發明專利說明書 200418861

（本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫）

※申請案號：93100400

※申請日期：93.1.8　　※IPC 分類：C07D487/04 (2006.01) A61K31/495 (2006.01)

壹、發明名稱：（中文/英文）

吡咯嗒哄衍生物

PYRROLOPYRIDAZINE DERIVATIVES

貳、申 請 人：（共 1 人）

姓名或名稱：（中文/英文）

藤澤藥品工業股份有限公司(藤沢薬品工業株式会社)

FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD.

代表人：（中文/英文）

青木初夫

AOKI, HATSUO

住居所或營業所地址：（中文/英文）

大阪市中央區道修町 3 丁目 4 番 7 號

4-7, Doshomachi 3-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, OSAKA 541-8514 JAPAN

國　籍：（中文/英文）

日本/Japan

參、發明人：（共 8 人）

姓　名：（中文/英文）

1.阿部義人/ABE, YOSHITO

2.井上誠/INOUE, MAKOTO

3.水谷剛/MIZUTANI, TSUYOSHI

4.澤田弘造/SAWADA, KOZO

5.大根和彥/OHNE, KAZUHIKO

6.奧村光晶/OKUMURA, MITSUAKI

7.澤田由紀/SAWADA, YUKI

8.今村健一郎/IMAMURA, KENICHIRO

住居所地址：（中文/英文）

1.～8.日本國大阪市中央區道修町3丁目4番7號

藤沢薬品工業株式会社内

c/o Fujisawa Pharmaceutical Co., Ltd.

4-7, Doshomachi 3-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, OSAKA

541-8514 JAPAN

國　籍：（中文/英文）

1.～8.日本/Japan

肆、聲明事項：

☐ 本案係符合專利法第二十條第一項☐第一款但書或☐第二款但書規定之期間，其日期為： 年 月 日。

◎本案申請前已向下列國家（地區）申請專利 ☑ 主張國際優先權：

【格式請依：受理國家（地區）；申請日；申請案號數 順序註記】

1. 澳洲 2003.01.09 2003900189
2. 澳洲 2003.07.14 2003903628
3.
4.
5.

☐ 主張國內優先權(專利法第二十五條之一)：

【格式請依：申請日；申請案號數 順序註記】

1.
2.

☐ 主張專利法第二十六條微生物：

☐ 國內微生物 【格式請依：寄存機構；日期；號碼 順序註記】

☐ 國外微生物 【格式請依：寄存國名；機構；日期；號碼 順序註記】

☐ 熟習該項技術者易於獲得，不須寄存。

玖、發明說明

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於一種新穎吡唑并嗒呯衍生物及其藥理容許鹽，其可抑制磷酸二酯酶 IV(PDE IV)之酵素活性及腫瘤壞死因子-α(TNF-α)之生成。

【先前技術】

已知環腺苷單磷鹽(腺苷 3'，5'-環單磷鹽，"cAMP"或"環狀 AMP")爲細胞內第二訊息子，其可仲介以第一訊息子(激素，神經傳導子或自體有效物)及細胞反應。第一訊息子可刺激 cAMP 之合成，而後，cAMP 可引導許多功能，例如代謝，收縮或分泌。cAMP 之效應終結係因被環腺苷磷酸二酯酶，尤爲磷酸二酯酶-4(PDE4 或 PDE-IV)降解，其對 cAMP 有專一性。PDE-IV 已發現存在於組織如中樞神經系統，心臟，血管平滑肌，呼吸道平滑肌，髓細胞，淋巴細胞等。由 PDE-IV 抑制劑而提升 cAMP 量，可對非適當活化呼吸道平滑肌及各種發炎細胞產生良好效應。

使用 PDE-IV 抑制劑之主要憂慮爲嘔吐之副作用，其如 C.Burnouf 等人所述已發生在數個候選化合物(Ann. Rep. In Med. Chem.，33:91-109(1998))。Burnouf 報導由各種化合物可引發不同嚴重性之副作用。

已知部份稠合雜環衍生物具有 PDE-IV 抑制活性，例如 WO03/016279，WO03/018579，WO03/000679 等。然而，仍待研發新穎化合物其可抑制 PDE-IV 且僅有最低副作用。雖然已知部份吡咯并嗒呯衍生物對羥甲基戊二醯(HMG)CoA 還

原酶有抑制活性，例如，WO91/18903，但吡咯并嗒咿衍生物對 PDE-IV 有抑制活性仍未知。

【發明內容】

本發明爲有關新穎吡咯并嗒咿衍生物。

本發明化合物可抑制 cAMP 磷酸二酯酶，尤爲磷酸二酯酶-4，亦可抑制腫瘤壞死因子-α之生成 (TNF-α)，血清糖蛋白質。

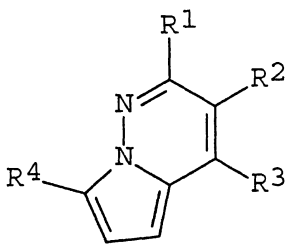
因此，本發明目的之一爲提供新穎且有用之吡咯并嗒咿衍生物及其藥理容許鹽，其具有强力磷酸二酯酶-4(PDE IV)-抑制活性，及對腫瘤壞死因子之生成有强力抑制活性(TNF)。

本發明另一目的爲提供製法以製備吡咯并嗒咿衍生物及其鹽。

本發明又另一目的爲提供醫藥組成物含該吡咯并嗒咿衍生物或其藥理容許鹽。

本發明又另一目的爲提供使用該吡咯并嗒咿衍生物或其藥理容許鹽之醫藥，以預防及治療人畜 PDE-IV 及 TNF 仲介疾病，例如急性發炎，特定自體免疫疾病，敗毒性器官受傷等。

本發明目的吡咯并嗒咿衍生物爲新穎且可如下式(I)所示：



(I)

其中

R^1 爲(1)羧基或已保護羧基，

(2)-$CONR^5R^6$，

(3)羥基或低烷氧基，

(4)胺基，環低烷胺基或單或二低烷胺基任意取代以低烷氧基，

(5)三鹵低烷基，

(6)三鹵低烷磺醯氧基或芳磺醯胺基，

(7)已取代或未取代低烷基，

(8)已取代或未取代芳基，或

(9)已取代或未取代雜環基，

R^2 爲 R^7 或 -$(A^1)p$-X-A^2-R^7，

其中

p 爲 0 或 1 之整數；

A^1 爲(C_1-C_2)伸烷基或-CH=CH-；

A^2 爲-$(CH_2)n$-或-(CH=CH)m-[式中 n 爲 1～6 之整數且 m 爲 1～3 之整數]；

X 爲單鍵，-O-，-NR^8-，-C(=O)-，-C(=NR^9)-或羥(C_1-C_2)伸烷基[式中 R^8 爲氫或低烷基，且 R^9 爲已取代或未取代含 N 雜環基]；且

R^7 爲

(1) 氫，

(2) 已取代或未取代芳基，

(3) 已取代或未取代雜環基，

(4) 羧基，已保護羧基或 $CONR^{10}R^{11}$，

(5) 醯基或鹵羰基，

(6) 氰基，

(7) 胺基，已保護胺基，或單或二低烷胺基，

(8) 羥基，芳氧基，醯氧基或低烷氧基任意取代以羥基或醯氧基，

(9) 低烷硫基，低亞磺醯基或低烷磺醯基，或

(10) $-O-R^{12}$，

或

R^1 及 R^2 共形成低伸烷基或低伸烯基，其可任意中斷以胺基或磺醯基，且可任意稠合以苯環，且可任意取代以一群含低烷基，羥基，氧及低烷氧基，

R^3 爲已取代或未取代芳基，或 已取代或未取代雜環基，

R^4 爲氫，鹵素，氰基，胺甲醯基，醯基，硫氰酸鹽，低烷硫基，低烯基，羥低烷基，三鹵低烷基或低烷基，

R^5，R^6，R^{10} 及 R^{11} 各爲氫，低烷磺醯基，雜環基或低烷基任意取代以羥基，烷氧基，硫基，羧基，已保護羧基或 $-R^{17}$，

或 R^5 及 R^6 或 R^{10} 及 R^{11} 與相連氮原子共表爲含 N 雜環基，且

R^{12} 及 R^{17} 各爲源自已保護或未保護糖，借除去其羥基而得之基，

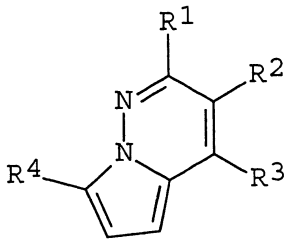
或其藥理容許鹽，或其前藥。

目的化合物(I)之適當製藥容許鹽爲習用無毒鹽，可含與鹼

之鹽或酸加成鹽，如與無機鹼之鹽，例如鹼金屬鹽(如鈉鹽、鉀鹽等)，鹼土金屬鹽(例如鈣鹼，鎂鹽等)，銨鹽；與有機鹼之鹽，如有機胺鹽(如三乙胺鹽，吡啶鹽，皮考林鹽，乙醇胺鹽，三乙醇胺鹽，二環己胺鹽，N，N'-二苄伸乙二胺鹽等)；無機酸加成鹽(如鹽酸鹽，氫溴酸鹽，硫酸鹽，磷酸鹽等)；有機羧酸或磺酸加成鹽(如甲酸鹽，乙酸鹽，三氟乙酸鹽，順丁烯二酸鹽，酒石酸鹽，反丁烯二酸鹽，甲磺酸鹽，苯磺酸鹽，甲苯磺酸鹽等)；與鹼或酸性胺基酸之鹽(如精胺酸，天冬胺酸，麩胺酸等)等。

"前藥"意指目的化合物(I)衍生物有化學或代謝可降解之基，其於化學或生物轉形後呈藥理活性化。

目的化合物(I)較佳具體實施例爲如下：



(I)

其中

R^1 爲

(1)羧基或酯化羧基(更宜爲乙氧羰基)，

(2)-$CONR^5R^6$[式中 R^5 及 R^6 各爲低烷基，或 R^5 及 R^6 與相連氮原子共表爲飽和 5-或 6-員雜單環基其含 1～2 個氮原子](更宜爲二甲胺甲醯基或 1-吡咯啶羰基)，

(3)羥基或低烷氧基，

(4)胺基，環低烷胺基，或單或二低烷胺基 任意取代以低烷氧基，

(5)三鹵低烷基，

(6)三鹵低烷磺醯氧基或芳磺醯胺基，

(7)低烷基任意取代以(i)鹵素；(ii)羧基；(iii)已保護羧基；(iv)氰基；(v)胺甲醯基；(vi)-OCONR^{15}R^{16}[式中 R^{15}及 R^{16}各爲氫，芳基或低烷基任意取代以芳基，或 R^{15}及 R^{16}與相連氮原子共表爲飽和 5-或 6-員雜單環基，其含 1～2 個氮原子且任意含 1 個氧原子](更宜爲二甲胺甲醯氧基，甲苯胺甲醯氧基，嗎啉基羰氧基或吡咯啶羰氧基)；(vii)低烷硫基；(viii)低烷磺醯基；(ix)低烷磺醯氧基；(x)低烷磺醯胺基；(xi)單或二低烷胺基任意取代以羥基，低烷氧基，芳氧基，或已取代或未取代芳基；(xii)胺基；(xiii)醯胺基(更宜爲低烷醯胺基，例如乙醯胺基，芳醯胺基例如苄醯胺基，或雜環羰胺基例如吡咔羰胺基)；(xiv)已保護胺基，例如酞醯亞胺基，苄胺基或低烷氧羰胺基；(xv)羥基；(xvi)醯氧基(更宜爲低烷醯氧基，例如乙醯氧基)；(xvii)環低烷氧基；(xviii)芳氧基；(xix)已取代或未取代芳基(更宜爲苯基)；(xx)飽和或未飽和 5 或 6 員雜單環基含 1～3 個氮原子且可任意含氧或硫原子(更宜爲哌咔基，嗎啉基，噁唑啶基，硫嗎啉基，哌啶基，吡咯啶基或三唑基)任意取代以低烷基，羥低烷基，芳基或氧基；或(xxi)低烷氧基任意取代以羧基，已保護羧基，羥基，已保護羥基，低烷氧基，環低烷基，已取代或未取代芳基(更宜爲苯基任意取代以氰基，羧基，已保護羧基或胺甲醯基)，飽和或未飽和 5 或 6 員雜單環基含 1～2 個氮原子(更宜爲吡啶基，吡咔基或哌咔基)任意取代以低烷基，或

-$CONR^{13}R^{14}$[式中 R^{13} 及 R^{14} 各爲氫或低烷基任意取代以芳基，或 R^{13} 及 R^{14} 與相連氮原子共表爲飽和 5-或 6-員雜單環基，其含 1～2 個氮原子且任意含 1 個氧原子](更宜爲胺甲醯基，甲胺甲醯基，苄胺甲醯基或嗎啉羰基)，

(8)芳基(更宜爲苯基)任意取代以取以基選自一群含鹵素，或

(9)飽和或未飽和 5-或 6-員雜單環基(更宜爲吡咯啶基，吡咯基，噁唑基，異噁唑基，噻唑基，呋喃基，噻吩基，吡啶基)任意取代以低烷基或鹵素，

R^2 爲 R^7 或 -$(A^1)p$-X-A^2-R^7

其中

p 爲 0 或 1，

A^1 爲 (C_1-C_2)伸烷基或 –CH=CH-；

A^2 爲 -$(CH_2)n$-或 –(CH=CH)m-[式中 n 爲 1～6 之整數且 m 爲 1～3 之整數]；

X 爲單鍵，-O-，-NR^8-，-C(=O)-，-C(=NR^9)-或羥(C_1-C_2)伸烷基；[其中 R^8 爲氫或低烷基，且 R^9 爲已取代或未取代吡咯基，例如 2-乙基-5-(4-氟苄醯基)吡唑基]

R^7 爲

(1)氫，

(2)芳基(更宜爲苯基)任意取代以低烷氧基，

(3)未飽和雜單環基含 1～2 個氮原子，(更宜爲吡啶基)，

(4)羧基，酯化羧基(更宜爲低烷氧羰基)或-$CONR^{10}R^{11}$[式中 R^{10} 及 R^{11} 各爲氫，低烷磺醯基，未飽和雜單環基含 1～2

個氮原子，例如吡啶基或低烷基任意取代以羥基，烷氧基，羧基，已保護羧基，磺酸基或 - R^{17}，或 R^{10} 及 R^{11} 與相連氮原子共表爲飽和 5-或 6-員雜單環基，其含 1～2 個氮原子且任意含 1 個氧原子，例如嗎啉基.]，

(5)醯基(例如低烷醯基，例如甲醯基或乙醯基，及雜環羰基例如吡啶羰基)或鹵羰基，

(6)氰基，

(7)胺基，已保護胺基，例如低烷氧羰胺基，或單或二低烷胺基，

(8)羥基，芳氧基，醯氧基或低烷氧基任意取代以羥基或醯氧基(例如低烷醯氧基)，

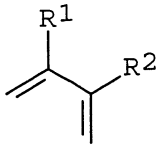
(9)低烷硫基，低亞磺醯基或低烷磺醯基，或

(10)-O-R^{12}，

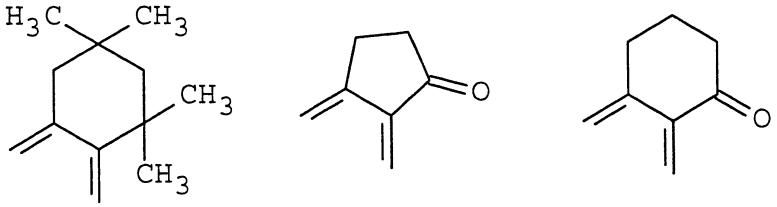
或

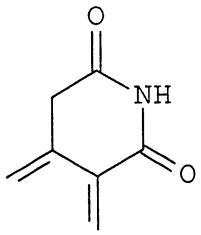
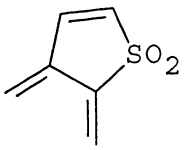
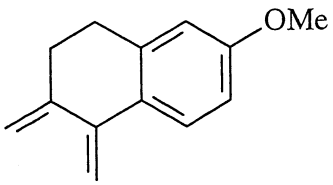
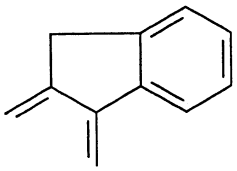
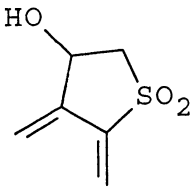
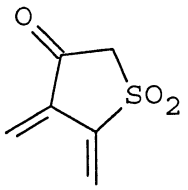
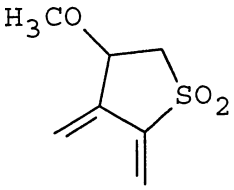
R^1 及 R^2 共表爲低伸烷基或低伸烯基，其可任意中斷以胺基或磺醯基，且亦可任意取代以一群含低烷基，羥基，氧及低烷氧基，

其由下式表示：



亦可含如下；



R^3 爲(1)芳基(更宜爲苯基或萘基)任意取代以一以上取代基選自一群含(i)鹵素，(ii)羧基，(iii)已保護羧基，(iv)氰基，(v)-$CONR^{15}R^{16}$[式中 R^{15} 及 R^{16} 各爲氫，低烷基任意取代以羥基]，(vi)低烷基，(vii)環低烷基，(viii)羥低烷基，(ix)低烷氧基，(x)三鹵低烷基，(xi)未飽和 5 或 6 員雜單環基含 1～2 個氧原子及 1～2 個氮原子，例如噁唑基，(xii)低烷磺醯基，(xiii)硝基，(xiv)胺磺醯基及(xv)已保護胺磺醯基；或

(2)雜環基選自一群含吡啶基，吡咯基，噁唑基，異噁唑基，呋喃基，噻吩基，喹啉基，苯并呋喃基及苯并噻吩基，其中該雜環基可任意取代以一以上取代基選自一群含(i)低烷基，(ii)環低烷基，(iii)低烷氧基，(iv)醯基，例如低烷醯基，(v)胺基，(vi)單或二低烷胺基，(vii)已保護胺基，例如

低烷氧羰胺基，(viii)氰基，(ix)羧基，(x)已保護羧基，例如乙氧羰基或甲氧羰基，(xi)-$CONR^{15}R^{16}$[式中 R^{15} 及 R^{16} 各爲氫，低烷基任意取代以羥基]，(xii)低烯基任意取代以低烷氧基，(xiii)鹵素，(xiv)低烷硫基及(xv)羥基；

R^4 爲氫，鹵素，氰基，胺甲醯基，低烷醯基，硫氰酸鹽，低烷硫基，低烯基，羥低烷基，三鹵低烷基或低烷基，且

R^{12} 及 R^{17} 各爲源自已保護或未保護糖之基，例如半乳糖，由除去其羥基之基，

或

式(I)化合物更宜爲：

R^1 爲

(1)單或二低烷胺基，

(2)芳基例如苯基，

(3)飽和或未飽和 5 或 6 員雜單環基，其含 1～2 個氮原子且任意含 1 個氧原子(更宜爲吡咯啶基，吡咯基，噁唑基，異噁唑基，噻唑基，呋喃基，噻吩基，吡啶基等)，或

(4)低烷基任意取代以低烷氧基或飽和 5-或 6-員雜單環基，其含 1～2 個氮原子且任意含 1 個氧原子(更宜爲哌啡基或嗎啉基)，其中低烷氧基可任意取代以環低烷基或未飽和 5-或 6-員雜單環基，其含 1～2 個氮原子(更宜爲吡啶基)，

R^2 爲 R^7 或 $-A^2-R^7$，其中

A^2 爲 $-(CH_2)n-$或$-(CH=CH)m-$[式中 n 爲 2～6 整數且 m 爲 1～2 整數，且

R^7 爲氫，低烷磺醯基，羧基，已保護羧基或未飽和 5-或

6-員雜單環基，其含 1～2 個氮原子(更宜爲吡啶基)，

R^3 爲(1)芳基任意取代以低烷基，環低烷基，鹵素，氰基或胺甲醯基；或

(2)未飽和稠合雜環基，其含 1～2 個氮原子(更宜爲喹啉基)；或未飽和 5 或 6 員雜單環基含一以上氮原子(更宜爲 3-吡啶基及 4-吡啶基)取代以低烷基，環低烷基或鹵素，且

R^4 爲低烷基.

式(I)化合物最宜爲：

R^1 爲苯基，飽和或未飽和 5 或 6 員雜單環基，含 1～2 個雜原子選自 N，O 或 S(更宜爲吡咯基，異噁唑基，呋喃基，噻吩基等)，或低烷基任意取代以低烷氧基或飽和 5-或 6-員雜單環基，其含 1～2 個氮原子且任意含 1 個氧原子(更宜爲哌啡基或嗎啉基)，其中低烷氧基可任意取代以環低烷基或未飽和 5 或 6 員雜單環基，其含一以上氮原子(更宜爲吡啶基)，

R^2 爲 $-(CH_2)n-R^7$，其中 n 爲 2～5 之整數，且 R^7 爲羧基或已保護羧基，

R^3 爲(1)苯基任意取代以低烷基，環低烷基，低烷氧基，鹵素，氰基或胺甲醯基；或(2)未飽和 5 或 6 員雜單環基含一以上氮原子(更宜爲 3-吡啶基及 4-吡啶基)取代以低烷基，環低烷基，低烷氧基，胺甲醯基或鹵素，且

R^4 爲低烷基。

式(I)化合物宜爲：

(1)3-[7-乙基-2-甲基-3-(4-吡啶基)-吡咯并[1，2-b]嗒啡-4-

基]苄腈，

(2)3-[7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈，

(3)4-[7-乙基-2-甲基-3-(甲磺醯基)-吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈，

(4)3-[7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄醯胺，

(5)5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯，

(6)2-{[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]甲基}-1，3-丙二醇，

(7)3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基-吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸，

(8)5-[7-乙基-2-甲基-4-(6-喹啉基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，

(9)5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，

(10)5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，

(11)5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，

(12)3-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸，

(13)5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-嗎啉甲基)吡咯并

[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，

(14)(2E)-3-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-2-丙烯酸乙酯，

(15)6-{4-[4-(胺羰基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}己酸

(16)3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸，

(17)4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸，

(18)5-[2-[(環己基甲氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，

(19)5-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸，

(20)4-{4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸，

(21)4-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸，

(22)4-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸，

(23)5-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，或

(24)5-{4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸，

或其藥理容許鹽。

式(I)化合物更宜爲：

(1)5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯，

(2)3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基-吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸，

(3)5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，

(4)5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，

(5)5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，

(6)3-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸，

(7)5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，

(8)6-{4-[4-(胺羰基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}己酸

(9)3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸，

(10)4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸，

(11)5-[2-[(環己基甲氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，及

(12)5-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(4-吡啶甲氧基)甲

基]吡咯并[1，2-b]嗒咪-3-基}戊酸，

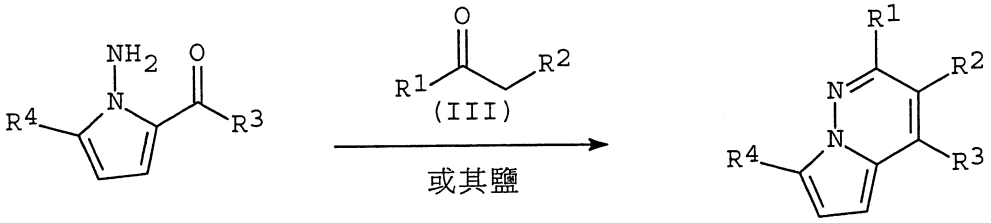
(13)4-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咪-3-基]丁酸，或

(14)5-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咪-3-基]戊酸，

或其藥理容許鹽。

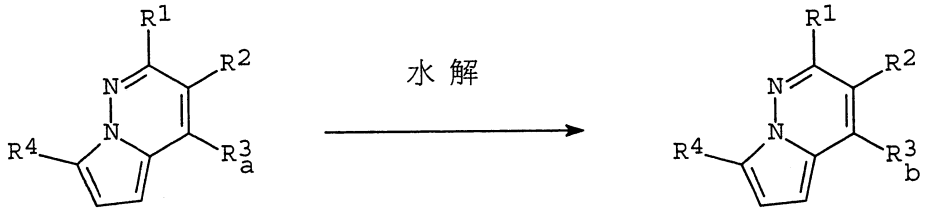
本發明目的化合物(I)可由下法製備。

製法 1



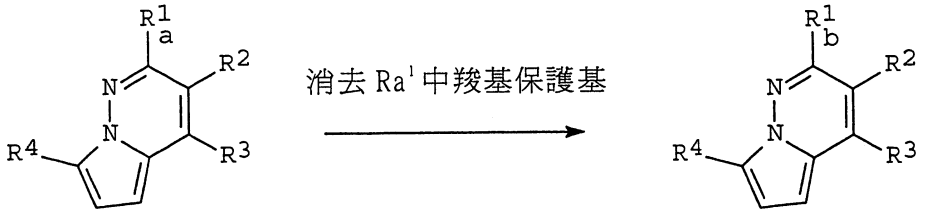
(II)或其鹽　　(I)或其鹽

製法 2



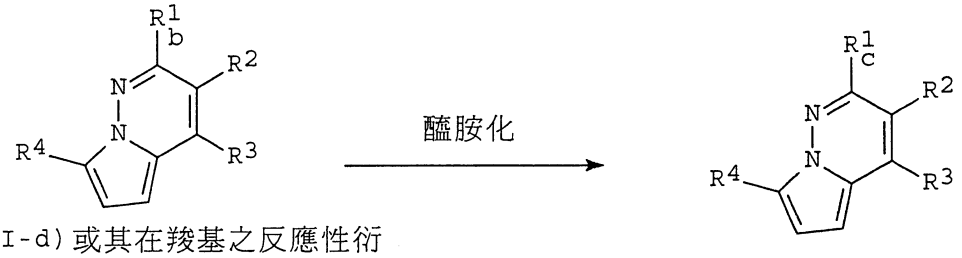
(I-a)或其鹽　　(I-b)或其鹽

製法 3



(I-c)或其鹽　　(I-d)或其鹽

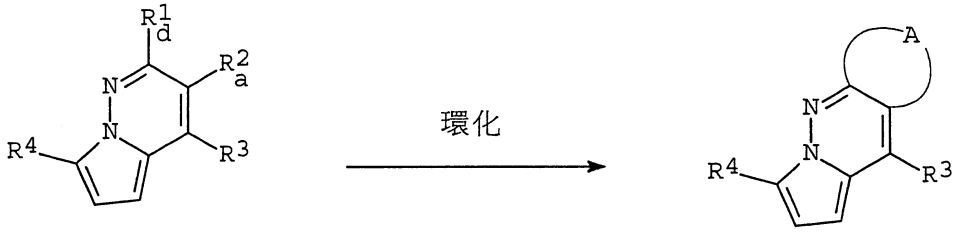
製 法 4



(I-d) 或其在羧基之反應性衍生物或其鹽

(I-e) 或其鹽

製 法 5



(I-e) 或其鹽

(I-g) 或其鹽

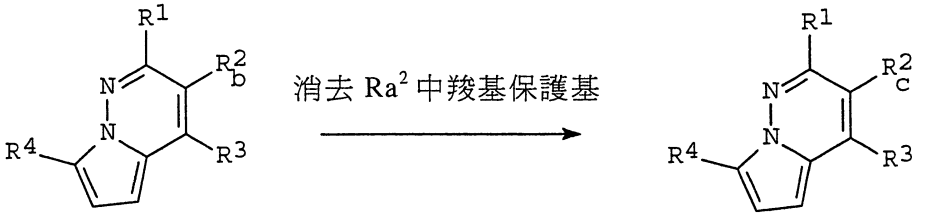
製 法 6



(I-b) 或其鹽

(I-h) 或其鹽

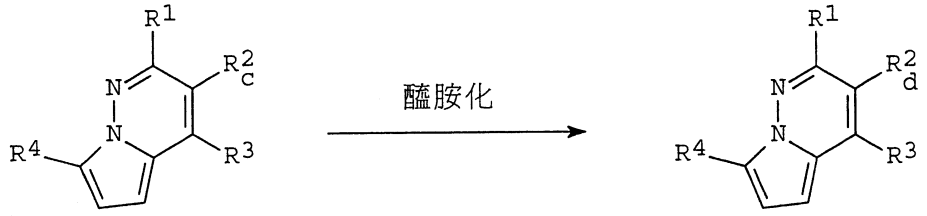
製 法 7



(I-i) 或其鹽

(I-j) 或其鹽

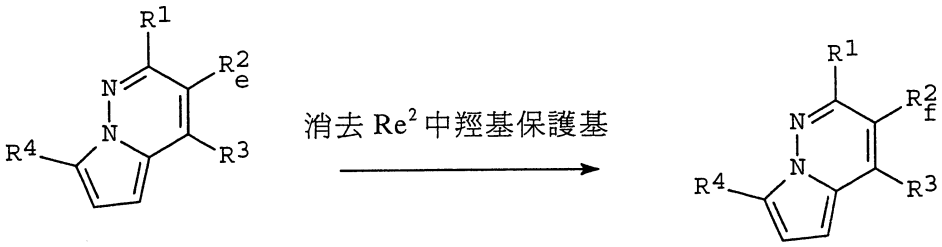
製 法 8



(I-j) 或其鹽，或其在羧基之反應性衍生物

(I-k) 或其鹽

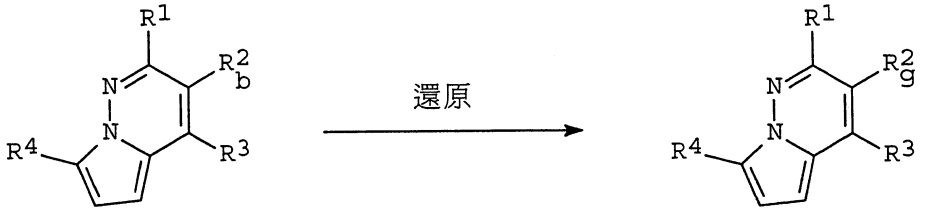
製 法 9



(I-l) 或其鹽

(I-m) 或其鹽

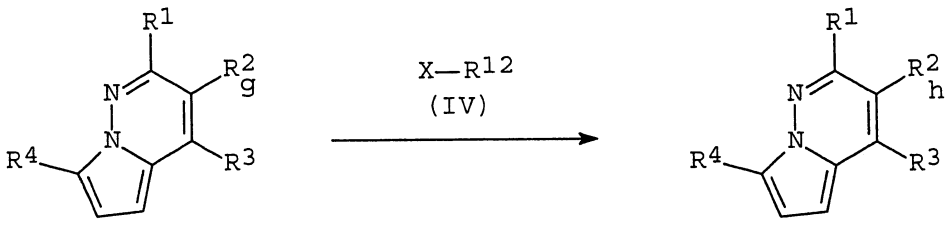
製 法 10



(I-i) 或其鹽

(I-n) 或其鹽

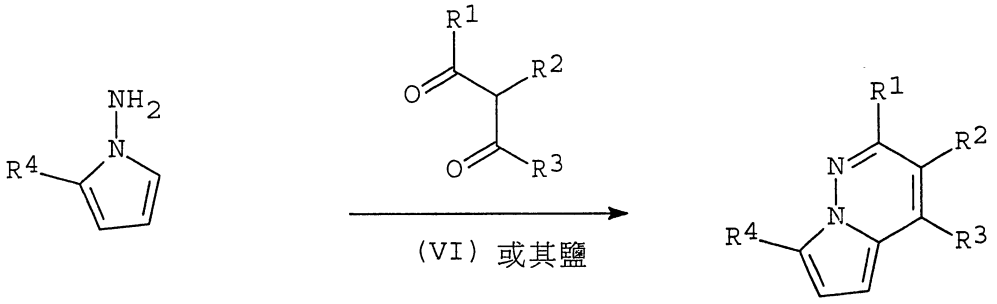
製 法 11



(I-n) 或其鹽

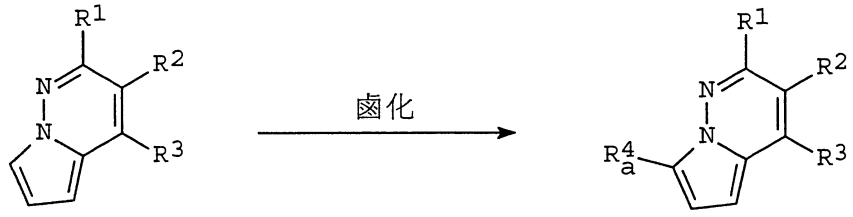
(I-o) 或其鹽

製 法 12



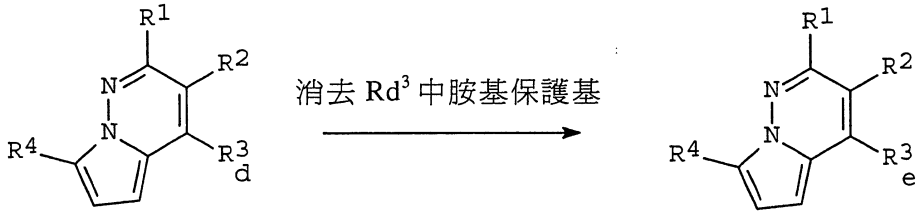
(V) 或其鹽　　(VI) 或其鹽　　(I) 或其鹽

製 法 13



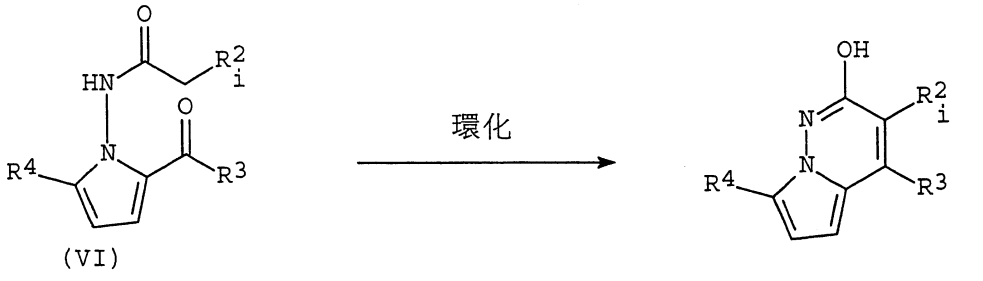
(I-p) 或其鹽　　(I-q) 或其鹽

製 法 14



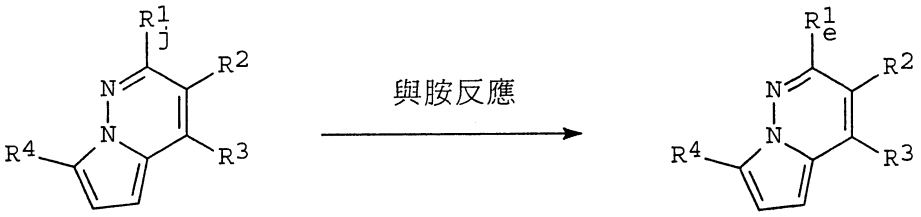
(I-r) 或其鹽　　(I-s) 或其鹽

製 法 15



(VI)　　(I-t) 或其鹽

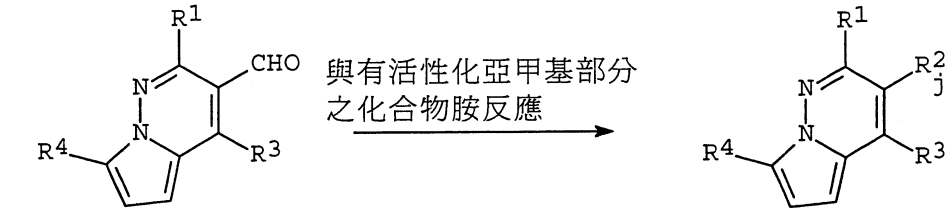
製 法 16



(I-u) 或其鹽或其在羥基之反應性衍生物

(I-v) 或其鹽

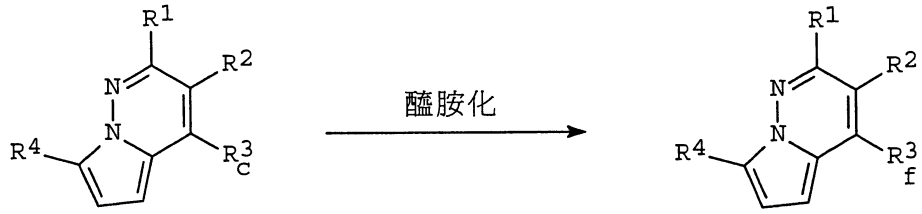
製 法 17



(I-w) 或其鹽

(I-x) 或其鹽

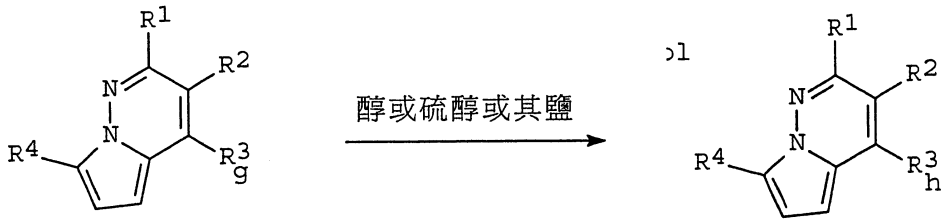
製 法 18



(I-h) 或其鹽

(I-y) 或其鹽

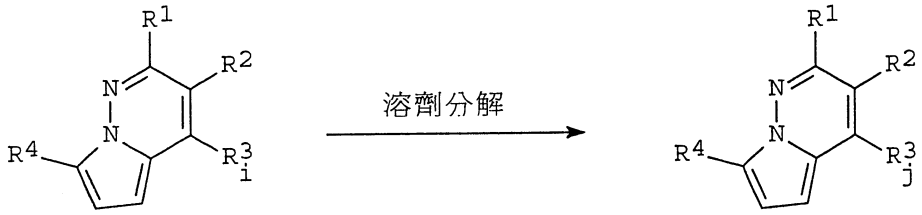
製 法 19



(I-z) 或其鹽

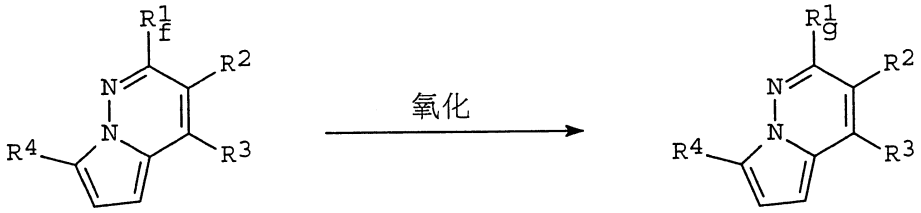
(I-aa) 或其鹽

製 法 20



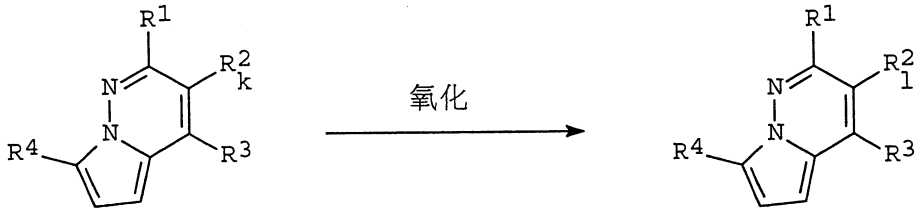
(I-ab) 或其鹽　　(I-ac)或其鹽

製 法 21



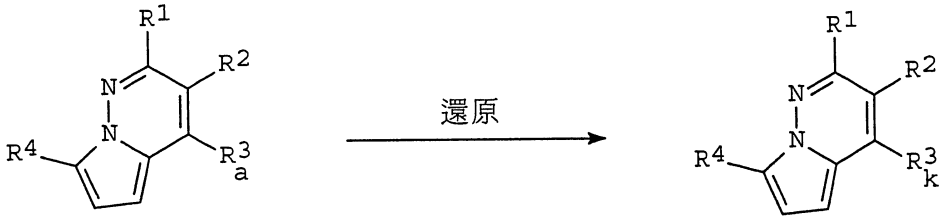
(I-ad)或其鹽　　(I-ae) 或其鹽

製 法 22



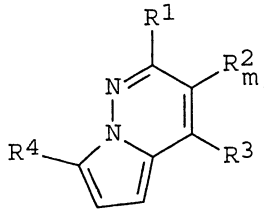
(I-af) 或其鹽　　(I-ag) 或其鹽

製 法 23



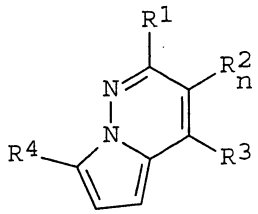
(I-a) 或其鹽　　(I-ah) 或其鹽

製法 24



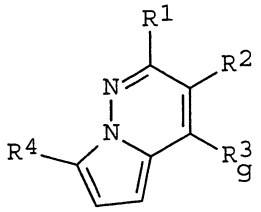
(I-ai) 或其鹽

消去胺基保護基



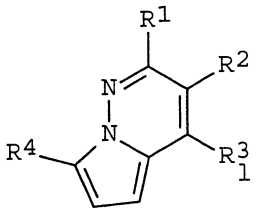
(I-aj) 或其鹽

製法 25



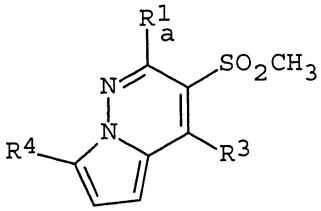
(I-z) 或其鹽

胺



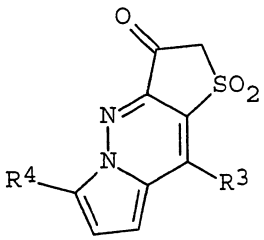
(I-ak) 或其鹽

製法 26



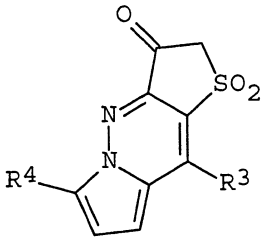
(I-al) 或其鹽

環化



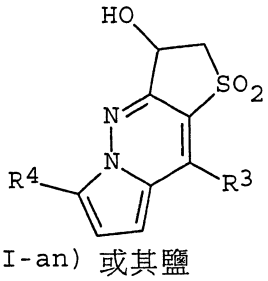
(I-am) 或其鹽

製法 27



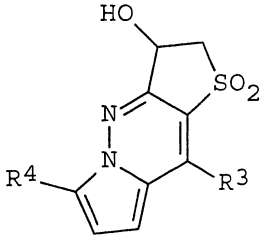
(I-am) 或其鹽

還原



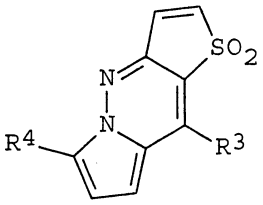
(I-an) 或其鹽

製法 28



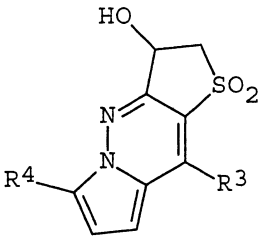
(I-an) 或其鹽

低烷基鹵



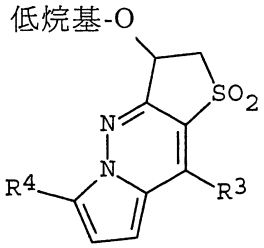
(I-ao) 或其鹽

製法 29



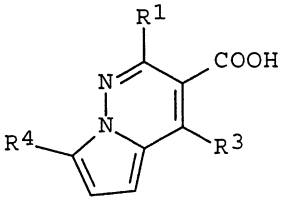
(I-an) 或其鹽

低烷基鹵



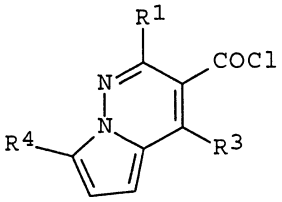
(I-ap) 或其鹽

製法 30



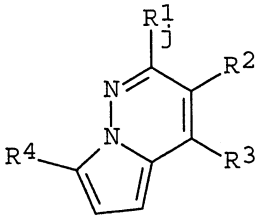
(I-aq) 或其鹽

草醯氯



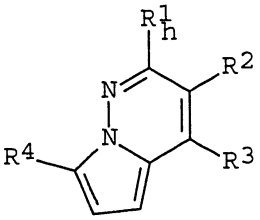
(I-ar) 或其鹽

製法 31



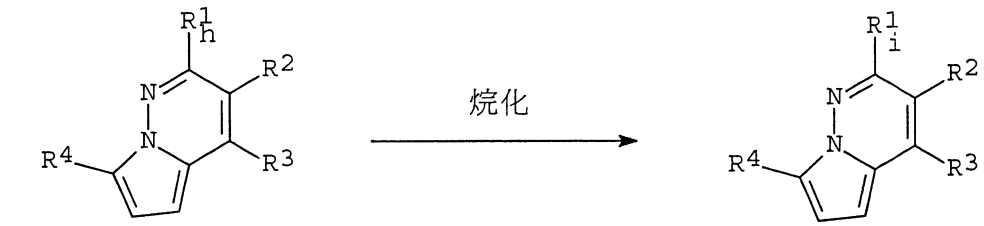
(I-u) 或其鹽

三氟甲磺酐



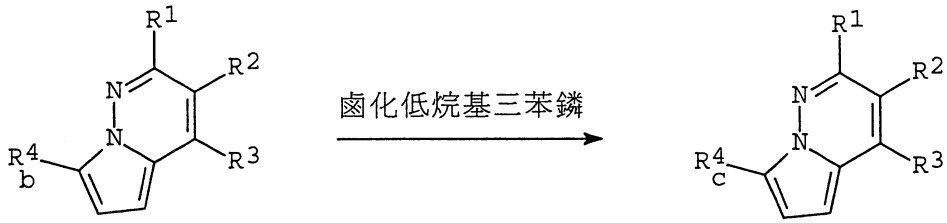
(I-as) 或其鹽

製法 32



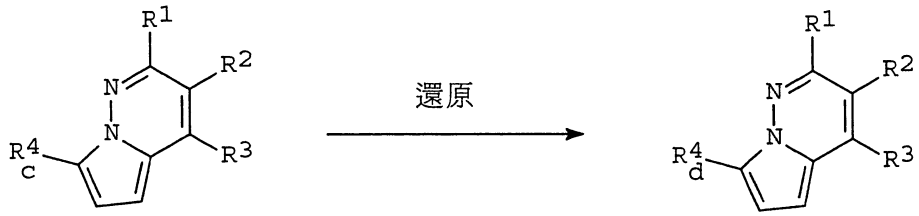
(I-as)或其鹽　　(I-at)或其鹽

製法 33



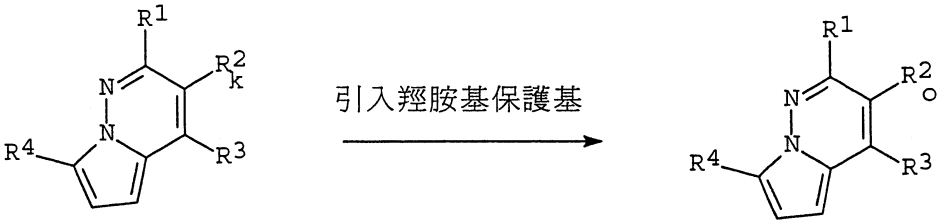
(I-au)或其鹽　　(I-av)或其鹽

製法 34



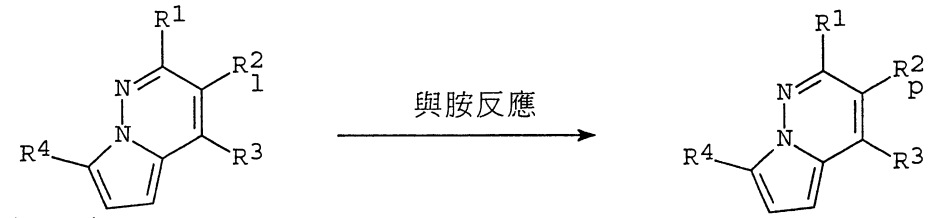
(I-av)或其鹽　　(I-aw)或其鹽

製法 35



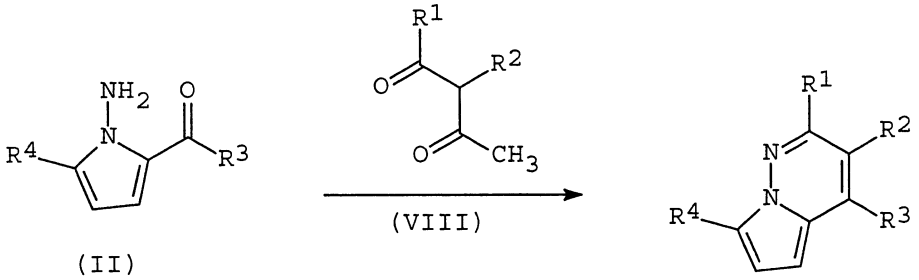
(I-af)或其鹽　　(I-ax)或其鹽

製 法 36



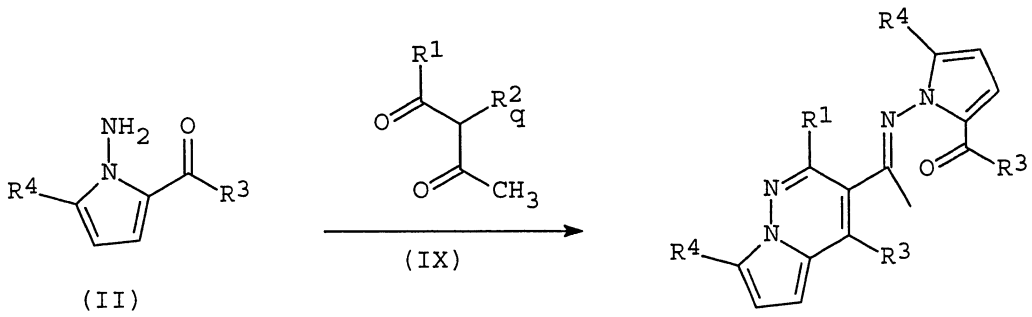
(I-ag) 或其鹽　　(I-ay)或其鹽

製 法 37



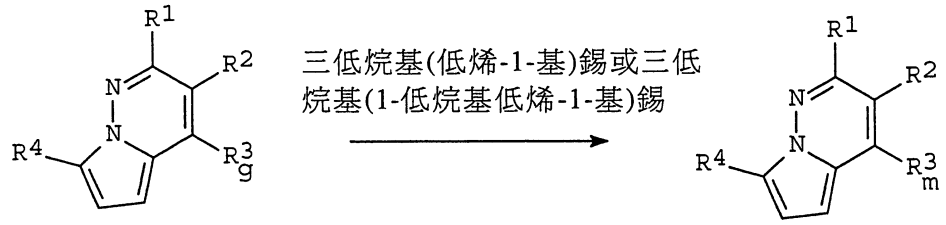
(II)　　(I) 或其鹽

製 法 38



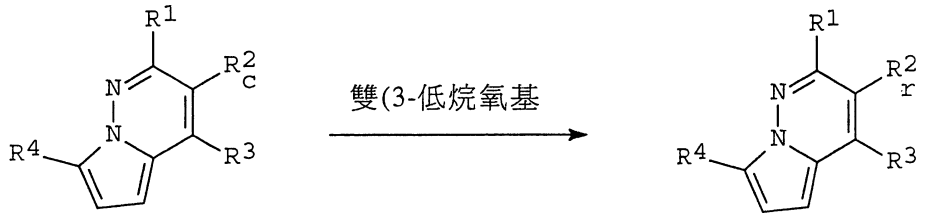
(II)　　(I-az) 或其鹽

製 法 39



(I-z) 或其鹽　　(I-ba)或其鹽

製法 40



(I-r) 或其鹽　　(I-bb) 或其鹽

其中 R^1，R^2，R^3 及 R^4 之定義如上，

$R^1{}_a$ 爲如上述 R^1 含有已保護羧基部份，

$R^1{}_b$ 爲如上述 R^1 含有羧基部份，

$R^1{}_c$ 爲 $-CONR^5R^6$，

$R^1{}_d$ 爲胺甲醯基低烷基，

$R^1{}_e$ 爲胺基，單或二低烷胺基，低烷氧基低烷胺基，含 N 雜環基，胺低烷基，單或二低烷胺低烷基，低烷氧基低烷胺低烷基含 N 雜環低烷基，

$R^1{}_f$ 爲低烷硫低烷基，

$R^1{}_g$ 爲低烷磺醯基低烷基，

$R^1{}_h$ 爲三氟甲磺醯氧基或三氟甲磺醯氧低烷基，

$R^1{}_i$ 爲低烷氧基或低烷氧低烷基，

$R^1{}_j$ 爲羥基或羥低烷基，

$R^2{}_a$ 爲低烷氧羰基，

$R^2{}_b$ 爲如上述 R^2 含有如已保護羧基部份，

$R^2{}_c$ 爲如上述 R^2 含有如羧基部份，

$R^2{}_d$ 爲如上述 R^2 含有如胺甲醯部份，

$R^2{}_e$ 爲如上述 R^2 含有如已保護羥基部份，

$R^{2}{}_{f}$ 爲如上述 R^{2} 含有如羥基部份，

$R^{2}{}_{g}$ 爲如上述 R^{2} 含有如羥甲基部份，

$R^{2}{}_{h}$ 爲 $-OR^{12}$，

$R^{2}{}_{i}$ 爲低烷氧羰基或低烷磺醯基，

$R^{2}{}_{j}$ 爲如上述 R^{2} 中已取代或未取代低烯基，其中該低烯基爲低 1-烯-1-基，

$R^{2}{}_{k}$ 爲如上述 R^{2} 含有如羥低烷基部份，

$R^{2}{}_{l}$ 爲如上述 R^{2} 含有如氧低烷基部份，

$R^{2}{}_{m}$ 爲如上述 R^{2} 含有如已保護胺基部份，

$R^{2}{}_{n}$ 爲如上述 R^{2} 含有如胺基部份，

$R^{2}{}_{o}$ 爲如上述 R^{2} 含有如已保護羥基部份，

$R^{2}{}_{p}$ 爲如上述 R^{2} 含有如羥低烷胺低烷基部份，

$R^{2}{}_{q}$ 爲如上述 R^{2} 含有如低烷氧羰基低烷基部份，

$R^{2}{}_{r}$ 爲如上述 R^{2} 含有如低烷氧羰甲羰基部份，

$R^{3}{}_{a}$ 爲如上述 R^{3} 含有如氰基部份，

$R^{3}{}_{b}$ 爲如上述 R^{3} 含有如胺甲醯部份，

$R^{3}{}_{c}$ 爲如上述 R^{3} 含有如羧基部份，

$R^{3}{}_{d}$ 爲如上述 R^{3} 含有如已保護胺磺醯基部份，

$R^{3}{}_{e}$ 爲如上述 R^{3} 含有如胺磺醯基部份，

$R^{3}{}_{f}$ 爲如上述 R^{3} 含有如 $-CONR^{10}R^{11}$ 部份，

$R^{3}{}_{g}$ 爲如上述 R^{3} 含有如鹵雜環部份，

$R^{3}{}_{h}$ 爲如上述 R^{3} 含有如烷氧雜環，硫烷氧雜環或羥基部份，

$R^{3}{}_{i}$ 爲如上述 R^{3} 含有如 1-低烷氧低烯-1-基雜環部份，

$R^3{}_j$ 爲如上述 R^3 含有如低烷醯基雜環部份，

$R^3{}_k$ 爲如上述 R^3 含有如胺甲基雜環部份，

$R^3{}_l$ 爲如上述 R^3 含有如單或二低烷胺雜環部份，

$R^3{}_m$ 爲如上述 R^3 含有如低烯-1-基雜環基或 1-低烷氧-1-低烯-1-基雜環部份，

$R^4{}_a$ 爲鹵素，

$R^4{}_b$ 爲甲醯基，

$R^4{}_c$ 爲低 1-烯-1-基，

$R^4{}_d$ 爲低烷基，

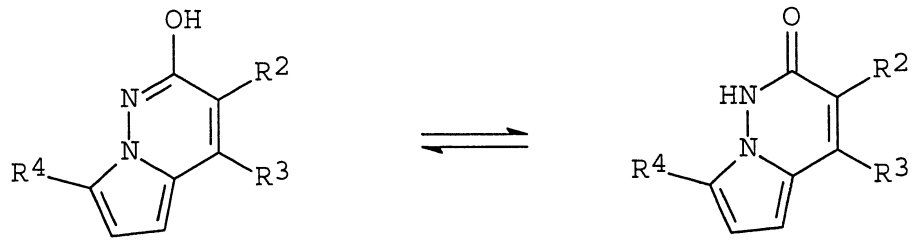
R^{12} 爲低烷基或源自已保護或未保護糖，除去羥基之基，

X 爲離去基，且

下式基：  爲低伸烷基中斷以亞胺基並取代以氧基。

本發明原料化合物(II)可依習用方法或如下製備例及/或實施例來製備。

需知化合物(I)之吡咯并嗒咿部份可以互變異構物形式存在，此互變異構物平衡可由下式表示。



其中 R^1，R^2，R^3 及 R^4 之定義如上。

上述互變異構物皆於本發明範圍內，本發明說明書及申請專利範圍中，爲便於闡明本發明，目的化合物(I)爲吡咯并嗒咿環之可能互變異構物之一種。

本說明書中所示於本發明範圍內之適例及各種定義之闡明詳述如下。

“低”一詞若無特別說明，意指 C1～6，宜爲 1～4。

適當“低烷基”及“低烷基部份”含直鏈或分岐鏈 C1～6 烷基，如甲基，乙基，丙基，異丙基，丁基，異丁基，第二丁基，第三丁基，戊基，第三戊基，己基等，宜爲 C_1-C_4 烷基。

適當“低烯基"可含乙烯基(乙烯基)，1-(或 2-)丙烯基，1-(或 2-或 3-)丁烯基，1-(或 2-或 3-或 4-)戊烯基，1-(或 2-或 3-或 4-或 5-)己烯基，1-甲基乙烯基，1-乙基乙烯基，1-(或 2-)甲基-1-(或 2-)丙烯基，1-(或 2-)乙基-1-(或 2-)丙烯基，1-(或 2-或 3-)甲基-1-(或 2-或 3-)丁烯基等，宜爲 C_2-C_4 烯基。

適當"低炔基"可含乙炔基，1-丙炔基，炔丙基，1-甲基炔丙基，1 或 2 或 3-丁炔基，1 或 2 或 3 或 4-戊炔基，1 或 2 或 3 或 4 或 5-己炔基等。

適當"低伸烷基"可含直鏈或分岐鏈者，例如亞甲基，伸乙基，三亞甲基，四亞甲基，五亞甲基，六亞甲基，甲基亞甲基，乙基伸乙基，伸丙基等，宜爲 C_1-C_4 伸烷基，最宜爲亞甲基。

羥(C_1-C_2)伸烷基可爲羥亞甲基，(羥甲基)亞甲基或 1-(或 2-)羥伸乙基。

適當“低烷氧基”可含甲氧基，乙氧基，丙氧基，異丙氧基，丁氧基，異丁氧基，第三丁氧基，戊氧基，第三戊氧基，己氧基等。

適當“鹵素”及“鹵素部份”含氟，氯，溴及碘。

適當“三鹵低烷基”可含三氯甲基，三氟甲基，三氯乙基，三溴甲基等。

適當“單或二低烷胺基”可含胺基取代以 1～2 個低烷基，例如甲胺基，乙胺基，二甲胺基等。

適當“單或二低烷胺基取代以低烷氧基”可爲甲氧甲胺基，甲氧乙胺基，甲氧乙基(甲基)胺基，甲氧乙基(乙基)胺基，二(甲氧乙基)胺基，乙氧甲胺基，乙氧乙胺基等。

適當“低烷硫基”可含習知者，例如甲硫基，乙硫基，丙硫基，丁硫基等。

適當“低烷亞磺醯基”可含習知者，例如甲亞磺醯基，乙亞磺醯基，丙亞磺醯基，丁亞磺醯基等。

適當“低烷磺醯基”可含習知者，例如甲磺醯基，乙磺醯基，丙磺醯基，丁磺醯基等。

適當“三鹵低烷磺醯氧基”可含磺醯氧基取代以三鹵低烷基，例如三氟甲磺醯氧基，三氟乙磺醯氧基，三氯甲磺醯氧基等。

適當"已保護羧基"及"已保護羧基部份"可含酯化羧基等。

該酯之適當例爲例如

低烷酯(例如甲酯，乙酯，丙酯，異丙酯，丁酯，異丁酯，第三丁酯，戊酯，第三戊酯，己酯等)；

低烯酯(例如乙烯酯，烯丙酯等)；

低炔酯(例如乙炔酯，丙炔酯等)；

低烷氧低烷酯(例如甲氧甲酯，乙氧甲酯，異丙氧甲酯，

1-甲氧乙酯，1-乙氧乙酯等）；

低烷硫低烷酯(例如甲硫甲酯，乙硫甲酯，乙硫乙酯，異丙硫甲酯等)；

單(或二或三)鹵低烷酯(例如2-碘乙酯，2，2，2-三氯乙酯等)；

低烷醯氧基低烷酯(例如乙醯氧甲酯，丙醯氧甲酯，丁醯氧甲酯，戊醯氧甲酯，特戊醯氧甲酯，己醯氧甲酯，1-乙醯氧乙酯，2-乙醯氧乙酯，2-丙醯氧乙酯等)；

低烷氧羰氧低烷酯(例如甲氧羰氧甲酯，乙氧羰氧甲酯，丙氧羰氧甲酯，1-(或2-)-[甲氧羰氧基]乙酯，1-(或2-)-[乙氧羰氧基]乙酯，1-(或2-)-[丙氧羰氧基]乙酯，1-(或2-)-[異丙氧羰氧基]乙酯等)；

低烷磺醯低烷酯(例如甲磺醯甲酯，2-甲磺醯乙酯等)；

低烷氧羰氧低烷酯(例如甲氧羰氧甲酯，乙氧羰氧甲酯，丙氧羰氧甲酯，第三丁氧羰基-乙醯氧甲酯，1-(或2-)甲氧羰氧乙酯，1-(或2-)乙氧羰氧乙酯，1-(或2-)-異丙氧羰氧乙酯等)；

亞酞低烷酯；

(5-低烷基-2-氧-1，3-二氧-4-基)低烷酯[例如(5-甲基-2-氧-1，3-二氧-4-基)甲酯，(5-乙基-2-氧-1，3-二氧-4-基)甲酯，(5-丙基-2-氧-1，3-二氧-4-基)乙酯等]；

單(或二或三)芳基低烷酯，例如，單(或二或三)苯基低烷酯其含一以上適當取代基(例如苄酯，4-甲氧苄酯，4-硝苄酯，苯乙酯，三苯甲酯，二苯甲酯，雙(甲氧苯基)甲酯，3，

4-二甲氧苄酯，4-羥基-3，5-二第三丁基苄酯等)；

芳酯其含一以上適當取代基，例如已取代或未取代苯酯(例如苯酯，甲苯酯，第三丁基苯酯，二甲苯酯，三甲苯酯，異丙苯酯，4-氯苯酯，4-甲氧苯酯等)；三低烷矽烷酯(例如三甲矽烷酯，三乙矽烷酯等)；

三低烷矽烷低烷酯(例如 2-三甲矽烷乙酯等)；等，

宜爲低烷酯，即低烷氧羰基(例如乙氧羰基等)。

"已保護胺基"意指胺基結合至胺基-保護基。此胺基保護基含低烷氧羰基(例如甲氧羰基，乙氧羰基，第三丁氧羰基等)；低烯氧羰基(例如乙烯氧羰基，烯丙氧羰基等)；任意已取代芳低烷氧羰基(例如苄氧羰基等)；酞醯亞胺；等。胺基保護基之適例爲有機合成所熟知，且可參見 T. W. Greene and P. G. M. Wuts，"Protective Groups in Organic Synthesis，" Second Edition，John Wiley and Sons，New York，N.Y.。

"已保護胺磺醯基"意指磺醯基在氮原子上有如上述胺基保護基。較佳胺基保護基爲芳低烷氧羰基(例如苄氧羰基等)；等。

適當"醯基"及"醯基部份"可含脂族醯基，及含芳環之醯基，其稱爲芳族醯基，或雜環，其稱爲雜環醯基。

該醯基之適當例爲如下：

脂族醯基，例如

低或高烷醯基，如甲醯基，乙醯基，丙醯基，丁醯基，2-甲基丙醯基，戊醯基，2，2-二甲基丙醯基，己醯基，庚醯

基，辛醯基，壬醯基，癸醯基，十一碳醯基，十二碳醯基，十三碳醯基，十四碳醯基，十五碳醯基，十六碳醯基，十七碳醯基，十八碳醯基，十九碳醯基，二十碳醯基等)；其中，較佳“低烷醯基”可含直鏈或分歧鏈者，例如甲醯基，乙醯基，丙醯基，丁醯基等。

低或高烯醯基(例如丙烯醯基，2-(或3-)-丁烯醯基，2-(或3-或4-)戊烯醯基，2-(或3-或4-或5-)-己烯醯基等)；

低烷二烯醯基(例如庚二烯醯基，己二烯醯基等)；

環低烷羰基(例如環丙羰基，環戊羰基，環己羰基等)；

低烷乙醛醯基(例如甲基乙醛醯基，乙基乙醛醯基，丙基乙醛醯基等)；

低烷氧基乙醛醯基(例如甲氧乙醛醯基，乙氧乙醛醯基，丙氧乙醛醯基等)；

芳族醯基如

芳醯基(例如苄醯基，甲苯醯基，萘甲醯基等)；

芳低烷醯基[例如苯低烷醯基(例如苯乙醯基，苯丙醯基，苯丁醯基，苯異丁醯基，苯戊醯基，苯己醯基等)，萘低烷醯基(例如萘乙醯基，萘丙醯基，萘丁醯基等)等]；

芳低烯醯基[例如苯低烯醯基(例如苯丙烯醯基，苯丁烯醯基，苯甲基丙烯醯基，苯戊烯醯基，苯己烯醯基等)，萘低烯醯基(例如萘丙烯醯基，萘丁烯醯基等)等]；

芳氧低烷醯基(例如苯氧乙醯基，苯氧丙醯基等)；

芳乙醛醯基(例如苯乙醛醯基，萘乙醛醯基等)；

雜環醯基如

雜環羰基；

雜環低烷醯基(例如雜環乙醯基，雜環丙醯基，雜環丁醯基，雜環戊醯基，雜環己醯基等)；

雜環低烯醯基(例如雜環丙烯醯基，雜環丁烯醯基，雜環戊烯醯基，雜環芳烯醯基等)；

雜環乙醛醯基；雜環氧羰基；等；

其中，適當"雜環基部份"可含飽和或未飽和，單環或多環雜環基，其含一以上雜原子如O，S，N等，係如下述且較佳"雜環羰基"可含羰基取代以如下述雜環基，例如吡咯啶羰基，吡啶羰基，吡咁羰基等。

適當"鹵羰基"可含氯羰基，溴羰基等。

適當"環低烷基"及"環低烷基部份"可爲C3～7者，例如環丙基，環丁基，環戊基，環己基等。

適當"芳基"及"芳基部份"可含C_6-C_{10}芳基，例如苯基，萘基等。

適當"雜環基部份"可含飽和或未飽和，單環或多環雜環基，含一以上雜原子，例如O，S，N等。

較佳雜環基可爲雜環基如

(1)未飽和3～8員(宜5或6員)雜單環基含1～4個氮原子，例如，吡咯基，吡咯基，咪唑基，吡唑基，吡啶基，二氫吡啶基，嘧啶基，吡咁基，嗒咁基，三唑基(例如1H-1，2，4-三唑基，4H-1，2，4-三唑基，1H-1，2，3-三唑基，2H-1，2，3-三唑基等)，四唑基(例如1H-四唑基，2H-四唑基等)等；

(2)飽和3～8員(宜5或6員)雜單環基含1～4個氮原子，例如，吡咯啶基，咪唑啶基，哌啶基，哌咁基等；

(3)未飽和稠合雜環基含1～4個氮原子，例如，吲哚基，異吲哚基，吲哚啉基，苯并咪唑基，喹啉基，四氫喹啉基(例如1，2，3，4-四氫喹啉基等)，異喹啉基，吲唑基，苯并三唑基，苯并嘧啶基(例如苯并[b]嘧啶基等)等；

(4)未飽和3～8員(宜5或6員)雜單環基含1～2個氧原子及1～3個氮原子，例如，噁唑基，異噁唑基，噁二唑基(例如1，2，4-噁二唑基，1，3，4-噁二唑基，1，2，5-噁二唑基等)等；

(5)飽和3～8員(宜5或6員)雜單環基含1～2個氧原子及1～3個氮原子，例如，嗎啉基，雪梨酮基等；

(6)未飽和稠合雜環基含1～2個氧原子及1～3個氮原子，例如，苯并噁唑基，苯并噁二唑基等；

(7)未飽和3～8員(宜5或6員)雜單環基含1～2個硫原子及1～3個氮原子，例如，噻唑基，異噻唑基，噻二唑基(例如1，2，3-噻二唑基，1，2，4-噻二唑基，1，3，4-噻二唑基，1，2，5-噻二唑基等)，二氫噻咁基等；

(8)飽和3～8員(宜5或6員)雜單環基含1～2個硫原子及1～3個氮原子，例如，噻唑啶基等；

(9)未飽和3～8員(宜5或6員)雜單環基含1～2個硫，例如，噻吩基，二氫二噻英基，二氫二亞硫基等；

(10)未飽和稠合雜環基含1～2個硫原子及1～3個氮原子，例如，苯并噻唑基，苯并噻二唑基等；

(11)未飽和 3～8 員(宜 5 或 6 員)雜單環基含 1 個氧原子，例如，呋喃基等；

(12)未飽和稠合雜環基含 1～2 個氧，例如，苯并二噁基(例如亞甲二氧苯基等)，苯并呋喃基等；

(13)未飽和 3～8 員(宜 5 或 6 員)雜單環基含 1 個氧 1～2 個硫，例如，二氫噁噻英基等；

(14)未飽和稠合雜環基含 1～2 個硫，例如，苯并噻吩基(例如苯并[b]噻吩基等)，苯并二噻英基等；

(15)未飽和稠合雜環基含 1 個氧 1～2 個硫，例如，苯并噁噻英等。

"雜環羰基"中適當"雜環基"及"雜環基部份"可如上述。

適當"含 N 雜環基"及"含 N 雜環基部份"可如上述，其中雜環基可含一以上氮原子，例如 1-吡咯啶基，嗎啉基等。

源自糖之基可爲源自如，甘油醛；醛糖例如赤蘚糖，蘇糖，阿拉伯糖，核糖，木糖，來蘇糖，葡萄糖，甘露糖或半乳糖；酮糖例如果糖或山梨糖；或二糖例如麥芽糖，乳糖或蔗糖。

上述糖之羥基保護基爲脂族醯基，例如甲醯基，或乙醯基；環醚，例如四氫-2-呋喃基或四氫-2-吡喃基；1-烷氧乙基，例如 1-甲氧乙基或 1-乙氧乙基；及矽烷基，例如三甲矽烷基，三乙矽烷基或第三丁二甲矽烷基。

R^1之適當“已取代或未取代低烷基”可含直鏈或分歧鏈低烷基(例如甲基，異丙基，新戊基等)任意取代以；

(1)鹵素(例如氟，溴等)，(2)羧基，(3)已保護羧基(例如酯

化羧基，例如乙氧羰基等），(4)氰基，(5)胺甲醯基，(6)-OCONR^{15}R^{16}[式中 R^{15}及 R^{16}各爲氫，芳基或低烷基任意取代以芳基，或 R^{13}及 R^{14}與相連氮原子共表爲飽和 5-或 6-員雜單環基，其含 1～2 個氮原子且任意含 1 個氧原子](更宜爲二甲胺甲醯氧基，甲苯胺甲醯氧基，嗎啉基羰氧基，吡咯啶羰氧基等)；(7)低烷硫基(例如甲硫基等)，(8)低烷磺醯基(例如甲磺醯基等)，(9)低烷磺醯氧基(例如甲磺醯氧基等)，(10)低烷磺醯胺基(例如甲磺醯胺基等)，(11)單或二低烷胺基任意取代以羥基，低烷氧基，醯氧基(例如苯氧基等)，或已取代或未取代芳基(例如苄胺基等)，(12)胺基；(13)醯胺基(更宜爲低烷醯胺基，例如乙醯胺基，芳醯胺基，例如苄醯胺基，或雜環羰胺基，例如吡咁羰胺基等)，(14)已保護胺基(例如甲氧羰胺基，酞醯亞胺基等)，(15)羥基，(16)醯氧基(更宜爲低烷醯氧基，例如乙醯氧基等)，(17)環低烷氧基，(18)芳氧基(例如苯氧基等)(19)已取代或未取代芳基(更宜爲苯基)，(20)飽和或未飽和 5 或 6 員雜單環基含 1～3 個氮原子，且任意含氧原子或硫原子(更宜爲哌咁基，嗎啉基，喀唑啶基，硫嗎啉基，哌啶基，吡咯啶基或三唑基)，任意取代以低烷基，羥低烷基，芳基或氧基，(21)低烷氧基(例如甲氧基，乙氧基，異丙氧基等)任意取代以羧基，已保護羧基(例如第三丁氧羰基等)，羥基，已保護羥基(例如四氫-2H-吡喃-2-基氧基等)，環低烷基(例如環丙基，環己基等)，已取代或未取代芳基(例如苯基任意取代以氰基，羧基，已保護羧基或胺甲醯基，例如苯基，2-，3-或 4-氰苯基，2-

，3-或 4-羧苯基，2-，3-或 4-(甲氧羰基)苯基，2-，3-或 4-胺甲醯苯基等)，飽和或未飽和 5-或 6-員雜環基，其含 1～2 個氮原子，任意取代以低烷基(更宜爲 2-，3-或 4-吡啶基，吡咔基或 4-甲哌咔基)(例如 2-，3-或 4-吡啶基，吡咔基等)，或-CONR^{13}R^{14}[式中 R^{13}及 R^{14}各爲氫或低烷基任意取代以芳基，或 R^{13}及 R^{14}與相連氮原子共表爲含 N 雜環基](例如嗎啉羰基，二甲胺甲醯基等)等。

適當"已取代或未取代芳基"可含 C6-10 芳基(例如苯基，萘基等)，任意取代以取以基選自一群含(1)鹵素(例如氟，氯等)，(2)羧基，(3)已保護羧基，(4)氰基，(5)-CONR^{15}R^{16}[式中 R^{15}及 R^{16}各爲氫，低烷基任意取代以羥基](例如胺甲醯基，羥乙胺甲醯基等)，(6)低烷基(例如甲基等)，(7)環低烷基(例如環丙基等)，(8)低烷氧基(例如甲氧基等)，(9)三鹵低烷基(例如三氟甲基等)，(10)雜環基例如噁唑基，(11)低烷磺醯基(例如甲磺醯基等)，(12)硝基，(13)胺基，(14)胺磺醯基及(15)已保護胺磺醯基，例如芳低烷氧羰胺磺醯基等。

其中，R^{1}之"已取代或未取代芳基"宜爲芳基任意取代以取代基選自一群含鹵素(例如苯基，4-氟苯基等)；

R^{3}之"已取代或未取代芳基"宜爲芳基任意取代以取以基選自一群含(1)鹵素，(2)羧基，(3)已保護羧基，例如酯化羧基(例如苄氧羰基等)，(4)氰基，(5)-CONR^{15}R^{16}[式中 R^{15}及 R^{16}各爲氫，低烷基任意取代以羥基]，(6)低烷基，(7)環低烷基，(8)低烷氧基，(9)三鹵低烷基，(10)雜環基，(11)低烷磺醯基，(12)硝基，(13)胺基，(14)胺磺醯基及(15)已保護胺

磺醯基等。(例如苯基，2-萘基，2-或3-氯苯基，2，3-，2，4-，3，4-或3，5-二氯苯基，3-或4-氟苯基，3-或4-氰苯基，3-或4-胺甲醯苯基，4-胺磺醯苯基，4-(苄氧羰胺磺醯基)苯基，3-羧苯基，3-(N-(2-羥乙基)胺甲醯基)苯基，3-硝苯基，3-三氟甲苯基，3-甲磺醯苯基，3-(5-噁唑基)苯基，3-甲氧苯基，3-甲苯基等)；且

R^7中"已取代或未取代芳基1"之較佳例爲芳基任意取代以低烷氧基(例如苯基，2-，3-或4-甲氧苯基等)。

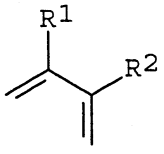
適當"已取代或未取代雜環基"可含如上述雜環基(更宜爲吡啶基，吡咪基，噁唑基，異噁唑基，呋喃基，噻吩基，喹啉基，苯并呋喃基及苯并噻吩基)，其可任意取代以取以基選自一群含(1)低烷基(例如甲基等)，(2)環低烷基(例如環丙基等)(3)低烷氧基(例如甲氧基等)，(4)醯基(例如低烷醯基，例如乙醯基等)，(5)胺基，(6)單或二低烷胺基(例如二甲胺基等)，(7)已保護胺基(例如低烷氧羰胺基例如第三丁氧羰胺基等)，(8)氰基，(9)羧基，(10)已保護羧基(例如苄氧羰基等)，(11)$-CONR^{15}R^{16}$[式中R^{15}及R^{16}各爲氫，低烷基任意取代以羥基](例如胺甲醯基，羥乙胺甲醯基等)，(12)低烯基任意取代以低烷氧基(例如乙烯基，1-乙氧乙烯基等)，(13)鹵素(例如氯，溴等)，(14)低烷硫基，(15)羥基等。

其中，R^1"已取代或未取代雜環基"之較佳例爲雜環基任意取代以低烷基或鹵素(例如2-吡啶基，5-溴-3-吡啶基，1-甲基-2-吡咯基，1-吡咯基，1-吡咯啶基，3-甲基-2-噻吩基，2-噻吩基，2-或3-呋喃基，2-噻唑基，5-噁唑基，5-甲基-

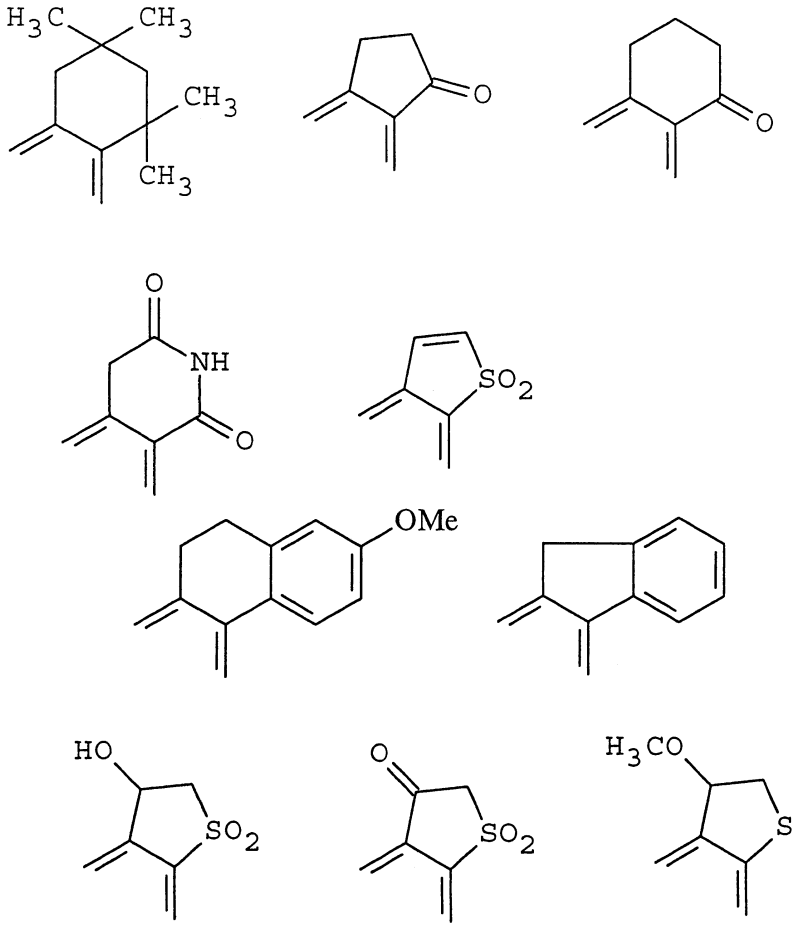
異噁唑基，3，5-二甲基-4-異噁唑基等)；及

R^3之"已取代或未取代雜環基"較佳例爲雜環基任意取代以一以上取代基選自一群含(1)低烷基，(2)環低烷基，(3)低烷氧基，(4)醯基，例如低烷醯基，(5)胺基，(6)單或二低烷胺基，(7)已保護胺基，例如低烷氧羰胺基，(8)氰基，(9)羧基，(10)已保護羧基，例如酯化羧基(例如苄氧羰基)，(11)胺甲醯基，(12)低烯基任意取代以低烷氧基，(13)鹵素，(14)低烷硫基，及(15)羥基(例如 3-或 4-吡啶基，2-吡咁基，6-甲氧基-2-吡咁基，4-或 5-噁唑基，2-苯并呋喃基，2-苯并噻吩基，3-或 6-喹啉基，2-氯-4-吡啶基，5-溴-3-吡啶基，5-氯-2-噻吩基，5，6-二氯-2-吡啶基，4-氯-2-吡啶基，5-氰基-3-吡啶基，5-羧基-3-吡啶基，5-胺甲醯基-3-吡啶基，5-(苄氧羰基)-3-吡啶基，5-(第三丁氧羰胺基)-3-吡啶基，5-胺基-3-吡啶基，2-甲氧基-4-吡啶基，3-甲氧基-5-異噁唑基，2-甲硫基-4-吡啶基，2-羥基-4-吡啶基，5-甲基-3-吡啶基，5-乙基-3-吡啶基，5-甲基-3-異噁唑基，5-乙烯基-3-吡啶基，2-乙烯基-4-吡啶基，5-乙醯基-3-吡啶基，2-二甲胺基-4-吡啶基，5-(1-乙氧乙烯基)-3-吡啶基，2-氧-1，2-二氫-4-吡啶基，或 2-甲硫基-4-吡啶基等)。

R^1及R^2可共形成低伸烷基或低伸烯基，其可任意中斷以胺基或磺醯基，且可任意取代以一群含低烷基，羥基，氧及低烷氧基，可如下式所示：



上式可含如下：



適當“已取代或未取代芳低烯基”可含 C_6-C_{10}芳低烯基，其可任意取代以鹵素(例如 2-苯乙烯基，2-(2-或 3-氯苯基)乙烯基等)。

適當"離去基"可含酸殘基，如上低烷氧基等。

上述製法可依習用方法，如製備例及/或實施例，成相似方法來製備。上述製法中，縮合雜環形成製法(如製法 1 及製法 12)，因對本發明極爲重要而詳加說明。

依製法 1，吡咯并嗒咿衍生物(I)可令 1-胺基-2-醯吡咯衍生物(II)或其鹽，與化合物(III)或其鹽，於存在觸媒量之酸

觸媒，在惰性溶劑，宜同時以物理方法除去所生成之水(例如 Dean-Stark trap)或化學方法(例如分子篩)，反應而製得。適當酸觸媒例如對甲苯磺酸，甲磺酸，氫氯酸，三氟乙酸等。適當惰性溶劑，例如，苯，甲苯，四氫呋喃等。

另一生成環之製法如製法 12 所述，此製法中，吡咯并嗒呻衍生物(I)可 1-胺吡咯衍生物(V)或其鹽，與β-二酮衍生物或其鹽，依上述製法 1 之方法反應而製得，因此，反應條件可參見製法 1。

本發明化合物可依習用純化有機化合物之方法，例如再結晶，柱層析，薄層層析，HPLC 等。化合物亦可依習用方法，例如 NMR 光譜，質譜，IR 光譜，元素分析，及測量熔點來分析。

製法 1～40 中目的化合物及原料之適鹽可參見化合物(I)所例示者。

新穎吡咯并嗒呻衍生物(I)及其藥理容許鹽對磷酸二酯酶 III(PDE III)幾乎不具强力抑制活性，但對磷酸二酯酶 IV(PDE IV)及腫瘤壞死因子有强力抑制活性。

即，吡咯并嗒呻衍生物(I)及其藥理容許鹽爲磷酸二酯酶 IV(PDE IV)及腫瘤壞死因子之生成(TNF)選擇性抑制劑。

因此，新穎吡咯并嗒呻衍生物(I)及其藥理容許鹽可用以預防及治療 PDE-IV 及 TNF 仲介疾病，例如急性發炎(例如風溼性關節炎，骨關節炎，氣腫，慢性支氣管炎，過敏性鼻炎等)，骨質疏鬆症，移植排斥，氣喘，慢性障礙性肺病(COPD)，皮膚嗜伊紅血球過多，纖維病(例如囊纖維化，肺纖維化

，肝纖維化，腎纖維化等)，(病毒洒精，藥物引發)急性及暴發性肝炎，肝皮脂腺病(洒精性及非洒精性肝皮脂腺病)，慢性(病毒及非-病毒)肝炎，肝硬化，自體免疫肝炎，胰炎，腎炎，內毒素休克，特定自體免疫疾病[例如關節强硬脊椎炎，自體免疫腦脊髓炎，自體免疫血球異常(例如溶血性尿毒症貧血，發育不全貧血，純紅血球貧血，自發性血小板減少症等)，全身性紅斑性狼瘡症(SLE)，多處軟骨炎，皮硬化，Wegener肉芽瘤，皮膚肌炎，慢性活化肝炎(Wilson氏疾病等)，重症肌無力，自發性口炎性腹瀉，自體免疫發炎性腸病(例如潰瘍性結腸炎，Crohn氏疾病等)，內分泌眼病，Grave氏疾病，肉狀瘤病，多處硬化，初級膽硬化，青少年糖尿病(I型糖尿病)，Reiter氏症，非感染性葡萄膜炎，自體免疫結膜炎(例如乾燥角膜結膜炎，青年角膜結膜炎等)，間質肺纖維化，乾癬性關節炎等]，與PDE-IV酶仲介之皮膚異常(如乾癬及其它良性或惡性增生性皮膚病，異位皮膚炎，及蕁麻疹)，神經變性疾病例如Parkinson疾病，阿茲海默氏疾病，急性及慢性多處硬化，癌惡病質，病毒感染，AIDS惡病質，血栓等。

醫療投予時，化合物(I)，或其前藥，或其鹽可單獨投予或宜混合藥理容許載體。

本發明活性成份可作爲醫藥製劑，例如，固體，半固體或液體形式，其含化合物(I)爲活性成份，混合有機或無機載體或賦形劑適於外用(局部)，腸內，靜脈，肌肉，非腸胃或粘膜施用。活性成份可處方以習用無毒製藥容許載體以製備油

膏，乳液，膏狀，錠劑，粒劑，膠囊，栓劑，溶液(如食鹽水)，乳劑，懸浮液(如橄欖油)，氣溶膠，丸劑，粉，漿液，注射液，小丸，泥敷劑，芳香水，洗液，鼻劑，舌下錠劑，鼻滴劑，及任何其它適當形式以使用。可用載體爲水，蠟，葡萄糖，乳糖，阿拉伯膠，明膠，甘露糖醇，澱粉，三矽酸鎂，滑石，玉米澱粉，角蛋白，石蠟，膠狀矽膠，馬鈴薯澱粉，尿及其它適於製備固體，半固體，或液體形式之載體，亦可用輔助劑，穩定劑，增稠劑，及著色劑及香料。製藥組成物中含有效量之活性化合物足以得到欲得效果以治療疾病。

活性成份可製備得口投予製劑，注射用製劑，外用製劑，吸入製劑，及粘膜投予製劑。

此外，本發明化合物可與其它醫療化合物組合使用。特爲，本發明 PDE4 抑制化合物宜組合使用與 i)白三烯受體拮抗劑，ii)白三烯合成抑制劑，iii)COX-2 選擇性抑制劑，iv)statins，v)NSAIDs，vi)M2/M3 拮抗劑，vii)皮質類固醇，viii)Hi(組胺酸)受體拮抗劑，ix)β 2 腎上腺受體拮抗劑，x)干擾素，xi)抗肝炎 C 病毒藥(HCV)例如蛋白質酶抑制劑，螺旋酶抑制劑，聚合酶抑制劑等，xii)抗肝炎 B 病毒藥例如 lamivudine，xiii)烏索脫氧胆酸(ursodesoxycholic acid)，xiv)甘草甜素，xv)人生長因子(HGF)，xvi)胺基水楊酸例如 salazosulfapyridine，mesalazin 等，xvii)膽固醇例如 prednisolone farnesylate，xviii)免疫抑制劑例如 azathioprine，6-硫氫嘌呤，tacrolimus 等。

本發明可用以治療哺乳動物含家畜哺乳類如牛，馬等，家畜動物如狗，貓，鼠等，以及人類，宜爲人類。

化合物(I)之醫療有效劑量雖依各受療患者之年齡及狀況改變，人之平均單一劑量中化合物(I)爲 0.01 mg，0.1 mg，1 mg，10 mg，50 mg，100 mg，250 mg，500 mg，及及 1000 mg 可有效治療上述疾病。一般而言，每日可投予 0.01 mg/個體至 1，000 mg/個體。

爲闡明本發明吡咯并嗒咔衍生物(I)及其藥理容許鹽之效果，下列爲吡咯并嗒咔衍生物(I)代表化合物之藥理試驗數據。

(a) U937 磷酸二酯酶 IV(PDE IV)之抑制作用

1. 試驗方法：

將培養 U937 細胞以磷酸鹽-緩衝食鹽水(PBS)洗 2 次，以細胞刮器收集。離心後，將細胞製粒懸浮在均質緩衝液(0.5 % 去氧氯酸鹽[DOC]，5 mM 2-硫氫乙醇，1 μM 亮肽素，100 μM PMSF，20 μM 對三苯甲基-L-離胺酸-氯甲酮[TLCK]在 PBS)。以超音波振盪數分鐘，以玻璃-Teflon 均質器振盪 20 次。將均質液離心於 200g 下 30 分鐘，再於 100，000 x g 下離心 90 分鐘(4℃)。將上清液以滲析緩衝液滲析，其爲如均質緩衝液但不含 DOC。將酶製備滲析液貯存在-20℃直到分析。

使用 PDE4，其活性可用磷酸二酯酶 [^{3}H]cAMP SPA 酶分析系(Amersham Pharmacia Biotech)估計，之 96 穴平板。反應之起始係由加入 0.025 μCi/well 之[^{3}H]cAMP 至酶混液含

50 mM Tris-HCl(pH 7.5)，8.3 mM $MgCl_2$，1.7 mM EGTA，及各濃度試驗化合物或載體。反應中亦加入 CI-930(10 μM 終濃度)，PDE3 專一性抑制劑。於 30℃培養 15 分鐘，各穴中加入 50 μL 之 SPA 懸浮液。以平板混合器振盪 20 分鐘。以 Top Counter 測量各穴同位素活性。

將試驗化合物溶在 100% 二甲亞碸(DMSO)，稀釋至欲得濃度且終溶液含 1% v/v 之 DMSO。

試驗化合物對 PDE4 酶活性之 IC_{50} 值由化合物處理組，相對於對照組之百分抑制率，以對數轉換回歸分析而計算得。百分抑制率可用下式計算：抑制作用(%)= {1-(C-B)/(A-B)} x 100；其中 A，B 及 C 各爲對照組，空白組及化合物處理組中同位素活性之平均。

2. 試驗結果

代表化合物(I)對 PDE-IV 之抑制作用如下：

實施例	化合物	IC50(μM)
198	6-{4-[4-(胺羰基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咔-3-基}己酸	<1

(b)人單核細胞 TNF-α 生成之抑制作用

1. 試驗方法

(1)人末梢血單核細胞(PBMCs)之製備

從健康志願者採末梢血(每人 30ml)，次分爲 15ml 加至含肝素之圓管，加入等量 RPMI1640。在稀釋血上加以 20 mL 之 Ficoll-Paque PLUS(Amersham Pharmacia Biotech)在聚苯乙烯離心管。於 1,600rpm 離心 30 分鐘，以小管收集散布在梯度中層之細胞，清洗以 40 mL 之 RPMI1640 數次，並於

1,200 rpm 離心 10 分鐘。將 PBMC 沈澱，懸浮在 RPMI1640 含 1%小牛血清及抗生素。數細胞後，製得 3 x 10^6 細胞/mL 之細胞液。

(2)由激活 PBMS 所產生 TNF-α

人 PBMC 可由 Ficoll-Paque PLUS 密度梯度方法製得，懸浮在上述培養液以得 3 x 10^6 細胞/mL 之濃度，將 0.5 mL 懸浮液置於 24-穴培養平板。加以 0.25 mL 之 LPS 及 0.25 mL 藥物或載體，將細胞置於 CO_2 培養器培養 24 小時。培養液中 LPS 終濃度爲 1 μg/mL。24 小時後，將各穴上清液於 1,700 rpm 離心 10 分鐘，貯於-80℃直到分析。使用 ELISA 測量培養液中 TNF-α 之量。

藥物對 LPS 激活 PBMC 所產生細胞激素之 IC_{50} 值，可將藥物處理組相較於載體處理組所產生細胞激素，作回歸分析而估計。

試驗結果

實施例	化合物	IC50(nM)
198	6-{4-[4-(胺羰基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}己酸	<100

【實施方式】

本發明之最佳進行形式

下列實施例可更闡明本發明化合物之製備。但本發明範圍並不僅限於此。此外，本發明並不僅限於下列實施例之化合物，本發明亦包含化合物或其部份之任何組合。熟知此藝者明瞭可使用下列製備方法之已知變異來製備化合物。

原料及中間產物可依習知方法，例如實施例或其相當方法而製備。

製備例，實施例及處方例之縮寫如下：

DMF	N，N-二甲基甲醯胺
EtOAc 或 AcOEt	乙酸乙酯
THF	四氫呋喃
Et3N	三乙胺
MeOH	甲醇
EtOH	乙醇
BuOH	丁醇
DCM	二氯甲烷
Pd/C	Pd-C

製備例 1

將 2-吡啶乙硫醇(17 g)溶在四氫呋喃(200 mL)，於冰水浴及氮氣下加入三乙胺(15.5 g)。於低於 10℃及 30 分鐘下加入含 4-氰苄醯氯(25.3 g)之四氫呋喃(80 mL)。15 分鐘後，移除冰浴，於室溫下攪拌過夜。真空濃縮。將殘渣分層於氯仿及水。將有機層清洗以飽和重碳酸鈉溶液及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣(38 g)碾製以異丙醚可得 S-(2-吡啶基)4-氰苯硫代羥酸酯(32.5 g)之淡棕色固體。

S-(2-吡啶基)4-氰苯硫代羥酸酯

NMR($CDCl_3$，δ)：7.38(1H，t，J=7Hz)，7.72(1H，d，J=8Hz)，7.75-7.87(3H，m)，8.11(2H，d，J=8Hz)，8.71(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 241(M+H)

下列化合物可仿製備例 1 之方法製備。

製備例 2

S-(2-吡啶基)2-氯-4-吡啶硫代羥酸酯

NMR($CDCl_3$，δ)：7.40(1H，m)，7.65-7.75(2H，m)，7.75-7.90(2H，m)，8.62(1H，d，J=5Hz)，8.70(1H，m)

製備例 4

S-(2-吡啶基)3-氰苯硫代羥酸酯

NMR($CDCl_3$，δ)：7.39(1H，m)，7.66(1H，t，J=8Hz)，7.72(1H，t，J=8Hz)，7.83(1H，m)，7.91(1H，d，J=8Hz)，8.24(1H，d，J=8Hz)，8.29(1H，s)，8.71(1H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 241(M+H)

製備例 5

S-(2-吡啶基)3-甲氧苯硫代羥酸酯

NMR($CDCl_3$，δ)：3.87(3H，s)，7.16(1H，m)，7.32-7.44(2H，m)，7.51(1H，m)，7.63(1H，d，J=8Hz)，7.71-7.83(2H，m)，8.69(1H，m)

製備例 6

S-(2-吡啶基)4-吡啶硫代羥酸酯

NMR($CDCl_3$，δ)：7.35-7.43(1H，m)，7.73(1H，d，J=8Hz)，7.77-7.88(3H，m)，8.70(1H，d，J=7Hz)，8.85(2H，d，J=8Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 217

製備例 7

S-(2-吡啶基)2-吡咿硫代羥酸酯

NMR($CDCl_3$，δ)：7.38(1H，m)，7.71(1H，d，J=8Hz)，7.82(1H，m)，8.73(2H，m)，8.86(1H，m)，9.17(1H，s)

製備例 8

S-(2-吡啶基)3-吡啶硫代羥酸酯

NMR($CDCl_3$，δ)：7.37(1H，m)，7.46(1H，m)，7.73(1H，m)，7.83(1H，m)，8.27(1H，m)，8.68(1H，m)，8.84(1H，m)，9.23(1H，m)

製備例 9

將 2-乙基-1H-吡咯溶在甲苯(120 mL)，於乾冰-丙酮浴下，於低於-60℃及 30 分鐘下滴加入 1M 甲溴化鎂之四氫呋喃(170 mL)。於冰水浴中攪拌 40 分鐘。於乾冰-丙酮浴下，於 10 分鐘內分批加入 S-(2-吡啶基)4-氰苯硫代羥酸酯(15.2 g)。攪拌 1.5 小時，加入飽和氯化銨溶液(100 mL)，回温至室温。分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以 1N NaOH(100 mL)2 次，水，及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。碾製以異丙醚可得 4-[(5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄腈(12.7 g)淡黃色固體。

4-[(5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.32(3H，t，J=8Hz)，2.75(2H，q，J=8Hz)，6.11(1H，d，J=5Hz)，6.76(1H，d，J=5Hz)，7.77(2H，d，J=8Hz)，7.94(2H，d，J=8Hz)，9.49(1H，br s)

MS(ESI^+)：m/z 225(M+H)

下列化合物可仿製備例 9 之方法製備。

製備例 10

(2E)-1-(5-乙基-1H-吡咯-2-基)-3-苯基-2-丙烯-1-酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.31(3H，t，J=7Hz)，2.73(2H，q，J=7Hz)，6.10(1H，m)，7.02(1H，m)，7.27(1H，d，J=16Hz)，7.35-7.43(3H，m)，7.63(2H，m)，7.79(1H，d，J=16Hz)

MS(ESI^+)：m/z 226(M+H)

製備例 11

將 4-[(5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]-苄腈(12.5 g)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(63 mL)，於冰水浴及氮氣下加入 60%NaH 之油(2.68 g)。30 分鐘後，加入 1-(胺氧基)-2，4-二硝苯(13.3 g)。2 小時後，分層於乙酸乙酯及水。將水層萃取以乙酸乙酯。將結合有機層清洗以水(100 mL)3 次，1N NaOH(100 mL)，及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以驟矽膠柱層析純化(矽膠，500 mL)，溶離以己烷-氯仿 = 1-2，1-5，及 1-10，碾製以異丙醚可得 4-[(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄腈(8.1 g，60.7%)之黃色固體。將混液及母液(7 g)以驟矽膠柱層析純化(矽膠，200 mL)，溶離以己烷-氯仿 = 2-1 及 1-1，碾製以異丙醚可得 4-[(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄腈(2.0 g，15%)淡黃色固體。

4-[(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]-苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.29(3H，t，J=8Hz)，2.77(2H，q，J=8Hz)，5.75(2H，br s)，5.94(1H，d，J=5Hz)，6.59(1H，d，J=5Hz)，7.76(2H，d，J=8Hz)，7.85(2H，d，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 240(M+H)

下列化合物可依製備例 11 之方法製備。

製備例 12

(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)(2-氯-4-吡啶基)甲酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.29(3H，t，J=7Hz)，2.77(2H，q，J=7Hz)，5.71(2H，s)，5.96(1H，d，J=4Hz)，6.63(1H，d，J=4Hz)，7.50(1H，d，J=4Hz)，7.61(1H，s)，8.52(1H，d，J=4Hz)

MS：(m/z)250(M+H)

製備例 13

3-[(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]-苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.29(3H，t，J=7Hz)，2.77(2H，q，J=7Hz)，5.74(2H，s)，5.94(1H，d，J=5Hz)，6.59(1H，d，J=5Hz)，7.59(1H，t，J=8Hz)，7.82(1H，d，J=8Hz)，8.00(1H，d，J=8Hz)，8.06(1H，s)

製備例 14

(2E)-1-(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)-3-苯基-2-丙烯-1-酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.28(3H，t，J=7Hz)，2.73(2H，q，J=7Hz)，5.93(1H，d，J=5Hz)，6.99(1H，d，J=5Hz)，7.30(1H，d，J=16Hz)，7.37-7.43(3H，m)，7.62(2H，m)，7.74(1H，d，J=16Hz)

MS(ESI^+)：m/z 241(M+H)

製備例 15

(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)(3-甲氧苯基)-甲酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.26(3H，t，J=7Hz)，2.75(2H，q，J=7Hz)

，3.86(3H，s)，5.79(2H，s)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.67(1H，d，J=4Hz)，7.07(1H，m)，7.29-7.40(3H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 245

製備例 16

(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)(4-吡啶基)甲酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.29(3H，t，J=7Hz)，2.77(2H，q，J=7Hz)，5.76(2H，s)，5.94(1H，d，J=4Hz)，6.63(1H，d，J=4Hz)，7.58(2H，d，J=7Hz)，8.75(2H，d，J=7Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 216

製備例 17

(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)(2-吡啡基)甲酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.29(3H，t，J=7Hz)，2.77(2H，q，J=7Hz)，5.79(2H，s)，5.98(1H，d，J=4Hz)，7.27(1H，d，J=4Hz)，8.63(1H，m)，8.71(1H，m)，9.17(1H，m)

製備例 18

(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)(3-吡啶基)甲酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.29(3H，t，J=7Hz)，2.77(2H，q，J=7Hz)，5.78(2H，s)，5.94(1H，d，J=4Hz)，6.65(1H，d，J=4Hz)，7.39(1H，m)，8.06(1H，m)，8.74(1H，m)，8.99(1H，m)

製備例 19

(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)(5-溴-3-吡啶基)-甲酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.29(3H，t，J=7Hz)，2.76(2H，q，J=7Hz)，5.72(2H，s)，5.96(1H，m)，6.65(1H，m)，8.19(1H，m)，8.70(1H，m)，8.89(1H，m)

製備例 20

將 3-氧丁酸第三丁酯(20.0 g)溶在四氫呋喃(200 mL)，於冰水浴及氮氣及 20 分鐘內，分批加入 60%NaH 之油(5.56 g)。40 分鐘後，於同溫加入 5-碘戊酸乙酯(35.6 g)。15 分鐘後，於室溫下攪拌。1 小時後，於 50℃下加熱 24 小時。將冷却液分層於乙酸乙酯及水。將水層萃取以乙酸乙酯。將結合有機層清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以驟矽膠柱層析純化(矽膠，1 L)，溶離以己烷-乙酸乙酯 = 50-1，20-1，10-1，及 8-1 可得 2-乙醯庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯(27.3 g，75.4%)之無色油。

2-乙醯庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.20-1.38(5H，m)，1.46(9H，s)，1.54-1.71(2H，m)，1.75-1.87(2H，m)，2.12(3H，s)，2.30(2H，t，J=8Hz)，3.30(12H，t，J=8Hz)，4.11(2H，q，J=8Hz)

下列化合物可依製備例 20 之方法製備。

製備例 21

2-乙醯壬二酸 1-第三丁酯 9-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23-1.33(9H，m)，1.46(9H，s)，1.55(2H，m)，1.77(2H，m)，2.21(3H，s)，2.28(2H，t，J=7Hz)，3.27(1H，t，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)

MS(ESI^+)：m/z 315(M+H)

製備例 22

2-乙醯己酸第三丁酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.90(3H，t，J=8Hz)，1.28-1.40(4H，

m)，1.46(9H，s)，1.73-1.89(2H，m)，2.22(3H，s)，3.30(1H，t，J=8Hz)

製備例 23

2-乙醯辛二酸 1-第三丁酯 8-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.21-1.33(7H，m)，1.46(9H，s)，1.54-1.69(2H，m)，1.74-1.85(2H，m)，2.21(3H，s)，2.28(2H，t，J=8Hz)，3.29(1H，t，J=8Hz)，4.12(2H，q，J=8Hz)

製備例 24

將氯化鎂(1.33 g)溶在二氯甲烷(40 mL)，於室温及氮氣下加入 2-乙醯庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯(4.0 g)。於冰浴下滴加入吡啶(2.26 mL)。於室温下攪拌 40 分鐘。於 2 分鐘內滴加入 3-氰苄醯氯(3.01 g)之二氯甲烷(6 mL)。於室温下攪拌 2 小時。於冰浴下加入 1N HCl 及乙酸乙酯。將有機層清洗以 1NHCl，水，及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得固體。將殘渣以驟矽膠柱層析純化(矽膠，300 mL)，溶離以己烷-乙酸乙酯= 10-1，8-1，5-1，及 3-1 可得 2-乙醯基-2-(3-氰苄醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯(4.23 g，72.9%)之無色油。

2-乙醯基-2-(3-氰苄醯基)-庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=8Hz)，1.28-1.40(11H，m)，1.63-1.75(2H，m)，2.19-2.28(2H，m)，2.32(2H，t，J=8Hz)，2.45(3H，s)，4.11(2H，q，J=8Hz)，7.56(1H，t，J=8Hz)，7.80(2H，dd，J=8，1Hz)，7.95(2H，dd，J=8，1Hz)，8.06(1H，br s)

MS(ESI$^+$)：m/z 416(M+H)

下列化合物可依製備例 24 之方法製備。

製備例 25

2-異丁醯基-4-甲基-3-氧戊酸乙酯

NMR(300 MHz，$CDCl_3$，δ)：1.10-1.23(12H，m)，1.30-1.43(3H，m)，2.91-3.10(2H，m)，4.21-4.36(2H，m)

製備例 26

2-(2-氯苄醯基)-4-甲基-3-氧戊酸乙酯

NMR(300 MHz，$CDCl_3$，δ)：0.79(3H，t，J=7.5Hz)，1.22(6H，d，J=7.5Hz)，3.36-3.54(1H，m)，3.88(2H，q，J=7.5Hz)，7.26-7.44(4H，m)

製備例 27

4-甲基-2-(2-萘甲醯基)-3-氧戊酸乙酯

NMR(300 MHz，$CDCl_3$，δ)：0.76-1.03(3H，m)，1.10-1.30(6H，m)，2.56-2.71(1/2H，m)，2.88-3.04(1/6H，m)，3.20-3.35(1/3H，m)，3.72-4.336(3H，m)，7.50-7.68(2+1/3H，m)，7.82-8.01(3+2/3H，m)，8.09(1/3H，s)，8.35(1/2H，s)，8.41(1/6H，s)

MS(ES+)：m/e 313.45

製備例 28

2-乙醯基-2-[3-(三氟甲基)苄醯基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.32(9H，s)，1.36-1.75(4H，m)，2.15-2.36(4H，m)，2.45(3H，s)，4.11(2H

，q，J=7Hz)，7.56(1H，t，J=8Hz)，7.79(1H，d，J=8Hz)，7.93(1H，d，J=8Hz)，8.04(1H，s)

製備例 29

2-乙醯基-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.27-1.42(2H，m)，1.34(9H，s)，1.65-1.77(2H，m)，2.16-2.35(4H，m)，2.39(3H，s)，2.43(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，7.87(1H，s)，8.56(1H，s)，8.73(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 406(M+H)

製備例 30

2-(甲氧乙醯基)-2-[(3-甲氧基-5-異噁唑基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.39(9H，s)，1.35-1.50(2H，m)，1.64-1.75(2H，m)，2.15-2.23(2H，m)，2.32(2H，t，J=7Hz)，3.40(3H，s)，4.01(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.57(2H，s)，6.54(1H，s)

製備例 31

2-乙醯基-2-[3-(1，3-噁唑-5-基)苄醯基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.33(9H，s)，1.30-1.43(2H，m)，1.62-1.76(2H，m)，2.17-2.35(4H，m)，2.44(3H，s)，4.09(2H，q，J=7Hz)，7.42(1H，s)，7.48(1H，t，J=8Hz)，7.69(1H，d，J=8Hz)，7.82(1H，d，J=8Hz)

，7.94(1H，s)，8.09(1H，m)

製備例 32

2-乙醯基-2-(3，4-二氯苄醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.43(2H，m)，1.35(9H，s)，1.63-1.74(2H，m)，2.15-2.34(4H，m)，2.41(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，7.48(1H，d，J=8Hz)，7.56(1H，dd，J=2，8Hz)，7.88(1H，d，J=2Hz)

製備例 33

2-乙醯基-2-[(4-氯-2-吡啶基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23-1.30(3H，m)，1.25(9H，s)，1.40-1.58(2H，m)，1.65-1.77(2H，m)，2.10-2.21(2H，m)，2.35(2H，t，J=7Hz)，2.61(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，7.39(1H，m)，8.04(1H，m)，8.43(1H，d，J=5Hz)

MS(ESI^+)：m/z 426(M+H)

製備例 34

2-[(5-氯-2-噻吩基)羰基]-2-(甲氧乙醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.25-1.40(2H，m)，1.41(9H，s)，1.62-1.74(2H，m)，2.26-2.37(4H，m)，3.37(3H，s)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.30(1H，d，J=17Hz)，4.42(1H，d，J=17Hz)，6.92(1H，d，J=4Hz)，7.39(1H，d，J=4Hz)

製備例 35

2-乙醯基-2-[(6-甲氧基-2-吡啉基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.26(9H，s)，1.38-1.49(2H，m)，1.66-1.80(2H，m)，2.14-2.26(2H，m)，2.33(2H，t，J=7Hz)，2.57(3H，s)，3.90(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，8.37(1H，s)，8.83(1H，s)

製備例 36

2-乙醯基-2-(1-苯并呋喃-2-基羰基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.33(9H，s)，1.38-1.55(2H，m)，1.64-1.77(2H，m)，2.23-2.36(4H，m)，2.49(3H，s)，4.08(2H，q，J=7Hz)，7.32(1H，m)，7.46(2H，m)，7.54(1H，s)，7.71(1H，d，J=8Hz)

製備例 37

2-乙醯基-2-(1-苯并噻吩-2-基羰基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.45(2H，m)，1.39(9H，s)，1.62-1.75(2H，m)，2.25-2.38(4H，m)，2.40(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，7.36-7.51(2H，m)，7.76(1H，s)，7.82-7.88(2H，m)

製備例 38

2-乙醯基-2-(1，3-噁唑-5-基羰基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.45(2H，

m)，1.38(9H，s)，1.63-1.77(2H，m)，2.15-2.27(2H，m)，2.30(2H，t，J=7Hz)，2.43(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，7.80(1H，s)，7.93(1H，s)

製備例 39

2-乙醯基-2-苄醯基庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.26(3H，t，J=7Hz)，1.20-1.40(2H，m)，1.32(9H，s)，1.60-1.73(2H，m)，2.26-2.38(4H，m)，2.40(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，7.36-7.78(5H，m)

製備例 40

2-乙醯基-2-(6-喹啉羰基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.21(3H，t，J=7Hz)，1.30(9H，s)，1.32-1.47(2H，m)，1.64-1.77(2H，m)，2.26-2.38(4H，m)，2.46(3H，s)，4.08(2H，q，J=7Hz)，7.48(1H，m)，8.04(1H，dd，J=2 Hz，8Hz)，8.13(1H，d，J=8Hz)，8.23(1H，d，J=8Hz)，8.28(1H，d，J=2Hz)，9.00(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 442(M+H)

製備例 41

2-乙醯基-2-[4-({[(苄氧基)羰基]胺基}磺醯基)苄醯基]-壬二酸 1-第三丁酯 9-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23-1.37(11H，m)，1.60(9H，s)，2.15-2.31(4H，m)，2.46(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，5.10(2H，s)，7.26-7.40(5H，m)，7.65(1H，s，br)，7.84(2H，d，J=9Hz)，8.06(2H，d，J=9Hz)

製備例 42

2-乙醯基-2-(2-氯異菸鹼醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.20-1.40(14H，m)，1.61-1.75(2H，m)，2.19-2.28(2H，m)，2.20(2H，t，J=8Hz)，2.31(2H，t，J=8Hz)，2.46(3H，s)，4.11(2H，q，J=8Hz)，7.41(1H，dd，J=7，1Hz)，7.55(1H，d，J=1Hz)，8.50(1H，d，J=7Hz)

製備例 43

2-乙醯基-2-[3-(甲磺醯基)苄醯基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=8Hz)，1.27-1.40(11H，m)，1.61-1.75(2H，m)，2.19-2.35(4H，m)，2.46(3H，s)，3.07(3H，s)，4.10(2H，q，J=8Hz)，7.65(1H，t，J=8Hz)，7.99(1H，dd，J=8，1Hz)，8.09(2H，br d，J=8Hz)，8.34(1H，br s)

製備例 44

2-乙醯基-2-(3-硝苄醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.30-1.39(12H，m)，1.61-1.75(2H，m)，2.19-2.35(4H，m)，2.47(3H，s)，4.10(2H，q，J=8Hz)，7.63(1H，t，J=8Hz)，8.09(1H，br d，J=8Hz)，8.39(1H，br d，J=8Hz)，8.60(1H，br s)

製備例 45

2-乙醯基-2-(4-氰苄醯基)己酸第三丁酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.90(3H，t，J=8Hz)，1.20-1.44(13H，m)，2.15-2.25(2H，m)，2.45(3H，s)，7.70(2H，d，J=8Hz)，7.83(2H，d，J=8Hz)

製備例 46

2-乙醯基-2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.36(9H，s)，1.32-1.45(2H，m)，1.65-1.77(2H，m)，2.18-2.28(2H，m)，2.32(2H，t，J=7Hz)，2.45(3H，s)，4.11(2H，q，J=7Hz)，8.20(1H，m)，8.80(2H，m)

MS：(m/z)470，472(M+H)

製備例 47

2-(2-氯異菸鹼醯基)-2-[(甲硫基)乙醯基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.37(9H，s)，1.23-1.45(2H，m)，1.63-1.77(2H，m)，2.05(3H，s)，2.16-2.28(2H，m)，2.32(2H，t，J=7Hz)，3.16(1H，d，J=17Hz)，4.07(1H，d，J=17Hz)，4.11(2H，q，J=7Hz)，7.68(1H，d，J=5Hz)，7.87(1H，s)，8.49(1H，d，J=5Hz)

製備例 48

2-(4-氟苄醯基)-3-氧丁酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：(互變異構物之混合物)0.97及1.02(3H，t，J=7Hz)，2.07及2.42(3H，s)，4.01及4.13(2H，q，J=7Hz)，7.06-7.18，7.56，及7.85(4H，m)

MS(ESI^+)：m/z 275(M+H)

製備例 49

2-乙醯基-2-(3-氰苄醯基)辛二酸 1-第三丁酯 8-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.21-1.46(16H，m)，1.56-1.70(2H，m)，2.15-2.25(2H，m)，2.29(2H，t，J=8Hz)，2.45(3H，s)，4.12(2H，q，J=8Hz)，7.56(1H，t，J=8Hz)，7.80(2H，dd，J=8，1Hz)，7.95(2H，dd，J=8，1Hz)，8.05(1H，br s)

製備例 50

2-乙醯基-2-[(6-氯-2-吡啶基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.27(9H，s)，1.20-1.78(4H，m)，2.08(2H，t，J=7Hz)，2.26-2.40(2H，m)，2.69(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，7.43(1H，d，J=8Hz)，7.81(1H，t，J=8Hz)，7.96(1H，d，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 426

製備例 51

2-乙醯基-2-(3-甲氧苄醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，m)，1.34(9H，s)，1.20-1.92(4H，m)，2.10-2.38(4H，m)，2.41(3H，s)，3.84(3H，s)，4.04-4.22(2H，m)，7.08(1H，br)，7.23-7.40(3H，m)

製備例 52

2-乙醯基-2-(3，5-二氯苄醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.26-1.40(2H，m)，1.36(9H，s)，1.63-1.76(2H，m)，2.15-2.36(4H，m)，2.43(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，7.51(1H，m)，7.60(2H，m)

製備例 53

2-乙醯基-2-[(5-氯-2-噻吩基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.40(9H，s)，1.30-1.90(4H，m)，2.20-2.35(4H，m)，2.38(3H，s)，4.11(2H，q，J=7Hz)，6.91(1H，d，J=4Hz)，7.32(1H，d，J=4Hz)

製備例 54

2-乙醯基-2-(3-氟苄醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.35(9H，s)，1.35-1.45(2H，m)，1.64-1.74(2H，m)，2.16-2.35(4H，m)，2.42(3H，s)，4.09(2H，q，J=7Hz)，7.24(1H，m)，7.35-7.43(1H，m)，7.46-7.53(2H，m)

製備例 55

2-乙醯基-2-(3-喹啉羰基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.22(3H，t，J=7Hz)，1.33(9H，s)，1.33-1.53(2H，m)，1.65-1.78(2H，m)，2.25-2.43(4H，m)，2.47(3H，s)，4.08(2H，q，J=7Hz)，7.63(1H，t，J=8Hz)，7.81-7.87(1H，t，J=8Hz)，7.91(1H，d，J=8Hz)，8.56(1H，m)，9.24(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 442

製備例 56

2-乙醯基-2-異菸鹼醯基庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.31(9H，s)，1.30-1.45(2H，m)，1.65-1.76(2H，m)，2.18-2.28(2H，m)，2.31(2H，t，J=7Hz)，2.45(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)

，7.52(2H，d，J=7Hz)，8.75(2H，d，J=7Hz)

製備例 57

2-乙醯基-2-[(3-甲氧基-5-異噁唑基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.39(9H，s)，1.35-1.50(2H，m)，1.62-1.75(2H，m)，2.11-2.23(2H，m)，2.33(2H，t，J=7Hz)，2.49(3H，s)，4.01(3H，s)，4.11(2H，q，J=7Hz)，6.53(1H，s)

製備例 58

2-乙醯基-2-[(5-甲基-3-異噁唑基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.31-1.48(2H，m)，1.37(9H，s)，1.63-1.75(2H，m)，2.18-2.26(2H，m)，2.31(2H，t，J=7Hz)，2.47(3H，s)，2.50(3H，s)，4.11(2H，q，J=7Hz)，6.38(1H，s)

製備例 59

2-(2-氯異菸鹼醯基)-2-(甲氧乙醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.32-1.45(2H，m)，1.36(9H，s)，1.64-1.78(2H，m)，2.16-2.28(2H，m)，2.31(2H，t，J=7Hz)，3.36(3H，s)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.25(1H，d，J=17Hz)，4.39(1H，d，J=17Hz)，7.39(1H，d，J=5Hz)，7.54(1H，s)，8.50(1H，d，J=5Hz)

MS(ESI^+)：m/z 456

製備例 60

2-(甲氧乙醯基)-2-(3-甲氧苄醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.22(3H，t，J=7Hz)，1.25-1.33(2H，m)，1.34(9H，s)，1.60-1.75(2H，m)，2.15-2.40(4H，m)，3.38(3H，s)，3.83(3H，s)，4.08(2H，q，J=7Hz)，4.39(1H，d，J=17Hz)，4.55(1H，d，J=17Hz)，7.07(1H，m)，7.26-7.34(3H，m)

MS(ESI^+)：m/z 451

製備例 61

2-(甲氧乙醯基)-2-(6-喹啉羰基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.32(9H，s)，1.30-1.50(2H，m)，1.65-1.78(2H，m)，2.26-2.44(4H，m)，3.38(3H，s)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.38(1H，d，J=17Hz)，4.57(1H，d，J=17Hz)，7.47(1H，m)，8.03(1H，d，J=8Hz)，8.13(1H，d，J=8Hz)，8.28(1H，d，J=8Hz)，8.27(1H，s)，9.01(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 472

製備例 62

2-(甲氧乙醯基)-2-(3-吡啶羰基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.47(2H，m)，1.35(9H，s)，1.63-1.78(2H，m)，2.22-2.38(4H，m)，3.37(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.32(1H，d，J=17Hz)，4.45(1H，d，J=17Hz)，7.37(1H，m)，8.03(1H，m)，8.73(1H

，m)，8.92(1H，m)

製備例 63

2-(3-氯苄醯基)-2-(甲氧乙醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.35(9H，s)，1.20-1.50(2H，m)，1.60-1.73(2H，m)，2.25-2.35(4H，m)，3.37(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.35(1H，d，J=17Hz)，4.50(1H，d，J=17Hz)，7.34(1H，m)，7.48(1H，d，J=8Hz)，7.59(1H，d，J=8Hz)，7.73(1H，m)

製備例 64

2-乙醯基-2-(3-甲基苄醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.40(2H，m)，1.33(9H，s)，1.60-1.72(2H，m)，2.10-2.38(4H，m)，2.21(3H，s)，2.39(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，7.26-7.36(2H，m)，7.48-7.62(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 405

製備例 67

2-(甲氧乙醯基)-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.36(9H，s)，1.30-1.45(2H，m)，1.62-1.76(2H，m)，2.20-2.36(4H，m)，2.40(3H，s)，3.38(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.34(1H，d，J=17Hz)，4.49(1H，d，J=17Hz)，7.86(1H，s)，8.56(1H，s)，8.73(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 436

製備例 68

2-乙醯基-2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.36(9H，s)，1.32-1.45(2H，m)，1.65-1.77(2H，m)，2.18-2.28(2H，m)，2.32(2H，t，J=7Hz)，2.45(3H，s)，4.11(2H，q，J=7Hz)，8.20(1H，m)，8.80(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 470，472

製備例 69

2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-2-(甲氧乙醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.44(2H，m)，1.37(9H，s)，1.65-1.77(2H，m)，2.18-2.36(4H，m)，3.36(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.28(1H，d，J=17Hz)，4.40(1H，d，J=17Hz)，8.18(1H，m)，8.80(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 500，502

製備例 70

2-乙醯基-2-[(5，6-二氯-3-吡啶基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.25-1.40(2H，m)，1.38(9H，s)，1.65-1.75(2H，m)，2.18-2.27(2H，m)，2.28-2.37(2H，m)，2.44(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，8.13(1H，d，J=2Hz)，8.57(1H，d，J=2Hz)

製備例 71

2-(甲氧乙醯基)-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.36(9H，s)，1.60-1.80(2H，m)，2.20-2.45(4H，m)，2.39(3H，s)，3.38(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.38(1H，d，J=18Hz)，4.50(1H，d，J=18Hz)，7.87(1H，s)，8.55(1H，s)，8.73(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 422

製備例 72

2-(甲氧乙醯基)-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.37(9H，s)，2.23-2.70(4H，m)，2.39(3H，s)，3.37(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.32(1H，d，J=18Hz)，4.43(1H，d，J=18Hz)，7.84(1H，s)，8.55(1H，s)，8.73(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 408

製備例 73

2-乙醯基-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.34(9H，s)，1.60-1.75(2H，m)，2.20-2.39(4H，m)，2.39(3H，s)，2.46(3H，s)，4.11(2H，q，J=7Hz)，7.87(1H，s)，8.56(1H，s)，8.73(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 392

製備例 74

2-乙醯基-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.36(9H，s)，2.39(3H，s)，2.44(3H，s)，2.35-2.47(2H，m)，2.56-2.70(2H，m)，4.11(2H，q，J=7Hz)，7.88(1H，s)，8.56(1H，s)，8.74(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 378

製備例 75

2-乙醯基-2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.37(9H，s)，2.40(2H，t，J=7Hz)，2.59(2H，t，J=7Hz)，2.46(3H，s)，4.13(2H，q，J=7Hz)，8.20(1H，t，J=3Hz)，8.81(2H，dd，J=7，3Hz)

製備例 76

2-(3-氰苄醯基)-2-(甲氧乙醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.20-1.41(14H，m)，1.60-1.74(2H，m)，2.27-2.34(4H，m)，3.37(83H，s)，4.10(2H，q，J=8Hz)，4.29(1H，d，J=16Hz)，4.46(1H，d，J=16Hz)，7.55(1H，t，J=8Hz)，7.80(1H，dd，J=8，1Hz)，7.93(1H，dd，J=8，1Hz)，8.04(1H，br s)

製備例 77

2-[(乙醯氧基)乙醯基]-2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.22-1.28(5H，m)，1.36(9H，s)，1.68(2H

，m)，2.14(3H，s)，2.32(2H，m)，4.11(2H，q，J=7Hz)，5.07(1H，d，J=18Hz)，5.34(1H，d，J=18Hz)，8.21(1H，m)，8.81(2H，m)

製備例 78

在 2-乙醯基-2-(3-氰苄醯基)-庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯(4.2 g)，於冰浴下加入三氟乙酸(20 mL)。30 分鐘後，移除冰浴，於室溫下攪拌。1 小時後，濃縮。溶在甲苯，真空蒸發可得 6-(3-氰苄醯基)-7-氧辛酸乙酯(3.20 g，100.4%)之無色油。

6-(3-氰苄醯基)-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=8Hz)，1.28-1.40(2H，m)，1.60-1.74(2H，m)，1.91-2.14(2H，m)，2.17(3H，s)，2.31(2H，t，J=8Hz)，4.11(2H，q，J=8Hz)，4.39(1H，t，J=8Hz)，7.64(1H，t，J=8Hz)，7.87(2H，dd，J=8，1Hz)，8.20(2H，dd，J=8，1Hz)，8.26(1H，br s)

MS(ESI^-)：m/z 314(M-H)

下列化合物可依製備例 78 之方法製備。

製備例 79

7-氧-6-[3-(三氟甲基)苄醯基]辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.32-1.43(2H，m)，1.62-1.77(2H，m)，1.96-2.17(2H，m)，2.17(3H，s)，2.30(2H，t，J=7Hz)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.44(1H，t，J=7Hz)，7.64(1H，t，J=8Hz)，7.86(1H，d，J=8Hz)，8.15(1H，d，J=8Hz)，8.24(1H，s)

製備例 80

6-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.26(3H，t，J=7Hz)，1.27-1.44(2H，m)，1.65-1.75(2H，m)，1.90-2.12(2H，m)，2.17(3H，s)，2.25-2.34(2H，m)，2.43(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.42(1H，t，J=7Hz)，8.03(1H，s)，8.63(1H，s)，8.98(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 306(M+H)

製備例 81

8-甲氧基-6-[(3-甲氧基-5-異喔唑基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.34-1.47(2H，m)，1.65-1.74(2H，m)，1.83-2.03(2H，m)，2.29(2H，t，J=7Hz)，3.31(3H，s)，4.05(5H，s)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.51(1H，t，J=7Hz)，6.56(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 342(M+H)

製備例 82

6-[3-(1，3-喔唑-5-基)苄醯基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.33-1.46(2H，m)，1.63-1.77(2H，m)，1.95-2.17(2H，m)，2.17(3H，s)，2.30(2H，t，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.46(1H，t，J=7Hz)，7.47(1H，s)，7.56(1H，t，J=8Hz)，7.85-7.96(2H，m)，7.98(1H，s)，8.27(1H，m)

製備例 83

6-(3，4-二氯苄醯基)-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.43(2H，

m)，1.60-1.74(2H，m)，1.91-2.14(2H，m)，2.14(3H，s)，2.30(2H，t，J=7Hz)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.34(1H，t，J=7Hz)，7.57(1H，d，J=8Hz)，7.78(1H，dd，J=2，8Hz)，8.06(1H，d，J=2Hz)

製備例 84

6-[(4-氯-2-吡啶基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.34-1.48(2H，m)，1.62-1.77(2H，m)，1.80-2.10(2H，m)，2.31(2H，t，J=7Hz)，2.34(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.83-4.92(1H，m)，7.49(1H，dd，J=2 Hz，5Hz)，8.04(1H，d，J=2Hz)，8.57(1H，d，J=5Hz)

MS(ESI^+)：m/z 326(M+H)

製備例 85

6-[(5-氯-2-噻吩基)羰基]-8-甲氧基-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.32-1.42(2H，m)，1.60-1.73(2H，m)，1.84-2.06(2H，m)，2.28(2H，t，J=7Hz)，3.30(3H，s)，3.97(1H，d，J=17Hz)，4.06(1H，d，J=17Hz)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.40(1H，t，J=7Hz)，6.99(1H，d，J=4Hz)，7.56(1H，d，J=4Hz)

製備例 86

6-[(6-甲氧基-2-吡啡基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.34-1.48(2H，m)，1.60-1.78(2H，m)，1.88-2.08(2H，m)，2.31(3H，s)，2.32(2H，t，J=7Hz)，4.01(3H，s)，4.11(2H，q，J=7Hz)，

4.62(1H，t，J=7Hz)，8.44(1H，s)，8.81(1H，s)

MS(ESI$^+$)：m/z 323(M+H)

製備例 87

6-(1-苯并呋喃-2-基羰基)-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.34-1.48(2H，m)，1.62-1.76(2H，m)，1.93-2.19(2H，m)，2.24(3H，s)，2.30(2H，t，J=7Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.37(1H，t，J=7Hz)，7.34(1H，t，J=8Hz)，7.51(1H，t，J=8Hz)，7.56-7.65(2H，m)，7.73(1H，d，J=8Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 895(M+H)

製備例 88

6-(1-苯并噻吩-2-基羰基)-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.35-1.48(2H，m)，1.60-1.80(2H，m)，1.95-2.17(2H，m)，2.19(3H，s)，2.30(2H，t，J=7Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.36(1H，t，J=7Hz)，7.38-7.53(2H，m)，7.82-7.93(2H，m)，8.05(1H，s)

製備例 89

6-(1，3-噁唑-5-基羰基)-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.43(2H，m)，1.65-1.78(2H，m)，1.92-2.10(2H，m)，2.21(3H，s)，2.32(2H，t，J=7Hz)，4.11(3H，m)，7.88(1H，s)，8.05(1H，s)

製備例 90

6-苄醯基-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.29-1.42(2H，m)，1.60-1.75(2H，m)，1.92-2.12(2H，m)，2.14(3H，s)，2.29(2H，t，J=7Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.43(1H，t，J=7Hz)，7.42-7.53(2H，m)，7.55-7.64(1H，m)，7.98(2H，d，J=8Hz)

製備例 91

7-氧-6-(6-喹啉羰基)辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.36-1.48(2H，m)，1.65-1.78(2H，m)，2.00-2.18(2H，m)，2.18(3H，s)，2.30(2H，t，J=7Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.58(1H，t，J=8Hz)，7.54(1H，m)，8.18(1H，d，J=8Hz)，8.28(1H，dd，J=2 Hz，8Hz)，8.32(1H，d，J=8Hz)，8.51(1H，d，J=2Hz)，9.05(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 342(M+H)

製備例 92

8-[4-({[(苄氧基)羰基]胺基}磺醯基)苄醯基]-9-氧癸酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23-1.37(9H，m)，1.55-1.68(11H，s)，2.01(2H，m)，2.18(3H，s)，2.29(2H，t，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.39(1H，t，J=7Hz)，5.11(2H，s)，7.30-7.49(5H，m)，7.74(1H，s，br)，8.04-8.13(4H，m)

MS(ESI^-)：m/z 530(M-H)

製備例 93

7-(1，3-噁唑-5-基)-7-氧庚酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.41(2H，m)，1.76(2H

，m)，2.03(2H，m)，2.31(2H，m)，3.20(2H，m)，4.10(2H，q，J=7Hz)，7.94(1H，s)，8.10(1H，s)

製備例 94

6-[3-(甲磺醯基)苄醯基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=8Hz)，1.59-1.64(2H，m)，1.91-2.15(2H，m)，2.18(3H，s)，2.30(2H，t，J=8Hz)，3.11(3H，s)，4.10(2H，q，J=8Hz)，4.45(1H，t，J=8Hz)，7.23(1H，t，J=8Hz)，8.17(1H，dd，J=8，1Hz)，8.25(2H，br d，J=8Hz)，8.53(1H，br s)

MS(ESI^+)：m/z 369(M+H)

製備例 95

6-(2-氯異菸鹼醯基)-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=8Hz)，1.30-1.40(2H，m)，1.60-1.71(2H，m)，1.90-2.14(2H，m)，2.27(3H，s)，2.25-2.74(2H，m)，4.11(2H，q，J=8Hz)，4.32(1H，t，J=8Hz)，7.15(1H，dd，J=7，1Hz)，7.76(1H，d，J=1Hz)，8.09(1H，d，J=7Hz)

MS(ESI^+)：m/z 326(M+H)

製備例 96

6-(3-硝苄醯基)-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=8Hz)，1.29-1.41(2H，m)，1.60-1.74(2H，m)，1.91-2.16(2H，m)，2.19(3H，s)，2.30(2H，t，J=8Hz)，4.11(2H，q，J=8Hz)，4.46(1H，t，J=8Hz)，7.71(1H，t，J=8Hz)，8.30(1H，br d，J=8Hz)，8.45(4H

，br d，J=8Hz)，8.80(1H，br s)

MS(ESI$^+$)：m/z 337(M+H)

製備例 97

4-(2-乙醯己醯基)苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：0.90(3H，t，J=8Hz)，1.18-1.44(4H，m)，1.90-2.12(2H，m)，2.17(3H，s)，4.40(1H，t，J=8Hz)，7.80(2H，d，J=8Hz)，8.08(2H，d，J=8Hz)

MS(ESI$^-$)：m/z 242(M-H)

製備例 98

6-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.32-1.43(2H，m)，1.60-1.76(2H，m)，1.96-2.15(2H，m)，2.19(3H，s)，2.30(2H，t，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.36(1H，t，J=7Hz)，8.37(1H，s)，8.87(1H，br)，9.07(1H，br)

MS：(m/z)370，372(M+H)

製備例 99

6-(2-氯異菸鹼醯基)-8-(甲硫基)-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.34-1.47(2H，m)，1.60-1.77(2H，m)，1.92(3H，s)，1.93-2.05(2H，m)，2.30(2H，t，J=7Hz)，3.19(1H，d，J=17Hz)，3.26(1H，d，J=17Hz)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.68(1H，t，J=7Hz)，7.72(1H，d，J=5Hz)，7.86(1H，s)，8.57(1H，d，J=5Hz)

MS：(m/z)370(M-H)，372(M+H)

製備例 100

7-(3-氰苄醯基)-8-氧壬酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.21-1.44(7H，m)，1.55-1.69(2H，m)，1.89-2.15(2H，m)，2.17(3H，s)，2.29(2H，t，J=8Hz)，4.12(2H，q，J=8Hz)，4.39(1H，t，J=8Hz)，7.64(1H，t，J=8Hz)，7.87(1H，dd，J=8，1Hz)，8.20(1H，dd，J=8，1Hz)，8.27(1H，br s)

MS(ESI^+)：m/z 330(M+H)

製備例 101

6-[(6-氯-2-吡啶基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.26(3H，t，J=7Hz)，1.36-1.52(2H，m)，1.63-1.75(2H，m)，1.77-2.06(2H，m)，2.29(2H，t，J=7Hz)，2.45(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.82(1H，t，J=7Hz)，7.51(1H，d，J=8Hz)，7.82(1H，t，J=8Hz)，7.97(1H，d，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 326

製備例 102

6-(3-甲氧苄醯基)-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.43(2H，m)，1.60-1.77(2H，m)，1.92-2.12(2H，m)，2.15(3H，s)，2.31(2H，t，J=7Hz)，3.88(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.42(1H，t，J=7Hz)，7.14(1H，dd，J=2Hz，8Hz)，7.40(1H，t，J=8Hz)，7.46-7.58(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 321

製備例 103

6-(3，5-二氯苄醯基)-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.32-1.42(2H，m)，1.63-1.75(2H，m)，1.90-2.12(2H，m)，2.16(3H，s)，2.30(2H，t，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.32(1H，t，J=7Hz)，7.58(1H，m)，7.82(2H，m)

製備例 104

6-[(5-氯-2-噻吩基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.40(2H，m)，1.62-1.74(2H，m)，1.90-2.12(2H，m)，2.16(3H，s)，2.29(2H，t，J=7Hz)，4.13(2H，q，J=7Hz)，4.14(1H，m)，6.98(1H，d，J=4Hz)，7.58(1H，d，J=4Hz)

製備例 105

6-(3-氟苄醯基)-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.28-1.42(2H，m)，1.60-1.75(2H，m)，1.90-2.13(2H，m)，2.14(3H，s)，2.29(2H，t，J=7Hz)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.37(1H，t，J=7Hz)，7.26-7.33(1H，m)，7.43-7.52(1H，m)，7.63-7.68(1H，m)，7.76(1H，d，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 309

製備例 106

7-氧-6-(3-喹啉羰基)辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.35-1.47(2H，m)，1.63-1.77(2H，m)，1.98-2.18(2H，m)，2.20(3H，s)，2.31(2H，t，J=7Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.55(1H，t，J=7Hz)

，7.66(1H，t，J=8Hz)，7.87(1H，t，J=8Hz)，7.97(1H，d，J=8Hz)，8.18(1H，d，J=8Hz)，8.78(1H，d，J=2Hz)，9.43(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 342

製備例 107

6-異菸鹼醯基-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.26-1.45(2H，m)，1.60-1.75(2H，m)，1.94-2.07(2H，m)，2.17(3H，s)，2.27-2.35(2H，m)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.38(1H，t，J=7Hz)，7.74(2H，m)，8.83(2H，m)

製備例 108

6-[(3-甲氧基-5-異噁唑基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.33-1.45(2H，m)，1.60-1.80(2H，m)，1.88-2.05(2H，m)，2.28(3H，s)，2.30-2.45(2H，m)，4.03(3H，s)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.33(1H，t，J=7Hz)，6.56(1H，s)

MS(ESI$^+$)：m/z 312

製備例 109

6-[(5-甲基-3-異噁唑基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.32-1.44(2H，m)，1.61-1.74(2H，m)，1.85-2.07(2H，m)，2.26-2.38(2H，m)，2.29(3H，s)，2.49(3H，s)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.64(1H，m)，6.39(1H，s)

MS(ESI$^+$)：m/z 296

製備例 110

6-(2-氯異菸鹼醯基)-8-甲氧基-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.28-1.43(2H，m)，1.66(2H，t，J=7Hz)，1.73-1.86(1H，m)，1.93-2.07(1H，m)，2.73(2H，t，J=7Hz)，3.23(3H，s)，3.89(1H，d，J=17Hz)，4.00(1H，d，J=17Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.58(1H，t，J=7Hz)，7.66(1H，d，J=5Hz)，7.78(1H，s)，8.60(1H，d，J=5Hz)

MS(ESI^+)：m/z 356，MS(ESI^-)：m/z 354

製備例 111

8-甲氧基-6-(3-甲氧苄醯基)-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.43(2H，m)，1.60-1.73(2H，m)，1.79-2.04(2H，m)，2.28(2H，t，J=7Hz)，3.27(3H，s)，3.87(3H，s)，4.00(2H，m)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.66(1H，t，J=7Hz)，7.13(1H，m)，7.39(1H，m)，7.45-7.55(2H，m)

製備例 112

8-甲氧基-7-氧-6-(6-喹啉羰基)辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.34-1.47(2H，m)，1.60-1.75(2H，m)，1.86-2.10(2H，m)，2.27(2H，t，J=7Hz)，3.24(3H，s)，4.02-4.10(2H，m)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.83(1H，t，J=7Hz)，7.48-7.55(1H，m)，8.16-8.33(3H，m)，8.49(1H，m)，9.02(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 372

製備例 113

8-甲氧基-7-氧-6-(3-吡啶羰基)辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.31-1.45(2H，m)，1.60-1.73(2H，m)，1.75-2.08(2H，m)，2.28(2H，t，J=7Hz)，3.24(3H，s)，3.94(1H，d，J=17Hz)，4.00(1H，d，J=17Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.67(1H，t，J=7Hz)，7.44(1H，m)，8.22(1H，m)，8.81(1H，d，J=5Hz)，9.18(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 322

製備例 114

6-(3-氯苄醯基)-8-甲氧基-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.44(2H，m)，1.60-1.74(2H，m)，1.75-1.92(1H，m)，1.94-2.10(1H，m)，2.28(2H，t，J=7Hz)，3.25(3H，s)，3.93(1H，d，J=17Hz)，4.02(1H，d，J=17Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.63(1H，t，J=7Hz)，7.43(1H，t，J=8Hz)，7.57(1H，d，J=8Hz)，7.83(1H，d，J=8Hz)，7.94(1H，s)

製備例 115

6-(3-甲基苄醯基)-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.29-1.42(2H，m)，1.60-1.73(2H，m)，1.90-2.06(2H，m)，2.13(3H，s)，2.28(2H，t，J=7Hz)，2.42(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.42(1H，t，J=7Hz)，7.31-7.43(2H，m)，7.73-7.78(2H，m)

製備例 118

8-甲氧基-6-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.47(2H，m)，1.60-1.74(2H，m)，1.75-1.93(1H，m)，1.93-2.08(1H，m)，2.26(2H，t，J=7Hz)，2.43(3H，s)，3.25(3H，s)，3.95(1H，d，J=17Hz)，4.03(1H，d，J=17Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.67(1H，t，J=7Hz)，8.03(1H，s)，8.63(1H，s)，8.98(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 336

製備例 119

6-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.32-1.43(2H，m)，1.60-1.76(2H，m)，1.96-2.15(2H，m)，2.19(3H，s)，2.30(2H，t，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.36(1H，t，J=7Hz)，8.37(1H，s)，8.87(1H，br)，9.07(1H，br)

MS(ESI^+)：m/z 370，372

製備例 120

6-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-8-甲氧基-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.47(2H，m)，1.60-1.72(2H，m)，1.75-1.93(1H，m)，1.95-2.08(1H，m)，2.27(2H，t，J=7Hz)，3.25(3H，s)，3.93(1H，d，J=17Hz)，4.02(1H，d，J=17Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.63(1H，t，J=7Hz)，8.38(1H，m)，8.88(1H，m)，9.07(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 400，402

製備例 121

6-[(5，6-二氯-3-吡啶基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.43(2H，m)，1.60-1.77(2H，m)，1.95-2.17(2H，m)，2.19(3H，s)，2.30(2H，t，J=7Hz)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.32(1H，t，J=7Hz)，8.31(1H，d，J=2Hz)，8.82(1H，d，J=2Hz)

製備例 122

7-甲氧基-5-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-6-氧庚酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.60-1.75(2H，m)，1.78-1.95(1H，m)，1.95-2.12(1H，m)，2.32(2H，t，J=7Hz)，2.44(3H，s)，3.25(3H，s)，3.94(1H，d，J=18Hz)，4.02(1H，d，J=18Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.69(1H，t，J=7Hz)，8.04(1H，s)，8.63(1H，s)，9.00(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 322

製備例 123

6-甲氧基-4-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-5-氧己酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，2.08-2.55(4H，m)，2.44(3H，s)，3.23(3H，s)，3.94(1H，d，J=18Hz)，4.01(1H，d，J=18Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.88(1H，m)，8.12(1H，s)，8.64(1H，s)，9.04(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 308

製備例 124

5-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-6-氧庚酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.60-1.75(2H，m)，1.96-2.13(2H，m)，2.18(3H，s)，2.36(2H，t，J=7Hz)，2.43(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.43(1H，t，J=7Hz)

，8.04(1H，s)，8.63(1H，s)，8.97(1H，s)

MS(ESI$^+$)：m/z 292

製備例 125

4-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-5-氧己酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，2.20(3H，s)，2.26-2.48(4H，m)，2.43(3H，s)，4.13(2H，q，J=7Hz)，4.62(1H，t，J=7Hz)，8.08(1H，s)，8.64(1H，s)，9.02(1H，s)

MS(ESI$^+$)：m/z 278

製備例 126

4-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-5-氧己酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，2.26(3H，s)，2.30(2H，t，J=7Hz)，2.43(2H，t，J=7Hz)，4.15(2H，q，J=7Hz)，8.65(1H，s)，8.94(1H，s)，9.22(1H，s)

製備例 127

6-(3-氰苄醯基)-8-甲氧基-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.19-1.43(12H，m)，1.57-1.70(2H，m)，1.80(1H，m)，1.99(1H，m)，2.28(2H，t，J=8Hz)，3.24(3H，s)，3.91(1H，d，J=16Hz)，4.01(1H，d，J=16Hz)，4.09(2H，q，J=8Hz)，4.65(1H，t，J=8Hz)，7.64(1H，t，J=8Hz)，7.87(1H，dd，J=8，1Hz)，8.18(1H，dd，J=8，1Hz)，8.25(1H，br s)

製備例 128

8-(乙醯氧基)-6-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.37(2H，m)，1.67(2H

，m)，1.98-2.06(5H，m)，2.30(2H，t，J=7Hz)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.47(1H，t，J=7Hz)，4.66(d，J=17Hz)，4.74(d，J=17Hz)，8.37(1H，m)，8.88(1H，m)，9.06(1H，m)

製備例 129

將 Meldrum 酸(30 g，0.208 mol)溶在二氯甲烷(420 mL)，於冰-甲醇浴及氮氣下(-9℃)，於 3 分鐘內加入吡啶(33.7 mL，0.416 mol)。於同溫及 1 小時內滴加入含甲氧乙醯氯(24.8 g)之二氯甲烷(180 mL)。加完後，於同溫下攪拌 1 小時，再於室溫下攪拌 2 小時。中止反應以 1N HCl(600 mL)。分離有機層，將水層萃取以二氯甲烷。將結合有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 5-(甲氧乙醯基)-2，2-二甲基-1，3-二噁烷-4，6-二酮之暗桔色油(38.1 g，84.7%).

5-(甲氧乙醯基)-2，2-二甲基-1，3-二噁烷-4，6-二酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.75(6H，s)，3.53(3H，s)，4.87(2H，s)

製備例 130

將 5-(甲氧乙醯基)-2，2-二甲基-1，3-二噁烷-4，6-二酮(38 g)溶在第三丁醇(120 mL)及甲苯(120 mL)，於氮氣下回流 2 小時。真空蒸發可得棕色油(32.5 g)。溶在己烷-乙酸乙酯= 2-1(200 mL)，加入矽膠(65 g)。於室溫下攪拌 30 分鐘，過濾，清洗以己烷-乙酸乙酯= 2-1(200 mL)。將濾液真空濃縮可得 4-甲氧基-3-氧丁酸第三丁酯淡黃色油(30.1 g，91.0%)。

4-甲氧基-3-氧丁酸第三丁酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.50(9H，s)，3.41(2H，s)，3.43(3H，s)，4.08(2H，s)

製備例 131

將 3-甲醯苄酸(500 mg)及異氰酸對-甲苯磺醯甲酯(715 mg)溶在甲醇(20 mL)，加入碳酸鉀(1.38 g)，加熱回流 2 小時。蒸發溶劑，分層於乙酸乙酯及水。分離水層，酸化以 1N HCl。濾集沈澱，清洗以水，甲醇及乙醚可得 3-(1，3-噁唑-5-基)苄酸之無色 非晶形物粉(484 mg)。

3-(1，3-噁唑-5-基)苄酸

NMR($DMSO-d_6$，δ)：7.63(1H，t，J=8Hz)，7.84(1H，s)，7.89-8.02(2H，m)，8.25(1H，m)，8.50(1H，s)，13.22(1H，br)

MS(ESI^+)：m/z 188(M-H)

製備例 132

將 1-(3-氯苯基)-1，3-丁烷二酮(500 mg)，5-(碘甲基)-2，2-二甲基-1，3-二噁烷(716 mg)，及碳酸鉀(351 mg)溶在二甲亞碸(2.5 mL)，於室溫下攪拌 14 小時，再於 40℃下攪拌 7 小時。分層於乙酸乙酯(20 mL)及水(10 mL)。將有機層清洗以水(10 x 2 mL)及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得棕色油。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-10～2-5 可得 1-(3-氯苯基)-2-[(2，2-二甲基-1，3-二噁烷-5-基)甲基]-1，3-丁烷二酮之黃色油(614 mg)。

1-(3-氯苯基)-2-[(2，2-二甲基-1，3-二噁烷-5-基)甲基]-1，3-丁烷二酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.39(6H，s)，1.70(1H，m)，1.91-2.15(2H，m)，2.16(3H，s)，3.61(2H，m)，3.88(2H，m)，4.46(1H，t，J=7Hz)，7.44(1H，t，J=9Hz)，7.57(1H，m)，7.86(1H，d，J=9Hz)，7.96(1H，m)

下列化合物可依製備例 132 之方法製備。

製備例 133

2-(1，3-噁唑-5-基羰基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.26(3H，t，J=7Hz)，1.32-1.38(11H，m)，1.67(2H，m)，1.97(2H，m)，2.30(2H，m)，3.86(1H，t，J=7Hz)，4.11(2H，q，J=7Hz)，7.86(1H，s)，8.03(1H，s)

製備例 134

2-[(3，5-二甲基-4-異噁唑基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.33-1.41(11H，m)，1.64(2H，m)，1.93(2H，m)，2.30(2H，m)，2.47(3H，s)，2.69(2H，s)，3.79(1H，t，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)

製備例 135

將氯化鎂(1.46 g)溶在四氫呋喃(10 ml)，加入含 3-氧-4-苯丁酸乙酯(2.0 g)之四氫呋喃(10 ml)，冷却至 0℃，加入吡啶(2.5 ml)。於 20℃下攪拌 30 分鐘，於 0℃下加入 4-氟苄醯氯(2.44 g)之四氫呋喃(10 ml)。於 20℃下攪拌 2 小時，分層於 0.5N HCl 及乙酸乙酯。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(乙酸

乙酯：己烷=1:5)可得 2-(4-氟苄醯基)-3-氧-4-苯丁酸乙酯(2.15 g)之油。

2-(4-氟苄醯基)-3-氧-4-苯丁酸乙酯

(互變異構物之混合物，太複雜而無法區別)

製備例 136

將 1-(4-氟苯基)丁烷-1，3-二酮(1.0 g)，碳酸鉀(3.42 g)，及溴化四丁銨(20 mg)溶在甲苯(10 ml)，回流 3 小時。冷却至 20℃，加入溴乙酸乙酯(0.74 ml)。靜置於 20℃過夜，分層於乙酸乙酯及 0.5N HCl。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(乙酸乙酯：己烷=1:5)可得 3-(4-氟苄醯基)-4-氧戊酸乙酯(964 mg)之油。

3-(4-氟苄醯基)-4-氧戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，2.18(3H，s)，3.01(2H，d，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.95(1H，d，J=7Hz)，7.18(2H，dt，J=2，7Hz)，8.07(2H，ddd，J=2，5，7Hz)

製備例 137

將 1-(4-氟苯基)丁烷-1，3-二酮(1.0 g)，碳酸鉀(3.84 g)，及溴化四丁銨(90 mg)溶在甲苯(20 ml)，回流 3 小時，加入 6-溴己酸乙酯(1.18 ml)。於 100℃下攪拌 3 小時，分層於乙酸乙酯及 0.5N HCl。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(乙酸乙酯：己烷=1:5)可得 7-(4-氟苄醯基)-8-氧壬酸乙酯(983 mg)之油。

7-(4-氟苄醯基)-8-氧壬酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.25-1.45(4H，m)，1.55-1.70(2H，m)，1.90-2.10(2H，m)，2.13(3H，s)，2.27(2H，t，J=7Hz)，4.11(2H，q，J=7Hz)，4.37(1H，t，J=7Hz)，7.16(2H，t，J=9Hz)，8.02(2H，dd，J=5，9Hz)

製備例 138

將戊烷-2，4-二酮(5.0 g)，7-溴庚酸乙酯(11.1 g)，碳酸鉀(13.8 g)，及碳酸銫(1.63 g)溶在乙腈(150 ml)及二甲亞碸(30 ml)，於 20℃下攪拌過夜，加入戊烷-2，4-二酮(5 g)。於 20℃下攪拌過夜，分層於乙酸乙酯及 0.5N HCl。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(乙酸乙酯：己烷=1:5)可得 8-乙醯基-9-氧癸酸乙酯(5.5 g)之油。

7-乙醯基-8-氧壬酸乙酯

(互變異構物之混合物，太複雜而無法區別)

製備例 139

將 7-乙醯基-8-氧壬酸乙酯(4.0 g)及氯化鎂(1.27 g)溶在二氯甲烷(70 ml)，於 0℃下加入吡啶(2.15 ml)。於 20℃下攪拌 1 小時，加入 4-氰苄醯氯(2.87 g)之二氯甲烷(10 ml)。於 20℃下攪拌 3 小時，分層於乙醚及 1N HCl。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(乙酸乙酯：己烷=1:5)可得 7-乙醯基-7-(4-氰苄醯基)-8-氧壬酸乙酯(3.52 g)之油。

2-乙醯基-2-(4-氰苄醯基)辛二酸 1-第三丁酯 8-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.25-1.45(4H，m)，1.30(9H，s)，1.55-1.70(2H，m)，2.20(2H，t，J=7Hz)，2.28(2H，t，J=7Hz)，2.44(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，7.72(2H，t，J=9Hz)，7.83(2H，d，J=9Hz)

製備例 140

將 7-乙醯基-7-(4-氰苄醯基)-8-氧壬酸乙酯(3.5 g)溶在三氟乙酸(12.6 ml)，於 20℃下攪拌 15 分鐘。分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以水，重碳酸鈉溶液及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，蒸發可得 7-(4-氰苄醯基)-8-氧壬酸乙酯(2.25 g)之油。

7-(4-氰苄醯基)-8-氧壬酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.25-1.45(4H，m)，1.55-1.70(2H，m)，1.80-2.10(2H，m)，2.16(3H，s)，2.28(2H，t，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.40(1H，t，J=7Hz)，7.80(2H，t，J=9Hz)，8.07(2H，d，J=9Hz)

製備例 141

將 4-(胺磺醯基)苄酸甲酯(5.10 g)及碳酸鉀(6.55 g)溶在二甲氧乙烷(50 mL)，回流 5 分鐘。冷却後，加入氯碳酸苄酯(5.25 g)之二甲氧乙烷(30 mL)，回流 1 小時。中止反應以加入 1N HCl(100 mL)。萃取以乙酸乙酯(200 mL)，將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得淡黃色油，靜置可固化。將固體碾製以二異丙醚(30 mL)可得 4-({[(苄氧基)羰基]胺基}磺醯基)苄酸甲酯白色粉(3.38 g)。

4-({[(苄氧基)羰基]胺基}磺醯基)苄酸甲酯

NMR($CDCl_3$，δ)：3.98(3H，s)，5.10(2H，s)，7.22(2H，m)，7.34(3H，m)，7.64(1H，s，br)，8.08(2H，d，J=9Hz)，8.16(2H，d，J=9Hz)

製備例 142

將 4-({[(苄氧基)羰基]胺基}-磺醯基)苄酸甲酯(3.38 g)及 85% KOH(1.28 g)溶在甲醇(40 mL)，攪拌 35 分鐘。蒸發甲醇，加入 1N HCl(20 mL)。可得白色結晶，濾集沈澱，清洗以水及二異丙醚，真空乾燥。可得 4-({[(苄氧基)羰基]胺基}磺醯基)苄酸之白色結晶(2.92 g)。

4-({[(苄氧基)羰基]胺基}磺醯基)苄酸

NMR($DMSO-d_6$，δ)：5.06(2H，s)，7.25(2H，m)，7.33(3H，m)，8.00(2H，d，J=9Hz)，8.15(2H，d，J=9Hz)

MS(ESI^-)：m/z 334(M-H)

製備例 143

將 S-(2-吡啶基)3-氰苯硫代羥酸酯(2.40 g)溶在甲苯(10 mL)，於冰-甲醇浴及 5 分鐘(-7～-2℃)內加入氯化鈦(1.99 g)。攪拌 10 分鐘，於 5 分鐘(-4～0℃)內加入 2-乙基-1H-吡咯(1.00 g)之甲苯(10 mL)。於室溫下攪拌 1.5 小時。加入乙酸乙酯(20 mL)及水(20 mL)，濾經矽藻土。將濾液稀釋以乙酸乙酯(80 mL)及水(30 mL)，將有機層清洗以水(30 mL)，1N NaOH(50 mL)，及食鹽水(50 mL)，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得暗色結晶(2.46 g)。碾製以二異丙醚(10 mL)可得 3-[(5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄腈之棕色結晶(1.57 g，70.1%)。

3-[(5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.33(3H，t，J=7Hz)，2.75(2H，q，J=7Hz)，6.12(1H，m)，6.78(1H，m)，7.60(1H，t，J=8Hz)，7.82(1H，d，J=8Hz)，8.07(1H，d，J=8Hz)，8.14(1H，s)，9.50(1H，s，br)

製備例 144

將氯化鎂(3.01 g)溶在四氫呋喃(30 mL)，加入 3-氧丁酸第三丁酯(5.00 g)。於冰浴冷卻。於 15 分鐘內加入吡啶(5.00 g)。於室溫下攪拌 1 小時，於冰浴冷卻。於 15 分鐘內加入含 2-氯苄醯氯(4.98 g)之四氫呋喃(30 mL)。於室溫下攪拌 1 小時。中止反應以加入 1N HCl(65 mL)。過濾，蒸發溶劑。將殘渣萃取以乙酸乙酯(150 mL)。將萃取物清洗以水(100 mL)，飽和重碳酸鈉溶液(100 mL)，及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 2-(3-氯苄醯基)-3-氧丁酸第三丁酯之黃色油(8.82 g)。

2-(3-氯苄醯基)-3-氧丁酸第三丁酯

NMR($CDCl_3$，δ)：互變異構物之混合物：1.20 及 1.27(9H，s)，2.16 及 2.44(3H，s)，7.33-7.71(4H，m)，13.66(1H，s)

製備例 145

將 2-(3-氯苄醯基)-3-氧丁酸第三丁酯(8.82 g)溶在三氟乙酸(40 mL)，於冰浴冷卻下攪拌 1 小時。蒸發揮發物，分層於乙酸乙酯(150 mL)及飽和重碳酸鈉。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 1-(3-氯苯基)-1，3-

丁烷二酮之淡桔色結晶(5.33 g)。

1-(3-氯苯基)-1，3-丁烷二酮

NMR($CDCl_3$，δ)：2.21(3H，s)，6.14(1H，s)，7.38(1H，t，J=9Hz)，7.48(1H，d，J=9Hz)，7.75(1H，d，J=9Hz)，7.85(1H，s)

製備例 146

將 2-(三甲矽烷基)乙醇(20.5 g)及吡啶(18.7 g)溶在二氯甲烷(40 mL)，於 30 分鐘內及於冰浴(6～20℃)下加入含乙二醯二氯(10.0 g)之二氯甲烷(20 mL)。移除冰浴，攪拌 0.5 小時。過濾，將濾液分層於乙酸乙酯(200 mL)及 1N HCl(200 mL)。將有機層清洗以飽和重碳酸鈉溶液及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得雙[2-(三甲矽烷基)乙基]草酸鹽淡黃色油(25.1 g)。

雙[2-(三甲矽烷基)乙基]草酸鹽

NMR($CDCl_3$，δ)：0.08(18H，s)，1.12(4H，m)，4.38(4H，m)

製備例 147

將二甲碸(7.00 g)溶在乙醚(50 mL)，加入第三丁氧化鉀(8.76 g)。加入雙[2-(三甲矽烷基)-乙基]草酸鹽(23.8 g)。於室溫下攪拌 36 小時。分層於乙酸乙酯(100 mL)及 1N HCl(50 mL)。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，蒸發可得暗桔色油。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-25～8-5 可得 3-(甲磺醯基)-2-氧丙酸 2-(三甲矽烷基)乙酯之淡棕色油(8.37 g)。

3-(甲磺醯基)-2-氧丙酸 2-(三甲矽烷基)乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.08(9H，s)，1.14(2H，m)，3.11(3H，s)，4.43(4H，m)，4.56(2H，s)

MS(ESI^-)：m/z 265(M-H)

製備例 148

將 4-氧-4-苯丁酸(5.00 g)，乙醇(2.59 g)，1-(3-二甲胺丙基)-3-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽(6.46 g)，及 4-(二甲胺基)吡啶(171 mg)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(25 mL)，於室溫下攪拌 1.5 小時。分層於乙酸乙酯(100 mL)及 1N HCl(75 mL)，將有機層清洗以水(75 x 3 mL)，飽和重碳酸鈉溶液(75 mL)，及食鹽水(75 mL)，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 4-氧-4-苯丁酸乙酯之無色油(4.19 g)。

4-氧-4-苯丁酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.27(3H，t，J=7Hz)，2.76(2H，t，J=7Hz)，3.32(2H，t，J=7Hz)，4.16(2H，q，J=7Hz)，7.47(2H，t，J=9Hz)，7.55(1H，d，J=9Hz)，7.98(2H，d，J=9Hz)

MS(ESI^+)：m/z 207(M+H)

下列化合物可仿製備例 148 之方法製備。

製備例 149

5-氧-5-苯戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.26(3H，t，J=7Hz)，2.08(2H，m)，2.44(2H，t，J=7Hz)，3.06(2H，t，J=7Hz)，4.14(2H，q，J=7Hz)，7.46(2H，t，J=9Hz)，7.56(1H，d，J=9Hz)，7.97(2H，d，J=9Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 221(M+H)

製備例 150

將 2-苄醯基環己酮(1.00 g)，乙氧化鈉(404 mg)溶在乙醇(5 mL)，於室温下攪拌 3.5 小時。中止反應以加入 1N HCl(1 mL)。蒸發溶劑，分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 7-氧-7-苯庚酸乙酯 之棕色油(1.33 g)。

7-氧-7-苯庚酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.42(2H，m)，1.63-1.81(4H，m)，2.32(2H，t，J=7Hz)，2.98(2H，t，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，7.47(2H，t，J=9Hz)，7.54(1H，d，J=7Hz)，7.95(2H，d，J=9Hz)

製備例 151

將 7-氯-7-氧庚酸乙酯(1.31 g)溶在二氯甲烷(25 mL)，於氮氣下加入含 2-(三甲矽烷基)-1，3-噻唑(500 mg)之二氯甲烷(5 mL)。攪拌 3 小時，中止反應以加入飽和重碳酸鈉溶液(5 mL)。分層於乙酸乙酯(30 mL)及飽和重碳酸鈉溶液(30 mL)，將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得無色油。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-10～2-5 可得 7-氧-7-(1，3-噻唑-2-基)庚酸乙酯之無色油(778 mg)。

7-氧-7-(1，3-噻唑-2-基)庚酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.44(2H，m)，1.64-1.85(4H，m)，2.32(2H，t，J=7Hz)，3.17(2H，t，J=7Hz)

，4.12(2H，q，J=7Hz)，7.66(1H，d，J=3Hz)，8.00(1H，d，J=3Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 256(M+H)

製備例 152

將 7-甲氧基-7-氧庚酸(1.00 g)溶在二氯甲烷(10 mL)，加入含三氟乙酐(1.33 g)之二氯甲烷(2 mL)。攪拌 0.5 小時，加入含 1-甲基-1H-吡咯(1.49 g)之二氯甲烷(2 mL)。於室溫下攪拌 2 小時 40 分鐘，再於 35℃下攪拌 2 小時。分層於乙酸乙酯及飽和重碳酸鈉。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得棕色油。以矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-20～4-5 可得 7-(1-甲基-1H-吡咯-2-基)-7-氧庚酸甲酯之無色油(615 mg)。

7-(1-甲基-1H-吡咯-2-基)-7-氧庚酸甲酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.34(2H，m)，1.61-1.77(4H，m)，2.32(2H，t，J=7Hz)，2.77(2H，t，J=7Hz)，3.66(3H，s)，3.94(3H，s)，6.13(1H，m)，6.79(1H，m)，6.93(1H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 238(M+H)

製備例 153

將 4-({[(苄氧基)羰基]胺基}-磺醯基)苄酸(2.90 g)溶在二氯甲烷(30 mL)，於冰浴冷卻下加入 N，N-二甲基甲醯胺(19.0 mg)，再加入草醯氯(1.15 g)。於室溫下攪拌 0.5 小時，回流 1 小時。加入草醯氯(439 mg)後再回流 5 分鐘。蒸發揮發物可得白色固體。將固體碾製以二異丙醚可得 [4-(氯羰基)苯基]磺醯胺甲酸苄酯白色粉(2.40 g)，其可不經純化用於下一

反應。

[4-(氨羰基)苯基]磺醯胺甲酸苄酯

製備例 154

將 4-(甲硫基)-3-氧丁酸第三丁酯(5.00 g)及碳酸鉀(3.72 g)溶在二甲基甲醯胺(25 mL)，加入 5-碘戊酸乙酯(6.89 g)，於室溫下攪拌 15 小時。分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=20:1-10:1)可得 2-[(甲硫基)乙醯基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯之無色油(5.88 g)。

2-[(甲硫基)乙醯基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.42(2H，m)，1.45(9H，s)，1.63-1.74(2H，m)，1.81-1.93(2H，m)，2.05(3H，s)，2.30(2H，t，J=7Hz)，3.23(1H，d，J=17Hz)，3.38(1H，d，J=17Hz)，3.74(1H，t，J=7Hz)，4.11(2H，q，J=7Hz)

製備例 155

將羥胺鹽酸鹽(29.4 g)溶在二氯甲烷(200 mL)，於 3 分鐘內及在甲醇-冰浴及氮氣下加入二異丙基乙胺(54.6 g)。可形成白色沈澱。攪拌 1 小時，於 60 分鐘內加入二苯膦基氯(20.0 g)之二氯甲烷(20 mL)。可形成白色結晶。回溫攪拌至 0℃下 1 小時。中止反應以於 3 分鐘內加入水(200 mL)。攪拌 0.5 小時，濾集結晶。將結晶清洗以水(50 x 3 mL)及二異丙醚(50 x 3 mL)。將結晶風乾過夜，及減壓微溫(4°C)下乾燥 3 小時可得粗製物。將固體碾製以 EtOH(乙醇)可得(胺氧基)(二苯

基)膦氧化物之白色 結晶(15.3 g)。

(胺氧基)(二苯基)膦氧化物

NMR($CDCl_3$，δ)：7.54-7.58(6H，m)，7.74-7.83(4H，m)，8.20-8.33(2H，m)

製備例 156

將 1-(1H-吡咯-2-基)乙酮(5.00 g)溶在四氫呋喃(100 mL)，於冰浴及氮氣下加入第三丁氧化鉀(6.17 g)。攪拌 1 小時，於 2 小時內加入(胺氧基)(二苯基)膦氧化物(12.8 g)。於室溫攪拌 2 小時，於 3 分鐘內加入水(4 mL)可得澄清液。蒸發溶劑，分層於乙酸乙酯(50 mL)及水(50 mL)。將水層萃取以乙酸乙酯(25 x 5 mL)，將結合有機萃取液清洗以食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥，蒸發可得棕色油(6.01 g)。將油溶在二異丙醚(30 mL)，加入己烷(15 mL)可得淡黃色結晶。攪拌 1 小時，濾除結晶。將濾液蒸發可得棕色油(5.69 g)。溶在乙酸乙酯(45.5 mL)，於冰浴冷卻。於 15 分鐘內加入 4NHCl-乙酸乙酯(11.5 mL)可得淡棕色沈澱。於冰浴下攪拌 0.5 小時，濾集沈澱，清洗以乙酸乙酯(5 x 3 mL)可得淡棕色粉(5.33 g)。將粉溶在乙酸乙酯(37 mL)並回溫至 3℃。於室溫下攪拌 1 小時。濾澱粉，清洗以乙酸乙酯(5 x 3 mL)可得 1-(1-胺基-1H-吡咯-2-基)乙酮鹽酸鹽之淡棕色粉(5.25 g)。

1-(1-胺基-1H-吡咯-2-基)乙酮鹽酸鹽

NMR($CDCl_3$，δ)：2.37(3H，s)，5.22(2H，s，br)，6.07(1H，m)，6.99(1H，m)，7.15(1H，m)

製備例 157

於氮氣下，將肼單水合物(530 g)於 55 分鐘內加至乙醇(1.7 L)。於 20 分鐘內加入 1-(1-胺基-1H-吡咯-2-基)乙酮鹽酸鹽(170 g)。於室溫下攪拌 10 分鐘，加熱至回流溫度 55 分鐘，回流 15 分鐘。於水浴冷却，加入水(1.7 L)(30～31°C)。蒸除乙醇，萃取以氯仿(0.85 x 4 mL)。將結合有機萃取液清洗以食鹽水(1.3 L)。將食鹽水萃取以氯仿(0.85 L)。將結合有機萃取液於無水硫酸鎂下乾燥，蒸發可得(1E)-1-(1-胺基-1H-吡咯-2-基)乙酮亞肼之棕色結晶(112 g)。

(1E)-1-(1-胺基-1H-吡咯-2-基)乙酮亞肼

NMR($CDCl_3$，δ)：2.10(3H，s)，5.11(2H，s，br)，5.83(2H，s，br)，5.98(1H，m)，6.25(1H，m)，6.79(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 139(M+H)

製備例 158

將(1E)-1-(1-胺基-1H-吡咯-2-基)乙酮亞肼(110 g)溶在甲苯(1.1 L)，於氮氣 5 分鐘內加入第三丁氧化鉀(93.8 g)，加熱至回流溫度 45 分鐘。回流 15 分鐘，冷却至室溫，分層於乙酸乙酯(1.1 L)及水(1.1 L)。將水層萃取以乙酸乙酯(1.1 L)。將結合有機萃取液清洗以食鹽水(1.1 L)，將食鹽水萃取以乙酸乙酯(0.5 L)。結合有機層，於無水硫酸鎂下乾燥，蒸發可得 2-乙基-1H-吡咯-1-胺之棕色油(94.4 g)。

2-乙基-1H-吡咯-1-胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.26(3H，t，J=7Hz)，21.62(2H，q，J=7Hz)，4.53(2H，s，br)，5.80(1H，m)，5.99(1H，m)，6.67(1H，m)

製備例 159

將 4-甲氧基-3-氧丁酸第三丁酯(3.09 g)及碳酸鉀(2.50 g)溶在二甲基甲醯胺(20 mL)，加入 5-碘戊酸乙酯(4.62 g)，於室溫下攪拌 15 小時。分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=20:1-5:1)可得 2-(甲氧乙醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯之無色油(4.33 g)。

2-(甲氧乙醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.44(2H，m)，1.45(9H，s)，1.60-1.73(2H，m)，1.80-1.93(2H，m)，2.29(2H，t，J=7Hz)，3.41(3H，s)，3.47(1H，t，J=7Hz)，4.02(4H，m)

MS：(m/z)317(M+H)

下列化合物可依製備例 159 之方法製備。

製備例 160

2-(甲氧乙醯基)己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.46(9H，s)，1.52-1.73(2H，m)，1.82-1.94(2H，m)，2.33(2H，t，J=7Hz)，3.42(3H，s)，3.50(1H，t，J=7Hz)，4.10(2H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)

製備例 161

2-(甲氧乙醯基)戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.26(3H，t，J=7Hz)，1.47(9H，s)，2.10-2.25(2H，m)，2.37(2H，t，J=7Hz)，3.42(3H，s)，3.62(1H

，t，J=7Hz)，4.12(2H，s)，4.13(2H，q，J=7Hz)

製備例 162

2-乙醯己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.26(3H，t，J=7Hz)，1.47(9H，s)，1.57-1.75(2H，m)，1.79-1.93(2H，m)，2.23(3H，s)，2.33(2H，t，J=7Hz)，3.33(1H，t，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)

MS(ESI^+)：m/z 273

製備例 163

2-乙醯戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.26(3H，t，J=7Hz)，1.47(9H，s)，2.08-2.22(2H，m)，2.24(3H，s)，2.33-2.42(2H，m)，3.45(1H，t，J=7Hz)，4.13(2H，q，J=7Hz)

製備例 164

將 2-乙基-1H-吡咯(7.00 g)溶在四氫呋喃(14 mL)，於冰浴冷卻下加入 0.93 M 乙基溴化鎂(198 mL)。於室溫下攪拌 1 小時。於冰浴冷卻及 50 分鐘內加入 5-溴菸鹼醯氯(22.3 g)之四氫呋喃(110 mL)。於冰浴冷卻下攪拌 15 分鐘，中止反應以加入飽和氯化銨溶液(30 mL)。分層於乙酸乙酯(350 mL)及水(350 mL)。將有機層清洗以飽和重碳酸鈉溶液及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得暗色膠(33.9 g)。將膠溶在乙酸乙酯/己烷(1:3，150 mL)及矽膠(150 mL)。過濾，將濾液濃縮可得黃色結晶(20.6 g)。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-20～4-5 可得(5-溴-3-吡啶基)(5-乙基-1H-吡咯-2-基)甲酮淡黃色固體(7.11 g)。

(5-溴-3-吡啶基)(5-乙基-1H-吡咯-2-基)甲酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.33(3H，t，J=7Hz)，2.75(2H，q，J=7Hz)，6.14(1H，m)，6.83(1H，m)，8.27(1H，m)，8.82(1H，m)，8.98(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 279(M+H)

製備例 165

將 4-(乙醯氧基)-3-氧丁酸第三丁酯(30.0 g)及 5-碘戊酸乙酯(35.5 g)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(150 mL)，於室溫下加入碳酸鉀(19.2 g)。攪拌 4 小時，中止反應以於冰浴冷卻下加入 1N HCl(140 mL)。分層於乙酸乙酯(450 mL)及水(300 mL)。將有機層清洗以水(500 mL，3 次)及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得棕色油 2-[(乙醯氧基)乙醯基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯(63.4 g，43%純)。

2-[(乙醯氧基)乙醯基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.20-1.37(5H，m)，1.46(9H，s)，1.63(2H，m)，1.85(2H，m)，2.17(3H，s)，2.30(2H，t，J=7Hz)，3.39(1H，t，J=7Hz)，4.11 82H，q，J=7Hz)，4.73(1H，d，J=17Hz)，4.82(1H，d，J=17Hz)

製備例 166

將乙噻吩(2.00 g)及 7-氯-7-氧庚酸乙酯(5.39 g)溶在二氯甲烷(20 mL)，於冰浴冷卻下及 0.5 小時(5～8℃)下加入 1 M 氯化錫之二氯甲烷(38.9 mL)。攪拌 0.5 小時，於室溫下攪拌 0.5 小時。倒至冰水(100 mL)，萃取以乙酸乙酯(100 mL)。將有機層清洗以水(100 mL)及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並

真空蒸發可得棕色油。以矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-10～3-10可得7-氧-7-(2-噻吩基)庚酸乙酯棕色油(5.79 g)。

7-氧-7-(2-噻吩基)庚酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.42(2H，m)，1.63-1.72(4H，m)，2.31(2H，t，J=7Hz)，2.91(2H，t，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，7.13(1H，m)，7.612(1H，m)，7.70(1H，m)

下列化合物可仿製備例129及製備例130之方法製備。

製備例167

3-(3，5-二甲基-4-異噁唑基)-3-氧丙酸第三丁酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.47(9H，s)，2.46(3H，s)，2.68(3H，s)，3.68(2H，s)

製備例168

4-甲基-3-氧戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.14(6H，d，J=7Hz)，1.28(3H，t，J=7Hz)，2.71(1H，五線，J=7Hz)，3.50(s，2H)，4.19(2H，q，J=7Hz)，7.06-7.18，7.56，及7.85(4H，m)

製備例169

4-(甲硫基)-3-氧丁酸第三丁酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.47(9H，s)，2.07(3H，s)，3.31(2H，s)，3.58(2H，s)

製備例170

3-(1，3-噁唑-5-基)-3-氧丙酸第三丁酯

NMR($CDCl_3$，δ)：(酮及烯醇形式之混合物)；酮形式：1.45(9H，s)，3.77(2H，s)，7.85(1H，s)，8.04(1H，s)；烯醇形式：d 1.45(9H，s)，5.54(1H，s)，7.53(1H，s)，7.91(1H，s)

下列化合物可依製備例 143 之方法製備。

製備例 171

(2-氯-4-吡啶基)(5-乙基-1H-吡咯-2-基)甲酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.32(3H，t，J=7Hz)，2.74(2H，q，J=7Hz)，6.13(1H，m)，6.79(1H，m)，7.56(1H，d，J=5Hz)，7.69(1H，s)，8.54(1H，d，J=5Hz)，9.40(1H，br)

製備例 172

(5-乙基-1H-吡咯-2-基)(3-甲氧苯基)甲酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.32(3H，t，J=7Hz)，2.74(2H，q，J=7Hz)，3.87(3H，s)，6.08(1H，m)，6.83(1H，m)，7.08(1H，dd，J=2 Hz，8Hz)，7.33-7.42(2H，m)，7.47(1H，d，J=8Hz)，9.58(1H，br)

MS(ESI^+)：m/z 230

製備例 173

(5-乙基-1H-吡咯-2-基)(4-吡啶基)甲酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.32(3H，t，J=7Hz)，2.72(2H，q，J=7Hz)，6.13(1H，m)，6.81(1H，m)，7.65(2H，d，J=7Hz)，8.77(2H，d，J=7Hz)，9.39(1H，br)

製備例 174

(5-乙基-1H-吡咯-2-基)(2-吡咁基)甲酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.33(3H，t，J=7Hz)，2.77(2H，q，J=7Hz)，6.14(1H，m)，7.51(1H，m)，8.65(1H，m)，8.74(1H，m)，9.36(1H，br)

製備例 175

(5-乙基-1H-吡咯-2-基)(3-吡啶基)甲酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.33(3H，t，J=7Hz)，2.76(2H，q，J=7Hz)，6.12(1H，m)，6.81(1H，m)，7.42(1H，m)，8.13(1H，m)，8.76(1H，m)，9.08(1H，m)，9.36(1H，br)

製備例 176

將 3-[(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄腈(300 mg)，甲磺醯基乙酸(208 mg)，1-(3-二甲胺丙基)-3-乙碳化二亞胺鹽酸鹽(361 mg)，及 1-羥基苯并三唑(254 mg)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(1 mL)，攪拌 1.5 小時。分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以水 2 次，飽和重碳酸鈉，及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得淡棕色固體。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1/2～1/0 可得 N-[2-(3-氰苄醯基)-5-乙基-1H-吡咯-1-基]-2-(甲磺醯基)乙醯胺之淡棕色泡沫，靜置可固化(505 mg)。

N-[2-(3-氰苄醯基)-5-乙基-1H-吡咯-1-基]-2-(甲磺醯基)乙醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.29(3H，t，J=7Hz)，2.62(2H，q，J=7Hz，)，3.28(3H，s)，4.15(2H，s)，6.12(1H，d，J=5Hz)，6.75(1H，d，J=5Hz)，7.58(1H，t，J=9Hz)，7.82(1H，d，J=9Hz)，8.01(1H，d，J=9Hz)，8.06(1H，s)

下列化合物可仿製備例 176 之方法製備。

製備例 177

3-{[2-(4-氰苄醯基)-5-乙基-1H-吡咯-1-基]胺基}-3-氧丙酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.20-1.37(6H，m)，2.56(2H，q，J=7Hz)，3.57(2H，s)，4.30(2H，q，J=7Hz)，6.06(1H，d，J=5Hz)，6.68(1H，d，J=5Hz)，7.54(2H，d，J=9Hz)，7.84(2H，d，J=9Hz)

例 1

將 4-[(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄腈(100 mg)溶在甲苯(1 mL)，於室溫下加入 1-(4-甲氧苯基)丙酮(103 mg)及對甲苯磺酸單水合物(16 mg)。於 80℃下加熱 3 小時。真空蒸發。將殘渣以矽膠柱層析純化，溶離以己烷-乙酸乙酯 = 20-1 及 15-1，得 4-[7-乙基-3-(4-甲氧苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈(31 mg，20.2%)之黃色固體。

4-[7-乙基-3-(4-甲氧苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.40(3H，t，J=8Hz)，2.31(3H，s)，3.16(2H，q，J=8Hz)，3.77(3H，s)，6.10(1H，d，J=5Hz)，6.60(1H，d，J=5Hz)，6.75(2H，d，J=8Hz)，6.93(2H，d，J=8Hz)，7.33(2H，d，J=8Hz)，7.53(2H，d，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 368(M+H)

下列化合物可依例 1 之方法製備。

例 2

4-(4-氰苯基)-2-(2-乙氧基-2-氧乙基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.84(3H，t，J=7Hz)，1.28(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，3.04(2H，q，J=7Hz)，3.93(2H，q，J=7Hz)，4.13(3H，s)，4.19(2H，q，J=7Hz)，6.24(1H，d，J=5Hz)，6.62(1H，d，J=5Hz)，7.13(2H，d，J=9Hz)，7.76(2H，d，J=9Hz)

例 3

4-(4-氰苯基)-7-乙基-2-(三氟甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.08(3H，t，J=7Hz)，1.41(3H，t，J=7Hz)，3.11(2H，q，J=7Hz)，4.11(2H，q，J=7Hz)，6.43(1H，d，J=5Hz)，6.93(1H，d，J=5Hz)，7.62(2H，d，J=9Hz)，7.80(2H，d，J=9Hz)

例 4

4-[7-乙基-2-甲基-3-(3-吡啶羰基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-4-基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.43(t，J=7 Hz，3H)，2.47(s，3H)，3.09(q，J=7 Hz，2 H)，6.35(d，J=5 Hz，1H)，6.74(d，J=5 Hz，1H)，7.23(1H，m)，7.48(2H，d，J=9Hz)，7.55(2H，d，J=9Hz)，7.93(1H，m)，8.62(1H，m)，8.74(1H，m)

例 5

3-[7-乙基-2-甲基-3-(4-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-4-基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.42(3H，t，J=7Hz)，2.32(3H，s)，3.08(2H，q，J=7Hz)，6.15(1H，d，J=5Hz)，6.67(1H，d，J=5Hz)，7.00(2H，d，J=9Hz)，7.37(2H，m)，7.57(2H，m)，8.50(2H，d，J=9Hz)

例 6

4-(3-苄基-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基)苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.40(3H，t，J=8Hz)，2.35(3H，s)，3.04(2H，q，J=8Hz)，3.83(3H，s)，5.94(1H，d，J=5Hz)，6.57(1H，d，J=5Hz)，6.98(2H，d，J=8Hz)，7.14-7.30(3H，m)，7.46(2H，d，J=8Hz)，7.68(2H，d，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 352(M+H)

例 7

4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-甲腈

熔點：172-173°C

NMR(CDCl3，δ)：1.41(3H，t，J=8Hz)，3.10(2H，q，J=8Hz)，6.65(1H，d，J=5Hz)，6.88(1H，d，J=5Hz)，7.47-7.64(6H，m)，7.70(1H，br s)，7.81-7.90(2H，m)

例 8

3-(3-乙基-7，7，9，9-四甲基-6，7，8，9-四氫吡咯并[1，2-b]啐喏啉-10-基)苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.00-1.15(12H，m)，1.37(3H，t，J=8Hz)，2.81(3H，s)，3.00(2H，q，J=8Hz)，3.82 (2H，t，J=5Hz)，5.46(1H，d，J=5Hz)，6.46(1H，d，J=5Hz)，7.50-7.65(3H，m)，7.72(1H，m)

例 9

3-(3-乙基-9-氧-6，7，8，9-四氫吡咯并[1，2-b]哼喏啉-10-基)苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.40(3H，t，J=8Hz)，2.08-2.22(2H，m)，2.60(2H，t，J=7Hz)，3.00-3.15(4H，m)，6.26(1H，d，J=5Hz)，6.74(1H，d，J=5Hz)，7.49-7.61(3H，m)，7.74(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 316(M+H)

例 10

3-(6-乙基-1-氧-2，3-二氫-1H-環戊[e]吡咯并[1，2-b]嗒咿-9-基)苄腈

熔點：150-154°C

NMR(CDCl3，δ)：1.43(3H，t，J=8Hz)，2.75(2H，t，J=7Hz)，3.10(2H，q，J=8Hz)，3.24(2H，t，J=7Hz)，6.67(1H，d，J=5Hz)，6.87(1H，d，J=5Hz)，7.60(1H，t，J=8Hz)，7.75-7.90(3H，m)

MS(ESI^+)：m/z 324(M+Na)

例 11

3-(7-乙基-2-新戊吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基)苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.05(9H，s)，1.39(3H，t，J=8Hz)，2.68(2H，s)，3.04(2H，q，J=8Hz)，6.36(1H，s)，6.48(1H，d，J=5Hz)，6.67(1H，d，J=5Hz)，7.51(1H，t，J=8Hz)，7.75(1H，br d，J=8Hz)，7.92-8.01(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 318(M+H)

例 12

3-[7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.44(3H，t，J=8Hz)，3.11(2H，q，J=8Hz)，6.52-6.60(2H，m)，6.74(1H，d，J=5Hz)，6.98(1H，s)，7.09(1H，d，J=5Hz)，7.56-7.68(2H，m)，7.78(1H，dd，J=8，1Hz)，7.96-8.08(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 314(M+H)

例 13

4-[7-乙基-2-甲基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.38(3H，t，J=8Hz)，2.89(3H，s)，3.00-3.11(5H，m)，6.09(1H，d，J=5Hz)，6.73(1H，d，J=5Hz)，7.45(2H，d，J=8Hz)，7.76(2H，d，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 340(M+H)

例 13-2

4-{7-乙基-2-[(甲磺醯基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基}苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.39(3H，t，J=8Hz)，2.96-3.09(5H，m)，4.44(2H，s)，6.63(1H，d，J=5Hz)，6.71(1H，s)，6.81(1H，d，J=5Hz)，7.79(2H，d，J=8Hz)，7.85(2H，d，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 340(M+H)

例 15

3-[7-乙基-2-甲基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.39(3H，t，J=8Hz)，2.89(3H，s)，3.00-3.11(5H，m)，6.09(1H，d，J=5Hz)，6.73(1H，d，J=5Hz)，7.54-7.63(3H，m)，7.77(1H，m)

例 16

將 4-[7-乙基-3-(4-甲氧苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈(22 mg)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(1 mL)，於室溫下加入 1N NaOH(0.12 mL)及 30%過氧化氫(0.07 mL)。攪拌 1 小時，分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以水 3 次及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以驟矽膠柱層析純化(矽膠，30 mL)，溶離以己烷-乙酸乙酯 = 5-1～0-1 可得 4-[7-乙基-3-(4-甲氧苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄醯胺(18 mg，78.0%)之黃色固體。

4-[7-乙基-3-(4-甲氧苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.41(3H，t，J=8Hz)，2.31(3H，s)，3.17(2H，q，J=8Hz)，3.77(3H，s)，5.61(0.2H，br s)，6.02(0.4H，br s)，6.13(1H，d，J=5Hz)，6.60(1H，d，J=5Hz)，6.75(2H，d，J=8Hz)，6.95(2H，d，J=8Hz)，7.31(2H，d，J=8Hz)，7.68(2H，d，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 386(M+H)

下列化合物可仿例 16 之方法製備。

例 17

3-[2-(二甲胺基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.32(3H，t，J=7Hz)，2.90(6H，s)，2.95(2H，q，J=7Hz)，3.36(3H，s)，6.21(1H，d，J=5Hz)，6.79(1H，d，J=5Hz)，7.44(1H，s，br)，7.52-7.56(2H，m)，7.90(1H，s)，7.94-8.06(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 387(M+H)

例 18

3-(7-乙基-2-新戊吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基)苄醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.05(9H，s)，1.39(3H，t，J=8Hz)，2.68(2H，s)，3.04(2H，q，J=8Hz)，5.70(1H，br s)，6.11(1H，br s)，6.41(1H，s)，6.52(1H，d，J=5Hz)，6.65(1H，d，J=5Hz)，7.59(1H，t，J=8Hz)，7.85-7.93(2H，m)，8.15(1H，br s)

MS(ESI^+)：m/z 336(M+H)

例 19

3-[7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.43(3H，t，J=8Hz)，3.10(2H，q，J=8Hz)，5.70(1H，br s)，6.13(1H，br s)，6.53-6.60(2H，m)，6.71(1H，d，J=5Hz)，7.02(1H，s)，7.06(1H，d，J=5Hz)，7.55-7.65(2H，m)，7.79-7.98(2H，m)，8.02(1H，br s)

MS(ESI^+)：m/z 332(M+H)

例 20

5-[2-({[4-(胺羰基)苄基]氧基}甲基)-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR(DMSO-d_6，δ)：1.27-1.45(7H，m)，1.99(2H，m)，2.96(2H，m)，3.40(2H，m)，4.67(2H，s)，4.72(2H，s)，

5.88(1H，d，J=5Hz)，6.67(1H，d，J=5Hz)，7.35(1H，s，br)，7.44(2H，d，J=8Hz)，7.86(2H，d，J=8Hz)，7.96(1H，s，br)，8.21(1H，m)，8.60(1H，m)，8.86(1H，m)

例 21

將 6-(3-氰苄醯基)-7-氧辛酸乙酯(3.18 g)溶在甲苯(30 mL)，於室溫下加入 2-乙基-1H-吡咯-1-胺(1.17 g)及對甲苯磺酸單水合物(96 mg)。回流 1 小時。真空蒸發。將殘渣以驟矽膠柱層析純化(矽膠，200 mL)，溶離以己烷-乙酸乙酯=20-1，15-1，及 10-1 可得 5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(3.29 g，83.8%)之黃色油。

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=8Hz)，1.32-1.58(7H，m)，2.18(2H，t，J=8Hz)，2.35-2.45(2H，m)，3.01(2H，q，J=8Hz)，4.10(2H，q，J=8Hz)，5.79(1H，d，J=5Hz)，6.51(1H，d，J=5Hz)，7.57-7.67(3H，m)，7.75(1H，m)

下列化合物可依例 21 之方法製備。

例 22

2，4-二異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

NMR(300 MHz，$CDCl_3$，δ)：1.32(6H，d，J=7.5Hz)，1.39(3H，t，J=7.5Hz)，1.46(6H，d，J=7.5Hz)，2.91-3.05(1H，m)，3.05-3.20(1H，m)，4.38(2H，q，J=7.5Hz)，6.64-6.68(1H，m)，6.76-6.80(1H，m)，7.65-7.68(1H，m)

MS(ES+)m/e 275.33

例 23

4-(2-氯苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

NMR(300 MHz，$CDCl_3$，δ)：0.89(3H，t，J=7.5Hz)，1.30-1.40(6H，m)，3.36-3.51(1H，m)，4.00(2H，q，J=7.5Hz)，6.10-6.18(1H，m)，6.75-6.84(1H，m)，7.28-7.45(3H，m)，7.45-7.55(1H，m)，7.75-7.81(1H，m)

例 24

2-異丙基-4-(2-萘基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

NMR(300 MHz，$CDCl_3$，δ)：0.78(3H，t，J=7.5Hz)，1.38(6H，d，J=7.5Hz)，3.24-3.35(1H，m)，3.95(2H，q，J=7.5Hz)，6.36-6.40(1H，m)，6.80-6.85(1H，m)，7.50-7.54(3H，m)，7.78-7.82(1H，m)，7.82-8.00(4H，m)

MS(ES+)m/e 359.56

例 25

5-{7-乙基-2-甲基-4-[3-(三氟甲基)苯基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.22(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.59(4H，m)，2.14(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.46(2H，m)，2.55(3H，s)，3.01(2H，q，J=7Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，5.83(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.53-7.64(3H，m)，7.71(1H，d，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 433(M+H)

例 26

5-[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒

咁-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.38-1.60(4H，m)，2.18(2H，t，J=7Hz)，2.42(3H，s)，2.38-2.50(2H，m)，2.55(3H，s)，3.00(2H，q，J=7Hz)，4.09(2H，q，J=7Hz)，5.87(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.50(1H，s)，8.39(1H，s)，8.53(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 380(M+H)

例 27

5-[7-乙基-4-(3-甲氧基-5-異噁唑基)-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咁-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.55-1.64(2H，m)，1.64-1.80(2H，m)，2.33(2H，t，J=7Hz)，2.74-2.85(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.43(3H，s)，4.08(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.62(2H，s)，6.28(1H，s)，6.38(1H，d，J=4Hz)，6.65(1H，d，J=4Hz)

MS(ESI^+)：m/z 416(M+H)

例 28

5-{7-乙基-2-甲基-4-[3-(1，3-噁唑-5-基)苯基]吡咯并[1，2-b]嗒咁-3-基}戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.20(3H，t，J=7Hz)，1.35(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.63(4H，m)，2.17(2H，t，J=7Hz)，2.44-2.57(2H，m)，2.56(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.05(2H，q，J=7Hz)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.50(1H，d，J=4Hz)，7.33(1H，d，J=8Hz)，7.39(1H，s)，7.53(1H，t，J=8Hz)，7.66(1H，

m)，7.74(1H，d，J=8Hz)，7.93(1H，s)

例 29

5-[4-(3，4-二氯苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.38-1.48(2H，m)，1.50-1.65(2H，m)，2.20(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.47(2H，m)，2.54(3H，s)，3.00(2H，q，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，5.87(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.19(1H，dd，J=2 Hz，8Hz)，7.46(1H，d，J=2Hz)，7.56(1H，d，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 433(M+H)

例 30

5-[4-(4-氯-2-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.44-1.67(4H，m)，2.15-2.26(2H，m)，2.42-2.56(2H，m)，2.56(3H，s)，3.01(2H，q，J=7Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，5.95(1H，d，J=3Hz)，6.54(1H，d，J=3Hz)，7.40(1H，dd，J=2 Hz，4Hz)，7.54(1H，d，J=2Hz)，8.67(1H，d，J=4Hz)

MS(ESI^+)：m/z 400(M+H)

例 31

5-[4-(5-氯-2-噻吩基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)

，1.48-1.74(4H，m)，2.28(2H，t，J=7Hz)，2.68-2.77(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.44(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.60(2H，s)，6.25(1H，d，J=4Hz)，6.60(1H，d，J=4Hz)，6.97(2H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 435(M+H)

例 32

5-[7-乙基-4-(6-甲氧基-2-吡啉基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.52-1.68(4H，m)，2.23(2H，t，J=7Hz)，2.48-2.55(2H，m)，2.56(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.98(3H，s)，4.09(2H，q，J=7Hz)，6.03(1H，d，J=4Hz)，6.55(1H，d，J=4Hz)，8.30(1H，s)，8.33(1H，s)

MS(ESI$^+$)：m/z 397(M+H)

例 33

5-[4-(1-苯并呋喃-2-基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.38(3H，t，J=7Hz)，1.62-1.83(4H，m)，2.33(2H，t，J=7Hz)，2.57(3H，s)，2.69-2.78(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，6.48(1H，d，J=4Hz)，6.59(1H，d，J=4Hz)，7.15(1H，s)，7.26-7.42(2H，m)，7.57(1H，d，J=8Hz)，7.68(1H，d，J=8Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 405(M+H)

例 34

5-[4-(1-苯并噻吩-2-基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.21(3H，t，J=7Hz)，1.35(3H，t，J=7Hz)，1.52-1.69(4H，m)，2.23(2H，t，J=7Hz)，2.56(3H，s)，2.61-2.70(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.07(2H，q，J=7Hz)，6.21(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.35-7.43(3H，m)，7.81-7.92(2H，m)

例 35

5-[7-乙基-2-甲基-4-(1，3-噁唑-5-基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.53-1.66(2H，m)，1.66-1.83(2H，m)，2.34(2H，t，J=7Hz)，2.56(3H，s)，2.62-2.73(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.13(2H，q，J=7Hz)，6.42(1H，d，J=4Hz)，6.58(1H，d，J=4Hz)，7.50(1H，s)，8.10(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 356(M+H)

例 36

5-(7-乙基-2-甲基-4-苯基吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基)戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.60(4H，m)，2.15(2H，t，J=7Hz)，2.41-2.48(2H，m)，2.55(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.08(2H，q，J=7Hz)，5.88(1H，d，J=4Hz)，6.48(1H，d，J=4Hz)，7.31-7.34(2H

，m)，7.40-7.49(3H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 365(M+H)

例 37

5-[7-乙基-2-甲基-4-(6-喹啉基)吡咯并[1，2-b]噻吩-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.18(3H，t，J=7Hz)，1.39(3H，t，J=7Hz)，1.39-1.55(4H，m)，2.14(2H，d，J=7Hz)，2.44-2.55(2H，m)，2.58(3H，s)，3.03(2H，q，J=7Hz)，4.03(2H，q，J=7Hz)，5.86(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.45-7.52(1H，m)，7.69(1H，dd，J=2Hz，8Hz)，7.84(1H，d，J=2Hz)，8.20(2H，d，J=8Hz)，9.00(1H，m)

例 38

7-{4-[4-({[(苄氧基)羰基]胺基}磺醯基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]噻吩-3-基}庚酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.12-1.23(7H，m)，1.33-1.51(7H，s)，2.17(2H，t，J=7Hz)，2.35(2H，m)，2.56(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.11(2H，q，J=7Hz)，5.17(2H，s)，5.78(1H，d，J=5Hz)，6.52(1H，d，J=5Hz)，7.29-7.38(5H，m)，7.49(2H，d，J=9Hz)，7.87(1H，s，br)，8.11(2H，d，J=9Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 606(M+H)

MS(ESI$^-$)：m/z 604(M-H)

例 39

2-{[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]噻吩-3-基]甲基}-1，3-丙二醇

NMR($CDCl_3$，δ)：1.26(3H，t，J=7Hz)，1.38(3H，t，J=7Hz)，1.64-1.82(3H，m)，2.59(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.45(2H，m)，3.63(2H，m)，4.12(2H，q，J=7Hz)，5.93(1H，d)，J=5Hz)，6.53(1H，d，J=5Hz)，7.28(1H，m)，7.42-7.44(3H，m)

例 40

5-{7-乙基-2-甲基-4-[3-(甲磺醯基)苯基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.22(3H，t，J=8Hz)，1.33-1.57(7H，m)，2.18(2H，t，J=8Hz)，2.35-2.45(2H，m)，2.56(3H，s)，3.01(2H，q，J=8Hz)，3.12(3H，s)，4.08(2H，q，J=8Hz)，5.80(1H，d，J=5Hz)，6.51(1H，d，J=5Hz)，7.64-7.74(2H，m)，7.96(1H，br s)，8.04(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 443(M+H)

例 41

5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=8Hz)，1.30-1.62(7H，m)，2.21(2H，t，J=8Hz)，2.35-2.45(2H，m)，2.55(3H，s)，3.00(2H，q，J=8Hz)，4.10(2H，q，J=8Hz)，5.85(1H，d，J=5Hz)，6.53(1H，d，J=5Hz)，7.24(1H，dd，J=7，1Hz)，7.35(1H，br s)，8.53(1H，d，J=7Hz)

MS(ESI^+)：m/z 400(M+H)

例 42

5-[7-乙基-2-甲基-4-(3-硝苯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.21(3H，t，J=8Hz)，1.34-1.59(7H，m)，2.17(2H，t，J=8Hz)，2.37-2.47(2H，m)，2.57(3H，s)，3.01(2H，q，J=8Hz)，4.08(2H，q，J=8Hz)，5.81(1H，d，J=5Hz)，6.52(1H，d，J=5Hz)，7.64-7.74(2H，m)，8.25(1H，br s)，8.33(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 410(M+H)

例 43

4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.98(3H，t，J=8Hz)，2.55(3H，s)，4.05(2H，q，J=8Hz)，6.35(1H，m)，6.81(1H，m)，7.12-7.22(2H，m)，7.41-7.50(2H，m)，7.76(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 359(M+H)

例 44

4-(3-丁基-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基)苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：0.78(3H，t，J=8Hz)，1.12-1.43(7H，m)，2.31-2.40(2H，m)，2.56(3H，s)，3.00(2H，q，J=8Hz)，5.79(1H，d，J=5Hz)，6.50(1H，d，J=5Hz)，7.47(2H，d，J=8Hz)，7.77(2H，d，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 318(M+H)

例 45

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.65(4H，m)，2.21(2H，t，J=7Hz)，2.37-2.49(2H，m)，2.56(3H，s)，3.00(2H，q，J=7Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，5.87(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.85(1H，m)，8.53(1H，d，J=2Hz)，8.77(1H，d，J=2Hz)

MS：(m/z)444，446(M+H)

例 46

5-{4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-[(甲硫基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.63(4H，m)，2.18(3H，s)，2.20(2H，t，J=7Hz)，2.48-2.58(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.81(2H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.57(1H，d，J=4Hz)，7.27(1H，m)，7.38(1H，s)，8.53(1H，d，J=4Hz)

MS：(m/z)446(M+H)

例 47

6-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]己酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.15-1.29(5H，m)，1.32-1.61(7H，m)，2.20(2H，t，J=8Hz)，2.33-2.43(2H，m)，2.56(3H，s)，3.01(2H，q，J=8Hz)，4.10(2H，q，J=8Hz)，5.79(1H，d，J=5Hz)，6.51(1H，d，J=5Hz)，7.57-7.67(3H，m)，7.75(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 404(M+H)

例 48

5-[4-(6-氯-2-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.46-1.65(4H，m)，2.22(2H，t，J=7Hz)，2.46-2.57(2H，m)，2.54(3H，s)，3.00(2H，q，J=7Hz)，4.09(2H，q，J=7Hz)，5.95(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.38-7.47(2H，m)，7.80(1H，t，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 400

例 49

5-[7-乙基-4-(3-甲氧苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.62(4H，m)，2.17(2H，t，J=7Hz)，2.43-2.52(2H，m)，2.54(3H，s)，3.00(2H，q，J=7Hz)，3.83(3H，s)，4.08(2H，q，J=7Hz)，5.91(1H，d，J=4Hz)，6.49(1H，d，J=4Hz)，6.87-6.99(3H，m)，7.37(1H，t，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 395

例 50

5-[4-(3，5-二氯苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.39-1.52(2H，m)，1.52-1.64(2H，m)，2.22(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.48(2H，m)，2.54(3H，s)，3.00(2H，q，J=7Hz)，

4.10(2H，q，J=7Hz)，5.88(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.25(2H，m)，7.45(1H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 433

例 51

5-[4-(5-氯-2-噻吩基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.46-1.58(2H，m)，1.60-1.74(2H，m)，2.28(2H，t，J=7Hz)，2.53(3H，s)，2.56-2.66(2H，m)，2.98(2H，q，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，6.20(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，6.94(1H，d，J=4Hz)，6.98(1H，d，J=4Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 405

例 52

5-[7-乙基-4-(3-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.39(3H，t，J=7Hz)，1.38-1.50(2H，m)，1.50-1.63(2H，m)，2.17(2H，t，J=7Hz)，2.39-2.48(2H，m)，2.54(3H，s)，3.03(2H，q，J=7Hz)，4.09(2H，q，J=7Hz)，5.88(1H，d，J=4Hz)，6.50(1H，d，J=4Hz)，7.03-7.16(3H，m)，7.38-7.47(1H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 383

例 53

5-[7-乙基-2-甲基-4-(3-喹啉基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.18(3H，t，J=7Hz)，1.38(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.60(4H，m)，2.16(2H，t，J=7Hz)，2.44-2.56(2H，m)，2.59(3H，s)，3.04(2H，q，J=7Hz)，4.03(2H，q，J=7Hz)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.62(1H，t，J=8Hz)，7.80(1H，t，J=8Hz)，7.90(1H，d，J=8Hz)，8.21(2H，m)，8.90(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI^+)：m/z 416

例 54

5-[7-乙基-2-甲基-4-(4-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.38(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.64(4H，m)，2.19(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.52(2H，m)，2.55(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.09(2H，q，J=7Hz)，5.83(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.29(2H，m)，8.72(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 366

例 55

5-[7-乙基-4-(3-甲氧基-5-異噁唑基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.55-1.82(4H，m)，2.33(2H，t，J=7Hz)，2.55(3H，s)，2.62-2.72(2H，m)，2.99(2H，q，J=7Hz)，4.08(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，6.26(1H，s)，6.34(1H，d，J=4Hz)，6.58(1H，d，J=4Hz)

例 56

5-[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-異噁唑基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.50-1.75(4H，m)，2.29(2H，t，J=7Hz)，2.55(6H，s)，2.56-2.65(2H，m)，2.99(2H，q，J=7Hz)，4.11(2H，q，J=7Hz)，6.16(1H，d，J=4Hz)，6.22(1H，s)，6.54(1H，d，J=4Hz)

MS(ESI^+)：m/z 370

例 57

5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.36-1.63(4H，m)，2.20(2H，t，J=7Hz)，2.48-2.63(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.45(3H，s)，4.09(2H，q，J=7Hz)，4.62(2H，s)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.60(1H，d，J=4Hz)，7.26(1H，m)，7.37(1H，s)，8.53(1H，d，J=5Hz)

MS(ESI^+)：m/z 430

例 58

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(3-甲氧苯基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.22(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.63(4H，m)，2.16(2H，t，J=7Hz)，2.54-2.65(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，3.45(3H，s)，3.83(3H，s)，4.08(2H，q，J=7Hz)，4.62(2H，s)，5.96(1H，d，J=4Hz)，6.56(1H

，d，J=4Hz)，6.87-7.00(3H，m)，7.38(1H，t，J=8Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 425

例 59

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(6-喹啉基)吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.17(3H，t，J=7Hz)，1.43(3H，t，J=7Hz)，1.36-1.58(4H，m)，2.10(2H，m)，2.56-2.68(2H，m)，3.07(2H，q，J=7Hz)，3.48(3H，s)，4.02(2H，q，J=7Hz)，4.66(2H，s)，5.90(1H，d，J=4Hz)，6.56(1H，d，J=4Hz)，7.45-7.50(1H，m)，7.72(1H，dd，J=2 Hz，8Hz)，7.86(1H，d，J=2Hz)，8.16-8.24(2H，m)，8.98(1H，m)

例 60

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.22(3H，t，J=7Hz)，1.38(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.60(4H，m)，2.17(2H，t，J=7Hz)，2.52-2.64(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，3.46(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.63(2H，s)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.58(1H，d，J=4Hz)，7.42(1H，m)，7.71(1H，m)，8.62(1H，m)，8.70(1H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 396

例 61

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)

，1.40-1.58(4H，m)，2.17(2H，t，J=7Hz)，2.51-2.62(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.45(3H，s)，4.08(2H，q，J=7Hz)，4.61(2H，s)，5.92(1H，d，J=4Hz)，6.56(1H，d，J=4Hz)，7.25(1H，m)，7.37(1H，s)，7.42(2H，m)

例 62

5-[7-乙基-2-甲基-4-(3-甲苯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.60(4H，m)，2.16(2H，t，J=7Hz)，2.40(3H，s)，2.40-2.50(2H，m)，2.54(3H，s)，3.03(2H，q，J=7Hz)，4.08(2H，q，J=7Hz)，5.90(1H，d，J=4Hz)，6.49(1H，d，J=4Hz)，7.10-7.15(2H，m)，7.24(1H，m)，7.33(1H，m)

MS：(m/z)379(M+H)

例 65

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.60(4H，m)，2.18(2H，t，J=7Hz)，2.42(3H，s)，2.48-2.63(2H，m)，3.05(2H，q，J=7Hz)，3.46(3H，s)，4.08(2H，q，J=7Hz)，4.62(2H，s)，5.90(1H，d，J=4Hz)，6.57(1H，d，J=4Hz)，7.51(1H，s)，8.41(1H，s)，8.53(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 410

例 66

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-

基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.65(4H，m)，2.21(2H，t，J=7Hz)，2.37-2.49(2H，m)，2.56(3H，s)，3.00(2H，q，J=7Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，5.87(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.85(1H，m)，8.53(1H，d，J=2Hz)，8.77(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI^+)：m/z 444，446

例 67

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咪-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.63(4H，m)，2.19(2H，t，J=7Hz)，2.50-2.66(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.46(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.62(2H，s)，5.91(1H，d，J=4Hz)，6.60(1H，d，J=4Hz)，7.88(1H，m)，8.55(1H，d，J=2Hz)，8.77(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI^+)：m/z 474，476

例 68

5-[4-(5，6-二氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咪-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.36-1.60(4H，m)，2.23(2H，t，J=7Hz)，2.37-2.50(2H，m)，2.55(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，5.87(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.81(1H，d，J=2Hz)，8.30(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 434

例 69

4-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.65-1.78(2H，m)，2.16-2.25(2H，m)，2.42(3H，s)，2.53-2.65(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，3.46(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.67(2H，m)，5.91(1H，d，J=4Hz)，6.58(1H，d，J=4Hz)，7.53(1H，s)，8.43(1H，s)，8.54(1H，s)

MS(ESI$^+$)：m/z 396

例 70

3-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，2.35-2.55(2H，m)，2.42(3H，s)，2.84-2.96(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，3.46(3H，s)，4.08(2H，q，J=7Hz)，4.65(2H，s)，5.91(1H，d，J=4Hz)，6.61(1H，d，J=4Hz)，7.51(1H，s)，8.41(1H，s)，8.52(1H，s)

例 71

4-[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.20(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.66-1.82(2H，m)，2.16-2.28(2H，m)，2.42(3H，s)，2.44-2.53(2H，m)，2.59(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.12(2H

，q，J=7Hz)，5.87(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.51(1H，s)，8.41(1H，d，J=2Hz)，8.53(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 366

例 72

3-[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基]丙酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，2.30-2.43(2H，m)，2.42(3H，s)，2.58(3H，s)，2.76-2.86(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，5.87(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.48(1H，s)，8.40(1H，d，J=2Hz)，8.53(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 352

例 73

3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基]丙酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.21(3H，t，J=7Hz)，1.39(2H，t，J=7Hz)，2.35(2H，t，J=7Hz)，2.58(3H，s)，2.74-2.83(2H，m)，3.01(2H，q，J=7Hz)，4.08(2H，q，J=7Hz)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.55(1H，d，J=4Hz)，7.87(1H，s)，8.53(1H，s)，8.79(1H，s)

MS：(m/z)416(M$^+$)，418(M$^+$-2)，85(bp)

例 74

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=8Hz)，1.32-1.55(5H，m)，2.16(2H，t，J=8Hz)，2.46-2.57(2H，m)，3.03(2H，q，J=8Hz)，3.46(3H，s)，4.09(1H，q，J=8Hz)，4.62(2H，s)，5.34(1H，d，J=5Hz)，6.57(1H，d，J=5Hz)，7.59-7.64(2H，m)，7.68(1H，br s)，7.75(1H，m)

MS(ESI^+)：420(M+H)

例 75

5-[2-[(乙醯氧基)甲基]-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.34-1.55(7H，m)，2.11-2.22(5H，m)，2.47(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.09(2H，q，J=7Hz)，5.29(2H，s)，5.94(1H，d，J=5Hz)，6.63(1H，d，J=5Hz)，7.88(1H，m)，8.56(1H，m)，8.79(1H，m)

例 76

將 5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(1.20 g)溶在乙醇(12 mL)，加入 1N NaOH(4.62 mL)，於室溫下攪拌 2 小時。酸化以 1N HCl 及分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以驟矽膠柱層析純化(矽膠，100 mL)，溶離以己烷-乙酸乙酯= 3-1，2-1，及 1-1 可得之黃色固體(846 mg)。將固體結晶自己烷-乙酸乙酯(5-1)可得 5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸之淡黃色結晶(795 mg，71.4%).

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

熔點：109-110°C

NMR(CDCl3，δ)：1.33-1.60(7H，m)，2.42(2H，t，J=8Hz)，2.34-2.48(2H，m)，2.56(3H，s)，3.01(2H，q，J=8Hz)，5.80(1H，d，J=5Hz)，6.52(1H，d，J=5Hz)，7.56-7.64(2H，m)，7.66(1H，br s)，7.76(1H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 362(M-H)

下列化合物可依例76之方法製備。

例77

3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.36(3H，t，J=7 H)，1.56(2H，m)，2.03(2H，m)，2.79(2H，m)，3.01(2H，q，J=7Hz)，6.01(1H，d，J=5Hz)，6.63(1H，d，J=5Hz)，7.27(1H，m)，7.40-7.53(8H，m)

例78

5-{7-乙基-2-甲基-4-[3-(三氟甲基)苯基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.62(4H，m)，2.22(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.46(2H，m)，2.56(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.84(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.53-7.64(3H，m)，7.72(1H，d，J=8Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 403(M-H)，405(M+H)

例79

5-[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.67(4H，m)，2.22(2H，t，J=7Hz)，2.42(3H，s)，2.35-2.48(2H，m)，2.56(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.83(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.53(1H，s)，8.39(1H，s)，8.53(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 352(M+H)

例 80

5-[7-乙基-4-(3-甲氧基-5-異噁唑基)-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.36(3H，t，J=7Hz)，1.58-1.83(4H，m)，2.38(2H，t，J=7Hz)，2.74-2.85(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.43(3H，s)，4.08(3H，s)，4.62(2H，s)，6.28(1H，s)，6.41(1H，d，J=4Hz)，6.67(1H，d，J=4Hz)

MS(ESI^+)：m/z 386(M-H)，388(M+H)

例 81

5-{7-乙基-2-甲基-4-[3-(1，3-噁唑-5-基)苯基]吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基}戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.38(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.65(4H，m)，2.21(2H，t，J=7Hz)，2.43-2.53(2H，m)，2.56(3H，s)，3.03(2H，q，J=7Hz)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.32(1H，d，J=8Hz)，7.39(1H，s)，7.53(1H，t，J=8Hz)，7.65(1H，s)，7.73(1H，d，J=8Hz)，7.93(1H，

s)

MS(ESI$^+$)：m/z 402(M-H)，404(M+H)

例 82

5-[4-(3，4-二氯苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.42-1.65(4H，m)，2.27(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.48(2H，m)，2.54(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.87(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.19(1H，dd，J=2 Hz，8Hz)，7.45(1H，d，J=2Hz)，7.56(1H，d，J=8Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 403(M-H)，405(M+H)

例 83

5-[4-(4-氯-2-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.36(3H，t，J=7Hz)，1.47-1.66(4H，m)，2.24(2H，t，J=7Hz)，1.45-2.56(2H，m)，2.55(3H，s)，3.00(2H，q，J=7Hz)，5.94(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.39(1H，dd，J=2 Hz，7Hz)，7.53(1H，d，J=2Hz)，8.67(1H，d，J=7Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 372(M+H)

例 84

5-[4-(5-氯-2-噻吩基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.36(3H，t，J=7Hz)，1.52-1.74(4H，

m)，2.33(2H，t，J=7Hz)，2.69-2.78(2H，m)，3.01(2H，q，J=7Hz)，3.44(3H，s)，4.60(2H，s)，6.25(1H，d，J=4Hz)，6.60(1H，d，J=4Hz)，6.97(2H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 405(M-H)，407(M+H)

例 85

5-[7-乙基-4-(6-甲氧基-2-吡啉基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.55-1.69(4H，m)，2.28(2H，m)，2.52(2H，m)，2.56(3H，s)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.97(3H，s)，6.03(1H，d，J=4Hz)，6.54(1H，d，J=4Hz)，8.30(1H，s)，8.32(1H，s)

MS(ESI$^+$)：m/z 369(M+H)

例 86

5-[4-(1-苯并呋喃-2-基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.39(3H，t，J=7Hz)，1.66-1.86(4H，m)，2.34-2.47(2H，m)，2.58(3H，s)，2.69-2.85(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，6.47(1H，d，J=4Hz)，6.61(1H，d，J=4Hz)，7.16(1H，s)，7.26-7.43(2H，m)，7.57(1H，d，J=8Hz)，7.68(1H，d，J=8Hz)

例 87

5-[4-(1-苯并噻吩-2-基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.53-1.73(4H，

m)，2.30(2H，t，J=7Hz)，2.56(3H，s)，2.62-2.73(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，6.19(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.34-7.45(3H，m)，7.79-7.93(2H，m)

例 88

5-[7-乙基-2-甲基-4-(1，3-噁唑-5-基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.57-1.70(2H，m)，1.70-1.88(2H，m)，2.43(2H，t，J=7Hz)，2.56(3H，s)，2.66-2.75(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，6.41(1H，d，J=4Hz)，6.60(1H，d，J=4Hz)，7.52(1H，s)，8.13(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 328(M+H)

例 89

5-(7-乙基-2-甲基-4-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.62(4H，m)，2.20(2H，t，J=7Hz)，2.43-2.52(2H，m)，2.54(3H，s)，3.01(2H，q，J=7Hz)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.48(1H，d，J=4Hz)，7.33(2H，m)，7.38-7.52(3H，m)

MS(ESI^+)：m/z 337(M+H)

例 90

5-[7-乙基-2-甲基-4-(6-喹啉基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.39(3H，t，J=7Hz)，1.47-1.61(4H，m)，2.14-2.23(2H，m)，2.44-2.55(2H，m)，2.59(3H，s)，3.05(2H，q，J=7Hz)，5.86(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，

J=4Hz)，7.49(1H，m)，7.73(1H，dd，J=2 Hz，8Hz)，7.85(1H，d，J=2Hz)，8.23(2H，m)，8.97(1H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 386(M-H)，388(M+H)

例 91

7-{4-[4-(胺磺醯基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}庚酸

NMR($CDCl_3$，δ)：0.98(2H，m)，1.17-1.48(9H，m)，2.27(2H，t，J=7Hz)，2.36(2H，m)，2.56(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.06(2H，s，br)，5.84(1H，d，J=5Hz)，6.52(1H，d，J=5Hz)，7.52(2H，d，J=9Hz)，8.04(2H，d，J=9Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 444(M+H)

例 92

({[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]羰基}胺基)乙酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.41(3H，t，J=7Hz)，3.07(2H，q，J=7Hz)，3.95(2H，d，J=5Hz)，6.02(1H，t，br，5Hz)，6.37(1H，d，J=5Hz)，6.50(1H，m)，6.75(1H，d，J=5Hz)，7.01(1H，d，J=7Hz)，7.37-7.45(3H，m)，7.51(1H，m)，7.55(1H，m)

例 93

5-{7-乙基-2-甲基-4-[3-(甲磺醯基)苯基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.30-1.59(7H，m)，2.22(2H，t，J=8Hz)，2.33-2.49(2H，m)，2.56(3H，s)，3.01(2H，q，J=8Hz)，

3.12(3H，s)，5.80(1H，d，J=5Hz)，6.50(1H，d，J=5Hz)，7.63-7.74(2H，m)，7.95(1H，br s)，8.03(1H，br d，J=8Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 415(M+H)

例 94

5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

熔點：139-140°C

NMR(CDCl3，δ)：1.32-1.64(7H，m)，2.28(2H，t，J=8Hz)，2.36-2.46(2H，m)，2.55(3H，s)，3.00(2H，q，J=8Hz)，5.85(1H，d，J=5Hz)，6.52(1H，d，J=5Hz)，7.24(1H，br d，J=7Hz)，7.36(1H，br s)，8.53(1H，d，J=7Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 372(M+H)

例 95

5-[7-乙基-2-甲基-4-(2-乙烯基-4-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.36(3H，t，J=8Hz)，1.40-1.62(4H，m)，2.25(2H，t，J=8Hz)，2.35-2.47(2H，m)，2.56(3H，s)，3.00(2H，q，J=8Hz)，5.54(1H，d，J=10Hz)，5.86(1H，d，J=5Hz)，6.23(1H，d，J=16Hz)，6.51(1H，d，J=5Hz)，6.88(1H，dd，J=16，10Hz)，7.20(1H，dd，J=6，1Hz)，7.38(1H，br s)，8.70(1H，d，J=6Hz)

例 96

5-[7-乙基-2-甲基-4-(3-硝苯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=8Hz)，1.41-1.59(4H，m)，2.23(2H，t，J=8Hz)，2.37-2.47(2H，m)，2.57(3H，s)，3.02(2H，q，J=8Hz)，5.81(1H，d，J=5Hz)，6.51(1H，d，J=5Hz)，7.63-7.74(2H，m)，8.25(1H，br s)，8.32(1H，m)

例 97

{[7-乙基-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]喏啉-3-基]甲氧基}乙酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.33-1.45(9小時，m)，3.04(2H，q，J=8Hz)，3.43(1H，m)，4.01(2H，s)，4.45(2H，s)，6.09(1H，d，J=5Hz)，6.58(1H，d，J=5Hz)，7.13-7.22(2H，m)，7.40-7.49(2H，m)

例 98

5-[4-(5-乙醯基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]喏啉-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.43-1.63(4H，m)，2.23(2H，t，J=7Hz)，2.35-2.48(2H，m)，2.57(3H，s)，2.69(3H，s)，3.03(2H，q，J=7Hz)，5.80(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，8.26(1H，m)，8.78(1H，d，J=2Hz)，9.23(1H，d，J=2Hz)

MS：(m/z)378(M-H)，380(M+H)

例 99

5-{4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-[(甲硫基)甲基]吡咯并[1，2-b]喏啉-3-基}戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.36(3H，t，J=7Hz)，1.42-1.65(4H，m)，2.18(3H，s)，2.28(2H，t，J=7Hz)，2.48-2.60(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.81(2H，s)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.57(1H，d，J=4Hz)，7.27(1H，m)，7.38(1H，s)，8.53(1H，d，J=5Hz)

MS：(m/z)416(M-H)，418(M+H)

例 100

5-{4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-[(甲磺醯基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.65(4H，m)，2.29(2H，t，J=7Hz)，2.56-2.67(2H，m)，2.98(2H，q，J=7Hz)，3.13(3H，s)，4.54(2H，s)，5.98(1H，d，J=4Hz)，6.69(1H，d，J=4Hz)，7.27(1H，m)，7.38(1H，s)，8.56(1H，d，J=5Hz)

MS：(m/z)448(M-H)，450(M+H)

例 101

5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.03-1.45(4H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.97(2H，t，J=7Hz)，2.36-2.48(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.96(1H，d，J=4Hz)，6.64(1H，d，J=4Hz)，7.31(1H，d，J=5Hz)，7.39-7.53(6H，m)，8.55(1H，d，J=5Hz)

例 102

5-[4-(6-氯-2-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯-[1，2-b]嗒咿-3-基

]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.36(3H，t，J=7Hz)，1.56-1.73(4H，m)，2.29(2H，t，J=7Hz)，2.46-2.56(2H，m)，2.56(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.96(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.38-7.48(2H，m)，7.78(1H，t，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 372(M+H)，MS(ESI^-)：m/z 370

例 103

5-[7-乙基-4-(3-甲氧苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.46-1.63(4H，m)，2.22(2H，t，J=7Hz)，2.44-2.53(2H，m)，2.54(3H，s)，3.01(2H，q，J=7Hz)，3.82(3H，s)，5.92(1H，d，J=4Hz)，6.49(1H，d，J=4Hz)，6.87-7.01(3H，m)，7.37(1H，t，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 367，MS(ESI^-)：m/z 365

例 104

5-[4-(3，5-二氯苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.42-1.53(2H，m)，1.53-1.66(2H，m)，2.27(2H，t，J=7Hz)，2.41-2.49(2H，m)，2.54(3H，s)，3.01(2H，q，J=7Hz)，5.88(1H，d，J=4Hz)，6.52(1H，d，J=4Hz)，7.26(2H，m)，7.45(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 405，MS(ESI^-)：m/z 403

例 105

5-[4-(5-氯-2-噻吩基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-

基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.36(3H，t，J=7Hz)，1.48-1.62(2H，m)，1.62-1.73(2H，m)，2.34(2H，t，J=7Hz)，2.53(3H，s)，2.58-2.67(2H，m)，2.99(2H，q，J=7Hz)，6.20(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，6.94(1H，d，J=4Hz)，6.98(1H，d，J=4Hz)

MS(ESI^+)：m/z 377，MS(ESI^-)：m/z 375

例 106

5-[7-乙基-4-(3-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.64(4H，m)，2.23(2H，t，J=7Hz)，2.41-2.49(2H，m)，2.55(3H，s)，3.00(2H，q，J=7Hz)，5.88(1H，d，J=4Hz)，6.50(1H，d，J=4Hz)，7.03-7.16(3H，m)，7.38-7.47(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 355，MS(ESI^-)：m/z 353

例 107

5-[7-乙基-2-甲基-4-(3-喹啉基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.39(3H，t，J=7Hz)，1.47-1.65(4H，m)，2.20-2.30(2H，m)，2.45-2.53(2H，m)，2.59(3H，s)，3.05(2H，q，J=7Hz)，5.87(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.62(1H，t，J=8Hz)，7.79(1H，t，J=8Hz)，7.87(1H，d，J=8Hz)，8.21(2H，m)，8.88(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI^+)：m/z 388，MS(ESI^-)：m/z 386

例 108

5-[7-乙基-2-甲基-4-(4-吡啶基)吡咯并[1，2-b]噻吩-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.70(4H，m)，2.20-2.30(2H，m)，2.37-2.53(2H，m)，2.56(3H，s)，3.01(2H，q，J=7Hz)，5.84(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.39(2H，d，J=7Hz)，8.74(2H，d，J=7Hz)

例 109

5-[7-乙基-4-(3-甲氧基-5-異噁唑基)-2-甲吡咯并[1，2-b]噻吩-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.36(3H，t，J=7Hz)，1.57-1.84(4H，m)，2.41(2H，t，J=7Hz)，2.55(3H，s)，2.63-2.72(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.08(3H，s)，6.27(1H，s)，6.34(1H，d，J=4Hz)，6.57(1H，d，J=4Hz)

例 110

5-[7-乙基-4-(3-甲氧苯基)-2-苯基吡咯并[1，2-b]噻吩-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.06-1.33(4H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.91(2H，t，J=7Hz)，2.42-2.53(2H，m)，3.01(2H，q，J=7Hz)，3.83(3H，s)，6.03(1H，d，J=4Hz)，6.59(1H，d，J=4Hz)，6.93-7.02(3H，m)，7.36-7.54(6H，m)

MS(ESI^+)：m/z 429

例 111

5-[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-異噁唑基)吡咯并[1，2-b]

嗒 咿-3-基]戊 酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.36(3H，t，J=7Hz)，1.52-1.77(4H，m)，2.35(2H，t，J=7Hz)，2.55(6H，s)，2.56-2.67(2H，m)，3.01(2H，q，J=7Hz)，6.16(1H，d，J=4Hz)，6.23(1H，s)，6.54(1H，d，J=4Hz)

MS(ESI^+)：m/z 342，MS(ESI^-)：m/z 340

例 112

5-[7-乙 基 -2-苯 基 -4-(4-吡 啶 基)吡 咯 并 [1，2-b]嗒 咿-3-基]戊 酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.11-1.33(4H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.99(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.50(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，5.94(1H，d，J=4Hz)，6.63(1H，d，J=4Hz)，7.38-7.56(7H，m)，8.74(2H，d，J=6Hz)

例 113

5-[7-乙 基 -2-苯 基 -4-(2-吡 咿 基)吡 咯 并 [1，2-b]嗒 咿-3-基]戊 酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.10-1.33(4H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.95(2H，t，J=7Hz)，2.45-2.57(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，6.05(1H，d，J=4Hz)，6.66(1H，d，J=4Hz)，7.40-7.55(5H，m)，8.67(1H，d，J=3Hz)，8.77(1H，s)，8.85(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 401，MS(ESI^-)：m/z 399

例 114

5-[7-乙 基 -2-苯 基 -4-(3-吡 啶 基)吡 咯 并 [1，2-b]嗒 咿-3-基]戊 酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.05-1.30(4H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.95(2H，t，J=7Hz)，2.35-2.48(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.94(1H，d，J=4Hz)，6.62(1H，d，J=4Hz)，7.40-7.55(6H，m)，7.76-7.83(1H，m)，8.65-8.72(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 400，MS(ESI^-)：m/z 398

例 115

5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.42-1.64(4H，m)，2.27(2H，t，J=7Hz)，2.48-2.62(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，3.45(3H，s)，4.62(2H，s)，5.90(1H，d，J=4Hz)，6.61(1H，d，J=4Hz)，7.27(1H，m)，7.38(1H，s)，8.53(1H，d，J=5Hz)

MS(ESI^+)：m/z 402

例 116

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(3-甲氧苯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.62(4H，m)，2.19(2H，t，J=7Hz)，2.55-2.66(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.45(3H，s)，3.82(3H，s)，4.62(2H，s)，5.96(1H，d，J=4Hz)，6.56(1H，d，J=4Hz)，6.87-7.00(3H，m)，7.37(1H，t，J=8Hz)

MS(ESI^+)：m/z 397，MS(ESI^-)：m/z 395

例 117

5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-(2-噻吩基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.20-1.50(4H，m)，1.38(3H，t，J=7Hz)，2.15(2H，t，J=7Hz)，2.55-2.68(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，5.93(1H，d，J=4Hz)，6.64(1H，d，J=4Hz)，7.13(1H，t，J=5Hz)，7.28(1H，d，J=5Hz)，7.35-7.47(3H，m)，8.54(1H，d，J=5Hz)

MS(ESI^+)：m/z 440

例 118

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(6-喹啉基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.39(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.60(4H，m)，2.16(2H，m)，2.55-2.75(2H，m)，3.07(2H，q，J=7Hz)，3.47(3H，s)，4.66(2H，s)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.57(1H，d，J=4Hz)，7.45-7.53(1H，m)，7.72(1H，d，J=8Hz)，7.86(1H，s)，8.22(2H，m)，8.94(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 418，MS(ESI^-)：m/z 416

例 119

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.38(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.64(4H，m)，2.22(2H，t，J=7Hz)，2.48-2.68(2H，m)，3.06(2H，q，J=7Hz)，3.46(3H，s)，4.63(2H，s)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.58(1H，d，J=4Hz)，7.48(1H，m)，7.78(1H，m)，8.62(1H

，m)，8.69(1H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 368

例 120

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.63(4H，m)，2.23(2H，t，J=7Hz)，2.53-2.63(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，3.45(3H，s)，4.63(2H，s)，5.93(1H，d，J=4Hz)，6.58(1H，d，J=4Hz)，7.25(1H，m)，7.36(1H，s)，7.42(2H，m)

例 121

5-[7-乙基-2-甲基-4-(3-甲苯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23-1.63(4H，m)，1.37(3H，t，J=7Hz)，2.22(2H，t，J=7Hz)，2.40(3H，s)，2.40-2.49(2H，m)，2.54(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.48(1H，d，J=4Hz)，7.10-7.14(2H，m)，7.23-7.27(1H，m)，7.32-7.38(1H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 351

例 124

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.44-1.65(4H，m)，2.16-2.26(2H，m)，2.43(3H，s)，2.47-2.69(2H，m)，

3.03(2H，q，J=7Hz)，3.45(3H，s)，4.63(2H，m)，5.88(1H，d，J=4Hz)，6.57(1H，d，J=4Hz)，7.56(1H，s)，8.42(1H，s)，8.53(1H，s)

MS(ESI$^+$)：m/z 382，MS(ESI$^-$)：m/z 380

例 125

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.67(4H，m)，2.27(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.52(2H，m)，2.56(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.87(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.88(1H，m)，8.53(1H，d，J=2Hz)，8.77(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 416，418

例 126

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.65(4H，m)，2.25(2H，t，J=7Hz)，2.49-2.68(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.45(3H，s)，4.63(2H，s)，5.91(1H，d，J=4Hz)，6.62(1H，d，J=4Hz)，7.89(1H，m)，8.51(1H，s)，8.79(1H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 446，448

例 127

5-[4-(5，6-二氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒

咁-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.43-1.68(4H，m)，2.29(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.52(2H，m)，2.57(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.87(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.81(1H，d，J=2Hz)，8.31(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI^+)：m/z 406，MS(ESI^-)：m/z 404

例 128

5-[7-乙基-2-甲基-4-(5-乙烯基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咁-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.68(4H，m)，2.23(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.53(2H，m)，2.56(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.46(1H，d，J=11Hz)，5.86(1H，d，J=4Hz)，5.89(1H，d，J=17Hz)，6.52(1H，d，J=4Hz)，6.72-6.83(1H，dd，J=11 Hz，17Hz)，7.77(1H，m)，8.47(1H，d，J=2Hz)，8.68(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI^+)：m/z 364

例 129

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-乙烯基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咁-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.65(4H，m)，2.22(2H，t，J=7Hz)，2.45-2.73(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，3.46(3H，s)，4.63(2H，m)，5.44(1H，d，J=11Hz)，5.87(1H，d，J=18Hz)，5.92(1H，d，J=4Hz)，6.57(1H，d，J=4Hz)，6.72-6.83(1H，dd，J=11 Hz，18Hz)，7.78(1H，

s)，8.48(1H，s)，8.68(1H，s)

MS(ESI$^+$)：m/z 394(M+H)，MS(ESI$^-$)：m/z 392

例 130

5-[4-(5-乙醯基-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.38(3H，t，J=7Hz)，1.44-1.60(4H，m)，2.22(2H，t，J=7Hz)，2.50-2.63(2H，m)，2.69(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.46(3H，s)，4.64(2H，s)，5.86(1H，d，J=4Hz)，6.59(1H，d，J=4Hz)，8.29(1H，m)，8.79(1H，d，J=2Hz)，9.23(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 410，MS(ESI$^-$)：m/z 408

例 131

4-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.38(3H，t，J=7Hz)，1.70-1.87(2H，m)，2.26(2H，t，J=7Hz)，2.45(3H，s)，2.53-2.81(2H，m)，3.06(2H，q，J=7Hz)，3.46(3H，s)，4.66(2H，m)，5.90(1H，d，J=4Hz)，6.59(1H，d，J=4Hz)，7.61(1H，s)，8.43(1H，s)，8.46(1H，s)

MS(ESI$^+$)：m/z 368

例 132

3-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，2.30-2.60(2H，

m)，2.42(3H，s)，2.77-3.13(2H，m)，3.05(2H，q，J=7Hz)，3.47(3H，s)，4.66(2H，s)，5.91(1H，d，J=4Hz)，6.60(1H，d，J=4Hz)，7.58(1H，s)，8.42(1H，s)，8.54(1H，s)

MS(ESI$^+$)：m/z 354

例 133

4-[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.70-1.88(2H，m)，2.22-2.32(2H，m)，2.45(3H，s)，2.50-2.62(2H，m)，2.59(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.86(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.60(1H，s)，8.42(2H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 338，MS(ESI$^-$)：m/z 336

例 134

3-[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，2.42(3H，s)，2.40-2.53(2H，m)，2.59(3H，s)，2.82(2H，t，J=7Hz)，3.03(2H，q，J=7Hz)，5.86(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.57(1H，s)，8.38(1H，s)，8.52(1H，s)

MS(ESI$^+$)：m/z 324，MS(ESI$^-$)：m/z 322

例 135

3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

熔點：181-182°C

NMR(CDCl3，δ)：1.38(2H，t，J=7Hz)，2.4(2H，t，J=7Hz)，2.58(3H，s)，2.74-2.85(2H，m)，3.01(2H，q，J=7Hz)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.55(1H，d，J=4Hz)，7.87(1H，s)，8.54(1H，s)，8.77(1H，s)

MS：(m/z)388(M^+)，390(M^++2)，114(bp)

例 136

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NNMR($CDCl_3$，δ)：1.30-1.57(5H，m)，2.21(2H，t，J=8Hz)，2.47-2.57(2H，m)，3.03(2H，q，J=8Hz)，3.45(3H，s)，4.62(2H，s)，5.84(1H，d，J=5Hz)，6.57(1H，d，J=5Hz)，7.59-7.64(2H，m)，7.68(1H，br s)，7.75(1H，m)

MS(ESI^+)：392(M+H)

例 136-2

5-[4-[3-(胺羰基)苯基]-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.30-1.70(5H，與 H_2O 重覆)，2.20-2.50(4H，m)，2.80-2.93(2H，m)，3.03(2H，q，J=8Hz)，3.46(3H，s)，4.54(1H，d，J=10Hz)，4.77(1H，d，J=10Hz)，5.80(1H，d，J=5Hz)，6.55(1H，d，J=5Hz)，7.43-7.50(2H，m)，7.58(1H，t，J=8Hz)，7.77(1H，br s)，7.88(1H，br s)，7.99(1H，br d，J=8Hz)

MS(ESI^+)：410(M+H)

例 137

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.06-1.26(4H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.94(2H，t，J=7Hz)，2.40(2H，m)，2.99(2H，q，J=7Hz)，5.96(1H，d，J=5Hz)，6.63(1H，d，J=5Hz)，7.40-7.52(5H，m)，7.93(1H，s)，8.59(1H，s)，8.77(1H，s)

例 138

5-[7-乙基-4-(5-乙基-3-吡啶基)-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.05-1.42(10H，m)，1.92(2H，m)，2.41(2H，m)，2.75(2H，q，J=7Hz)，3.01(2H，q，J=7Hz)，5.93(1H，d，J=5Hz)，6.55(1H，d，J=5Hz)，7.37-7.54(5H，m)，7.62(1H，m)，8.45(1H，m)，8.52(1H，m)

例 139

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(2-噻吩基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25-1.48(7H，m)，2.12(2H，t，J=7Hz)，2.62(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，5.93(1H，d，J=5Hz)，6.64(1H，d，J=5Hz)，7.14(1H，m)，7.37(1H，d，J=5Hz)，7.43(1H，d，J=5Hz)，7.92(1H，s)8.58(1H，m)，8.79(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 484(M+H)

例 140

5-[2-[(苄氧基)甲基]-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1

，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.34-1.48(5H，m)，2.09(2H，m)，2.53(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，4.07(2H，J=7Hz)，4.65(2H，s)，4.72(2H，s)，5.90(1H，d，J=5Hz)，6.60(1H，d，J=5Hz)，7.29-7.38(5H，m)，7.86(1H，s)，8.54(1H，m)，8.77(1H，m)

例 141

5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-2-{[(4-氰苄基)氧基]甲基}-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.35-1.56(7H，m)，2.18(2H，m)，2.57(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，4.69(2H，s)，4.74(2H，s)，5.92(1H，d，J=5Hz)，6.62(1H，d，J=5Hz)，7.47(2H，d，J=8Hz)，7.64(2H，d，J=8Hz)，7.88(1H，s)，8.54(1H，m)，8.79(1H，m)

例 142

5-[2-[(苄胺基)甲基]-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.20-1.49(7H，m)，2.17(2H，m)，2.32(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，4.29(4H，s)，5.94(1H，d，J=5Hz)，6.51(1H，s，br)，6.12(1H，d，J=5Hz)，7.27-7.36(3H，m)，7.48(2H，m)，7.84(1H，m)，8.49(1H，m)，8.75(1H，m)

例 143

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-嗎啉甲基)吡咯并[1，

2-b]嗒 咿-3-基]戊 酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.20-1.38(5H，m)，1.49(4H，m)，2.24(2H，q，J=7Hz)，2.59(4H，m)，3.01(2H，q，J=7Hz)，3.70(4H，m)，5.88(1H，d，J=5Hz)，6.55(1H，d，J=5Hz)，7.90(1H，m)，8.55 81H，m)，8.78(1H，m)

例 144

5-{4-[5-(胺 羰 基)-3-吡 啶 基]-7-乙 基 -2-甲 吡 咯 并 [1，2-b]嗒 咿-3-基 }戊 酸 可 得 自 5-[4-(5-氰 基 -3-吡 啶 基)-7-乙 基 -2-甲 吡 咯 并 [1，2-b]-嗒 咿-3-基]戊 酸 乙 酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.10-1.70(4H，m)，1.37(3H，t，J=7Hz)，2.24-2.77(4H，m)，2.59(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.77(1H，d，J=4Hz)，6.52(1H，d，J=4Hz)，7.57(1H，br)，7.97(1H，br)，8.07(1H，s)，8.68(1H，s)，9.18(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 381

例 145

5-[4-[5-(胺 羰 基)-3-吡 啶 基]-7-乙 基 -2-(甲 氧 甲 基)吡 咯 并 [1，2-b]嗒 咿-3-基]戊 酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.16-1.72(4H，m)，1.37(3H，t，J=7Hz)，2.25-2.50(3H，m)，2.83-2.97(1H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，3.47(3H，s)，4.56(1H，d，J=17Hz)，4.77(1H，d，J=17Hz)，5.81(1H，d，J=4Hz)，6.58(1H，d，J=4Hz)，7.52(1H，br)，7.82(1H，br)，8.11(1H，m)，8.70(1H，d，J=2Hz)，9.18(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI^+)：m/z 411

例 146

將 4-膦酸巴豆酸三乙酯(2.13 g)溶在四氫呋喃(20 mL)，於 2℃及氮氣下滴加入雙(三甲矽烷基)醯胺鋰(1.1mol/L 溶液在己烷，15mL)，於同溫下攪拌 30 分鐘。滴加入含 4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-甲醛(1.2 g)之四氫呋喃(20 mL)。於 2℃攪拌 3 小時，倒至飽和氯化銨溶液，萃取以乙酸乙酯。將有機層清洗以水，食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥後濃縮。以矽膠柱層析純化(3%乙酸乙酯在己烷)可得標題化合物(1.06 g)之黃色結晶。

(2E，4E)-5-[4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-2，4-戊二烯酸乙酯

NMR(300 MHz，$CDCl_3$，δ)：1.28(3H，t，J=7Hz)，1.35(6H，d，J=7Hz)，3.30(1H，五線，J=7Hz)，4.19(2H，quartet，J=7Hz)，5.63(1H，d，J=16Hz)，5.94(1H，dd，J=16，11Hz)，6.16(1H，dd，J=4.4，1.5Hz)，6.76(1H，dd，J=4.4，2.6Hz)，6.78(1H，d，J=16Hz)，7.11-7.23(3H，m)，7.33-7.40(2H，m)，7.72(1H，dd，J=2.6，1.5Hz)

MS(ESI^+)：m/z 379(M+H)

下列化合物可依例 146 之方法製備。

例 147

(2E)-3-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-2-丙烯酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，1.40(6H，d，J=7Hz)，3.38(1H，m)，4.16(2H，q，J=7Hz)，5.57(1H，d，J=15Hz)

，6.25(1H，d，J=5Hz)，6.74(1H，d，J=5Hz)，7.15(1H，d，J=8.5Hz)，7.29(1H，d，J=8.5Hz)，7.33(1H，d，J=8.5Hz)，7.35(1H，d，J=8.5Hz)，7.63(1H，d，J=15Hz)

MS(ESI⁻)：m/z 385(M-H)

例 148

(2E)-3-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-2-丙烯腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.41(6H，d，J=7Hz)，3.28(1H，m)，4.99(1H，d，J=15Hz)，6.24(1H，d，J=5Hz)，6.76(1H，d，J=15Hz)，7.17-7.27(2H，m)，7.30-7.40(3H，m)

MS(ESI⁻)：m/z 340(M+H)

例 149

將(2E，4E)-5-[4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-2，4-戊二烯酸乙酯(300 mg)溶在四氫呋喃(3 mL)及乙酸(1mL腈，滴加入N-氯丁二醯亞胺(106 mg)。於室温下攪拌24小時。濃縮，分層於飽和碳酸氫鈉溶液及乙酸乙酯。將有機層清洗以食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥，濃縮。以矽膠柱層析純化(1%乙酸乙酯在己烷)可得標題化合物(110mg)之油。

(2E，4E)-5-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-2，4-戊二烯酸乙酯

NMR(300 MHz，$CDCl_3$，δ)：1.28(3H，t，J=7Hz)，1.40(6H，d，J=7Hz)，3.33(1H，五線，J=7Hz)，4.19(2H，quartet，J=7Hz)，5.64(1H，d，J=16Hz)，5.94(1H，dd，J=16，11Hz)

，6.18(1H，d，J=4.4Hz)，6.71(1H，d，J=4.4Hz)，6.79(1H，d，J=16Hz)，7.13-7.23(3H，m)，7.32-7.37(2H，m)

下列化合物可依例 149 之方法製備。

例 151

7-氯-4-(2-氯苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

NMR(300 MHz，$CDCl_3$，δ)：0.89(3H，t，J=7.5Hz)，1.41(6H，d，J=7.5Hz)，3.41-3.56(1H，m)，4.00(2H，q，J=7.5Hz)，6.16(1H，d，J=5Hz)，6.76(1H，d，J=5Hz)，7.25-7.53(4H，m)

MS(ES+)：m/e 377.44

例 152

7-氯-2-異丙基-4-(2-萘基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

NMR(300 MHz，$CDCl_3$，δ)：0.78(3H，t，J=7.5Hz)，1.43(6H，d，J=7.5Hz)，3.29-3.41(1H，m)，3.95(2H，q，J=7.5Hz)，6.40(1H，d，J=5Hz)，6.79(1H，d，J=5Hz)，7.50-7.60(3H，m)，7.81-8.00(4H，m)

例 153

將(2E，4E)-5-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-2，4-戊二烯酸乙酯(82 mg)溶在乙醇(2 mL)，加入 1N NaOH 溶液(0.5 mL)，於室溫下攪拌 12 小時。真空濃縮，溶在水，酸化以 1N HCl，萃取以乙酸乙酯。將有機層清洗以水，食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥後濃縮。以矽膠柱

層析純化(50%乙酸乙酯在己烷)可得標題化合物(14mg)之棕色非晶形固體，可結晶自乙醇.

(2E，4E)-5-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-2，4-戊二烯酸

NMR(300 MHz，$CDCl_3$，δ)：1.40(6H，d，J=7Hz)，1.30-1.90(1H，br)，3.34(1H，五線，J=7Hz)，5.64(1H，d，J=16Hz)，5.98(1H，dd，J=16，11Hz)，6.19(1H，d，J=4.4Hz)，6.72(1H，d，J=4.4Hz)，6.84(1H，d，J=16Hz)，7.14-7.37(5H，m)

MS(ESI^-)：m/z 383(M-H)

例 154

將 5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-(2-噻吩基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(130 mg)溶在甲苯(5 mL)，加入 28%甲基鈉甲醇溶液(536 mg)，加熱回流 2 小時。以 1N HCl 酸化至 pH 4，萃取以氯仿。分離有機層，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣溶在乙醇(5 mL)，加入 1N NaOH 溶液(1 mL)，於 60℃下加熱 1 小時。以 1N HCl 酸化至 pH 4，萃取以氯仿。分離有機層，清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=1:1)可得 5-[7-乙基-4-(2-甲氧基-4-吡啶基)-2-(2-噻吩基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸之黃色粉(50.0 mg)。

5-[7-乙基-4-(2-甲氧基-4-吡啶基)-2-(2-噻吩基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.30-1.48(4H，m)，1.38(3H，t，J=7Hz)

，2.13(2H，t，J=7Hz)，2.58-2.69(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.02(3H，s)，5.96(1H，d，J=4Hz)，6.61(1H，d，J=4Hz)，6.78(1H，s)，6.90(1H，d，J=5Hz)，7.12(1H，m)，7.34(1H，m)，7.42(1H，d，J=5Hz)，8.29(1H，d，J=5Hz)

下列化合物可依例 154 之方法製備。

例 155

5-[7-乙基-4-(2-甲氧基-4-吡啶基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.31-1.64(7H，m)，2.25(2H，t，J=8Hz)，2.43(2H，br t，J=8Hz)，2.54(3H，s)，3.00(2H，q，J=8Hz)，4.04(3H，s)，5.60(1H，br s)，5.90(1H，d，J=5Hz)，6.51(1H，d，J=5Hz)，6.81(1H，br s)，6.93(1H，br d，J=7Hz)，8.30(1H，d，J=7Hz)

MS(ESI^+)：m/z 368(M+H)

例 155-2

5-[7-乙基-2-甲基-4-(2-氧-1，2-二氫-4-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.29-1.67(7H，m)，2.29(2H，t，J=8Hz)，2.35-2.60(5H，m)，3.00(2H，q，J=8Hz)，5.94(1H，d，J=5Hz)，6.54(1H，d，J=5Hz)，6.64(1H，br d，J=7Hz)，6.84(1H，br s)，7.70(1H，br d，J=7Hz)

MS(ESI^+)：m/z 354(M+H)

下列化合物可依例 154 之方法製備。

例 156

5-[7-乙基-4-(2-甲氧基-4-吡啶基)-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.08-1.30(4H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.95(2H，t，J=7Hz)，2.48-2.53(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，4.01(3H，s)，6.02(1H，d，J=4Hz)，6.63(1H，d，J=4Hz)，6.82(1H，s)，6.94(1H，d，J=5Hz)，7.42-7.54(5H，m)，8.29(1H，d，J=5Hz)

MS(ESI^+)：m/z 430

例 157

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(2-甲氧基-4-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.64(4H，m)，2.24(2H，t，J=7Hz)，2.53-2.64(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.45(3H，s)，4.01(3H，s)，4.61(2H，s)，5.94(1H，d，J=4Hz)，6.58(1H，d，J=4Hz)，6.77(1H，s)，6.89(1H，d，J=5Hz)，8.28(1H，d，J=5Hz)

MS(ESI^+)：m/z 398，MS(ESI^-)：m/z 396

例 158

將 5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(120 mg)溶在甲苯(5 mL)及四氫呋喃(10 mL)，加入硫甲氧化鈉(91.0 mg)，加熱回流 4 小時。酸化以 1N HCl，萃取以氯仿。分離有機層，清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=10:1-3:1)可得 5-{7-乙基-4-[2-(甲硫基)-4-吡啶基]-2-苯

基吡咯并-[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸之黃色粉(85.0 mg)。

5-{7-乙基-4-[2-(甲硫基)-4-吡啶基]-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.07-1.17(2H，m)，1.17-1.30(2H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.97(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.48(2H，m)，2.61(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.98(1H，d，J=4Hz)，6.63(1H，d，J=4Hz)，7.03(1H，dd，J=1 Hz，5Hz)，7.25(1H，m)，7.43-7.55(5H，m)，8.57(1H，d，J=5Hz)

MS(ESI^+)：m/z 446(M+H)

例 159

將 3-[(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄腈(3.00 g)，6-苯并已酸乙酯(5.07 g)，及三氟甲磺酸(376 mg)溶在甲苯(60 mL)，以 Dean-Stark 器回流 1 小時 20 分鐘。分層於乙酸乙酯(60 mL)及水(60 mL)，將有機層清洗以飽和重碳酸鈉溶液(60 mL)及食鹽水(60 mL)，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得暗色油。以驟矽膠柱層析純化，溶離以丙酮= 1-100 至 7-100 可得 5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并-[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯之桔色油(4.45 g，78.6%)。

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.01-1.27(7H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.86(2H，t，J=7Hz)，2.40(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.02(2H，q，J=7Hz)，5.90(1H，d，J=5Hz)，6.61(1H，d，J=5Hz)，7.44-7.53(5H，s)，7.60-7.69(2H，m)，7.74-7.79(2H

，m)

下列化合物可仿例159之方法製備。

例160

5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-(2-噻吩基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.21(3H，t，J=7Hz)，1.38(3H，t，J=7Hz)，1.25-1.48(4H，m)，2.07(2H，t，J=7Hz)，2.57-2.68(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，5.93(1H，d，J=4Hz)，6.64(1H，d，J=4Hz)，7.12(1H，m)，7.28(1H，dd，J=1 Hz，5Hz)，7.37(1H，m)，7.41(1H，s)，7.45(1H，d，J=5Hz)，8.55(1H，d，J=5Hz)

MS：(m/z)468(M+H)

例161

5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.05-1.17(2H，m)，1.19-1.30(2H，m)，1.28(3H，t，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.91(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.48(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，5.96(1H，d，J=4Hz)，6.64(1H，d，J=4Hz)，7.31(1H，dd，J=2 Hz，5Hz)，7.41-7.54(6H，m)，8.56(1H，d，J=5Hz)

MS(ESI^+)：m/z 462(M+H)

例162

[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙

酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.08(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.36(2H，s)，3.93(2H，q，J=7Hz)，6.09(1H，d，J=5Hz)，6.66(1H，d，J=5Hz)，7.33(1H，m)，7.41-7.50(8H，m)

MS(ESI^+)：m/z 419(M+H)

例 163

4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯 NMR($CDCl_3$，δ)：1.06(3H，t，J=7Hz)，1.41(3H，t，J=7Hz)，3.08(2H，q，J=7Hz)，4.09(2H，q，J=7Hz)，6.34(1H，d，J=5Hz)，6.53(1H，m)，6.74(1H，d，J=5Hz)，6.97(1H，m)，7.39-7.46(3H，m)，752(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 395(M+H)

例 164

4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(2-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.94(3H，m)，1.41(3H，m)，3.08(2H，q，J=7Hz)，3.11(2H，m)，4.00(2H，m)，6.36(1H，m)，6.76(1H，m)，7.26-7.55(4H，m)，7.84(1H，m)，8.15(1H，m)，8.57(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 406(M+H)

例 165

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(1，3-噻唑-2-基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.21(3H，t，J=7Hz)，1.33-1.50(7H，m)，2.14(2H，t，J=7Hz)，2.46(2H，m)，2.97(2H，q，J=7Hz)，3.06(2H，q，J=7Hz)，4.05(2H，q，J=7Hz)，5.88(1H，d，J=5Hz)，6.67(1H，d，J=5Hz)，7.43(1H，d，J=3Hz)，7.64-7.67(2H，m)，7.70(1H，m)，7.78(1H，m)，7.93(1H，d，J=3Hz)

例 166

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(1-甲基-1H-吡咯-2-基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸甲酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.04(2H，m)，1.21-1.41(5H，m)，1.99(2H，t，J=7Hz)，2.46(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.60(3H，s)，3.68(3H，s)，5.89(1H，d，J=5Hz)，6.23(1H，m)，6.35(1H，m)，6.62(1H，d，J=5Hz)，6.76(1H，m)，7.62-7.79(4H，m)

例 167

3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.08(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，2.02(2H，m)，2.80(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.89(2H，q，J=7Hz)，6.01(1H，d，J=5Hz)，6.63(1H，d，J=5Hz)，7.31(1H，m)，7.41-7.54(8H，m)

例 168

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(1，3-噁唑-5-基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.17-1.49(10H，m)，2.08(2H，t，J=7Hz)，2.57(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，4.06(2H，q，J=7Hz)，5.91(1H，d，J=5Hz)，6.66(1H，d J=5Hz)，7.55(1H，s)，7.62-7.68(3H，m)，7.78(1H，m)，8.04(1H，s)

例 169

5-[7-乙基-4-(3-甲氧苯基)-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.05-1.29(4H，m)，1.18(3H，t，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.86(2H，t，J=7Hz)，2.42-2.52(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.84(3H，s)，4.02(2H，q，J=7Hz)，6.02(1H，d，J=4Hz)，6.60(1H，d，J=4Hz)，6.95-7.02(3H，m)，7.36-7.56(6H，m)

例 170

5-[7-乙基-2-苯基-4-(4-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.04-1.29(4H，m)，1.19(3H，t，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.88(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.48(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.04(2H，q，J=7Hz)，5.95(1H，d，J=4Hz)，6.62(1H，d，J=4Hz)，7.36(2H，m)，7.42-7.54(5H，m)，8.76(2H，m)

例 171

5-[7-乙基-2-苯基-4-(2-吡咿基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.10-1.32(4H，m)，1.18(3H，t，J=7Hz)

，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.90(2H，t，J=7Hz)，2.45-2.55(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.02(2H，q，J=7Hz)，6.05(1H，d，J=4Hz)，6.66(1H，d，J=4Hz)，7.43-7.56(5H，m)，8.66(1H，m)，8.77(1H，m)，8.86(1H，m)

例 172

5-[7-乙基-2-苯基-4-(3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.04-1.30(4H，m)，1.18(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.87(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.50(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.01(2H，q，J=7Hz)，5.96(1H，d，J=4Hz)，6.63(1H，d，J=4Hz)，7.42-7.55(6H，m)，7.77(1H，m)，8.66-8.73(2H，m)

例 173

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.12-1.28(7H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.89(2H，t，J=7Hz)，2.43(2H，m)，3.01(2H，m)，4.02(2H，q，J=7Hz)，5.97(1H，d，J=5Hz)，6.65(1H，d，J=5Hz)，7.43-7.55(5H，m)，7.93(1H，m)，8.61(1H，m)，8.79(1H，m)

例 174

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(2-噻吩基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.16-1.46(10H，m)，1.57(2H，t，J=7Hz)

，2.62(2H，m)，2.30(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，4.05(2H，q，J=7Hz)，5.93(1H，d，J=5Hz)，6.63(1H，d，J=5Hz)，7.36(1H，m)，7.44(1H，m)，7.91(1H，m)

例 175

將 5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(1.00 g)溶在二甲亞碸(20 mL)，於 1.5 小時期間加入 1N NaOH(5.31 mL)。中止反應以於冰浴冷卻下加入 1N HCl(6 mL)。分層於乙酸乙酯(50 mL)及水(50 mL)。將有機層清洗以水(50 x 2 mL)及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1/3 ～ 1/1 可得 5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸之黃色固體(668 mg)。

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.03-1.25(4H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.93(2H，t，J=7Hz)，2.39(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.91(1H，d，J=5Hz)，6.63(1H，d，J=5Hz)，7.26-7.53(5H，s)，7.56-7.69(2H，m)，7.72-7.79(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 424(M+H)

下列化合物可依例 175 之方法製備。

例 176

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(1，3-噻唑-2-基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.20-1.52(7H，m)，2.19(2H，m)，2.98(2H

，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，4.05(2H，q，J=7Hz)，5.38(1H，d，J=5Hz)，6.67(1H，d，J=5Hz)，7.43(1H，d，J=3Hz)，7.60-7.64(2H，m)，7.67(1H，m)，7.76(1H，m)，7.92(1H，d，J=3Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 431(M+H)

例 177

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-(1-甲基-1H-吡咯-2-基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.12(2H，m)，1.23-1.41(5H，m)，2.04(2H，t，J=7Hz)，2.48(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.68(3H，s)，5.90(1H，d，J=5Hz)，6.22(1H，m)，6.35(1H，m)，6.62(1H，d，J=5Hz)，6.75(1H，m)，7.57-7.789(4H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 427(M+H)

例 178

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-(1，3-噁唑-5-基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.31-1.49(7H，m)，2.17(2H，t，J=7Hz)，2.57(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，5.42(1H，d，J=5Hz)，6.67(1H，d，J=5Hz)，7.56(1H，s)，7.64(2H，m)，7.67(1H，s)，7.78(1H，m)，8.07(1H，s)

例 179

5-[4-(3-氰苯基)-2-(3，5-二甲基-4-異噁唑基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.04-1.30(7H，m)，1.97(2H，t，J=7Hz)

，2.26-2.35(5H，m)，2.41(3H，s)，3.00(2H，q，J=7Hz)，4.06(2H，q，J=7Hz)，5.97(1H，d，J=5Hz)，6.68(1H，d，J=5Hz)，7.61-7.68(2H，m)，7.73(1H，s)，7.79(1H，m)

例 180

將含 3-[(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄腈(120 mg)，2-[(3，5-二甲基-4-異噁唑基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯(203 mg)，及甲苯磺酸單水合物(3.76 mg)之甲苯(1 mL)回流 1 小時。加入對甲苯磺酸單水合物(14.5 mg)，回流 1 小時。加入三氟甲磺酸(3.76 mg)，攪拌 0.5 小時。分層於乙酸乙酯(20 mL)及飽和重碳酸鈉溶液(10 mL)。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1/40～2/5 可得 5-[4-(3-氰苯基)-2-(3，5-二甲基-4-異噁唑基)-7-乙吡咯-[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯之黃色膠(75.7 mg，19.1%)。

5-[4-(3-氰苯基)-2-(3，5-二甲基-4-異噁唑基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.04-1.30(7H，m)，1.97(2H，t，J=7Hz)，2.26-2.35(5H，m)，2.41(3H，s)，3.00(2H，q，J=7Hz)，4.06(2H，q，J=7Hz)，5.97(1H，d，J=5Hz)，6.68(1H，d，J=5Hz)，7.61-7.68(2H，m)，7.73(1H，s)，7.79(1H，m)

例 181

將 N-[2-(3-氰苄醯基)-5-乙基-1H-吡咯-1-基]-2-(甲磺醯基)乙醯胺(2.70 g)溶在四氫呋喃(30 mL)，於冰浴冷卻下加入 NaH(601 mg，60%油中)。攪拌 40 分鐘，中止反應以加入 1N

HCl(15 mL)。萃取以乙酸乙酯(50 mL)，將萃取物清洗以水(50 x 2 mL)及食鹽水(50 mL)，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得棕黃色固體(3.36 g)。將固體碾製以二異丙醚(20 mL)可得 3-[7-乙基-3-(甲磺醯基)-2-氧-1，2-二氫吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈之黃色粉(2.31 g，90.1%)。

3-[7-乙基-3-(甲磺醯基)-2-氧-1，2-二氫吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，2.46-3.07(5H，m)，6.81(1H，d，J=5Hz)，6.70(1H，d，J=5Hz)，7.60-7.69(3H，m)，7.83(1H，d，J=9Hz)

下列化合物可仿例 181 之方法製備。

例 182

4-(4-氰苯基)-7-乙基-2-氧-1，2-二氫吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.78(3H，t，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.02(2H，q，J=7Hz)，6.15(1H，d，J=5Hz)，6.64(1H，d，J=5Hz)，7.42(2H，d，J=9Hz)，7.77(2H，d，J=9Hz)，11.74(1H，s，br)

MS(ESI^+)：m/z 336(M+H)

例 183

將 3-[7-乙基-3-(甲磺醯基)-2-氧-1，2-二氫吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈(1.30 g)及三乙胺(578 mg)溶在二氯甲烷(18 mL)，於冰浴冷卻下及 30 分鐘(3～7℃)加入三氟甲磺酐(1.61 g)。攪拌 0.5 小時，中止反應以加入水(100 mL)。分層於乙

酸乙酯(200 mL)其含氯仿(200 mL)及 1N HCl(50 mL)。濾集不溶黃色固體(0.542 g)。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得暗黃色固體(1.27 g)。結合固體，碾製以二異丙醚(30 mL)可得三氟甲磺酸 4-(3-氰苯基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-2-酯之棕黃色粉(1.67 g，92.6%)。

三氟甲磺酸 4-(3-氰苯基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-2-酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.39(3H，t，J=7Hz)，3.02(2H，q，J=7Hz，)，3.22(3H，s)，6.40(1H，d，J=5Hz)，6.93(1H，d，J=5Hz)，7.63(3H，m)，7.82(1H，m)

例 184

將三氟甲磺酸 4-(3-氰苯基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-2-酯(150 mg)及吡咯啶(45.6 mg)溶在四氫呋喃(1 mL)，回流 1.5 小時。分層於乙酸乙酯(20 mL)及 1N HCl(10 mL)。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得暗色固體。以膠矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-4～1-2 可得 3-[7-乙基-3-(甲磺醯基)-2-(1-吡咯啶基)-吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈之黃色油，靜置可析出結晶(112 mg，89.6%)。

3-[7-乙基-3-(甲磺醯基)-2-(1-吡咯啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.38(3H，t，J=7Hz)，1.99(4H，m)，3.99(2H，q，J=7Hz)，3.22(3H，s)，3.42-3.70(4H，m)，6.28(1H，d

，J=5Hz)，6.68(1H，d，J=5Hz)，7.57(1H，t，J=9Hz)，7.69-7.78(3H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 395(M+H)

下列化合物可依例 184 之方法製備。

例 185

3-[2-(二甲胺基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒哄-4-基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.39(3H，t，J=7Hz)，2.97(6H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.26(3H，s)，6.28(1H，d，J=5Hz)，6.69(1H，d，J=5Hz)，7.57(1H，t，J=9Hz)，7.66-7.79(3H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 369(M+H)

例 186

3-[7-乙基-2-[(2-甲氧乙基)胺基]-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒哄-4-基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.35(3H，t，J=7Hz)，2.96(2H，q，J=7Hz)，3.07(3H，s)，3.43(3H，s)，3.61-3.73(4H，m)，5.96(1H，d，J=5Hz)，6.51(1H，d，J=5Hz)，6.75(1H，m，br)，7.51-7.60(3H，m)，7.74(1H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 399(M+H)

例 187

將 2-(4-氟苄醯基)-3-氧-4-苯丁酸乙酯(1.4 g)，1H-吡咯-1-胺(350 mg)，及對甲苯磺酸單水合物(41 mg)溶在乙醇(10 ml)，回流 5 小時。分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析

純化(乙酸乙酯：己烷=1:4)可得 2-苄基-4-(4-氟苯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯(828 mg)之油。

2-苄基-4-(4-氟苯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.70(3H，t，J=7Hz)，3.71(2H，q，J=7Hz)，4.29(2H，s)，6.37(1H，dd，J=1，4Hz)，6.85(1H，dd，J=2，4Hz)，7.10-7.30(7H，m)，7.38-7.46(2H，m)，7.83(1H，dd，1，2Hz)

例 188

將 2-苄基-4-(4-氟苯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯(730 mg)溶在四氫呋喃(10 ml)，加入 N-氯丁二醯亞胺(260 mg)，於 20℃下攪拌 2 小時。分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以硫代硫酸鈉溶液，水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(甲苯及乙酸乙酯=10:1)可得 2-苄基-7-氯-4-(4-氟苯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯(285 mg)之黃色油。

2-苄基-7-氯-4-(4-氟苯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.69(3H，t，J=7Hz)，3.70(2H，q，J=7Hz)，4.37(2H，s)，6.39(1H，d，J=4Hz)，6.82(1H，d，J=4Hz)，7.10-7.30(7H，m)，7.35-7.45(2H，m)

例 189

將 3-(4-氟苄醯基)-4-氧戊酸乙酯(800 mg)，1H-吡咯-1-胺(265 mg)，及對甲苯磺酸單水合物(31 mg)溶在乙醇(5 ml)，回流 5 小時。分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以食

鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(乙酸乙酯：己烷=1:4)可得[4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙酸乙酯(1.09 g)之油。

[4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，2.45(3H，s)，3.45(2H，s)，4.16(2H，q，J=7Hz)，6.03(1H，dd，J=1，4Hz)，6.72(1H，dd，J=2，4Hz)，7.17(2H，dt，J=2，7Hz)，7.40(2H，ddd，J=2，5，7Hz)，7.68(1H，dd，J=1，2Hz)

例 190

將[4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙酸乙酯(100 mg)溶在四氫呋喃(2 ml)，加入 N-氯丁二醯亞胺(43 mg)，於 20℃下攪拌 2 小時。分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以乙酸乙酯，水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(甲苯及乙酸乙酯=10:1)可得[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙酸乙酯(34 mg)之黃色油。

[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，2.54(3H，s)，3.47(2H，s)，4.16(2H，q，J=7Hz)，6.05(1H，d，J=4Hz)，6.68(1H，d，J=4Hz)，7.18(2H，dt，J=2，7Hz)，7.38(2H，ddd，J=2，5，7Hz)

例 191

將[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙酸

乙酯(300 mg)溶在四氫呋喃(4 ml)，加入 1N NaOH(1.7 ml)，再加入甲醇(2 ml)。靜置於 20℃過夜，分層於 1N HCl 及乙酸乙酯。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。碾製以乙醚可得[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]乙酸(250 mg)之黃色粉。

[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]乙酸

NMR($CDCl_3$，δ)：2.57(3H，s)，3.54(2H，s)，6.06(1H，d，J=4Hz)，6.69(1H，d，J=4Hz)，7.19(2H，t，J=7Hz)，7.38(2H，dd，J=5，7Hz)

例 192

將[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]乙酸(220 mg)溶在四氫呋喃(10 ml)，加入 1，1'-羰基二咪唑(18 mg)，於 20℃下攪拌 1 小時，加入雙(3-乙氧基-3-氧-丙酸)鎂(109 mg)。於 20℃下攪拌過夜，加入雙(3-乙氧基-3-氧-丙酸)鎂(109 mg)。攪拌 3 小時，分層於 1N HCl 及乙酸乙酯。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(乙酸乙酯：己烷=1:5)可得產物(237 mg)之油，碾製以乙酸乙酯，清洗以異丙醚可得 4-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]-3-氧丁酸乙酯(212 mg)之黃色粉。

4-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]-3-氧丁酸乙酯

熔點：116-118℃

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=7Hz)，2.46(3H，s)，3.40(2H

，s)，3.75(2H，s)，4.16(2H，q，J=7Hz)，6.04(1H，d，J=4Hz)，6.68(1H，d，J=4Hz)，7.20(2H，t，J=7Hz)，7.28(2H，dd，J=5，7Hz)

例 193

將 4-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-3-氧-丁酸乙酯(160 mg)溶在甲醇(5 ml)，於 0℃下加入硼氫化鈉(23.4 mg)，於同温下攪拌 1 小時。分層於 1N HCl 及乙酸乙酯。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以製備性薄層層析純化，溶離以乙酸乙酯及己烷(1:3)，碾製以乙酸乙酯可得 4-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-3-羥基丁酸乙酯(95 mg)之黃色粉。

4-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-3-羥基丁酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，2.18-2.38(2H，m)，2.67(3H，s)，2.70-2.85(2H，m)，4.03(1H，m)，4.09(2H，q，J=7Hz)，5.96(1H，d，J=4Hz)，6.65(1H，d，J=4Hz)，7.19(2H，t，J=7Hz)，7.30-7.45(2H，m)

例 194

將 4-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-3-羥基丁酸乙酯(52 mg)溶在四氫呋喃(1 ml)，加入 1N NaOH(0.27 ml)，再加入甲醇(1 ml)。靜置於 20℃過夜，分層於 1N HCl 及乙酸乙酯。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 4-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-

甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-3-羥基丁酸(45 mg)之黃色油。

4-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-3-羥基丁酸

NMR($CDCl_3$，δ)：2.125-2.45(2H，m)，2.66(3H，s)，2.70-2.88(2H，m)，4.02(1H，m)，5.97(1H，d，J=4Hz)，6.65(1H，d，J=4Hz)，7.20(2H，t，J=7Hz)，7.30-7.45(2H，m)

例 195

將 7-(4-氟苄醯基)-8-氧壬酸乙酯(300 mg)，(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)(4-氟苯基)甲酮(216 mg)，及對甲苯磺酸單水合物(35.4 mg)溶在乙醇(6 ml)，回流 5 小時。分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(乙酸乙酯：己烷=1:4)可得6-[7-乙基-2，4-雙(4-氟苯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]己酸乙酯(83 mg)及 6-[7-乙基-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]己酸乙酯(40 mg)之油。

6-[7-乙基-2，4-雙(4-氟苯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]己酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.85-1.00(2H，m)，1.00-1.10(2H，m)，1.16-1.30(2H，m)，1.21(3H，t，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，2.00(2H，t，J=7Hz)，2.40(2H，t，J=7Hz)，3.01(2H，q，J=7Hz)，4.06(2H，q，J=7Hz)，5.97(1H，d，J=4Hz)，6.61(1H，d，J=4Hz)，7.12-7.24(4H，m)，7.38(2H，dd，J=5，9Hz)，7.50(2H，dd，J=5，9Hz)

6-[7-乙基-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]己

酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.15-1.30(2H，m)，1.23(3H，t，J=7Hz)，1.35-1.45(2H，m)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.55(2H，m)，2.18(2H，t，J=7Hz)，2.40(2H，t，J=7Hz)，2.54(3H，s)，3.01(2H，q，J=7Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，5.85(1H，d，J=4Hz)，6.49(1H，d，J=4Hz)，7.16(2H，t，J=9Hz)，7.32(2H，dd，J=5，9Hz)

例 196

將(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)(4-氟苯基)甲酮(500 mg)，8-乙醯基-9-氧癸酸乙酯(678 mg)，及對甲苯磺酸單水合物(82 mg)溶在乙醇(5 ml)，回流 2 小時。分層於乙酸乙酯及 1N HCl。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(甲苯)可得 6-[7-乙基-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-eb]嗒咿-3-基]己酸乙酯(130 mg)油及[5-乙基-1-({(1E)-1-[7-乙基-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]亞乙基}胺基)-1H-吡咯-2-基](4-氟苯基)-甲酮(70 mg)黃色結晶.

[5-乙基-1-({(1E)-1-[7-乙基-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]亞乙基}胺基)-1H-吡咯-2-基](4-氟苯基)甲酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.13(3H，t，J=7Hz)，1.39(3H，t，J=7Hz)，1.80-2.00(2H，m)，1.91(3H，s)，2.86(3H，s)，3.06(2H，q，J=7Hz)，5.97(1H，d，J=4Hz)，6.11(1H，d，J=4Hz)，6.62(2H，t，J=4Hz)，7.11(4H，t，J=9Hz)，7.48(2H，dd

，J=5，9Hz)，7.82(2H，dd，J=5，9Hz)

6-[7-乙基-4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]己酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.15-1.30(2H，m)，1.23(3H，t，J=7Hz)，1.35-1.45(2H，m)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.55(2H，m)，2.18(2H，t，J=7Hz)，2.40(2H，t，J=7Hz)，2.54(3H，s)，3.01(2H，q，J=7Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，5.85(1H，d，J=4Hz)，6.49(1H，d，J=4Hz)，7.16(2H，t，J=9Hz)，7.32(2H，dd，J=5，9Hz)

例 197

將 7-(4-氰苄醯基)-8-氧壬酸乙酯(2.2 g)，2-乙基-1H-吡咯-1-胺(809 mg)，及對甲苯磺酸單水合物(64 mg)溶在甲苯(40 ml)，回流 20 分鐘。分層於乙酸乙酯及 1N HCl。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(乙酸乙酯：己烷=1:5)可得產物，碾製以己烷可得 6-[4-(4-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯-[1，2-b]嗒咿-3-基]己酸乙酯(2.21 g)之黃色結晶。

6-[4-(4-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]己酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.15-1.25(2H，m)，1.25(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.45(2H，m)，1.38(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.65(2H，m)，2.19(2H，t，J=7Hz)，2.38(2H，t，J=7Hz)，2.56(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，5.80(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.48(2H，t，J=9Hz)，7.78(2H

，d，J=9Hz)

例 198

將 6-[4-(4-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]己酸乙酯(1.5 g)溶在四氫呋喃(15 ml)，加入 2N 氫氧化鉀(7.4 ml)，再加入甲醇(7.4 ml)。於 50℃下攪拌 2 小時，再於 60℃下攪拌 3 小時，分層於 1N HCl 及乙酸乙酯。濾集沈澱，清洗以乙酸乙酯。結合有機層及洗液，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。碾製以乙酸乙酯，濾集沈澱。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=1:1)，碾製以異丙醚可得 6-[4-(4-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]己酸(650 mg)之黃色結晶。結合沈澱，結晶自乙酸乙酯可得 6-{4-[4-(胺羰基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}己酸(550 mg，37.6%)之黃色結晶。

6-[4-(4-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]己酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.15-1.30(2H，m)，1.35-1.45(2H，m)，1.38(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.60(2H，m)，2.26(2H，t，J=7Hz)，2.38(2H，t，J=7Hz)，2.56(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.80(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.48(2H，t，J=9Hz)，7.79(2H，d，J=9Hz)

6-{4-[4-(胺羰基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}己酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.1-1.20(2H，m)，1.29(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.45(4H，m)，2.10(2H，t，J=7Hz)，2.37(2H，t，J=7Hz)

，2.51(3H，s)，2.92(2H，q，J=7Hz)，5.73(1H，d，J=4Hz)，6.51(1H，d，J=4Hz)，7.45(2H，t，J=9Hz)，7.47(1H，s)，7.80(2H，d，J=9Hz)，8.09(1H，s)

例 199

將 3-[(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄腈(200 mg)溶在甲苯(6 mL)，於室溫下加入 2，4-戊二酮(837 mg)及對甲苯磺酸單水合物(32 mg)。回流 1 小時。將殘渣以驟矽膠柱層析純化(矽膠，80 mL)，溶離以己烷-乙酸乙酯= 10-1 可得 3-(3-乙醯基-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基)苄腈(63 mg，24.8%)之黃色固體。

3-(3-乙醯基-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基)苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.39(3H，t，J=8Hz)，1.95(3H，s)，2.50(3H，s)，3.04(2H，q，J=8Hz)，6.27(1H，d，J=5Hz)，6.69(1H，d，J=5Hz)，7.59-7.72(2H，m)，7.76-7.84(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 304(M+H)

例 200

將(2E)-3-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-2-丙烯酸乙酯(50 mg)溶在甲苯，於乾冰-丙酮浴下滴加入 1.5M 二異丁鋁氫化物(0.277 mL)之甲苯(24 mL)。攪拌 2 小時(-10°C)。中止反應以加入鈉，鉀-酒石酸，濾經矽藻土。分離有機層，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以驟矽膠柱層析純化(矽膠，40 mL)，溶離以己烷-乙酸乙酯= 10-1，5-1，及 3-1 可得(2E)-3-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-2-丙烯-1-醇之黃色固體(30 mg)

。

(2E)-3-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-2-丙烯-1-醇

NMR($CDCl_3$，δ)：1.38(6H，d，J=7Hz)，3.31(1H，m)，4.05-4.11(2H，m)，5.48(1H，dt，J=15，6Hz)，6.11(1H，d，J=5Hz)，6.45(1H，d，J=15Hz)，6.68(1H，d，J=5Hz)，7.08-7.18(2H，m)，7.29-7.40(2H，m)

MS(ESI^-)：m/z 345(M+H)

下列化合物可依例200之方法製備。

例 201

[4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]甲醇

NMR($CDCl_3$，δ)：1.45(1H，t，J=5Hz)，2.65(3H，s)，4.47(2H，d，J=5Hz)，6.13(1H，m)，6.73(1H，m)，7.14-7.28(2H，m)，7.43-7.51(2H，m)，7.70(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 257(M+H)

例 202

[7-乙基-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]甲醇

NMR($CDCl_3$，δ)：1.31-1.46(10小時，m)，3.04(2H，q，J=8Hz)，3.46(1H，m)，4.49(2H，d，J=5Hz)，6.05(1H，d，J=5Hz)，6.56(1H，d，J=5Hz)，7.12-7.22(2H，m)，7.41-7.50(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 313(M+H)

例 203

2-{[7-乙基-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]甲氧基}乙醇

NMR($CDCl_3$，δ)：1.30-1.45(9小時，m)，3.04(2H，q，J=8Hz)，3.35(1H，m)，3.46(2H，t，J=6Hz)，3.69(2H，br t，J=8Hz)，4.30(2H，s)，6.07(1H，d，J=5Hz)，6.55(1H，d，J=5Hz)，7.11-7.22(2H，m)，7.41-7.51(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 357(M+H)

例 204

將(2E)-3-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-2-丙烯-1-醇(30 mg)溶在N，N-二甲基甲醯胺(1 mL)，於冰水浴及氮氣下加入60%NaH之油(3.8 mg)。20分鐘後，加入甲碘(18.5 mg)。15分鐘後，於室溫下攪拌5小時。分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以水3次及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以p-TLC純化(己烷-乙酸乙酯=10-1)可得7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙基-3-[(1E)-3-甲氧基-1-丙烯基]吡咯并[1，2-b]嗒咿之棕色油(3.5 mg，10.2 %).

7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙基-3-[(1E)-3-甲氧基-1-丙烯基]吡咯并[1，2-b]嗒咿

NMR($CDCl_3$，δ)：1.38(3H，t，J=7Hz)，3.31(1H，m)，4.05-4.11(2H，m)，5.48(1H，dt，J=15，6Hz)，6.11(1H，d，J=5Hz)，6.45(1H，d，J=15Hz)，6.68(1H，d，J=5Hz)，7.08-7.18(2H，m)，7.29-7.40(2H，m)

MS(ESI^-)：m/z 345(M+H)

例 205

在二甲亞碸(0.5 mL)中加入 60%NaH 之油(27 mg)，於 60℃下加熱 40 分鐘。於室温下加入(3-羧丙基)(三苯基)溴化鏻(124 mg)，攪拌 40 分鐘。於室温下加入 7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-甲醛(40 mg)。4 小時後，酸化以 1N HCl，分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以水 3 次及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以 p-TLC 純化(己烷-乙酸乙酯 = 1-1)可得(4E)-5-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-4-戊烯酸之黃色油(21 mg，E:Z=16:1，56.3%).

(4E)-5-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-4-戊烯酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.40(6H，d，J=7Hz)，2.20-2.37(4H，m)，3.25(1H，m)，5.30(0.94H，dt，J=15，7Hz)，5.01(0.06H，m)，6.09(1H，d，J=5Hz)，6.24(0.94H，d，J=15Hz)，6.84(0.06H，d，J=10Hz)，6.67(0.94H，d，J=5Hz)，6.70(0.06H，d，J=5Hz)，7.07-7.17(2H，m)，7.26-7.35(2H，m).

MS(ESI^-)：m/z 385(M-H)

例 206

將 7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-甲醛(40 mg)，於室温下加入 1N NaOH(19.3 mg)及丙酮(0.425 mL)。8 小時後，分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以 p-TLC 純化(己烷-乙酸乙酯 = 5-1)可得(3E)-4-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異

丙吡咯并[1，2-b]-嗒咿-3-基]-3-丁烯-2-酮之黃色固體(33 mg)。

(3E)-4-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-3-丁烯-2-酮

NMR($CDCl_3$，δ)：1.40(6H，d，J=7Hz)，2.13(3H，s)，3.38(1H，m)，5.89(1H，d，J=15Hz)，6.23(1H，d，J=5Hz)，6.75(1H，d，J=5Hz)，7.13-7.23(2H，m)，7.30-7.39(2H，m)，7.49(1H，d，J=15Hz)

例 207

將 4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯(100 mg)溶在四氫呋喃(1 mL)，於乾冰-丙酮浴下充以氮氣。加入 2，2'-偶氮雙異丁腈(0.5 mg)。5 分鐘後，加入 1，3-二溴-5，5-二甲基-2，4-咪唑啶二酮(43.8 mg)。攪拌 3 小時(-78～-30°C)。加入水(5 mL)，萃取以乙酸乙酯。將有機層清洗以食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥，蒸發可得之黃色膠。以驟矽膠柱層析純化，溶離以甲苯-己烷 = 1-5～2-3 可得 7-溴-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯之黃色膠(90.0 mg，72.5%)。

7-溴-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.98(3H，t，J=7Hz)，1.40(6H，d，J=7Hz)，3.31(1H，七線，J=7Hz)，4.05(2H，q，J=7Hz)，6.39(1H，d，J=5Hz)，6.87(1H，d，J=5Hz)，7.16(2H，t，J=9Hz)，7.45(2H，dd，J=4 及 9Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 405(M+H)

例 208

將 NaH(74.4 mg)溶在二甲亞碸(1.4 mL)，於 60℃下攪拌 1 小時。於室溫下加入含三苯鏻甲基溴(1.11 g)之二甲亞碸(1.0 mL)。攪拌 0.5 小時，加入 4-(4-氟苯基)-7-甲醯基-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯(500 mg)。攪拌 15 小時，分層於乙酸乙酯(20 mL)及水(5 mL)。將有機層清洗以水及食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥，蒸發可得桔色膠。以矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-7～3-1 可得 4-(4-氟苯基)-2-異丙基-7-乙烯吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯之黃色膠，靜置可固體化(361 mg，72.6%)。

4-(4-氟苯基)-2-異丙基-7-乙烯吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.97(3H，t，J=7Hz)，1.38(6H，d，J=7Hz)，3.32(1H，七線，J=7Hz)，4.03(2H，q，J=7Hz)，5.35(1H，dd，J=2 及 12Hz)，6.11(1H，dd，J=2 及 18Hz)，6.34(1H，d，J=5Hz)，6.99(1H，d，J=5Hz)，7.16(1H，t，J=9Hz)，7.25(1H，dd，J=12 及 18Hz)，7.45(2H，d，J=4 及 9Hz)

例 209

將 7-{4-[4-({[(苄氧基)羰基]-胺基}磺醯基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}庚酸乙酯(169 mg)溶在乙醇(2 mL)，加入 10% Pd-C(1.6 mg)，於氫氣(3 kg/cm2)下攪拌 2 小時。濾經矽藻土，將濾液濃縮可得之黃色膠。以製備性矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-1 可得 7-{4-[4-(

胺磺醯基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}庚酸乙酯之黃色膠(76.8 mg，58.4%)。

7-{4-[4-(胺磺醯基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}庚酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.07-1.25(7H，m)，1.30-1.46(7H，m)，2.18(2H，t，J=7Hz)，2.36(2H，m)，2.55(3H，s)，3.00(2H，q，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，5.21(2H，s)，5.82(1H，d，J=5Hz)，6.50(1H，d，J=5Hz)，7.52(2H，d，J=9Hz)，8.05(2H，d，J=9Hz)

MS(ESI^+)：m/z 472(M+H)

例 210

將 4-(4-氰苯基)-2-(2-乙氧基-2-氧乙基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯(77.9 mg)溶在乙醇(0.5 mL)-四氫呋喃(0.5 mL)，加入 1N KOH。於室溫下攪拌 2.5 小時。加入 1N 氫氧化鉀(0.04 mL)並攪拌 1 小時。中止反應以加入 1N HCl(0.23 mL)。蒸發揮發物，分層於乙酸乙酯(10 mL)及 1N HCl(6 mL)。將有機層清洗以食鹽水，乾燥後蒸發可得[4-(4-氰苯基)-3-(乙氧羰基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-2-基]乙酸之黃色固體(67.7 mg，93.4%)。

[4-(4-氰苯基)-3-(乙氧羰基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-2-基]乙酸

NMR($CDCl_3$，δ)：0.84(3H，t，J=7Hz)，1.38(3H，t，J=7Hz)，3.05(2H，q，J=7Hz)，3.93(2H，q，J=7Hz)，4.18(3H，s)，6.27(1H，d，J=5Hz)，6.74(1H，d，J=5Hz)，7.52(2H，d

，J=9Hz)，7.76(2H，d，J=9Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 378(M+H)

例 211

將 2-(2-胺基-2-氧乙基)-4-(4-氰苯基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯(35.0 mg)溶在四氫呋喃(1 mL)，於冰浴下加入 60%NaH(4.50 mg)。攪拌 1 小時。中止反應以加入 1N HCl(4 mL)。萃取以乙酸乙酯(10 mL)，將有機層清洗以及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以製備性矽膠柱層析純化，溶離以氯仿-甲醇= 10-1 可得 4-(7-乙基-1，3-二氧-1，2，3，4-四氫吡啶并[3，4-e]吡咯并[1，2-b]-嗒咿-10-基)苄腈之黃色固體(3.86 mg，12.6%).

4-(7-乙基-1，3-二氧-1，2，3，4-四氫吡啶并[3，4-e]吡咯并[1，2-b]嗒咿-10-基)苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.40(3H，t，J=7Hz)，3.08(2H，q，J=7Hz)，4.16(3H，s)，6.38(1H，d，J=5Hz)，6.85(1H，d，J=5Hz)，7.46(2H，d，J=9Hz)，7.78(2H，d，J=9Hz)，7.92(1H，s，br)

例 212

於室溫下在甲醇(1 mL)中加入 60%NaH(6.51 mg)。加入三氟甲磺酸 4-(3-氰苯基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-2-酯(70.0 mg)。於室溫至攪拌 2 小時，再於 50℃下攪拌 1 小時。分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以製備性矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-1 可得 3-[7-乙基-2-甲氧基-3-(甲

磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈之黃色固體(1.92 mg，3.7%)。

3-[7-乙基-2-甲氧基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.38(3H，t，J=7Hz)，3.01(2H，q，J=7Hz，)，3.24(3H，s)，4.18(3H，s)，6.12(1H，d，J=5Hz)，6.63(1H，d，J=5Hz)，7.53-7.64(3H，m)，7.76(1H，m)

例 213

將 4-(3-氰苯基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-2-羧酸乙酯(92.6 mg)溶在四氫呋喃(1 mL)及乙醇(0.5 mL)，加入 1N NaOH(0.349 mL)。於室温下攪拌 3 小時。加入 1N NaOH(0.1 mL)，攪拌 40 分鐘。加入 1N NaOH(0.1 mL)後攪拌 1.5 小時。中止反應以加入 1N HCl(1 mL)，分層於乙酸乙酯(20 mL)及水(10 mL)。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得紅色油。以膠矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-1 可得 3-(6-乙基-1，1-二氧-3-氧-2，3-二氫吡咯并[1，2-b]噻吩并[2，3-e]-嗒咿-9-基)苄腈紅色泡沫(52.4 mg，64.0%)。

3-(6-乙基-1，1-二氧-3-氧-2，3-二氫吡咯并[1，2-b]噻吩并[2，3-e]嗒咿-9-基)苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.45(3H，t，J=7Hz)，3.21，(3H，s)，4.28(2H，s)，6.91(1H，d，J=5Hz)，7.26(1H，d，J=5Hz)，7.75(1H，t，J=9Hz)，7.91(1H，d，J=9Hz)，8.08-8.16(2H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 352(M+H)

例 214

將 3-(6-乙基-1，1-二氧-3-氧-2，3-二氫吡咯并[1，2-b]噻吩并[2，3-e]嗒咿-9-基)苄腈(60.0 mg)溶在四氫呋喃(0.2 mL)，於冰浴下加入硼烷-四氫呋喃複合物之四氫呋喃(0.487 mL)1 M 溶液。攪拌 1 小時，中止反應以加入 1N HCl(1 mL)。分層於乙酸乙酯(20 mL)及水(10 mL)，將有機層清洗以食鹽水，乾燥後蒸發可得 3-(6-乙基-3-羥基-1，1-二氧-2，3-二氫吡咯并[1，2-b]噻吩并[2，3-e]嗒咿-9-基)-苄腈黃色泡沫(576 mg，99.8%)。

3-(6-乙基-3-羥基-1，1-二氧-2，3-二氫吡咯并[1，2-b]噻吩并[2，3-e]嗒咿-9-基)苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.45(3H，t，J=7Hz)，3.21，(3H，s)，4.28(2H，s)，6.91(1H，d，J=5Hz)，7.26(1H，d，J=5Hz)，7.75(1H，t，J=9Hz)，7.91(1H，d，J=9Hz)，8.08-8.16(2H，m)

例 215

將 3-(6-乙基-3-羥基-1，1-二氧-2，3-二氫吡咯并[1，2-b]噻吩并[2，3-e]嗒咿-9-基)苄腈(54.0 mg)溶在四氫呋喃(1 mL)，於冰浴下加入 60%NaH(6.69 mg)。攪拌 0.5 小時，加入甲碘(25.9 mg)，於室溫下攪拌 3 小時 20 分鐘。加入甲碘(25.9 mg)後攪拌 6 小時。加入 60%NaH(3.0 mg)及甲碘(25.9 mg)，攪拌 1 小時。分層於乙酸乙酯及 1N HCl，將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得之黃色油。以

製備性矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-2 可得 3-(6-乙基-1，1-二氧吡咯并[1，2-b]噻吩并[2，3-e]嗒咿-9-基)苄腈(5.9 mg，10.5%，之黃色固體)及 3-(6-乙基-3-甲氧基-1，1-二氧-2，3-二氫吡咯并[1，2-b]噻吩并[2，3-e]嗒咿-9-基)苄腈(16.8 mg，30.0%，桔色膠).

3-(6-乙基-1，1-二氧吡咯并[1，2-b]噻吩并[2，3-e]嗒咿-9-基)苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.40(3H，t，J=7Hz)，3.07(2H，q，J=7Hz)，6.68(1H，d，J=5Hz)，6.82(1H，d，J=5Hz)，7.02(1H，d，J=7Hz)，7.37(1H，d，J=7Hz)，7.72(1H，t，J=9Hz)，7.87(1H，d，J=9Hz)，8.11-8.16(2H，m)

3-(6-乙基-3-甲氧基-1，1-二氧-2，3-二氫吡咯并[1，2-b]噻吩并[2，3-e]嗒咿-9-基)苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.42(3H，t，J=7Hz)，3.12(2H，q，J=7Hz)，3.67(3H，s)，3.73(2H，m)，5.02(1H，m)，6.74(1H，d，J=5Hz)，6.97(1H，d，J=5Hz)，7.70(1H，t，J=9Hz)，7.85(1H，d，J=9Hz)，8.04-8.13(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 368(M+H)

例 216

將 3-[(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄腈(1.00 g)，3-(甲磺醯基)-2-氧丙酸乙酯(1.34 g)，及對甲苯磺酸單水合物(79.5 mg)溶在甲苯(20 mL)，使用 Dean-Stark 縮合器回流 1 小時。蒸發揮發物。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-10～9-15 可得中間亞胺(1.38 g，67.7%)之桔色

泡沫。將泡沫溶在 N-甲嗎啉(10 mL)，於 130℃下攪拌 1 小時。分層於乙酸乙酯(50 mL)及水(30 mL)。將有機層清洗以水(30 x 2 mL)及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得暗桔色固體。將固體碾製以二異丙醚(10 mL)可得 4-(3-氰苯基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒呯基-2-羧酸 2-(三甲矽烷基)乙酯之黃色粉(1.11 g，67.7%)。

4-(3-氰苯基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒呯基-2-羧酸 2-(三甲矽烷基)乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.12(9H，s)，1.22(2H，m)，1.39(3H，t，J=7Hz)，3.09(2H，q，J=7Hz)，3.23(3H，s)，4.53(2H，m)，6.30(1H，d，J=5Hz)，6.89(1H，d，J=5Hz)，7.50-7.67(3H，m)，7.82(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 470(M+H)

下列化合物可仿例 216 之方法製備。

例 217

4-(3-氰苯基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒呯基-2-羧酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.39(3H，t，J=7Hz)，1.47(3H，t，J=7Hz)，3.10(2H，q，J=7Hz)，3.21，(3H，s)，4.51(2H，q，J=7Hz)，6.30(1H，d，J=5Hz)，6.90(1H，d，J=5Hz)，7.61-7.67(3H，m)，7.72(1H，m)

例 218

將 4-(3-氰苯基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒呯基-2-羧酸 2-(三甲矽烷基)乙酯(1.09)溶在三氟乙酸(5 mL)，

於冰浴冷卻下攪拌 1.5 小時。中止反應以加入水(20 mL)。可形成黃色結晶，濾集沈澱。將結晶清洗以水(5 mL)及己烷(3 mL)，可得 4-(3-氰苯基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-2-羧酸之黃色結晶(756 mg，88.2%)。

4-(3-氰苯基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-2-羧酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.41(2H，m)，3.10(2H，q，J=7Hz)，3.30(3H，s)，6.36(1H，d，J=5Hz)，6.94(1H，d，J=5Hz)，7.53-7.67(3H，m)，7.82(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 370(M+H)

例 219

將 4-(3-氰苯基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-2-羧酸(40.0 mg)，二甲胺鹽酸鹽(12.4 mg)，1-(3-二甲胺丙基)-3-乙碳化二亞胺(25.2 mg)，及 1-羥基苯并三唑(21.9 mg)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(1 mL)，於室温下攪拌 3 小時。分層於乙酸乙酯(20 mL)及 1N HCl(10 mL)。將有機層清洗以水(10 x 3 mL)，飽和重碳酸鈉(10 mL)，及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 4-(3-氰苯基)-7-乙基-N，N-二甲基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-2-羧醯胺之黃色固體(43.4 mg，101%)。

4-(3-氰苯基)-7-乙基-N，N-二甲基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-2-羧醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.38(2H，m)，3.07(2H，q，J=7Hz)，3.12(3H，s)，3.18(3H，s)，3.27(3H，s)，6.27(1H，d，J=5Hz)

，6.85(1H，d，J=5Hz)，7.57-7.67(3H，m)，7.81(1H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 397(M+H)

例 220

將 4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸乙酯(450 mg)及 85%氫氧化鉀(3.01 g)溶在乙醇(3 mL)及水(2 mL)，回流 2.5 小時。於冰浴下冷卻，中止反應以濃鹽酸(5 mL)。分層於乙酸乙酯(20 mL)及水(10 mL)，將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得之黃色固體(388 mg)。將固體碾製以己烷可得 4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸之黃色粉(361 mg，86.4%)。

4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.41(3H，t，J=7Hz)，3.08(2H，q，J=7Hz)，6.37(1H，d，J=5Hz)，6.55(1H，m)，6.76(1H，d，J=5Hz)，7.02(1H，d，J=3Hz)，7.40-7.55(5H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 367(M+H)

例 221

將 4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸(358 mg)及 N，N-二甲基甲醯胺(1.39 mg)溶在二氯甲烷(3 mL)，於室溫下加入草醯氯(157 mg)。攪拌 30 分鐘，蒸發揮發物，將殘渣共沸以甲苯 3 次可得 4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羰基氯之黃色膠(396 mg，106%).

4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羰基氯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.42(3H，t，J=7Hz)，3.10(2H，q，J=7Hz)，6.45(1H，d，J=5Hz)，6.59(1H，m)，6.82(1H，d，J=5Hz)，7.06(1H，d，J=7Hz)，7.38-7.55(4H，m)，7.63(1H，m)

例 222

將胺基乙酸甲酯鹽酸鹽(26.1 mg)及三乙胺(42.0 mg)溶在二氯甲烷(0.5 mL)，於冰浴冷卻下加入 4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羰基氯(40.0 mg)之二氯甲烷(0.5 mL)。分層於乙酸乙酯(20 mL)及 1N HCl(10 mL)，將有機層清洗以食鹽水(10 mL)，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得({[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(3-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]羰基}胺基)乙酸甲酯之黃色膠(50.6 mg，111%)。

({[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(3-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]羰基}胺基)乙酸甲酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.41(3H，t，J=7Hz)，3.10(2H，q，J=7Hz)，3.69(3H，s)，3.95(2H，d，J=5Hz)，6.01(1H，t，br，5Hz)，6.35(1H，d，J=5Hz)，6.51(1H，m)，6.75(1H，d，J=5Hz)，7.01(1H，d，J=7Hz)，7.37-7.48(3H，m)，7.53(1H，m)，7.58(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 438(M+H)

下列化合物可仿例 222 之方法製備。

例 223

4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(2-呋喃基)-N，N-雙(2-羥基 ethyl)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.42(3H，t，J=7Hz)，2.35-2.72(4H，m)，3.08(2H，d，J=5Hz)，3.20-3.63(4H，m)，3.82(2H，m)，6.40(1H，t，br，5Hz)，6.54(1H，m)，6.75(1H，d，J=5Hz)，7.04(1H，d，J=3Hz)，7.40-7.48(2H，m)，7.53-7.60(2H，m)，7.71(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 454(M+H)

例 224

將 3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸(100 mg)溶在二噁烷(0.5 mL)，加入三乙胺(25.2 mg)，再加入含特戊醯氯(30.1 mg)之二噁烷(0.5 mL)。可形成白色沈澱。於室溫下攪拌 40 分鐘，濾除沈澱，清洗以二噁烷(2 mL)。在結合洗液中加入含 2-胺乙磺酸(38.6 mg)之 1N NaOH(0.247 mL)。於室溫下攪拌 1 小時。分層於乙酸乙酯(15 mL)及水(5 mL)。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以製備性矽膠柱層析純化，溶離以氯仿-甲醇 = 5-1 可得 2-({3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并-[1，2-b]嗒咿-3-基]丙醯基}胺基)乙磺酸之黃色固體(104 mg，82.0%)。

2-({3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙醯基}胺基)乙磺酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.27(5H，m)，2.59(4H，m)，2.90-3.14(4H，m)，5.96(1H，m)，6.06(1H，m)，7.06-7.40(9H，m)

例 225

將 3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸(100 mg)，特戊酸(2R，3R，4S，5S，6R)-2-胺基-3，5-雙[(2，2-二甲基丙醯基)-氧基]-6-{[(2，2-二甲基丙醯基)氧基]甲基}四氫-2H-吡喃-4-酯(255 mg)，1-(3-二甲胺丙基)-3-乙碳化二亞胺(0.494 mmol)，及 1-羥基苯并三唑(66.7 mg)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(1 mL)，於室溫下攪拌 1 小時。分層於乙酸乙酯(20 mL)及 1N HCl(10 mL)。將有機層清洗以水(10 x 3 mL)，飽和重碳酸鈉溶液(10 mL)，及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得黃色泡沫(339 mg)。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-已烷 = 1-10～2-5 可得特戊酸(2R，3R，4S，5S，6R)-2-({3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙醯基}胺基)-3，5-雙[(2，2-二甲基丙醯基)氧基]-6-{[(2，2-二甲基丙醯基)-氧基]甲基}四氫-2H-吡喃-4-酯黃色泡沫(240 mg，108%)。

特戊酸(2R，3R，4S，5S，6R)-2-({3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙醯基}胺基)-3，5-雙[(2，2-二甲基丙醯基)氧基]-6-{[(2，2-二甲基丙醯基)氧基]甲基}四氫-2H-吡喃-4-酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.97-1.26(36H，m)，1.35(3H，t，J=7Hz)，1.83(2H，m)，2.81(2H，m)，3.01(2H，q，J=7Hz)，3.87-4.16(3H，m)，4.90-5.27(3H，m)，5.36-5.51(2H，m)，6.01(1H，d，J=5Hz)，6.52(1H，d，J=5Hz)，7.29(1H，m)，7.40-7.59(8H，m)

例 226

將[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙酸乙酯(114 mg)溶在四氫呋喃(2 mL)，於冰浴冷卻下加入1 M 二異丁基氫化鋁之甲苯(0.816 mL)。於室温下攪拌1小時，加入1 M 二異丁基氫化鋁(0.41 mL)。1小時後，中止反應以加入1N HCl(1 mL)。分層於乙酸乙酯(20 mL)及1N HCl(10 mL)，濾經矽藻土。將有機層清洗以水(10 mL)及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得之黃色膠。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-20～2-50可得2-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙醇之黃色油，靜置可析出結晶(107 mg，104%)。

2-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙醇

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，2.77(2H，t，J=7Hz)，3.01(2H，q，J=7Hz)，3.26(2H，m)，3.26(2H，m)，6.00(1H，d，J=5Hz)，6.63(1H，d，J=5Hz)，7.34(1H，m)，7.41-7.55(8H，m)

例 227

將2-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙醇(105 mg)，2，3，4，6-四-O-乙醯基-β-D-半乳糖基溴(299 mg)，碳酸銀(154 mg)溶在甲苯(2 mL)，於冰浴冷卻下加入三氟甲磺酸銀(3.58 mg)。40分鐘後，加入2，3，4，6-四-O-乙醯基-β-D-半乳糖基溴(114 mg)，碳酸銀(229 mg)，攪拌50分鐘。加入2，3，4，6-四-O-乙醯基-β-D-

半乳糖基溴(114 mg)及碳酸銀(154 mg)後，再攪拌 50 分鐘。濾經矽藻土，將濾液分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得之黃色膠。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-10～7/10 可得乙酸(2R，3R，4S，5S，6R)-4，5-雙(乙醯氧基)-6-[(乙醯氧基)甲基]-2-{2-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙氧基}四氫-2H-吡喃-3-酯之黃色膠(115 mg，58.4%)。

乙酸(2R，3R，4S，5S，6R)-4，5-雙(乙醯氧基)-6-[(乙醯氧基)甲基]-2-{2-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙氧基}四氫-2H-吡喃-3-酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.35(3H，t，J=7Hz)，1.70(3H，m)，1.94(3H，s)，2.04(3H，s)，2.11(3H，s)，2.78(2H，m)，3.01(2H，q，J=7Hz)，3.10(1H，m)，3.46(1H，m)，3.62(1H，t，J=6Hz)，3.79(1H，d，J=8Hz)，3.98(2H，m)，4.83(1H，dd，J=3及 10Hz)，4.97(1H，dd，J=8 及 10Hz)，5.28(1H，d，J=3Hz)，6.02(1H，d，J=5Hz)，6.64(1H，d，J=5Hz)，7.31(1H，m)，7.41-7.56(8H，m)

例 228

將乙酸(2R，3R，4S，5S，6R)-4，5-雙(乙醯氧基)-6-[(乙醯氧基)甲基]-2-{2-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙氧基}四氫-2H-吡喃-3-酯(113 mg)溶在甲醇(2 mL)，於室溫下加入甲氧化鈉(0.86 mg)。攪拌 2 小時，蒸發溶劑，分層於乙酸乙酯(20 mL)及水(10 mL)。將有機層

清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得黃色泡沫(77.3 mg)。將泡沫碾製以己烷可得(2R，3R，4S，5R，6R)-2-{2-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙氧基}-6-(羥甲基)四氫-2H-吡喃-3，4，5-三醇之黃色粉(48.3 mg，89.7%)。

(2R，3R，4S，5R，6R)-2-{2-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙氧基}-6-(羥甲基)四氫-2H-吡喃-3，4，5-三醇

NMR($CDCl_3$，δ)：1.36(3H，t，J=7Hz)，1.92(1H，m)，2.06(1H，m)，2.56(1H，s，br)，2.76-2.92(3H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.24(2H，m)，3.38-3.50(3H，m)，3.63-3.84(3H，m)，2.41(1H，s，br)，6.01(1H，d，J=5Hz)，6.63(1H，d，J=5Hz)，7.32(1H，m)，7.41-7.57(8H，m)

下列化合物可依例228之方法製備。

例229

3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-N-[(2R，3R，4S，5R，6R)-3，4，5-三羥基-6-(羥甲基)四氫-2H-吡喃-2-基]丙醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.38(3H，t，J=7Hz)，1.97(2H，m)，2.83(2H，m)，3.01(2H，q，J=7Hz)，3.31-3.52(3H，m)，3.61-3.76(2H，m)，3.88(1H，m)，4.63(1H，d，J=9Hz)，6.01(1H，d，J=5Hz)，6.64(1H，d，J=5Hz)，7.34(1H，m)，7.42-7.59(8H，m)

例230

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]

嗒咿-3-基]戊酸乙酯可得自 5-[2-[(乙醯氧基)甲基]-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.34-1.50(5H，m)，1.54(2H，m)，2.19(2H，t，J=7Hz)，2.37(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.71(1H，t，J=5Hz)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.86(2H，d，J=5Hz)，5.97(1H，d，J=5Hz)，6.60(1H，d，J=5Hz)，7.88(1H，m)，8.55(1H，m)，8.79(1H，m)

例 231

將 5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸(50 mg)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(1 mL)，於室溫下加入 1，1'-羰基二咪唑(33.6 mg)。攪拌 1 小時，加入甲磺醯胺(19.7 mg)及 1，8-二吖雙環[5.4.0]十一碳-7-烯(31.6 mg)。於 50℃下加熱 2 小時。分層於乙酸乙酯及水。將水層酸化以 1NHCl，萃取以乙酸乙酯。將有機層清洗以水 3 次及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得之黃色固體。將殘渣結晶自 IPE 可得黃色固體(45 mg)。將固體結晶自乙醇可得 N-{5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊醯基}甲磺醯胺(25 mg，)之黃色固體。

N-{5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊醯基}甲磺醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.33-1.61(7H，m)，2.21(2H，t，J=8Hz)，2.40(2H，t，J=8Hz)，2.55(3H，s)，3.00(2H，q，J=8Hz)，3.29(3H，s)，5.80(1H，d，J=5Hz)，6.52(1H，d，J=5Hz)，7.58-7.67(3H，m)，7.76(1H，m)，7.86(1H，br s)

MS(ESI$^+$)：m/z 439(M+H)

例 232

將 5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸乙酯(45 mg)溶在四氫呋喃(1 mL)，於冰浴冷卻下加入硼氫化鋰(5 mg)。於室溫下攪拌。2 小時後，再加入硼氫化鋰(5 mg)並攪拌過夜。分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，真空蒸發。將殘渣以 p-TLC 純化(己烷-乙酸乙酯= 1-1)可得 3-[7-乙基-3-(6-羥己基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-4-基]苄腈(26 mg，64.5%)之黃色油及 6-{4-[3-(胺甲基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}-1-己醇(13 mg，31.9%)黃色固體。

3-[7-乙基-3-(6-羥己基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-4-基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.15-1.53(11H，m)，2.32-2.41(2H，m)，2.56(3H，s)，3.01(2H，q，J=8Hz)，3.58(2H，br t，J=8Hz)，5.58(1H，br t，J=8Hz)，5.79(1H，d，J=5Hz)，6.51(1H，d，J=5Hz)，7.57-7.63(2H，m)，7.65(1H，br s)，7.75(1H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 362(M+H)

6-{4-[3-(胺甲基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}-1-己醇

NMR($CDCl_3$，δ)：1.03-1.43(11H，m)，2.41(2H，t，J=8Hz)，2.55(3H，s)，3.01(2H，q，J=8Hz)，3.39-3.61(2H，m)，3.88-4.04(2H，m)，4.25(2H，br s)，5.31(1H，d，J=5Hz)，

6.49(1H，d，J=5Hz)，7.28-7.40(3H，m)，7.51(1H，t，J=8Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 366(M+H)

例 233

將 6-{4-[4-(胺羰基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}己酸(590 mg)溶在水(3 mL)，於室温下加入 1N NaOH(1.5 mL)。5 小時後，可得澄清液。濾經濾紙，清洗以水(0.4 mL x3)，冷凍 15 小時可得 6-{4-[4-(胺羰基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}己酸鈉鹽(612 mg，98.2%)淡黃色粉。

6-{4-[4-(胺羰基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}己酸鈉鹽

NMR(DMSO-d_6，δ)：1.10-1.15(2H，m)，1.20-1.40(7H，m)，1.74(2H，t，J=8Hz)，2.25-2.38(2H，m)，2.50(3H，s)，2.91(2H，q，J=8Hz)，5.72(1H，d，J=5Hz)，6.50(1H，d，J=5Hz)，7.39-7.46(3H，m)，7.97(2H，d，J=8Hz)，8.26(1H，br s)

例 234

將 5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸(100 mg)，三乙胺(29.4 mg)，及二苯磷醯偶氮(79.9 mg)溶在第三丁醇(2 mL)，於 80℃下加熱 8 小時。將冷却反應液分層於乙酸乙酯及水。將水層萃取以乙酸乙酯。將結合有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以 p-TLC 純化(己烷-乙酸乙酯 = 3-1)可得 4-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁胺甲酸第三丁酯(28 mg

，23.4%)之黃色油。

4-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁胺甲酸第三丁酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.27-1.47(14H，m)，2.34-2.45(2H，m)，2.55(3H，s)，2.91-3.02(4H，m)，4.39(1H，br s)，5.79(1H，d，J=5Hz)，6.51(1H，d，J=5Hz)，7.56-7.67(3H，m)，7.75(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 433(M+H)

例 235

於 4-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁胺甲酸第三丁酯 (25 mg)中，於室温下加入 4NHCl-乙酸乙酯(1 mL)。1小時後，真空蒸發。碾製以異丙醚可得 3-[3-(4-胺丁基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈鹽酸鹽暗綠色非晶形物(18 mg)。

3-[3-(4-胺丁基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈鹽酸鹽

NMR($CDCl_3$，δ)：1.27-1.47(14H，m)，2.34-2.45(2H，m)，2.55(3H，s)，2.91-3.02(4H，m)，4.39(1H，br s)，5.79(1H，d，J=5Hz)，6.51(1H，d，J=5Hz)，7.56-7.67(3H，m)，7.75(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 333(M+H)

例 236

將氯化鋰(16.5 mg)中加入含 5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(65 mg)及三丁(乙烯

基)錫(56.7 mg)之二噁烷(1 mL)及肆(三苯膦)鈀(0)(1.9 mg)。回流4小時，加入三丁(乙烯基)錫(50 mg)及肆(三苯膦)鈀(0)(1.9 mg)。回流過夜，中止反應以加入氟化鉀(1.8 mmol)之水。濾經矽藻土，清洗以乙酸乙酯。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以驟矽膠柱層析純化(矽膠，50 mL)，溶離以己烷-乙酸乙酯= 5-1及3-1可得5-[7-乙基-2-甲基-4-(2-乙烯基-4-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(18 mg，28.3%)之黃色油。

5-[7-乙基-2-甲基-4-(2-乙烯基-4-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.15-1.70(10H，m)，2.18(2H，t，J=8Hz)，2.36-2.46(2H，m)，2.55(3H，s)，3.00(2H，q，J=8Hz)，4.08(2H，q，J=8Hz)，5.54(1H，d，J=10Hz)，5.86(1H，d，J=5Hz)，6.25(1H，d，J=16Hz)，6.51(1H，d，J=5Hz)，6.87(1H，dd，J=16，10Hz)，7.16(1H，dd，J=6，1Hz)，7.33(1H，br s)，8.70(1H，d，J=6Hz)

MS(ESI^+)：m/z 392(M+H)

下列化合物可依例236之方法製備。

例237

5-{4-[5-(1-乙氧乙烯基)-3-吡啶基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.42(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.60(4H，m)，2.20(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.52(2H，m)，2.56(3H，s)，3.03(2H，q，J=7Hz)，

3.96(2H，q，J=7Hz)，4.09(2H，q，J=7Hz)，4.34(1H，d，J=2Hz)，4.76(1H，d，J=2Hz)，5.87(1H，d，J=4Hz)，6.52(1H，d，J=4Hz)，7.89(1H，m)，8.53(1H，d，J=2Hz)，8.93(1H，d，J=2Hz)

MS：(m/z)436(M+H)

例 238

5-[7-乙基-2-甲基-4-(5-乙烯基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.22(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.65(4H，m)，2.18(2H，t，J=7Hz)，2.40-2.53(2H，m)，2.56(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.08(2H，q，J=7Hz)，5.43(1H，d，J=11Hz)，5.88(1H，d，J=4Hz)，5.89(1H，d，J=18Hz)，6.52(1H，d，J=4Hz)，6.71-6.83(1H，dd，J=11 Hz，18Hz)，7.73(1H，m)，8.47(1H，d，J=2Hz)，8.68(1H，d，J=2Hz)

例 239

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-乙烯基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.22(3H，t，J=7Hz)，1.38(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.60(4H，m)，2.17(2H，t，J=7Hz)，2.52-2.65(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，3.46(3H，s)，4.08(2H，q，J=7Hz)，4.63(2H，s)，5.43(1H，d，J=11Hz)，5.88(1H，d，J=18Hz)，5.91(1H，d，J=4Hz)，6.58(1H，d，J=4Hz)，6.71-6.83(1H，dd，J=11 Hz，18Hz)，7.75(1H，m)，8.49(1H，d，J=2Hz)

，8.71(1H，d，J=2Hz)

例 240

5-[4-[5-(1-乙氧乙烯基)-3-吡啶基]-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.22(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.42(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.63(4H，m)，2.18(2H，t，J=7Hz)，2.51-2.63(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.47(3H，s)，3.93(2H，q，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.35(1H，d，J=3Hz)，4.63(2H，s)，4.77(1H，d，J=3Hz)，5.92(1H，d，J=4Hz)，6.58(1H，d，J=4Hz)，7.92(1H，m)，8.53(1H，d，J=2Hz)，8.93(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI^+)：m/z 466

例 241

5-[7-乙基-2-苯基-4-(5-乙烯基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.15-1.31(7H，m)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.87(2H，t，J=7Hz)，2.43(2H，m)，3.01(2H，q，J=7Hz)，3.98(2H，q，J=7Hz)，5.45(1H，d，J=11Hz)，5.88(1H，d，J=18Hz)，5.98(1H，d，J=5Hz)，6.62(1H，d，J=5Hz)，6.78(1H，dd，J=11 及 18Hz)，7.44-7.55(5H，m)，7.81(1H，m)，8.55(1H，m)，8.72(1H，m)

例 242

將-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸(50 mg)溶在二噁烷(1.5 mL)，置於密閉管並加入

50%二甲胺之水(1.5 mL)。加熱至 175℃過夜。將反應液冷却後真空濃縮。溶在水(1 mL)，調整 pH 至 7-8。萃取以氯仿 3 次。將有機層於硫酸鎂下乾燥並真空蒸發。將殘渣以驟矽膠柱層析純化(矽膠，50 mL)，溶離以氯仿-乙酸乙酯= 1-1 及氯仿-甲醇= 20-1 可得黃色油(43 mg)。將油結晶自異丙醚可得 5-{4-[2-(二甲胺基)-4-吡啶基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸之黃色固體(27 mg，52.8%).

5-{4-[2-(二甲胺基)-4-吡啶基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.36(3H，t，J=8Hz)，1.40-1.65(4H，m)，2.25(2H，t，J=8Hz)，1.86-1.96(2H，m)，2.55(3H，s)，3.00(2H，q，J=8Hz)，4.08(2H，q，J=8Hz)，5.54(1H，d，J=10Hz)，5.86(1H，d，J=5Hz)，6.25(1H，d，J=16Hz)，6.51(1H，d，J=5Hz)，6.87(1H，dd，J=16，10Hz)，7.16(1H，dd，J=6，1Hz)，7.33(1H，br s)，8.70(1H，d，J=6Hz)

例 243

將 7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-甲醛(40 mg)溶在乙醇(1 mL)，於冰浴冷卻下加入 2-胺乙醇(11.8 mg)，氰硼氫化鈉(12.1 mg)，及乙酸(1 滴)。10 分鐘後，於室溫下攪拌。2 小時後後加入氰硼氫化鈉(11.8 mg)，以乙酸(5 滴)酸化至 pH4。攪拌過夜，分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以飽和重碳酸鈉溶液，水，及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以 p-TLC 純化(氯仿-甲醇= 10-1)可得 2-({[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-

基]甲基}胺基)乙醇淡黃色油(21 mg)。

2-({[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]甲基}胺基)乙醇

NMR($CDCl_3$，δ)：1.43(6H，d，J=7Hz)，2.65(2H，t，J=7Hz)，3.42(1H，m)，3.53(2H，t，J=7Hz)，3.59(2H，s)，6.01(1H，d，J=5Hz)，6.77(1H，d，J=5Hz)，7.14-7.24(2H，m)，7.35-7.44(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 362(M+H)

例 244

將[4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯-[1，2-b]嗒咿-3-基]甲醇(505 mg)及三乙胺(997 mg)溶在二氯甲烷(4 mL)及二甲亞碸(2 mL)，於冰浴冷卻及氮氣下加入三氧化硫-吡啶複合物(941 mg)。30分鐘後，於室溫下攪拌2小時。將反應液濃縮至約1/3體積。分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以水3次及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以驟矽膠柱層析純化(矽膠，30 mL)，溶離以己烷-氯仿 = 3-1及2-1可得4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-甲醛黃色固體(340 mg，67.9%).

4-(4-氟苯基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-甲醛

NMR($CDCl_3$，δ)：2.77(3H，s)，6.50(1H，m)，6.86(1H，m)，7.20-7.30(2H，m)，7.44-7.54(2H，m)，8.89(1H，br s)，9.79(1H，s)

例 245

將4-(4-氟苯基)-2-異丙基-7-乙烯吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-

羧酸乙酯(8.9 g)及 10%Pd-C(900 mg)溶在乙醇(180 mL)，於氫氣(3.5 大氣壓)及室溫下攪拌。10 小時後，靜置過夜。加入 10%Pd-C(900 mg)，於氫氣(3.5 大氣壓)及室溫下攪拌。12 小時後，靜置過夜。加入 10%Pd-C(900 mg)，於氫氣(3.5 大氣壓)及室溫下攪拌 8 小時。濾經矽藻土。將濾液真空濃縮可得 7-乙基-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯之黃色油(9.0 g，100.5%)。

7-乙基-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.96(3H，t，J=8Hz)，1.38(3H，t，J=8Hz)，3.05(2H，q，J=8Hz)，4.01(2H，q，J=8Hz)，6.27(1H，d，J=5Hz)，6.64(1H，d，J=5Hz)，7.10-7.19(2H，m)，7.41-7.49(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 362(M +H)

下列化合物可依例 245 之方法製備。

例 246

5-[7-乙基-4-(5-乙基-3-吡啶基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸可得自 5-[7-乙基-2-甲基-4-(5-乙烯基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.30(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.65(4H，m)，2.22(2H，m)，2.35-2.50(2H，m)，2.56(3H，s)，2.75(2H，q，J=7Hz)，3.00(2H，q，J=7Hz)，5.84(1H，d，J=4Hz)，6.52(1H，d，J=4Hz)，7.57(1H，s)，8.42(1H，d，J=2Hz)，8.53(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 366(M+H)，MS(ESI$^-$)：m/z 364

例 247

5-[7-乙基-4-(5-乙基-3-吡啶基)-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.30(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.45-1.64(4H，m)，2.17(2H，m)，2.45-2.67(2H，m)，2.73(2H，q，J=7Hz)，3.04(2H，q，J=7Hz)，3.45(3H，s)，4.62(2H，m)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.58(1H，d，J=4Hz)，7.59(1H，s)，8.44(1H，s)，8.54(1H，s)

MS(ESI$^+$)：m/z 396

例 248

5-[7-乙基-4-(5-乙基-3-吡啶基)-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.04-1.23(7H，m)，1.32(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.86(2H，t，J=7Hz)，2.42(2H，m)，2.74(2H，q，J=7Hz)，3.01(2H，q，J=7Hz)，3.99(2H，q，J=7Hz)，5.97(1H，d，J=5Hz)，6.62(1H，d，J=5Hz)，7.45-7.53(5H，m)，7.60(1H，m)，8.50(1H，m)，8.56(1H，m)

例 249

將 3-(7-乙基-2-新戊吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基)苄醯胺(35 mg)溶在乙醇(1 mL)，於室温下加入水(0.2 mL)及氫氧化鉀(68.9 mg)。加熱至 60℃。2 小時後，加入氫氧化鉀(100 mg)。5 小時後，加入氫氧化鉀(100 mg)。12 小時後，酸化以 1NHCl

。濾集沈澱，清洗以水及乙酸乙酯可得 3-(7-乙基-2-新戊吡咯并-[1，2-b]嗒咿-4-基)苄酸之黃色固體(19 mg，54.1%).

3-(7-乙基-2-新戊吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基)苄酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.05(9H，s)，1.39(3H，t，J=8Hz)，2.69(2H，s)，3.04(2H，q，J=8Hz)，6.42(1H，s)，6.54(1H，d，J=5Hz)，6.65(1H，d，J=5Hz)，7.62(1H，t，J=8Hz)，7.97(1H，d，J=8Hz)，8.21(1H，d，J=8Hz)，8.46(1H，br s)

MS(ESI^+)：m/z 337(M+H)

下列化合物可仿例 249 之方法製備。

例 250

3-[7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.44(3H，t，J=8Hz)，3.11(2H，q，J=8Hz)，6.56(1H，m)，6.61(1H，d，J=5Hz)，6.72(1H，d，J=5Hz)，7.03(1H，br s)，7.07(1H，d，J=5Hz)，7.55-7.69(2H，m)，8.03(1H，br d，J=8Hz)，8.23(1H，br d，J=8Hz)，8.52(1H，br s)

例 251

將 5-{4-[5-(1-乙氧乙烯基)-3-吡啶基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯(190 mg)溶在甲醇(5 mL)及 1N HCl(5 mL)，於室温下攪拌 2 小時。稀釋以食鹽水，萃取以氯仿。分離有機層，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=10:1-2:1)可得 5-[4-(5-乙醯基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯之黃色油(160 mg)。

5-[4-(5-乙醯基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.38(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.60(4H，m)，2.19(2H，t，J=7Hz)，2.36-2.47(2H，m)，2.57(3H，s)，2.70(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.08(2H，q，J=7Hz)，5.81(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，8.23(1H，m)，8.78(1H，d，J=2Hz)，9.23(1H，d，J=2Hz)

MS：(m/z)408(M+H)

下列化合物可仿例251之方法製備。

例252

5-[4-(5-乙醯基-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.38(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.59(4H，m)，2.17(2H，t，J=7Hz)，2.50-2.63(2H，m)，2.70(3H，s)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.46(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.63(2H，s)，5.86(1H，d，J=4Hz)，6.59(1H，d，J=4Hz)，8.26(1H，m)，8.79(1H，d，J=2Hz)，9.24(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI^+)：m/z 438

例253

將5-{4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-[(甲硫基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}戊酸乙酯(139 mg)溶在四氫呋喃(4 mL)及水(1 mL)，加入過硫酸氫鉀製劑 oxone(287 mg)並於室溫下攪拌4小時。稀釋以水，萃取以乙酸乙酯。分離有機層，

清洗以飽和重碳酸鈉溶液，硫代硫酸鈉溶液及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=10:1-1:1)可得 5-{4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-[(甲磺醯基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯之黃色油(124 mg)。

5-{4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-[(甲磺醯基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.63(4H，m)，2.21(2H，t，J=7Hz)，2.57-2.68(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.12(3H，s)，4.10(2H，q，J=7Hz)，4.53(2H，s)，5.98(1H，d，J=4Hz)，6.68(1H，d，J=4Hz)，7.27(1H，m)，7.38(1H，s)，8.56(1H，d，J=5Hz)

例 254

將 5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(167 mg)及氰化銅(I)(37 mg)溶在 1-甲基-2-吡咯啶酮(3 mL)，於 170℃下攪拌 4 小時。分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=20:1-5:1)可得 5-[4-(5-氰基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯之黃色油(88 mg)。

5-[4-(5-氰基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.24(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.62(4H，m)，2.21(2H，t，J=7Hz)，2.35-2.47(2H，

m)，2.57(3H，s)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.12(2H，q，J=7Hz)，5.79(1H，d，J=4Hz)，6.54(1H，d，J=4Hz)，7.98(1H，m)，8.80(1H，d，J=2Hz)，8.97(1H，d，J=2Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 391.

下列化合物可依例254之方法製備。

例255

5-[4-(5-氰基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.67(4H，m)，2.28(2H，m)，2.37-2.47(2H，m)，2.57(3H，s)，3.01(2H，q，J=7Hz)，5.80(1H，d，J=4Hz)，6.55(1H，d，J=4Hz)，8.01(1H，s)，8.81(1H，br)，8.98(1H，br)

例256

5-[4-(5-氰基-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.37(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.60(4H，m)，2.19(2H，t，J=7Hz)，2.49-2.60(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，3.46(3H，s)，4.12(2H，q，J=7Hz)，4.63(2H，s)，5.84(1H，d，J=4Hz)，6.63(1H，d，J=4Hz)，8.02(1H，m)，8.83(1H，d，J=2Hz)，8.98(1H，d，J=2Hz)

例257

5-[4-(5-氰基-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.38(3H，t，J=7Hz)，1.40-1.65(4H，

m)，2.27(2H，t，J=7Hz)，2.48-2.64(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.46(3H，s)，4.64(2H，s)，5.84(1H，d，J=4Hz)，6.62(1H，d，J=4Hz)，8.03(1H，s)，8.82(1H，s)，8.97(1H，s)

例 258

5-[4-(5-氰基-3-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸

NMR($CDCl_3$，δ)：1.06-1.24(4H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.94(2H，t，J=7Hz)，2.38(2H，m)，2.99(2H，q，J=7Hz)，5.88(1H，d，J=5Hz)，6.64(1H，d，J=5Hz)，7.44-7.52(5H，m)，8.06(1H，s)，8.87(1H，s)，8.98(1H，s)

MS(ESI^+)：m/z 425(M+H)

例 259

將鋁氫化鋰(98.8 mg)溶在四氫呋喃(10 mL)，於冰水冷卻下加入 5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸乙酯(600 mg)之四氫呋喃(10 mL)，於 0℃ 下攪拌 2 小時。中止反應以飽和酒石酸鉀鈉溶液，濾除不溶物，清洗以乙酸乙酯。將濾液清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=10:1-2:1)可得 5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]-1-戊醇之黃色油(478 mg)。

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]-1-戊醇

NMR($CDCl_3$，δ)：0.90-1.22(6H，m)，1.27(1H，t，J=7Hz)

，1.36(3H，t，J=7Hz)，2.37-2.47(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.29-3.41(2H，m)，5.97(1H，d，J=4Hz)，6.61(1H，d，J=4Hz)，7.32(1H，m)，7.40-7.55(8H，m)

例 260

將 5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-1-戊醇(63.0 mg)及三乙胺(22.8 mg)溶在二氯甲烷(3 mL)，於冰水冷卻下加入甲磺醯氯(18.9 mg)，於 0℃下攪拌 1 小時。清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣加入氰化鈉(14.7 mg)之二甲基甲醯胺(2 mL)，於 60℃下攪拌 5 小時。分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=20:1-5:1)可得 6-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]己腈之黃色油(58.5 mg)。

6-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]己腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.00-1.15(4H，m)，1.17-1.28(2H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.98(2H，t，J=7Hz)，2.38-2.47(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，5.99(1H，d，J=4Hz)，6.62(1H，d，J=4Hz)，7.32(1H，m)，7.38-7.56(8H，m)

MS(ESI^+)：m/z 428

例 261

將 5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-1-戊醇(65 mg)，四氟硼酸三甲氧鎓(27.5 mg)及 2，6-二

第三丁基-4-甲吡啶(47.8 mg)溶在 1，2-二氯乙烷(3 mL)，於室温下攪拌 4 小時。清洗以水，1N HCl，水，飽和重碳酸鈉溶液及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=20:1-5:1)可得 4-(3-氯苯基)-7-乙基-3-(5-甲氧戊基)-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿之黃色油(60 mg)。

4-(3-氯苯基)-7-乙基-3-(5-甲氧戊基)-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿

NMR($CDCl_3$，δ)：00.90-1.32(6H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，2.37-2.47(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.08(2H，t，J=7Hz)，3.31(3H，s)，5.97(1H，d，J=4Hz)，6.61(1H，d，J=4Hz)，7.27-7.33(1H，m)，7.38-7.53(8H，m)

MS(ESI^+)：m/z 433

例 262

將 5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-1-戊醇(55 mg)及三乙胺(19.9 mg)溶在二氯甲烷(3 mL)，於冰水冷卻下加入甲磺醯氯(16.5 mg)，於 0℃下攪拌 1 小時。將溶液清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣溶在 1，2-二氯乙烷(3 mL)，加入 2 M 二甲胺之四氫呋喃(3 mL)，於 60℃下攪拌 120 小時。將溶液稀釋以氯仿，清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=20:1-5:1)可得 5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-N，N-二甲基-1-戊胺之黃色油(38 mg)。

N-{5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊基}-N，N-二甲胺

NMR($CDCl_3$，δ)：0.86-0.97(2H，m)，1.02-1.15(4H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.97-2.04(2H，m)，2.11(6H，s)，2.37-2.47(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.97(1H，d，J=4Hz)，6.61(1H，d，J=4Hz)，7.31(1H，m)，7.39-7.54(8H，m)

MS(ESI^+)：m/z 446

例 263

將含 5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸(60 mg)之二氯甲烷(2 ml)攪拌溶液，加入 1-(3-二甲胺丙基)-3-乙碳化二亞胺鹽酸鹽(35.3 mg)及 2-胺吡啶(20 mg)，攪拌 10 分鐘。加入 4-二甲胺吡啶(2 mg)，於室溫下攪拌 15 小時。稀釋以水，萃取以乙酸乙酯。將有機層清洗以水，食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥後真空濃縮。將殘渣以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯及正己烷(1:2)可得 5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-N-(2-吡啶基)戊醯胺(55.7mg)之黃色非晶形物。

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-N-(2-吡啶基)戊醯胺

熔點：67-70°C

NMR(CDCl3，δ)：1.12(2H，五線，J=7Hz)，1.30(2H，五線，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.95(2H，t，J=7Hz)，2.43(2H，q，J=7Hz)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.90(1H，d，J=4Hz)，6.62(1H，d，J=4Hz)，7.00-7.05(1H，m)，7.43-7.54(5H

，m)，7.59-7.77(6H，m)，8.11(1H，d，J=7.5Hz)，8.24(1H，d，J=4Hz)

MS：(m/z)499(M+)，45(bp)

下列化合物可依例263之方法製備。

例264

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-N-(2-吡啶基)戊醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.15(2H，五線，J=7Hz)，1.24(2H，五線，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.91(2H，t，J=7Hz)，2.45(2H，t，J=7Hz)，3.00(2H，q，J=7Hz)，5.97(1H，d，J=5Hz)，6.60(1H，d，J=4Hz)，7.00(1H，t，J=7Hz)，7.30(1H，s)，7.38-7.53(7H，m)，7.65-7.73(2H，m)，8.11(1H，d，J=7Hz)，8.25(1H，d，J=5Hz)

MS：(m/z)509(M^++H)，74(bp)

例265

N-{5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊醯基}甲磺醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.08(2H，五線，J=7Hz)，1.23(2H，五線，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.85(2H，t，J=7Hz)，2.44(2H，t，J=7Hz)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.21(3H，s)，5.99(1H，d，J=4Hz)，6.62(1H，d，J=4Hz)，7.30-7.33(1H，m)，7.43-7.55(8H，m)

例266

5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒

咁-3-基]-N-(2-吡啶基)戊醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.12(2H，五線，J=7Hz)，1.27(2H，五線，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.97(2H，t，J=7Hz)，2.45(2H，t，J=7Hz)，3.01(2H，q，J=7Hz)，5.95(1H，d，J=5Hz)，6.63(1H，d，J=4Hz)，7.01(1H，t，J=7Hz)，7.31(1H，d，J=7Hz)，7.41-7.53(6H，m)，7.68(1H，ddd，J=7，7，1Hz)，7.77(1H，s)，8.12(1H，d，J=7.5Hz)，8.24(1H，d，J=5Hz)，8.53(1H，d，J=6Hz)

MS：(m/z)510(M++H)，80(bp)

例 267

N-{5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咁-3-基]戊醯基}甲磺醯胺

熔點：124-125°C

NMR(CDCl3，δ)：1.37(3H，t，J=7Hz)，1.43-1.49(2H，m)，1.55-1.65(2H，m)，2.23(2H，t，J=7Hz)，2.34-2.48(2H，m)，2.55(3H，s)，3.01(2H，q，J=7Hz)，3.28(3H，s)，5.87(1H，d，J=4Hz)，6.53(1H，d，J=4Hz)，7.09(1H，s)，7.40(1H，s)，8.53(1H，s)，8.77(1H，s)

MS：(m/z)493(M^+)，491(M^+-2)，137(bp)

例 268

將 5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咁-3-基]戊酸乙酯(100.0 mg)及(溴甲基)苯(111 mg)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(1 mL)，於冰浴冷卻下加入 60%NaH(17.4 mg)。攪拌 2.5 小時，中止反應以加入 1N HCl(1 mL)，分層

於乙酸乙酯(10 mL)及水(5 mL)。將有機層清洗以 1N HCl(5 mL)，水(5 mL，3 次)，及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1/40～20/40 可得 5-[2-[(苄氧基)甲基]-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯之黃色膠(47.7 mg，39.9%)。

5-[2-[(苄氧基)甲基]-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.34-1.48(5H，m)，2.09(2H，m)，2.53(2H，m)，3.04(2H，q，J=7Hz)，4.07(2H，J=7Hz)，4.65(2H，s)，4.72(2H，s)，5.90(1H，d，J=5Hz)，6.60(1H，d，J=5Hz)，7.29-7.38(5H，m)，7.86(1H，s)，8.54(1H，m)，8.77(1H，m)

下列化合物可仿例 268 之方法製備。

例 269

5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-2-{[(4-氰苄基)氧基]甲基}-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，J=7Hz)，1.35-1.55(7H，m)，2.12(2H，t，J=7Hz)，2.57(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，4.07(2H，q，J=7Hz)，4.49(2H，s)，4.76(2H，s)，5.93(1H，d，J=7Hz)，6.62(1H，d，J=7Hz)，7.48(2H，d，J=8Hz)，7.65(2H，d，J=8Hz)，7.86(1H，m)，8.54(1H，m)，8.78(1H，m)

例 270

將 5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1,2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(200 mg)及三乙胺(65.9 mg)溶在二氯甲烷(2 mL)，於冰浴冷卻下加入甲磺醯氯(54.7 mg)。攪拌 1 小時，中止反應以加入 1N HCl(1 mL)。分層於乙酸乙酯(20 mL)及 1N HCl(5 mL)。將有機層清洗以飽和重碳酸鈉溶液及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[(甲磺醯基)氧基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯之黃色膠(247 mg)。

5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[(甲磺醯基)氧基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.22(3H，t，J=7Hz)，1.34-1.65(7H，m)，2.20(2H，t，J=7Hz)，2.55(2H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.15(3H，s)，4.07(2H，q，J=7Hz)，5.42(2H，s)，5.99(1H，d，J=5Hz)，6.68(1H，d，J=5Hz)，7.87(1H，m)，8.54(1H，m)，8.81(1H，m)

例 271

將 5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[(甲磺醯基)氧基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯(50.0 mg)，苄胺(29.8 mg)溶在二氯甲烷(1 mL)，於室溫下攪拌 20 小時。分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以食鹽水，乾燥後蒸發。以製備性薄層層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1:2 可得 5-[2-[(苄胺基)甲基]-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯之黃色膠(19.1 mg)。

5-[2-[(苄胺基)甲基]-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1

，2-b]嗒吡-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.30-1.50(7H，m)，2.13(2H，t，J=7Hz)，2.42(2H，m)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.96(4H，m)，4.09(2H，q，J=7Hz)，5.89(1H，d，J=5Hz)，6.57(1H，d，J=5Hz)，7.23-7.42(5H，m)，7.86(1H，m)，8.53(1H，m)，8.77(1H，m)

下列化合物可仿例271之方法製備。

例272

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.23(3H，t，J=7Hz)，1.31-1.56(7H，m)，2.19(2H，t，J=7Hz)，2.45-2.65(6H，m)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.60-3.75(6H，m)，4.09(2H，q，J=7Hz)，5.88(1H，d，J=5Hz)，6.57(1H，d，J=5Hz)，7.89(1H，m)，8.55(1H，m)，8.78(1H，m)

例273

將(7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基)甲醇(40 mg)溶在N，N-二甲基甲醯胺(1 mL)，於冰浴冷卻下加入40%NaH之油(5.5 mg)。20分鐘後，於同溫下加入2-溴乙酸乙酯(31 mg)。15分鐘後，於室溫下攪拌5小時。分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以水3次及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以p-TLC純化(己烷-乙酸乙酯=10-1)可得[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]乙酸甲酯之淡黃色固體(42 mg)。

[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙酸甲酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.41(6H，d，J=8Hz)，2.06(3H，s)，3.21(1H，m)，4.92(2H，s)，6.14(1H，d，J=5Hz)，6.72(1H，d，J=5Hz)，7.13-7.24(2H，m)，7.34-7.43(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 361(M+H)

下列化合物可仿製備例20之方法製備。

例274

{[7-乙基-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]甲氧基}乙酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：1.25(3H，t，J=8Hz)，1.30-1.45(9小時，m)，3.04(2H，q，J=8Hz)，3.51(1H，m)，3.97(2H，s)，4.15(2H，q，J=8Hz)，4.40(2H，s)，6.06(1H，d，J=5Hz)，6.56(1H，d，J=5Hz)，7.11-7.22(2H，m)，7.41-7.51(2H，m)

MS(ESI^+)：m/z 399(M+H)

下列化合物可仿製備例276之方法製備。

例275

2-(2-胺基-2-氧乙基)-4-(4-氰苯基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

NMR($CDCl_3$，δ)：0.84(3H，t，J=7Hz)，1.38(3H，t，J=7Hz)，3.06(2H，q，J=7Hz)，3.96(2H，q，J=7Hz)，4.02(3H，s)，5.41(1H，s，br)，6.09(1H，s，br)，6.28(1H，d，J=5Hz)，6.75(1H，d，J=5Hz)，7.53(2H，d，J=9Hz)，7.77(2H，d

，J=9Hz)

MS(ESI$^+$)：m/z 753(2M + H)

例 276

將 4-(3-氰苯基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-2-羧酸(40.0 mg)，吡咯啶(10.8 mg)，1-(3-二甲胺丙基)-3-乙碳化二亞胺鹽酸鹽(31.1 mg)，及 1-羥苯并三唑(21.9 mg)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(1 mL)，於室溫下攪拌 6 小時。分層於乙酸乙酯(20 mL)及 1N HCl(10 mL)。將有機層清洗以水(10 mL)3 次，飽和重碳酸鈉溶液(10 mL)，及食鹽水，乾燥後蒸發可得 3-[7-乙基-3-(甲磺醯基)-2-(1-吡咯啶羰基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈之黃色固體(35.6 mg)。

3-[7-乙基-3-(甲磺醯基)-2-(1-吡咯啶羰基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.38(2H，m)，1.99(4H，m)，3.07(2H，q，J=7Hz)，3.23(3H，s)，3.59(2H，t，J=7Hz)，3.68(2H，t，J=7Hz)，6.27(1H，d，J=5Hz)，6.83(1H，d，J=5Hz)，7.57-7.66(3H，m)，7.79(1H，m)

MS(ESI$^+$)：m/z 423(M+H)

例 277

將 3-[7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄酸(40 mg)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(4 mL)，於室溫下加入 1-(3-二甲胺丙基)-3-乙碳化二亞胺鹽酸鹽(30 mg)，1-羥苯并三唑(24 mg)，及 2-胺乙醇(15 mg)。攪拌過夜，分層於乙酸乙酯及飽和重碳酸鈉。將有機層清洗以水 3 次及食鹽水，於硫酸

鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以驟矽膠柱層析純化(矽膠，40 mL)，溶離以氯仿-甲醇= 50-1～20-1可得之黃色固體(42 mg)。將固體碾製以異丙醚可得3-[7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]-N-(2-羥乙基)苄醯胺之黃色固體(35 mg)。

3-[7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]-N-(2-羥乙基)苄醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.43(3H，t，J=8Hz)，2.39-2.49(2H，m)，3.10(2H，q，J=8Hz)，3.60-3.74(2H，m)，3.80-3.94(2H，m)，6.53-6.86(4H，m)，7.00(1H，s)，6.61(1H，d，J=5Hz)，6.72(1H，d，J=5Hz)，7.03(1H，br s)，7.07(1H，d，J=5Hz)，7.55-7.65(2H，m)，7.86-7.97(2H，m)，8.17(1H，br s)

MS(ESI^+)：m/z 376(M+H)

下列化合物可依例283之方法製備。

例278

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-N-甲基戊醯胺

熔點：60°C

NMR(CDCl3，δ)：1.02-1.12(2H，m)，1.17-1.25(2H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.73(2H，t，J=7Hz)，2.40(2H，t，J=7Hz)，2.71(3H，d，J=7Hz)，3.03(2H，q，J=7Hz)，5.09(1H，寬 s)，5.90(1H，d，J=4Hz)，6.63 1H，d，J=4Hz)，7.45-7.55(5H，m)，7.60-7.78(4H，m)

MS：(m/z)437(M^++H)，115(bp)

例 279

4-(3-氯苯基)-7-乙基-3-[5-(4-嗎啉基)-5-氧戊基]-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒呯

熔點：55-58°C

NMR(CDCl3，δ)：1.05-1.14(2H，m)，1.17-1.23(2H，m)，1.35(3H，t，J=7Hz)，1.84(2H，t，J=7Hz)，2.45(2H，t，J=7Hz)，3.02(2H，q，J=7Hz)，3.24(2H，t，J=6Hz)，3.50(2H，t，J=6Hz)，3.55-3.62(4H，m)，5.99(1H，d，J=4Hz)，6.62(1H，d，J=4Hz)，7.30-7.35(1H，m)，7.40-7.55(8H，m)

MS：(m/z)502(M^++H)，115(bp)

例 280

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]-N-甲基戊醯胺

熔點：70-72°C

NMR(CDCl3，δ)：1.06(2H，五線，J=7Hz)，1.22(2H，五線，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.72(2H，t，J=7Hz)，2.43(2H，t，J=7Hz)，2.70(3H，d，J=7Hz)，3.03(2H，q，J=7Hz)，5.08(1H，寬 s)，5.99(1H，d，J=4Hz)，6.61(1H，d，J=4Hz)，7.29-7.33(1H，m)，7.41-7.55(8H，m)

MS：(m/z)446(M^++H)，115(bp)

例 281

5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]-N-甲基戊醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.07(2H，五線，J=7Hz)，1.23(2H，五

線，J=7Hz)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.74(2H，t，J=7Hz)，2.41(2H，t，J=7Hz)，2.71(3H，d，J=7Hz)，3.02(2H，q，J=7Hz)，5.10(1H，寬 s)，5.95(1H，d，J=4Hz)，6.64(1H，d，J=4Hz)，7.31(1H，d，J=7Hz)，7.42(1H，s)，7.46-7.52(1H，m)，7.41-7.55(1H，d，J=7Hz)

MS：(m/z)447(M^++H)，115(bp)

例 282

3-{7-乙基-3-[5-(4-嗎啉基)-5-氧戊基]-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基}苄腈可得自 5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

熔點：66-69°C

NMR(CDCl3，δ)：1.04-1.12(2H，m)，1.17-1.23(2H，m)，1.36(3H，t，J=7Hz)，1.84(2H，t，J=7Hz)，2.42(2H，t，J=7Hz)，3.03(2H，q，J=7Hz)，3.23(2H，t，J=6Hz)，3.50(2H，t，J=6Hz)，3.55-3.63(4H，m)，5.90(1H，d，J=4Hz)，6.63(1H，d，J=4Hz)，7.43-7.55(5H，m)，7.60-7.78(4H，m)

MS：(m/z)493(M^++H)，126(bp)

例 283

將 5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸(50 mg)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(1 mL)，於室溫下加入 1-(3-二甲胺丙基)-3-乙碳化二亞胺鹽酸鹽(35 mg)及 1-羥苯并三唑(28 mg)。30 分鐘後，加入嗎啉(24 mg)。5 小時後，分層於乙酸乙酯及飽和重碳酸鈉。將有機層清洗以水 3 次及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以驟矽膠柱

層析純化(矽膠，40 mL)，溶離以己烷-乙酸乙酯= 3-1，2-1，1-1，1-3，及 0-1 可得 3-{7-乙基-2-甲基-3-[5-(4-嗎啉基)-5-氧戊基]吡咯并[1，2-b]嗒吡-4-基}苄腈之黃色膠(53 mg)。

3-{7-乙基-2-甲基-3-[5-(4-嗎啉基)-5-氧戊基]吡咯并[1，2-b]嗒吡-4-基}苄腈

NMR($CDCl_3$，δ)：1.15-1.61(7H，m)，2.18(2H，t，J=8Hz)，2.41(2H，t，J=8Hz)，2.56(3H，s)，3.00(2H，q，J=8Hz)，3.82 (2H，t，J=5Hz)，3.51-3.68(6H，m)，5.78(1H，d，J=5Hz)，6.50(1H，d，J=5Hz)，7.56-7.67(3H，m)，7.74(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 431(M+H)

下列化合物可仿例 283 之方法製備。

例 284

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊醯胺

NMR($CDCl_3$，δ)：1.31-1.61(7H，m)，2.11(2H，t，J=8Hz)，2.40(2H，t，J=8Hz)，2.56(3H，s)，3.00(2H，q，J=8Hz)，5.36(2H，br s)，5.79(1H，d，J=5Hz)，6.50(1H，d，J=5Hz)，7.56-7.67(3H，m)，7.75(1H，m)

MS(ESI^+)：m/z 361(M+H)

製備例 178

將 60%NaH(8.79 g)溶在四氫呋喃(500 mL)，加入環己醇(10 g)，於 0℃下攪拌 0.5 小時。於冰水冷卻下加入溴乙酸(13.9 g)，加熱回流 2 小時。加入水，將有機溶劑真空蒸發

。將溶液稀釋以水，清洗以乙醚，酸化以 1 N HCl，萃取以乙醚。分離有機層，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得(環己氧基)乙酸之無色油(13.3 g)。

(環己氧基)乙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.18-1.47(5H，m)，1.52-1.63(1H，m)，1.72-1.85(2H，m)，1.90-2.03(2H，m)，3.36-3.47(1H，m)，4.13(2H，s).

下列化合物可仿製備例 178 之方法製備。

製備例 179

異丙氧乙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(6H，d，J= 7 Hz)，3.68-3.82(1H，m)，4.11(2H，s).

下列化合物可仿製備例 129 及製備例 130 之方法製備。

製備例 180

4-(苄氧基)-3-氧丁酸第三丁酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.44(9H，s)，3.45(2H，s)，4.14(2H，s)，4.60(2H，s)，7.28-7.40(5H，m).

製備例 181

4-(環己氧基)-3-氧丁酸第三丁酯

^{1}H NMR($CDCl_3$) 1.18-1.43(5H，m)，1.47(9H，s)，1.53-1.63(1H，m)，1.69-1.85(2H，m)，1.87-1.97(2H，m)，3.24-3.38(1H，m)，3.46(2H，s)，4.11(2H，s).

製備例 182

4-異丙氧基-3-氧丁酸第三丁酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(6H，d，J= 7 Hz)，1.47(9H，s)，3.45(2H，s)，3.60-3.70(1H，m)，4.08(2H，s).

下列化合物可仿製備例 159 之方法製備。

製備例 183

2-乙醯丁二酸 1-第三丁酯 4-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.47(9H，s)，2.35(3H，s)，3.08(2H，m)，3.93(1H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz).

製備例 184

2-[(苄氧基)乙醯基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.30-1.50(2H，m)，1.40(9H，s)，1.56-1.72(2H，m)，1.75-1.95(2H，m)，2.28(2H，t，J= 7 Hz)，3.52(1H，t，J= 7 Hz)，4.11(2H，q，J= 7 Hz)，4.16(2H，s)，4.59(2H，s)，7.27-7.40(5H，m).

製備例 185

2-[(苄氧基)乙醯基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.41(9H，s)，2.10-2.23(2H，m)，2.36(2H，t，J= 7 Hz)，3.66(1H，t，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.18(2H，s)，4.60(2H，s)，7.26-7.38(5H，m).

製備例 186

2-[(環己氧基)乙醯基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.44(9H，s)，1.15-1.92(16H，m)，2.29(2H，t，J= 7 Hz)，3.24-3.38(1H

，m)，3.56(1H，t，J= 7 Hz)，4.12(4H，m)，

製備例 187

2-(異丙氧乙醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(6H，d，J= 7 Hz)，1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.25-1.45(2H，m)，1.45(9H，s)，1.60-1.72(2H，m)，1.75-1.95(2H，m)，2.29(2H，t，J= 7 Hz)，3.54(1H，t，J= 7 Hz)，3.60-3.68(1H，m)，4.11(2H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 345.

下列化合物可仿製備例 20 之方法製備。

製備例 188

2-[(環己氧基)乙醯基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.45(9H，s)，1.18-1.62(6H，m)，1.66-1.78(2H，m)，1.84-1.98(2H，m)，2.10-2.23(2H，m)，2.38(2H，t，J= 7 Hz)，3.25-3.38(1H，m)，3.69(1H，t，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.15(2H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 357.

製備例 189

將 60%NaH(527 mg)溶在二甲基甲醯胺(20 mL)，於冰水冷卻下加入 3，5-吡啶二羧酸(2.00 g)，於 0℃下攪拌 1 小時。加入(溴甲基)苯(2.05 g)，於 60℃下攪拌 2 小時。分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。碾製以乙酸乙酯可得 5-[(苄氧基)羰基]菸鹼

酸淡黃色粉(722 mg)。

5-[(苄氧基)羰基]菸鹼酸

^{1}H NMR(DMSO-d_6)δ 5.42(2H，s)，7.34-7.54(5H，m)，8.63(1H，m)，9.23-9.34(2H，m).

下列化合物可仿製備例 24 之方法製備。

製備例 190

2-乙醯基-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]丁二酸 1-第三丁酯 4-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.40(9H，s)，2.38(3H，s)，2.45(3H，s)，3.20(2H，m)，4.13(2H，q，J= 7 Hz)，7.88(1H，s)，8.57(1H，s)，8.74(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 363.

製備例 191

2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-3-氧丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.96(3H，t，J= 7 Hz)，2.15(3H，s)，2.45(3H，s)，4.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.12(1H，t，J= 7 Hz)，7.89(1H，s)，8.54(1H，s)，8.72(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 250.

製備例 192

2-乙醯基-2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.36(9H，s)，1.60-1.73(2H，m)，2.23-2.35(2H，m)，2.38(2H，t，J= 7 Hz)，2.48(3H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，8.20(1H，m)，8.78(1H

，m)，8.81(1H，m).

製備例 193

2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-2-(甲氧乙醯基)戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(9H，s)，2.40-2.47(2H，m)，2.55-2.67(2H，m)，3.36(3H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.27(1H，d，J= 17 Hz)，4.40(1H，d，J= 17 Hz)，8.21(1H，m)，8.79(1H，d，J= 2 Hz)，8.82(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 472 474.

製備例 194

2-乙醯基-2-({5-[(苄氧基)羰基]-3-吡啶基}羰基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.20-1.40(2H，m)，1.32(9H，s)，1.65-1.76(2H，m)，2.19-2.26(2H，m)，2.32(2H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，5.41(2H，s)，7.35-7.48(5H，m)，8.62(1H，m)，9.07(1H，d，J= 2 Hz)，9.33(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 526.

製備例 195

2-[(苄氧基)乙醯基]-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.20-1.46(2H，m)，1.32(9H，s)，1.60-1.74(2H，m)，2.10-2.36(4H，m)，

2.35(3H，s)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，4.38(1H，d，J= 18 Hz)，4.53(1H，d，J= 18 Hz)，4.54(2H，m)，7.27-7.40(5H，m)，7.79(1H，m)，8.54(1H，d，J= 2 Hz)，8.72(1H，d，J= 2 Hz)。

MS(ESI$^+$)：m/z 512.

製備例 196

2-[(苄氧基)乙醯基]-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.34(9H，s)，2.35(3H，s)，2.40-2.72(4H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.38(1H，d，J= 17 Hz)，4.50(1H，d，J= 17 Hz)，4.53(2H，m)，7.25-7.38(5H，m)，7.81(1H，s)，8.54(1H，s)，8.73(1H，s)。

MS(ESI$^+$)：m/z 484.

製備例 197

2-[(環己氧基)乙醯基]-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.16-1.55(10H，m)，1.37(9H，s)，1.60-1.76(2H，m)，1.78-1.90(2H，m)，2.15-2.28(2H，m)，2.31(2H，t，J= 7 Hz)，2.39(3H，s)，3.17-3.29(1H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.34(1H，d，J= 18 Hz)，4.44(1H，d，J= 18 Hz)，7.86(1H，s)，8.56(1H，s)，8.76(1H，s)。

MS(ESI$^+$)：m/z 504.

製備例 198

2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-2-[(環己氧基)乙醯基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(9H，s)，1.16-1.88(14H，m)，2.15-2.40(4H，m)，3.16-3.28(1H，m)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，4.28(1H，d，J= 18 Hz)，4.38(1H，d，J= 18 Hz)，8.20(1H，m)，8.78(1H，d，J= 2 Hz)，8.84(1H，d，J= 2 Hz)。

MS(ESI$^+$)：m/z 568 570.

製備例 199

2-[(環己氧基)乙醯基]-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.15-1.38(4H，m)，1.39(9H，s)，1.45-1.75(4H，m)，1.76-1.93(2H，m)，2.39(3H，s)，2.45-2.75(4H，m)，3.17-3.30(1H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.32(1H，d，J= 17 Hz)，4.41(1H，d，J= 17 Hz)，7.88(1H，s)，8.55(1H，s)，8.77(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 476.

製備例 200

2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-2-[(環己氧基)乙醯基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.15-1.35(4H，m)，1.40(9H，s)，1.40-1.65(2H，m)，1.65-1.75(2H，m)，1.75-1.92(2H，m)，2.35-2.85(4H，m)，3.16-3.32(1H，m)

，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.28(1H，d，J= 17 Hz)，4.35(1H，d，J= 17 Hz)，8.22(1H，t，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz)，8.87(1H，d，J= 2 Hz)。

MS(ESI$^+$)：m/z 540 542.

製備例 201

2-(異丙氧乙醯基)-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.12(6H，d，J= 7 Hz)，1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.30-1.55(2H，m)，1.37(9H，s)，1.63-1.77(2H，m)，2.19-2.28(2H，m)，2.28(2H，t，J= 7 Hz)，2.39(3H，s)，3.53-3.64(1H，m)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，4.31(1H，d，J= 18 Hz)，4.42(1H，d，J= 18 Hz)，7.86(1H，s)，8.55(1H，s)，8.74(1H，s)。

MS(ESI$^+$)：m/z 464.

製備例 202

2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-2-(異丙氧乙醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.10(6H，d，J= 7 Hz)，1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(9H，s)，1.18-1.48(2H，m)，1.64-1.77(2H，m)，2.18-2.37(4H，m)，3.52-3.64(1H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.25(1H，d，J= 17 Hz)，4.36(1H，d，J= 17 Hz)，8.19(1H，t，J= 2 Hz)，8.77(1H，d，J= 2 Hz)，8.83(1H，d，J= 2 Hz)。

MS(ESI$^+$)：m/z 528 530.

製備例 203

2-[(乙醯氧基)乙醯基]-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.33(9H，s)，1.20-1.42(2H，m)，1.63-1.74(2H，m)，2.14(3H，s)，2.27-2.38(4H，m)，2.40(3H，s)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，5.08(1H，d，J= 18 Hz)，5.36(1H，d，J= 18 Hz)，7.84(1H，s)，8.56(1H，s)，8.75(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 464.

下列化合物可仿製備例 78 之方法製備。

製備例 204

3-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-4-氧戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，2.21(3H，s)，2.44(3H，s)，3.03(2H，t，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.96(1H，t，J= 7 Hz)，8.08(1H，s)，8.66(1H，s)，9.03(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 264.

製備例 205

5-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-6-氧庚酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.60-1.78(2H，m)，1.98-2.12(2H，m)，2.20(3H，s)，2.36(2H，t，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.39(1H，t，J= 7 Hz)，8.38(1H，m)，8.87(1H，d，J= 2 Hz)，9.08(1H，d，J= 2 Hz).

製備例 206

4-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-6-甲氧基-5-氧己酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，2.04-2.16(1H，m)，2.20-2.34(1H，m)，2.40-2.48(2H，m)，3.22(3H，s)，3.93(1H，d，J= 17 Hz)，4.00(1H，d，J= 17 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.85(1H，m)，8.47(1H，m)，8.88(1H，s)，9.16(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 372 374.

製備例 207

5-(2-乙醯基-7-乙氧基-7-氧庚醯基)菸鹼酸苄酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.30-1.43(2H，m)，1.65-1.75(2H，m)，1.93-2.15(2H，m)，2.19(3H，s)，2.29(2H，t，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.44(1H，t，J= 7 Hz)，5.43(2H，s)，7.35-7.50(5H，m)，8.81(1H，m)，9.28(1H，d，J= 2 Hz)，9.39(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 426.

製備例 208

8-(苄氧基)-6-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.30-1.43(2H，m)，1.60-1.69(2H，m)，1.73-1.86(1H，m)，1.95-2.08(1H，m)，2.25(2H，t，J= 7 Hz)，2.34(3H，s)，4.05(2H，s)，4.07(2H，q，J= 7 Hz)，4.35-4.45(2H，m)，4.69(1H，t，J= 7 Hz)，7.09(2H，m)，7.17-7.25(3H，m)，7.93(1H，s)，8.58(1H，d，J= 2 Hz)，8.94(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 412.

製備例 209

6-(苄氧基)-4-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-5-氧己酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，2.07-2.35(2H，m)，2.34(3H，s)，2.38-2.48(2H，m)，4.05(2H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.34(1H，d，J= 17 Hz)，4.41(1H，d，J= 17 Hz)，4.90(1H，m)，7.03(2H，m)，7.15-7.25(3H，m)，8.00(1H，s)，8.57(1H，s)，9.02(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 384.

製備例 210

8-(環己氧基)-6-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.91-1.70(12H，m)，1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.70-1.85(2H，m)，1.96-2.04(2H，m)，2.27(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，3.14-3.28(1H，m)，4.00(2H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.76(1H，t，J= 7 Hz)，8.04(1H，s)，8.62(1H，s)，9.00(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 404.

製備例 211

6-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-8-(環己氧基)-7-氧辛酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.95-1.87(14H，m)，1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.96-2.07(2H，m)，2.28(2H，t，J= 7 Hz)，3.16-3.27(1H，m)，3.96-4.07(2H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.72(1H，t，J= 7 Hz)，8.38(1H，m)，8.87(1H，d，J= 2 Hz)，9.08(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 468 470.

製備例 212

6-(環己氧基)-4-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-5-氧己酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.88-1.25(5H，m)，1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.83(5H，m)，2.04-2.14(1H，m)，2.18-2.34(1H，m)，2.42(2H，m)，2.44(3H，s)，3.13-3.27(1H，m)，4.00(2H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.93(1H，m)，8.13(1H，s)，8.63(1H，d，J= 2 Hz)，9.07(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 376.

製備例 213

4-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-6-(環己氧基)-5-氧己酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.88-1.85(10H，m)，1.25(3H，t，J= 7 Hz)，2.02-2.14(1H，m)，2.18-2.34(1H，m)，2.40-2.50(2H，m)，3.15-3.27(1H，m)，3.97(1H，d，J= 17 Hz)，4.02(1H，d，J= 17 Hz)，4.13(2H，q，J= 7 Hz)，4.87-4.95(1H，m)，8.48(1H，t，J= 2 Hz)，8.88(1H，d，J= 2 Hz)，9.19(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 440 442.

製備例 214

8-異丙氧基-6-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.86(3H，d，J= 7 Hz)，1.02(3H，d，J= 7 Hz)，1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.30-1.48(2H，m)，1.60-1.72(2H，m)，1.72-1.88(1H，m)，1.95-2.07(1H，m)，2.27(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，3.44-3.54(1H，m)，3.95(1H，d，J= 18 Hz)，4.03(1H，d，J= 18 Hz)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)

，4.73(1H，t，J= 7 Hz)，8.06(1H，s)，8.63(1H，s)，9.02(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 364.

製備例 215

6-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-8-異丙氧基-7-氧辛酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.88(3H，d，J= 7 Hz)，1.03(3H，t，J= 7 Hz)，1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.20-1.46(2H，m)，1.58-1.72(2H，m)，1.73-1.87(1H，m)，1.95-2.07(1H，m)，2.27(2H，t，J= 7 Hz)，3.46-3.58(1H，m)，3.94(1H，d，J= 17 Hz)，4.03(1H，d，J= 17 Hz)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，4.68(1H，t，J= 7 Hz)，8.40(1H，t，J= 2 Hz)，8.86(1H，d，J= 2 Hz)，9.08(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 428 430.

製備例 216

8-(乙醯氧基)-6-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.37-1.47(2H，m)，1.60-1.77(2H，m)，2.01(3H，s)，1.97-2.08(2H，m)，2.29(2H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，4.52(1H，t，J= 7 Hz)，4.68(1H，d，J= 18 Hz)，4.76(1H，d，J= 18 Hz)，8.04(1H，s)，8.66(1H，s)，8.98(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 364.

下列化合物可仿例 21 之方法製備。

例 285

[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒

咁-3-基]乙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.40(3H，s)，2.50(3H，s)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.44(2H，s)，4.14(2H，q，J= 7 Hz)，5.98(1H，d，J= 4 Hz)，6.56(1H，d，J= 4 Hz)，7.55(1H，s)，8.45(1H，s)，8.54(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 338.

例 286

7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咁基-3-羧酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.96(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.41(3H，s)，2.61(3H，s)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，4.05(2H，q，J= 7 Hz)，6.30(1H，d，J= 4 Hz)，6.67(1H，d，J= 4 Hz)，7.58(1H，s)，8.48(1H，d，J= 2 Hz)，8.51(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 324.

例 287

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咁-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.21(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.67-1.78(2H，m)，2.22(2H，t，J= 7 Hz)，2.42-2.54(2H，m)，2.59(3H，s)，3.01(2H，q，J= 7 Hz)，4.06(2H，q，J= 7 Hz)，5.87(1H，d，J= 4 Hz)，6.53(1H，d，J= 4 Hz)，7.87(1H，m)，8.54(1H，d，J= 2 Hz)，8.77(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 430 432.

例 288

3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咪-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.42(2H，t，J= 7 Hz)，2.85-2.97(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，3.46(3H，s)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.65(2H，s)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.87(1H，m)，8.54(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 446 448.

例 289

4-[2-[(乙醯氧基)甲基]-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咪-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.60-1.75(2H，m)，2.17(3H，s)，2.10-2.28(2H，m)，2.45-2.60(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，4.05(2H，q，J= 7 Hz)，5.32(2H，s)，5.95(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.88(1H，m)，8.55(1H，m)，8.78(1H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 488 490.

例 290

5-[3-(5-乙氧基-5-氧戊基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咪-4-基]菸鹼酸苄酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.33-1.60(4H，m)，2.18(2H，t，J= 7 Hz)，2.35-2.47(2H

，m)，2.56(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，5.42(2H，s)，5.82(1H，d，J= 4 Hz)，6.53(1H，d，J= 4 Hz)，7.36-7.47(5H，m)，8.33(1H，m)，8.77(1H，d，J= 2 Hz)，9.33(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 500.

例 291

5-[2-[(苄氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.20-1.50(4H，m)，2.06(2H，t，J= 7 Hz)，2.42(3H，s)，2.47-2.63(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.64(2H，s)，4.73(2H，s)，5.90(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.27-7.39(5H，m)，7.51(1H，s)，8.41(1H，d，J= 2 Hz)，8.53(1H，d，J= 2 Hz).

例 292

3-[2-[(苄氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.16(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.36(2H，t，J= 7 Hz)，2.42(3H，s)，2.80-3.00(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.65(2H，s)，4.75(2H，s)，5.92(1H，d，J= 2 Hz)，6.59(1H，d，J= 2 Hz)，7.26-7.38(5H，m)，7.48(1H，s)，8.40(1H，d，J= 2 Hz)，8.53(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 458.

例 293

5-[2-[(環己氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20-1.60(10H，m)，1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.70-1.83(2H，m)，1.96-2.07(2H，m)，2.15(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.53-2.68(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，3.42-3.53(1H，m)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.69(2H，s)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.55(1H，d，J= 4 Hz)，7.53(1H，s)，8.42(1H，d，J= 2 Hz)，8.53(1H，d，J= 2 Hz).

例 294

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(環己氧基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22-1.62(10H，m)，1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.73-1.86(2H，m)，1.98-2.07(2H，m)，2.18(2H，t，J= 7 Hz)，2.53-2.70(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.42-3.56(1H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.69(2H，s)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.88(1H，m)，8.54(1H，d，J= 2 Hz)，8.77(1H，d，J= 2 Hz).

例 295

3-[2-[(環己氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.19(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.16-1.45(4H，m)，1.52-1.65(2H，m)，1.73-1.83(2H

，m)，1.98-2.07(2H，m)，2.35-2.47(2H，m)，2.42(3H，s)，2.84-2.98(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.45-3.56(1H，m)，4.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.71(2H，s)，5.89(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.50(1H，s)，8.42(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 450.

例 296

3-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(環己氧基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.15-1.60(6H，m)，1.73-1.85(2H，m)，1.97-2.08(2H，m)，2.45(2H，t，J= 7 Hz)，2.83-2.97(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，3.42-3.56(1H，m)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.71(2H，s)，5.90(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.86(1H，t，J= 2 Hz)，8.53(1H，d，J= 2 Hz)，8.77(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 514 516.

例 297

5-[7-乙基-2-(異丙氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.26(6H，d，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.38-1.62(4H，m)，2.17(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.53-2.68(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.76-3.88(1H，m)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)

，4.66(2H，s)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.57(1H，d，J= 4 Hz)，7.52(1H，s)，8.42(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 438.

例 298

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(異丙氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.25(6H，d，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.37-1.64(4H，m)，2.15(2H，t，J= 7 Hz)，2.54-2.72(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.75-3.87(1H，m)，4.09(2H，q，J= 7 Hz)，4.66(2H，s)，5.89(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.88(1H，m)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 502 504.

例 299

5-[2-[(乙醯氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.30-1.58(4H，m)，2.13(2H，t，J= 7 Hz)，2.18(3H，s)，2.44(3H，s)，2.40-2.55(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，5.29(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.52(1H，s)，8.42(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 438.

下列化合物可仿例 236 之方法製備。

例 300

4-{4-[5-(1-乙氧乙烯基)-3-吡啶基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.41(3H，t，J= 7 Hz)，1.68-1.80(2H，m)，2.22(2H，t，J= 7 Hz)，2.44-2.54(2H，m)，2.59(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.95(2H，q，J= 7 Hz)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，4.36(1H，d，J= 3 Hz)，4.77(1H，d，J= 3 Hz)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.52(1H，d，J= 4 Hz)，7.92(1H，m)，8.53(1H，d，J= 2 Hz)，8.93(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 422.

例 301

3-[4-[5-(1-乙氧乙烯基)-3-吡啶基]-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.19(3H，t，J= 7 Hz)，1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.42(2H，t，J= 7 Hz)，2.84-2.97(2H，m)，3.07(2H，q，J= 7 Hz)，3.47(3H，s)，3.97(2H，q，J= 7 Hz)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.36(1H，d，J= 3 Hz)，4.66(2H，s)，4.77(1H，d，J= 3 Hz)，5.95(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.92(1H，m)，8.54(1H，d，J= 2 Hz)，8.95(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 438.

例 302

3-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-乙烯基-3-吡啶基)吡咯并[1

，2-b]嗒吡-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.18(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.40(2H，t，J= 7 Hz)，2.84-2.98(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.47(3H，s)，4.04(2H，q，J= 7 Hz)，4.65(2H，s)，5.46(1H，d，J= 11 Hz)，5.87(1H，d，J= 18 Hz)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，6.72-6.83(1H，dd，J= 11 Hz，18 Hz)，7.74(1H，m)，8.49(1H，d，J= 2 Hz)，8.72(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 394.

例 303

4-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-乙烯基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]丁酸甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.65-1.78(2H，m)，2.23(2H，t，J= 7 Hz)，2.54-2.70(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，3.47(3H，s)，3.58(3H，s)，4.67(2H，s)，5.46(1H，d，J= 11 Hz)，5.88(1H，d，J= 18 Hz)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，6.73-6.83(1H，dd，J= 11 Hz，18 Hz)，7.77(1H，m)，8.51(1H，d，J= 2 Hz)，8.71(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 394.

例 304

4-[4-[5-(1-乙氧乙烯基)-3-吡啶基]-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]丁酸甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7

Hz)，1.67-1.82(2H，m)，2.22(2H，t，J= 7 Hz)，2.53-2.67(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，3.47(3H，s)，3.58(3H，s)，3.95(2H，q，J= 7 Hz)，4.34(1H，d，J= 2 Hz)，4.67(2H，s)，4.77(1H，d，J= 2 Hz)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.59(1H，d，J= 4 Hz)，7.92(1H，m)，8.54(1H，d，J= 2 Hz)，8.95(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 438.

例 305

3-{4-[5-(1-乙氧乙烯基)-3-吡啶基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.19(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.44(3H，t，J= 7 Hz)，2.33-2.43(2H，m)，2.58(3H，s)，2.76-2.87(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.96(2H，q，J= 7 Hz)，4.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.36(1H，d，J= 2 Hz)，4.77(1H，d，J= 2 Hz)，5.91(1H，d，J= 4 Hz)，6.54(1H，d，J= 4 Hz)，7.91(1H，m)，8.53(1H，d，J= 2 Hz)，8.96(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 408.

下列化合物可仿例 251 之方法製備。

例 306

4-[4-(5-乙醯基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.19(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.66-1.82(2H，m)，2.21(2H，t，J= 7 Hz)，2.41-2.51(2H

，m)，2.60(3H，s)，2.69(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.03(2H，q，J= 7 Hz)，5.83(1H，d，J= 4 Hz)，6.53(1H，d，J= 4 Hz)，8.25(1H，m)，8.79(1H，d，J= 2 Hz)，9.25(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 394.

例 307

3-[4-(5-乙醯基-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.18(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.41(2H，t，J= 7 Hz)，2.70(3H，s)，2.83-2.96(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，3.47(3H，s)，4.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.66(2H，s)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，8.26(1H，m)，8.79(1H，d，J= 2 Hz)，9.25(1H，d，J= 2 Hz).

例 308

4-[4-(5-乙醯基-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.64-1.80(2H，m)，2.20(2H，t，J= 7 Hz)，2.53-2.65(2H，m)，2.70(3H，s)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，3.47(3H，s)，3.57(3H，s)，4.67(2H，s)，5.87(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，8.27(1H，s)，8.81(1H，d，J= 2 Hz)，9.26(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 410.

例 309

3-[4-(5-乙醯基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.19(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.33-2.42(2H，m)，2.59(3H，s)，2.69(3H，s)，2.75-2.83(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，4.05(2H，q，J= 7 Hz)，5.83(1H，d，J= 4 Hz)，6.53(1H，d，J= 4 Hz)，8.25(1H，m)，8.78(1H，d，J= 2 Hz)，9.26(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 380.

例 310

將 5-[3-(5-乙氧基-5-氧戊基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]菸鹼酸苄酯(330 mg)及 10%Pd-C(33 mg)溶甲醇(10 mL)，於氫氣(4 大氣壓)及室溫下攪拌 2 小時。濾除觸媒，清洗以氯仿。將濾液真空蒸發可得 5-[3-(5-乙氧基-5-氧戊基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]菸鹼酸黃色油(272 mg)。

5-[3-(5-乙氧基-5-氧戊基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]菸鹼酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.21(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.35-1.63(4H，m)，2.19(2H，t，J= 7 Hz)，2.38-2.49(2H，m)，2.57(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.11(2H，q，J= 7 Hz)，5.85(1H，d，J= 4 Hz)，6.53(1H，d，J= 4 Hz)，8.40(1H，m)，8.83(1H，d，J= 2 Hz)，9.37(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^-)：m/z 408，MS(ESI^+)：m/z410.

例 311

將 5-[3-(5-乙氧基-5-氧戊基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]菸鹼酸(235 mg)及三乙胺(87.1 mg)溶於第三丁醇(10 mL)，加入二苯磷醯疊氮(237 mg)，加熱回流 2 小時。蒸發溶劑，分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=20:1-2:1)可得 5-(4-{5-[(第三丁氧羰基)胺基]-3-吡啶基}-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯黃色油(190 mg)。

5-(4-{5-[(第三丁氧羰基)胺基]-3-吡啶基}-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.42-1.67(4H，m)，1.52(9H，s)，2.19-2.28(2H，m)，2.38-2.50(2H，m)，2.55(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.53(1H，d，J= 4 Hz)，6.93(1H，br)，7.87(1H，s)，8.30(1H，d，J= 2 Hz)，8.70(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 481.

例 312

將 5-(4-{5-[(第三丁氧羰基)胺基]-3-吡啶基}-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯(190 mg)溶在 2 NHCl 乙酸乙酯(4 mL)，於室溫下攪拌 2 小時。蒸發溶劑，分層於乙酸乙酯及飽和重碳酸鈉溶液。分離有機層，清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(氯仿及甲醇=100:1-20:1)可得 5-[4-(5-胺基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲

吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯黃色油(140 mg)。

5-[4-(5-胺基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.65(4H，m)，2.23(2H，t，J= 7 Hz)，2.45(2H，t，J= 7 Hz)，2.54(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.97(2H，br)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.53(1H，d，J= 4 Hz)，7.02(1H，m)，8.02(1H，d，J= 2 Hz)，8.17(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 381(M+H).

例 313

將 5-[4-(5-胺基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(55 mg)，37%甲醛溶液(277 mg)及氰硼氫化鈉(27.3 mg)溶在乙腈(1 mL)及甲醇(1 mL)，加入乙酸(2 滴)，於室溫下攪拌 2 小時。稀釋以飽和重碳酸鈉溶液，萃取以氯仿。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以製備性矽膠柱層析純化，溶離以氯仿及甲醇(20:1)可得 5-{4-[5-(二甲胺基)-3-吡啶基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯黃色油(36.5 mg)。

5-{4-[5-(二甲胺基)-3-吡啶基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.63(4H，m)，2.19(2H，t，J= 7 Hz)，2.40-2.53(2H，m)，2.55(3H，s)，3.02(6H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)

，4.09(2H，q，J= 7 Hz)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.50(1H，d，J= 4 Hz)，6.96(1H，m)，7.95(1H，d，J= 2 Hz)，8.20(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 409.

下列化合物可仿例 245 之方法製備。

例 314

3-[7-乙基-4-(5-乙基-3-吡啶基)-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.29(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.45-2.58(2H，m)，2.73(2H，q，J= 7 Hz)，2.82-3.02(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.47(3H，s)，4.67(2H，s)，5.91(1H，d，J= 4 Hz)，6.59(1H，d，J= 4 Hz)，7.58(1H，m)，8.43(1H，d，J= 2 Hz)，8.53(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^-$)：m/z 366，MS(ESI$^+$)：m/z 368.

例 315

4-[7-乙基-4-(5-乙基-3-吡啶基)-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.31(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.69-1.85(2H，m)，2.20-2.31(2H，m)，2.52-2.75(2H，m)，2.77(2H，q，J= 7 Hz)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，3.46(3H，s)，4.60-4.80(2H，m)，5.91(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.61(1H，s)，8.44-8.53(2H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 382.

下列化合物可仿例 228 之方法製備。

例 316

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.65-1.79(2H，m)，2.25(2H，t，J= 7 Hz)，2.39-2.53(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，3.61(3H，s)，4.90(2H，s)，5.96(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.88(1H，m)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.79(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 432 434 .

例 317

5-[7-乙基-2-(羥甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.35-1.60(4H，m)，2.17(2H，t，J= 7 Hz)，2.35-2.45(2H，m)，2.43(3H，s)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，3.83(1H，t，J= 7 Hz)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，4.85(2H，d，J= 7 Hz)，5.96(1H，d，J= 4 Hz)，6.57(1H，d，J= 4 Hz)，7.50(1H，s)，8.42(1H，s)，8.54(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 396.

下列化合物可仿例 268 之方法製備。

例 318

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.65-1.79(2H，

m)，2.24(2H，t，J= 7 Hz)，2.52-2.70(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，3.46(3H，s)，3.60(3H，s)，4.76(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.88(1H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.79(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 446 448.

例 319

5-[2-[(2-第三丁氧基-2-氧乙氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.30-1.60(4H，m)，1.47(9H，s)，2.17(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.58-2.72(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.08(2H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.81(2H，s)，5.91(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.53(1H，s)，8.43(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 510.

例 320

5-[2-[(環丙基甲氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.20-0.32(2H，m)，0.53-0.63(2H，m)，1.07-1.20(1H，m)，1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.60(4H，m)，2.15(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.53-2.68(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.41(2H，d，J= 7 Hz)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.70(2H，s)，5.89(1H，d，J= 4 Hz)，6.56(1H，d，J= 4 Hz)，7.52(1H，s)，8.43(1H

，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 450.

例 321

5-[2-[(環己基甲氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.88-1.05(2H，m)，1.16-1.35(4H，m)，1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.38-1.59(4H，m)，1.60-1.87(5H，m)，2.16(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.54-2.67(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.35(2H，d，J= 7 Hz)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，4.64(2H，s)，5.89(1H，d，J= 4 Hz)，6.56(1H，d，J= 4 Hz)，7.52(1H，s)，8.43(1H，d，J= 2 Hz)，8.53(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 492.

例 322

5-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(3-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(3H，t，J= 7 Hz)，1.35-1.54(4H，m)，2.12(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.50-2.63(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.66(2H，s)，4.76(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.28(1H，m)，7.52(1H，s)，7.72(1H，d，J= 8 Hz)，8.42(1H，d，J= 2 Hz)，8.54(2H，m)，8.62(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 487.

例 323

5-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(2-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咪-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.21(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.36-1.54(4H，m)，2.12(2H，t，J= 7 Hz)，2.42(3H，s)，2.56-2.68(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.77(2H，s)，4.85(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.22(1H，m)，7.43-7.54(2H，m)，7.66-7.74(1H，m)，8.42(1H，d，J= 2 Hz)，8.54(1H，d，J= 2 Hz)，8.57(1H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 487.

例 324

5-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咪-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(3H，t，J= 7 Hz)，1.38-1.57(4H，m)，2.12(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.52-2.68(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.66(2H，s)，4.77(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 2 Hz)，7.28(2H，d，J= 7 Hz)，7.52(1H，s)，8.42(1H，d，J= 2 Hz)，8.53(1H，d，J= 2 Hz)，8.58(2H，d，J= 7 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 487.

例 325

5-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(2-吡咪甲氧基)甲基]

吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.38-1.57(4H，m)，2.13(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.52-2.68(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.07(2H，q，J= 7 Hz)，4.82(2H，s)，4.88(2H，m)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.52(1H，s)，8.43(1H，d，J= 2 Hz)，8.48-8.57(3H，m)，8.75(1H，m).

MS(ESI^+)：m/z 488.

例 326

5-[4-(3-氰苯基)-2-(乙氧甲基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.18-1.29(6H，m)，1.34-1.53(7H，m)，2.14(2H，t，J = 7 Hz)，2.52(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.53(2H，q，J = 7 Hz)，4.07(2H，q，J = 7 Hz)，4.66(1H，s)，5.73(1J，d，J = 5 Hz)，6.56(1H，d，J = 5 Hz)，7.60(2H，m)，7.67(1H，s)，7.75(1H，m)

例 327

5-[2-[(苄氧基)甲基]-4-(3-氰苯基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J = 7 Hz)，1.30-1.46(7H，m)，2.06(2H，t，J = 7 Hz)，2.51(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，4.07(2H，q，J = 7 Hz)，4.64(3H，s)，4.72(3H，s)，5.83(1H，d，J = 5 Hz)，6.57(1H，d，J = 5 Hz)，7.25-7.38(5H，m)，7.57(2H，d，J = 9 Hz)，7.65(1H，s)，7.74(1H，m)

。

例 328

4-({[4-(3-氰苯基)-3-(5-乙氧基-5-氧戊基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-2-基]甲氧基}甲基)苄酸甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J = 7 Hz)，1.32-1.49(7H，m)，2.01(2H，t，J = 7 Hz)，2.52(2H，m)，3.02(2H，t，J = 7 Hz)，3.92(3H，s)，4.07(2H，t，J = 7 Hz)，4.69(2H，s)，4.75(2H，s)，6.84(1H，d，J = 5 Hz)，6.59(1H，d，J = 5 Hz)，7.43(2H，d，J = 9 Hz)，7.60(2H，m)，7.65(1H，s)，7.75(1H，m)，8.02(2H，d，J = 9 Hz)。

例 329

將 5-[2-[(2-第三丁氧基-2-氧乙氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(60 mg)溶在三氟乙酸(2 mL)，於室温下攪拌 2 小時，並真空蒸發可得{[3-(5-乙氧基-5-氧戊基)-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-2-基]甲氧基}乙酸之棕色油(55 mg)。

{[3-(5-乙氧基-5-氧戊基)-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-2-基]甲氧基}乙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.35-1.60(4H，m)，2.23(2H，t，J= 7 Hz)，2.50-2.58(2H，m)，2.67(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.30(2H，s)，4.87(2H，s)，5.86(1H，d，J= 4 Hz)，6.67(1H，d，J= 4 Hz)，8.15(1H，s)，8.69(1H，s)，8.85(1H，s).

MS(ESI$^-$)：m/z 452，MS(ESI$^+$)：m/z 454.

例 330

將{[3-(5-乙氧基-5-氧戊基)-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-2-基]甲氧基}乙酸(55 mg)，1-乙基-3-(3'-二甲胺丙基)碳化二亞胺鹽酸鹽(34.9 mg)及 1-羥苯并三唑(24.6 mg)溶在二甲基甲醯胺(2 mL)，加入嗎啉(12.7 mg)，於室溫下攪拌 1 小時。分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以飽和重碳酸鈉溶液，水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(乙酸乙酯:甲醇=50:1-20:1)可得 5-(7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-{[2-(4-嗎啉基)-2-氧乙氧基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯黃色油(50 mg)。

5-(7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-{[2-(4-嗎啉基)-2-氧乙氧基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.63(4H，m)，2.15(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.54-2.68(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.48-3.57(2H，m)，3.63-3.78(6H，m)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.30(2H，s)，4.78(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.52(1H，s)，8.43(1H，d，J= 2 Hz)，8.54(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 523.

下列化合物可仿例 330 之方法製備。

例 331

5-[7-乙基-2-{[2-(甲胺基)-2-氧乙氧基]甲基}-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.38-1.62(4H，m)，2.18(2H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，2.48-2.62(2H，m)，2.88(3H，d，J= 7 Hz)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.11(2H，q，J= 7 Hz)，4.13(2H，s)，4.77(2H，s)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，6.79(1H，br)，7.53(1H，s)，8.44(1H，s)，8.56(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 467.

下列化合物可仿例 271 之方法製備。

例 332

5-[2-[(苄胺基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.30-1.50(2H，m)，1.60-1.85(2H，m)，2.12(2H，t，J= 7 Hz)，2.30-2.45(2H，m)，2.42(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.96(2H，s)，3.98(2H，s)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，5.87(1H，d，J= 4 Hz)，6.54(1H，d，J= 4 Hz)，7.27-7.43(5H，m)，7.48(1H，s)，8.38(1H，d，J= 2 Hz)，8.53(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 485.

例 333

將 5-[7-乙基-2-(羥甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(100 mg)，1H-異吲哚-1，3(2H)二酮

(44.6 mg)，偶氮二羧酸二異丙酯(76.7 mg)及三苯膦(99.5 mg)溶在四氫呋喃(2 mL)，於室溫下攪拌 1 小時。蒸發溶劑，以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=20:1-1:1)可得 5-[2-[(1，3-二氧-1，3-二氫-2H-異吲哚-2-基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯黃色油(107 mg)。

5-[2-[(1，3-二氧-1，3-二氫-2H-異吲哚-2-基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.89(3H，t，J= 7 Hz)，1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.20-1.40(2H，m)，1.53-1.75(2H，m)，2.24(2H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，2.47(2H，q，J= 7 Hz)，2.50-2.64(2H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，5.10(2H，s)，5.85(1H，d，J= 4 Hz)，6.43(1H，d，J= 4 Hz)，7.51(1H，s)，7.78(2H，m)，7.96(2H，m)，8.43(1H，s)，8.55(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 525.

例 334

將 5-[2-[(1，3-二氧-1，3-二氫-2H-異吲哚-2-基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(107 mg)及肼單水合物(51.1 mg)溶在乙醇(2 mL)，加熱回流 2 小時。蒸發溶劑，將殘渣分層於氯仿及飽和重碳酸鈉溶液。分離有機層，清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 5-[2-(胺甲基)-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯黃色油(67.6 mg)。

5-[2-(胺甲基)-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]

嗒吡-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.38-1.62(4H，m)，2.14(2H，t，J= 7 Hz)，2.42(3H，s)，2.38-2.56(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，4.06(2H，s)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，5.90(1H，d，J= 4 Hz)，6.55(1H，d，J= 4 Hz)，7.51(1H，s)，8.41(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 395.

例 335

將 5-[2-(胺甲基)-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸乙酯(67.6 mg)及乙酐(19.2 mg)溶在二氯甲烷(3 mL)，於室温下攪拌 1 小時。稀釋以氯仿，清洗以飽和重碳酸鈉溶液及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以製備性矽膠柱層析純化，溶離以氯仿及甲醇(20:1)可得 5-[2-[(乙醯胺基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸乙酯黃色油(70 mg)。

5-[2-[(乙醯胺基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.40(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.63(4H，m)，2.12(2H，m)，2.15(3H，s)，2.43(3H，s)，2.40-2.53(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，4.66(2H，m)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.59(1H，d，J= 4 Hz)，6.85(1H，br)，7.50(1H，s)，8.40(1H，d，J= 2 Hz)，8.54(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 437.

例 336

將 5-[2-(胺甲基)-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(80 mg)及吡啶(1 mL)溶在二氯甲烷(2 mL)，於冰浴冷卻下加入甲磺醯氯(34.8 mg)，室溫下攪拌1小時。稀釋以氯仿，清洗以飽和重碳酸鈉溶液及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以製備性矽膠柱層析純化，溶離以氯仿及甲醇(20:1)可得 5-(7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-{[(甲磺醯基)胺基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯黃色油(62.8 mg)

5-(7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-{[(甲磺醯基)胺基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.62(4H，m)，2.19(2H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，2.38-2.51(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.06(3H，s)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.58(2H，s)，5.63(1H，br)，5.97(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.50(1H，s)，8.41(1H，d，J= 2 Hz)，8.54(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 473.

例 337

將 5-[2-(胺甲基)-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(75 mg)，苄酸(27.9 mg)，1-乙基-3-(3'-二甲胺丙基)碳化二亞胺鹽酸鹽(54.7 mg)及 1-羥苯并三唑(38.5 mg)溶在二甲基甲醯胺(2 mL)，於室溫下攪拌 2 小時。分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以飽和重碳酸

鈉溶液，水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以製備性矽膠柱層析純化，溶離以氯仿及甲醇(20:1)可得5-[2-[(苄醯胺基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯黃色油(60 mg)。

5-[2-[(苄醯胺基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.42(3H，t，J= 7 Hz)，1.42-1.65(4H，m)，2.17(2H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，2.44-2.58(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.86(2H，m)，5.96(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.46-7.59(4H，m)，7.78(1H，br)，7.91-7.97(2H，m)，8.44(1H，d，J= 2 Hz)，8.56(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 499.

下列化合物可仿例337之方法製備。

例 338

5-(7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-{[(2-吡咿羰基)胺基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.41(3H，t，J= 7 Hz)，1.42-1.64(4H，m)，2.18(2H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，2.47-2.59(2H，m)，3.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.09(2H，q，J= 7 Hz)，4.89(2H，d，J= 7 Hz)，5.96(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.53(1H，s)，8.43(1H，d，J= 2 Hz)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.62(1H，m)，8.79(1H，m)，9.15(1H，br)，9.46(1H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 501.

例 339

將 5-[2-(胺甲基)-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(80 mg)及吡啶(1 mL)溶在二氯甲烷(2 mL)，於冰浴冷卻下加入氯碳酸甲酯(34.8 mg)，於室溫下攪拌 2 小時。蒸發溶劑，分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以飽和重碳酸鈉溶液及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以製備性矽膠柱層析純化，溶離以氯仿及甲醇(20:1)可得 5-[7-乙基-2-{[(甲氧羰基)胺基]甲基}-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯黃色油(70 mg)。

5-[7-乙基-2-{[(甲氧羰基)胺基]甲基}-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.63(4H，m)，2.19(2H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，2.40-2.55(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.07(3H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.57(2H，m)，5.72(1H，br)，5.97(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.51(1H，s)，8.41(1H，s)，8.56(1H，s).

例 340

將 5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(70.0 mg)及三乙胺(18.5 mg)溶在二氯甲烷(1 mL)，於冰浴下加入甲磺醯氯(20.9 mg)。攪拌 1 小時，加入 1-甲哌咿(27.0 mg)。於冰浴下攪拌 0.5 小時，於室溫下

攪拌過夜。分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。製備性矽膠薄層層析純化(氯仿-甲醇 = 20-1)可得 5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-甲基-1-哌啡基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒啡-3-基}戊酸乙酯之黃色膠(52.4 mg，63.5%)。

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-甲基-1-哌啡基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒啡-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)：1.23(3H，t，J = 7 Hz)，1.33-1.60(7小時，m)，2.16(2H，t，J = 7 Hz)，2.29(3H，s)，2.34-2.65(6H，m)，3.00(2H，q，J = 7 Hz)，3.54(2H，s)，4.08('2H，q，J = 7 Hz)，5.86(1H，d，J = 5 Hz)，6.55(1H，d，J = 5 Hz9，7.87(1H，m)，8.54(1H，m)，8.77(1H，m).

例 341

將 5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒啡-3-基]戊酸乙酯(300 mg，0.652 mmol)及四溴甲烷(432 mg，1.30 mmol)溶在四氫呋喃(3 mL)，於 40 分鐘內加入三苯膦(308 mg，1.17 mmol)。濃縮，將殘渣以驟矽膠柱層析純化(乙酸乙酯-己烷 = 1-8～1-5)可得 5-[2-(溴甲基)-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒啡-3-基]戊酸乙酯之黃色膠(229 mg，50.4%)。

5-[2-(溴甲基)-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒啡-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.41-1.50(4H，m)，2.19(2H，t，J = 7 Hz)，2.58(2H

，m)，3.01(2H，q，J = 7 Hz)，4.08(2H，q，J = 7 Hz)，4.66(2H，s)，5.94(1H，d，J = 5 Hz)，6.63(1H，d，J = 5 Hz)，7.88(1H，m)，8.55(1H，m)，8.79(1H，m).

例 342

將 5-[2-(溴甲基)-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(70.0 mg)及氰化鉀(13.1 mg)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(1 mL)，於室溫下攪拌 28 小時。分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以水(2 次)，食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-2-(氰甲基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯之黃色膠(28.8 mg，45.9%)。

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-2-(氰甲基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J = 7 Hz)，1.46-1.65(7H，m)，2.22(2H，t，J = 7 Hz)，2.48(2H，m)，3.04(2H，q，J = 7 Hz)，3.98(2H，s)，4.10(2H，q，J = 7 Hz)，5.98(1H，d，J = 5 Hz)，6.65(1H，d，J = 5 Hz)，7.88(1H，m)，8.55(1H，m)，8.81(1H，m)。

下列化合物可仿例 76 之方法製備。

例 343

[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J= 7 Hz)，2.45(3H，s)，2.56(3H，s)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.28(1H，d，J= 17 Hz)

，3.53(1H，d，J= 17 Hz)，5.91(1H，d，J= 4 Hz)，6.52(1H，d，J= 4 Hz)，7.71(1H，s)，8.47(1H，s)，8.59(1H，s).

MS(ESI$^-$)：m/z 308，MS(ESI$^+$)：m/z 310.

例 344

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.65-1.85(2H，m)，2.31(2H，t，J= 7 Hz)，2.45-2.63(2H，m)，2.59(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.53(1H，d，J= 4 Hz)，7.90(1H，s)，8.53(1H，s)，8.75(1H，s).

MS(ESI$^-$)：m/z 400 402，MS(ESI$^+$)：m/z 402 404.

例 345

4-[4-(5-乙醯基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.68-1.82(2H，m)，2.26(2H，t，J= 7 Hz)，2.45-2.58(2H，m)，2.60(3H，s)，2.70(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，5.83(1H，d，J= 4 Hz)，6.54(1H，d，J= 4 Hz)，8.28(1H，m)，8.77(1H，d，J= 2 Hz)，9.19(1H，d，J= 2 Hz).

例 346

3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.49(2H，t，J= 7 Hz)，2.80-3.00(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，3.46(3H，

s)，4.66(2H，s)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.88(1H，s)，8.55(1H，s)，8.77(1H，s).

MS(ESI⁻)：m/z 416 418，MS(ESI⁺)：m/z 418 420.

例 347

3-[4-(5-乙醯基-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.48(2H，t，J= 7 Hz)，2.68(3H，s)，2.85-2.97(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，3.47(3H，s)，4.67(2H，s)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，8.27(1H，m)，8.78(1H，d，J= 2 Hz)，9.23(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI⁻)：m/z 380，MS(ESI⁺)：m/z 382.

例 348

3-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-乙烯基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.46-2.58(2H，m)，2.83-3.03(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，3.47(3H，s)，4.68(2H，s)，5.46(1H，d，J= 11 Hz)，5.88(1H，d，J= 18 Hz)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，6.68-6.82(1H，dd，J= 11 Hz，18 Hz)，7.78(1H，m)，8.47(1H，d，J= 2 Hz)，8.68(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI⁻)：m/z 364，MS(ESI⁺)：m/z 366.

例 349

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]

嗒 咿-3-基]丁 酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.68-1.82(2H，m)，2.29(2H，t，J= 7 Hz)，2.55-2.75(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，3.45(3H，s)，4.64(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.91(1H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.77(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^-)：m/z 430 432，MS(ESI^+)：m/z 432 434.

例 350

4-[7-乙 基 -2-(甲 氧 甲 基)-4-(5-乙 烯 基 -3-吡 啶 基)吡 咯 并 [1，2-b]嗒 咿-3-基]丁 酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.72-1.87(2H，m)，2.26(2H，t，J= 7 Hz)，2.53-2.80(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，3.46(3H，s)，4.68(2H，m)，5.47(1H，d，J= 11 Hz)，5.88(1H，d，J= 18 Hz)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.59(1H，d，J= 4 Hz)，6.72-6.83(1H，dd，J= 11 Hz，18 Hz)，7.81(1H，m)，8.50(1H，d，J= 2 Hz)，8.63(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^-)：m/z 378，MS(ESI^+)：m/z 380.

例 351

4-[4-(5-乙 醯 基 -3-吡 啶 基)-7-乙 基 -2-(甲 氧 甲 基)吡 咯 并 [1，2-b]嗒 咿-3-基]丁 酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.66-1.83(2H，m)，2.26(2H，t，J= 7 Hz)，2.55-2.70(2H，m)，2.70(3H，s)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，3.46(3H，s)，4.67(2H，s)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，8.29(1H，m)，8.80(1H

，d，J= 2 Hz)，9.22(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI⁻)：m/z 394，MS(ESI⁺)：m/z 396.

例 352

5-[4-(5-胺基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.34(3H，t，J= 7 Hz)，1.44-1.65(4H，m)，2.16-2.32(2H，m)，2.34-2.46(2H，m)，2.53(3H，s)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，5.06(2H，br)，5.86(1H，d，J= 4 Hz)，5.98(1H，d，J= 4 Hz)，7.45(1H，s)，7.84(1H，s)，8.58(1H，s).

MS(ESI⁻)：m/z 351，MS(ESI⁺)：m/z 353.

例 353

5-{4-[5-(二甲胺基)-3-吡啶基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.70(4H，m)，2.23(2H，m)，2.36-2.50(2H，m)，2.56(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.06(6H，s)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.53(1H，d，J= 4 Hz)，7.13(1H，s)，7.90(1H，s)，8.14(1H，m).

MS(ESI⁺)：m/z 381.

例 354

3-[4-(5-乙醯基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.40-2.53(2H，m)，2.60(3H，s)，2.68(3H，s)，2.83(2H，t，J= 7 Hz)，3.03(2H

，q，J= 7 Hz)，5.83(1H，d，J= 4 Hz)，6.53(1H，d，J= 4 Hz)，8.27(1H，m)，8.78(1H，d，J= 2 Hz)，9.22(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^-$)：m/z 350，MS(ESI$^+$)：m/z 352.

例 355

5-[2-[(苄氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.35-1.55(4H，m)，2.05-2.20(2H，m)，2.42(3H，s)，2.40-2.70(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.63(2H，s)，4.74(2H，m)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.27-7.42(5H，m)，7.53(1H，s)，8.40(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 458.

例 356

3-[2-[(苄氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.40(3H，s)，2.40-2.54(2H，m)，2.80-3.08(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.65(2H，s)，4.77(2H，m)，5.89(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.26-7.42(5H，m)，7.54(1H，s)，8.39(1H，d，J= 2 Hz)，8.48(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^-$)：m/z 428，MS(ESI$^+$)：m/z 430.

例 357

5-[2-[(環己氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20-1.45(6H，m)，1.36(3H，t，J= 7 Hz)，1.45-1.63(4H，m)，1.70-1.83(2H，m)，1.95-2.08(2H，m)，2.14-2.28(2H，m)，2.42(3H，s)，2.46-2.60(1H，m)，2.60-2.75(1H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.42-3.54(1H，m)，4.72(2H，m)，5.87(1H，d，J= 4 Hz)，6.54(1H，d，J= 4 Hz)，7.55(1H，s)，8.41(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI^-)：m/z 448，MS(ESI^+)：m/z 450.

例 358

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(環己氧基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.18-1.60(10H，m)，1.36(3H，t，J= 7 Hz)，1.70-1.80(2H，m)，1.95-2.05(2H，m)，2.22(2H，t，J= 7 Hz)，2.50-2.70(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.42-3.53(1H，m)，4.68(2H，s)，5.89(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.88(1H，s)，8.54(1H，d，J= 2 Hz)，8.77(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 514 516.

例 359

3-[2-[(環己氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20-1.45(5H，m)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.50-1.60(1H，m)，1.72-1.84(2H，m)，1.96-2.08(2H，m)，2.42(3H，s)，2.48-2.62(2H，m)，2.80-3.10(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.44-3.66(1H，m)，4.73(2H，s)，5.88(1H

，d，J= 4 Hz)，6.57(1H，d，J= 4 Hz)，7.55(1H，s)，8.40(1H，s)，8.51(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 422.

例 360

3-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(環己氧基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.18-1.47(5H，m)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.52-1.63(1H，m)，1.72-1.85(2H，m)，1.97-2.07(2H，m)，2.48-2.62(2H，m)，2.80-3.10(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.44-3.57(1H，m)，4.73(2H，s)，5.91(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.88(1H，t，J= 2 Hz)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.77(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^-$)：m/z 484 486，MS(ESI$^+$)：m/z 486 488.

例 361

5-[7-乙基-2-(異丙氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(6H，d，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.44-1.63(4H，m)，2.15-2.27(2H，m)，2.43(3H，s)，2.47-2.60(1H，m)，2.60-2.73(1H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.75-3.87(1H，m)，4.67(2H，s)，5.87(1H，d，J= 4 Hz)，6.56(1H，d，J= 4 Hz)，7.55(1H，s)，8.41(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI$^-$)：m/z 408，MS(ESI$^+$)：m/z 410.

例 362

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(異丙氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(6H，d，J= 7 Hz)，1.36(3H，t，J= 7 Hz)，1.45-1.65(4H，m)，2.23(2H，t，J= 7 Hz)，2.50-2.60(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.75-3.85(1H，m)，4.66(2H，s)，5.89(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.89(1H，m)，8.54(1H，d，J= 2 Hz)，8.77(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 474 476.

例 363

5-[7-乙基-2-(羥甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.65(4H，m)，2.22(2H，t，J= 7 Hz)，2.33-2.45(2H，m)，2.43(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.87(2H，s)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.57(1H，d，J= 4 Hz)，7.56(1H，s)，8.43(1H，s)，8.54(1H，s).

MS(ESI$^-$)：m/z 366，MS(ESI$^+$)：m/z 368.

例 364

5-(7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-{[2-(4-嗎啉基)-2-氧乙氧基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.63(4H，m)，2.22(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.50-2.72(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.51(2H，m)，3.57-3.75(6H，m)，4.32(2H，s)，4.70-4.86(2H，m)，5.90(1H，d，J= 4 Hz)

，6.59(1H，d，J= 4 Hz)，7.53(1H，s)，8.42(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI⁻)：m/z 493，MS(ESI⁺)：m/z 495.

例 365

5-[7-乙基-2-{[2-(甲胺基)-2-氧乙氧基]甲基}-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.65(4H，m)，2.22(2H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，2.45-2.64(2H，m)，2.87(3H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.13(2H，s)，4.74(2H，m)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，6.83(1H，br)，7.57(1H，s)，8.42(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI⁻)：m/z 437，MS(ESI⁺)：m/z 439.

例 366

5-[2-[(環丙基甲氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.23-0.33(2H，m)，0.55-0.64(2H，m)，1.07-1.22(1H，m)，1.36(3H，t，J= 7 Hz)，1.45-1.68(4H，m)，2.19(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.50-2.75(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.40(2H，d，J= 7 Hz)，4.70(2H，m)，5.87(1H，d，J= 4 Hz)，6.56(1H，d，J= 4 Hz)，7.57(1H，s)，8.40(1H，s)，8.54(1H，s).

MS(ESI⁺)：m/z 422.

例 367

5-[2-[(環己基甲氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)

吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.87-1.04(2H，m)，1.10-1.82(13H，m)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.18(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.47-2.72(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.33(2H，d，J= 7 Hz)，4.63(2H，m)，5.87(1H，d，J= 4 Hz)，6.56(1H，d，J= 4 Hz)，7.56(1H，s)，8.42(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI^-)：m/z 462，MS(ESI^+)：m/z 464.

例 368

5-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(3-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.35-1.57(4H，m)，2.13(2H，t，J= 7 Hz)，2.42(3H，s)，2.47-2.66(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.68(2H，s)，4.77(2H，m)，5.90(1H，d，J= 4 Hz)，6.59(1H，d，J= 4 Hz)，7.28-7.36(1H，m)，7.53(1H，s)，7.73(1H，d，J= 8 Hz)，8.41(1H，d，J= 2 Hz)，8.53(2H，m)，8.63(1H，s).

MS(ESI^-)：m/z 457，MS(ESI^+)：m/z 459.

例 369

5-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(2-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.45-1.65(4H，m)，2.23(2H，t，J= 7 Hz)，2.41(3H，s)，2.48-2.74(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.80(2H，s)，4.82(2H，m)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.57(1H，d，J= 4 Hz)，7.26(1H，

m)，7.47-7.53(2H，m)，7.69-7.77(1H，m)，8.42(1H，d，J= 2 Hz)，8.50(1H，d，J= 2 Hz)，8.58(1H，d，J= 7 Hz).

MS(ESI$^-$)：m/z 457，MS(ESI$^+$)：m/z 459.

例 370

5-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.62(4H，m)，2.16(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.48-2.71(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，4.68(2H，s)，4.79(2H，m)，5.91(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.32(2H，d，J= 7 Hz)，7.54(1H，s)，8.42(1H，d，J= 2 Hz)，8.54(1H，d，J= 2 Hz)，8.55(2H，d，J= 7 Hz).

MS(ESI$^-$)：m/z 457，MS(ESI$^+$)：m/z 459.

例 371

5-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(2-吡咿甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.45-1.62(4H，m)，2.18(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.48-2.73(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.83(2H，s)，4.88(2H，m)，5.90(1H，d，J= 4 Hz)，6.59(1H，d，J= 4 Hz)，7.54(1H，s)，8.42(1H，s)，8.48-8.56(3H，m)，8.76(1H，s).

MS(ESI$^-$)：m/z 458，MS(ESI$^+$)：m/z 460.

例 372

5-[2-[(苄胺基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并

[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸

^{1}H NMR(DMSO-d_6)δ 1.33(3H，t，J= 7 Hz)，1.28-1.48(4H，m)，2.03-2.13(2H，m)，2.30-2.45(2H，m)，2.40(3H，s)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.37(2H，s)，4.46(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.68(1H，d，J= 4 Hz)，7.40-7.52(3H，m)，7.56-7.67(3H，m)，8.36(1H，d，J= 2 Hz)，8.57(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 457.

例 373

5-[2-[(乙醯胺基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.40(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.64(4H，m)，2.16(3H，s)，2.23(2H，t，J= 7 Hz)，2.35-2.50(2H，m)，2.43(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.63-4.72(2H，m)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.57(1H，d，J= 4 Hz)，6.88-6.97(1H，br)，7.53(1H，s)，8.41(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI$^-$)：m/z 407，MS(ESI$^+$)：m/z 409.

例 374

5-(7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-{[(甲磺醯基)胺基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基)戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.46-1.66(4H，m)，2.23(2H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，2.39-2.53(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.05(3H，s)，4.57(2H，s)，5.72(1H，br)，5.96(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.54(1H

，s)，8.41(1H，d，J= 2 Hz)，8.55(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI⁻)：m/z 443，MS(ESI⁺)：m/z 445.

例 375

5-[2-[(苄醯胺基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.42(3H，t，J= 7 Hz)，1.50-1.68(4H，m)，2.25(2H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，2.40-2.60(2H，m)，3.07(2H，q，J= 7 Hz)，4.89(2H，m)，5.95(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.46-7.60(4H，m)，7.83(1H，br)，7.93(2H，d，J= 8 Hz)，8.44(1H，d，J= 2 Hz)，8.56(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI⁻)：m/z 469，MS(ESI⁺)：m/z 471.

例 376

5-(7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-{[(2-吡咿羰基)胺基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.41(3H，t，J= 7 Hz)，1.51-1.72(4H，m)，2.24(2H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，2.45-2.58(2H，m)，3.10(2H，q，J= 7 Hz)，4.90(2H，m)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.59(1H，d，J= 4 Hz)，7.55(1H，s)，8.43(1H，s)，8.53(1H，s)，8.62(1H，m)，8.79(1H，d，J= 2 Hz)，9.20(1H，br)，9.45(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI⁻)：m/z 471，MS(ESI⁺)：m/z 473.

例 377

5-[7-乙基-2-{[(甲氧羰基)胺基]甲基}-4-(5-甲基-3-吡啶

基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.45-1.65(4H，m)，2.23(2H，t，J= 7 Hz)，2.40-2.53(2H，m)，2.44(3H，s)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.05(3H，s)，4.58(2H，s)，5.69(1H，br)，5.96(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.53(1H，s)，8.41(1H，d，J= 2 Hz)，8.54(1H，d，J= 2 Hz).

例 378

將 7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯(682 mg)溶在乙醇(20 mL)，加入氫氧化鉀(5 g)溶液(10 mL)，加熱回流 1 小時。酸化以 1 N HCl 至 pH 3-4，稀釋以食鹽水，萃取以氯仿 2 次。分離有機層，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將固體碾製以乙酸乙酯可得 7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸黃色粉(590 mg)

7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.39(3H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，2.69(3H，s)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，6.29(1H，d，J= 4 Hz)，6.67(1H，d，J= 4 Hz)，7.97(1H，s)，8.41(1H，s)，8.58(1H，s).

MS(ESI^-)：m/z 294，MS(ESI^+)：m/z 296.

下列化合物可仿例 175 之方法製備。

例 379

5-[4-(3-氰苯基)-2-(乙氧甲基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒

咁-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J = 7 Hz)，1.34-1.53(7H，m)，2.20(2H，t，J = 7 Hz)，2.53(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.62(2H，q，J = 7 Hz)，4.66(2H，s)，5.33(1H，d，J = 5 Hz)，6.57(1H，d，J = 5 Hz)，7.60(2H，m)，7.66(1H，s)，7.74(1H，m)

例 380

5-[2-[(苄氧基)甲基]-4-(3-氰苯基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咁-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.30-1.46(7H，m)，2.11(2H，t，J = 7 Hz)，2.50(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，4.64(3H，s)，4.71(3H，s)，5.83(1H，d，J = 5 Hz)，6.56(1H，d，J = 5 Hz)，7.25-7.34(5H，m)，7.57(2H，d，J = 9 Hz)，7.65(1H，s)，7.74(1H，m)。

MS(ESI$^+$)：m/z 468(M + H)

例 381

4-({[3-(4-羧丁基)-4-(3-氰苯基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咁-2-基]甲氧基}甲基)苄酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.05-1.43(7H，m)，1.92(2H，m)，2.31(2H，m)，3.04(2H，m)，4.65(2H，s)，4.72(2H，s)，5.82(1H，m)，6.58(1H，m)，7.46-7.77(6H，m)，8.09(2H，d，J = 8 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 510(M-H)

例 381-2

4-({[4-[3-(胺甲醯基)苯基]-3-(4-羧丁基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-2-基]甲氧基}甲基)苄酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.20-1.45(7H，m)，2.03(2H，m)，2.52(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，4.69(2H，s)，4.73(2H，s)，5.36(1H，d，J = 5 Hz)，6.57(1H，d，J = 5 Hz)，7.39-7.60(4H，m)，7.77(1H，s)，7.93(1H，d，J = 8 Hz)，7.98(2H，d，J = 8 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 528(M-H)

下列化合物可仿例 77 之方法製備。

例 382

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-甲基-1-哌咿基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.34(3H，t，J = 7 Hz)，1.38-1.59(4H，m)，2.22(2H，m)，2.43-2.60(5H，m)，2.83-3.04(8H，m)，3.74(3H，s)，5.88(1H，d，J = 5 Hz)，6.56(1H，d，J = 5 Hz)，7.87(1H，m)，8.54(1H，m)，8.76(1H，m).

例 383

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-2-(氰甲基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.35-1.60(7H，m)，2.27(2H，m)，2.46(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.98(2H，s)，3.97(1H，d，J = 5 Hz)，6.65(1H，d，J = 5 Hz)，7.90(1H，m)，8.54(1H，s，br)，8.79(1H，s，br)。

例 384

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.35-1.60(7H，m)，2.22(2H，t，J = 7 Hz)，2.38(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，4.86(2H，s)，5.95(1H，d，J = 5 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，7.88(1H，m)，8.54(1H，s，br)，8.79(1H，s，br).

例 385

將 7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸(70 mg)，1-乙基-3-(3'-二甲胺丙基)碳化二亞胺鹽酸鹽(68.2 mg)及 1-羥苯并三唑(48 mg)溶在二甲基甲醯胺(2 mL)，加入 2-胺乙醇(17.4 mg)，於室溫下攪拌 1 小時。分層於乙酸乙酯及水。分離有機層，清洗以飽和重碳酸鈉溶液，水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(氯仿及甲醇=50:1-10:1)。將固體碾製以異丙醚可得 7-乙基-N-(2-羥乙基)-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧醯胺之黃色粉(47 mg)。

7-乙基-N-(2-羥乙基)-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧醯胺

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.39(3H，s)，2.57(3H，s)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.33(2H，m)，3.45(2H，m)，6.03(1H，br)，6.31(1H，d，J= 4 Hz)，6.66(1H，d，J= 4 Hz)，7.71(1H，s)，8.47(1H，s)，8.58(1H，s).

MS(ESI^-)：m/z 337，MS(ESI^+)：m/z 339.

下列化合物可仿例 385 之方法製備。

例 386

N-丁基-7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧醯胺

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.80(3H，t，J= 7 Hz)，0.96-1.08(2H，m)，1.08-1.25(2H，m)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.40(3H，s)，2.56(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.16(2H，m)，5.36(1H，br)，6.31(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.69(1H，s)，8.53(1H，s)，8.62(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 351.

例 387

3-({[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]羰基}胺基)丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.21(2H，t，J= 7 Hz)，2.40(3H，s)，2.55(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.43(2H，q，J= 7 Hz)，4.04(2H，q，J= 7 Hz)，6.08(1H，br)，6.30(1H，d，J= 4 Hz)，6.65(1H，d，J= 4 Hz)，7.67(1H，s)，8.50(1H，d，J= 1 Hz)，8.60(1H，d，J= 1 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 395.

下列化合物可仿製備例 176 之方法製備。

例 388

4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲基-3-[3-(4-嗎啉基)-3-氧丙基]吡咯并[1，2-b]嗒咿

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ：^{1}H NMR($CDCl_3$)δ：1.37(3H，t，J=7Hz)

，2.41(2H，t，J=7Hz)，2.60(3H，s)，2.72-2.82(2H，m)，3.01(2H，q，J=7Hz)，3.19(2H，t，J=5Hz)，3.55(4H，t，J=5Hz)，3.63(2H，t，J=5Hz)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.55(1H，d，J=4Hz)，7.87(1H，t，J=1Hz)，8.54(1H，d，J=1Hz)，8.77(1H，d，J=1Hz)

MS(m/z)457(M^+)，459(M++2)，115(bp)

熔點：178-180℃

例 389

3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-N-甲基丙醯胺

^{1}H NMR($CDCl_3$) δ：^{1}H NMR($CDCl_3$)δ： 1.38(3H，t，J=7Hz)，2.20(2H，t，J=7Hz)，2.60(3H，s)，2.75(3H，d，J=6Hz)，2.78-2.89(2H，m)，3.01(2H，q，J=7Hz)，5.21-5.27(1H，m)，5.88(1H，d，J=4Hz)，6.54(1H，d，J=4Hz)，7.86(1H，t，J=1Hz)，8.53(1H，d，J=1Hz)，8.78(1H，d，J=1Hz)

MS(m/z)401(M^++1)，403(M^++1)，115(bp)

熔點：172-174℃

下列化合物可仿例 263 之方法製備。

例 390

N-{3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙醯基}甲磺醯胺

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ:1.36(3H，t，J=7Hz)，2.33-2.45(2H，m)，2.58(3H，s)，2.84-2.95(2H，m)，3.01(2H，q，J=7Hz)，3.26(3H，s)，5.89(1H，d，J=4Hz)，6.56(1H，d，J=4Hz)，

7.90(1H，s)，8.50(1H，s)，8.77(1H，s)

MS(m/z)465(M+，bp)，467(M+-2，bp)

熔點：196.5-197.5℃

下列化合物可仿例224之方法製備。

例391

2-[{3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙醯基}(甲基)胺基]乙磺酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.32(3H，t，J = 7 Hz)，1.90 2H，m)，2.26(3H，s)，2.57-2.2.78(4H，m)，2.98(2H，q，J = 7 Hz)，3.31(2H，m)，6.00(1H，d，J = 5 Hz)，6.61(1H，d，J = 5 Hz)，7.20-7.52(5H，m).

下列化合物之製備可仿製備例20之方法來進行。

製備例217

2-(異丁氧乙醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.95(6H，d，J = 7 Hz)，1.27(3H，t，J = 7 Hz)，1.31-1.41(2H，m)，1.46(9H，s)，1.66(2H，tt，J = 7，7 Hz)，1.75-1.98(3H，m)，2.31(2H，t，J = 8 Hz)，3.26(2H，d，J = 7 Hz)，3.56(1H，t，J = 7 Hz)，4.06-4.17(4H，m).

製備例218

2-(異丁氧乙醯基)己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.93(6H，d，J = 7 Hz)，1.25(3H，t，J = 7 Hz)，1.45(9H，s)，1.59-1.69(2H，m)，1.80-1.95(3H，m)，2.32(2H，t，J = 7 Hz)，2.25(2H，d，J = 7 Hz)，3.57(1H

，t，J = 7 Hz)，4.10(2H，s)，4.12(2H，q，J = 7 Hz).

下列化合物之製備可仿製備例 24 之方法來進行。

製備例 219

2-乙醯基-2-(2-氯異菸鹼醯基)己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.34(9H，s)，1.60-1.73(2H，m)，2.22-2.32(2H，m)，2.39(2H，t，J= 7 Hz)，2.49(3H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，7.43(1H，d，J= 5 Hz)，7.57(1H，s)，8.50(1H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 412.

製備例 220

2-乙醯基-2-(2-氯異菸鹼醯基)戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.72-1.84(2H，m)，2.33(2H，t，J= 7 Hz)，2.47-2.57(2H，m)，2.58(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.53(1H，d，J= 4 Hz)，7.27(1H，m)，7.38(1H，s)，8.53(1H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI^-)：m/z 356，MS(ESI^+)：m/z 358.

製備例 221

2-(2-氯異菸鹼醯基)-2-(苯乙醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.35(9H，s)，1.63-1.76(2H，m)，2.22-2.37(4H，m)，3.93(1H，d，J= 17 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.29(1H，d，J= 17 Hz)，7.22(2H，d，J= 8 Hz)，7.26-7.36(4H，m)，7.50(1H，s)，8.42(1H

，d，J= 5 Hz)。

MS(ESI$^+$)：m/z 502.

製備例 222

2-[2-(2-甲氧基-2-氧乙氧基)乙基]-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-3-氧丁酸第三丁酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.33(9H，s)，2.39(3H，s)，2.47(3H，s)，2.62(2H，t，J= 7 Hz)，3.66(2H，m)，3.70(3H，s)，3.90(2H，s)，7.87(1H，s)，8.56(1H，s)，8.75(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 394.

製備例 223

2-乙醯基-2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]丁二酸 1-第三丁酯 4-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.27(3H，t，J= 7 Hz)，1.41(9H，s)，2.45(3H，s)，3.22(2H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，8.22(1H，m)，8.80(1H，m)，8.82(1H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 428 430.

製備例 224

2-[(乙醯氧基)乙醯基]-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.35(9H，s)，2.14(3H，s)，2.40(3H，s)，2.40-2.48(2H，m)，2.62-2.70(2H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，5.12(1H，d，J= 18 Hz)，5.34(1H，d，J= 18 Hz)，7.85(1H，s)，8.58(1H，s)，8.78(1H，s)。

MS(ESI$^+$)：m/z 436.

製備例 225

2-[(乙醯氧基)乙醯基]-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.34(9H，s)，1.60-1.75(2H，m)，2.14(3H，s)，2.26-2.39(4H，m)，2.40(3H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，5.13(1H，d，J= 18 Hz)，5.40(1H，d，J= 18 Hz)，7.86(1H，s)，8.57(1H，s)，8.78(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 450.

製備例 226

2-[(乙醯氧基)乙醯基]-2-(3-氰苄醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.32(9H，s)，1.26-1.46(2H，m)，1.66-1.77(2H，m)，2.14(3H，s)，2.26-2.38(4H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，5.06(1H，d，J= 18 Hz)，5.42(1H，d，J= 18 Hz)，7.57(1H，t，J= 8 Hz)，7.81(1H，d，J= 8 Hz)，7.92(1H，d，J= 8 Hz)，8.09(1H，s).

製備例 227

2-[(乙醯氧基)乙醯基]-2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.36(9H，s)，1.60-1.74(2H，m)，1.85-1.96(2H，m)，2.14(3H，s)，2.28-2.42(2H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，5.12(1H，d，J= 17 Hz)，5.42(1H，d，J= 17 Hz)，8.23(1H，m)，8.81(1H，

m)，8.83(1H，m).

製備例 228

2-[(乙醯氧基)乙醯基]-2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(9H，s)，2.14(3H，s)，2.41-2.51(2H，m)，2.66(2H，t，J= 7 Hz)，4.13(2H，q，J= 7 Hz)，5.11(1H，d，J= 18 Hz)，5.33(1H，d，J= 18 Hz)，8.22(1H，m)，8.82(2H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 500 502.

製備例 229

2-[(環己基甲氧基)乙醯基]-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.80-0.98(2H，m)，1.00-1.32(3H，m)，1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(9H，s)，1.46-1.62(6H，m)，2.39(3H，s)，2.40-2.72(4H，m)，3.19(2H，d，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.31(1H，d，J= 17 Hz)，4.39(1H，d，J= 17 Hz)，7.88(1H，s)，8.56(1H，s)，8.77(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 490.

製備例 230

2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-2-[(環己基甲氧基)乙醯基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.78-0.98(2H，m)，1.10-1.33(3H，m)，1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.40(9H，s)，1.38-1.83(6H，m)，2.35-2.75(4H，m)，3.22(2H，d，J= 7 Hz)，4.12(2H，q

，J= 7 Hz)，4.25(1H，d，J= 17 Hz)，4.37(1H，d，J= 17 Hz)，8.22(1H，s)，8.78(1H，s)，8.86(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 554 556.

製備例 231

2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-2-[(環己基甲氧基)乙醯基]己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.80-0.97(2H，m)，1.12-1.35(3H，m)，1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(9H，s)，1.46-1.80(10H，m)，2.22-2.45(2H，m)，3.20(2H，d，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.30(1H，d，J= 17 Hz)，4.38(1H，d，J= 17 Hz)，8.22(1H，s)，8.78(1H，s)，8.85(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 568 570.

製備例 232

2-[(環丙基甲氧基)乙醯基]-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.16-0.28(2H，m)，0.48-0.59(2H，m)，0.98-1.12(1H，m)，1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(9H，s)，1.55-1.80(4H，m)，2.18-2.40(2H，m)，2.39(3H，s)，3.31(2H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.38(1H，d，J= 17 Hz)，4.53(1H，d，J= 17 Hz)，7.88(1H，s)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.75(1H，d，J= 2 Hz)。

MS(ESI$^+$)：m/z 462.

製備例 233

2-[(環丙基甲氧基)乙醯基]-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]戊

二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.15-0.23(2H，m)，0.48-0.56(2H，m)，0.95-1.10(1H，m)，1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(9H，s)，2.39(3H，s)，2.40-2.68(4H，m)，3.28(2H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.36(1H，d，J= 17 Hz)，4.48(1H，d，J= 17 Hz)，7.88(1H，s)，8.55(1H，s)，8.75(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 448.

製備例 234

2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-2-[(2-甲氧乙氧基)乙醯基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.46(9H，s)，2.15-2.25(2H，m)，2.42-2.72(2H，m)，3.38(3H，s)，3.48-3.72(4H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.43(1H，d，J= 17 Hz)，4.58(1H，d，J= 17 Hz)，8.22(1H，s)，8.78(1H，s)，8.82(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 516 518.

製備例 235

2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-3-氧丁酸第三丁酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22，1.30(9H，s)，2.22，2.45(3H，s)，7.96，8.13(1H，s)，8.66，8.76-8.80(2H，m).

製備例 236

2-[(乙醯氧基)乙醯基]-2-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J = 7 Hz)，

1.36(9H，s)，1.63-1.71(2H，m)，2.14(3H，s)，2.27-2.40(4H，m)，4.13(2H，q，J = 7 Hz)，5.11(1H，d，J = 18 Hz)，5.38(1H，d，J = 18 Hz)，8.07(1H，dd，J = 2 Hz)，8.71(1H，d，J = 2 Hz)，8.80(1H，d，J = 2 Hz).

製備例 237

2-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]-2-[(環丙基甲氧基)乙醯基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.15-0.20(2H，m)，0.49-0.58(2H，m)，0.95-1.04(1H，m)，1.24(3H，t，J = 7 Hz)，1.38(9H，s)，1.68(2H，tt，J = 7，7 Hz)，2.14-2.33(4H，m)，3.26-3.29(2H，m)，4.07-4.19(4H，m)，4.31(1H，d，J = 17 Hz)，4.45(1H，d，J = 17 Hz)，8.05(1H，dd，J = 2 Hz)，8.68(1H，d，J = 2 Hz)，8.78(1H，d，J = 2 Hz).

製備例 238

2-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]-2-[(環丙基甲氧基)乙醯基]己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.14-0.21(2H，m)，0.49-0.55(2H，m)，0.92-1.04(1H，m)，1.25(3H，t，J = 7 Hz)，1.39(9H，s)，1.62-1.74(2H，m)，1.82-1.90(2H，m)，2.21-2.33(2H，m)，3.27-3.31(2H，m)，4.12(2H，q，J = 7 Hz)，4.34(1H，d，J = 18 Hz)，4.46(1H，d，J = 18 Hz)，8.07(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.68(1H，d，J = 2 Hz)，8.80(1H，d，J = 2 Hz).

製備例 239

2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-2-(異丁氧乙醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR(300 MHz, $CDCl_3$)δ 0.85(6H, d, J = 7 Hz), 1.24(3H, t, J = 7 Hz), 1.38(9H, s), 1.67(2H, t, J = 7 Hz), 1.75-1.93(3H, m), 2.24-2.33(4H, m), 3.17(2H, d, J = 7 Hz), 4.11(2H, q, J = 7 Hz), 4.28(1H, d, J = 17 Hz), 4.38(1H, d, J = 17 Hz), 8.20(1H, dd, J = 2, 2 Hz), 8.79(1H, d, J = 2 Hz), 8.84(1H, d, J = 2 Hz).

製備例 240

2-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]-2-(異丁氧乙醯基)戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR(300 MHz, $CDCl_3$)δ 0.84(6H, d, J = 7 Hz), 1.24(3H, t, J = 7 Hz), 1.39(9H, s), 1.80(1H, qt, J = 7 Hz), 2.34-2.71(4H, m), 3.17(2H, d, J = 7 Hz), 4.12(2H, q, J = 7 Hz), 4.28(1H, d, J = 18 Hz), 4.36(1H, d, J = 18 Hz), 8.07(1H, s), 8.69(1H, s), 8.83(1H, s).

製備例 241

2-[(乙醯氧基)乙醯基]-2-(3-氯苄醯基)戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR(300 MHz, $CDCl_3$)δ 1.24(3H, t, J = 7 Hz), 1.34(9H, s), 2.14(3H, s), 2.35-2.44(2H, m), 2.60-2.68(2H, m), 4.11(2H, q, J = 7 Hz), 5.11(1H, d, J = 18 Hz), 5.35(1H, d, J = 18 Hz), 7.38(1H, dd, J = 8, 8 Hz), 7.53(1H, d, J = 8 Hz), 7.60(1H, d, J = 8 Hz), 7.79(1H, s).

製備例 242

2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-2-(異丁氧乙醯基)己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR(300 MHz, $CDCl_3$)δ 0.85(6H, d, J = 7 Hz), 1.25(3H, t, J = 7 Hz), 1.39(9H, s), 1.59-1.72(2H, m), 1.80(1H, qt, J = 7, 7Hz), 2.19-2.39(4H, m), 3.18(2H, d, J = 7 Hz), 4.12(2H, q, J = 7 Hz), 4.31(1H, d, J = 17 Hz), 4.40(1H, d, J = 17 Hz), 8.22(1H, dd, J = 2, 2 Hz), 8.79(1H, d, J = 2 Hz), 8.85(1H, d, J = 2 Hz).

製備例 243

3-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-3-氧丙酸第三丁酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.05(9H, s), 7.86(2H, s), 8.46(2H, s), 8.61(2H, s).

MS(ESI^-): m/z 481 483 485.

製備例 244

2-[(乙醯氧基)乙醯基]-2-(3-氯苄醯基)己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H, t, J = 8 Hz), 1.33(9H, s), 1.56-1.72(2H, m), 2.15(3H, s), 2.20-2.41(4H, m), 4.11(2H, q, J = 8 Hz), 5.13(1H, d, J = 18 Hz), 5.40(1H, d, J = 18 Hz), 7.38(1H, t, J = 8 Hz), 7.52(1H, br d, J = 8 Hz), 7.60(1H, br d, J = 8 Hz), 7.79(1H, br s).

製備例 245

2-(甲氧乙醯基)-2-[(5-甲氧基-3-吡啶基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 8 Hz)，1.27-1.43(11H，m)，1.60-1.74(2H，m)，2.15-2.34(4H，m)，3.37(3H，s)，3.90(3H，s)，4.10(2H，q，J = 8 Hz)，4.35(1H，d，J = 18 Hz)，4.48(1H，d，J = 18 Hz)，7.58(1H，m)，8.43(1H，d，J = 3 Hz)，8.50(1H，d，J = 1 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 452(M + H).

製備例 246

2-乙醯基-2-[(5-甲氧基-3-吡啶基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J = 8 Hz)，1.27-1.40(11H，m)，1.60-1.74(2H，m)，2.15-2.34(4H，m)，2.44(3H，s)，3.89(3H，s)，4.10(2H，q，J = 8 Hz)，7.61(1H，m)，8.43(1H，d，J = 3 Hz)，8.49(1H，d，J = 1 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 422(M + H).

製備例 247

2-(甲氧乙醯基)-2-[(5-甲氧基-3-吡啶基)羰基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J = 8 Hz)，1.38(9H，s)，2.36-2.48(2H，m)，2.53-2.67(2H，m)，3.37(3H，s)，3.90(3H，s)，4.11(2H，q，J = 8 Hz)，4.33(1H，d，J = 18 Hz)，4.45(1H，d，J = 18 Hz)，7.59(1H，m)，8.43(1H，d，J = 3 Hz)，8.51(1H，d，J = 1 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 446(M + + Na).

製備例 248

2-(甲氧乙醯基)-2-[(5-甲氧基-3-吡啶基)羰基]己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J = 8 Hz)，1.37(9H，s)，1.52-1.75(2H，m)，2.18-2.39(4H，m)，3.38(3H，s)，3.90(3H，s)，4.11(2H，q，J = 8 Hz)，4.37(1H，d，J = 18 Hz)，4.51(1H，d，J = 18 Hz)，7.60(1H，m)，8.43(1H，d，J = 3 Hz)，8.50(1H，d，J = 1 Hz).

MS(ESI+)：m/z 438(M + H).

製備例 249

2-(甲氧乙醯基)-2-(5-嘧啶羰基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J = 8 Hz)，1.30-1.44(11H，m)，1.62-1.75(2H，m)，2.16-2.35(4H，m)，3.35(3H，s)，4.11(2H，q，J = 8 Hz)，4.20(1H，d，J = 18 Hz)，4.33(1H，d，J = 18 Hz)，9.01(2H，s)，9.31(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 423(M + H).

製備例 250

2-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]-2-(甲氧乙醯基)己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J = 8 Hz)，1.39(9H，s)，1.57-1.74(2H，m)，1.78(2H，br t，J = 8 Hz)，2.23-2.41(2H，m)，3.38(3H，s)，4.14(2H，q，J = 8 Hz)，4.33(1H，d，J = 18 Hz)，4.45(1H，d，J = 18 Hz)，8.07(1H，m)，8.71(1H

，br s)，8.80(1H，br s).

MS(ESI$^+$)：m/z 442(M + H).

製備例 251

2-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]-2-(甲氧乙醯基)戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J = 8 Hz)，1.39(9H，s)，2.37-2.48(2H，m)，2.53-2.65(2H，m)，3.36(3H，s)，4.13(2H，q，J = 8 Hz)，4.26(1H，d，J = 18 Hz)，4.40(1H，d，J = 18 Hz)，8.06(1H，br s)，8.70(1H，br s)，8.80(1H，br s).

MS(ESI$^+$)：m/z 428(M + H).

製備例 252

2-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]-2-(甲氧乙醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J = 8 Hz)，1.31-1.48(11H，m)，1.55-1.75(2H，m)，2.15-2.35(4H，m)，3.36(3H，s)，4.10(2H，q，J = 8 Hz)，4.27(1H，d，J = 18 Hz)，4.43(1H，d，J = 18 Hz)，8.03(1H，t，J = 2 Hz)，8.69(1H，d，J = 2 Hz)，8.77(1H，d，J = 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 456(M + H).

製備例 253

4-(乙醯氧基)-2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-3-氧丁酸甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 2.21(3H，s)，3.58(3H，br s)，4.87(1H，br s)，5.19(2H，br s)，7.98(1H，br s)，8.58(1H，br s)，8.79(1H，br s).

MS(ESI$^+$)：m/z 358，360(M + H).

製備例 254

2-(2-{2-[2-(乙醯氧基)乙氧基]乙氧基}乙基)-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-3-氧丁酸第三丁酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.32(9H，s)，2.07(3H，s)，2.38(3H，s)，2.45(3H，s)，2.57(2H，t，J = 7 Hz)，3.43(4H，m)，3.57(4H，m)，4.16(2H，m)，7.84(1H，m)，8.53(1H，m)，8.75(1H，m).

製備例 255

2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-2-(甲氧乙醯基)己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(9H，s)，1.55-1.75(2H，m)，2.23-2.45(4H，m)，3.38(3H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.34(1H，d，J= 18 Hz)，4.47(1H，d，J= 18 Hz)，8.22(1H，m)，8.81(1H，d，J= 2 Hz)，8.83(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 486 488.

製備例 256

2-(2-氯異菸鹼醯基)-3-氧丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.91-1.00(3H，m)，2.24(1.2H，s)，2.48(1.8H，s)，4.02(1.2H，q，J = 8 Hz)，4.10(0.8H，q J = 8 Hz)，7.24(0.6H，m)，7.39(0.6H，s)，7.45(0.4H，m)，7.54(1H，s)，8.49(1H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 298(M + H).

下列化合物之製備可仿製備例 78 之方法來進行。

製備例 257

5-(2-氯異菸鹼醯基)-6-氧庚酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.60-1.73(2H，m)，1.98-2.10(2H，m)，2.20(3H，s)，2.35(2H，t，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.37(1H，t，J= 7 Hz)，7.67(1H，d，J= 5 Hz)，7.77(1H，s)，8.59(1H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 312 .

製備例 258

4-(2-氯異菸鹼醯基)-5-氧己酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，2.21(3H，s)，2.22-2.35(2H，m)，2.36-2.47(2H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.57(1H，t，J= 7 Hz)，7.76(1H，dd，J= 2 Hz，5 Hz)，7.83(1H，d，J= 2 Hz)，8.61(1H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 298.

製備例 259

6-(2-氯異菸鹼醯基)-7-氧-8-苯辛酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.20-1.38(2H，m)，1.60-1.72(2H，m)，1.95-2.06(2H，m)，2.28(2H，t，J= 7 Hz)，3.71(1H，d，J= 17 Hz)，3.80(1H，d，J= 17 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.41(1H，t，J= 7 Hz)，7.10(2H，m)，7.20-7.33(4H，m)，7.39(1H，s)，8.42(1H，d，J= 5 Hz).

製備例 260

({3-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-4-氧戊基}氧基)乙酸甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 2.23(3H，s)，2.23-2.40(2H，m)，2.44(3H，s)，3.58(2H，m)，3.71(3H，s)，4.02(2H，s)，4.89(1H，t，J= 7 Hz)，8.12(1H，s)，8.64(1H，s)，9.07(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 294.

製備例 261

(4-氧-4-苯丁氧基)乙酸甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 2.04-2.16(2H，m)，3.15(2H，t，J= 7 Hz)，3.64(2H，t，J= 7 Hz)，3.73(3H，s)，4.09(2H，s)，7.46(2H，t，J= 8 Hz)，7.56(1H，t，J= 8 Hz)，7.99(2H，d，J= 8 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 237.

下列化合物之製備可仿製備例 78 之方法來進行。

製備例 262

3-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-4-氧戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，2.22(3H，s)，2.97-3.17(2H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.91(1H，m)，8.41(1H，m)，8.88(1H，m)，9.12(1H，m).

MS(ESI^+)：m/z 328 330.

製備例 263

6-(乙醯氧基)-4-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-5-氧己酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.98(3H，s)，2.23-2.34(2H，m)，2.40-2.50(2H，m)，2.45(3H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.69(2H，m)，4.82(1H，t，J= 7 Hz)，8.14(1H，s)，8.67(1H，s)，9.07(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 336.

製備例 264

7-(乙醯氧基)-5-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-6-氧庚酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.60-1.80(2H，m)，2.02(3H，s)，1.97-2.13(2H，m)，2.35(2H，t，J= 7 Hz)，2.45(3H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.56(1H，t，J= 7 Hz)，4.69(1H，d，J= 17 Hz)，4.78(1H，d，J= 17 Hz)，8.06(1H，s)，8.66(1H，s)，9.00(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 350.

製備例 265

8-(乙醯氧基)-6-(3-氯苄醯基)-7-氧辛酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.35-1.50(2H，m)，1.60-1.78(2H，m)，2.04(3H，s)，2.00-2.12(2H，m)，2.29(2H，t，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.49(1H，t，J= 7 Hz)，4.68(1H，d，J= 17 Hz)，4.75(1H，d，J= 17 Hz)，7.66(1H，t，J= 8 Hz)，7.88(1H，d，J= 8 Hz)，8.16(1H，d，J= 8 Hz)，8.26(1H，s).

MS(ESI^-)：m/z 372.

製備例 266

7-(乙醯氧基)-5-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-6-氧庚酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.60-1.82(2H，m)，2.04(3H，s)，2.03-2.15(2H，m)，2.35(2H，t，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.51(1H，t，J= 7 Hz)，4.70(1H，d，J= 17 Hz)，4.75(1H，d，J= 17 Hz)，8.39(1H，m)，8.88(1H，s)，9.07(1H，s).

MS(ESI$^-$)：m/z 414 416，MS(ESI$^+$)：m/z 414 416.

製備例 267

6-(乙醯氧基)-4-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-5-氧己酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，2.00(3H，s)，2.22-2.36(2H，m)，2.43-2.53(2H，m)，4.13(2H，q，J= 7 Hz)，4.70(2H，m)，4.80(1H，t，J= 7 Hz)，8.48(1H，s)，8.90(1H，s)，9.19(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 400 402.

製備例 268

6-(環己基甲氧基)-4-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-5-氧己酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.60-0.82(2H，m)，0.93-1.10(3H，m)，1.12-1.65(6H，m)，1.25(3H，t，J= 7 Hz)，2.07-2.17(1H，m)，2.22-2.35(1H，m)，2.42(2H，m)，2.44(3H，s)，3.05-3.23(2H，m)，3.96(2H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.92(1H，m)，8.16(1H，s)，8.66(1H，s)，9.08(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 390.

製備例 269

4-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-6-(環己基甲氧基)-5-氧己酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.63-0.84(2H，m)，0.93-1.88(3H，m)，1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.35-1.90(6H，m)，2.02-2.14(1H，m)，2.20-2.36(1H，m)，2.44(2H，t，J= 7 Hz)，3.04-3.20(2H，m)，3.95(2H，s)，4.13(2H，q，J= 7 Hz)，4.85-4.93(1H

，m)，8.50(1H，m)，8.88(1H，d，J= 2 Hz)，9.20(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 454 456.

製備例 270

5-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-7-(環己基甲氧基)-6-氧庚酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.75-0.86(2H，m)，0.95-1.15(3H，m)，1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.90(10H，m)，2.36(2H，t，J= 7 Hz)，3.12(2H，q，J= 7 Hz)，3.97(2H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.71(1H，t，J= 7 Hz)，8.41(1H，s)，8.88(1H，s)，9.12(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 468 470.

製備例 271

7-(環丙基甲氧基)-5-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-6-氧庚酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ -0.08-0.00(1H，m)，0.00-0.15(1H，m)，0.28-0.49(2H，m)，0.72-0.87(1H，m)，1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.58-2.13(4H，m)，2.32(2H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，3.10-3.26(2H，m)，4.02(2H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.77(1H，t，J= 7 Hz)，8.07(1H，s)，8.63(1H，s)，9.03(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 362.

製備例 272

6-(環丙基甲氧基)-4-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-5-氧己酸

乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ -0.08-0.00(1H，m)，0.00-0.13(1H，m)，0.23-0.47(2H，m)，0.68-0.84(1H，m)，1.24(3H，t，J= 7 Hz)，2.03-2.17(1H，m)，2.22-2.36(1H，m)，2.40(2H，m)，2.44(3H，s)，3.12(2H，m)，3.98(1H，d，J= 17 Hz)，4.06(1H，d，J= 17 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.93(1H，m)，8.12(1H，s)，8.65(1H，s)，9.08(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 348.

製備例 273

4-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-6-(2-甲氧乙氧基)-5-氧己酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.90-2.37(2H，m)，2.43(2H，t，J= 7 Hz)，3.18(3H，s)，3.16-3.73(4H，m)，4.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.10-4.24(2H，m)，4.86-4.93(1H，m)，8.51(1H，m)，8.87(1H，d，J= 2 Hz)，9.20(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^-$)：m/z 414 416，MS(ESI$^+$)：m/z 416 418.

製備例 274

1-(5-溴-3-吡啶基)-1，3-丁烷二酮

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 2.25(3H，s)，6.18(1H，s)，8.31(1H，s)，8.78(1H，s)，8.96(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 242 244.

製備例 275

7-(乙醯氧基)-5-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]-6-氧庚酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J = 7 Hz)，1.60-1.70(4H，m)，2.04(3H，s)，2.35(2H，t，J = 6 Hz)，4.12(2H，q，J = 7 Hz)，4.52(1H，t，J = 7 Hz)，4.69(1H，d，J = 18 Hz)，4.78(1H，d，J = 18 Hz)，8.24(1H，s)，8.78(1H，s)，9.05(1H，s).

製備例 276

6-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]-8-(環丙基甲氧基)-7-氧辛酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ -0.09-0.11(2H，m)，0.25-0.35(1H，m)，0.37-0.46(1H，m)，0.70-0.79(1H，m)，1.24(3H，t，J = 7 Hz)，1.29-1.41(2H，m)，1.64(2H，t，J = 7 Hz)，1.72-1.84(1H，m)，1.96-2.08(1H，m)，2.28(2H，t，J = 7 Hz)，3.12(1H，dd，J = 10，7 Hz)，3.21(1H，dd，J = 10，7 Hz)，3.97(1H，d，J = 12 Hz)，4.05(1H，d，J = 12 Hz)，4.11(2H，q，J = 7 Hz)，4.70(1H，t，J = 7 Hz)，8.26(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.77(1H，dd，J = 2 Hz)，9.09(1H，dd，J = 2 Hz).

製備例 277

5-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]-7-(環丙基甲氧基)-6-氧庚酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ -0.07-0.09(2H，m)，0.24-0.46(2H，m)，0.68-0.79(1H，m)，1.23(3H，t，J = 7 Hz)，1.47-1.84(3H，m)，1.98-2.10(1H，m)，2.33(2H，t，J = 7 Hz)，3.12(1H，dd，J = 10，7 Hz)，3.21(1H，dd，J = 10，

7 Hz)，3.97(1H，d，J = 17 Hz)，4.06(1H，d，J = 17 Hz)，4.10(2H，q，J = 7 Hz)，4.73(1H，t，J = 6 Hz)，8.27(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.77(1H，d，J = 2 Hz)，9.10(1H，d，J = 2 Hz).

製備例 278

6-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-8-異丁氧基-7-氧辛酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.72(3H，d，J = 7 Hz)，0.77(3H，d，J = 7 Hz)，1.24(3H，t，J = 7 Hz)，1.30-1.42(2H，m)，1.54-1.70(3H，m)，1.75-1.87(1H，m)，1.95-2.08(1H，m)，2.28(2H，t，J = 8 Hz)，3.10(1H，dd，J = 9，7 Hz)，3.14(1H，dd，J = 9，7 Hz)，3.98(2H，s)，4.11(2H，q，J = 7 Hz)，4.70(1H，t，J = 6 Hz)，8.39(1H，dd，J = 2 Hz)，8.87(1H，d，J = 2 Hz)，9.08(1H，d，J = 2 Hz).

製備例 279

4-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]-6-異丁氧基-5-氧己酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.68(3H，d，J = 7 Hz)，0.72(3H，d，J = 7 Hz)，1.25(3H，t，J = 7 Hz)，1.52(1H，qt，J = 7，7 Hz)，2.02-2.13(1H，m)，2.20-2.32(1H，m)，2.44(2H，t，J = 7 Hz)，3.07(1H，dd，J = 9，7 Hz)，3.12(1H，dd，J = 9，7 Hz)，3.98(2H，s)，4.14(2H，q，J = 7 Hz)，4.90(1H，d，J = 9 Hz)，4.92(1H，d，J = 9 Hz)，8.34(1H，dd，J = 2 Hz)，8.78(1H，d，J = 2 Hz)，9.15(1H，d，J = 2 Hz).

製備例 280

6-(乙醯氧基)-4-(3-氯苄醯基)-5-氧己酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J = 7 Hz)，1.95(3H，s)，2.20-2.29(2H，m)，2.41-2.47(2H，m)，4.15(2H，q，J = 7 Hz)，4.64(1H，d，J = 17 Hz)，4.71(1H，d，J = 17 Hz)，4.78(1H，t，J = 6 Hz)，7.48(1H，dd，J = 8，8 Hz)，7.60(1H，d，J = 8 Hz)，7.96(1H，d，J = 8 Hz)，8.04(1H，s).

製備例 281

5-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-7-異丁氧基-6-氧庚酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.72(3H，d，J = 7 Hz)，0.77(3H，d，J = 7 Hz)，1.23(3H，t，J = 7 Hz)，1.61-1.73(3H，m)，1.77-1.88(1H，m)，1.98-2.10(1H，m)，2.33(2H，t，J = 7 Hz)，3.10(1H，dd，J = 9，7 Hz)，3.15(1H，dd，J = 9，7 Hz)，3.99(2H，s)，4.11(2H，q，J = 7 Hz)，4.73(1H，t，J = 7 Hz)，8.40(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.87(1H，d，J = 2 Hz)，9.10(1H，d，J = 2 Hz).

製備例 282

1，3-雙(5-溴-3-吡啶基)-1，3-丙二酮

^{1}H NMR(DMSO-d_6)δ 7.60(1H，s)，8.78(2H，s)，8.88(2H，s)，9.30(2H，s).

製備例 283

7-(乙醯氧基)-5-(3-氯苄醯基)-6-氧庚酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J = 8 Hz)，1.57-1.75(2H，m)，1.90-2.12(5H，m)，2.34(2H，t，J = 8 Hz)，4.11(2H，q，J = 8 Hz)，4.52(1H，t，J = 8 Hz)，4.71(2H，q，J = 8 Hz)

，4.65(1H，d，J = 16 Hz)，4.75(1H，d，J = 16 Hz)，7.43(1H，t，J = 8 Hz)，7.60(1H，br d，J = 8 Hz)，7.84(1H，br d，J = 8 Hz)，7.96(1H，br s).

製備例 284

8-甲氧基-6-[(5-甲氧基-3-吡啶基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 8 Hz)，1.27-1.43(2H，m)，1.55-1.70(2H，m)，1.84(1H，m)，2.00(1H，m)，2.27(2H，d，J = 8 Hz)，3.26(3H，s)，3.92(3H，s)，3.98(2H，d，J = 5 Hz)，4.10(2H，q，J = 8 Hz)，4.67(1H，t，J = 8 Hz)，7.71(1H，m)，8.50(1H，d，J = 3 Hz)，8.78(1H，br s).

MS(ESI^+)：m/z 352(M + H).

製備例 285

6-[(5-甲氧基-3-吡啶基)羰基]-7-氧辛酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J = 8 Hz)，1.27-1.41(2H，m)，1.60-1.73(2H，m)，1.90-2.14(2H，m)，2.18(3H，s)，2.24-2.84(2H，m)，3.26(3H，s)，3.92(3H，s)，4.10(2H，q，J = 8 Hz)，4.40(1H，t，J = 8 Hz)，7.71(1H，m)，8.51(1H，d，J = 3 Hz)，8.78(1H，br s).

製備例 286

6-甲氧基-4-[(5-甲氧基-3-吡啶基)羰基]-5-氧己酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J = 8 Hz)，2.10(1H，m)，2.25(1H，m)，2.38-2.47(2H，m)，3.24(3H，s)，3.94(3H，s)，3.95(1H，d，J = 16 Hz)，4.00(1H，d，J = 16 Hz)，4.12(2H，q，J = 8 Hz)，4.38(1H，m)，7.83(1H，m)，8.52(1H，d

，J = 3 Hz)，8.87(1H，d，J = 1 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 346(M+ + Na).

製備例 287

7-甲氧基-5-[(5-甲氧基-3-吡啶基)羰基]-6-氧庚酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 8 Hz)，1.54-1.74(2H，m)，1.84(1H，m)，2.02(1H，m)，2.32(2H，d，J = 8 Hz)，3.26(3H，s)，3.92(3H，s)，3.99(2H，d，J = 5 Hz)，4.10(2H，q，J = 8 Hz)，4.70(1H，t，J = 8 Hz)，7.71(1H，m)，8.51(1H，d，J = 3 Hz)，8.79(1H，br s).

MS(ESI$^+$)：m/z 338(M + H).

製備例 288

8-甲氧基-7-氧-6-(5-嘧啶羰基)辛酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 8 Hz)，1.25-1.45(2H，m)，1.55-1.70(2H，m)，1.81(1H，m)，2.03(1H，m)，2.28(2H，t，J = 8 Hz)，3.24(3H，s)，3.92(1H，d，J = 18 Hz)，4.01(1H，d，J = 18 Hz)，4.10(2H，q，J = 8 Hz)，9.26(2H，s)，9.40(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 323(M + H).

製備例 289

5-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]-7-甲氧基-6-氧庚酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J = 8 Hz)，1.52-1.74(2H，m)，1.83(1H，m)，2.02(1H，m)，2.34-2.40(2H，m)，3.25(3H，s)，3.92(1H，d，J = 16 Hz)，4.01(1H，d，J = 16 Hz)，4.11(2H，q，J = 8 Hz)，4.68(1H，t，J = 8 Hz)，8.23(1H，

br s)，8.78(1H，br s)，9.05(1H，br s).

MS(ESI$^+$)：m/z 342(M + H).

製備例 290

4-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]-6-甲氧基-5-氧己酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J = 8 Hz)，2.09(1H，m)，2.25(1H，m)，2.38-2.49(2H，m)，3.22(3H，s)，3.91(1H，d，J = 18 Hz)，4.00(1H，d，J = 18 Hz)，4.14(2H，q，J = 8 Hz)，4.85(1H，m)，8.33(1H，br s)，8.78(1H，br s)，9.14(1H，br s).

MS(ESI$^+$)：m/z 328(M+ H).

製備例 291

6-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]-8-甲氧基-7-氧辛酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 8 Hz)，1.27-1.43(2H，m)，1.50-1.71(2H，m)，1.82(1H，m)，2.00(1H，m)，2.27(2H，d，J = 8 Hz)，3.25(3H，s)，3.92(1H，d，J = 16 Hz)，4.02(1H，d，J = 16 Hz)，4.10(2H，q，J = 8 Hz)，4.63(1H，t，J = 8 Hz)，8.23(1H，br s)，8.78(1H，br s)，9.03(1H，br s).

MS(ESI$^+$)：m/z 356(M + H).

製備例 292

2-[2-({3-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-4-氧戊基}氧基)乙氧基]乙酸乙酯三氟乙酸鹽

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 2.06(3H，s)，2.28(3H，s)，2.33(2H，m)，2.65(3H，s)，3.47-3.67(8H，m)，4.17(2H，m)，4.71(1H，t，J = 7 Hz)，8.66(1H，m)，8.88(1H，m)，9.31(1H，m).

製備例 293

5-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-7-甲氧基-6-氧庚酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.56-1.73(2H，m)，1.77-1.92(1H，m)，1.96-2.10(1H，m)，2.32(2H，t，J= 7 Hz)，3.25(3H，s)，3.92(1H，d，J= 17 Hz)，4.02(1H，d，J= 17 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.67(1H，t，J= 7 Hz)，8.39(1H，m)，8.87(1H，d，J= 2 Hz)，9.09(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 386 388.

下列化合物之製備可仿製備例 129 及 130 之方法來進行。

製備例 294

3-氧-4-苯丁酸第三丁酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.46(9H，s)，3.37(2H，s)，3.82(2H，s)，7.21(2H，d，J= 8 Hz)，7.25-7.37(3H，m).

製備例 295

3-氧-3-苯丁酸第三丁酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.43(9H，s)，3.81(2H，s)，7.40-7.52(2H，m)，7.56-7.63(1H，m)，7.94(2H，d，J= 8 Hz).

製備例 296

4-(環己基甲氧基)-3-氧丁酸第三丁酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.89-1.07(2H，m)，1.13-1.40(3H，m)，1.47(9H，s)，1.60-1.83(6H，m)，3.28(2H，d，J= 7 Hz)，3.45(2H，s)，4.06(2H，s).

製備例 297

4-(環丙基甲氧基)-3-氧丁酸第三丁酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.20-0.28(2H，m)，0.55-0.64(2H，m)，1.03-1.17(1H，m)，1.47(9H，s)，3.36(2H，d，J= 7 Hz)，3.45(2H，s)，4.15(2H，s).

製備例 298

4-(2-甲氧乙氧基)-3-氧丁酸第三丁酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.47(9H，s)，3.38(3H，s)，3.44(2H，s)，3.57(2H，m)，3.70(2H，m)，4.20(2H，s).

製備例 299

4-異丁氧基-3-氧丁酸第三丁酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.93(6H，d，J = 7 Hz)，1.45(9H，s)，1.91(1H，qt，J = 7，7 Hz)，3.26(2H，d，J = 7 Hz)，3.45(2H，s)，4.07(2H，s).

製備例 300

3-(3-甲基-2-噻吩基)-3-氧丙酸第三丁酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.47(9H，s)，2.57(3H，s)，3.79(2H，s)，6.96(1H，d，J = 5 Hz)，7.44(1H，d，J = 5 Hz).

製備例 301

3-(5-甲基-3-異噁唑基)-3-氧丙酸第三丁酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.475-1.57(9H，m)，2.49(3H，m)，3.95(2H，s)，6.40(1H，s).

下列化合物之製備可仿製備例 132 之方法來進行。

製備例 302

(2E)-5-(3-氰苄醯基)-6-氧-2-庚烯酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.28(3H，t，J = 7 Hz)，2.20(3H，s)，

2.88(2H，m)，4.16(2H，q，J = 7 Hz)，4.54(1H，t，J = 7 Hz)，5.88(1H，d，J = 16 Hz)，6.82(1H，dt，J = 7 及 16 Hz)，7.65(1H，t，J = 8Hz)，7.89(1H，d，J = 8 Hz)，8.20(1H，d，J = 8 Hz)，8.27(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 300.14(M + H)

製備例 303

2-[(3-甲基-2-噻吩基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J = 7 Hz)，1.35-1.51(11H，m)，1.65(2H，m)，1.96(2H，m)，2.30(2H，t，J = 7 Hz)，2.58(3H，s)，3.94(1H，t，J = 7 Hz)，4.12(2H，q，J = 7 Hz)，6.97(1H，d，J = 5 Hz)，7.44(1H，d，J = 5 Hz).

製備例 304

2-[(5-甲基-3-異噁唑基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 11.24(3H，t，J = 7 Hz)，1.39(9H，s)，1.67(2H，m)，1.98(2H，m)，2.49(3H，s)，4.10(2H，q，J = 7 Hz)，4.26(1H，t，J = 7 Hz)，6.37(1H，s).

下列化合物之製備可仿製備例 152 之方法來進行。

製備例 305

7-氧-7-(2-噻吩基)庚酸甲酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.41(2H，m)，1.63-1.82(4H，m)，2.33(2H，t，J = 7 Hz)，2.91(2H，t，J = 7 Hz)，3.67(3H，s)，1.73(1H，m)，7.62(1H，m)，7.70(1H，m).

下列化合物之製備可仿製備例 153 之方法來進行。

製備例 306

5-甲氧苯鹼醯氯鹽酸鹽

製備例 307

5-嘧啶羰基氯鹽酸鹽

製備例 308

5-氯苯鹼醯氯鹽酸鹽

製備例 309

2-溴-4-(氯羰基)苄酸甲酯

下列化合物之製備可仿製備例 159 之方法來進行。

製備例 310

2-(苯乙醯基)庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.18-1.50(2H，m)，1.46(9H，s)，1.50-1.75(2H，m)，1.75-1.88(2H，m)，2.24(2H，t，J= 7 Hz)，3.47(1H，t，J= 7 Hz)，3.81(2H，s)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，7.20(2H，d，J= 8 Hz)，7.25-7.37(3H，m).

製備例 311

2-[2-(2-甲氧基-2-氧乙氧基)乙基]-3-氧丁酸第三丁酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.46(9H，s)，2.04-2.23(2H，m)，2.29(3H，s)，3.54(2H，t，J= 7 Hz)，3.69(1H，t，J= 7 Hz)，3.74(3H，s)，4.04(2H，s).

製備例 312

2-苄醯基-4-(2-甲氧基-2-氧乙氧基)丁酸第三丁酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.34(9H，s)，2.26-2.40(2H，m)，3.55-3.67(2H，m)，3.70(3H，s)，4.04(2H，s)，4.57(1H，t

，J= 7 Hz)，7.47(2H，t，J= 8 Hz)，7.56(1H，m)，8.01(2H，d，J= 8 Hz).

製備例 313

2-[(乙醯氧基)乙醯基]己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.48(9H，s)，1.60-1.73(2H，m)，1.82-1.95(2H，m)，2.17(3H，s)，2.32(2H，t，J= 7 Hz)，3.43(1H，t，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.72(1H，d，J= 17 Hz)，4.83(1H，d，J= 17 Hz).

製備例 314

2-[(環己基甲氧基)乙醯基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.85-1.06(2H，m)，1.13-1.34(3H，m)，1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.45(9H，s)，1.60-1.85(6H，m)，2.08-2.23(2H，m)，2.36(2H，t，J= 7 Hz)，3.27(2H，d，J= 7 Hz)，3.67(1H，t，J= 7 Hz)，4.10(2H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz).

製備例 315

2-[(環己基甲氧基)乙醯基]己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.88-1.06(2H，m)，1.12-1.34(3H，m)，1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.45(9H，s)，1.54-1.94(10H，m)，2.32(2H，t，J= 7 Hz)，3.27(2H，d，J= 7 Hz)，3.56(1H，t，J= 7 Hz)，4.09(2H，s)，4.11(2H，q，J= 7 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 385.

製備例 316

2-[(環丙基甲氧基)乙醯基]己二酸 1-第三丁酯 6-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.22-0.33(2H，m)，0.54-0.64(2H，m)，1.04-1.18(1H，m)，1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.45(9H，s)，1.60-1.73(2H，m)，1.83-1.95(2H，m)，2.33(2H，t，J= 7 Hz)，3.33(2H，d，J= 7 Hz)，3.53(1H，t，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.18(2H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 343.

製備例 317

2-[(環丙基甲氧基)乙醯基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.20-0.35(2H，m)，0.56-0.64(2H，m)，1.04-1.16(1H，m)，1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.45(9H，s)，2.12-2.24(2H，m)，2.38(2H，t，J= 7 Hz)，3.36(2H，m)，3.65(1H，t，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.19(2H，s).

製備例 318

2-[(2-甲氧乙氧基)乙醯基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.46(9H，s)，2.10-2.23(2H，m)，2.38(2H，t，J= 7 Hz)，3.37(3H，s)，3.60(2H，m)，3.62(1H，t，J= 7 Hz)，3.70(2H，m)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.23(1H，d，J= 17 Hz)，4.30(1H，d，J= 17 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 333.

製備例 319

2-(異丁氧乙醯基)戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.93(6H，d，J = 7 Hz)，1.26(3H，t，J = 7 Hz)，1.45(9H，s)，1.91(1H，qt，J = 7，7 Hz)

，2.13(2H，m)，2.37(2H，t，J = 7 Hz)，3.25(2H，d，J = 7 Hz)，3.67(1H，t，J = 7 Hz)，4.12(2H，s)，4.13(2H，q，J = 7 Hz).

下列化合物之製備可仿製備例 164 之方法來進行。

製備例 320

2-溴-4-[(5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄酸甲酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.32(3H，t，J = 7 Hz)，2.72(2H，q，J = 7 Hz)，3.97(3H，s)，6.10(1H，m)，6.77(1H，m)，7.81(1H，d，J = 8 Hz)，7.85(1H，d，J = 8 Hz)，8.11(1H，s)，9.32(1H，s，br).

下列化合物之製備可仿製備例 165 之方法來進行。

製備例 321

2-(2-{2-[2-(乙醯氧基)乙氧基]乙氧基}乙基)-3-氧丁酸第三丁酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.46(9H，s)，2.00-2.17(5H，m)，2.25(3H，s)，3.45-3.70(10H，m)，4.22(2H，m).

下列化合物之製備可仿製備例 178 之方法來進行。

製備例 322

異丁氧乙酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.94(6H，d，J = 7 Hz)，1.93(1H，qt，J = 7，7 Hz)，3.34(2H，d，J = 7 Hz)，4.12(2H，s).

製備例 323

將 60% NaH(2.66 g)溶在 DMF(20 mL)，於冰水冷卻下加入羥乙酸甲酯(5.00 g)，於 0℃ 下攪拌 0.5 小時。於冰水冷卻下

加入 2-(2-溴乙氧基)四氫-2H-吡喃(12.8 g)，於室溫下攪拌 2 小時。分層於 AcOEt 及水。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=10:1-3:1)可得[2-(四氫-2H-吡喃-2-基氧基)乙氧基]乙酸甲酯淡黃色油(4.45 g)。

[2-(四氫-2H-吡喃-2-基氧基)乙氧基]乙酸甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.48-1.95(6H，m)，3.46-3.57(2H，m)，3.64-3.75(2H，m)，3.76(3H，s)，3.82-3.97(2H，m)，4.20(2H，s)，4.66(1H，m).

製備例 324

將[2-(四氫-2H-吡喃-2-基氧基)乙氧基]乙酸甲酯(1.07 g)及嘧錠對-甲苯磺酸鹽(24.6 mg)溶在 MeOH(10 mL)，加熱回流 2 小時。蒸發溶劑，以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=10:1-1:3)可得(2-羥乙氧基)乙酸甲酯之無色油(555 mg)。

(2-羥乙氧基)乙酸甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 3.69(2H，m)，3.76(2H，m)，3.78(3H，s)，4.16(2H，s).

製備例 325

將(2-羥乙氧基)乙酸甲酯(540 mg)，咪唑(411 mg)及三苯膦(1.37 g)溶在乙醚(2 mL)及 CH_3CN(1 mL)，於冰水冷卻下加入碘(1.43 g)，於 0℃下攪拌 2 小時。濾除不溶物，將濾液稀釋以 AcOEt，清洗以 Na_2SO_3 溶液及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=20:1-5:1)可得(2-碘乙氧基)乙酸甲酯之無色油(898 mg)。

(2-碘乙氧基)乙酸甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 3.30(2H，t，J= 7 Hz)，3.77(3H，s)，3.84(2H，t，J= 7 Hz)，4.17(2H，s).

製備例 326

將 60% NaH(1.02 g)in THF(50 mL)，於冰水冷卻下加入 4-(乙醯氧基)-3-氧丁酸第三丁酯(5.00 g)，於 0℃下攪拌 0.5 小時。加入 3-碘丙酸乙酯(5.54 g)，於 50℃下攪拌 8 小時。分層於 AcOEt 及水。分離有機層，清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=20:1-3:1)可得 2-[(乙醯氧基)乙醯基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯黃色油(4.27 g)。

2-[(乙醯氧基)乙醯基]戊二酸 1-第三丁酯 5-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.46(9H，s)，2.14-2.24(2H，m)，2.17(3H，s)，2.36(2H，t，J= 7 Hz)，3.60(1H，t，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.73(1H，d，J= 18 Hz)，4.83(1H，d，J= 18 Hz).

製備例 327

將 4-硫嗎啉羧酸苄酯(4.8 g)溶在甲醇(30 mL)及 H_2O(20 mL)，於冰浴冷卻下加入過硫酸氫鉀製劑 oxone(16.2 g)，於室溫下攪拌 2 小時。真空蒸發，分層於 EtOAc 及水。將水層萃取以 EtOAc。將結合有機層清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯)可得 4-硫嗎啉羧酸苄酯 1，1-二氧化物之無色固體(3.8 g)。

4-硫嗎啉羧酸苄酯 1，1-二氧化物

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 3.02(4H，br s)，4.01(4H，t，J = 5 Hz)，5.16(2H，s)，7.33-7.40(5H，m).

製備例 328

將硫嗎啉(2 g)溶在 1N NaOH(11.6 mL)，於冰浴冷卻下加入氯碳酸苄酯(1.66 mL)，於室溫下攪拌 2 小時。中和以 1N HCl，萃取以 EtOAc 2 次。將結合有機層清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥並真空蒸發。以矽膠柱層析純化可得 4-硫嗎啉羧酸苄酯之無色固體(4.8 g)。

4-硫嗎啉羧酸苄酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 2.59(4H，br s)，3.77(4H，t，J = 5 Hz)，5.14(2H，s)，7.30-7.41(5H，m).

製備例 329

將 4-硫嗎啉羧酸苄酯 1，1-二氧化物(3.8 g)溶在甲醇(32 mL)及 1，4-二噁烷(8 mL)，於室溫下加入 Pd-C(10%溼；380 mg)。於室溫及氫氣(3.4 大氣壓)下攪拌 4 小時。過濾並真空蒸發可得硫嗎啉 1，1-二氧化物之無色固體(2.22 g)。

硫嗎啉 1，1-二氧化物

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 3.03(4H，t，J = 5 Hz)，3.33(4H，t，J = 5 Hz).

MS(m/z)136(M+H).

製備例 330

將[(5-氯-4-硫氫基-6-甲基-3-吡啶基)氧基]乙酸(10 g)溶在二氯甲烷(100 mL)，於冰-MeOH 浴下加入 Et3N(14 mL)。於低於 10℃及 30 分鐘下滴加入三氟甲磺酐(14.3 mL)。2 小

時後，分層於 $CHCl_3$ 及水。將水層萃取以 $CHCl_3$ 2 次。將結合有機層於硫酸鎂下乾燥並真空蒸發可得棕色油。以矽膠柱層析純化(矽膠，100 mL；己烷：乙酸乙酯=15-1 及 10-1)可得三氟甲磺酸 5-氯-3-吡啶基酯(15.8 g)之淡棕色油。

三氟甲磺酸 5-氯-3-吡啶基酯

^1H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 7.69(1H，dd，J = 4，4 Hz)，8.52(1H，d，J = 4 Hz)，8.65(1H，d，J = 4 Hz).

製備例 331

於乙醇(66 mL)及 DMF(66 mL)中，於冰浴冷卻下加入 Et3N(29.4 mL)，1，3-丙二基雙(二苯膦)(3.48 g)及乙酸鈀(1.9 g)。於同溫下加入三氟甲磺酸 5-氯-3-吡啶基酯(22.1 g)。於 50℃及 CO(1 大氣壓)下攪拌 4 小時。分層於 EtOAc 及水。將水層萃取以 EtOAc。將結合有機層清洗以水 3 次，於硫酸鎂下乾燥並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(矽膠，200 mL；己烷：乙酸乙酯=15-1 及 10-1)可得 5-氯菸鹼酸乙酯(10.5 g)之淡棕色油。

5-氯菸鹼酸乙酯

^1H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.42(3H，t，J = 7 Hz)，4.43(2H，q，J = 7 Hz)，8.28(1H，dd，J = 3，3 Hz)，8.74(1H，d，J = 3 Hz)，9.09(1H，d，J = 3 Hz).

製備例 332

於 5-氯菸鹼酸鹽(10.5 g)中，於室温下加入 1N NaOH(84.9 mL)。於 60℃下加熱 1 小時。以 HCl 調至 pH 4-5。濾集沈澱可得 5-氯菸鹼酸(6.9 g)無色固體。

^{1}H NMR(300 MHz，DMSO-d_6)δ 8.30(1H，dd，J = 3 Hz)，8.88(1H，d，J = 3 Hz)，9.01(1H，d，J = 3 Hz)，13.8(1H，br s).

5-氯菸鹼酸鹽

^{1}H NMR(300 MHz，DMSO-d_6)δ 8.30(1H，dd，J = 3，3 Hz)，8.88(1H，d，J = 3 Hz)，9.01(1H，d，J = 3 Hz)，13.8(1H，br s).

下列化合物之製備可仿製備例 332 之方法來進行。

製備例 333

5-甲氧菸鹼酸

^{1}H NMR(DMSO-d_6)δ 3.87(3H，s)，7.73(1H，m)，8.48(1H，d，J = 3 Hz)，8.65(1H，d，J = 1 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 154(M + H).

製備例 334

5-嘧啶羧酸

^{1}H NMR(DMSO-d_6)δ 9.20(2H，s)，9.37(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 148(M+ + Na).

製備例 335

將二異丙胺(5.41 g)溶在 THF(30 mL)，於乾冰-丙酮冷却下加入 1.5 M 正丁鋰已烷溶液(35 mL)，於-78℃下攪拌 10 分鐘。於乾冰-丙酮冷却下加入乙酸第三丁酯(5.87 g)，於-78℃下攪拌 10 分鐘，於乾冰-丙酮冷却下滴加入含-溴菸鹼酸(3.00 g)及 N，N-羰基二咪唑(2.65 g)之 THF(30 mL)。於-78℃下攪拌 0.5 小時。分層於乙酸乙酯及 NH_4Cl 溶液。分離有

機層，清洗以 $NaHCO_3$ 溶液及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。碾製以異丙醚可得 3-(5-溴-3-吡啶基)-3-氧丙酸第三丁酯之無色粉(3.71 g)。

3-(5-溴-3-吡啶基)-3-氧丙酸第三丁酯

烯醇形式： ^1H NMR($CDCl_3$)δ 1.54(9H，s)，5.62(1H，s)，8.19(1H，m)，8.72(1H，d，J= 2 Hz)，8.86(1H，d，J= 2 Hz)。

酮形式： ^1H NMR($CDCl_3$)δ 1.44(9H，s)，3.90(2H，s)，8.37(1H，m)，8.86(1H，d，J= 2 Hz)，9.03(1H，d，J= 2 Hz)。

MS(ESI^+)：m/z 300 302.

製備例 336

將 NaH 溶在 DMF(50 mL)，清洗以己烷 3 次，於 10℃ 及冰水浴下，於氮氣下分批加入 5-羥菸鹼酸甲酯(10.2 g)。30 分鐘後，滴加入甲基碘(4.56 mL)。可形成沈澱並難以攪拌。加入 DMF(30 mL)。20 分鐘後，於室温下攪拌 3 小時。中止反應以加入 MeOH，真空濃縮。加入 $CHCl_3$，飽和 $NaHCO_3$，及食鹽水。分離有機層，將水層萃取以 $CHCl_3$。將結合有機層於硫酸鎂下乾燥，真空蒸發。將殘渣以驟矽膠柱層析純化(矽膠，200 mL)，溶離以己烷-AcOEt = 5-1 及 3-1 可得 5-甲氧菸鹼酸甲酯(3.47 g)之淡棕色固體

5-甲氧菸鹼酸甲酯

^1H NMR($CDCl_3$)δ 3.91(3H，s)，3.96(3H，s)，7.76(1H，m)，8.47(1H，d，J = 3 Hz)，8.83(1H，d，J = 1 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 168(M + H).

製備例 337

將 2-溴-4-[(5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄酸甲酯(330 mg)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(5 mL)，於冰浴冷卻下及 5 分內加入 60%NaH 之油(58.4 mg)。攪拌 1 小時，於 40 分鐘內分批加入(胺氧基)(二苯基)膦氧化物(340 mg)。攪拌 1 小時。中止反應以加入水(10 mL)。分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以水(2 次)及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。溶在乙酸乙酯-己烷(1-5)，將溶液加入矽膠。過濾，將濾液蒸發可得 4-[(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]-2-溴苄酸甲酯之桔色固體(310 mg)。

4-[(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]-2-溴苄酸甲酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.29(3H，t，J = 7 Hz)，2.76(2H，q，J = 7 Hz)，3.97(3H，s)，5.73(2H，s，br)，5.93(1H，d，J = 5 Hz)，6.62(1H，d，J = 5 Hz)，7.73(1H，d，J = 8 Hz)，7.84(1H，d，J = 8 Hz)，8.02(1H，s).

製備例 338

將 2-溴對酞酸二甲酯(1.04 g)溶在甲醇(10 mL)，於室溫下加入 1 N NaOH(5.71 mL)。攪拌 1.5 小時，中止反應以加入 1 N HCl(7 mL)。可形成白色結晶。加入水(10 mL)以助結晶。濾集結晶，清洗以水，風乾。可得 3-溴-4-(甲氧羰基)苄酸之白色結晶(532 mg)。

3-溴-4-(甲氧羰基)苄酸

^{1}H-NMR(DMSO-d_6)δ 3.89(3H，s)，7.87(1H，d，J = 8 Hz)

，8.01(1H，d，J = 8 Hz)，8.17(1H，s)。

製備例 339

將 2-[2-(2-氯乙氧基)乙氧基]乙酸乙酯(6.23 g)及 NaI(22.2 g)溶在丙酮(60 mL)，回流 4 小時。加入 NaI(11.0 g)後再回流 4 小時。蒸發溶劑，分層於 EtOAc(50 mL)及水(50 mL)。將水層清洗以 10%硫代硫酸鈉及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 2-[2-(2-碘乙氧基)乙氧基]乙酸乙酯之淡黃色油(9.74 g)。

2-[2-(2-碘乙氧基)乙氧基]乙酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 2.09(3H，s)，3.27(2H，t，J = 7 Hz)，3.65-3.78(8H，m)，4.24(2H，m)。

製備例 340

將 2-[(5-甲基-3-異噁唑基)羰基]庚二酸 1-第三丁酯 7-乙酯(126 mg)溶在三氟乙酸(1 mL)，於室溫下攪拌 1.5 小時。蒸發揮發物，共沸以甲苯可得 7-乙氧基-2-[(5-甲基-3-異噁唑基)羰基]-7-氧庚酸 之淡桔色油(106 mg)。

7-乙氧基-2-[(5-甲基-3-異噁唑基)羰基]-7-氧庚酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J = 7 Hz)，1.41(2H，m)，1.65(2H，m)，2.02(2H，m)，2.30(2H，m)，2.50(3H，s)，2.55(1H，s，br)，4.10(2H，q，J = 7 Hz)，4.47(1H，t，J = 7 Hz)，6.40(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 296.22(M-H)及 593.52(2M-H)

製備例 341

將二甲碸(5.43 g)溶在四氫呋喃(10 mL)，於乾冰-丙酮浴及

氮氣下加入 1.59 M 正丁鋰(36.3 mL)。攪拌 0.5 小時，加入甲氧乙酸甲酯(2.00 g)之四氫呋喃(5 mL)。攪拌 2 小時，回溫至室溫 2 小時。分層於 EtOAc 及 4 N HCl。中止反應以加入 4 N HClin EtOAc(15 mL)。分層於 EtOAc(100 mL)及食鹽水(100 mL)。將水層清洗以 EtOAc(100 mL，5 次)。結合有機層，將結合萃取液於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以驟矽膠柱層析純化(EtOAc-己烷 = 50-200～300-100)可得 2-(甲磺醯基)-1-甲氧乙酮之無色油(2.24 g)。

1-甲氧基-3-(甲磺醯基)丙酮

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 2.99(3H，s)，3.08(2H，s)，3.47(3H，s)，4.19(2H，s).

下列化合物之製備可仿例 1 之方法來進行。

例 392

4-[3-溴-4-(甲氧羰基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.98(3H，t，J = 7 Hz)，1.38(3H，t，J = 7 Hz)，2.61(3H，s)，3.04(2H，q，J = 7 Hz)，3.98(3H，s)，4.05(2H，q，J = 7 Hz)，6.29(1H，d，J = 5 Hz)，6.67(1H，d，J = 7 Hz)，7.44(1H，d，J = 8 Hz)，7.76(1H，s)，7.89(1H，d，J = 8 Hz).

例 393

3-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 7 Hz)，2.98(2H，q，J =

7 Hz)，3.18(3H，s)，3.45(3H，s)，4.59(2H，s)，6.25(1H，d，J = 5 Hz)，6.71(1H，d，J = 5 Hz)，7.65(1H，t，J = 8 Hz)，7.78(1H，d，J = 8 Hz)，7.94(1H，d，J = 8 Hz)，7.99(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 370(M + H)

下列化合物之製備可仿例 16 之方法來進行。

例 394

5-{4-[3-(胺羰基)苯基]-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.02(4H，m)，1.28(3H，t，J = 7 Hz)，1.70(2H，m)，2.37(2H，m)，2.92(2H，q，J = 7 Hz)，5.87(1H，d，J = 5 Hz)，6.66(1H，d，J = 5 Hz)，7.46-7.67(5H，m)，7.96-8.08(3H，m).

下列化合物之製備可仿例 21 之方法來進行。

例 395

4-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.21(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.65-1.78(2H，m)，2.22(2H，t，J= 7 Hz)，2.40-2.52(2H，m)，2.58(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.05(2H，q，J= 7 Hz)，5.86(1H，d，J= 4 Hz)，6.53(1H，d，J= 4 Hz)，7.25(1H，d，J= 5 Hz)，7.36(1H，s)，8.53(1H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 386 .

例 396

3-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.30-2.39(2H，m)，2.57(3H，s)，2.74-2.83(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.55(1H，d，J= 4 Hz)，7.24(1H，d，J= 5 Hz)，7.35(1H，s)，8.53(1H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 372.

例 397

5-[2-苄基-4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.30-1.50(4H，m)，2.10(2H，t，J= 7 Hz)，2.23-2.35(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，4.09(2H，q，J= 7 Hz)，4.21(2H，s)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.14-7.32(7H，m)，8.50(1H，d，J= 5 Hz).

例 398

{2-[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙氧基}乙酸甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.42(3H，s)，2.61(3H，s)，2.78-2.88(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.46-3.57(2H，m)，3.71(3H，s)，3.95(2H，s)，5.87(1H，d，J= 4 Hz)，6.52(1H，d，J= 4 Hz)，7.54(1H，s)，8.43(1H，d，J= 2 Hz)，8.53(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 368.

例 399

[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.51(3H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.43(2H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，5.99(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.94(1H，m)，8.58(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 402 404.

例 400

3-[2-[(乙醯氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.16(3H，s)，2.32-2.42(2H，m)，2.44(3H，s)，2.77-2.90(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，5.31(2H，s)，5.96(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.53(1H，s)，8.42(1H，d，J=2 Hz)，8.55(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 410.

例 401

4-[2-[(乙醯氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.64-1.78(2H，m)，2.10-2.23(2H，m)，2.17(3H，s)

，2.43(3H，s)，2.43-2.58(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，5.33(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.53(1H，s)，8.43(1H，s)，8.55(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 424.

例 402

5-[2-[(乙醯氧基)甲基]-4-(3-氰苯基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.60(4H，m)，2.16(2H，t，J= 7 Hz)，2.17(3H，s)，2.40-2.52(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，5.29(2H，s)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.60-7.68(3H，m)，7.75-7.83(1H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 448.

例 403

4-[2-[(乙醯氧基)甲基]-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.65-1.82(2H，m)，2.17(3H，s)，2.21(2H，t，J= 7 Hz)，2.45-2.63(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，4.05(2H，q，J= 7 Hz)，5.33(2H，s)，5.95(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.90(1H，m)，8.57(1H，d，J= 2 Hz)，8.80(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 488 490.

例 404

3-[2-[(乙醯氧基)甲基]-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.16(3H，s)，2.36(2H，t，J= 7 Hz)，2.77-2.95(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，4.06(2H，q，J= 7 Hz)，5.31(2H，s)，5.96(1H，d，J= 4 Hz)，6.64(1H，d，J= 4 Hz)，7.88(1H，s)，8.56(1H，m)，8.80(1H，m).

MS(ESI^+)：m/z 474 476.

例 405

3-[2-[(環己基甲氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.88-1.06(2H，m)，1.19(3H，t，J= 7 Hz)，1.15-1.36(3H，m)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.58-1.85(6H，m)，2.42(2H，m)，2.43(3H，s)，2.83-2.97(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，3.38(2H，d，J= 7 Hz)，4.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.66(2H，s)，5.91(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.52(1H，s)，8.42(1H，d，J= 2 Hz)，8.54(1H，d，J= 2 Hz).

例 406

3-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(環己基甲氧基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.85-1.06(2H，m)，1.20(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.16-1.46(3H，m)，1.55-1.84(6H，m)，2.43(2H，t，J= 7 Hz)，2.82-3.00(2H，m)，3.06(2H

，q，J= 7 Hz)，3.37(2H，d，J= 7 Hz)，4.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.66(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.87(1H，m)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 528 530.

例 407

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(環己基甲氧基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.87-1.06(2H，m)，1.21(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.16-1.46(3H，m)，1.50-1.85(8H，m)，2.23(2H，t，J= 7 Hz)，2.55-2.75(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，3.38(2H，d，J= 7 Hz)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.67(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.89(1H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.79(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 542 544.

例 408

4-[2-[(環丙基甲氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.22-0.32(2H，m)，0.53-0.65(2H，m)，1.10-1.20(1H，m)，1.19(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.65-1.80(2H，m)，2.14-2.30(2H，m)，2.43(3H，s)，2.57-2.74(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，3.43(2H，d，J= 7 Hz)，4.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.74(2H，s)，5.90(1H，d，J= 4 Hz)，6.57(1H，d，J= 4 Hz)，7.53(1H，s)，8.43(1H，s)，8.54(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 436.

例 409

3-[2-[(環丙基甲氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.22-0.32(2H，m)，0.54-0.63(2H，m)，1.10-1.20(1H，m)，1.21(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.40-2.50(2H，m)，2.43(3H，s)，2.86-2.98(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，3.42(2H，d，J= 7 Hz)，4.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.71(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.52(1H，s)，8.42(1H，s)，8.54(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 422.

例 410

3-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-甲氧乙氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.44(2H，t，J= 7 Hz)，2.82-2.98(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，3.38(3H，s)，3.58(2H，m)，3.76(2H，m)，4.05(2H，q，J= 7 Hz)，4.76(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.87(1H，m)，8.54(1H，s)，8.79(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 490 492.

例 411

4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.39(3H，t，J= 7 Hz)，2.54(3H，s)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，6.39(1H，s)，6.51(1H，d，J= 4 Hz)，6.67(1H，d，J= 4 Hz)，8.17(1H，m)，8.76(1H，d，J= 2 Hz)，8.86(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 316 318.

例 412

4-[2-[(乙醯氧基)甲基]-4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.70(2H，tt，J = 7，7 Hz)，2.17(3H，s)，2.20(2H，t，J = 7 Hz)，2.45-2.54(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，4.04(2H，q，J = 7 Hz)，5.33(2H，s)，5.94(1H，d，J = 4 Hz)，6.63(1H，d，J = 4 Hz)，7.74(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.53(1H，d，J = 2 Hz)，8.70(1H，d，J = 2 Hz).

例 413

5-{4-(5-氯-3-吡啶基)-2-[(環丙基甲氧基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.23-0.26(2H，m)，0.54-0.59(2H，m)，1.07-1.16(1H，m)，1.23(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.41-1.56(4H，m)，2.17(2H，t，J = 7 Hz)，2.53-2.64(2H，m)，3.03(2H，q，J =7 Hz)，3.41(2H，d，J = 7 Hz)，4.09(2H，q，J = 7 Hz)，4.70(2H，s)，5.90(1H，d，J = 5 Hz)，6.58(1H，d，J = 5 Hz)，7.72(1H，s)，8.51(1H，s)，8.68(1H，s).

例 414

4-{4-(5-氯-3-吡啶基)-2-[(環丙基甲氧基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.24(2H，dt，J = 7，7 Hz)，0.56(2H，dt，J = 7，7 Hz)，1.07-1.15(1H，m)，1.20(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.72(2H，tt，J = 7，7 Hz)，2.21(2H，t，J = 7 Hz)，2.55-2.66(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.43(2H，d，J = 7 Hz)，4.04(2H，q，J = 7 Hz)，4.73(2H，s)，5.91(1H，d，J = 5 Hz)，6.59(1H，d，J = 5 Hz)，7.74(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.52(1H，d，J = 2 Hz)，8.68(1H，d，J = 2 Hz).

例 415

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(異丁氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.92(6小時，d，J = 7 Hz)，1.26(3H，t，J = 7 Hz)，1.34(3H，t，J = 7 Hz)，1.38-1.56(4H，m)，1.92(1H，qt，J = 7，7 Hz)，2.15(2H，t，J = 7 Hz)，2.51-2.63(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.33(2H，d，J = 7 Hz)，4.09(2H，q，J = 7 Hz)，4.65(2H，s)，5.90(1H，d，J = 7 Hz)，6.59(1H，d，J = 7 Hz)，7.88(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.55(1H，d，J = 2 Hz)，8.77(1H，d，J = 2 Hz).

例 416

3-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(異丁氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.92(6H，d，J = 7 Hz)，1.19(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.91(1H，qt，J = 7，7 Hz)，2.41(2H，t，J = 8 Hz)，2.84-2.94(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.35(2H，d，J = 7 H)，4.05(2H，q，J = 7 Hz)，4.68(2H，s)，5.92(1H，d，J = 4 Hz)，6.61(1H，d，J = 4 Hz)，7.72(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.51(1H，d，J = 2 Hz)，8.69(1H，d，J = 2 Hz).

例 417

3-[2-[(乙醯氧基)甲基]-4-(3-氯苯基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.19(3H，t，J = 7 Hz)，1.36(3H，t，J = 7 Hz)，2.15(3H，s)，2.33(2H，t，J = 8 Hz)，2.82(2H，t，J = 8 Hz)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，4.06(2H，q，J = 7 Hz)，5.31(2H，s)，5.97(1H，d，J = 4 Hz)，6.61(1H，d，J = 4 Hz)，7.23-7.26(1H，m)，7.37(1H，s)，7.44-7.46(2H，m).

例 418

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(異丁氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.92(6H，d，J = 7 Hz)，1.20(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.71(2H，tt，J = 8，8 Hz)，1.91(1H，qt，J = 7，7 Hz)，2.20(2H，t，J = 8 Hz)，2.56-2.66(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.34(2H，d，J = 7 Hz)，4.05(2H，q，J = 7 Hz)，4.69(2H，s)，5.91(1H

，d，J = 5 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，7.89(1H，s)，8.56(1H，d，J = 2 Hz)，8.78(1H，d，J = 2 Hz).

例 419

2，4-雙(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.45(3H，t，J= 7 Hz)，3.14(2H，q，J= 7 Hz)，6.66(1H，d，J= 4 Hz)，6.86(1H，d，J= 4 Hz)，6.91(1H，s)，8.23(1H，m)，8.48(1H，m)，8.77(1H，m)，8.83(1H，m)，8.94(1H，d，J= 2 Hz)，9.18(1H，d，J= 2 Hz).

例 420

4-[2-[(乙醯氧基)甲基]-4-(3-氯苯基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.19(3H，t，J = 8 Hz)，1.34(3H，t，J = 8 Hz)，1.63-1.76(2H，m)，2.10-2.22(5H，m)，2.45-2.55(2H，m)，3.01(2H，q，J = 8 Hz)，4.04(2H，q，J = 8 Hz)，5.32(2H，s)，5.95(1H，d，J = 5 Hz)，6.59(1H，d，J = 5 Hz)，7.21-7.29(1H，與 $CDCl_3$ 重覆)，7.36(1H，br s)，7.38-7.46(2H，m).

MS(ESI^+)：m/z 443(M + H).

例 421

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲氧基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 8 Hz)，1.33-1.60(7H，m)，1.55-1.70(2H，m)，2.17(2H，t，J = 8 Hz)，2.46-2.64(2H，m)，3.04(2H，d，J = 8 Hz)，3.46(3H，s)，3.90(3H，s)

，4.09(2H，q，J = 8 Hz)，4.62(2H，s)，5.93(1H，d，J = 5 Hz)，6.59(1H，d，J = 5 Hz)，7.23(1H，m)，8.22(1H，d，J = 1 Hz)，8.40(1H，d，J = 3 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 426(M + H).

例 422

5-[7-乙基-4-(5-甲氧基-3-吡啶基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 8 Hz)，1.33-1.62(7H，m)，2.18(2H，t，J = 8 Hz)，2.38-2.49(2H，m)，2.56(3H，s)，3.01(2H，q，J = 8 Hz)，3.90(3H，s)，4.08(2H，q，J = 8 Hz)，5.89(1H，d，J = 5 Hz)，6.51(1H，d，J = 5 Hz)，7.21(1H，m)，8.21(1H，d，J = 1 Hz)，8.40(1H，d，J = 3 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 396(M + H).

例 423

3-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲氧基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J = 8 Hz)，1.38(3H，t，J = 8 Hz)，2.40(2H，t，J = 8 Hz)，2.81-2.96(2H，m)，3.04(2H，d，J = 8 Hz)，3.47(3H，s)，3.90(3H，s)，4.05(2H，q，J = 8 Hz)，4.65(2H，s)，5.96(1H，d，J = 5 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，7.21(1H，m)，8.23(1H，br s)，8.40(1H，d，J = 3 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 398(M + H).

例 424

4-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲氧基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J = 8 Hz)，1.38(3H，t，J = 8 Hz)，1.64-1.79(2H，m)，2.14-2.24(2H，m)，2.53-2.66(2H，m)，3.04(2H，d，J = 8 Hz)，3.47(3H，s)，3.90(3H，s)，4.04(2H，q，J = 8 Hz)，4.67(2H，br s)，5.94(1H，d，J = 5 Hz)，6.59(1H，d，J = 5 Hz)，7.23(1H，m)，8.22(1H，d，J = 1 Hz)，8.40(1H，d，J = 3 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 412(M + H).

例 425

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-嘧啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 8 Hz)，1.30-1.62(7H，m)，2.19(2H，t，J = 8 Hz)，2.46-2.60(2H，m)，3.04(2H，d，J = 8 Hz)，3.47(3H，s)，3.90(3H，s)，4.09(2H，q，J = 8 Hz)，4.63(2H，s)，5.90(1H，d，J = 5 Hz)，6.61(1H，d，J = 5 Hz)，8.80(2H，s)，9.34(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 397(M + H).

例 426

4-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.21(3H，t，J = 8 Hz)，1.37(3H，t，J = 8 Hz)，1.62-1.76(2H，m)，2.21(2H，t，J = 8 Hz)，2.49-2.67(2H，m)，3.04(2H，d，J = 8 Hz)，3.46(3H，s)，4.06(2H，q

，J = 8 Hz)，4.67(2H，br s)，5.92(1H，d，J = 5 Hz)，6.61(1H，d，J = 5 Hz)，7.74(1H，m)，8.53(1H，d，J = 1 Hz)，8.69(1H，d，J = 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 414(M-H).

例 427

3-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J = 8 Hz)，1.38(3H，t，J = 8 Hz)，2.40(2H，t，J = 8 Hz)，2.82-2.94(2H，m)，3.04(2H，d，J = 8 Hz)，3.47(3H，s)，4.06(2H，q，J = 8 Hz)，4.65(2H，s)，5.93(1H，d，J = 5 Hz)，6.67(1H，d，J = 5 Hz)，7.73(1H，br s)，8.51(1H，br s)，8.70(1H，br s).

MS(ESI$^+$)：m/z 402(M + H).

例 428

5-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 8 Hz)，1.34-1.60(7H，m)，2.19(2H，t，J = 8 Hz)，2.47-2.64(2H，m)，3.04(2H，d，J = 8 Hz)，3.46(3H，s)，4.10(2H，q，J = 8 Hz)，4.62(2H，s)，5.90(1H，d，J = 5 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，7.73(1H，m)，8.51(1H，br s)，8.68(1H，br s).

MS(ESI$^+$)：m/z 426(M + H).

例 429

2-[(乙醯氧基)甲基]-4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，

2-b]嗒咿基-3-羧酸甲酯

熔點：122-123 deg.

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 8 Hz)，2.12(3H，s)，3.06(2H，t，J = 8 Hz)，3.61(3H，s)，5.43(2H，s)，6.37(1H，d，J = 5 Hz)，6.78(1H，d，J = 5 Hz)，7.93(1H，t，J = 1 Hz)，8.57(1H，d，J = 1 Hz)，8.78(1H，d，J = 1 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 432，434(M + H).

例 430

2-(2-{2-[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙氧基}乙氧基)乙酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 7 Hz)，2.05(3H，s)，2.42(3H，s)，2.59(3H，s)，2.75(2H，m)，3.00(2H，q，J = 7 Hz)，3.39-3.48(4H，m)，3.54(2H，m)，3.63(2H，m)，4.16(2H，m)，5.86(1H，d，J = 5 Hz)，6.52(1H，d，J = 5 Hz)，7.50(1H，m)，8.43(1H，m)，8.52(1H，m).

例 431

(2E)-4-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-2-丁烯酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.27(3H，t，J = 7 Hz)，1.36(3H，t，J = 7 Hz)，2.49(3H，s)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.30(2H，m)，4.16(2H，q，J = 7 Hz)，5.58(1H，d，J = 16 Hz)，5.90(1H，d，J = 5 Hz)，6.56(1H，d，J = 5 Hz)，6.97(1H，dt，J = 7 及 16 Hz)，7.58(2H，m)，7.65(1H，s)，7.75(1H，m).

例 432

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1,2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz, $CDCl_3$)δ 1.23(3H, t, J= 7 Hz), 1.37(3H, t, J= 7 Hz), 1.65-1.78(2H, m), 2.23(2H, t, J= 7 Hz), 2.54-2.72(2H, m), 3.04(2H, q, J= 7 Hz), 3.46(3H, s), 4.06(2H, q, J= 7 Hz), 4.66(2H, s), 5.93(1H, d, J= 4 Hz), 6.62(1H, d, J= 4 Hz), 7.89(1H, m), 8.55(1H, d, J= 2 Hz), 8.77(1H, d, J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$): m/z 460 462.

例 433

4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1, 2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.99(3H, t, J = 8 Hz), 1.38(3H, t, J = 8 Hz), 2.63(3H, s), 3.05(2H, q, J = 8 Hz), 4.07(2H, q, J = 8 Hz), 6.27(1H, d, J = 5 Hz), 6.70(1H, d, J = 5 Hz), 7.30(1H, dd, J = 5, 1 Hz), 7.41(1H, br s), 8.49(1H, d, J = 5 Hz).

MS(ESI$^+$): m/z 344(M + H).

下列化合物之製備可仿例 76 之方法來進行。

例 434

4-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1, 2-b]嗒咿-3-基]丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H, t, J= 7 Hz), 1.72-1.84(2H, m), 2.33(2H, t, J= 7 Hz), 2.47-2.57(2H, m), 2.58(3H,

s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.53(1H，d，J= 4 Hz)，7.27(1H，m)，7.38(1H，s)，8.53(1H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI⁻)：m/z 356，MS(ESI⁺)：m/z 358.

例 435

3-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.36-2.47(2H，m)，2.58(3H，s)，2.76-2.88(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，5.89(1H，d，J= 4 Hz)，6.55(1H，d，J= 4 Hz)，7.25(1H，d，J= 5 Hz)，7.35(1H，s)，8.53(1H，d，J= 5 Hz).

例 436

4-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.30-1.42(2H，m)，1.35(9H，s)，1.63-1.76(2H，m)，2.22-2.37(4H，m)，3.93(1H，d，J= 17 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.29(1H，d，J= 17 Hz)，7.22(2H，d，J= 8 Hz)，7.26-7.36(4H，m)，7.50(1H，s)，8.42(1H，d，J= 5 Hz)。

MS(ESI⁻)：m/z 418，MS(ESI⁺)：m/z 420。

例 437

3-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J= 7 Hz)，2.06(2H，t，J= 7

Hz)，2.78(2H，t，J= 7 Hz)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，5.99(1H，d，J= 4 Hz)，6.67(1H，d，J= 4 Hz)，7.28(1H，d，J= 5 Hz)，7.41(1H，s)，7.45-7.55(5H，m)，8.53(1H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI$^-$)：m/z 404，MS(ESI$^+$)：m/z 406.

例 438

5-[2-苄基-4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.16-1.32(2H，m)，1.39(3H，t，J= 7 Hz)，1.38-1.53(2H，m)，2.15(2H，t，J= 7 Hz)，2.30-2.40(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.21(2H，s)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.18-7.35(7H，m)，8.49(1H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI$^-$)：m/z 446，MS(ESI$^+$)：m/z 448.

例 439

{2-[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙氧基}乙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.44(3H，s)，2.59(3H，s)，2.74-2.92(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.54-3.66(2H，m)，3.93(2H，m)，5.82(1H，d，J= 4 Hz)，6.53(1H，d，J= 4 Hz)，7.63(1H，s)，8.52(1H，s)，8.56(1H，s).

例 440

{2-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙氧基}乙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.80(2H，t，J= 7 Hz)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.20(2H，t，J= 7 Hz)，3.72(3H，s)，6.01(1H，d，J= 4 Hz)，6.67(1H，d，J= 4 Hz)，7.42(1H，d，J= 5 Hz)，7.45-7.60(6H，m)，8.57(1H，d，J= 5 Hz).

例 441

[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.55(3H，s)，2.97-3.10(2H，m)，3.30-3.62(2H，m)，5.97(1H，m)，6.57(1H，m)，8.03(1H，s)，8.69(1H，s)，8.77(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 374 376.

例 442

3-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.33-2.50(2H，m)，2.42(3H，s)，2.80-3.00(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.72(2H，s)，4.83(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.36(2H，d，J= 7 Hz)，7.55(1H，s)，8.41(1H，s)，8.44(2H，d，J= 7 Hz)，8.53(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 429 431.

例 443

3-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(2-吡咿甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.42(3H，s)，

2.40-2.55(2H，m)，2.83-3.12(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.84(2H，s)，4.91(2H，m)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.57(1H，s)，8.42(1H，s)，8.48-8.55(3H，m)，8.76(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 432.

例 444

3-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(2-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.50-2.60(2H，m)，2.88-3.05(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.81(2H，s)，4.87(2H，s)，5.82(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.27(1H，m)，7.48(1H，d，J= 8 Hz)，7.56(1H，s)，7.77(1H，t，J= 8 Hz)，8.43(1H，s)，8.54(2H，m).

例 445

4-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.40(3H，t，J= 7 Hz)，1.70-1.85(2H，m)，2.16-2.31(2H，m)，2.44(3H，s)，2.53-2.83(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，4.72(2H，s)，4.83-4.98(2H，m)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.30(2H，d，J= 7 Hz)，7.57(1H，s)，8.38-8.55(4H，m).

MS(ESI$^-$)：m/z 443，MS(ESI$^+$)：m/z 445.

例 446

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡

咯并[1，2-b]嗒吲-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.63(4H，m)，2.20(2H，t，J= 7 Hz)，2.52-2.68(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，4.69(2H，s)，4.78(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.35(2H，d，J= 6 Hz)，7.88(1H，m)，8.54(2H，d，J= 6 Hz)，8.55(1H，m)，8.79(1H，m).

例 447

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(3-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒吲-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.62(4H，m)，2.17(2H，t，J= 7 Hz)，2.50-2.67(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，4.69(2H，s)，4.76(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.32-7.38(1H，m)，7.77(1H，d，J= 8 Hz)，7.88(1H，m)，8.55(2H，m)，8.65(1H，m)，8.78(1H，m).

MS(ESI^-)：m/z 521 523，MS(ESI^+)：m/z 523 525.

例 448

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒吲-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.48-1.67(4H，m)，2.26(2H，t，J= 7 Hz)，2.53-2.75(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.82(2H，s)，4.83(2H，s)，5.90(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.26-7.34(1H，m)，7.53(1H，d，J= 8 Hz)，7.75-7.83(1H，m)，7.87(1H，m)，8.55(1H，d

，J= 2 Hz)，8.62(1H，m)，8.77(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 523 525.

例 449

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-吡啉甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.45-1.64(4H，m)，2.23(2H，t，J= 7 Hz)，2.53-2.72(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.83(2H，s)，4.87(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.88(1H，m)，8.53(3H，m)，8.77(2H，m).

MS(ESI$^-$)：m/z 522 524，MS(ESI$^+$)：m/z 524 526.

例 450

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基}丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.39(3H，t，J= 7 Hz)，1.69-1.84(2H，m)，2.27(2H，t，J= 7 Hz)，2.56-2.80(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，4.73(2H，s)，4.92(2H，m)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.31(2H，d，J= 6 Hz)，7.90(1H，m)，8.46(2H，d，J= 6 Hz)，8.57(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^-$)：m/z 507 509，MS(ESI$^+$)：m/z 509 511.

例 451

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(3-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基}丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.66-1.83(2H，m)，2.26(2H，t，J= 7 Hz)，2.53-2.77(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，4.71(2H，s)，4.86(2H，m)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.33(1H，m)，7.78(1H，d，J= 8 Hz)，7.90(1H，m)，8.50(1H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.60(1H，s)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 509 511.

例 452

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.70-1.85(2H，m)，2.23-2.34(2H，m)，2.57-2.76(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.81(2H，s)，4.90(2H，m)，5.91(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.28(1H，m)，7.49(1H，d，J= 7 Hz)，7.77(1H，t，J= 8 Hz)，7.88(1H，m)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.57(1H，m)，8.74(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 509 511.

例 453

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(環丙基甲氧基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.22(2H，m)，0.57(2H，m)，1.07-1.22(1H，m)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.72-1.87(2H，m)，2.28(2H，t，J= 7 Hz)，2.58-2.77(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.41(2H，d，J= 7 Hz)，4.72(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)

，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.93(1H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.77(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI⁻)：m/z 470 472，MS(ESI⁺)：m/z 472 474.

例 454

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-吡啉甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基}丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.68-1.83(2H，m)，2.27(2H，t，J= 7 Hz)，2.56-2.78(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.84(2H，s)，4.92(2H，m)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.91(1H，m)，8.51(2H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.76(2H，m).

MS(ESI⁻)：m/z 508 510，MS(ESI⁺)：m/z 510 512.

例 455

3-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基}丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.39(3H，t，J= 7 Hz)，2.38(2H，t，J= 7 Hz)，2.83-2.98(2H，m)，3.07(2H，q，J= 7 Hz)，4.74(2H，s)，4.83(2H，s)，5.95(1H，d，J= 4 Hz)，6.65(1H，d，J= 4 Hz)，7.38(2H，d，J= 6 Hz)，7.88(1H，s)，8.43(2H，d，J= 6 Hz)，8.55(1H，s)，8.78(1H，s).

MS(ESI⁻)：m/z 493 495，MS(ESI⁺)：m/z 495 497.

例 456

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-羥乙氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基}丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.68-1.83(2H，m)，2.28(2H，t，J= 7 Hz)，2.53-2.76(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.75(2H，m)，3.79(2H，m)，4.78(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.90(1H，s)，8.56(1H，s)，8.78(1H，s).

MS(ESI$^-$)：m/z 460 462，MS(ESI$^+$)：m/z 462 464.

例 457

3-[2-[(環己基甲氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.88-1.06(2H，m)，1.10-1.36(3H，m)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.58-1.85(6H，m)，2.42(3H，s)，2.48-2.60(2H，m)，2.80-3.02(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，3.39(2H，d，J= 7 Hz)，4.67(2H，m)，5.89(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.57(1H，s)，8.42(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI$^-$)：m/z 434，MS(ESI$^+$)：m/z 436.

例 458

3-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(環己基甲氧基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.88-1.05(2H，m)，1.10-1.36(3H，m)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.56-1.83(6H，m)，2.51(2H，t，J= 7 Hz)，2.80-3.07(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，3.37(2H，d，J= 7 Hz)，4.67(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.89(1H，m)，8.55(1H，s)，8.79(1H，s).

MS(ESI$^-$)：m/z 498 500，MS(ESI$^+$)：m/z 500 502.

例 459

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(環己基甲氧基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.86-1.03(2H，m)，1.10-1.35(3H，m)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.60-1.82(8H，m)，2.28(2H，t，J= 7 Hz)，2.55-2.76(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，3.36(2H，d，J= 7 Hz)，4.67(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.91(1H，m)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.76(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^-$)：m/z 512 514，MS(ESI$^+$)：m/z 514 516.

例 460

4-[2-[(環丙基甲氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.22-0.32(2H，m)，0.55-0.63(2H，m)，1.10-1.22(1H，m)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.73-1.86(2H，m)，2.20-2.35(2H，m)，2.46(3H，s)，2.55-2.86(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，3.43(2H，d，J= 7 Hz)，4.70-4.85(2H，m)，5.88(1H，d，J= 4 Hz)，6.57(1H，d，J= 4 Hz)，7.62(1H，s)，8.42(1H，s)，8.46(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 408.

例 461

3-[2-[(環丙基甲氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.23-0.35(2H，m)，0.54-0.65(2H，m)，1.08-1.24(1H，m)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.50-2.65(2H，m)，2.70-3.05(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，3.44(2H，d，J= 7 Hz)，4.74(2H，s)，5.89(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.56(1H，s)，8.42(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI^-)：m/z 392，MS(ESI^+)：m/z 394.

例 462

3-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-甲氧乙氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.48-2.62(2H，m)，2.83-3.02(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.37(3H，s)，3.60(2H，m)，3.73(2H，m)，4.75(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.89(1H，m)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^-)：m/z 460 462，MS(ESI^+)：m/z 462 464.

例 463

5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[(4-嗎啉基羰基)氧基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.35-1.65(4H，m)，2.23(2H，t，J= 7 Hz)，2.40-2.56(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.48-3.57(4H，m)，3.60-3.78(4H，m)，5.33(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.89(1H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.79(1H，d，J= 2 Hz).

例 464

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-2-({[(二甲胺基)羰基]氧基}甲基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J= 7 Hz)，1.45-1.65(4H，m)，2.22(2H，t，J= 7 Hz)，2.42-2.57(2H，m)，2.97(6H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，5.30(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.89(1H，s)，8.54(1H，s)，8.78(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 503 505.

例 465

5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[(1-吡咯啶羰基)氧基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基)戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.63(4H，m)，1.82-1.97(4H，m)，2.23(2H，t，J= 7 Hz)，2.43-2.58(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.37-3.52(4H，m)，5.31(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.88(1H，m)，8.54(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^-)：m/z 527 529，MS(ESI^+)：m/z 529 531.

例 466

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[({[甲基(苯基)胺基]羰基}氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.58(4H，m)，2.18(2H，t，J= 7 Hz)，2.32-2.53(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，3.37(3H，s)，5.36(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)

，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.16-7.40(5H，m)，7.87(1H，s)，8.52(1H，s)，8.79(1H，s).

例 467

4-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[(4-嗎啉基羰基)氧基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基)丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.65-1.84(2H，m)，2.27(2H，t，J= 7 Hz)，2.45-2.68(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，3.53(4H，m)，3.69(4H，m)，5.36(2H，s)，5.95(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.91(1H，m)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

例 468

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-2-({[(二甲胺基)羰基]氧基}甲基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J= 7 Hz)，1.66-1.82(2H，m)，2.27(2H，t，J= 7 Hz)，2.46-2.68(2H，m)，2.97(6H，s)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，5.33(2H，s)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.92(1H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

例 469

3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-2-({[(二甲胺基)羰基]氧基}甲基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J= 7 Hz)，2.45(2H，t，J= 7 Hz)，2.82-2.96(2H，m)，2.97(6H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，5.33(2H，s)，5.96(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)

，7.89(1H，m)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^-$)：m/z 473 475，MS(ESI$^+$)：m/z 475 477.

例 470

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(1，1-二氧-4-硫嗎啉基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}戊酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J = 7 Hz)，1.42-1.56(4H，m)，2.26(2H，t，J = 7 Hz)，2.48-2.61(2H，m)，3.01(2H，q，J = 7 Hz)，3.10(4H，t，J = 6 Hz)，3.19(4H，t，J = 6 Hz)，3.85(2H，s)，5.92(1H，d，J = 4 Hz)，6.61(1H，d，J = 4 Hz)，7.89(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.56(1H，d，J = 2 Hz)，8.78(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)550(M+H).

例 471

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-硫嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.43-1.58(4H，m)，2.24(2H，t，J = 7 Hz)，2.49-2.61(2H，m)，2.66(4H，t，J = 4 Hz)，2.86(4H，t，J = 4 Hz)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.68(2H，s)，5.89(1H，d，J = 5 Hz)，6.58(1H，d，J = 5 Hz)，7.90(1H，s)，8.56(1H，s)，8.79(1H，s).

MS(m/z)518(M+H).

例 472

5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[4-(2-羥乙基)-1-哌呯基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基)戊酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.34(3H，t，J = 7 Hz)，1.41-1.57(4H，m)，2.21(2H，t，J = 6 Hz)，2.43-2.57(2H，m)，2.80-2.84(4H，m)，2.91-3.00(6H，m)，3.65(2H，s)，3.83(2H，m)，5.88(1H，d，J = 5 Hz)，6.57(1H，d，J = 5 Hz)，7.88(1H，s)，8.55(1H，s)，8.77(1H，s).

MS(m/z)545(M+H).

例 473

4-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-硫嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.72(2H，tt，J = 7，7 Hz)，2.26(2H，t，J = 7 Hz)，2.53-2.68(6H，m)，2.87-2.90(4H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.72(2H，s)，5.91(1H，d，J = 4 Hz)，6.59(1H，d，J = 4 Hz)，7.78(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.52(1H，d，J = 2 Hz)，8.68(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)460(M+H).

例 474

4-{4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 7 Hz)，1.73(2H，tt，J = 7，7 Hz)，2.25(2H，t，J = 7 Hz)，2.57-2.73(2H，m)，3.04(2H，q，J = 7 Hz)，4.72(2H，s)，4.89(2H，s)，5.93(1H，d，J =5 Hz)，6.63(1H，d，J =5 Hz)，7.31(2H，d，J = 6 Hz)，7.76(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.46(2H，d

，J = 6 Hz)，8.53(1H，d，J = 2 Hz)，8.67(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)465(M+H).

例 475

4-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基]丁酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.73(2H，tt，J = 7，7 Hz)，2.26(2H，t，J = 7 Hz)，2.54-2.72(6H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.66-3.73(6H，m)，5.90(1H，d，J = 4 Hz)，6.59(1H，d，J = 4 Hz)，7.79(1H，s)，8.53(1H，s)，8.67(1H，s).

MS(m/z)443(M+H).

例 476

5-{4-(5-氯-3-吡啶基)-2-[(環丙基甲氧基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基}戊酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.24(2H，dt，J = 7，7 Hz)，0.57(2H，dt，J = 7，7 Hz)，1.07-1.17(1H，m)，1.38(3H，t，J = 7 Hz)，1.45-1.61(4H，m)，2.23(2H，t，J = 7 Hz)，2.52-2.66(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.41(2H，d，J = 7 Hz)，4.70(2H，s)，5.90(1H，d，J = 4 Hz)，6.59(1H，d，J = 4 Hz)，7.74(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.52(1H，d，J = 2 Hz)，8.68(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)442(M+H).

例 477

4-{4-(5-氯-3-吡啶基)-2-[(環丙基甲氧基)甲基]-7-乙基吡

咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.23(2H，dt，J = 6，6 Hz)，0.56(2H，dt，J = 6，6 Hz)，1.05-1.17(1H，m)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.75(2H，tt，J = 7，7 Hz)，2.28(2H，t，J = 7 Hz)，2.57-2.70(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.42(2H，d，J = 7 Hz)，4.73(2H，s)，5.91(1H，d，J = 5 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，7.77(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.52(1H，d，J = 2 Hz)，8.66(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)428(M+H).

例 478

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(異丁氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.93(6H，d，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.42-1.59(4H，m)，1.92(1H，qt，J = 7，7 Hz)，2.24(2H，t，J = 7 Hz)，2.48-2.69(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.33(2H，d，J = 7 Hz)，4.66(2H，s)，5.91(1H，d，J = 4 Hz)，6.60(1H，d，J = 4 Hz)，7.90(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.56(1H，d，J = 2 Hz)，8.77(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)489(M+H).

例 479

3-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(異丁氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.92(6H，d，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.91(1H，qt，J = 7，7 Hz)，2.49(2H，t，J

= 8 Hz)，2.82-2.98(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.35(2H，d，J = 7 Hz)，4.69(2H，s)，5.92(1H，d，J = 4 Hz)，6.61(1H，d，J = 4 Hz)，7.72(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.51(1H，d，J = 2 Hz)，8.69(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)416(M+H).

例 480

3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J = 7 Hz)，2.55(2H，t，J = 8 Hz)，2.66(4H，br s)，2.79-2.97(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.70-3.74(6H，m)，5.92(1H，d，J = 4 Hz)，6.61(1H，d，J = 4 Hz)，7.90(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.55(1H，d，J = 2 Hz)，8.79(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)474(M+H).

例 481

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J = 7 Hz)，1.73(2H，tt，J = 7，7 Hz)，2.26(2H，t，J = 7 Hz)，2.57-2.70(6H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.69(6H，m)，5.90(1H，d，J = 4 Hz)，6.58(1H，d，J = 4 Hz)，7.93(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.57(1H，d，J = 2 Hz)，8.77(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)488(M+H).

例 482

4-{4-(5-氯-3-吡啶基)-2-[(環丙胺基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.54-0.60(2H，m)，0.74-0.79(2H，m)，1.38(3H，t，J = 7 Hz)，1.65(2H，tt，J = 6，6 Hz)，2.21(2H，t，J = 6 Hz)，2.45-2.55(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，4.30(2H，s)，5.04(1H，br s)，5.93(1H，d，J = 5 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，7.73(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.52 (1H，d，J = 2 Hz)，8.69(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)413(M+H).

例 483

5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[(2-苯氧乙基)胺基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J = 7 Hz)，1.42-1.56(4H，m)，2.22(2H，br s)，2.34-2.48(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.38-3.43(2H，br s)，4.23-4.50(4H，m)，5.93(1H，d，J = 4 Hz)，6.60(1H，d，J = 4 Hz)，6.89-6.97(3H，m)，7.23-7.30(2H，m)，7.85(1H，s)，8.52(1H，s)，8.78(1H，s).

MS(m/z)552(M+H).

例 484

5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[(2-羥乙基)(甲基)胺基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J = 7 Hz)，1.34-1.54(4H，m)，2.15-2.26(2H，m)，2.33-2.52(2H，m)

，2.98(2H，q，J = 7 Hz)，3.16(3H，s)，3.59-3.72(2H，m)，3.99-4.10(2H，m)，4.70(2H，s)，5.94(1H，d，J = 4 Hz)，6.59(1H，d，J = 4 Hz)，7.85(1H，s)，8.51(1H，s)，8.73(1H，s).

MS(m/z)490(M+H).

例 485

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(1-哌啶甲基)吡咯并[1，2-b]噻吩-3-基]戊酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J = 7 Hz)，1.39-1.51(6H，m)，1.62-1.71(4H，m)，2.19(2H，t，J = 6 Hz)，2.52-2.65(2H，m)，2.78-2.91(4H，m)，3.10(2H，q，J = 7 Hz)，3.65(2H，s)，5.89(1H，d，J = 5 Hz)，6.58(1H，d，J = 5 Hz)，7.88(1H，s)，8.55(1H，s)，8.76(1H，s).

MS(m/z)500(M+H).

例 486

3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-硫嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]噻吩-3-基]丙酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 7 Hz)，2.52(2H，t，J = 8 Hz)，2.68(4H，t，J = 5 Hz)，2.81-2.95(6H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.74(2H，s)，5.92(1H，d，J = 5 Hz)，6.61(1H，d，J = 5 Hz)，7.89(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.55(1H，d，J = 2 Hz)，8.79(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)490(M+H).

例 487

3-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[4-(2-羥乙基)-1-哌啉基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基)丙酸

^{1}H NMR(300 MHz，DMSO-d_6)δ 1.32(3H，t，J = 7 Hz)，2.40-2.56(12H，m)，2.58-2.65(2H，m)，2.94(2H，q，J = 7 Hz)，3.52(2H，t，J = 5 Hz)，3.67(2H，s)，5.83(1H，d，J = 5 Hz)，6.62(1H，d，J = 5 Hz)，8.25(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.63(1H，d，J = 2 Hz)，8.86(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)517(M+H).

例 488

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(異丁氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基]丁酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.91(6H，d，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.74(2H，tt，J = 8，8 Hz)，1.91(1H，qt，J = 7，7 Hz)，2.27(2H，t，J = 8 Hz)，2.56-2.73(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.33(2H，d，J = 7 Hz)，4.68(2H，s)，5.92(1H，d，J = 5 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，7.92(1H，dd，J = 7，7 Hz)，8.56(1H，d，J = 2 Hz)，8.77(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)475(M+H).

例 489

5-[2-{[2-(苄胺基)-2-氧乙氧基]甲基}-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.33(3H，t，J= 7 Hz)，1.39-1.60(4H，m)，2.15(2H，t，J= 7 Hz)，2.42(3H，s)，2.40-2.58(2H，

m)，2.95(2H，q，J= 7 Hz)，4.19(2H，s)，4.50(2H，d，J= 7 Hz)，4.75(2H，m)，5.91(1H，d，J= 4 Hz)，6.59(1H，d，J= 4 Hz)，7.07(1H，br)，7.22-7.34(5H，m)，7.54(1H，s)，8.40(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI$^-$)：m/z 513，MS(ESI$^+$)：m/z 515.

例 490

5-(7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-{[(苯磺醯基)胺基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J= 7 Hz)，1.23-1.60(4H，m)，2.19(2H，t，J= 7 Hz)，2.28-2.46(2H，m)，2.42(3H，s)，2.97(2H，q，J= 7 Hz)，4.37(2H，m)，5.89(1H，d，J= 4 Hz)，5.90(1H，m)，6.57(1H，d，J= 4 Hz)，7.42-7.53(4H，m)，7.90(2H，d，J= 8 Hz)，8.34(1H，s)，8.53(1H，s).

MS(ESI$^-$)：m/z 505，MS(ESI$^+$)：m/z 507.

例 491

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(1-吡咯啶甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.35(3H，t，J = 7 Hz)，1.39-1.57(4H，m)，1.79-1.88(4H，m)，2.18(2H，t，J = 7 Hz)，2.84-2.89(6H，m)，3.00(2H，q，J = 7 Hz)，3.89-4.02(2H，m)，5.88(1H，d，J = 5 Hz)，6.56(1H，d，J = 5 Hz)，7.87(1H，s)，8.55(1H，s)，8.75(1H，s).

MS(m/z)486(M+H).

例 492

3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 8 Hz)，2.39-2.48(2H，m)，2.83-2.94(2H，m)，3.03(2H，q，J = 8 Hz)，3.45(3H，s)，4.65(2H，s)，5.95(1H，d，J = 5 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，7.24(1H，m)，7.35(1H，br s)，7.40-7.46(2H，m).

MS(ESI^+)：m/z 373(M + H).

例 493

4-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 8 Hz)，1.64-1.78(2H，m)，2.24 (2H，t，J = 8 Hz)，2.56-2.66(2H，m)，3.04(2H，q，J = 8 Hz)，3.45(3H，s)，4.65(2H，s)，5.94(1H，d，J = 5 Hz)，6.59(1H，d，J = 5 Hz)，7.21-7.29(1H，與 $CDCl_3$ 重覆)，7.36(1H，br s)，7.39-7.46(2H，m).

MS(ESI^+)：m/z 387(M + H).

例 494

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-苯基-1-哌呯基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}戊酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.41-1.61(4H，m)，2.22(2H，t，J = 7 Hz)，2.49-2.67(2H，m)，2.76(4H，t，J = 5 Hz)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.20(4H，t，J = 5 Hz)，3.73(2H，s)，5.89(1H，d，J = 5 Hz)，6.58(1H，d，J = 5 Hz)，6.85(1H，dd，J = 8，8 Hz)，6.93(2H，J =

8 Hz)，7.25(2H，J = 8 Hz)，7.90(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.56(1H，d，J = 2 Hz)，8.77(1H，d，J = 2 Hz).

例 495

5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[(2-甲氧乙基)胺基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.28(3H，t，J = 7 Hz)，1.32-1.43(4H，m)，2.03-2.17(2H，m)，2.23-2.41(2H，m)，2.49-2.88(2H，m)，2.98(2H，q，J = 7 Hz)，3.37(3H，s)，3.89-3.99(2H，m)，4.51(2H，s)，5.91(1H，d，J = 5 Hz)，6.57(1H，d，J = 5 Hz)，7.82(1H，s)，8.47(1H，s)，8.72(1H，s).

例 496

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲氧基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

熔點：111-112℃

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 8 Hz)，1.41-1.60(4H，m)，2.21(2H，br t，J = 8 Hz)，2.30-2.70(2H，m)，3.04(2H，d，J = 8 Hz)，3.46(3H，s)，3.90(3H，s)，4.63(2H，br d，J = 5 Hz)，5.92(1H，d，J = 5 Hz)，6.58(2H，d，J = 8 Hz)，7.25(1H，m)，8.22(1H，d，J = 1 Hz)，8.40(1H，d，J = 3 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 398(M + H).

例 497

5-[7-乙基-4-(5-甲氧基-3-吡啶基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒

咁-3-基]戊酸

熔點：133-134℃

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 8 Hz)，1.40-1.62(7H，m)，2.24(2H，t，J = 8 Hz)，2.35-2.49(2H，m)，2.56(3H，s)，3.01(2H，q，J = 8 Hz)，3.89(3H，s)，5.87(1H，d，J = 5 Hz)，6.51(1H，d，J = 5 Hz)，7.23(1H，m)，8.20(1H，d，J = 1 Hz)，8.39(1H，d，J = 3 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 369(M + H).

例 498

3-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲氧基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咁-3-基]丙酸

熔點：164-165℃

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 8 Hz)，2.44-2.54(2H，m)，2.80-3.00(2H，m)，3.04(2H，d，J = 8 Hz)，3.47(3H，s)，3.89(3H，s)，4.66(2H，br s)，5.95(1H，d，J = 5 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，7.25(1H，m)，8.22(1H，d，J = 1 Hz)，8.38(1H，d，J = 3 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 370(M + H).

例 499

4-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲氧基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咁-3-基]丁酸

熔點：140-141℃

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 8 Hz)，1.68-1.82(2H，m)，2.25(2H，t，J = 8 Hz)，2.52-2.75(2H，m)，3.04(2H，

d，J = 8 Hz)，3.46(3H，s)，3.92(3H，s)，4.65(2H，br d，J = 7 Hz)，5.94(1H，d，J = 5 Hz)，6.59(1H，d，J = 5 Hz)，7.29(1H，m)，8.23(1H，d，J = 1 Hz)，8.37(1H，d，J = 3 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 384(M + H).

例 500

5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-嘧啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 8 Hz)，1.40-1.64(4H，m)，2.25(2H，t，J = 8 Hz)，2.49-2.61(2H，m)，3.04(2H，d，J = 8 Hz)，3.47(3H，s)，4.65(2H，s)，5.91(1H，d，J = 5 Hz)，6.62(1H，d，J = 5 Hz)，8.82(2H，s)，9.32(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 369(M + H).

例 501

4-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸

熔點：112-113℃

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 8 Hz)，1.66-1.79(2H，m)，2.28(2H，t，J = 8 Hz)，2.52-2.71(2H，m)，3.05(2H，d，J = 8 Hz)，3.46(3H，s)，4.66(2H，br s)，5.92(1H，d，J = 5 Hz)，6.61(1H，d，J = 5 Hz)，7.77(1H，m)，8.53(1H，d，J = 1 Hz)，8.67(1H，d，J = 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 388(M + H).

例 502

3-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1,2-b]嗒咿-3-基]丙酸

熔點：159-160℃

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H, t, J = 8 Hz), 2.47(2H, br t, J = 8 Hz), 2.79-2.98(2H, m), 3.04(2H, d, J = 8 Hz), 3.47(3H, s), 4.66(2H, s), 5.93(1H, d, J = 5 Hz), 6.67(1H, d, J = 5 Hz), 7.74(1H, m), 8.51(1H, d, J = 1 Hz), 8.68(1H, d, J = 3 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 374, 376(M + H).

例 503

5-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1,2-b]嗒咿-3-基]戊酸

熔點：118-119℃

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H, t, J = 8 Hz), 1.40-1.62(7H, m), 2.24(2H, t, J = 8 Hz), 2.45-2.64(2H, m), 3.04(2H, d, J = 8 Hz), 3.45(3H, s), 4.63(2H, s), 5.91(1H, d, J = 5 Hz), 6.60(1H, d, J = 5 Hz), 7.74(1H, m), 8.51(1H, d, J = 1 Hz), 8.67(1H, d, J = 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 402, 404(M + H).

例 504

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4H-1, 2, 4-三唑-4-基甲基)吡咯并[1, 2-b]嗒咿-3-基]丁酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.36(3H, t, J = 7 Hz), 1.60(2H, m), 2.32(2H, m), 2.46(2H, m), 3.01(2H, q, J = 7 Hz), 5.75(2H

，m)，5.97(1H，d，J = 5 Hz)，6.66(1H，d，J = 5 Hz)，7.87(1H，m)，7.97(1H，s)，8.53(1H，s)，8.65(1H，s)，8.69(1H，s).

例 505

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(環丙胺基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.56(2H，m)，0.75(2H，m)，1.38(3H，t，J = 7 Hz)，1.65(2H，m)，2.21(2H，m)，2.50(2H，m)，3.01(2H，q，J = 7 Hz)，3.27(3H，br)，4.29(2H，s)，5.93(1H，d，J = 5 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，7.98(1H，m)，8.55(1H，m)，8.78(1H，m)。

MS(ESI^+)m/z：457 及 459(M + H)

例 506

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-氧-1，3-噁唑啶-3-基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.68(2H，m)，2.31(2H，m)，2.53(2H，m)，2.98(2H，q，J = 7 Hz)，3.77(2H，m)，4.42(2H，t，J = 7 Hz)，4.67(2H，m)，5.94(1H，d，J = 5 Hz)，6.63(1H，d，J = 5 Hz)，7.89(1H，m)，8.55(1H，m)，8.78(1H，m).

例 507

2-溴-4-[3-(乙氧羰基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.00(3H，t，J = 7 Hz)，1.38(3H，t，J =

7 Hz)，2.62(3H，s)，3.04(2H，q，J = 7 Hz)，4.06(2H，q，J = 7 Hz)，6.29(1H，d，J = 5 Hz)，6.68(1H，d，J = 5 Hz)，7.49(2H，dd，J = 2 及 8 Hz)，7.82(1H，d，J = 2 Hz)，8.07(1H，d，J = 8 Hz)。

MS(ESI$^+$)m/z：431 及 433(M + H)

例 508

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-(苯氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.25-1.49(7H，m)，2.15(2H，m)，2.54(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，5.23(2H，s)，5.86(1H，d，J = 5 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，6.98(1H，t，J = 8 Hz)，7.06(2H，d，J = 8 Hz)，7.28(2H，t，J = 8 Hz)，7.60(2H，m)，7.67(1H，s)，7.77(1H，m).

例 509

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-(3-甲基-2-噻吩基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.14-1.28(4H，m)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，2.01(2H，t，J = 7 Hz)，2.23(3H，s)，2.40(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，5.92(1J，d，J = 5 Hz)(，6.64(1H，d，J = 5 Hz)，6.94(1J，d，J = 5 Hz)，7.33(1H，d，J = 5 Hz)，7.57-7.66(2H，m)，7.73-7.76(2H，m).

例 510

(2E)-4-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-2-丁烯酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 7 Hz)，2.55(3H，s)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.09(2H，d，J = 7 Hz)，5.45(1H，dt，J = 7 及 16 Hz)，6.05(1H，d，J = 5 Hz)，6.25(1H，d，J = 16 Hz)，6.57(1H，d，J = 5 Hz)，7.55(1H，t，J = 8 Hz)，7.66+-7.72(3H，m).

MS(ESI^+)：m/z 345(M+H)

例 511

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.68-1.84(2H，m)，2.28(2H，t，J= 7 Hz)，2.56-2.74(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.46(3H，s)，4.66(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.92(1H，m)，8.57(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^-)：m/z 430 432，MS(ESI^+)：m/z 432 434.

下列化合物之製備可仿例 159 之方法來進行。

例 512

4-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.36(3H，t，J= 7 Hz)，1.35-1.45(2H，m)，1.88(2H，t，J= 7 Hz)，2.43-2.55(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，5.98(1H，d，J= 4 Hz)，6.65(1H，d，J= 4 Hz)，7.33(1H，d，J= 5 Hz)，7.42-7.55(6H，m)，8.55(1H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 448.

例 513

3-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.09(3H，t，J= 7 Hz)，1.36(3H，t，J= 7 Hz)，1.98-2.08(2H，m)，2.75-2.85(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.92(2H，q，J= 7 Hz)，6.00(1H，d，J= 4 Hz)，6.67(1H，d，J= 4 Hz)，7.32(1H，d，J= 5 Hz)，7.42(1H，s)，7.43-7.57(5H，m)，8.55(1H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 434.

例 514

{2-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]乙氧基}乙酸甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J= 7 Hz)，2.73-2.85(2H，t，J= 7 Hz)，3.03(2H，t，J= 7 Hz)，3.15(2H，t，J= 7 Hz)，3.74(2H，s)，4.09(3H，s)，6.02(1H，d，J= 4 Hz)，6.67(1H，d，J= 4 Hz)，7.39(1H，m)，7.42-7.60(6H，m)，8.53(1H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 450.

例 515

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-(3-甲基-2-噻吩基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.09-1.26(7H，m)，1.36(3H，t，J = 7 Hz)，1.93(2H，t，J = 7 Hz)，2.23(3H，s)，2.39(2H，m)，3.03(2H

，q，J = 7 Hz)，4.03(2H，q，J = 7 Hz)，5.93(1H，d，J = 5 Hz)，6.64(1H，d，J = 7 Hz)，6.96(1H，d，J = 5 Hz)，7.33(1H，d，J = 5 Hz)，7.60-7.67(2H，m)，7.72-7.79(2H，m).

例 516

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(2-噻吩基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸甲酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.21-1.47(7H，m)，2.04(2H，t，J = 7 Hz)，2.60(2H，m)，3.05(2H，q，J = 7 Hz)，3.61(3H，s)，5.37(1H，d，J = 5 Hz)，6.63(1H，d，J = 5 Hz)，7.13(1H，m)，7.36(1H，m)，7.44(1H，m)，7.62-7.78(4H，m).

例 517

3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.08(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.98(2H，m)，2.75(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.89(2H，q，J = 7 Hz)，5.93(1H，d，J = 5 Hz)，6.63(1H，d，J = 5 Hz)，7.41-7.55(5H，m)，7.57-7.78(4H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 424(M + H)

例 518

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.02-1.25(7H，m)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.88(2H，t，J = 7 Hz)，2.43(2H，m)，3.01(2H，q，J = 7 Hz)，4.00(2H，q，J = 7 Hz)，5.96(1H，d，J = 5 Hz)，6.60(1H

，d，J = 5 Hz)，7.29(1H，m)，7.37-7.54(8H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 461

例 519

4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-甲腈

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.42(3H，t，J = 8 Hz)，3.12(2H，t，J = 8 Hz)，6.65(1H，d，J = 5 Hz)，6.94(1H，d，J = 5 Hz)，7.51-7.59(3H，m)，7.83-7.91(2H，m)，8.19(1H，m)，8.85-8.92(2H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 403，405(M + H).

下列化合物之製備可仿例 175 之方法來進行。

例 520

5-{4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.36-1.57(4H，m)，2.16(2H，t，J= 7 Hz)，2.51-2.62(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.69(2H，s)，4.78(2H，s)，5.87(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.35(2H，d，J= 5 Hz)，7.61(2H，d，J= 5 Hz)，7.67(1H，s)，7.77(1H，m)，8.54(2H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI$^-$)：m/z 467，MS(ESI$^+$)：m/z 469.

例 521

5-{4-[3-(胺羰基)苯基]-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.47-1.68(4H，m)，2.15-2.40(2H，m)，2.40-2.56(1H，m)，2.82-2.96(1H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，4.68(2H，s)，4.72(1H，d，J= 17 Hz)，4.93(1H，d，J= 17 Hz)，5.83(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.31(2H，d，J= 5 Hz)，7.39(1H，br)，7.45(1H，d，J= 8 Hz)，7.58(1H，t，J= 8 Hz)，7.69(1H，br)，7.77(1H，br)，7.98(1H，d，J= 8 Hz)，8.57(2H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI^-)：m/z 485，MS(ESI^+)：m/z 487.

例 522

5-{4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-[(2-吡啉甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.30-1.57(4H，m)，2.18(2H，m)，2.48-2.65(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.83(2H，s)，4.85(2H，s)，5.86(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.61(2H，d，J= 5 Hz)，7.68(1H，s)，7.77(1H，m)，8.53(2H，d，J= 5 Hz)，8.76(1H，s).

MS(ESI^-)：m/z 468，MS(ESI^+)：m/z 470.

例 523

5-{4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-[(3-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基}戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.38-1.57(4H，m)，2.15(2H，t，J= 7 Hz)，2.49-2.62(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，4.69(2H，s)，4.76(2H，s)，5.85(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.33(1H，m)，7.62(2H，m)，7.67(1H

，s)，7.73-7.82(2H，m)，8.53(1H，d，J= 5 Hz)，8.67(1H，s).

MS(ESI$^-$)：m/z 467，MS(ESI$^+$)：m/z 469.

例 524

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-(5-甲基-3-異噁唑基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.34-1.52(7H，m)，2.17(2H，t，J = 7 Hz)，2.53(3H，s)，2.77(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，5.89(1H，d，J = 5 Hz)，6.54(1H，s)，6.67(1H，d，J = 5 Hz)，7.63(2H，m)，7.68(1H，s)，7.78(1H，m).

例 525

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-(2-噻吩基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.23-1.42(7H，m)，2.07(2H，t，J = 7 Hz)，2.58(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，5.87(1H，d，J = 5 hz)，6.56(1H，d，J = 5 Hz)，7.13(1H，m)，7.36(1H，m)，7.43(1H，d，J = 5 Hz)，7.62(2H，m)，7.70(1H，s)，7.76(1H，m).

例 526

3-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J = 7 Hz)，1.99(2H，m)，2.75(2H，m)，3.00(2H，q，J = 7 Hz)，5.93(1H，d，J = 5 Hz)，6.63(1H，d，J = 5 Hz)，7.42-7.55(5H，m)，7.57-7.78(4H

，m).

例 527

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.03-1.25(4H，m)，1.36(3H，t，J = 7 Hz)，1.90(2H，t，J = 7 Hz)，2.41(2H，m)，3.00(2H，q，J = 7 Hz)，5.97(1H，d，J = 5 Hz)，6.59(1H，d，J = 5 Hz)，7.28(1H，m)，7.35-7.54(8H，m).

MS(ESI^+)：m/z 433(M+H)

下列化合物之製備可仿例 180 之方法來進行。

例 528

5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(5-甲基-3-異噁唑基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J = 7 Hz)，1.32-1.46(5H，m)，1.72(2H，m)，2.10(2H，t，J = 7 Hz)，2.54(3H，s)，2.78(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，4.06(2H，q，J = 7 Hz)，5.89(1H，d，J = 5 Hz)，6.54(1H，s)，6.66(1H，d，J = 5 Hz)，7.62(2H，m)，7.67(1H，s)，7.77(1H，m).

下列化合物之製備可仿製備例 176 之方法來進行。

例 529

4-[4-(胺羰基)-3-溴苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.03(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，2.60(3H，s)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，4.07(2H，q

，J = 7 Hz)，5.83(1H，s，br)，6.19(1H，s，br)，6.28(1H，d，J = 5 Hz)，6.67(1H，d，J = 5 Hz)，7.46(1H，d，J = 8 Hz)，7.72(1H，s)，7.77(1H，d，J = 8 Hz)。

下列化合物之製備可仿例 184 之方法來進行。

例 530

3-[2-(環戊胺基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-4-基]苄腈

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J = 7 Hz)，1.51-1.80(6H，m)，2.15(2H，m)，2.96(2H，q，J = 7 Hz)，3.05(3H，s)，4.27(1H，m)，5.94(1H，d，J = 5 Hz)，6.47-6.53(2H，m)，7.53-7.59(3H，m)，7.74(1H，m).

例 531

3-[7-乙基-2-(甲胺基)-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-4-基]苄腈

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 7 Hz)，2.94-3.07(8H，m)，5.95(1H，d，J = 5 Hz)，6.50(2H，m)，7.54-7.59(3H，m)，7.74(1H，m).

下列化合物之製備可仿例 225 之方法來進行。

例 532

叁(2，2-二甲基丙酸)(2R，3R，4S，5S，6R)-2-({3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丙醯基}胺基)-6-{[(2，2-二甲基丙醯基)氧基]甲基}四氫-2H-吡喃-3，4，5-三酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.07(9H，s)，1.11(9H，s)，1.16(9H，

s)，1.18(9H，s)，1.37 (3H，t，J = 7 Hz)，2.23(2H，m)，2.84(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.48(3H，s)，3.91-4.21(3H，m)，4.62-4.67(2H，m)，5.00-5.26(3H，m)，5.43(2H，m)，5.91(1H，d，J = 5 Hz)，6.55(1H，m，br)，6.62(1H，d，J = 5 Hz)，7.84(1H，m)，8.51(1H，m)，8.77(1H，m).

下列化合物之製備可仿例 226 之方法來進行。

例 533

[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]甲醇

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.40 (3H，t，J = 7 Hz)，2.53(1H，t，J = 7 Hz)，3.07(2H，q，J = 7 Hz)，4.48(2H，m)，6.23(1H，d，J = 5 Hz)，6.62(1H，m)，6.71(1H，d，J = 5 Hz)，7.10(1H，d，J = 5 Hz)，7.46-7.52(3H，m)，7.61(1H，m)，7.64(1H，m).

例 534

[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]甲醇

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 8 Hz)，3.05(2H，q，J = 8 Hz)，3.45-3.55(4H，m)，4.40(2H，br d，J = 7 Hz)，4.77(2H，br s)，6.22(1H，d，J = 5 Hz)，6.70(1H，d，J = 5 Hz)，8.11(1H，m)，8.74(1H，br s)，8.80(1H，d，J = 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 302(M + H).

下列化合物之製備可仿例 227 之方法來進行。

例 535

三乙酸(2R，3S，4S，5R，6R)-2-[(乙醯氧基)甲基]-6-({5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊基}氧基)四氫-2H-吡喃-3，4，5-三酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.82-1.18(6H，m)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.92-2.17(14H，m)，2.35(2H，m)，3.01(2H，q，J = 7 Hz)，3.16(1H，m)，3.62(1H，m)，3.85(1H，m)，4.11(2H，m)，4.10(2H，m)，4.30(1H，d，J = 8.1 Hz)，4.96(1H，m)，5.11(1H，m)，5.35(1H，m)，5.90(1H，d，J = 5 Hz)，6.62(1H，d，J = 5 Hz)，7.44-7.53(5H，m)，7.60-7.80(4H，m).

下列化合物之製備可仿例 228 之方法來進行。

例 536

3-[7-乙基-2-(羥甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.19(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(3H，t，J= 7 Hz)，2.33(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.70-2.82(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，3.71(1H，t，J= 5 Hz)，4.05(2H，q，J= 7 Hz)，4.89(2H，d，J= 5 Hz)，5.98(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.52(1H，s)，8.42(1H，d，J= 2 Hz)，8.56(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 368.

例 537

4-[7-乙基-2-(羥甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(3H，t，J= 7

Hz)，1.62-1.78(2H，m)，2.16-2.28(2H，m)，2.36-2.53(2H，m)，2.44(3H，s)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，3.86(1H，t，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.90(2H，m)，5.96(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.53(1H，s)，8.44(1H，s)，8.56(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 382.

例 538

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(3H，t，J= 7 Hz)，1.46-1.65(4H，m)，2.16(2H，t，J= 7 Hz)，2.32-2.44(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.86(2H，s)，5.91(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.58-7.68(3H，m)，7.75-7.82(1H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 406.

例 539

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.25(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.64-1.79(2H，m)，2.23(2H，t，J= 7 Hz)，2.42-2.53(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，4.91(2H，s)，5.97(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.89(1H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.80(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 446 448.

例 540

3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.32(2H，m)，2.68-2.90(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.10(2H，m)，4.89(2H，s)，6.03(1H，m)，6.65(1H，m)，7.90(1H，m)，8.58(1H，m)，8.83(1H，m).

MS(ESI^+)：m/z 432 434.

例 541

4-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J = 7 Hz)，1.38(3H，t，J = 7 Hz)，1.67(2H，tt，J = 7，7 Hz)，2.20(2H，t，J = 7 Hz)，2.37-2.79(2H，m)，3.04(2H，q，J = 7 Hz)，3.77(1H，t，J = 4 Hz)，4.07(2H，q，J = 7 Hz)，4.91(2H，d，J = 4 Hz)，5.96(1H，d，J = 4 Hz)，6.61(1H，d，J = 4 Hz)，7.73(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.52(1H，d，J = 2 Hz)，8.70(1H，d，J = 2 Hz).

例 542

3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J = 7 Hz)，1.38(3H，t，J = 7 Hz)，2.31(2H，t，J = 8 Hz)，2.85(2H，t，J = 8 Hz)，3.04(2H，q，J = 7 Hz)，3.69-3.75(1H，br s)，4.06(2H

，q，J = 7 Hz)，4.88(2H，s)，6.00(1H，d，J = 4 Hz)，6.59(1H，d，J = 4 Hz)，7.23-7.26(1H，m)，7.36(1H，s)，7.44-7.46(2H，m).

例 543

4-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.21(3H，t，J = 8 Hz)，1.38(3H，t，J = 8 Hz)，1.57(3H，s)，1.59-1.74(2H，m)，2.20(2H，t，J = 8 Hz)，2.37-2.47(2H，m)，3.03(2H，q，J = 8 Hz)，3.84(1H，t，J = 5 Hz)，4.06(2H，q，J = 8 Hz)，4.39(2H，d，J = 5 Hz)，5.32(2H，s)，5.96(1H，d，J = 5 Hz)，6.56(1H，d，J = 5 Hz)，7.21-7.29(1H，與 $CDCl_3$ 重覆)，7.36(1H，br s)，7.39-7.47(2H，m).

例 544

9-(5-溴-3-吡啶基)-6-乙基-1H，3H-呋喃[3，4-e]吡咯并[1，2-b]嗒咿-1-酮

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.42(3H，t，J = 8 Hz)，3.11(2H，q，J = 8 Hz)，5.32(2H，s)，6.87(1H，d，J = 5 Hz)，6.99(1H，d，J = 5 Hz)，8.20(1H，m)，8.83-8.87(2H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 358，360(M + H).

4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸

^{1}H NMR($CDCl_3$-CD3OD)δ 1.40(3H，t，J = 8 Hz)，3.09(2H，q，J = 8 Hz)，4.93(2H，s)，6.34(1H，d，J = 5 Hz)，6.79(1H

，d，J = 5 Hz)，7.96(1H，m)，8.55(1H，br s)，8.73(1H，br s).

MS(ESI$^+$)：m/z 376，378(M + H).

例 545

3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-N-[(2R，3R，4S，5R，6R)-3，4，5-三羥基-6-(羥甲基)四氫-2H-吡喃-2-基]丙醯胺

^{1}H-NMR(DMSO-d_6)δ 1.30(3H，t，J = 7 Hz)，2.21(1H，m)，2.96(2H，q，J = 7 Hz)，3.25-3.45(8H，m)，3.66(1H，m)，4.40(1H，m)，4.55-4.67(5H，m)，4.75(1H，m)，5.85(1H，d，J = 5 Hz)，6.66(1H，d，J = 5 Hz)，8.23(1H，m)，8.33(1H，d，br，J = 7 Hz)，8.61(1H，m)，8.84(1H，m).

例 546

3-[7-乙基-2-苯基-3-(5-{[(2R，3R，4S，5R，6R)-3，4，5-三羥基-6-(羥甲基)四氫-2H-吡喃-2-基]氧基}戊基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.85-1.38(6H，m)，1.46(3H，t，J = 7 Hz)，2.13(2H，m)，2.38(2H，m)，2.65(1H，m)，2.73(1H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.23(1H，m)，3.48-3.70(4H，m)，3.80-4.01(3H，m)，4.13(1H，m)，5.90(1H，d，J = 5 Hz)，663(1H，d，J = 5 Hz)，7.42-7.55(5H，m)，7.60-7.79(4H，m).

下列化合物之製備可仿例 235 之方法來進行。

例 547

N-(2-胺乙基)-3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丙醯胺

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 7 Hz)，2.29(2H，m)，2.72-3.07(6H，m)，3.33(2H，q，J = 7 Hz)，3.49(3H，s)，4.68(2H，s)，5.93(1H，d，J = 5 Hz)，6.06(1H，m，br)，6.62(1H，d，J = 5 Hz)，7.89(1H，m)，8.55(1H，m)，8.77(1H，m)。

MS(ESI^+)m/z：460 及 462(M + H)

下列化合物之製備可仿例 268 之方法來進行。

例 548

3-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.15(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.37(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.86-3.01(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.99(2H，q，J= 7 Hz)，4.68(2H，s)，4.81(2H，s)，5.95(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.27(2H，d，J= 7 Hz)，7.51(1H，s)，8.43(1H，s)，8.56(1H，s)，8.57(2H，d，J= 7 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 459.

例 549

3-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(2-吡呯甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.16(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.39(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.88-3.03(2H，

m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，4.01(2H，q，J= 7 Hz)，4.83(2H，s)，4.90(2H，s)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.53(1H，s)，8.42(1H，m)，8.48-8.55(3H，m)，8.76(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 460.

例 550

3-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(2-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.15(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.40(2H，t，J= 7 Hz)，2.42(3H，s)，2.88-3.00(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.99(2H，q，J= 7 Hz)，4.79(2H，s)，4.86(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.16-7.23(1H，m)，7.45-7.53(2H，m)，7.68(1H，m)，8.42(1H，m)，8.53(2H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 459.

例 551

4-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.18(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.60-1.80(2H，m)，2.13-2.25(2H，m)，2.43(3H，s)，2.53-2.76(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.68(2H，s)，4.83(2H，m)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.27(2H，d，J= 5 Hz)，7.53(1H，s)，8.42(1H，s)，8.53(1H，s)，8.55(2H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 473.

例 552

5-{4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.35-1.57(4H，m)，2.11(2H，t，J= 7 Hz)，2.53-2.65(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.67(2H，s)，4.78(2H，s)，5.87(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.28(2H，d，J= 5 Hz)，7.61(2H，m)，7.66(1H，s)，7.78(1H，m)，8.58(2H，d，J= 5 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 497.

例 553

5-{4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-[(2-吡咿甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.35-1.58(4H，m)，2.11(2H，t，J= 7 Hz)，2.55-2.65(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，4.82(2H，s)，4.86(2H，s)，5.86(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.62(2H，m)，7.67(1H，s)，7.78(1H，m)，8.51(2H，m)，8.74(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 498.

例 554

5-{4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-[(3-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(3H，t，J= 7 Hz)，1.32-1.66(4H，m)，2.10(2H，t，J= 7 Hz)，2.48-2.60(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.66(2H，s)，4.75(2H，s)，5.86(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.28(1H，m)，7.58-7.63(2H，m)，7.66(1H，s)，7.66-7.80(2H，m)，8.54(1H，m)，8.62(1H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 497.

例 555

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.62(4H，m)，2.16(2H，t，J= 7 Hz)，2.53-2.71(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，4.09(2H，q，J= 7 Hz)，4.67(2H，s)，4.78(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.31(2H，d，J= 5 Hz)，7.88(1H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.58(2H，d，J= 5 Hz)，8.79(1H，d，J= 2 Hz).

例 556

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(3-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.40(3H，t，J= 7 Hz)，1.30-1.60(4H，m)，2.15(2H，t，J= 7 Hz)，2.50-2.68(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.68(2H，s)，4.78(2H，s)，5.95(1H，m)，6.63(1H，m)，7.24-7.38(1H，m)，7.75(1H，m)，7.89(1H，m)，8.58(2H，s)，8.64(1H

，s)，8.80(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 551 553.

例 557

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.24(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.58(4H，m)，2.12(2H，t，J= 7 Hz)，2.53-2.68(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.10(2H，q，J= 7 Hz)，4.78(2H，s)，4.84(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.22(1H，m)，7.48(1H，d，J= 8 Hz)，7.68-7.75(1H，m)，7.88(1H，m)，8.57(2H，m)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

例 558

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-吡咿甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.62(4H，m)，2.15(2H，t，J= 7 Hz)，2.53-2.72(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，4.08(2H，q，J= 7 Hz)，4.82(2H，s)，4.86(2H，s)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.88(1H，m)，8.52(2H，m)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.74(1H，m)，8.79(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 552 554.

例 559

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.19(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.60-1.80(2H，m)，2.22(2H，t，J= 7 Hz)，2.55-2.74(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，4.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.69(2H，s)，4.83(2H，s)，5.96(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.30(2H，d，J= 6 Hz)，7.88(1H，m)，8.56(2H，d，J= 6 Hz)，8.57(1H，m)，8.80(1H，m).

MS(ESI^+)：m/z 537 539.

例 560

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(3-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.55-1.82(2H，m)，2.18(2H，t，J= 7 Hz)，2.52-2.72(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，4.05(2H，q，J= 7 Hz)，4.68(2H，s)，4.83(2H，s)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.28(1H，m)，7.73(1H，d，J= 8 Hz)，7.88(1H，m)，8.54(2H，m)，8.62(1H，s)，8.79(1H，s)

例 561

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.63-1.82(2H，m)，2.18(2H，t，J= 7 Hz)，2.55-2.75(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.00(2H，q，J= 7 Hz)，4.80(2H，s)，4.88(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.22(1H，m)，7.48(1H，d，J= 8 Hz)，7.71(1H，

t，J= 8 Hz)，7.89(1H，m)，8.55(2H，m)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 537 539.

例 562

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(環丙基甲氧基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.25(2H，m)，0.60(2H，m)，1.08-1.22(1H，m)，1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.69-1.82(2H，m)，2.21(2H，t，J= 7 Hz)，2.56-2.72(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.42(2H，d，J= 7 Hz)，4.04(2H，q，J= 7 Hz)，4.73(2H，s)，5.91(1H，d，J= 4 Hz)，6.59(1H，d，J= 4 Hz)，7.89(1H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.79(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 500 502.

例 563

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-吡咿甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.19(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，1.70-1.82(2H，m)，2.23(2H，t，J= 7 Hz)，2.56-2.76(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.04(2H，q，J= 7 Hz)，4.84(2H，s)，4.95(2H，m)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.89(1H，m)，8.50(2H，m)，8.56(1H，s)，8.74(1H，s)，8.79(1H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 538 540.

例 564

3-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.16(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.41(2H，t，J= 7 Hz)，2.85-3.07(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.02(2H，q，J= 7 Hz)，4.68(2H，s)，4.81(2H，s)，5.95(1H，d，J= 4 Hz)，6.65(1H，d，J= 4 Hz)，7.31(2H，d，J= 6 Hz)，7.87(1H，m)，8.55(1H，m)，8.56(2H，d，J= 6 Hz)，8.79(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 523 525.

例 565

4-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[2-(四氫-2H-吡喃-2-基氧基)乙氧基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.46-1.93(8H，m)，2.21(2H，t，J= 7 Hz)，2.55-2.76(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.46-3.56(1H，m)，3.60-3.68(1H，m)，3.74-3.82(2H，m)，3.83-3.96(2H，m)，4.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.63(1H，m)，4.77(2H，s)，5.91(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.89(1H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

例 566

4-{4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.19(3H，t，J = 7 Hz)，1.38(3H，t，J = 7 Hz)，1.70(2H，t，J = 7 Hz)，2.19(2H，t，J = 7

Hz)，2.55-2.67(2H，m)，3.04(2H，q，J = 7 Hz)，4.03(2H，q，J = 7 Hz)，4.69(2H，s)，4.83(2H，s)，5.94(1H，d，J = 5 Hz)，6.63(1H，d，J = 5 Hz)，7.29(2H，d，J = 6 Hz)，7.73(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.52(1H，d，J = 2 Hz)，8.58(2H，d，J = 6 Hz)，8.69(1H，d，J = 2 Hz).

例 567

3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咔-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J = 8 Hz)，1.37(3H，t，J = 8 Hz)，2.33-2.44(2H，m)，2.84-2.94(2H，m)，3.03(2H，q，J = 8 Hz)，3.45(3H，s)，4.05(2H，q，J = 8 Hz)，4.64(2H，s)，5.94(1H，d，J = 5 Hz)，6.58(1H，d，J = 5 Hz)，7.21-7.29(1H，與 $CDCl_3$ 重覆)，7.36(1H，br s)，7.38-7.46(2H，m).

例 568

4-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咔-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J = 8 Hz)，1.37(3H，t，J = 8 Hz)，1.62-1.78(2H，m)，2.14-2.28(2H，m)，2.53-2.66(2H，m)，3.04(2H，q，J = 8 Hz)，3.46(3H，s)，4.04(2H，q，J = 8 Hz)，4.65(2H，s)，5.93(1H，d，J = 5 Hz)，6.58(1H，d，J = 5 Hz)，7.21-7.29(1H，與 $CDCl_3$ 重覆)，7.36(1H，br s)，7.39-7.46(2H，m).

下列化合物之製備可仿例 272 之方法來進行。

例 569

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(1，1-二氧-4-硫嗎啉基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 7 Hz)，1.36(3H，t，J = 7 Hz)，1.39-1.53(4H，m)，2.19(2H，t，J = 7 Hz)，2.50-2.61(2H，m)，3.00(2H，q，J = 7 Hz)，3.10(4H，t，J = 6 Hz)，3.21(4H，t，J = 6 Hz)，3.85(2H，s)，4.10(2H，q，J = 7 Hz)，5.92(1H，d，J = 4 Hz)，6.61(1H，d，J = 4 Hz)，7.88(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.55(1H，d，J = 2 Hz)，8.80(1H，d，J = 2 Hz).

例 570

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-硫嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.41-1.54(4H，m)，2.19(2H，t，J = 7 Hz)，2.50-2.61(2H，m)，2.66(4H，t，J = 4 Hz)，2.85(4H，t，J = 4 Hz)，3.01(2H，q，J = 7 Hz)，3.67(2H，s)，4.10(2H，q，J = 7 H)，5.88(1H，d，J = 5 Hz)，6.57(1H，d，J = 5 Hz)，7.88(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.55(1H，d，J = 2 Hz)，8.79(1H，d，J = 2 Hz).

例 571

5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[4-(2-羥乙基)-1-哌呯基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基)戊酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 7 Hz)，

1.36(3H，t，J = 7 Hz)，1.40-1.55(4H，m)，2.18(2H，t，J = 7 Hz)，2.48-2.66(12H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.61(2H，t，J = 5 Hz)，3.66(2H，s)，4.10(2H，q，J = 7 Hz)，5.88(1H，d，J = 4 Hz)，6.57(1H，d，J = 4 Hz)，7.88(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.55(1H，d，J = 2 Hz)，8.78(1H，d，J = 2 Hz).

例 572

4-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-硫嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.21(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.70(2H，tt，J = 7，7 Hz)，2.19(2H，t，J = 7 Hz)，2.50-2.67(6H，m)，2.86(4H，t，J = 5 Hz)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.70(2H，s)，4.05(2H，q，J = 5 Hz)，5.89(1H，d，J = 4 Hz)，6.58(1H，d，J = 4 Hz)，7.74(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.52(1H，d，J = 2 Hz)，8.68(1H，d，J = 2 Hz).

例 573

4-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.21(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.72(2H，tt，J = 7，7 Hz)，2.20(2H，t，J = 7 Hz)，2.56-2.69(6H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.68-3.71(6H，m)，4.05(2H，q，J = 7 Hz)5.89(1H，d，J = 4 Hz)，6.58(1H，d，J = 4 Hz)，7.74(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.53(1H，d，J = 2 Hz)，8.69(1H，d，J = 2 Hz).

例 574

3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.21(3H，t，J = 7 Hz)，1.34(3H，t，J = 7 Hz)，2.47-2.54(2H，m)，2.59(4H，t，J = 5 Hz)，2.81-2.95(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.67(4H，t，J = 5 Hz)，3.69(2H，s)，4.07(2H，q，J = 7 Hz)，5.90(1H，d，J = 4 Hz)，6.59(1H，d，J = 4 Hz)，7.88(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.55(1H，d，J = 2 Hz)，8.79(1H，d，J = 2 Hz).

例 575

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.21(3H，t，J = 7 Hz)，1.36(3H，t，J = 7 Hz)，1.73(2H，tt，J = 7，7 Hz)，2.20(2H，t，J = 7 Hz)，2.55-2.69(6H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.69(4H，t，J = 5 Hz)，4.05(2H，q，J = 7 Hz)，5.89(1H，d，J = 4 Hz)，6.58(1H，d，J = 4 Hz)，7.89(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.57(1H，d，J = 2 Hz)，8.79(1H，d，J = 2 Hz).

例 576

4-{4-(5-氯-3-吡啶基)-2-[(環丙胺基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基}丁酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 0.46-0.52(4H，m)，1.21(3H，t，J = 7 Hz)，1.38(3H，t，J = 7 Hz)，1.71(2H，tt，J = 8，8 Hz)，2.21(2H，t，J = 8 Hz)，2.32-2.39(1H，m)，

2.45-2.54(2H，m)，3.04(2H，q，J = 7 Hz)，4.06(2H，q，J = 7 Hz)，4.07(2H，s)，5.89(1H，d，J = 4 Hz)，6.57(1H，d，J = 4 Hz)，7.72(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.50(1H，d，J = 2 Hz)，8.68(1H，d，J = 2 Hz).

例 577

5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[(2-苯氧乙基)胺基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.40-1.56(4H，m)，2.18(2H，t，J = 8 Hz)，2.41-2.52(2H，m)，3.04(2H，q，J = 7 Hz)，3.19(2H，t，J = 5 Hz)，4.07(2H，s)，4.09(2H，q，J = 7 Hz)，4.17(2H，t，J = 5 Hz)，5.90(1H，d，J = 4 Hz)，6.57(1H，d，J = 4 Hz)，6.92-6.98(3H，m)，7.29-7.32(2H，m)，7.86(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.54(1H，d，J = 2 Hz)，8.78(1H，d，J = 2 Hz).

例 578

5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[(2-羥乙基)(甲基)胺基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.42-1.63(4H，m)，2.20(2H，t，J = 8 Hz)，2.38(3H，s)，2.53-2.64(2H，m)，2.75(2H，t，J = 5 Hz)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.66(2H，t，J = 5 Hz)，3.77(2H，s)，4.10(2H，q，J = 7 Hz)，5.90(1H，d，J = 4 Hz)，6.59(1H，d，J = 4 Hz)，7.88(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.55(1H，d

，J = 2 Hz)，8.78(1H，d，J = 2 Hz).

例 579

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(1-哌啶甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 7 Hz)，1.36(3H，t，J = 7 Hz)，1.42-1.58(6H，m)，1.69(4H，tt，J = 5，5 Hz)，2.18(2H，t，J = 8 Hz)，2.53-2.64(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.19(4H，t，J = 5 Hz)，3.60(2H，s)，4.07(2H，q，J = 7 Hz)，5.86(1H，d，J = 5 Hz)，6.54(1H，d，J = 5 Hz)，7.89(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.56(1H，d，J = 2 Hz)，8.75(1H，d，J = 2 Hz).

例 580

3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-硫嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，2.46(2H，t，J = 8 Hz)，2.64(4H，t，J = 5 Hz)，2.86(6H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.69(2H，s)，4.06(2H，q，J = 7 Hz)，5.91(1H，d，J = 5 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，7.88(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.56(1H，d，J = 2 Hz)，8.80(1H，d，J = 2 Hz).

例 581

3-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[4-(2-羥乙基)-1-哌啡基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基)丙酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.21(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H

，t，J = 7 Hz)，2.46-2.63(12H，m)，2.80-2.94(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.61(2H，t，J = 5 Hz)，3.70(2H，s)，4.08(2H，q，J = 7 Hz)，5.90(1H，d，J = 5 Hz)，6.59(1H，d，J = 5 Hz)，7.88(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.56(1H，d，J = 2 Hz)，8.79(1H，d，J = 2 Hz).

例 582

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(1-吡咯啶甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.40-1.55(4H，m)，1.75-1.80(4H，m)，2.19(2H，t，J = 7 Hz)，2.54-2.66(6H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.76-3.81(2H，m)，4.10(2H，q，J = 7 Hz)，5.87(1H，d，J = 5 Hz)，6.55(1H，d，J = 5 Hz)，7.89(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.56(1H，d，J = 2 Hz)，8.77(1H，d，J = 2 Hz).

例 583

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-苯基-1-哌咿基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.21(3H，t，J = 7 Hz)，1.38(3H，t，J = 7 Hz)，1.41-1.54(4H，m)，2.17(2H，t，J = 7 Hz)，2.53-2.68(2H，m)，2.75(4H，t，J = 5 Hz)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.19(4H，t，J = 5 Hz)，3.73(2H，s)，4.07(2H，q，J = 7 Hz)，5.89(1H，d，J = 5 Hz)，6.58(1H，d，J = 5 Hz)，6.85(1H，dd，J = 8，8 Hz)，6.93(2H，J = 8 Hz)，7.25(2H，J = 8 Hz)，7.89(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.56(1H，d，J =

2 Hz)，8.78(1H，d，J = 2 Hz).

例 584

5-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[(2-甲氧乙基)胺基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.41-1.60(4H，m)，2.19(2H，t，J = 7 Hz)，2.43-2.52(2H，m)，2.96(2H，t，J = 5 Hz)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.40(3H，s)，3.58(2H，t，J = 5 Hz)，3.99(2H，s)，4.10(2H，q，J = 7 Hz)，5.89(1H，d，J = 5 Hz)，6.56(1H，d，J = 5 Hz)，7.87(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.54(1H，d，J = 2 Hz)，8.78(1H，d，J = 2 Hz).

下列化合物之製備可仿例 385 之方法來進行。

例 585

3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-N-[2-羥基-1，1-雙(羥甲基)乙基]丙醯胺

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 7 Hz)，2.25-3.10(6H，m)，3.49(3H，s)，3.58(4H，m)，3.81(2H，m)，4.55(2H，s)，5.97(1H，d，J = 5 Hz)，6.54(1H，s)，6.64(1H，d，J = 5 Hz)，7.93(1H，m)，8.52(1H，m)，8.78(1H，m).

例 586

[2-({3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙醯基}胺基)乙基]胺甲酸第三丁酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.43(9H，s)，2.26(2H，m)，2.88(2H，m)，3.04(2H，q，J = 7 Hz)，3.20(2H，m)

，3.28(2H，m)，3.48(3H，s)，4.67(2H，s)，4.85(1H，s，br)，5.93(1H，d，J = 5 Hz)，6.20(1H，s，br)，6.63(1H，d，J = 5 Hz)，7.88(1H，m)，8.53(1H，m)，8.79(1H，m)。

下列化合物之製備可仿例 330 之方法來進行。

例 587

5-[2-{[2-(苄胺基)-2-氧乙氧基]甲基}-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.34(3H，t，J= 7 Hz)，1.33-1.55(4H，m)，2.12(2H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，2.40-2.56(2H，m)，2.96(2H，q，J= 7 Hz)，4.07(2H，q，J= 7 Hz)，4.19(2H，s)，4.52(2H，d，J= 7 Hz)，4.76(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.59(1H，d，J= 4 Hz)，7.06(1H，br)，7.23-7.38(5H，m)，7.49(1H，s)，8.40(1H，s)，8.54(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z　543.

下列化合物之製備可仿例 333 之方法來進行。

例 588

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4H-1，2，4-三唑-4-基甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]丁酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.22-1.34(6H，m)，1.67(2H，m)，2.23(2H，m)，2.51(2H，m)，2.98(2H，q，J = 7 Hz)，4.21(2H，q，J = 7 Hz)，5.67(2H，m)，5.97(1H，d，J = 5 Hz)，6.63(1H，d，J = 5 Hz)，7.85(1H，m)，7.96(1H，s)，8.34(1H，s)，8.53(1H，m)，8.79(1H，m).

下列化合物之製備可仿例 336 之方法來進行。

例 589

5-(7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-{[(苯磺醯基)胺基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基)戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.26-1.57(4H，m)，2.16(2H，t，J= 7 Hz)，2.33-2.46(2H，m)，2.42(3H，s)，2.98(2H，q，J= 7 Hz)，4.11(2H，q，J= 7 Hz)，4.38(2H，m)，5.91(1H，br)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.58(1H，d，J= 4 Hz)，7.43-7.55(4H，m)，7.93(2H，d，J= 8 Hz)，8.33(1H，d，J= 2 Hz)，8.54(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z　535.

下列化合物之製備可仿例 340 之方法來進行。

例 590

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(環丙胺基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.48(4H，m)，1.19(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.70(2H，t，J = 7 Hz)，2.22(2H，m)，2.50(2H，m)，2.95-3.07(3H，m)，3.96-4.12(4H，m)，5.90(1H，d，J = 5 Hz)，6.57(1H，d，J = 5 Hz)，7.88(1H，m)，8.54(1H，m)，8.77(1H，m).

例 591

將 LiAlH4(113 mg)溶在 THF(10 mL)，於冰水冷卻下加入[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙酸乙酯(600 mg)，於 0℃下攪拌 2 小時。加入酒石酸鉀鈉

溶液，濾除不溶物。蒸發溶劑，分層於 AcOEt 及水。分離有機層，清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=5:1-1:1)可得 2-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙醇 黃色油(246 mg)。

2-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙醇

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.60(3H，s)，2.72-2.84(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.65(2H，t，J= 7 Hz)，5.89(1H，d，J= 4 Hz)，6.55(1H，d，J= 4 Hz)，7.91(1H，t，J= 2 Hz)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.76(1H，d，J= 2 Hz). MS(ESI^+)：m/z 360 362.

例 592

將 3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸(1.07 g)，二苯磷醯疊氮(1.14 g)及 Et3N(0.576 mL)溶在 BuOH(30 mL)，加熱回流 2 小時。蒸發溶劑，分層於 AcOEt 及水。分離有機層，清洗以 $NaHCO_3$ 溶液及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=20:1-3:1)可得{2-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙基}胺甲酸第三丁酯黃色油(450 mg)。

{2-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙基}胺甲酸第三丁酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(9H，s)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，

2.64(3H，s)，2.62-2.75(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.10-3.27(2H，m)，4.40-4.52(1H，m)，5.89(1H，d，J= 4 Hz)，6.55(1H，d，J= 4 Hz)，7.89(1H，m)，8.53(1H，m)，8.77(1H，m).

例 593

將 60% NaH(74 mg)溶在 DMF(3 mL)，於冰水冷卻下加入 3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯(200 mg)，於 0℃下攪拌 0.5 小時。於冰水冷卻下加入 3-(溴甲基)吡啶溴化氫(234 mg)，於室溫下攪拌 2 小時。分層於 AcOEt 及水。分離水層，以 HCl 酸化至 pH 3-4，萃取以 AcOEt。將有機層清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化($CHCl_3$ 及 MeOH=100:1-20:1)可得 3-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(3-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸之黃色粉(110 mg)。

3-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(3-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸

^1H NMR($CDCl_3$)δ 1.39(3H，t，J= 7 Hz)，2.41(2H，t，J= 7 Hz)，2.80-2.98(2H，m)，3.04(2H，q，J= 7 Hz)，4.70(2H，s)，4.83(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.32-7.38(1H，m)，7.81(1H，d，J= 8 Hz)，7.87(1H，m)，8.52(1H，d，J= 8 Hz)，8.53(1H，d，J= 2 Hz)，8.63(1H，s)，8.77(1H，d，J= 2 Hz).

下列化合物之製備可仿例 593 之方法來進行。

例 594

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-甲氧乙氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咪-3-基}丁酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.72-1.83(2H，m)，2.28(2H，t，J= 7 Hz)，2.60-2.77(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.39(3H，s)，3.62(2H，m)，3.77(2H，m)，4.75(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.92(1H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.77(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^-)：m/z 474 476，MS(ESI^+)：m/z 476 478.

例 595

3-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咪-3-基}丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.48-2.62(2H，m)，2.98-3.10(2H，m)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，4.82(2H，s)，4.88(2H，s)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.27(1H，m)，7.48(1H，d，J= 8 Hz)，7.77(1H，t，J= 8 Hz)，7.90(1H，m)，8.56(2H，m)，8.80(1H，m).

MS(ESI^+)：m/z 495 497.

例 596

3-{4-(5-溴-3-吡啶基)-2-[(環丙基甲氧基)甲基]-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咪-3-基}丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.25(2H，m)，0.58(2H，m)，1.12(1H，m)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，2.40-2.63(2H，m)，2.85-3.05(2H，m)，3.02(2H，q，J= 7 Hz)，3.42(2H，d，J= 7 Hz)，4.73(2H

，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.89(1H，m)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.77(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^-$)：m/z 456 458，MS(ESI$^+$)：m/z 458 460.

例 597

3-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-吡啉甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基}丙酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.48(2H，t，J= 7 Hz)，2.85-3.09(2H，m)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.84(2H，s)，4.92(2H，s)，5.96(1H，d，J= 4 Hz)，6.65(1H，d，J= 4 Hz)，7.90(1H，m)，8.48-8.62(3H，m)，8.77(2H，m).

例 598

將 4-(4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-{[2-(四氫-2H-吡喃-2-基氧基)乙氧基]甲基}吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基)丁酸乙酯(89 mg)及吡錠討對甲對磺酸鹽(0.8 mg)溶在 MeOH(5 mL)，加熱回流 2 小時。蒸發溶劑，以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=10:1-1:1)可得 4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-羥乙氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基}丁酸乙酯黃色油(69 mg)。

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-羥乙氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒啉-3-基}丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.69-1.84(2H，m)，2.22(2H，t，J= 7 Hz)，2.53-2.72(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.76(2H，m)，3.83(2H，m)，4.07(2H，q，J= 7 Hz)，4.79(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)

，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.89(1H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.79(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 490 492.

例 599

將 60% NaH(69.5 mg)溶在 DMF(3 mL)，於冰水冷卻下加入 5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(200 mg)，於 0℃下攪拌 0.5 小時。加入 4-嗎啉羰基氯(659 mg)及於室溫下攪拌 15 小時。分層於 AcOEt 及水。分離有機層，清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=20:1-1:1)可得 4-嗎啉羧酸[4-(5-溴-3-吡啶基)-3-(5-乙氧基-5-氧戊基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-2-基]甲酯黃色油(75 mg)。

4-嗎啉羧酸[4-(5-溴-3-吡啶基)-3-(5-乙氧基-5-氧戊基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-2-基]甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.40-1.60(4H，m)，2.18(2H，t，J= 7 Hz)，2.42-2.54(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.53-3.57(4H，m)，3.63-3.78(4H，m)，4.09(2H，q，J= 7 Hz)，5.33(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.87(1H，m)，8.54(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 573 575.

下列化合物之製備可仿例 599 之方法來進行。

例 600

5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-2-({[(二甲胺基)羰基]氧基}甲基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基]戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.36(3H，t，J= 7 Hz)，1.35-1.60(4H，m)，2.17(2H，t，J= 7 Hz)，2.44-2.57(2H，m)，2.98(6H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.09(2H，q，J= 7 Hz)，5.30(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.87(1H，m)，8.54(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 531 533.

例 601

吡咯啶羧酸[4-(5-溴-3-吡啶基)-3-(5-乙氧基-5-氧戊基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒吩-2-基]甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J= 7 Hz)，1.36(3H，t，J= 7 Hz)，1.38-1.60(4H，m)，1.86-1.98(4H，m)，2.17(2H，t，J= 7 Hz)，2.44-2.57(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.36-3.52(4H，m)，4.11(2H，q，J= 7 Hz)，5.32(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.61(1H，d，J= 4 Hz)，7.87(1H，m)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

例 602

5-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[({[甲基(苯基)胺基]羰基}氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基}戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.32-1.57(4H，m)，2.13(2H，t，J= 7 Hz)，2.33-2.48(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.38(3H，s)，4.08(2H，q，

J= 7 Hz)，5.34(2H，s)，5.92(1H，d，J= 4 Hz)，6.60(1H，d，J= 4 Hz)，7.20-7.38(5H，m)，7.83(1H，s)，8.49(1H，s)，8.77(1H，s).

例 603

4-嗎啉羧酸[4-(5-溴-3-吡啶基)-3-(4-乙氧基-4-氧丁基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-2-基]甲酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J= 7 Hz)，1.63-1.80(2H，m)，2.22(2H，t，J= 7 Hz)，2.44-2.65(2H，m)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，3.54(4H，m)，3.68(4H，m)，4.05(2H，q，J= 7 Hz)，5.37(2H，s)，5.94(1H，d，J= 4 Hz)，6.62(1H，d，J= 4 Hz)，7.87(1H，m)，8.55(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 559 561.

例 604

4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-2-({[(二甲胺基)羰基]氧基}甲基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J= 7 Hz)，1.36(3H，t，J= 7 Hz)，1.66-1.79(2H，m)，2.20(2H，t，J= 7 Hz)，2.46-2.62(2H，m)，2.97(6H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.04(2H，q，J= 7 Hz)，5.34(2H，s)，5.93(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.89(1H，m)，8.56(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 517 519.

例 605

3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-2-({[(二甲胺基)羰基]氧基}甲基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]丙酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J= 7 Hz)，1.36(3H，t，J= 7 Hz)，2.37(2H，t，J= 7 Hz)，2.82-2.93(2H，m)，2.97(6H，s)，3.03(2H，q，J= 7 Hz)，4.05(2H，q，J= 7 Hz)，5.32(2H，s)，5.96(1H，d，J= 4 Hz)，6.63(1H，d，J= 4 Hz)，7.88(1H，m)，8.54(1H，d，J= 2 Hz)，8.78(1H，d，J= 2 Hz).

例 606

將 NaH(93.1 mg)溶在 DMF(4 mL)，於冰浴冷卻下加入 3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基]丙酸乙酯(150 mg)，攪拌 1 小時。加入 4-(溴甲基)吡啶溴化氫(196 mg)，於室温下攪拌 1 小時。中止反應以加入水。萃取以 $CHCl_3$。將有機層清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥並真空蒸發。以矽膠柱層析純化($CHCl_3$-MeOH = 30-1)可得 3-{4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基}丙酸(18 mg)黃色固體。

3-{4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒吡-3-基}丙酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.39(3H，t，J = 7 Hz)，2.33(2H，t，J = 7 Hz)，2.84-2.91(2H，m)，3.04(2H，q，J = 7 Hz)，4.73(2H，s)，4.82(2H，s)，5.96(1H，d，J = 5 Hz)，6.62(1H，d，J = 5 Hz)，7.23-7.26(1H，m)，7.36-7.38(3H，m)，7.42-7.44(2H，m)，8.41(2H，d，J = 5 Hz).

MS(m/z)450(M+H).

下列化合物之製備可仿製備例 606 之方法來進行。

例 607

3-{4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-[(3-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.39(3H，t，J = 7 Hz)，2.32-2.38(2H，m)，2.84-2.92(2H，m)，3.04(2H，q，J = 7 Hz)，4.70(2H，s)，4.82(2H，s)，5.94(1H，d，J = 5 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，7.21-7.24(1H，m)，7.31-7.36(2H，m)，7.40-7.42(2H，m)，7.80(2H，d，J = 8 Hz)，8.51(1H，d，J = 5 Hz)，8.64(1H，s).

例 608

3-{4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-[(2-吡咿甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丙酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 7 Hz)，2.42(2H，t，J = 7 Hz)，2.91-2.97(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，4.83(2H，s)，4.90(2H，s)，5.96(2H，d，J = 5 Hz)，6.62(2H，d，J = 5 Hz)，7.23-7.26(1H，m)，7.36(1H，s)，7.43-7.44(2H，m)，8.51-8.53(2H，m)，8.75(1H，s).

例 609

將 5-[7-乙基-2-甲基-4-(2-乙烯基-4-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸(15 mg)溶在 MeOH，加入 10% Pd/C(2 mg)。於氫氣(1 atm)下攪拌 6 小時。濾經矽藻土，將濾液真空濃縮。將固體碾製以己烷可得 5-[7-乙基-4-(2-乙基-4-吡啶基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸 (14 mg)之黃色固

體。

5-[7-乙基-4-(2-乙基-4-吡啶基)-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.29-1.64(10H，m)，2.18-2.30(2H，m)，2.45-2.48(2H，m)，2.56(3H，s)，2.91-3.06(4H，m)，5.84(1H，d，J = 5 Hz)，6.53(1H，d，J = 16 Hz)，6.51(1H，d，J = 5 Hz)，7.25-7.32(2H，m)，8.69(1H，br s).

例 610

將4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(羥甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯(70.0 mg)溶在甲苯(1 mL)，於冰浴冷卻下依次加入三丁膦(0.098 mL)，1，3-噁唑啶-2-酮(34.1 mg)。攪拌5分鐘，加入1，1'-(偶氮二羰基)二哌啶(98.9 mg)。於冰浴冷卻下攪拌10分鐘，於室溫下攪拌8小時。加入己烷(5 mL)，過濾。蒸發濾液。以製備性薄層層析純化(乙酸乙酯-己烷 = 1-1)可得4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-氧-1，3-噁唑啶-3-基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸乙酯之黃色膠(25.0 mg)。

4-{4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(2-氧-1，3-噁唑啶-3-基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}丁酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.20(3H，t，J = 7 Hz)，1.369(3H，t，J = 7 Hz)，1.65(3H，t，J = 7 Hz)，2.25(2H，t，J = 7 Hz)，2.51(2H，m)，2.99(2H，q，J = 7 Hz)，3.79(2H，t，J = 7 Hz)，4.04(2H，q，J = 7 Hz)，4.43(2H，t，J = 7 Hz)，4.69(2H，m)，5.95(1H，d，J = 5 Hz)，6.61(1H，d，J = 5 Hz)，7.87(1H

，m)，8.55(1H，m)，8.80(1H，m).

例 611

將 2-溴-4-[3-(乙氧羰基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-4-基]苄酸(50.0 mg)溶在四氫呋喃(1 mL)，於冰浴冷卻下加入 1 M 硼烷-四氫呋喃複合物(0.348 mL)。於室溫下攪拌 2 小時，加入硼烷-四氫呋喃複合物(0.348 mL)。於室溫下攪拌 15 小時。分層於乙酸乙酯及 1 N HCl。將有機層清洗以水，飽和重碳酸鈉，及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 4-[3-溴-4-(羥甲基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸乙酯之黃色油(54.2 mg)。

4-[3-溴-4-(羥甲基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.99(3H，t，J = 7 Hz)，1.38(3H，t，J = 7 Hz)，2.59(3H，s)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，4.07(2H，q，J = 7 Hz)，4.82(2H，s)，6.33(1H，d，J = 5 Hz)，6.66(1H，d，J = 5 Hz)，7.44(1H，d，J = 8 Hz)，7.58(1H，d，J = 8 Hz)，7.67(1H，s).

例 612

將 2-(2-{2-[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]乙氧基}乙氧基)乙酸乙酯(62.0 mg)溶在甲醇(1 mL)，加入碳酸鉀(22.2 mg)。攪拌 1.5 小時，蒸發溶劑。以製備性薄層層析純化($CHCl_3$-MeOH = 20-1)可得目的物之黃色膠(54.1 mg)。將膠溶在 1 N HCl(1 mL)，冷凍乾燥可得暗綠色膠，靜置可析出結晶。將固體碾製以二異丙醚可得

2-(2-{2-[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙氧基}乙氧基)乙醇鹽酸鹽之黃色粉(40.3 mg)。

2-(2-{2-[7-乙基-2-甲基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]乙氧基}乙氧基)乙醇鹽酸鹽

^{1}H-NMR(DMSO-d_6)：1.29(3H，t，J = 7 Hz)，2.51(3H，s)，2.56(3H，s)，2.62(2H，m)，2.94(2H，q，J = 7 Hz)，3.30-3.47(10H，m)，5.84(1H，d，J = 5 Hz)，6.59(1H，d，J = 5 Hz)，8.26(1H，m)，8.77(1H，m)，8..85(1H，m).

例 613

將 5-[2-(溴甲基)-4-(3-氰苯基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯(70.0 mg)，苯酚(21.1 mg)，及碳酸鉀(31.0 mg)溶在 N，N-二甲基甲醯胺，於室溫下攪拌 2.5 小時。分層於乙酸乙酯及 1 N HCl。將有機層清洗以水，飽和重碳酸鈉，及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-(苯氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯之黃色膠(77.5 mg，108%)。

5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-(苯氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.21(3H，t，J = 7 Hz)，1.35-1.53(7H，m)，2.07(2H，m)，2.54(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，4.05(2H，q，J = 7 Hz)，5.24(2H，s)，5.86(1H，d，J = 5 Hz)，6.65(1H，d，J = 5 Hz)，6.80-7.01(3H，m)，7.03(2H，d，J = 9 Hz)，7.32(2H，t，J = 9 Hz)，7.55-7.63(2H，m)，7.67(1H，s)，7.76(1H，m).

MS(ESI$^+$)：m/z 482(M + H)

例 614

將三氟甲磺酸 4-(3-氰苯基)-7-乙基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-2-酯(50.0 mg)，3-呋喃硼酸(23.6 mg)，二氯雙(三苯膦)鈀(3.71 mg)，及 2 N 碳酸鈉(44.8 mg 於 0.2 mL 水)溶在二噁烷，於 85℃下攪拌 20 分鐘。分層於 EtOAc 及水，將有機層清洗以食鹽水，乾燥後蒸發。以製備性薄層層析純化(EtOAc-己烷 = 1-1)可得 3-[7-乙基-2-(2-呋喃基)-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-4-基]苄腈之桔色固體(11.5 mg)。

3-[7-乙基-2-(2-呋喃基)-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-4-基]苄腈

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.40(3H，t，J = 7 Hz)，3.10(2H，q，J = 7 Hz)，3.20(3H，s)，6.30(1H，d，J = 5 Hz)，6.63(1H，m)，6.87(1H，d，J = 5 Hz)，6.95(1H，m)，7.60-7.73(4H，m)，8.79(1H，m).

例 615

將 5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸(100 mg)溶在四氫呋喃(1 mL)，於冰浴及氮氣下加入 1 M 硼烷-四氫呋喃複合物(0.708 mL，)。於浴中攪拌 4 小時，再於室溫下攪拌 1 小時。中止反應以加入 1 N HCl(1 mL)。分層於 EtOAc(10 mL)及 1 N HCl(5 mL)。將有機層清洗以水及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以製備性薄層層析純化，溶離以丙酮-己烷 = 1-2 可得 3-[7-乙基-3-(5-羥戊基)-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒呯-4-基]苄腈之黃色膠(104

mg)。

3-[7-乙基-3-(5-羥戊基)-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.98-1.17(6H，m)，1.36(3H，t，J = 7 Hz)，2.38(2H，m)，2.58(2H，m)，3.34(2H，m)，5.89(1H，d，J = 5 Hz)，6.62(1H，d，J = 5 Hz)，7.45-7.53(5H，m)，7.55-7.67(4H，m).

MS(ESI+)：m/z 410(M + H)

下列化合物之製備可仿製備例 24 之方法來進行。

製備例 343

2-[(5-溴-3-吡啶基)羰基]-4-甲氧基-3-氧丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.96-1.10(3H，m)，3.23(1.5H，s)，3.49(1.5H，s)，4.00-4.34(4H，m)，4.57(1H，s)，8.00(0.5H，br s)，8.23(0.5H，br s)，8.60-8.91(2H，m).

製備例 344

2-乙醯基-2-[(6-氰基-3-吡啶基)羰基]辛二酸 1-第三丁酯 8-乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.22-1.46(16H，m)，1.55-1.70(2H，m)，2.17-2.34(4H，m)，2.48(3H，s)，4.14(2H，q，J = 8 Hz)，7.77(1H，br d，J = 8 Hz)，8.17(1H，dd，J = 8，2 Hz)，8.97(1H，d，J = 2 Hz).

下列化合物之製備可仿製備例 78 之方法來進行。

製備例 345

7-[(6-氰基-3-吡啶基)羰基]-8-氧壬酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.20-1.45(7H，m)，1.52-1.70(2H，m)，1.92-2.14(2H，m)，2.17-2.39(5H，m)，4.11(2H，q，J = 8 Hz)，4.40(1H，t，J = 8 Hz)，7.84(1H，br d，J = 8 Hz)，8.39(1H，m)，9.23(1H，br s).

下列化合物之製備可仿製備例 130 之方法來進行。

製備例 346

4-甲氧基-3-氧丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.28(3H，t，J = 8 Hz)，3.42(3H，s)，3.51(2H，s)，4.09(2H，s)，4.20(2H，q，J = 8 Hz).

下列化合物之製備可仿製備例 338 之方法來進行。

製備例 347

3-[(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]-5-溴苄酸苄酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.28(3H，t，J = 7 Hz)，2.75(2H，q，J = 7 Hz)，5.37(2H，s)，5.73(2H，s)，5.94(1H，d，J = 5 Hz)，6.66(1H，d，J = 5 Hz)，7.35-7.48(5H，m)，7.99(1H，s)，8.33(1H，s)，8.38(1H，s).

下列化合物之製備可仿製備例 321 之方法來進行。

製備例 348

3-溴-5-[(5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄酸苄酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.29(3H，t，J = 7 Hz)，2.72(2H，q，J = 7 Hz)，5.37(2H，s)，6.09(1H，m)，6.78(1H，m)，7.33-7.45(5H，m)，8.15(1H，s)，8.33(1H，s)，8.45(1H，s).

下列化合物之製備可仿製備例 310 之方法來進行。

製備例 349

3-溴-5-(氯羰基)苄酸苄酯

製備例 350

將 3-溴-5-碘苄酸苄酯(1.00 g)溶在 THF(10 mL)，於冰浴及氮氣下加入 0.76 M 異丙基溴化鎂(3.16 mL)。攪拌 0.5 小時，倒至乾冰。回温至室温 1 小時。分層於 EtOAc 及 1 N HCl。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以驟矽膠柱層析純化(氯仿-甲醇 = 50-0～50-2)可得 3-苄氧羰基-5-溴苄酸白色固體(273 mg)。

3-[(苄氧基)羰基]-5-溴苄酸

^{1}H-NMR(DMSO-d_6)δ 5.39(2H，s)，7.30-7.52(5H，m)，8.29(2H，s)，8.43(1H，s).

製備例 351

將 3-溴-5-碘苄酸(5.00 g)及 N，N-二甲基甲醯胺(0.059 mL)溶在二氯甲烷(50 mL)，於冰浴及氮氣下加入草醯氯(1.47 mL)。攪拌 1 小時，蒸發揮發物。溶在二氯甲烷(50 mL)，於冰浴冷卻下加入苄醇(1.82 g)，再加入三乙胺(3.2 mL)。於室温下攪拌 2 小時。分層於 EtOAc 及水。將有機層清洗以水(2 次)，飽和 $NaHCO_3$ 溶液，及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥並蒸發。以驟矽膠柱層析純化(EtOAc-己烷 s = 1/200～20/200)可得 3-溴-5-碘苄酸苄酯之白色結晶(5.95 g)。

3-溴-5-碘苄酸苄酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 5.35(3H，s)，7.35-7.68(5H，m)，8.04(1H，s)，8.16(1H，m)，8.30(1H，s).

下列化合物之製備可仿例 1 之方法來進行。

例 615

3-溴-5-[7-乙基-2-甲基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒哄-4-基]苄酸苄酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 7 Hz)，2.88(3H，s)，3.05(3H，s)，3.06(2H，q，J = 7 Hz)，5.35(2H，s)，6.15(1H，d，J = 5 Hz)，6.72(1H，d，J = 5 Hz)，7.33-7.45(5H，m)，7.68(1H，m)，7.94(1H，m)，8.28(1H，m).

例 616

4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-苯基吡咯并[1，2-b]嗒哄基-3-甲腈

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.42(3H，t，J = 8 Hz)，3.12(2H，q，J = 8 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，6.92(1H，d，J = 5 Hz)，7.50-7.58(3H，m)，7.73(1H，t，J = 8 Hz)，7.82-7.91(3H，m)，7.93-8.01(2H，m).

例 617

2-第三丁基-4-(3-氰苯基)-7-乙基吡咯并[1，2-b]嗒哄基-3-甲腈

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 8 Hz)，1.60(9H，s)，3.05(2H，q，J = 8 Hz)，6.48(1H，d，J = 5 Hz)，6.77(1H，d，J = 5 Hz)，7.45-7.54(3H，m)，7.60(1H，br s).

下列化合物之製備可仿製備例 78 之方法來進行。

例 618

6-[4-(6-氰基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒哄-3-基]己酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.15-1.64(12H，m)，2.21(1H，t，J = 8

Hz)，2.32-2.44(2H，m)，2.56(3H，s)，3.01(2H，q，J = 8 Hz)，4.10(2H，q，J = 8 Hz)，5.79(1H，d，J = 5 Hz)，6.54(1H，d，J = 5 Hz)，7.85(1H，br s)，8.30(1H，br d，J = 8 Hz)，8.72(1H，br s).

MS(ESI$^+$)：m/z 405(M + H).

下列化合物之製備可仿製備例 21 之方法來進行。

例 619

4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$) δ 1.04(3H，t，J = 8 Hz)，1.38(3H，t，J = 8 Hz)，3.06(2H，q，J = 8 Hz)，3.39(3H，s)，4.10(2H，q，J = 8 Hz)，4.76(2H，s)，6.33(1H，d，J = 5 Hz)，6.74(1H，d，J = 5 Hz)，7.96(1H，br s)，8.61(1H，br s)，8.78(1H，d，J = 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 418，420(M + H).

下列化合物之製備可仿例 76 之方法來進行。

例 620

3-溴-5-[7-乙基-2-甲基-3-(甲磺醯基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-4-基]苄酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$ + CD3OD δ 1.38(3H，t，J = 7 Hz)，2.86(3H，s)，3.05(3H，s)，3.06(2H，q，J = 7 Hz)，6.19(1H，d，J = 5 Hz)，6.71(1H，d，J = 5 Hz)，7.53(1H，s)，7.90(1H，s)，8.23(1H，s).

例 621

(2E)-3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙烯酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.39(3H，t，J = 8 Hz)，3.07(2H，q，J = 8 Hz)，3.51(3H，s)，4.65(2H，s)，5.96(1H，d，J = 15 Hz)，6.27(1H，d，J = 5 Hz)，6.74(1H，d，J = 5 Hz)，7.68(1H，d，J = 15 Hz)，7.93(1H，m)，8.57(1H，d，J = 1 Hz)，8.70(1H，d，J = 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 416，418(M + H).

例 622

6-[4-(6-氰基-3-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]己酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.15-1.69(9H，m)，1.90-2.50(4H，m)，2.56(3H，s)，3.01(2H，q，J = 8 Hz)，5.80(1H，d，J = 5 Hz)，6.51(1H，d，J = 5 Hz)，7.84(1H，dd，J = 8，2 Hz)，8.28(1H，d，J = 8 Hz)，8.51(1H，d，J = 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 377(M + H).

例 622-2

6-{4-[6-(胺羰基)-3-吡啶基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}己酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.16-1.51(9H，m)，2.10-2.24(2H，m)，2.35-2.47(2H，m)，2.58(3H，s)，3.01(2H，q，J = 8 Hz)，5.85(1H，d，J = 5 Hz)，6.54(1H，d，J = 5 Hz)，7.22(1H，br s)，7.90(1H，dd，J = 8，1 Hz)，8.01(1H，br s)，8.34(1H，d，J = 8 Hz)，8.61(1H，d，J = 1 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 395(M + H).

下列化合物之製備可仿例 147 之方法來進行。

例 623

(2E)-3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙烯酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.27(3H，t，J = 8 Hz)，1.39(3H，t，J = 8 Hz)，3.06(2H，q，J = 8 Hz)，3.51(3H，s)，4.17(2H，q，J = 8 Hz)，4.64(2H，s)，5.97(1H，d，J = 15 Hz)，6.24(1H，d，J = 5 Hz)，6.73(1H，d，J = 5 Hz)，7.51(1H，d，J = 15 Hz)，7.91(1H，br s)，8.57(1H，br s)，8.70(1H，br s).

MS(ESI$^+$)：m/z 444，446(M + H).

下列化合物之製備可仿例 200 之方法來進行。

例 624

[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]甲醇

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 8 Hz)，3.05(2H，q，J = 8 Hz)，3.45-3.55(4H，m)，4.40(2H，br d，J = 7 Hz)，4.77(2H，br s)，6.22(1H，d，J = 5 Hz)，6.70(1H，d，J = 5 Hz)，8.11(1H，m)，8.74(1H，br s)，8.80(1H，d，J = 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 376，378(M + H).

下列化合物之製備可仿例 205 之方法來進行。

例 625

(4E)-5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-4-戊烯酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 8 Hz)，2.26-2.43(4H，m)，2.50(3H，s)，3.01(2H，q，J = 8 Hz)，5.40(1H，dt，J = 15，7 Hz)，6.05(1H，d，J = 5 Hz)，6.20(1H，d，J = 15 Hz)，6.56(1H，d，J = 5 Hz)，7.28(1H，br d，J = 5 Hz)，7.39(1H，br s)，8.47(1H，br d，J = 5 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 370(M + H).

例 625-2

(4Z)-5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-4-戊烯酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.39(3H，t，J = 8 Hz)，1.87-2.00(2H，m)，2.12(2H，t，J = 8 Hz)，2.42(3H，s)，3.03(2H，q，J = 8 Hz)，5.58(1H，dt，J = 10，8 Hz)，6.17(1H，d，J = 5 Hz)，6.26(1H，br d，J = 10 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，7.35(1H，br d，J = 5 Hz)，7.44(1H，br s)，8.48(1H，br d，J = 5 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 370(M + H).

下列化合物之製備可仿例 220 之方法來進行。

例 626

4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.39(3H，t，J = 8 Hz)，3.06(2H，q，J = 8 Hz)，3.44(3H，s)，4.82(2H，s)，6.36(1H，d，J = 5 Hz)，6.77(1H，d，J = 5 Hz)，8.09(1H，br s)，8.65(1H，br s)，8.72(1H，br s).

MS(ESI^+)：m/z 390，392(M + H).

例 627

4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 8 Hz)，2.70(3H，s)，3.06(2H，q，J = 8 Hz)，6.26(1H，d，J = 5 Hz)，6.72(1H，d，J = 5 Hz)，7.32(1H，dd，J = 5，1 Hz)，7.43(1H，br s)，8.50(1H，d，J = 5 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 316(M + H).

下列化合物之製備可仿例 244 之方法來進行。

例 628

4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-甲醛

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.39(3H，t，J = 8 Hz)，2.81(3H，s)，3.09(2H，q，J = 8 Hz)，6.43(1H，d，J = 5 Hz)，6.78(1H，d，J = 5 Hz)，7.34(1H，br d，J = 5 Hz)，7.46(1H，br s)，8.56(1H，d，J = 5 Hz)，9.76(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 300(M + H).

例 629

4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-甲醛

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.41(3H，t，J = 8 Hz)，3.14(2H，q，J = 8 Hz)，3.55(3H，s)，4.94(2H，s)，6.50(1H，d，J = 5 Hz)，6.84(1H，d，J = 5 Hz)，7.95(1H，br s)，8.12(1H，br s)，8.84(1H，br s)，9.85(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 374，376(M + H).

例 630

將氧氯化磷(241 mg，1.57 mmol)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(4 mL)，於室温攪拌 10 分鐘。冷却至 0℃，加入含 4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸乙酯(428 mg，1.31 mmol)之 N，N-二甲基甲醯胺(0.7 mL)。回温至 50℃，攪拌 45 分鐘。因仍有原料，加入含氧氯化磷(621 mg，0.67 mmol)之 N，N-二甲基甲醯胺(0.2 mL)，攪拌 15 分鐘。倒至冰水(10 mL)，萃取以乙酸乙酯(30 mL)。將有機層清洗以水及飽和重碳酸鈉。將水層萃取以乙酸乙酯。將結合有機萃取液清洗以食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥，蒸發可得藍色油。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-20～1-10 可得 4-(4-氟苯基)-7-甲醯基-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸乙酯之黃色油，靜置可析出結晶(360 mg，77.5%)。

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.02(3H，t，J = 7 Hz)，1.41(6H，d，J = 7 Hz)，3.29(1H，七線，J = 7 Hz，)，4.10(2H，q，J = 7 Hz)，6.42(1H，d，J = 5 Hz)，7.20(2H，t，J = 9 Hz)，7.45-7.51(3H，m)，10.56(1H，s).

MS(ESI$^+$)：m/z 355(M + H)

例 631

將 N，N-二甲基乙醯胺(80.1 mg，0.919 mmol)溶在二氯乙烷(1 mL)，於 0℃下加入氧氯化磷(141 mg，0.919 mmol)之二氯乙烷(0.5 mL)。攪拌 0.5 小時，加入 4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸乙酯(200 mg，0.613 mmol)

之二氯乙烷(0.5 mL)。於室溫下攪拌3天。分層於乙酸乙酯(30 mL)及水(5 mL)，將有機層清洗以飽和重碳酸鈉溶液及食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥，蒸發可得桔色膠。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-20～1-10可得7-乙醯基-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯之黃色膠(144 mg，63.8%)。

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.00(3H，t，J = 7 Hz)，1.41(6H，d，J = 7 Hz)，2.88(3H，s)，3.09(1H，七線，J = 7 Hz)，4.09(2H，q，J = 7 Hz)，6.40(1H，d，J = 5 Hz)，7.19(2H，t，J = 9 Hz)，7.46(2H，dd，J = 3及9 Hz)，7.57(2H，d，J = 7 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 369(M + H)

例 632

將4-(4-氟苯基)-7-甲醯基-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯(100 mg，0.282 mmol)及硼氫化鈉(10.7 mg，0.282 mmol)溶在乙醇(1 mL)，於冰浴下攪拌0.5小時。分層於乙酸乙酯(10 mL)及水(5 mL)，將有機層清洗以食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥，蒸發可得4-(4-氟苯基)-7-羥甲基1-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯之黃色膠(89.1 mg，89.1%)。

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.97(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(6H，，J = 7 Hz)，3.25-3.37(2H，m)，4.04(2H，q，J = 7 Hz)，5.06(1H，d，J = 7 Hz)，6.32(1H，d，J = 5 Hz)，6.78(1H，d，J = 5 Hz)，7.19(2H，t，J = 9 Hz)，7.46(2H，d，J = 4及9 Hz).

例 633

將 4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咁基-3-羧酸乙酯(80.0 mg，0.245 mmol)及 N，N-二甲胺吡啶(29.9 mg，0.245 mmol)溶在 N，N-二甲基甲醯胺(0.5 mL)，於-20℃加下 3，7-二硝基-5-(三氟甲基)二苯并[b，d]噻吩三氟甲磺酸鹽(120 mg，0.245 mmol)。於 0℃下攪拌 45 分鐘再於室溫下攪拌 12 小時。加入水(5 mL)及乙酸乙酯(10 mL)，過濾。將有機層清洗以食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥，蒸發可得棕色膠。以驟矽膠柱層析純化，溶離以甲苯-己烷 = 1-5～4-5 可得 4-(4-氟苯基)-2-異丙基-7-三氟甲吡咯并[1，2-b]嗒咁基-3-羧酸乙酯之黃色膠(46.7 mg，48.3%)。

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.00(3H，t，J = 7 Hz)，1.38(6H，d，J = 7 Hz)，3.26(1H，七線，J = 7 Hz)，4.08(2H，q，J = 7 Hz)，6.33(1H，d，J = 5 Hz)，7.12(1H，d，J = 5 Hz)，7.19(2H，t，J = 9 Hz)，7.47(2H，d，J = 4 及 9 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 395(M + H)

例 634

將 4-(4-氟苯基)-7-甲醯基-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咁基-3-羧酸乙酯(200 mg，0.564 mmol)，羥胺鹽酸鹽(51.0 mg，0.734 mmol)，及甲酸鈉(69.1 mg，1.02 mmol)溶在甲酸(2 mL)，回流 2 小時。蒸發可得綠色膠。將膠分層於乙酸乙酯(10 mL)及飽和重碳酸鈉溶液(5 mL)。將有機層清洗以食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥，蒸發可得綠色膠。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-10～1-8 可得 7-氰基-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咁基-3-羧酸乙酯之黃色結晶

(144 mg，72.6%)。

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.01(3H，t，J = 7 Hz)，1.41(6H，d，J = 7 Hz)，3.26(1H，七線，J = 7 Hz)，4.09(2H，q，J = 7 Hz)，6.36(1H，d，J = 5 Hz)，7.20(2H，t，J = 9 Hz)，7.28(1H，d，J = 5 Hz)，7.47(2H，d，J = 4 及 9 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 398(M + HCOOH + H)

例 635

將 7-氰基-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯(70.4 mg，0.200 mmol)溶在硫酸(1 mL)，於 70℃下攪拌 50 分鐘。分層於乙酸乙酯及水。將有機層清洗以食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥，蒸發可得棕色膠。以製備性矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-1 可得 7-胺羰基-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯之桔色固體(5.2 mg，7.0%)。

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.99(3H，t，J = 7 Hz)，1.41(6H，d，J = 7 Hz)，3.41(1H，七線，J = 7 Hz)，4.08(2H，q，J = 7 Hz)，5.93(1H，br s)，6.46(1H，d，J = 5 Hz)，7.45(2H，t，J = 9 Hz)，7.28(1H，d，J = 5 Hz)，8.90(1H，br s).

例 636

將 4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羧酸乙酯(100 mg，0.306 mmol)及硫氰酸銨(28.0 mg，0.368 mmol)溶在甲醇(100 mL)，於冰浴冷卻下加入酒石酸銫銨(386 mg，0.705 mmol)。攪拌 30 分鐘。加入酒石酸銫銨(8.2 mg，0.107 mmol)後再攪拌 10 分鐘。加入水(5 mL)，萃取以乙酸乙酯(20

mL)。將有機層清洗以食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥，蒸發可得暗綠色膠。以驟矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-10～3-20可得4-(4-氟苯基)-2-異丙基-7-硫氰酸吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸乙酯之黃色膠(89.6 mg，82.3%)。

^{1}H-NMR($CDCl_3$，δ)：δ 1.01(3H，t，J = 7 Hz)，1.46(6H，d，J = 7 Hz)，3.36(1H，七線，J = 7 Hz)，4.08(2H，q，J = 7 Hz)，6.23(1H，d，J = 5 Hz)，7.14-7.22(3H，m)，7.16(2H，t，J = 9 Hz)，7.46(2H，dd，J = 4及9 Hz).

例 637

將4-(4-氟苯基)-2-異丙基-7-硫氰酸吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸乙酯(77.7 mg，0.219 mmol)溶在甲醇(0.7 mL)，於室溫下加入85%氫氧化鉀(0.3 mg，0.004 mmol)。攪拌5分鐘，分層於乙酸乙酯(20 mL)及水(5 mL)。將有機層清洗以食鹽水，於無水硫酸鎂下乾燥，蒸發可得之黃色膠。以製備性矽膠柱層析純化，溶離以乙酸乙酯-己烷 = 1-7可得4-(4-氟苯基)-2-異丙基-7-(甲硫基)吡咯并[1，2-b]嗒呯基-3-羧酸乙酯之黃色膠(35.9 mg，44.1%)。

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.98(3H，t，J = 7 Hz)，1.41(6H，d，J = 7 Hz)，2.52(3H，s)，3.32(1H，七線，J = 7 Hz)，4.05(2H，q，J = 7 Hz)，6.35(1H，d，J = 5 Hz)，6.89(1H，d，J = 5 Hz)，7.16(2H，t，J = 9 Hz)，7.44(2H，d，J = 4及9 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 373(M + H)

下列化合物之製備可仿例1之方法來進行。

例 638

3-(9-乙基-3-甲氧基-5，6-二氫苯并[f]吡咯并[1，2-b]哼喏啉-12-基)苄腈

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.41(3H，t，J = 8 Hz)，2.91-3.11(6H，m)，3.78(3H，s)，6.09(1H，d，J = 5 Hz)，6.38(1H，dd，J = 8，3 Hz)，6.52(1H，d，J = 8 Hz)，6.59(1H，d，J = 5 Hz)，6.77(1H，br s)，7.56(1H，t，J = 8 Hz)，7.67(1H，br d，J = 8 Hz)，7.70-7.77(2H，m).

例 639

4-(3-乙基-6H-茚基并[1，2-e]吡咯并[1，2-b]嗒咿-11-基)苄腈

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.43(3H，t，J = 8 Hz)，3.09(2H，q，J = 8 Hz)，4.11(3H，s)，6.14(1H，d，J = 5 Hz)，6.64(1H，d，J = 5 Hz)，6.71(1H，d，J = 8 Hz)，7.07(1H，t，J = 8 Hz)，7.20-7.30(1H，與 $CDCl_3$ 重覆)，7.49(1H，d，J = 8 Hz)，7.69(2H，d，J = 8 Hz)，7.88(2H，d，J = 8 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 336(M + H).

下列化合物之製備可仿製備例 24 之方法來進行。

製備例 352

4-甲氧基-2-[(5-甲基-3-吡啶基)羰基]-3-氧丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.97，1.26(3H，t，J= 7 Hz)，2.40(3H，s)，3.24，3.35，3.49(3H，s)，3.98-4.20(2H，m)，4.11，4.20，4.54(2H，s)，5.70(1H，s)，7.67，7.92，8.02，8.50-8.66，8.77，8.89(3H，m).

製備例 353

2-[(5-氯-3-吡啶基)羰基]-4-甲氧基-3-氧丁酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.00，1.06，1.28，1.35(3H，t，J= 7 Hz)，3.23，3.43，3.49(3H，s)，4.05-4.33(2H，m)，4.56(2H，s)，7.85，8.05，8.22，8.29，8.58-8.82，8.85，9.01，9.10(3H，m).

下列化合物之製備可仿製備例 176 之方法來進行。

製備例 354

3-溴-5-({1-[(氰乙醯基)胺基]-5-乙基-1H-吡咯-2-基}羰基)苄酸第三丁酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.29(34H，t，J = 7 Hz)，1.60(9H，s)，2.61(2H，q，J = 7 Hz)，3.64(2H，s)，6.00(1H，m)，6.80(1H，m)，8.03(1H，m)，8.26(1H，m)，8.28(1H，m).

製備例 355

3-溴-5-[(5-乙基-1-{[(甲磺醯基)乙醯基]胺基}-1H-吡咯-2-基)羰基]苄酸第三丁酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.29(3H，t，J = 7 Hz)，1.60(9H，s)，2.60(2H，q，J = 7 Hz)，2.92(3H，s)，4.04(2H，s)，6.11(1H，m)，6.78(1H，m)，8.03(1H，m)，8.25(1H，m)，8.27(1H，m).

下列化合物之製備可仿製備例 153 之方法來進行。

製備例 356

3-溴-5-(氰羰基)苄酸第三丁酯

下列化合物之製備可仿製備例 164 之方法來進行。

製備例 357

3-溴-5-[(5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]苄酸第三丁酯

1H-NMR($CDCl_3$)δ 1.32(3H，t，J = 7 Hz)，1.61(9H，s)，2.74(2H，q，J = 7 Hz)，6.10(1H，m)，6.80(1H，m)，8.13(1H，m)，8.26(1H，m)，8.39(1H，m)，9.34(1H，s，br).

下列化合物之製備可仿製備例 338 之方法來進行。

製備例 358

3-[(1-胺基-5-乙基-1H-吡咯-2-基)羰基]-5-溴苄酸第三丁酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.29(3H，t，J = 7 Hz)，1.61(9H，s)，2.76(2H，q，J = 7 Hz)，5.74(2H，s，br)，5.93(1H，d，J = 5 Hz)，6.63(1H，d，J = 5 Hz)，8.05(1H，m)，8.25(1H，m)，8.29(1H，m).

製備例 359

將 3-溴-5-碘苄酸第三丁酯(4.00 g)溶在四氫呋喃(30 mL)，於氮氣下加入 0.76 M 異丙基溴化鎂(13.7 mL)之冰-甲醇浴。攪拌 0.5 小時，倒至乾冰。回溫至室溫 1 小時。分層於 EtOAc 及 1 N HCl。將有機層萃取以 1 N NaOH(2 次)。酸化以濃 HCl，萃取以氯仿(2 次)。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 3-溴-5-(第三丁氧羰基)苄酸之淡棕色固體(529 mg)。

3-溴-5-(第三丁氧羰基)苄酸

^{1}H-NMR(DMSO-d_6)δ 1.57(9H，s)，8.21(1H，s)，8.25(1H，s)，8.37(1H，s).

製備例 360

將 $MgSO_4$(7.36 g)溶在二氯甲烷(50 mL)，於室溫劇烈攪拌下加入硫酸(0.758 mL)。攪拌 15 分鐘，加入 3-溴-5-碘苄酸(5.00 g)，再加入第三-丁醇(7.31 mL)。於室溫攪拌 3 天。分層於 EtOAc 及水。將有機層清洗以飽和 $NaHCO_3$ 及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得 3-溴-5-碘苄酸第三丁酯淡紫結晶(4.44 g)。

3-溴-5-碘苄酸第三丁酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.58(9H，s)，8.00(1H，m)，8.06(1H，m)，8.22(1H，m).

製備例 361

將鋰(316 mg)溶在乙醚(10 mL)，於甲醇-冰水浴及氮氣下，於 20 分鐘內加入環丙溴(2.50 g)之乙醚(10 mL)。於冰浴冷卻下攪拌 0.5 小時。在乾冰-丙酮浴冷却。於 15 分鐘內加入三異丙氧硼烷(5.05 g)之四氫呋喃(5 mL)。回溫至室溫 2 小時。中止反應以加入 HCl。將有機溶劑蒸發，萃取以乙醚(30 mL，5 次)。將結合萃取液於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得白色固體(968 mg)。將固體碾製以冷己烷可得環丙硼酸白色粉(789 mg)。

環丙硼酸

^{1}H-NMR(DMSO-d_6)δ-0.40(1H，m)，0.32(2H，m)，0.39(2H，m)，7.28(2H，s).

下列化合物之製備可仿例 21 之方法來進行。

例 640

7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]

嗒咁基-3-羧酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 0.99(3H，t，J= 7 Hz)，1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.41(3H，s)，3.06(2H，q，J= 7 Hz)，3.38(3H，s)，4.06(2H，q，J= 7 Hz)，4.75(2H，s)，6.33(1H，d，J= 4 Hz)，6.71(1H，d，J= 4 Hz)，7.61(1H，s)，8.52(1H，d，J= 2 Hz)，8.54(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 354.

例 641

4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咁基-3-羧酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.04(3H，t，J = 7 Hz)，1.38(3H，t，J = 7 Hz)，3.06(2H，q，J = 7 Hz)，3.39(3H，s)，4.09(2H，q，J = 7 Hz)，4.76(2H，s)，6.33(1H，d，J = 4 Hz)，6.75(1H，d，J = 4 Hz)，7.81(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.57(1H，d，J = 2 Hz)，8.68(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)374(M+1).

下列化合物之製備可仿例 076 之方法來進行。

例 642

(2E)-3-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咁-3-基]丙烯酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.39(3H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，3.07(2H，q，J= 7 Hz)，3.51(3H，s)，4.65(2H，s)，5.97(1H，d，J= 16 Hz)，6.27(1H，d，J= 4 Hz)，6.71(1H，d，J= 4 Hz)，7.61(1H，s)，7.72(1H，d，J= 16 Hz)，8.46(1H，d，

J= 2 Hz)，8.57(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI$^+$)：m/z 352.

例 643

(2E)-3-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙烯酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.39(3H，t，J = 7 Hz)，3.07(2H，q，J = 7 Hz)，3.51(3H，s)，4.65(2H，s)，5.97(1H，d，J = 16 Hz)，6.27(1H，d，J = 4 Hz)，6.75(1H，d，J = 4 Hz)，7.69(1H，d，J = 16 Hz)，7.78(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.54(1H，d，J = 2 Hz)，8.71(1H，d，J = 2 Hz).

MS(m/z)400(M+1).

例 644

4-[4-(5-環丙基-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸

1H-NMR($CDCl_3$)δ 0.78(2H，m)，1.10(2H，m)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.73(2H，m)，1.98(1H，m)，2.23(2H，m)，2.62(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz9，3.46(3H，s)，4.65(2H，q，J = 7 Hz)，5.88(1H，d，J = 5 Hz)，6.57(1H，d，J = 5 Hz)，7.36(1H，m)，8.41(1H，m)，8.47(1H，m).

例 645

5-[4-(5-環丙基-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.75(2H，m)，1.08(2H，m)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.40-1.57(4H，m)，1.96(1H，m)，2.18(2H

，m)，2.51(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.45(3H，s)，4.61(2H，m)，5.87(1H，d，J = 5 Hz)，6.56(1H，d，J = 5 Hz)，7.34(1H，m)，8.39(1H，m)，8.50(1H，m).

例 646

3-[4-(5-環丙基-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸

^{1}H-NMR(DMSO-d_6)δ 0.76(2H，m)，1.08(2H，m)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.95(1H，m)，2.48(2H，m)，2.87(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.47(3H，s)，4.66(2H，m)，5.90(1H，d，J = 5 Hz)，6.59(1H，d，J = 5 Hz)，7.35(1H，m)，8.40(1H，m)，8.48(1H，m).

例 647

5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-5-氧戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 8 Hz)，1.73-1.85(2H，m)，2.26(2H，t，J = 8 Hz)，2.36(2H，t，J = 8 Hz)，2.46(3H，s)，3.04(2H，q，J = 8 Hz)，6.33(1H，d，J = 5 Hz)，6.70(1H，d，J = 5 Hz)，7.34(1H，br d)，7.45(1H，br s)，8.53(1H，d，J = 6 Hz).

例 648

(2E)-3-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙烯酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 8 Hz)，2.67(3H，s)，3.05(2H，q，J = 8 Hz)，5.79(1H，d，J = 15 Hz)，6.19(1H

，d，J = 5 Hz)，6.67(1H，d，J = 5 Hz)，7.24-7.29(1H，與 $CDCl_3$ 重覆)，7.40(1H，br s)，7.51(1H，d，J = 15 Hz)，8.55(1H，d，J = 5 Hz).

下列化合物之製備可仿例 146 之方法來進行。

例 649

(2E)-3-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丙烯酸乙酯

^1H NMR($CDCl_3$)δ 1.27(3H，t，J = 8 Hz)，1.38(3H，t，J = 8 Hz)，2.65(3H，s)，3.04(2H，q，J = 8 Hz)，4.17(2H，q，J = 8 Hz)，5.76(1H，d，J = 15 Hz)，6.16(1H，d，J = 5 Hz)，6.65(1H，d，J = 5 Hz)，7.24-7.29(1H，與 $CDCl_3$ 重覆)，7.40(1H，br s)，7.53(1H，d，J = 15 Hz)，8.53(1H，d，J = 5 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 370(M + H).

下列化合物之製備可仿例 181 之方法來進行。

例 650

3-溴-5-(3-氰基-7-乙基-2-氧-1，2-二氫吡咯并[1，2-b]嗒呯-4-基)苄酸第三丁酯

^1H-NMR($CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J = 7 Hz)，2.94(2H，q，J = 7 Hz)，6.57(1H，d，J = 5 Hz)，6.72(1H，d，J = 5 Hz)，7.94(1H，m)，8.20(1H，m)，8.38(1H，m).

例 651

3-溴-5-[7-乙基-3-(甲磺醯基)-2-氧-1，2-二氫吡咯并[1，2-b]嗒呯-4-基]苄酸第三丁酯

1H-NMR($CDCl_3$)δ 1.35(3H，t，J = 7 Hz)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.06(3H，s)，6.24(1H，d，J = 5 Hz)，6.70(1H，d，J = 5 Hz)，7.23(1H，m)，7.94(1H，m)，8.25(1H，m).

下列化合物之製備可仿例 183 之方法來進行。

例 652

3-溴-5-(3-氰基-7-乙基-2-{[(三氟甲基)磺醯基]氧基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基)苄酸第三丁酯

1H-NMR($CDCl_3$)δ 1.39(3H，t，J = 7 Hz)，1.61(9H，s)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，6.81(1H，d，J = 5 Hz)，700(1H，d，J = 5 Hz)，7.96(1H，m)，8.21(1H，m)，8.33(1H，m).

例 653

3-溴-5-(7-乙基-3-(甲磺醯基)-2-{[(三氟甲基)磺醯基]氧基}吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基)苄酸第三丁酯

1H-NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 7 Hz)，1.59(9H，s)，3.01(2H，q，J = 7 Hz)，3.22(3H，s)，6.46(1H，d，J = 5 Hz)，7.12(1H，d，J = 5 Hz)，7.67(1H，m)，7.90(1H，m)，8.23(1H，m).

下列化合物之製備可仿例 184 之方法來進行。

例 654

3-溴-5-[3-氰基-7-乙基-2-(1-吡咯啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄酸第三丁酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.35(3H，t，J = 7 Hz)，1.60(9H，s)，2.01(4H，m)，2.93(2H，q，J = 7 Hz)，3.73(4H，m)，6.32(1H，d，J = 5 Hz)，6.58(1H，d，J = 7 Hz)，7.86(1H，m)，8.12(1H

，m)，8.24(1H，m)。

例 655

3-溴-5-[7-乙基-3-(甲磺醯基)-2-(1-吡咯啶基)吡咯并[1，2-b]嗒吩-4-基]苄酸第三丁酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.58(9H，s)，1.99(4H，m)，2.98(2H，q，J = 7 Hz)，3.21(3H，s)，3.52(4H，m)，6.30(1H，d，J = 5 Hz)，6.66(1H，d，J = 5 Hz)，7.76(1H，m)，8.00(1H，m)，8.19(1H，m)。

下列化合物之製備可仿例 147 之方法來進行。

例 656

(2E)-3-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基]丙烯酸乙酯

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.27(3H，t，J = 7 Hz)，1.39(3H，t，J = 7 Hz)，3.07(2H，q，J = 7 Hz)，3.51(3H，s)，4.18(2H，q，J = 7 Hz)，4.64(2H，s)，5.97(1H，d，J = 16 Hz)，6.24(1H，d，J = 4 Hz)，6.72(1H，d，J = 4 Hz)，7.61(1H，d，J = 16 Hz)，7.76(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.54(1H，d，J = 2 Hz)，8.68(1H，d，J = 2 Hz).

下列化合物之製備可仿例 205 之方法來進行。

例 657

(4E)-5-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒吩-3-基]-4-戊烯酸

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 7 Hz)，2.25-2.41(4H，m)，3.05(2H，q，J = 7 Hz)，3.50(3H，s)，

4.57(2H，s)，5.53(1H，dd，J = 16，7 Hz)，6.13(1H，d，J = 4 Hz)，6.36(1H，d，J = 16 Hz)，6.65(1H，d，J = 4 Hz)，7.80(1H，s)，8.54(1H，br s)，8.62(1H，br s).

MS(m/z)400(M+1).

下列化合物之製備可仿製備例 153 之方法來進行。

例 658

4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羰基氯

下列化合物之製備可仿例 244 之方法來進行。

例 659

7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-甲醛

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.40(3H，t，J= 7 Hz)，2.45(3H，s)，3.12(2H，q，J= 7 Hz)，3.56(3H，s)，4.96(2H，s)，6.51(1H，d，J= 4 Hz)，6.80(1H，d，J= 4 Hz)，7.62(1H，s)，8.54(1H，s)，8.61(1H，s)，9.79(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 310.

例 660

4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-甲醛

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.41(3H，t，J = 7 Hz)，3.12(2H，q，J = 7 Hz)，3.54(3H，s)，4.94(2H，s)，6.50(1H，d，J = 4 Hz)，6.84(1H，d，J = 4 Hz)，7.81(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.59(1H，d，J = 2 Hz)，8.74(1H，d，J = 2 Hz)

，9.85(1H，s).

下列化合物之製備可仿例 533 之方法來進行。

例 661

[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]甲醇

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J= 7 Hz)，2.43(3H，s)，3.05(2H，q，J= 7 Hz)，3.52(3H，s)，4.37-4.51(2H，br)，4.66-4.78(2H，br)，6.20(1H，d，J= 4 Hz)，6.67(1H，d，J= 4 Hz)，7.75(1H，s)，8.54(1H，s)，8.60(1H，s).

MS(ESI^+)：m/z 312.

例 662

[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]甲醇

^{1}H NMR(300 MHz，$CDCl_3$)δ 1.38(3H，t，J = 7 Hz)，3.05(2H，q，J = 7 Hz)，3.53(3H，s)，4.41(2H，d，J = 6 Hz)，4.77(2H，s)，6.22(1H，d，J = 4 Hz)，6.70(1H，d，J = 4 Hz)，7.97(1H，dd，J = 2，2 Hz)，8.69-8.71(2H，m).

MS(m/z)332(M+1).

例 663

將 7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-甲醛(48 mg)及(三苯亞膦基)乙酸乙酯(56.8 mg)溶在 THF(3 mL)，於室溫下攪拌 2 小時。蒸發溶劑，以矽膠柱層析純化(己烷：乙酸乙酯=5:1-2:1)可得(2E)-3-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-

基]丙烯酸乙酯黃色粉(30 mg)。

(2E)-3-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙烯酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.26(3H，t，J= 7 Hz)，1.39(3H，t，J= 7 Hz)，2.42(3H，s)，3.07(2H，q，J= 7 Hz)，3.51(3H，s)，4.12(2H，q，J= 7 Hz)，4.64(2H，s)，5.97(1H，d，J= 16 Hz)，6.24(1H，d，J= 4 Hz)，6.70(1H，d，J= 4 Hz)，7.55(1H，s)，7.63(1H，d，J= 16 Hz)，8.47(1H，d，J= 2 Hz)，8.55(1H，d，J= 2 Hz).

MS(ESI^+)：m/z 380.

例 664

將 4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯(75.0 mg)，環丙硼酸(18.2 mg)，三環己膦(4.57 mg)，及磷酸鉀(104 mg)溶在甲苯-水(1 mL-0.2 mL)，加入乙酸鈀(1.83 mg)。於 100℃攪拌 2 小時。分層於 EtOAc 及水。將有機層清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。以製備性矽膠薄層層析純化(EtOAc-己烷 = 1-3)可得 4-[4-(5-環丙基-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯之黃色膠(60.9 mg)。

4-[4-(5-環丙基-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.76(2H，m)，1.07(2H，m)，1.20(3H，t，J= 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.68(2H，m)，1.96(1H，m)，2.17(2H，m)，2.56(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)

，3.46(3H，s)，4.03(2H，q，J = 7 Hz)，4.65(2H，m)，5.90(1H，d，J = 5 Hz)，6.57(1H，d，J = 5 Hz)，7.30(1H，m)，8.40(1H，m)，8.51(1H，m).

下列化合物之製備可仿例 664 之方法來進行。

例 665

5-[4-(5-環丙基-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.76(2H，m)，1.08(2H，m)，1.23(3H，t，J = 7 Hz)，1.35-1.57(7H，m)，1.96(1H，m)，2.16(2H，t，J = 7 Hz)，2.53(2H，m)，3.03(2H，q，J = 7 Hz)，3.46(3H，s)，4.08(2H，q，J = 7 Hz)，4.62(2H，s)，5.89(1H，d，J = 5 Hz)，6.56(1H，d，J = 5 Hz)，7.29(1H，m)，8.40(1H，m)，8.52(1H，m).

例 666

3-[4-(5-環丙基-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸乙酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.76(2H，m)，1.08(2H，m)，1.19(3H，t，J = 7 Hz)，1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.97(1H，m)，2.38(2H，m)，2.85(2H，m)，3.02(2H，q，J = 7 Hz)，3.46(3H，s)，4.04(2H，q，J = 7 Hz)，4.64(2H，s)，5.92(1H，d，J = 5 Hz)，6.59(1H，d，J = 5 Hz)，7.29(1H，m)，8.40(1H，m)，8.53(1H，m).

例 667

3-[3-氰基-7-乙基-2-(1-吡咯啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-

基]-5-環丙基苄酸第三丁酯

^{1}H-NMR($CDCl_3$)δ 0.81(2H，m)，1.03(2H，m)，1.35(3H，t，J = 7 Hz)，1.59(9H，s)，1.94-2.08(5H，m)，2.94(2H，q，J = 7 Hz)，3.68-3.77(4H，m)，6.35(1H，j，J = 5 Hz)，6.55(1H，d，J = 5 Hz)，7.43(1H，s)，7.84(1H，s)，7.97(1H，s).

例 668

將 3-溴-5-[3-氰基-7-乙基-2-(1-吡咯啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄酸第三丁酯(16.0 mg)溶在三氟乙酸(0.5 mL)，於室溫下攪拌 0.5 小時。中止反應以加入水。中和以加入 NaOH(pH = 3)。萃取以 EtOAc。將萃取物清洗以食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發可得綠色黃色固體。將固體碾製以己烷-$CHCl_3$(2-1)可得 3-溴-5-[3-氰基-7-乙基-2-(1-吡咯啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄酸之黃色粉(10.8 mg)。

3-溴-5-[3-氰基-7-乙基-2-(1-吡咯啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$ + CD_3OD δ 1.36(3H，t，J = 7 Hz)，2.01(4H，m)，2.94(2H，q，J = 7 Hz)，3.72(4H，m)，6.36(1H，d，J = 5 Hz)，6.60(1H，d，J = 5 Hz)，7.92(1H，m)，8.23(1H，m)，8.35(1H，m).

下列化合物之製備可仿例 668 之方法來進行。

例 669

3-[3-氰基-7-乙基-2-(1-吡咯啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]-5-環丙基苄酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$ + CD_3OD δ 0.81(2H，m)，1.05(2H，m)，1.35(3H，t，J = 7 Hz)，2.01(5H，m)，2.94(2H，q，J = 7 Hz)，7.73(4H，m)，6.37(1H，d，J = 5 Hz)，6.57(1H，d，J = 5 Hz)，6.98(1H，s)，7.90(1H，s)，8.08(1H，s).

例 670

3-溴-5-[7-乙基-3-(甲磺醯基)-2-(1-吡咯啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄酸

^{1}H-NMR($CDCl_3$ + CD3OD δ 1.37(3H，t，J = 7 Hz)，1.98(4H，m)，2.99(2H，q，J = 7 Hz)，320(3H，s)，3.56(4H，m)，6.32(1H，d，J = 5 Hz)，6.67(1H，d，J = 5 Hz)，7.80(1H，m)，8.08(1H，m)，8.30(1H，m).

例 671

在含 Zn-Cu 偶合物之 3-頸三角瓶，於室温及氮氣下加入含 4-碘丁酸乙酯(369 mg)之甲苯(3 mL)及 N，N-二甲基乙醯胺(0.2 mL)。於同温下攪拌 1 小時，再於 60℃ 下攪拌 3 小時。加入含肆(三苯膦)鈀(44 mg)之甲苯(0.5 mL)，攪拌 5 分鐘。移除油浴，在冰水浴下冷却。滴加入含 4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿基-3-羰基氯(212 mg)之 DCM(1 mL)。10 分鐘後，於室温下攪拌 2 小時。分層於 AcOEt 及 H_2O。將有機層清洗以飽和 $NaHCO_3$ 及食鹽水，於硫酸鎂下乾燥，並真空蒸發。將殘渣以驟矽膠柱層析純化(矽膠，80 mL)，溶離以己烷-AcOEt = 10-1 及 5-1 可得 5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-5-氧戊酸乙酯黃色非晶形物(143 mg)。

5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-5-氧戊酸乙酯

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.23(3H，t，J = 8 Hz)，1.38(3H，t，J = 8 Hz)，1.71-1.84(2H，m)，2.17(3H，t，J = 8 Hz)，2.32(3H，t，J = 8 Hz)，2.46(3H，s)，3.04(2H，q，J = 8 Hz)，4.06(2H，q，J = 8 Hz)，6.32(1H，d，J = 5 Hz)，6.70(1H，d，J = 5 Hz)，7.32(1H，dd，J = 5，1)，7.46(1H，br s)，8.53(1H，d，J = 5 Hz).

例 672

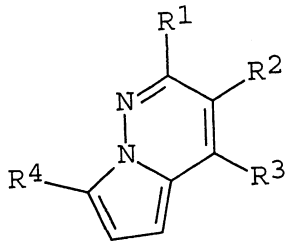
將 5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-5-氧戊酸(47 mg)溶在 EtOH(1 mL)，於冰浴及氮氣下加入硼氫化鈉(5 mg)。10 分鐘後，於室溫下攪拌。1 小時後，加入硼氫化鈉(5 mg)。2 小時後，分層於 $CHCl_3$ 及 H_2O。將水層萃取以 $CHCl_3$ 2 次。將結合有機層於硫酸鎂下乾燥並真空蒸發。將殘渣以 p-TLC 純化($CHCl_3$-MeOH = 10-1)可得 5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-5-羥戊酸黃色非晶形物(28 mg)。

5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]-5-羥戊酸

^{1}H NMR($CDCl_3$)δ 1.36(3H，t，J = 8 Hz)，1.46-1.83(3H，m)，1.95(1H，m)，2.70(3H，br s)，3.01(2H，q，J = 8 Hz)，4.63(1H，m)，5.85(1H，m)，6.55(1H，d，J = 5 Hz)，7.18-7.29(1H，與 $CDCl_3$ 重覆)，7.34(1H，d，J = 2 Hz)，8.49(1H，d，J = 5 Hz).

伍、中文發明摘要

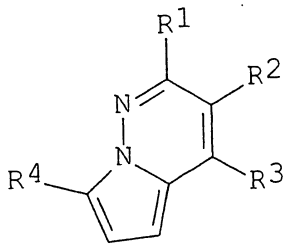
本發明係關於式(I)化合物與其鹽，其中 R^1，R^2，R^3 及 R^4 之定義如說明書其所示，使用其爲醫藥，其製法，及使用其以治療 PDE-IV 或 TNF-α仲介疾病。



(I)

陸、英文發明摘要

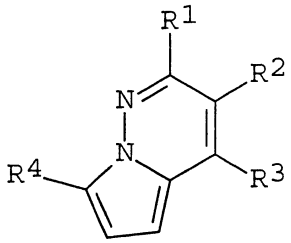
The invention relates to compound of the formula (I) or its salt, in which R^1, R^2, R^3 and R^4 are as defined in the description, their use of as medicament, the process for their preparation and use for the treatment of PDE-IV or TNF-α mediated diseases.



(I)

拾、申請專利範圍

1. 一種如下式化合物或其藥理容許鹽，或其前藥：



(I)

其中

R^1 爲(1)羧基或已保護羧基，

(2)-$CONR^5R^6$，

(3)羥基或低烷氧基，

(4)胺基，環低烷胺基或單或二低烷胺基任意取代以低烷氧基，

(5)三鹵低烷基，

(6)三鹵低烷磺醯氧基或芳磺醯胺基，

(7)已取代或未取代低烷基，

(8)已取代或未取代芳基，或

(9)已取代或未取代雜環基，

R^2 爲 R^7 或 -$(A^1)p$-X-A^2-R^7，

其中 p 爲 0 或 1 之整數

A^1 爲(C_1-C_2)伸烷基或-CH=CH-；

A^2 爲-$(CH_2)n$-或-(CH=CH)m-[式中 n 爲 1～6 之整數且 m 爲 1～3 之整數]；

X 爲單鍵，-O-，-NR^8-，-C(=O)-，-C(=NR^9)-或羥(C_1-C_2)伸烷基[式中 R^8 爲氫或低烷基，且 R^9 爲已取代或未取代含 N 雜環基]，且

R^7 爲

(1)氫，

(2)已取代或未取代芳基，

(3)已取代或未取代雜環基，

(4)羧基，已保護羧基或 $CONR^{10}R^{11}$，

(5)醯基或鹵羰基，

(6)氰基，

(7)胺基，已保護胺基，或單或二低烷胺基，

(8)羥基，芳氧基，醯氧基或低烷基任意取代以羥基或醯氧基，

(9)低烷硫基，低亞磺醯基或低烷磺醯基，或

(10)-O-R^{12}，或

R^1 及 R^2 共形成低伸烷基或低伸烯基，其可任意中斷以胺基或磺醯基，且可任意稠合以苯環，且可任意取代以一群含低烷基，羥基，氧及低烷氧基，

R^3 爲已取代或未取代芳基，或已取代或未取代雜環基，

R^4 爲氫，鹵素，氰基，胺甲醯基，醯基，硫氰酸鹽，低烷硫基，低烯基，羥低烷基，三鹵低烷基或低烷基，

R^5，R^6，R^{10} 及 R^{11} 各爲氫，低烷磺醯基，雜環基或低烷基任意取代以羥基，烷氧基，磺酸基，羧基，已保護羧基或-R^{17} 或 R^5 及 R^6 或 R^{10} 及 R^{11} 與相連氮原子共表爲含N雜環基，且

R^{12} 及 R^{17} 各爲源自被保護或借除去其羥基而得之未保護糖基。

2. 如申請專利範圍第 1 項之化合物，其中

R^1 爲(1)羧基或已保護羧基，

(2)-$CONR^5R^6$[式中 R^5 及 R^6 各爲低烷基，或 R^5 及 R^6 與相連氮原子共表爲飽和 5-或 6-員雜單環基其含 1～2 個氮原子]，

(3)羥基或低烷氧基，

(4)胺基，環低烷胺基，或單或二低烷胺基 任意取代以低烷氧基，

(5)三鹵低烷基，

(6)三鹵低烷磺醯氧基或芳磺醯胺基，

(7)低烷基任意取代以(i)鹵素；(ii)羧基；(iii)已保護羧基；(iv)氰基；(v)胺甲醯基；(vi)-$OCONR^{15}R^{16}$[式中 R^{15} 及 R^{16} 各爲氫，芳基或低烷基任意取代以芳基，或 R^{15} 及 R^{16} 與相連氮原子共表爲飽和 5-或 6-員雜單環基，其含 1～2 個氮原子且任意含 1 個氧原子]；(vii)低烷硫基；(viii)低烷磺醯基；(ix)低烷磺醯氧基；(x)低烷磺醯胺基；(xi)單或二低烷胺基任意取代以羥基，低烷氧基，芳氧基，或已取代或未取代芳基；(xii)胺基；(xiii)醯胺基；(xiv)已保護胺基；(xv)羥基；(xvi)醯氧基；(xvii)環低烷氧基；(xviii)芳氧基；(xix)芳基；(xx)飽和或未飽和 5 或 6 員雜單環基含 1～3 個氮且可任意含氧或硫原子，亦可任意取代以低烷基，羥低烷基，芳基或氧基；或(xxi)低烷氧基任意取代以羧基，已保護羧基，羥基，已保護羥基，低烷氧基，環低烷基，已取代或未取代芳基，飽和或未飽和 5 或 6

員雜單環基含 1～2 個氮原子，任意取代以低烷基，或 -CONR^{13}R^{14}[式中 R^{13} 及 R^{14} 各爲氫或低烷基任意取代以芳基，或 R^{13} 及 R^{14} 與相連氮原子共表爲飽和 5-或 6-員雜單環基，其含 1～2 個氮原子且任意含 1 個氧原子]，

(8)芳基任意取代以取以基選自一群含鹵素，或

(9)飽和或未飽和 5-或 6-員雜單環基任意取代以低烷基或鹵素，

R^2 爲 R^7 或 - (A^1)p-X-A^2-R^7

其中

p 爲 0 或 1；

A^1 爲 (C_1-C_2)伸烷基或 –CH=CH-；

A^2 爲 -(CH_2)n-或 –(CH=CH)m-[式中 n 爲 1～6 之整數且 m 爲 1～3 之整數]；

X 爲單鍵，-O-，-NR^8-，-C(=O)-，-C(=NR^9)-或羥 (C_1-C_2)伸烷基；[其中 R^8 爲氫或低烷基，且 R^9 爲已取代或未取代吡咯基]

R^7 爲

(1) 氫，

(2) 芳基任意取代以低烷氧基，

(3) 未飽和雜單環基含 1～2 個氮原子，

(4) 羧基，酯化羧基或-CONR^{10}R^{11}[式中 R^{10} 及 R^{11} 各爲氫，低烷磺醯基，未飽和雜單環基含 1～2 個氮原子或低烷基任意取代以羥基，烷氧基，羧基，已保護羧基，磺酸基或 - R^{17}，或 R^{10} 及 R^{11} 與相連氮原子

共表爲飽和 5-或 6-員雜單環基，其含 1～2 個氮原子且任意含 1 個氧原子，例如嗎啉基]，

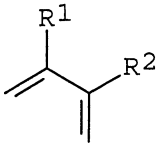
(5) 醯基或鹵羰基，

(6) 氰基，

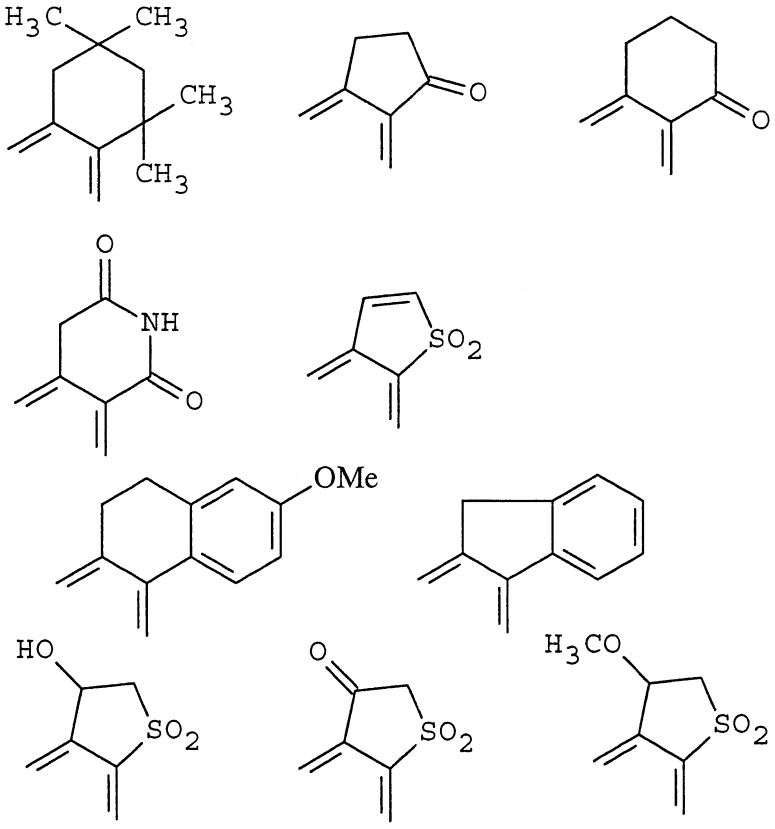
(7) 胺基，已保護胺基或單或二低烷胺基，

(8) 羥基，芳氧基，醯氧基或低烷氧基任意取代以羥基或醯氧基，

(9) 低烷硫基，低亞磺醯基或低烷磺醯基，或

(10) -O-R^{12}，或 

爲由下式所表示：



R^3爲(1)芳基任意取代以一以上取代基選自一群含(i)鹵素

，(ii)羧基，(iii)已保護羧基，(iv)氰基，(v)-$CONR^{15}R^{16}$[式中 R^{15} 及 R^{16} 各爲氫，低烷基任意取代以羥基]，(vi)低烷基，(vii)環低烷基，(viii)羥低烷基，(ix)低烷氧基，(x)三鹵低烷基，(xi)未飽和 5 或 6 員雜單環基含 1～2 個氧原子及 1～2 個氮原子，(xii)低烷磺醯基，(xiii)硝基，(xiv)胺磺醯基及(xv)已保護胺磺醯基；或

(2)雜環基選自一群含吡啶基，吡咔基，噁唑基，異噁唑基，呋喃基，噻吩基，喹啉基，苯并呋喃基及苯并噻吩基，其中該雜環基可任意取代以一以上取代基選自一群含(i)低烷基，(ii)環低烷基，(iii)低烷氧基，(iv)醯基，(v)胺基，(vi)單或二低烷胺基，(vii)已保護胺基，(viii)氰基，(ix)羧基，(x)已保護羧基，(xi)-$CONR^{15}R^{16}$[式中 R^{15} 及 R^{16} 各爲氫，低烷基任意取代以羥基]，(xii)低烯基任意取代以低烷氧基，(xiii)鹵素，(xiv)低烷硫基及(xv)羥基；

R^4 爲氫，鹵素，氰基，胺甲醯基，醯基，硫氰酸鹽，低烷硫基，低烯基，羥低烷基，三鹵低烷基或低烷基，

R^{12} 及 R^{17} 各爲源自已保護或未保護糖之基，例如半乳糖，由除去其羥基之基。

3. 如申請專利範圍第 2 項之化合物，其中 R^4 爲低烷基。

4. 如申請專利範圍第 3 項之化合物，其中

R^1 爲(1)單或二低烷胺基，

(2)苯基，

(3)飽和或未飽和 5 或 6 員雜單環基選自一群含吡咯啶基，吡咯基，噁唑基，異噁唑基，噻唑基，呋喃基，噻吩

基及吡啶基，或

(4)低烷基任意取代以(i)低烷氧基或(ii)飽和 5-或 6-員雜單環基選一群含哌咔基及嗎啉基，其中低烷氧基可任意取代以環低烷基或吡啶基。

5. 如申請專利範圍第 4 項之化合物，其中

R^2 爲 R^7 或 $-A^2-R^7$，其中

A^2 爲 $-(CH2)n-$ 或 $-(CH=CH)m-$ [式中 n 爲 2～6 整數且 m 爲 1～2 整數，且

R^7 爲氫，低烷磺醯基，羧基，酯化羧基或吡啶基，

R^3 爲(1)苯基任意取代以低烷基，環低烷基，低烷氧基，鹵素，氰基或胺甲醯基；或

(2)喹啉基；或吡啶基取代以低烷基，環低烷基，低烷氧基，胺甲醯基或鹵素。

6. 如申請專利範圍第 5 項之化合物，其中

R^1 爲苯基，吡咯基，異噁唑基，呋喃基，噻吩基，低烷基任意取代以低烷氧基，哌咔基或嗎啉基，其中低烷氧基可任意取代以環低烷基或吡啶基，

R^2 爲 $-(CH2)n-R^7$，其中 n 爲 2～5 之整數，且 R^7 爲羧基或酯化羧基，及

R^3 爲(1)苯基任意取代以低烷基，環低烷基，低烷氧基，鹵素，氰基或胺甲醯基；或(2)吡啶基取代以低烷基，環低烷基，低烷氧基，胺甲醯基或鹵素。

7. 如申請專利範圍第 5 項之化合物，其爲如下化合物或其藥理容許鹽：

(1)3-[7-乙基-2-甲基-3-(4-吡啶基)-吡咯并[1,2-b]嗒咿-4-基]苄腈，

(2)3-[7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈，

(3)4-[7-乙基-2-甲基-3-(甲磺醯基)-吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄腈，

(4)3-[7-乙基-2-(2-呋喃基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-4-基]苄醯胺，

(5)5-[4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸乙酯，

(6)2-{[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]甲基}-1，3-丙二醇，

(7)3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基-吡咯并[1,2-b]嗒咿-3-基]丙酸，

(8)5-[7-乙基-2-甲基-4-(6-喹啉基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，

(9)5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，

(10)5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，

(11)5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸，

(12)3-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丙酸，

(13)5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸，

(14)(2E)-3-[7-氯-4-(4-氟苯基)-2-異丙吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]-2-丙烯酸乙酯，

(15)6-{4-[4-(胺羰基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}己酸

(16)3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丙酸，

(17)4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丁酸，

(18)5-[2-[(環己基甲氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸，

(19)5-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}戊酸，

(20)4-{4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}丁酸，

(21)4-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丁酸，

(22)4-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丁酸，

(23)5-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸，或

(24)5-{4-(3-氰苯基)-7-乙基-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}戊酸。

8. 如申請專利範圍第 6 項之化合物，其爲如下化合物或其藥理容許鹽：

(1)5-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸乙酯，

(2)3-[4-(3-氯苯基)-7-乙基-2-苯基-吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丙酸，

(3)5-[4-(2-氯-4-吡啶基)-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸，

(4)5-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸，

(5)5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸，

(6)3-[7-乙基-2-(甲氧甲基)-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丙酸，

(7)5-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(4-嗎啉甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸，

(8)6-{4-[4-(胺羰基)苯基]-7-乙基-2-甲吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基}己酸，

(9)3-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丙酸，

(10)4-[4-(5-溴-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]丁酸，

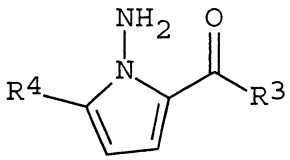
(11)5-[2-[(環己基甲氧基)甲基]-7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)吡咯并[1，2-b]嗒呯-3-基]戊酸，

(12)5-{7-乙基-4-(5-甲基-3-吡啶基)-2-[(4-吡啶甲氧基)甲基]吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基}戊酸，

(13)4-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]丁酸，或

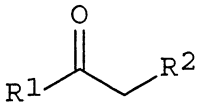
(14)5-[4-(5-氯-3-吡啶基)-7-乙基-2-(甲氧甲基)吡咯并[1，2-b]嗒咿-3-基]戊酸。

9. 一種製備如申請專利範圍第1項之化合物之方法，包含令式(II)化合物或其鹽



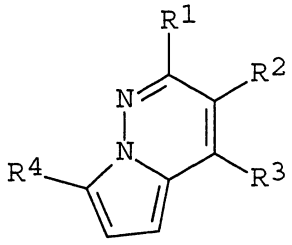
[其中 R^3 及 R^4 之定義如申請專利範圍第1項所示]

與式(III)化合物或其鹽



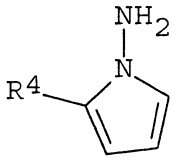
[其中 R^1 及 R^2 之定義如申請專利範圍第1項所示]

反應可得式(I)化合物或其鹽



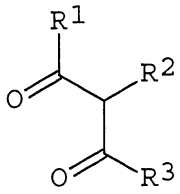
[其中 R^1，R^2，R^3 及 R^4 之定義如申請專利範圍第1項所示]，或

(2)令式(V)化合物或其鹽



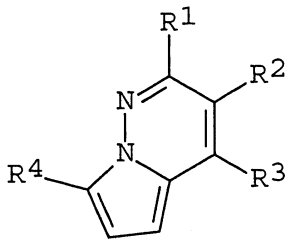
[式中 R^4 之定義如申請專利範圍第 1 項所示]

與式(VI)化合物或其鹽



[其中 R^1，R^2 及 R^3 之定義如申請專利範圍第 1 項所示]

反應可得式(I)化合物或其鹽



[其中 R^1，R^2，R^3 及 R^4 之定義如申請專利範圍第 1 項所示]。

10. 一種醫藥組成物，其含如申請專利範圍第 1 項之化合物爲活性成份，混合藥理容許載體。

11. 如申請專利範圍第 10 項之醫藥組成物，以抑制磷酸二酯酶 IV(PDE-IV)酵素活性及/或抑制腫瘤壞死因子之生成(TNF)。

12. 如申請專利範圍第 10 項之醫藥組成物，以預防或治療疾

病，其可由 PDE-IV 抑制劑或 TNF 產生抑制劑而治療。

13. 如申請專利範圍第 10 項之醫藥組成物，以預防或治療氣喘，慢性障礙性肺病(COPD)，纖維病，急性及暴發性肝炎，肝皮脂腺病(酒精性及非酒精性肝皮脂腺病)，慢性(病毒及非-病毒)肝炎，肝硬化，自體免疫肝炎，自體免疫發炎性腸病，異位皮膚炎，阿茲海默氏疾病及病毒感染。

14. 一種使用 PDE-IV 抑制劑或 TNF 產生抑制劑來預防或治療疾病之方法，含投予有效量之如申請專利範圍第 1 項之化合物。

15. 一種預防或治療氣喘、慢性障礙性肺病(COPD)、纖維病、急性及暴發性肝炎、肝皮脂腺病(酒精性及非酒精性肝皮脂腺病)、慢性(病毒及非-病毒)肝炎、肝硬化、自體免疫肝炎、自體免疫發炎性腸病、異位皮膚炎、阿茲海默氏疾病及病毒感染之方法，含投予治療有效量或預防有效量之如申請專利範圍第 1 項之化合物。

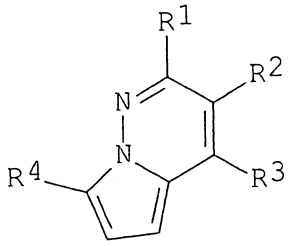
16. 一種使用如申請專利範圍第 1 項之化合物來製備醫藥以預防或治療疾病之用途，其可由 PDE-IV 抑制劑或 TNF 產生抑制劑而治療。

柒、指定代表圖

（一）本案指定代表圖為：無。

（二）本代表圖之元件代表符號簡單說明

捌、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式



(I)