

# 發明專利說明書

(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：96127596

※申請日期：96.7.27

※IPC 分類：

一、發明名稱：(中文/英文)

調節 CB2 受體之化合物

COMPOUNDS WHICH MODULATE THE CB2 RECEPTOR

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

德商百靈佳殷格翰國際股份有限公司

BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH

代表人：(中文/英文)

1. 漢茲 哈蒙

HAMMANN, HEINZ

2. 麥可 康特

KOMPTER, MICHAEL

住居所或營業所地址：(中文/英文)

德國萊茵區英格翰市賓格街 173 號

BINGER STRASSE 173 D-55216 INGELHEIM AM RHEIN GERMANY

國籍：(中文/英文)

德國 GERMANY

Co7D 417/02 (2006.01)

Co7D 413/02 (2006.01)

Co7D 401/02 (2006.01)

Co7D 217/24 (2006.01)

Co7D 261/14 (2006.01)

Co7D 277/46 (2006.01)

Co7D 407/04 (2006.01)

A61K 31/427 (2006.01)

A61K 31/42 (2006.01)

A61K 31/5377 (2006.01)

A61K 31/4427 (2006.01)

A61P 29/00 (2006.01)

A61P 25/02 (2006.01)

三、發明人：(共 12 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 安琪拉 蓓瑞  
BERRY, ANGELA
2. 皮耶 法蘭西斯柯 希利洛  
CIRILLO, PIER FRANCESCO
3. 金 理察 海齊  
HICKEY, EUGENE RICHARD
4. 多莉絲 萊瑟  
RIETHER, DORIS
5. 大衛 S. 湯姆森  
THOMSON, DAVID S.
6. 莫妮卡 耳曼  
ERMANN, MONIKA
7. 詹姆士 艾德華 真肯士  
JENKINS, JAMES EDWARD
8. 殷諾森 木胥  
MUSHI, INNOCENT
9. 麥爾康 泰勒  
TAYLOR, MALCOLM
10. 錢達那 修德胡利  
CHOWDHURY, CHANDANA
11. 克里斯多夫 法蘭西斯 帕莫  
PALMER, CHRISTOPHER FRANCIS
12. 耐吉 布倫麥爾  
BLUMIRE, NIGEL

國 籍：(中文/英文)

- 1-3. 均 美國 U.S.A.
4. 奧地利 AUSTRIA

5. 英國 U.K.
6. 奧地利 AUSTRIA
7. 英國 U.K.
8. 坦尚尼亞 TANZANIA
- 9-12.均 英國 U.K.

#### 四、聲明事項：

☐ 主張專利法第二十二條第二項 ☐ 第一款或 ☐ 第二款規定之事實，其事實發生日期為： 年 月 日。

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1. 美國；2006 年 07 月 28 日；60/820,622
- 2.

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

- 1.
- 2.

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

## 九、發明說明：

### 申請案資料

本申請案係主張2006年7月28日提出申請之美國臨時申請案序號60/820,622之權益。

### 【發明所屬之技術領域】

本發明係關於會調節CB2受體之新穎化合物，及其作為藥劑之用途。

### 【先前技術】

類大麻苳為在大麻 (*Cannabis sativa*) (亦稱為大麻葉) 中所發現之約60種不同化合物之組群，其中大麻醇、大麻二醇及 $\Delta^9$ -四氫大麻醇(THC)為最代表性分子。大麻屬之治療用途可回溯至中國古老朝代，且包括關於各種疾病之應用，範圍從缺乏食慾、嘔吐、痛性痙攣、月經疼痛、痙攣狀態至風濕病。大麻屬用途之長久歷史已導致數種醫藥之發展。例如，馬里諾(Marinol)與喜沙美(Cesamet)，其係個別以THC及其類似那比隆(nabilone)為基礎，其係作為止吐劑與食慾刺激劑使用。儘管臨床利益，大麻屬之治療用途係受限於其精神活性作用，包括幻覺、上癮及賴藥性。Mechoulam R編著之類大麻苳作為治療劑，Boca Raton, FL；CRC出版社，1986，係提供大麻屬醫藥用途之回顧。

類大麻苳之生理作用係藉由至少兩種G-蛋白質偶合受體CB1與CB2所媒介。自體射線照片研究已証實CB1受體係主要被表現於中樞神經系統中，特別是在大腦皮質、海馬、基底神經節及小腦中。其亦被發現於生殖系統及其他末梢

組織中，包括免疫系統，達較少程度。

CB1 受體會調節神經遞質自胞突接合前神經元之釋出，且咸認會媒介大麻屬之大部份欣快及其他中樞神經系統作用，譬如 THC 所引致之環強直性昏厥、低移動性及體溫過低，已發現其係完全不存在於具有 CB1 基因缺失之老鼠中 (Zimmer 等人，在類大麻苳 CB1 受體被剔除老鼠中之增加死亡率、活動性不足及痛覺遲鈍. *Proc Natl Acad Sci USA*. (1999) 96: 5780-5785)。

CB2 受體係幾乎只發現於免疫系統中，具有最大密度在脾臟中。據估計 CB2 在免疫細胞中之表現程度係高於 CB1 約 10 至 100 倍。在免疫系統內，CB2 係被發現於各種細胞類型中，包括 B 細胞、NK 細胞、單細胞、微神經膠質細胞、嗜中性白血球、T 細胞、樹突細胞及肥大細胞，這指出廣範圍之免疫功能可經過 CB2 調節劑調節 (Klein 等人，類大麻苳系統與免疫系統. *J Leukoc Biol* (2003) 74: 486-496)。此係藉由 THC 之免疫調節作用不存在於 CB2 缺乏老鼠中 (Bicklet 等人，藉由類大麻苳之免疫調節係不存在於缺乏類大麻苳 CB2 受體之老鼠中. *Eur J Pharmacol* (2000) 396: 141-149) 之發現所支持。CB2 選擇性配位體已被發展，且測試關於其在各種炎性環境中之作用。例如，在發炎之動物模式中，CB2 選擇性催動劑、逆催動劑及拮抗劑已被証實於抑制發炎上係為有效 (Hanus 等人，HU-308: 末梢類大麻苳受體 CB(2) 之專一催動劑. *Proc Natl Acad Sci USA*. (1999) 96: 14228-14233, Ueda 等人，類大麻苳 CB(2) 受體逆催動劑 JTE-907 在老鼠之皮膚發炎中

涉及類大麻苳 CB(2) 受體所媒介回應與功效. *Eur J Pharmacol.* (2005) 520: 164-171, 及 Smith 等人, 類大麻苳受體配位體在老鼠腹膜炎模式中之消炎活性, *Eur J Pharmacol.* (2001) 432: 107-119)。再者, CB2 選擇性催動劑係在多發性硬化之動物模式中抑制疾病嚴重性與痙攣狀態 (Baker 等人, 類大麻苳在多發性硬化模式中控制痙攣狀態與震顫. *Nature* (2000) 404: 84-87. Arevalo-Martin 等人, 類大麻苳在多發性硬化之老鼠模式中之治療作用, *J Neurosci.* (2003) 23: 2511-2516)。一起採用此等結果, 係支持可採用 CB2 受體調節劑以治療具有炎性成份之醫療症狀概念。

除了發炎以外, 已証實 CB2 催動劑會抑制疼痛與嘔吐。例如, CB2 選擇性催動劑係使因熱或其他刺激所引致之疼痛回應變遲鈍 (Malan 等人, CB2 類大麻苳受體所媒介之末梢抗感受傷害. *Pain.* (2001) 93: 239-45, 與 Nackley 等人, 類大麻苳 CB(2) 受體之選擇性活化作用係在發炎之大白鼠模式中壓抑脊髓 fos 蛋白質表現與疼痛行為. *Neuroscience* (2003) 119: 747-57)。亦已証實 CB2 活化作用會抑制神經病原性疼痛回應 (Ibrahim 等人, CB2 類大麻苳受體藉由 AM1241 之活化作用會抑制實驗神經病原性疼痛: 藉由未存在於 CNS 中之受體之疼痛抑制. *Proc Natl Acad Sci USA.* (2003) 100: 10529-33)。最後, 與未發現 CB2 在腦部中之較早期資料對照, 最近論文証實 CB2 在腦部中之表現, 於脾臟中含量之約 1.5% 下。CB2 活化作用藉此論文証實係負責內類大麻苳之止吐作用 (Van Sickle 等人, 腦幹類大麻苳 CB2 受體之確認與功能性特徵鑒定。

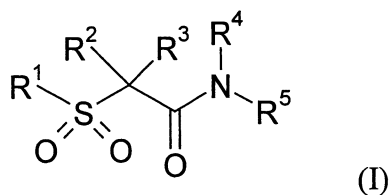
Science. 2005 310 : 329-332)。前文結果係確認CB2催動劑可用於治療炎症與神經病原性疼痛以及嘔吐。

### 【發明內容】

本發明係提供新穎化合物，其會結合且調節CB2受體。本發明亦提供一種方法與醫藥組合物，藉由投予治療量之此等化合物以治療發炎。最後，本發明係提供一種方法與醫藥組合物，藉由投予治療量之新穎CB2催動劑化合物以治療疼痛。

### 發明詳述

在本發明之最寬廣一般方面中，其係提供下式化合物



及其互變異構物、前體藥物及藥學上可接受之鹽，其中：

$R^1$  為芳基或雜芳基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自  $C_1$ - $C_6$  烷基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、 $C_1$ - $C_6$  環烷基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、 $C_1$ - $C_6$  烷硫基、 $C_1$ - $C_6$  烷基磺醯基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧羰基、 $C_1$ - $C_6$  烷胺基、 $C_3$ - $C_6$  環烷胺基、 $C_1$ - $C_6$  二烷胺基、 $C_1$ - $C_6$  烷胺基羰基、醯基胺基、 $C_1$ - $C_6$  二烷胺基羰基、羥基、鹵素、氰基、硝基、酮基、雜環基、芳基及雜芳基；

$R^2$  與  $R^3$  係獨立為氫或  $C_1$ - $C_6$  烷基；或  $R^2$  與  $R^3$  和彼等所連接之碳一起，以形成3-至6-員環烷基或雜環；

$R^4$  為氫或甲基；

$R^5$  為芳基或雜芳基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自  $C_1$ - $C_6$  烷基(其係視情況被1至3個鹵原子或被雜環基取代)、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、 $C_1$ - $C_6$  環烷基、雜環基、苯氧基、鹵素、氰基、二甲胺基烷基、苯基(其係視情況被1至2個鹵原子或視情況被鹵素取代之  $C_1$ - $C_4$  烷基取代)、噻吩基(其係視情況被1至2個鹵原子或視情況被鹵素取代之  $C_1$ - $C_4$  烷基取代)及吡啶基(其係視情況被1至2個視情況被鹵素取代之  $C_1$ - $C_4$  烷基取代)；

其中當  $R^5$  為 5-烷氧基苯并噻唑基、3-烷基 2-吡啶基、未經取代之 3-吡啶基、1-苯基 5-吡唑基、2-噻唑基、2,3-二氫-苯并[1,4]二氧陸園烯及苯并[1,3]二氧伍園烯，且  $R^1$  為苯基、4-氯苯基或 4-甲基苯基時， $R^2$  與  $R^3$ ，和彼等所連接之碳原子一起，並未形成環丙基環；

或其互變異構物或藥學上可接受之鹽。

在第一個亞屬方面，本發明係提供式 I 化合物，其中  $R^1$  為苯基、萘基、吡啶基、吡咯基、噻吩基、苯并呋唑基、苯并吡唑基、苯并異呋唑基、苯并噻唑基、苯并異噻唑基、苯并咪唑基、苯并噻二唑基、苯并呋二唑基、二氫苯并二氧陸園烯、二甲基吡嗪基、喹啉基、異喹啉基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自  $C_1$ - $C_6$  烷基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、 $C_1$ - $C_6$  環烷基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、 $C_1$ - $C_6$  烷硫基、 $C_1$ - $C_6$  烷基磺醯基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧羰基、 $C_1$ - $C_6$  烷基胺基、 $C_3$ - $C_6$  環

烷胺基、 $C_1$ - $C_6$ 二烷胺基、 $C_1$ - $C_6$ 烷胺基羰基、鹽基胺基、 $C_1$ - $C_6$ 二烷胺基羰基、羥基、鹵素、氰基、硝基、酮基、苯基、吡唑基、嗎福啉基及一氮四圓基；

$R^2$ 與 $R^3$  係獨立為氫、甲基、乙基、正-丙基、異丙基、異丁基、第三-丁基，或 $R^2$ 與 $R^3$ 和彼等所連接之碳一起，以形成環丙基、環丁基、環戊基、環己基或四氫哌喃基環；

$R^4$  為氫；

$R^5$  為苯基、萘基、吡啶基、嘧啶基、喹啉基、異喹啉基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、噁唑基、異噁唑基、噻唑基、異噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、吡啶基、苯并噁唑基、苯并吡唑基、苯并異噁唑基、苯并噻唑基、苯并異噻唑基、苯并咪唑基、四氫苯并噁唑基、四氫苯并噻唑基或四氫苯并咪唑基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自 $C_1$ - $C_6$ 烷基(其係視情況被1至3個鹵原子或六氫吡啶基取代)、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、烷氧羰基、 $C_1$ - $C_6$ 環烷基、四氫哌喃基、苯氧基、鹵素、氰基、二甲胺基烷基、苯基(其係視情況被1至2個鹵原子、視情況被鹵素取代之 $C_1$ - $C_4$ 烷基取代)、噻吩基(其係視情況被1至2個鹵原子、視情況被鹵素取代之 $C_1$ - $C_4$ 烷基取代)及吡啶基(其係視情況被1至2個視情況被鹵素取代之 $C_1$ - $C_4$ 烷基取代)。

於進一步亞屬方面，本發明係提供式I化合物，其中

$R^1$  為苯基或萘基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自 $C_1$ - $C_6$ 烷基(其係視情況被1至3個鹵原子取

代)、 $C_1-C_6$ 環烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_1-C_6$ 烷基磺醯基、 $C_1-C_6$ 烷氧羰基、 $C_1-C_6$ 烷胺基羰基、羧基胺基、 $C_1-C_6$ 二烷胺基羰基、羥基、鹵素、氰基、硝基、苯基、吡唑基、嗎福啉基及一氮四圓基；

$R^2$ 與 $R^3$ 係獨立為氫、甲基、乙基、正-丙基、異丙基、異丁基、第三-丁基，或 $R^2$ 與 $R^3$ 和彼等所連接之碳一起，以形成環丙基、環丁基、環戊基、環己基或四氫吡喃基環；

$R^4$ 為氫；

$R^5$ 為苯基、萘基、吡啶基、喹啉基、異喹啉基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、呋唑基、異呋唑基、噻唑基、異噻唑基、三唑基、呋二唑基、噻二唑基、吡啶基、苯并呋唑基、苯并吡唑基、苯并異呋唑基、苯并噻唑基、苯并異噻唑基、苯并咪唑基、四氫苯并呋唑基、四氫苯并噻唑基或四氫苯并咪唑基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自 $C_1-C_6$ 烷基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、 $C_1-C_6$ 烷氧基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、烷氧羰基、 $C_1-C_6$ 環烷基、四氫吡喃基、苯氧基、鹵素、氰基、二甲胺基烷基、苯基(其係視情況被1至2個鹵原子、視情況被鹵素取代之 $C_1-C_4$ 烷基取代)、噻吩基(其係視情況被1至2個鹵原子、視情況被鹵素取代之 $C_1-C_4$ 烷基取代)及吡啶基(其係視情況被1至2個視情況被鹵素取代之 $C_1-C_4$ 烷基取代)。

於另一亞屬方面，本發明係提供式I化合物，其中

$R^1$ 為吡啶基、吡啶基、噻吩基、苯并呋唑基、苯并吡唑

基、苯并異𪗇唑基、苯并噻唑基、苯并異噻唑基、苯并咪唑基、苯并噻二唑基、苯并𪗇二唑基、喹啉基、異喹啉基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷胺基羰基、鹽基胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>二烷胺基羰基、羥基、鹵素、氰基、硝基、嗎福啉基、一氮四圓基、苯基及吡唑基；

R<sup>2</sup>與R<sup>3</sup> 係獨立為氫、甲基、乙基、正-丙基、異丙基、異丁基、第三-丁基，或R<sup>2</sup>與R<sup>3</sup>和彼等所連接之碳一起，以形成環丙基、環丁基、環戊基、環己基或四氫哌喃基環；

R<sup>4</sup> 為氫；

R<sup>5</sup> 為苯基、萘基、吡啶基、喹啉基、異喹啉基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、𪗇唑基、異𪗇唑基、噻唑基、異噻唑基、三唑基、𪗇二唑基、噻二唑基、𪗇𪗇基、苯并𪗇唑基、苯并吡唑基、苯并異𪗇唑基、苯并噻唑基、苯并異噻唑基、苯并咪唑基、四氫苯并𪗇唑基、四氫苯并噻唑基或四氫苯并咪唑基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、烷氧羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、苯氧基、鹵素、氰基、二甲胺基烷基、苯基(其係視情況被1至2個鹵原子、視情況被鹵素取代之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基取代)、噻吩基(其係視情況被1至2個鹵原子、視情況被鹵素取代之C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基取代)及吡啶基(其係視情況被1至

2個視情況被鹵素取代之 $C_1$ - $C_4$ 烷基取代)。

於另一亞屬方面，本發明係提供式I化合物，其中

$R^1$  為苯基、萘基、3-吡啶基、噻吩基、苯并噻二唑基、喹啉基或異喹啉基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自甲基、乙基、正-丙基、異丙基、環丙基、第三-丁基、三氟甲基、三氟乙基、甲氧基、三氟甲氧基、甲磺醯基、氟基、氯基、溴基、氰基硝基、嗎福啉及一氮四環；

$R^2$ 與 $R^3$  係獨立為氫、甲基、異丙基、第三-丁基，或 $R^2$ 與 $R^3$ 和彼等所連接之碳一起，以形成環丙基或環丁基環；

$R^4$  為氫；

$R^5$  為苯基、吡啶基、喹啉基、異喹啉基、吡唑基、咪唑基、異噁唑基、噁唑基、噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、苯并噁唑基、苯并異噻唑基、苯并噻唑基或四氫苯并噻唑基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自甲基、乙基、環丙基、第三-丁基、三氟甲基、苯氧基、乙氧羰基、氯基、苯基(其係視情況被氯基取代)、噻吩基及吡啶基。

本發明亦包括上述式I化合物之互變異構物、前體藥物及藥學上可接受之鹽。此外，本發明係包括該化合物之非晶質或結晶形式，及若存在時之經單離類質同晶型體或多晶型混合物。

除非另有述及，否則在本專利說明書中使用之所有術語，應以其如同此項技藝中所已知之一般意義被明瞭。在

本申請案之所有上文所揭示化合物中，於命名法係與結構衝突之情況下，應明瞭的是，該化合物係藉由結構所定義。

"烷基"一詞，或含有烷基之任何取代基，譬如烷氧基或鹼基胺基，應明瞭係為分枝或未分枝之烷基，較佳為 $C_1-C_6$ ，且應明瞭係視情況部份或完全被鹵化。

"芳基"一詞係指苯基與萘基。

"雜芳基"一詞係指：

吡啶基、吡咯基、噻吩基、苯并呋喃基、苯并吡喃基、苯并異呋喃基、苯并噻喃基、苯并異噻喃基、苯并咪喃基、苯并噻二喃基、苯并呋二喃基、二氫苯并二氧陸園烯、二甲基吡喃基、喹啉基、異喹啉基嘧啶基、吡咯基、吡喃基、咪喃基、呋喃基、異呋喃基、噻喃基、異噻喃基、三喃基、呋二喃基、噻二喃基、苯并呋喃基、苯并吡喃基、四氫苯并呋喃基、四氫苯并噻喃基或四氫苯并咪喃基。

"雜環"一詞係指六氫吡啶基、四氫吡咯、一氫四園基、六氫吡喃基、嗎福啉基、四氫呋喃基、四氫哌喃基。

式I化合物會調節CB2受體之活性。由於此項事實，故式I化合物可用於治療發炎，以更完整地描述於下文之方式。

除非另有指明，否則各芳基或雜芳基係包括其部份或完全氫化衍生物。例如，萘基可包括其氫化衍生物，譬如四氫萘基。本文中所述芳基與雜芳基化合物之其他部份或完全氫化衍生物係為一般熟諳此藝者所明瞭。

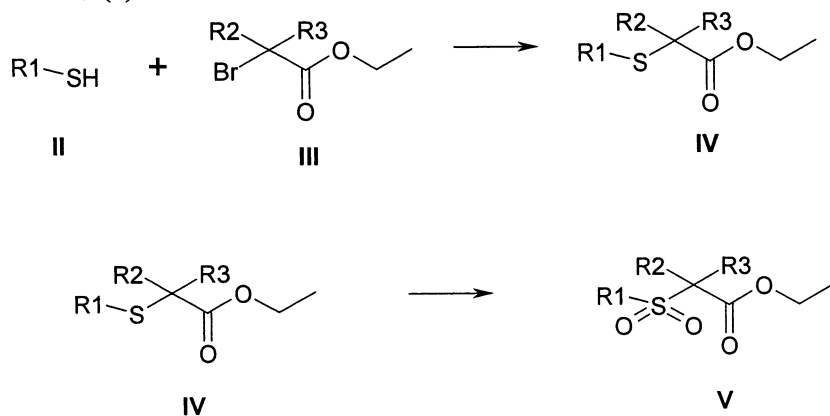
作為CB2受體催動劑之式I化合物可另外用於治療疼痛，以更完整地描述於下文之方式。

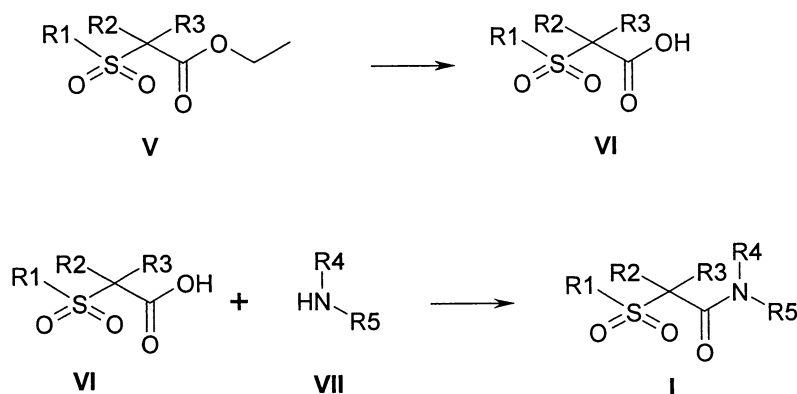
式I化合物可使用下文所述之一般合成方法製造，其亦構成本發明之一部份。

### 一般合成方法

本發明亦提供製造式(I)化合物之方法。在所有方法中，除非另有指定，否則在下文化學式中之 $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ 及 $R^5$ ，將具有上文所述本發明式(I)中之 $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ 及 $R^5$ 之意義。最適宜反應條件與反應時間可依所使用之特定反應物而改變。除非另有指明，否則溶劑、溫度、壓力及其他反應條件可容易地由一般熟諳此藝者選擇。特定程序係提供於合成實例段落中。典型上，若需要，則反應進展可藉薄層層析法(TLC)監控，而中間物與產物可於矽膠上藉層析及/或藉再結晶作用純化。下述實例係為說明性，且正如熟諳此藝者所明瞭，特定試劑或條件可按對個別化合物所需要而修正，無需過度實驗。於下文方法中所使用之起始物質與中間物，係為無論是市購可得，或容易地藉熟諳此藝者已知之方法製備。

式(I)化合物可藉由方法A中所示之方法合成

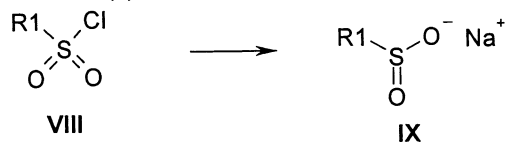


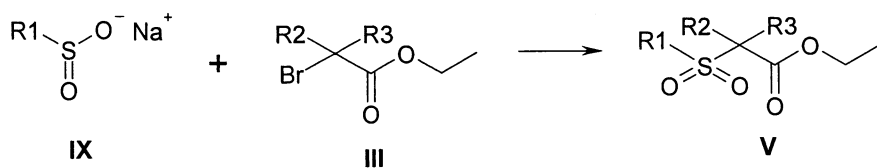


### 方法 A

如方法 A 中所示，式 II 硫醇與式 III 溴基乙酯，在適當溶劑中，於適當鹼存在下反應，係提供式 IV 硫醚。使式 IV 硫醚與適當氧化劑反應，提供其相應之式 V 磺。式 V 磺之酯基，在適當溶劑中，於適當鹼譬如氫氧化鋰存在下之水解作用，係提供其相應之式 VI 酸。使式 VI 酸與試劑譬如二氯化亞硫醯或氯化草醯反應，係提供氯化醯，其係接著與式 VII 胺，在適當溶劑中，於適當鹼存在下反應，以提供式 (I) 化合物。或者，式 VI 酸亦可與式 VII 胺，在標準偶合條件下偶合，以提供式 (I) 化合物。此項技藝中已知之標準肽偶合反應(參閱，例如 M. Bodanszky, 1984, 肽合成之實務, Springer-Verlag) 可被採用於此等合成中。適當偶合條件之實例為羧酸在適當溶劑譬如 DMF 中之溶液，以 EDC、HOBT，及鹼譬如二異丙基乙胺，接著為所要之胺處理。最初式 (I) 產物藉此項技藝中已知與示於下文實例中之方法之進一步改質，可用以製備本發明之其他化合物。

式 (I) 化合物亦可藉由方法 B 中所示之方法合成

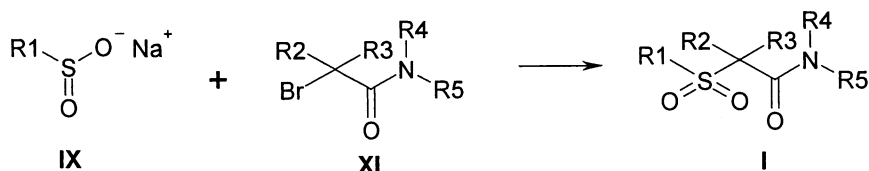
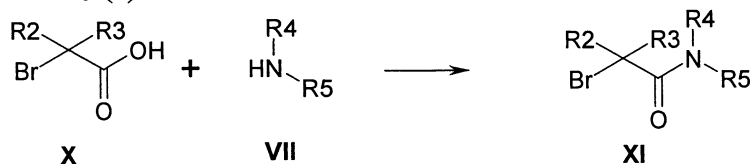




### 方法 B

如方法 B 中所示，式 VIII 氯化磺醯係使用文獻上所報告之程序，被轉化成相應之式 IX 亞磺酸鈉鹽。式 IX 磺與式 III 溴基乙酯在適當溶劑中之反應，係提供式 V 磺。使式 V 磺接受如方法 A 中所示之一系列反應，以提供式 (I) 化合物。

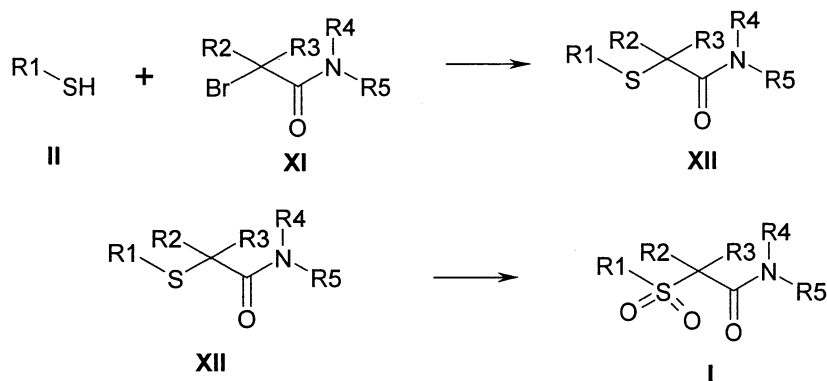
式 (I) 化合物可藉由方法 C 中所示之方法合成



### 方法 C

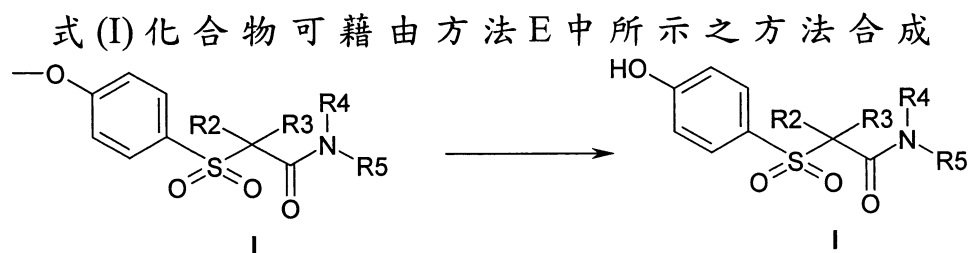
如方法 C 中所示，使式 X 酸與試劑譬如二氯化亞硫醯或氯化草醯反應，係提供氯化醯，其係接著與式 VII 胺，在適當溶劑中，於適當鹼存在下反應，以提供式 (XI) 化合物。或者，式 X 酸亦可與式 VII 胺，在標準偶合條件下偶合，以提供式 (XI) 化合物。式 XI 醯胺與式 IX 亞磺酸鈉鹽，在適當溶劑中，於適當鹼存在下反應，係提供式 (I) 化合物。

式 (I) 化合物可藉由方法 D 中所示之方法合成



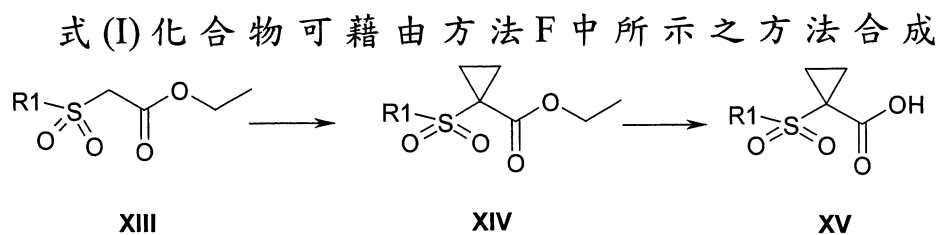
### 方法 D

如方法 A 中所示，式 II 硫醇與式 XI 溴基醯胺，在適當溶劑中，於適當鹼存在下反應，係提供式 XII 硫醚。使式 XII 硫醚與適當氧化劑，在適當溶劑中反應，係提供式 (I) 化合物。



### 方法 E

如方法 E 中所示，式 (I) 化合物，其中 R1 為對-甲氧苯基，可使用適當脫甲基化試劑，譬如三溴化硼，被轉化成另一種式 (I) 化合物。

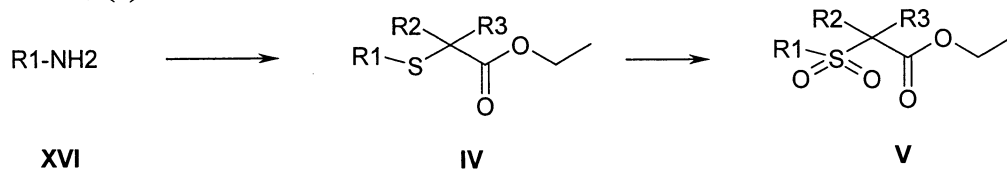


### 方法 F

如方法 F 中所示，式 XIII 磺與試劑譬如 1,2-二溴乙烷，在適當反應條件下，於適當鹼存在下反應，係提供式 XIV 環丙基化合物。式 XIV 環丙基化合物在適當條件下之水解作

用，係提供其相應之式 XV 酸，其可接著使用方法 A 中之程序，被轉化成式 (I) 化合物，其中 R<sub>2</sub> 與 R<sub>3</sub> 係形成環丙基環。

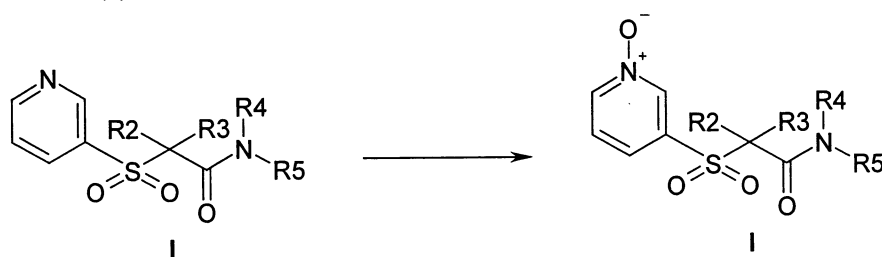
式(I)化合物可藉由方法G中所示之方法合成



## 方法 G

如方法 G 中所概述，式 XVI 胺係使用文獻上之程序被轉化成式 IV 硫醚(參考：Katz 等人, J. Org. Chem. 1954, 19, 711-715；Zhang 等人, J. Am. Chem. Soc. 1997, 119, 1676-1681)。式 IV 化合物以適當氧化劑，譬如單過硫酸鉀，在適當溶劑中之氧化作用，係提供式 V 砜，其可接著使用方法 A 中之合成順序被轉化成式 (I) 化合物。

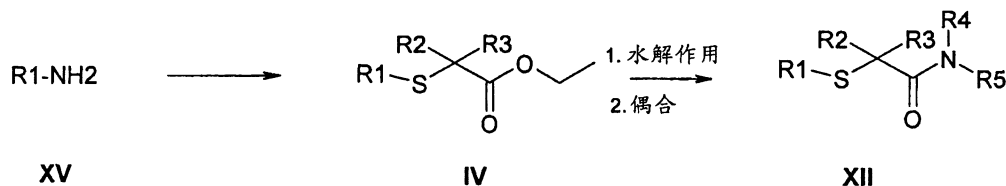
式(I)化合物可藉由方法H中所示之方法合成



## 方法 H

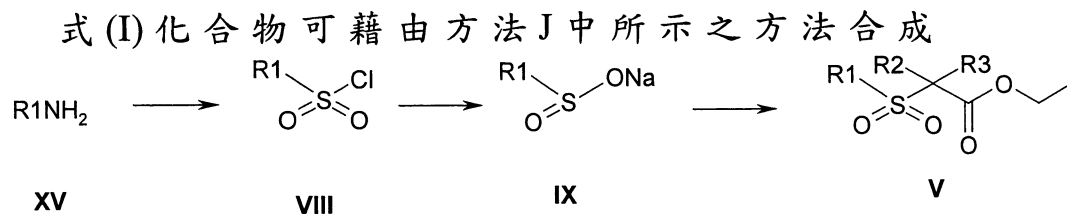
如方法H中所示，式(I)化合物，其中R1為吡啶基，可使用適當氧化劑，譬如間-氯基過氧苯甲酸，被轉化成另一種式(I)化合物。

式(I)化合物可藉由方法I中所示之方法合成



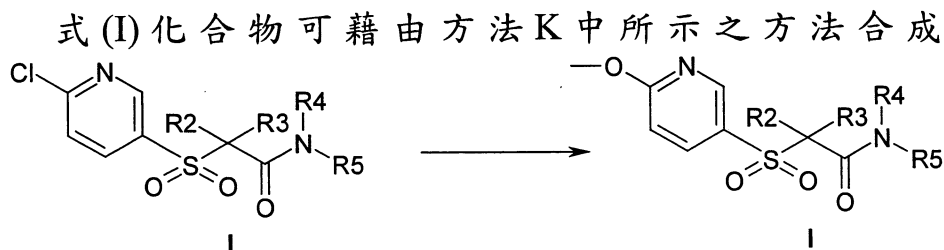
### 方法 I

如方法 I 中所概述，式 XV 胺係使用文獻上之程序被轉化成式 IV 硫醚（參考：Katz 等人, J. Org. Chem. 1954, 19, 711-715；Zhang 等人, J. Am. Chem. Soc. 1997, 119, 1676-1681）。式 IV 化合物之水解作用，接著與適當胺耦合，如方法 A，係提供式 XII 鹽胺。式 XII 鹽胺與適當氧化劑，於適當溶劑存在下之反應，係提供式 (I) 化合物，如方法 D。



### 方法 J

如方法 J 中所概述，式 XV 胺係使用標準文獻程序被轉化成其相應之氯化磺鹽 VIII（參考：Markley 等人, J. Med. Chem. 1986, 29, 427-433）。然後，使式 VIII 氯化磺鹽藉由方法 B 中所概述之合成順序，轉化成式 (I) 化合物。



### 方法 K

如方法 K 中所示，式 (I) 化合物，其中 R1 為 2-氯基吡啶基，

可被轉化成另一種式(I)化合物，其中R1為2-甲氧基吡啶基，其方式是與適當親核性試劑，譬如烷氧化物，在適當反應條件下反應。

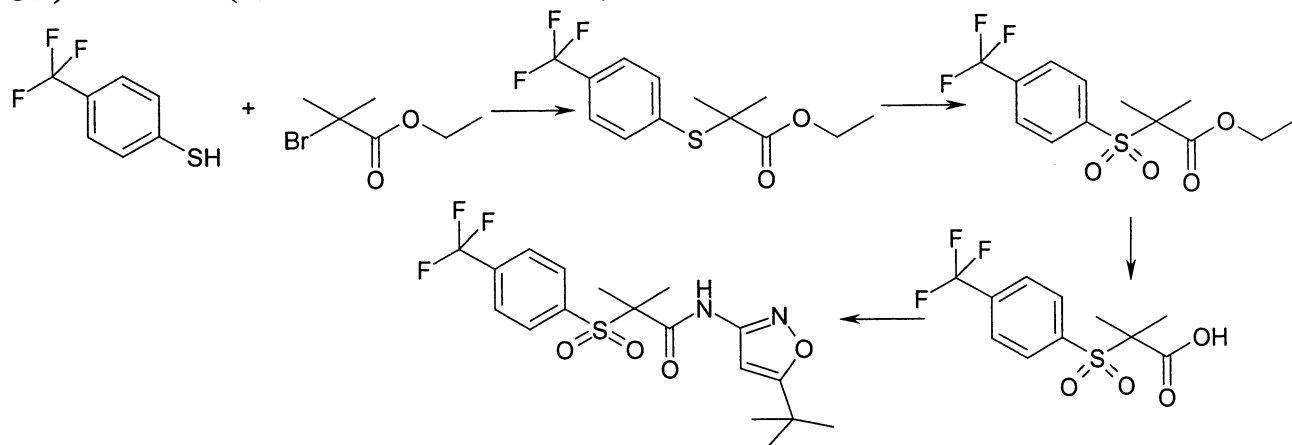
### 【實施方式】

#### 實例

其中可製造本發明化合物之方式，將藉由下述實例而進一步明瞭。

#### 方法A

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺基)-丙醯胺(在表19中之實例6)之合成



#### 步驟1：2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯基硫基)-丙酸乙酯之合成

按藉由下述參考資料之修改所述製成：

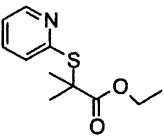
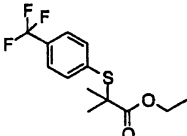
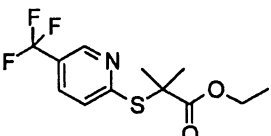
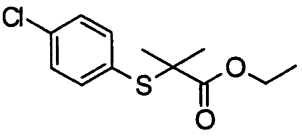
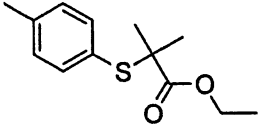
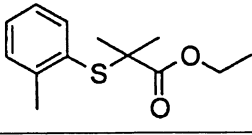
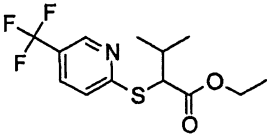
Brown 等人, *J. Med. Chem.* 1999, 42, 3785-3788

於10克(56毫莫耳)4-三氟甲基苯-1-硫醇在乙醇(100毫升)中之經攪拌溶液內，添加3.14克(56毫莫耳)KOH九粒，接著為10.95克(56毫莫耳) $\alpha$ -溴基異丁酸乙酯。將反應混合物加熱至回流，歷經18小時。使反應物冷卻至室溫。藉過濾分離

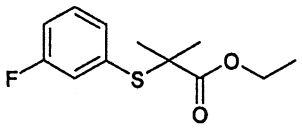
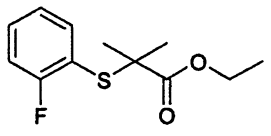
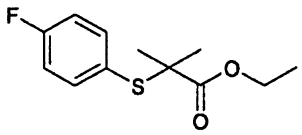
固體(KBr)，並以乙醇(20毫升)沖洗。在減壓下濃縮濾液，並使殘留物溶於DCM (60毫升)中。以水(2 x 30毫升)洗滌有機層。將含水洗液以DCM (15毫升)逆萃取。將合併之有機物質以鹽水洗滌，並以Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>脫水乾燥。過濾，及在減壓下濃縮，獲得16.3克2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯基硫基)-丙酸乙酯。

根據此程序，合成下列硫醚：

表 1

| 分子結構                                                                                | 名稱                            | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ] |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------|--------|-------------------------|
|   | 2-甲基-2-(吡啶-2-基硫基)-丙酸乙酯        | 93     | 226                     |
|  | 2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯基硫基)-丙酸乙酯     | 99     | 293                     |
|  | 2-甲基-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-基硫基)-丙酸乙酯 | 89     | 294                     |
|  | 2-(4-氯苯基硫基)-2-甲基-丙酸乙酯         | 79     | 259                     |
|  | 2-甲基-2-對-甲苯基硫基-丙酸乙酯           | 85     | 239                     |
|  | 2-甲基-2-鄰-甲苯基硫基-丙酸乙酯           | 85     | 239                     |
|  | 3-甲基-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-基硫基)-丁酸乙酯 | 81     | 308                     |

| 分子結構 | 名稱                          | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ] |
|------|-----------------------------|--------|-------------------------|
|      | 2-(4-三氟甲基-苯基硫基)-丙酸乙酯        | 86     | 279                     |
|      | (4-三氟甲基-苯基硫基)-醋酸乙酯          | 79     | 265                     |
|      | 2-甲基-2-(萘-2-基硫基)-丙酸乙酯       | 100    | 275                     |
|      | 1-(4-三氟甲基-苯基硫基)-環丁烷羧酸乙酯     | 94     | 305                     |
|      | 2-甲基-2-苯基硫基-丙酸乙酯            | 82     | 225                     |
|      | 2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯基硫基)-丙酸乙酯   | 83     | 293                     |
|      | 1-(4-氯苯基硫基)-環丁烷羧酸乙酯         | 91     | 271                     |
|      | 2-(3,4-二氯-苯基硫基)-2-甲基-丙酸乙酯   | 100    | 293                     |
|      | 2-甲基-2-(4-甲基-噻唑-2-基硫基)-丙酸乙酯 | 70     | 246                     |
|      | 2-(4-甲氧基-苯基硫基)-2-甲基-丙酸乙酯    | 92     | 255                     |
|      | 2-(2,4-二氯-苯基硫基)-2-甲基-丙酸乙酯   | 87     | 293/295/<br>297         |
|      | 3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯基硫基)-丁酸乙酯   | 90     | 307                     |

| 分子結構                                                                              | 名稱                    | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ] |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|--------|-------------------------|
|  | 2-(3-氟苯基硫基)-2-甲基-丙酸乙酯 | 97     | 243                     |
|  | 2-(2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙酸乙酯 | 94     | 243                     |
|  | 2-(4-氟苯基硫基)-2-甲基-丙酸乙酯 | 66     | 243                     |

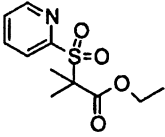
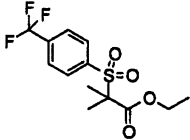
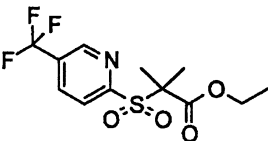
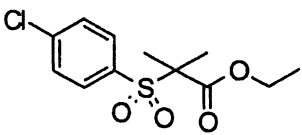
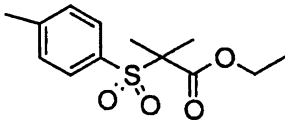
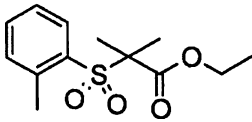
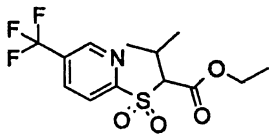
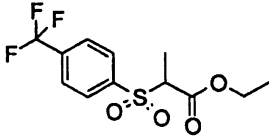
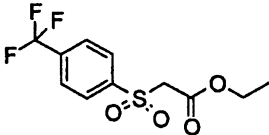
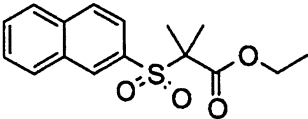
### 步驟 2：2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺基)-丙酸乙酯之合成

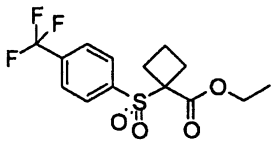
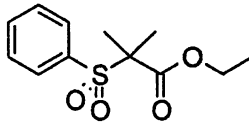
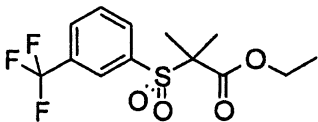
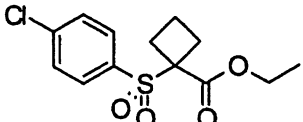
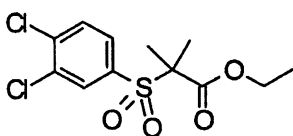
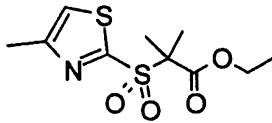
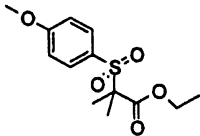
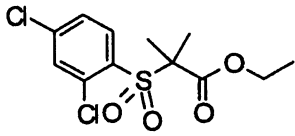
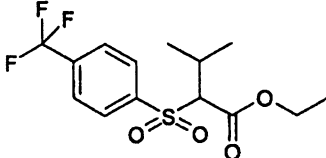
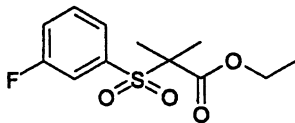
按藉由下述參考資料之修改所述製成：Aranapakam, V. 等人, *J. Med. Chem.* **2004**, 47, 6255-6269。

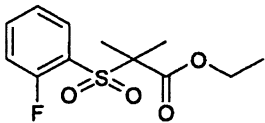
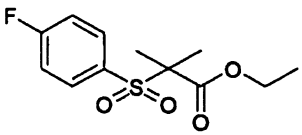
於 16.3 克 (56 毫莫耳) 2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯基硫基)-丙酸乙酯在二氧陸園/水 (5/1, 160 毫升) 中之溶液內，以一份添加 68.6 克 (112 毫莫耳) 單過硫酸鉀三倍鹽 (OXON<sup>®</sup>)。將白色懸浮液於室溫下攪拌 18 小時。藉過濾分離白色固體，並以二氧陸園 (20 毫升) 洗滌。使濾液在減壓下濃縮，以移除有機溶劑。以 DCM (3 x 80 毫升) 萃取所形成之水溶液。將合併之有機萃液以鹽水洗滌，以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 脫水乾燥，及過濾。使濾液在減壓下濃縮，而得 15.3 克所要之 2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺基)-丙酸乙酯。

根據此程序，合成下列磺類：

表 2

| 分子結構                                                                                | 名稱                            | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ] |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------|--------|-------------------------|
|    | 2-甲基-2-(吡啶-2-磺醯基)-丙酸乙酯        | 87     | 258                     |
|    | 2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙酸乙酯     | 84     | 325                     |
|    | 2-甲基-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-磺醯基)-丙酸乙酯 | 85     | 326                     |
|   | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙酸乙酯        | 86     | 291                     |
|  | 2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙酸乙酯        | 69     | 271                     |
|  | 2-甲基-2-(甲苯-2-磺醯基)-丙酸乙酯        | 78     | 271                     |
|  | 3-甲基-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-磺醯基)-丁酸乙酯 | 86     | 340                     |
|  | 2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙酸乙酯          | 73     | 311                     |
|  | (4-三氟甲基-苯磺醯基)-醋酸乙酯            | 81     | 297                     |
|  | 2-甲基-2-(萘-2-磺醯基)-丙酸乙酯         | 82     | 307                     |

| 分子結構                                                                                | 名稱                              | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ] |
|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|--------|-------------------------|
|    | 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-<br>環丁烷羧酸乙酯     | 85     | 337                     |
|    | 2-苯磺醯基-2-甲基-丙酸<br>乙酯            | 85     | 257                     |
|    | 2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯<br>磺醯基)-丙酸乙酯   | 100    | 325                     |
|    | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷<br>羧酸乙酯        | 82     | 303/305                 |
|   | 2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-<br>甲基-丙酸乙酯   | 100    | 325/327/<br>329         |
|  | 2-甲基-2-(4-甲基-噻唑-2-<br>磺醯基)-丙酸乙酯 | 100    | 278                     |
|  | 2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-<br>甲基-丙酸乙酯    | 100    | 287                     |
|  | 2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-<br>甲基-丙酸乙酯   | 30     | 325/327/<br>329         |
|  | 3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯<br>磺醯基)-丁酸乙酯   | 80     | 339                     |
|  | 2-(3-氟-苯磺醯基)-2-甲基-<br>丙酸乙酯      | 86     | 275                     |

| 分子結構                                                                              | 名稱                     | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ] |
|-----------------------------------------------------------------------------------|------------------------|--------|-------------------------|
|  | 2-(2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙酸乙酯 | 88     | 275                     |
|  | 2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙酸乙酯 | 98     | 275                     |

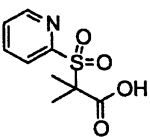
### 步驟 3：2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙酸之合成

按藉由下述參考資料之修改所述製成：Troeger；Uhde J. *Prakt. Chem.* **1899**, 59, 320-349。

於 15.3 克 (47 毫莫耳) 2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙酸乙酯在 THF/水 (4/1, 160 毫升) 中之溶液內，添加 3.95 克 (94 毫莫耳) 氫氧化鋰單水合物。將反應物在室溫下攪拌 18 小時。以水 (60 毫升) 進一步稀釋反應物，然後以 DCM (2 x 40 毫升) 洗滌。使鹼性水層於冰浴中冷卻，接著以 1N HCl 水溶液酸化至 pH 2。以 DCM (3 x 60 毫升) 萃取酸性水層。將合併之有機萃液以鹽水洗滌，以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 脫水乾燥，及過濾。在減壓下濃縮濾液，獲得 11.6 克 2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙酸。

根據此程序，合成下列酸類：

表 3

| 分子結構                                                                                | 名稱                   | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ] |
|-------------------------------------------------------------------------------------|----------------------|--------|-------------------------|
|  | 2-甲基-2-(吡啶-2-磺醯基)-丙酸 | 86     | 230                     |

| 分子結構 | 名稱                          | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ]       |
|------|-----------------------------|--------|-------------------------------|
|      | 2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙酸     | 75     | 297                           |
|      | 2-甲基-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-磺醯基)-丙酸 | 52     | 298                           |
|      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙酸        | 60     | 263/265                       |
|      | 2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙酸        | 98     | 243                           |
|      | 2-甲基-2-(甲苯-2-磺醯基)-丙酸        | 95     | 243                           |
|      | 3-甲基-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-磺醯基)-丁酸 | 54     | 312                           |
|      | 2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙酸          | 69     | 283, 300 [M+H <sub>2</sub> O] |
|      | (4-三氟甲基-苯磺醯基)-醋酸            | 70     | 286 [M+H <sub>2</sub> O]      |
|      | 2-甲基-2-(萘-2-磺醯基)-丙酸         | 35     | 279                           |
|      | 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丁烷羧酸       | 75     | 309, 326 [M+H <sub>2</sub> O] |
|      | 2-苯磺醯基-2-甲基-丙酸              | 90     | 229                           |

| 分子結構 | 名稱                        | 產率 [%] | m/z<br>[M+H <sup>+</sup> ]                          |
|------|---------------------------|--------|-----------------------------------------------------|
|      | 2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺醯基)-丙酸   | 89     | 314<br>[M+H <sub>2</sub> O]                         |
|      | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸        | 95     | 275, 292<br>[M+H <sub>2</sub> O]                    |
|      | 2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙酸   | 74     | 297/299,<br>314/316/<br>318<br>[M+H <sub>2</sub> O] |
|      | 2-甲基-2-(4-甲基-噻唑-2-磺醯基)-丙酸 | 100    | 250                                                 |
|      | 2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙酸    | 92     | 259                                                 |
|      | 2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙酸   | 90     | 314/316/<br>318<br>[M+H <sub>2</sub> O]             |
|      | 3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丁酸   | 68     | 328<br>[M+H <sub>2</sub> O]                         |
|      | 2-(3-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙酸      | 72     | 247,<br>264[M+H <sub>2</sub> O]                     |
|      | 2-(2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙酸      | 60     | 247, 264<br>[M+H <sub>2</sub> O]                    |
|      | 2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙酸      | 70     | 247, 264<br>[M+H <sub>2</sub> O]                    |

**步驟 4：N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺之合成**

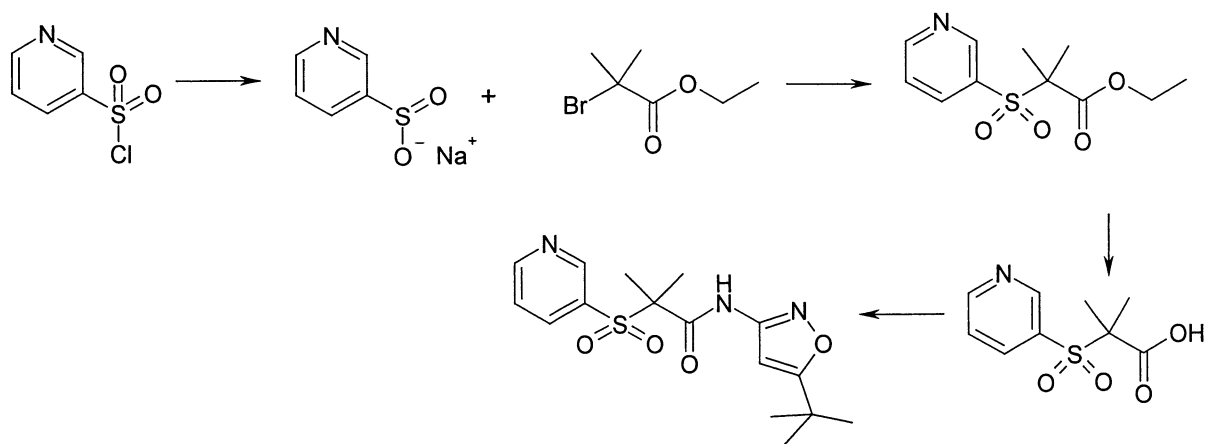
200 毫克 (0.68 毫莫耳) 2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙酸之活化成其氯化醯，係經由以二氯化亞硫醯 (2 毫升) 於 80 °C 下處理 2 小時而達成。使反應混合物冷卻至室溫，並在減壓下移除過量二氯化亞硫醯。

使粗製氯化醯溶於 DCM (3 毫升) 中，並添加至 95 毫克 (0.68 毫莫耳) 3-胺基-5-第三-丁基異噁唑與 N,N-二異丙基乙胺 (0.27 毫升) 在 DCM (2 毫升) 中之溶液內。將反應物在室溫下攪拌 18 小時。使反應物蒸發至乾涸。以 DCM (4 毫升) 稀釋反應混合物，並以飽和 NaHCO<sub>3</sub> 水溶液 (3 毫升) 洗滌。將有機層以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 脫水乾燥，過濾，及在減壓下濃縮。使粗產物藉管柱層析純化 (矽膠，溶離劑：DCM，0-5% 醋酸乙酯)，而得 125 毫克 N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺。

於表 19 方法 A 中所列示之實例係根據此程序製成。

**方法 B**

**N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺 (在表 19 中之實例 120) 之合成**



### 步驟 1：3-吡啶基亞磺酸鈉鹽之合成

按藉由下述參考資料之修改所述製成：Faucher A.-M. 等人，*J. Med. Chem.* **2004**, 47, 19-21；Binsiti, C. *Eur. J. Med. Chem. Chim. Ther.* **2001**, 36, 809-828. Field, L.；Clark, R.D. *Org. Synth.* **1958**, 38, 62-64。

#### 變異方式 A

於 1N NaOH 水溶液 (1.5 毫升) 與 5.54 克  $\text{Na}_2\text{SO}_3$  (44 毫莫耳) 在水 (12 毫升) 中之溶液內，添加 0.93 克 (4.4 毫莫耳) 氯化 3-吡啶磺鹽。將反應物在  $100^\circ\text{C}$  下加熱 10 分鐘。於減壓下移除溶劑。將粗製 3-吡啶基亞磺酸鈉鹽使用於下一步驟，無需進一步純化。

#### 變異方式 B

於 0.39 克  $\text{NaHCO}_3$  (4.6 毫莫耳) 與 0.58 克  $\text{Na}_2\text{SO}_3$  (4.6 毫莫耳) 在水 (2.5 毫升) 中之溶液內，添加 0.5 克 (2.3 毫莫耳) 氯化 3-吡啶磺鹽。將反應物在  $80^\circ\text{C}$  下加熱 3 小時。於減壓下移除溶劑。使濾液在減壓下濃縮，而得 3-吡啶基亞磺酸鈉鹽。

### 步驟 2：2-甲基-2-(吡啶-3-磺基)-丙酸乙酯之合成

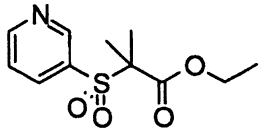
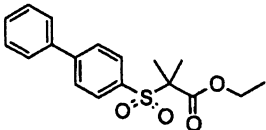
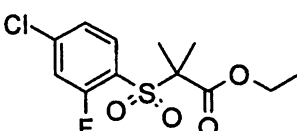
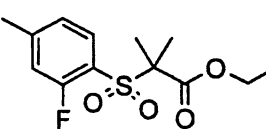
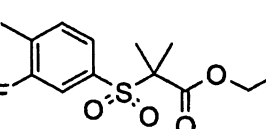
按藉由下述參考資料之修改所述製成：Faucher, A.-M. 等人，

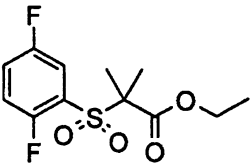
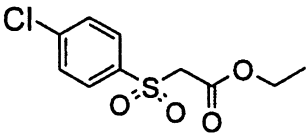
*J. Med. Chem.* **2004**, 47, 19-21 ; Binsiti, C. *Eur. J. Med. Chem. Chim. Ther.* **2001**, 36, 809-828 ; Field, L. ; Clark, R.D. *Org. Synth.* **1958**, 38, 62-64 ; Troeger ; Uhde ; *J. Prakt. Chem.* **1899**, 59, 320-349 。

使粗製 3-吡啶基亞磺酸鈉鹽(4.4 毫莫耳，藉由變異方式 A 合成)懸浮於 DMF (20 毫升)中。添加吡啶(0.8 毫升)與  $\alpha$ -溴基異丁酸乙酯(1 毫升)。將反應物在室溫及氮氣下攪拌 18 小時。將反應混合物以 DCM (200 毫升)稀釋，以水(2 x 100 毫升)、鹽水(1 x 50 毫升)洗滌，並以  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  脫水乾燥。過濾，在減壓下濃縮，接著管柱層析(矽膠，溶離劑 DCM，0-10% 醋酸乙酯)，獲得 0.24 克 2-甲基-2-(吡啶-3-磺基)-丙酸乙酯。

根據此程序，合成下列磺類：

表 4

| 分子結構                                                                                | 名稱                          | 產率 [%] | m/z [ $\text{M}+\text{H}^+$ ]                 |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------|--------|-----------------------------------------------|
|  | 2-甲基-2-(吡啶-3-磺基)-丙酸乙酯       | 23     | 258                                           |
|  | 2-(聯苯基-4-磺基)-2-甲基-丙酸乙酯      | 14     | 333                                           |
|  | 2-(4-氯基-2-氟-苯磺基)-2-甲基-丙酸乙酯  | 50     | 309, 326<br>[ $\text{M}+\text{H}_2\text{O}$ ] |
|  | 2-(2-氟基-4-甲基-苯磺基)-2-甲基-丙酸乙酯 | 60     | 289, 306<br>[ $\text{M}+\text{H}_2\text{O}$ ] |
|  | 2-(3-氟基-4-甲基-苯磺基)-2-甲基-丙酸乙酯 | 67     | 289, 306<br>[ $\text{M}+\text{H}_2\text{O}$ ] |

| 分子結構                                                                              | 名稱                        | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ] |
|-----------------------------------------------------------------------------------|---------------------------|--------|-------------------------|
|  | 2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙酸乙酯 | 36     | 293                     |
|  | (4-氯-苯磺醯基)-醋酸乙酯           | 71     | 293                     |

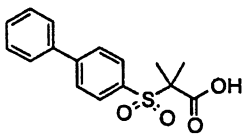
### 步驟3：2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙酸之合成

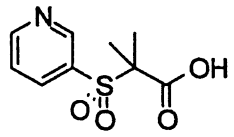
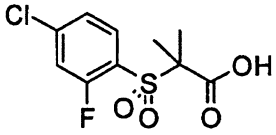
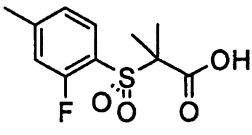
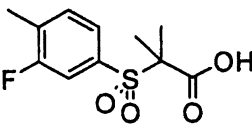
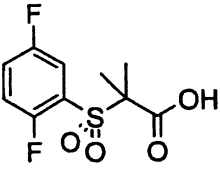
2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙酸係一般性地按方法A步驟3中所述製成：

於240毫克(0.93毫莫耳) 2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙酸乙酯在THF/水(4/1, 10毫升)中之溶液內，添加76毫克(1.8毫莫耳)氫氧化鋰單水合物。將反應物在室溫下攪拌18小時。以水(20毫升)進一步稀釋反應物，然後以DCM(2 x 15毫升)洗滌。使鹼性水層在冰浴中冷卻，並以1M HCl水溶液酸化至pH 2。以異丙醇/氯仿(1/1, 3 x 20毫升)萃取酸性水層。將合併之有機萃液以鹽水洗滌，以Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>脫水乾燥，及過濾。於減壓下濃縮濾液，獲得213毫克2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙酸。

根據此程序，合成下列酸類：

表5

| 分子結構                                                                                | 名稱                    | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ] |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|--------|-------------------------|
|  | 2-(聯苯基-4-磺醯基)-2-甲基-丙酸 | 83     | 305                     |

| 分子結構                                                                               | 名稱                        | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ]       |
|------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------|--------|-------------------------------|
|   | 2-甲基-2-(吡啶-3-磺基)-丙酸       | 100    | 230                           |
|   | 2-(4-氯基-2-氟-苯磺基)-2-甲基-丙酸  | 87     | 298[M+H <sub>2</sub> O]       |
|   | 2-(2-氟基-4-甲基-苯磺基)-2-甲基-丙酸 | 75     | 261, 278 [M+H <sub>2</sub> O] |
|   | 2-(3-氟基-4-甲基-苯磺基)-2-甲基-丙酸 | 95     | 261, 278 [M+H <sub>2</sub> O] |
|  | 2-(2,5-二氟-苯磺基)-2-甲基-丙酸    | 68     | 265, 282 [M+H <sub>2</sub> O] |

#### 步驟 4: N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(吡啶-3-磺基)-丙酸之合成

110 毫克 (0.48 毫莫耳) 2-甲基-2-(吡啶-3-磺基)-丙酸之活化其氯化鹽，係經由以二氯化亞硫鹽 (1 毫升) 於 80°C 下處理 2 小時而達成。使反應物冷卻至室溫，並在減壓下移除過量二氯化亞硫鹽。

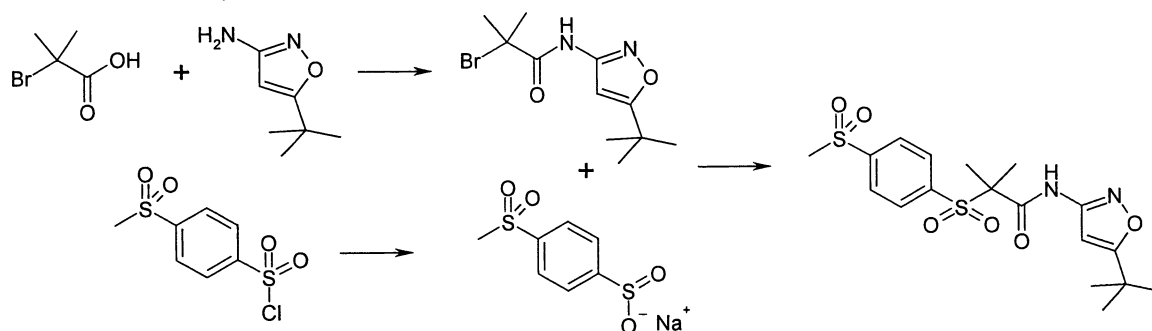
使粗製氯化鹽溶於 DCM (2 毫升) 中，並添加至 78 毫克 (0.55 毫莫耳) 2-胺基-5-第三-丁基異噁唑與 N,N-二異丙基乙胺 (0.24 毫升) 在 DCM (1 毫升) 中之溶液內。將反應物在室溫下攪拌 18 小時。將反應混合物以 DCM 稀釋，以飽和 NaHCO<sub>3</sub> 水溶液 (2 毫升)、鹽水 (2 毫升) 洗滌，及以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 脫水乾燥。過濾，及濃縮濾液，獲得粗產物。藉管柱層析進一步純化 (矽膠，

溶離劑：DCM，0-10% 醋酸乙酯)，並藉由質量觸發預備之 LC/MS，產生 39 毫克 N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺。

於表 18 方法 B 中所列示之實例係根據此程序製成。

### 方法 C

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-甲磺醯基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 (在表 19 中之實例 131) 之合成



### 步驟 1: 2-溴-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺之合成

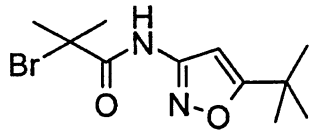
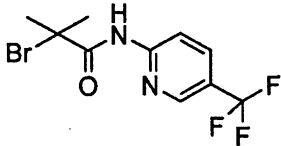
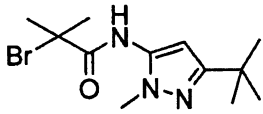
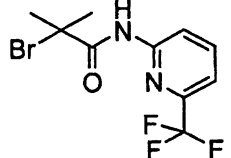
按藉由下述參考資料之修改所述製成：Kato A. 等人, *Heterocycles* **1999**, 50, 299-308。

5 克 (30 毫莫耳) 2-溴基-2-甲基丙酸之活化成其氯化醯，係經由以二氯化亞硫醯 (10 毫升) 於 60°C 下處理 2 小時而達成。使反應物冷卻，並在減壓下移除過量二氯化亞硫醯，而得所要之氯化醯。於 4.2 克 (30 毫莫耳) 3-胺基-5-第三-丁基異噁唑與 5.2 毫升 (30 毫莫耳) N,N-二異丙基乙胺在 DCM (20 毫升) 中之溶液內，逐滴添加在 DCM (15 毫升) 中作成溶液之氯化醯。將反應物於室溫下攪拌 18 小時。以飽和 NaHCO<sub>3</sub> 水溶液 (2 x 15 毫升) 洗滌反應混合物，並分離液層。將有機層以鹽水再洗滌，以 MgSO<sub>4</sub> 脫水乾燥，過濾，及在減壓下濃縮。使

粗製物藉乾燥急驟式管柱層析純化(矽膠，溶離劑DCM，0-20%醋酸乙酯)，而產生8.5克2-溴-N-(5-第三-丁基-異呋唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺。

根據此程序，合成下列醯胺類：

表 6

| 分子結構                                                                                | 名稱                                      | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ] |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------|--------|-------------------------|
|    | 2-溴-N-(5-第三-丁基-異呋唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺        | 97     | 289/291                 |
|    | 2-溴基-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺         | 55     | 311/313                 |
|  | 2-溴-N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺 | 51     | 302/304                 |
|  | 2-溴基-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺         | 72     | 311/313                 |

#### 步驟 2：4-甲烷磺醯基-苯亞磺酸鈉鹽之合成：

於0.26克(3.2毫莫耳) NaHCO<sub>3</sub>與0.4克(3.2毫莫耳) Na<sub>2</sub>SO<sub>3</sub>在水(1.5毫升)中之溶液內，添加0.4克(1.6毫莫耳)氯化4-(甲磺醯基)-苯磺醯。將反應物在80°C下加熱3小時。於減壓下移除溶劑。使粗製物質懸浮於沸騰之乙醇(20毫升)中，並藉過濾移除無機固體。在減壓下濃縮濾液，而得0.14克4-甲烷磺醯基-苯亞磺酸鈉鹽。

**步驟3：N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-甲磺醯基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺之合成**

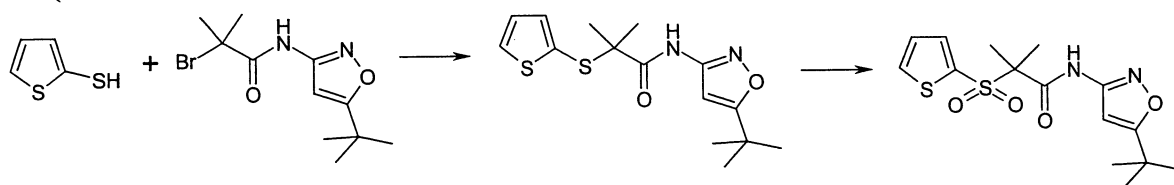
按藉由下述參考資料之修改所述製成：Faucher, A.-M. 等人, *J. Med. Chem.* **2004**, 47, 19-21；Troeger；Uhde；*J. Prakt. Chem.* **1899**, 59, 320-349, Binsiti, C. *Eur. J. Med. Chem. Chim. Ther.* **2001**, 36, 809-828；Field, L.；Clark, R.D. *Org. Synth.* **1958**, 38, 62-64。

於 160 毫克 (0.55 毫莫耳) 2-溴-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺在 DMF (3 毫升) 中之溶液內，以一份添加 181 毫克 (0.71 毫莫耳) 4-甲磺醯基-苯亞磺酸鈉鹽。添加吡啶 (48 微升)，並將反應物於 50°C 下攪拌 18 小時。以 1M HCl 水溶液 (1 毫升) 使混合物酸化，並以乙醚 (3 x 3 毫升) 萃取。使合併之有機層以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 脫水乾燥，及在減壓下移除溶劑。使粗製物質藉管柱層析純化 (矽膠，溶離劑庚烷，0-20% 醋酸乙酯)，而得 47 毫克 N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-甲磺醯基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺。

於表 19 方法 C 中所列示之實例係根據此程序製成。

**方法 D**

**N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-2-磺醯基)-丙醯胺 (在表 19 中之實例 124) 之合成**

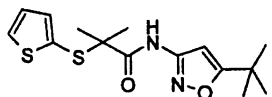


**步驟 1: N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-2-基硫基)-丙醯胺之合成**

於 0.16 毫升 (1.7 毫莫耳) 噻吩-2-硫醇在乙醇 (5 毫升) 中之經攪拌溶液內，添加 102 毫克 (1.8 毫莫耳) KOH 丸粒，接著為 460 毫克 (1.6 毫莫耳) 2-溴-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺 (按方法 C 步驟 1 中所述製成)。將反應混合物加熱至回流，歷經 18 小時。使反應物冷卻至室溫。藉過濾分離固體 (KBr)，並以乙醇 (15 毫升) 沖洗。在減壓下濃縮濾液，並使殘留物藉管柱層析純化 (矽膠，溶離劑：庚烷，0-10% 醋酸乙酯)，而產生 504 毫克 N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-2-基硫基)-丙醯胺。

根據此程序，合成下列醯胺類：

表 7

| 分子結構                                                                                | 名稱                                        | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ] |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------|--------|-------------------------|
|  | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-2-基硫基)-丙醯胺 | 97     | 325                     |

**步驟 2: N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-2-磺基)-丙醯胺之合成**

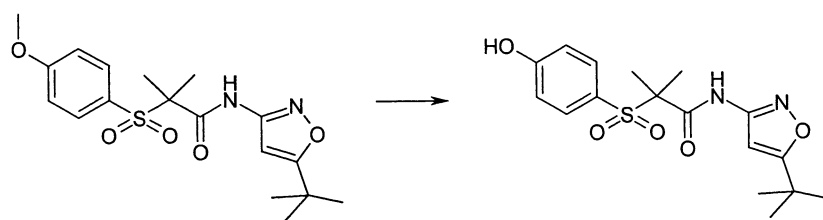
於 106 毫克 (0.3 毫莫耳) N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-2-基硫基)-丙醯胺之硫醚在二氧陸圓/水 (5/1, 6 毫升) 中之溶液內，以一份添加 635 毫克 (1 毫莫耳) 單過硫酸鉀三倍鹽 (OXON<sup>®</sup>, 54 毫莫耳)。將白色懸浮液於室溫下攪拌 18 小時。藉過濾分離白色固體，並以二氧陸圓 (10 毫升) 洗滌。

使濾液在減壓下濃縮，以移除有機溶劑。以 DCM (2 x 5 毫升) 萃取所形成之水溶液。將合併之有機萃液以飽和  $\text{NaHCO}_3$  水溶液 (5 毫升)、鹽水洗滌，以  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  脫水乾燥，及過濾。使濾液在減壓下濃縮。使粗製殘留物藉管柱層析純化 (矽膠，溶離劑 DCM，0-10% 醋酸乙酯)，而得 53 毫克 N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-2-磺基)-丙醯胺。

於表 19 方法 D 中所列示之實例係根據此程序製成。

#### 方法 E

N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-(4-羥基-苯磺基)-2-甲基-丙醯胺 (在表 19 中之實例 137) 之合成

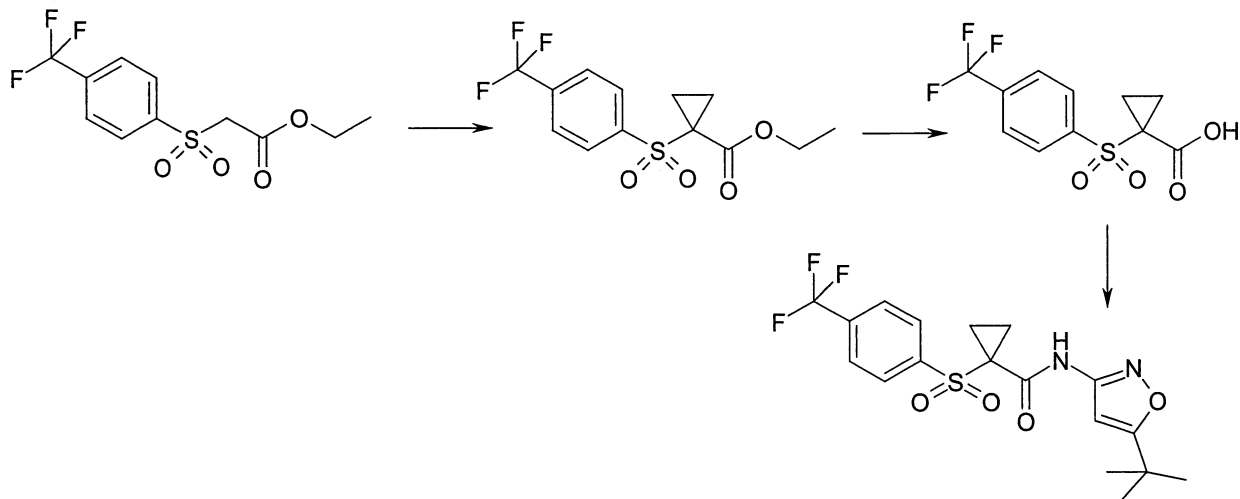


於 203 毫克 (0.53 毫莫耳) N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-(4-甲氧基-苯磺基)-2-甲基-丙醯胺 (實例 43，表 19，根據方法 A 製成) 在 DCM (5 毫升) 中之溶液內，在  $0^\circ\text{C}$  及氮大氣下，添加 0.3 毫升 (3.18 毫莫耳)  $\text{BBR}_3$ 。使反應物溫熱至室溫，並攪拌 18 小時。將反應物傾倒在飽和  $\text{NaHCO}_3$  水溶液-冰混合物 (20 毫升) 上。使含水混合物酸化至 pH 5，並以 DCM (3 x 15 毫升) 萃取。將合併之有機萃液以  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  脫水乾燥，過濾，及在減壓下濃縮。使粗產物藉管柱層析進一步純化 (矽膠，溶離劑 DCM，0-20% 醋酸乙酯)，而得 64 毫克 N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-(4-羥基-苯磺基)-2-甲基-丙醯胺。

於表 19 方法 E 中所列示之實例 137 係根據此程序製成。

## 方法 F

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺(在表 19 中之實例 166)之合成



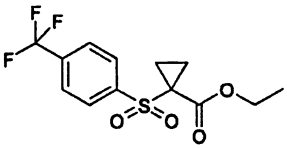
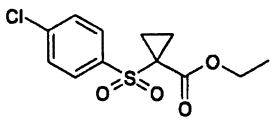
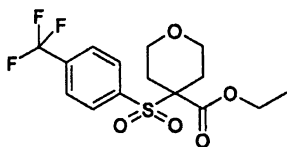
## 步驟 1：1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸乙酯之合成

按藉由下述參考資料之修改所述製成：Aranapakam V. 等人，*J. Med. Chem.* **2003**, 46, 2361-2375；Aranapakam V. 等人，*J. Med. Chem.* **2003**, 46, 2376-2396；

於 1.69 克 (5.69 毫莫耳) (4-三氟甲基-苯磺醯基)-醋酸乙酯 (根據方法 A 步驟 1 與 2 製成)、1.59 克 (11.5 毫莫耳) 碳酸鉀、100 毫克 18-冠-6 醚及 100 毫克溴化四丁基銨在丙酮 (40 毫升) 中之混合物內，添加 0.49 毫升 (5.69 毫莫耳) 1,2-二溴乙烷。將反應物在密封管中加熱至 65°C，歷經 18 小時。過濾混合物，並使濾液在減壓下濃縮。使殘留物藉管柱層析純化 (矽膠，溶離劑庚烷，0-20% 醋酸乙酯)，而得 2.99 克 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸乙酯。

根據此程序，合成下列礬類：

表 8

| 分子結構                                                                              | 名稱                           | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ]       |
|-----------------------------------------------------------------------------------|------------------------------|--------|-------------------------------|
|  | 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸乙酯      | 82     | 323, 340 [M+H <sub>2</sub> O] |
|  | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸乙酯         | 100    | 289, 306 [M+H <sub>2</sub> O] |
|  | 4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-吡喃-4-羧酸乙酯 | 77     | 367, 384 [M+H <sub>2</sub> O] |

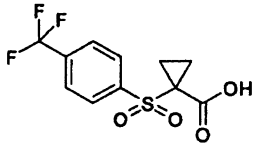
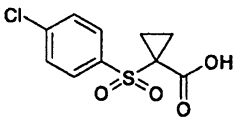
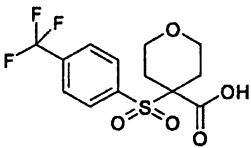
### 步驟 2：1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸之合成

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸係一般性地按方法 A 步驟 3 中所述製成：

於 2.99 克 (9.29 毫莫耳) 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸乙酯在 THF/ 水 (1/1, 50 毫升) 中之溶液內，添加 0.82 克 (19.5 毫莫耳) 氫氧化鋰單水合物。將反應物在室溫下攪拌 18 小時。在減壓下移除有機溶劑，並以乙醚 (2 x 50 毫升) 洗滌水層。使鹼性水層在冰浴中冷卻，並以 1M HCl 水溶液酸化至 pH 2。以醋酸乙酯 (3 x 50 毫升) 萃取酸性水層。將合併之有機萃液以鹽水洗滌，以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 脫水乾燥，及過濾。於減壓下濃縮濾液，獲得 2.19 克 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸。

根據此程序，合成下列酸類。

表 9

| 分子結構                                                                              | 名稱                         | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ]       |
|-----------------------------------------------------------------------------------|----------------------------|--------|-------------------------------|
|  | 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸      | 80     | 295, 312 [M+H <sub>2</sub> O] |
|  | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸         | 99     | 278 [M+H <sub>2</sub> O]      |
|  | 4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-吡喃-4-羧酸 | 77     | 339, 356 [M+H <sub>2</sub> O] |

步驟 3：1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺之合成

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺係一般性地按方法 A 步驟 4 中所述製成。

170 毫克(0.58 毫莫耳) 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸之活化成其氯化醯，係經由以二氯化亞硫醯(1 毫升)於 80 °C 下處理 2 小時而達成。使反應物冷卻至室溫，並在減壓下移除過量二氯化亞硫醯。

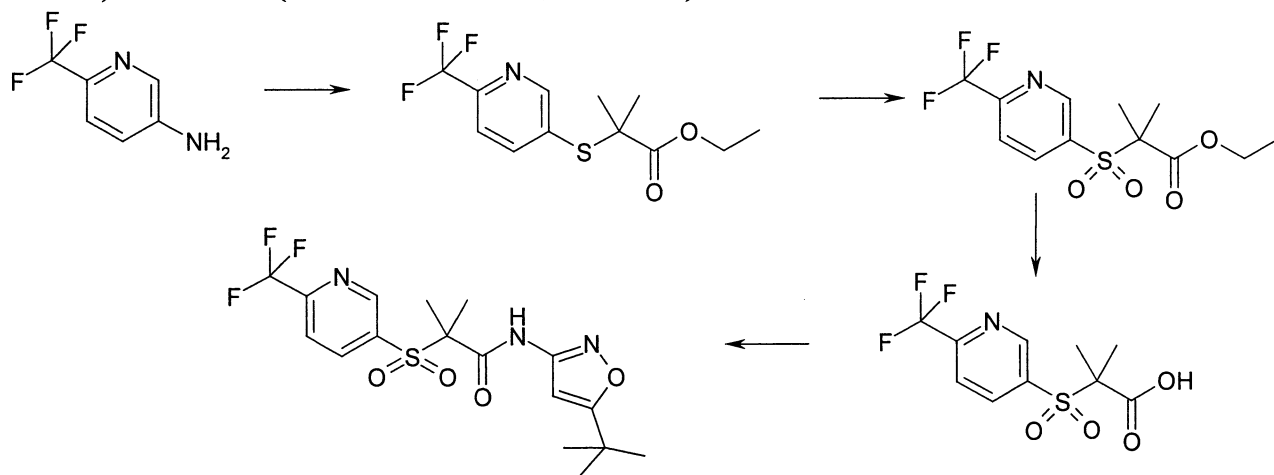
使粗製氯化醯溶於 DCM (2 毫升) 中，並添加至 75 毫克(0.54 毫莫耳) 2-胺基-5-第三-丁基異噁唑與 N,N-二異丙基乙胺(0.19 毫升)在 DCM (1 毫升) 中之溶液內。將反應物在室溫下攪拌過夜。將反應混合物以 DCM 稀釋，以飽和 NaHCO<sub>3</sub> 水溶液(2 毫升)、鹽水(2 毫升)洗滌，及以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 脫水乾燥。過濾，及濃縮濾液，獲得粗產物。藉管柱層析進一步純化(矽膠，溶離劑：庚烷，0-40% 醋酸乙酯)，產生 63 毫克 1-(4-三氟甲基

-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺。

於表 19 方法 F 中之所列示之實例係根據此程序製成。

#### 方法 G

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺(在表 19 中之實例 211)之合成



#### 步驟 1：2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-基硫基)-丙酸乙酯之合成

按藉由下述參考資料之修改所述製成：Katz 等人, *J. Org. Chem.* **1954**, *19*, 711-715；Zhang 等人, *J. Am. Chem. Soc.* **1997**, *119*, 1676-1681。

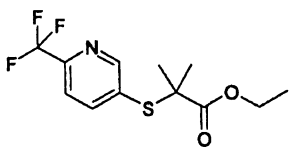
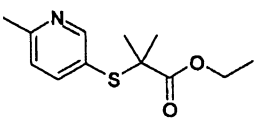
於 9.67 克 (59.7 毫莫耳) 3-胺基-6-三氟甲基吡啶在醋酸 (190 毫升) 中之溶液內，在 0°C 下，添加 62 毫升硫酸，並使混合物冷卻至 0°C。逐滴添加 5.92 克亞硝酸鈉在水中之溶液 (35 毫升)，歷經 15 分鐘，同時保持溫度低於 10°C。將所形成之溶液在 0°C 下攪拌 20 分鐘，然後添加 1.54 克 (25.6 毫莫耳) 尿素，並將混合物於 0°C 下攪拌 5 分鐘。在 0°C 下，將此溶液添加至 39.1 克 (244 毫莫耳) 乙基磺原酸鉀在水中之溶液 (90 毫升)

內，並將所形成之混合物加熱至 80°C，歷經 1 小時。於冷卻至 0°C 後，使溶液藉由添加 5N NaOH 水溶液而被中和。以 DCM (3 x 250 毫升) 萃取水溶液，且將合併之有機萃液以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 脫水乾燥，過濾，及在減壓下濃縮。

使所形成之油溶於 350 毫升乙醇中，在氮大氣下脫氣 20 分鐘，且添加 11.2 克氫氧化鉀。將反應物加熱至 80°C，歷經 1 小時，然後添加 26.5 毫升 (178 毫莫耳)  $\alpha$ -溴基異丁酸乙酯。將混合物於室溫下攪拌 18 小時，然後在減壓下濃縮。藉管柱層析純化 (矽膠，溶離劑庚烷，0-20% 醋酸乙酯)，獲得 2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-基硫基)-丙酸乙酯。

根據此程序，合成下列硫醚。

表 10

| 分子結構                                                                                | 名稱                            | 產率 [%]         | m/z [M+H <sup>+</sup> ] |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------|----------------|-------------------------|
|  | 2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-基硫基)-丙酸乙酯 | 92<br>(50% 純度) | 294                     |
|  | 2-甲基-2-(6-甲基-吡啶-3-基硫基)-丙酸乙酯   | 43             | 240                     |

#### 步驟 2: 2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-基硫基)-丙酸乙酯之合成

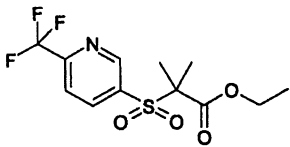
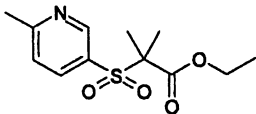
2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-基硫基)-丙酸乙酯係一般性地按方法 A 步驟 2 中所述製成。

於 2.81 克 (50 毫莫耳%，5.2 毫莫耳) 2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-基硫基)-丙酸乙酯在二氧陸圓/水混合物 (1:1, 100 毫升) 中之溶液內，添加 18.8 克 (30.7 毫莫耳) 單過硫酸鉀三倍鹽 (OXON®)。將白色懸浮液於室溫下攪拌 18 小時。藉過濾分

離白色固體，並以二氧陸圀(100 毫升)洗滌。使濾液在減壓下濃縮，以移除有機溶劑。以 DCM (3 x 100 毫升)萃取所形成之水溶液。將合併之有機萃液以鹽水洗滌，以  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  脫水乾燥，及過濾。在減壓下濃縮濾液，並使所形成之殘留物藉管柱層析純化(矽膠，溶離劑庚烷，0-20% 醋酸乙酯)，而得 2.12 克 2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酸乙酯。

根據此程序，合成下列磺酯類。

表 11

| 分子結構                                                                                | 名稱                           | 產率 [%]           | m/z<br>[M+H <sup>+</sup> ] |
|-------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------|------------------|----------------------------|
|   | 2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酸乙酯 | 63<br>(歷經 2 個步驟) | 326                        |
|  | 2-甲基-2-(6-甲基-吡啶-3-磺基)-丙酸乙酯   | 63               | 272                        |

### 步驟 3：2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酸之合成

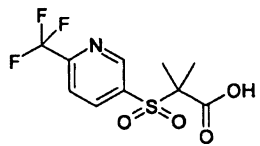
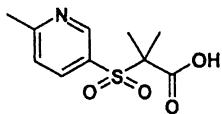
2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酸係一般性地按方法 A 步驟 3 中所述製成：

於 7.67 克 (23.6 毫莫耳) 2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酸乙酯在 THF/水 (1/1, 200 毫升) 中之溶液內，添加 1.97 克 (46.9 毫莫耳) 氫氧化鋰單水合物。將反應物在室溫下攪拌 18 小時。在減壓下移除有機溶劑，並以乙醚 (200 毫升) 洗滌水層。使鹼性水層在冰浴中冷卻，並以 2M HCl 水溶液酸化至 pH 2。以醋酸乙酯 (4 x 200 毫升) 萃取酸性水層。將合併之有機萃液以鹽水洗滌，以  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  脫水乾燥，及過濾。於減

壓下濃縮濾液，獲得 6.34 克 2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酸。

根據此程序，合成下列酸類。

表 12

| 分子結構                                                                              | 名稱                         | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ] |
|-----------------------------------------------------------------------------------|----------------------------|--------|-------------------------|
|  | 2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酸 | 90     | 298                     |
|  | 2-甲基-2-(6-甲基-吡啶-3-磺基)-丙酸   | 82     | 244                     |

步驟 3：N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酰胺之合成

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酰胺係一般性地按方法 A 步驟 4 中所述製成。

104 毫克 (0.35 毫莫耳) 2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酸之活化成其氯化鹽，係經由以二氯化亞硫鹽 (1 毫升) 於 70°C 下處理 3 小時而達成。使反應物冷卻至室溫，並在減壓下移除過量二氯化亞硫鹽。

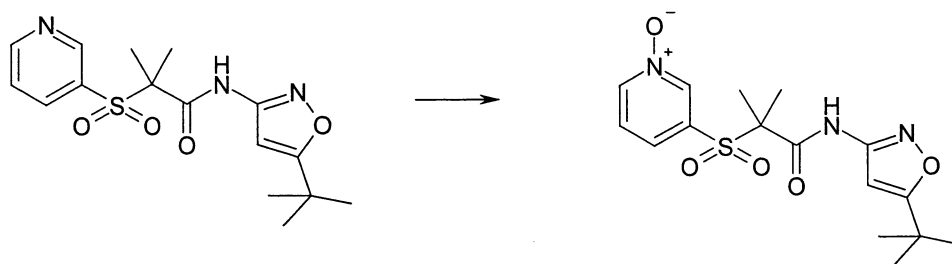
使粗製氯化鹽溶於 DCM (2 毫升) 中，並添加至 51.3 毫克 (0.36 毫莫耳) 2-胺基-5-第三-丁基異噁唑與 N,N-二異丙基乙胺 (0.17 毫升) 在 DCM (1 毫升) 中之溶液內。將反應物在室溫下攪拌 18 小時。將反應混合物以 DCM 稀釋，以飽和 NaHCO<sub>3</sub> 水溶液 (2 毫升)、鹽水 (2 毫升) 洗滌，及以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 脫水乾燥。過濾，並濃縮濾液，獲得粗產物。藉管柱層析進一步純化 (矽膠，溶離劑：DCM，0-10% 醋酸乙酯)，產生 78 毫克 N-(5-第三

-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺。

於表 19 方法 G 中所列示之實例係根據此程序製成。

#### 方法 H

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(1-氧基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺 (在表 19 中之實例 198) 之合成

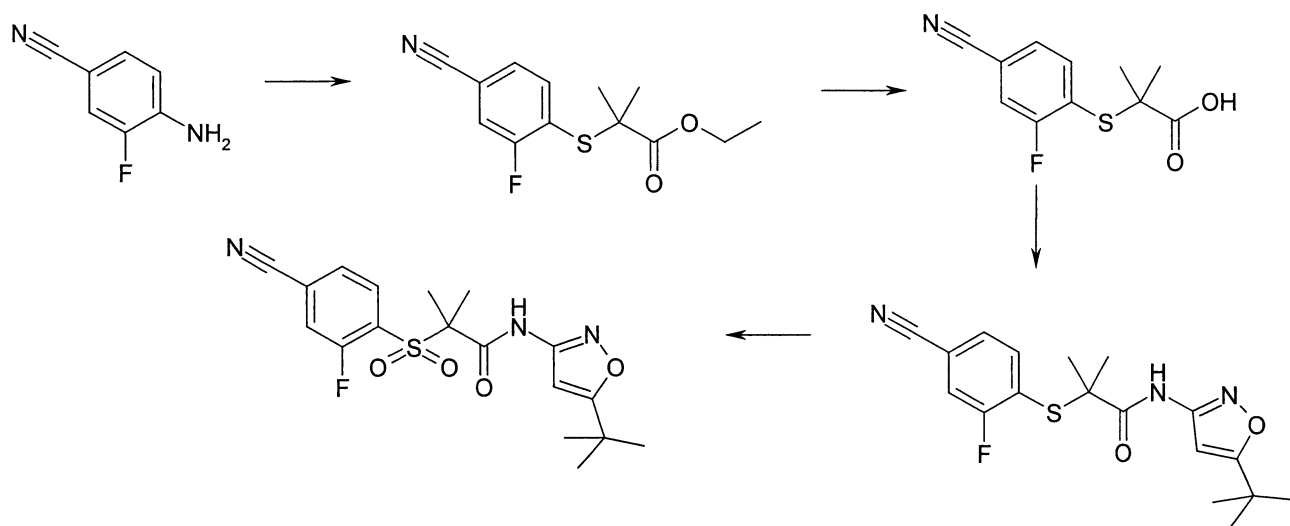


於 50 毫克 (0.14 毫莫耳) N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺 (在表 19 中之實例 120) 在 DCM (2 毫升) 中之溶液內，添加 77 毫克 (0.28 毫莫耳) 間-氯基過氧苯甲酸。將反應物在室溫下攪拌 2 小時。以 DCM (5 毫升) 稀釋反應物，並以 1N NaOH 水溶液洗滌。將有機層以鹽水洗滌，以  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  脫水乾燥，過濾，及在減壓下濃縮。使殘留物藉管柱層析純化 (矽膠，溶離劑 DCM)，而得 25 毫克 N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(1-氧基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺。

於表 19 方法 H 中所列示之實例係根據此程序製成。

#### 方法 I

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 (在表 19 中之實例 246) 之合成



### 步驟 1：2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙酸乙酯之合成

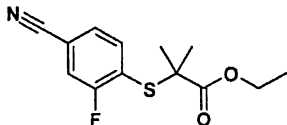
按藉由下述參考資料之修改所述製成：Katz 等人, *J. Org. Chem.* **1954**, *19*, 711-715；Zhang 等人, *J. Am. Chem. Soc.* **1997**, *119*, 1676-1681。

於 3 克 (22 毫莫耳) 4-胺基-3-氟-苯甲腈在醋酸 (60 毫升) 中之溶液內，在 0°C 下，添加 20 毫升硫酸，並使混合物冷卻至 0°C。逐滴添加 2.03 克 (29.4 毫莫耳) 亞硝酸鈉在水 (15 毫升) 中之溶液，歷經 10 分鐘，同時保持溫度低於 10°C。將所形成之溶液在 0°C 下攪拌 20 分鐘，然後添加 0.5 克 (832 毫莫耳) 尿素，且將混合物於 0°C 下攪拌 5 分鐘。於此溶液中，添加 4.4 克 (23 毫莫耳) 碘化銅在水 (10 毫升) 中之溶液，並將混合物攪拌 5 分鐘，接著，在 0°C 下添加 13 克 (81.3 毫莫耳) 乙基磺原酸鉀在水 (90 毫升) 中之溶液。將所形成之混合物加熱至 80°C，歷經 1 小時。於冷卻至室溫後，以 DCM (3 x 40 毫升) 萃取混合物。使有機萃液以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 脫水乾燥，過濾，及在減壓下濃縮。

使所形成之油溶於100毫升乙醇中，在氮大氣下脫氣20分鐘，且添加3.6克(63毫莫耳)氫氧化鉀。將反應物加熱至80°C，歷經1小時，然後，添加10毫升(67.4毫莫耳) $\alpha$ -溴基異丁酸乙酯。將混合物於室溫下攪拌18小時，接著在減壓下濃縮。藉管柱層析純化(矽膠，溶離劑庚烷，醋酸乙酯0-20%)，然後於減壓下蒸餾，獲得1.1克2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙酸乙酯。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, 氯仿-d):  $\delta$  ppm 1.25 (3H, t, J=7.09 Hz), 1.54 (6H, s), 4.15 (2H, q, J=7.09 Hz), 7.37-7.45 (2H, m), 7.56-7.62 (1H, m)

根據此程序，合成下列硫醚。

表 13

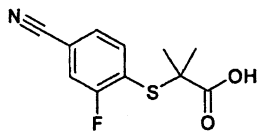
| 分子結構                                                                                | 名稱                         | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ]   |
|-------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------|--------|---------------------------|
|  | 2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙酸乙酯 | 17     | 藉 <sup>1</sup> H NMR 特徵鑒定 |

#### 步驟2：2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙酸之合成

於1.1克(4.1毫莫耳)2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙酸乙酯在THF(50毫升)中之溶液內，添加1.58克(12.3毫莫耳)三甲基矽烷醇化鉀。將反應物在室溫下攪拌3小時。於減壓下移除溶劑。使殘留物於DCM(50毫升)與水(50毫升)之間作分液處理。以1M HCl水溶液使水層酸化，並以DCM(4 x 50毫升)萃取。將合併之有機萃液以Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>脫水乾燥，過濾，及在減壓下濃縮濾液，而得1.04克2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙酸。

根據此程序，合成下列酸類。

表 14

| 分子結構                                                                              | 名稱                           | 產率 [%] | m/z [M-H <sup>+</sup> ] |
|-----------------------------------------------------------------------------------|------------------------------|--------|-------------------------|
|  | 2-(4-氰基-2-氟苯基<br>硫基)-2-甲基-丙酸 | 100    | 238 (負離子)               |

步驟 3：N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙醯胺之合成

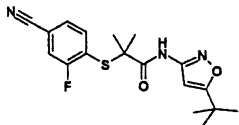
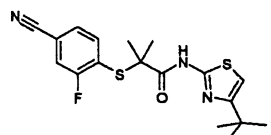
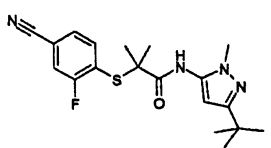
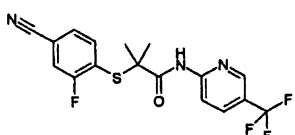
N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙醯胺係一般性地按方法 A 步驟 4 中所述製成。

173 毫克 (0.72 毫莫耳) 2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙酸之活化成其氯化醯，係經由以二氯化亞硫醯 (1 毫升) 於 70°C 下處理 3 小時而達成。使反應物冷卻至室溫，並在減壓下移除過量二氯化亞硫醯。

使粗製氯化醯溶於 DCM (2 毫升) 中，並添加至 199 毫克 (1.42 毫莫耳) 2-胺基-5-第三-丁基異噁唑在 DCM (1 毫升) 中之溶液內。將反應物在室溫下攪拌 18 小時。將反應混合物以 DCM 稀釋，以飽和 NaHCO<sub>3</sub> 水溶液 (2 毫升)、鹽水 (2 毫升) 洗滌，及以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 脫水乾燥。過濾，並濃縮濾液，獲得粗產物。藉管柱層析進一步純化 (矽膠，溶離劑：庚烷，0-25% 醋酸乙酯)，產生 190 毫克 N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙醯胺。

根據此程序，合成下列醯胺類。

表 15

| 分子結構                                                                               | 名稱                                                   | 產率<br>[%] | m/z<br>[M-H <sup>+</sup> ] |
|------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------|-----------|----------------------------|
|   | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙醯胺        | 50        | 362                        |
|   | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙醯胺         | 64        | 378                        |
|   | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙醯胺 | 60        | 375                        |
|  | 2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺          | 80        | 384                        |

#### 步驟 4：N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氰基-2-氟-苯磺基)-2-甲基-丙醯胺之合成

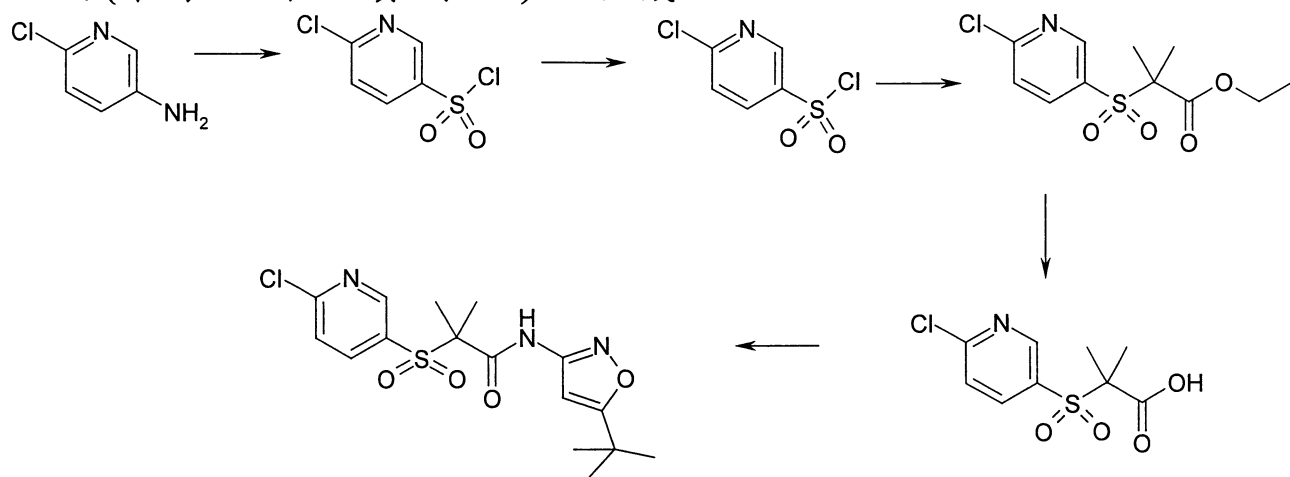
於 190 毫克 (0.52 毫莫耳) N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氰基-2-氟苯基硫基)-2-甲基-丙醯胺在二氧陸園 (10 毫升) 中之溶液內，添加 1.29 克 (2.1 毫莫耳) 單過硫酸鉀三倍鹽 (OXON<sup>®</sup>)。將白色懸浮液於室溫下攪拌 18 小時。藉過濾分離白色固體，並以二氧陸園 (20 毫升) 洗滌。在減壓下濃縮濾液。使殘留物溶於水中，並以 DCM (3 x 8 毫升) 萃取。將合併之有機萃液以鹽水洗滌，以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 脫水乾燥，及過濾。在減壓下濃縮濾液，且使所形成之殘留物藉管柱層析純化 (矽膠，溶離劑庚烷，0-20% 醋酸乙酯)，而得 48 毫克 N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氰基-2-氟-苯磺基)-2-甲基-丙醯

胺。

於表 19 方法 I 中所列示之實例係根據此程序製成。

#### 方法 J

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙  
醯胺 (在表 19 中之實例 253) 之合成



#### 步驟 1：氯化 6-氯-吡啶-3-磺醯之合成

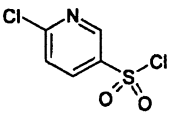
按藉由下述參考資料之修改所述製成：Markley 等人，*J. Med. Chem.* **1986**, 29, 427-433。

使 10 克 (79.2 毫莫耳) 3-胺基-6-氯吡啶在濃 HCl (16 毫升) 與冰醋酸 (89 毫升) 中之溶液，在冰浴中冷卻至 10°C。分次添加 5.46 克 (79.2 毫莫耳) 亞硝酸鈉，保持溫度低於 15°C。將混合物攪拌 1 小時，然後，在 5°C 下逐滴添加至二氧化硫 (約 27 毫升)、2.77 克 (16.2 毫莫耳) 氯化銅(II) 二水合物及醋酸 (59 毫升) 在水 (11 毫升) 中之溶液內，歷經 10 分鐘。使反應混合物溫熱至室溫，並傾倒於冰/水 (300 毫升) 上，且再攪拌 15 分鐘。藉過濾分離所形成之沉澱物，以水 (2 x 100 毫升) 洗滌，並於減壓下乾燥，而得 12.99 克氯化 6-氯-吡啶-3-磺醯；<sup>1</sup>H NMR

(400 MHz, 氯仿-d)  $\delta$  ppm 7.62 (1H, d,  $J=8.31$  Hz), 8.26 (1H, dd,  $J=8.56, 2.69$  Hz), 9.04 (1H, d,  $J=2.69$  Hz).

根據此程序，下列氯化磺醯類已被合成。

表 16

| 分子結構                                                                              | 名稱             | 產率 [%] | m/z [ $M+H^+$ ]     |
|-----------------------------------------------------------------------------------|----------------|--------|---------------------|
|  | 氯化 6-氯-吡啶-3-磺醯 | 77     | 藉 $^1H$ NMR<br>特徵鑒定 |

### 步驟 2：6-氯-吡啶-3-亞磺酸鈉鹽之合成

6-氯-吡啶-3-亞磺酸鈉鹽係一般性地根據方法 B 步驟 2 製成。

於 0.81 克  $NaHCO_3$  (9.61 毫莫耳) 與 1.21 克  $Na_2SO_3$  (9.61 毫莫耳) 在水 (10 毫升) 中之溶液內，添加 1 克 (4.7 毫莫耳) 氯化 6-氯-吡啶-3-磺醯。將反應物在  $80^\circ C$  下加熱 3 小時。於減壓下移除溶劑。使濾液在減壓下濃縮，而得 6-氯-吡啶-3-亞磺酸鈉鹽。

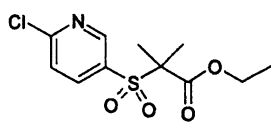
### 步驟 3：2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙酸乙酯之合成

2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙酸乙酯係一般性地藉由方法 B 步驟 2 之修改製成。

使粗製 6-氯-吡啶-3-亞磺酸鈉鹽 (4.7 毫莫耳) 懸浮於 DMF (20 毫升) 中。添加吡啶 (0.8 毫升) 與  $\alpha$ -溴基異丁酸乙酯 (1 毫升)。將反應物在  $50^\circ C$  及氮氣下攪拌 18 小時。使反應混合物於乙醚 (100 毫升) 與水 (50 毫升) 之間作分液處理。以鹽水 (50 毫升) 洗滌有機層，並以  $Na_2SO_4$  脫水乾燥。過濾，在減壓下濃縮，接著管柱層析 (矽膠，溶離劑庚烷，0-25% 醋酸乙酯)，獲得 0.83 克 2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙酸乙酯。

根據此程序，下列磺酯類已被合成。

表 17

| 分子結構                                                                              | 名稱                        | 產率 [%] | m/z [M+H <sup>+</sup> ] |
|-----------------------------------------------------------------------------------|---------------------------|--------|-------------------------|
|  | 2-(6-氯-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙酸乙酯 | 61     | 292/294                 |

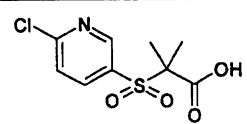
#### 步驟 4：2-(6-氯-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙酸之合成

2-(6-氯-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙酸係一般性地藉由方法 I 步驟 2 之修改製成。

於 834 毫克 (2.86 毫莫耳) 2-(6-氯-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙酸乙酯在 THF (30 毫升) 中之溶液內，添加 552 毫克 (4.3 毫莫耳) 三甲基矽烷醇化鉀。將反應物在室溫下攪拌 3 小時。於減壓下移除溶劑。使殘留物於 DCM (50 毫升) 與水 (50 毫升) 之間作分液處理。以 1M HCl 水溶液使水層酸化，並以 DCM (4 x 50 毫升) 萃取。將合併之有機萃液以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 脫水乾燥，過濾，並在減壓下濃縮濾液，而得 661 毫克 2-(6-氯-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙酸。

根據此程序，合成下列酸類。

表 18

| 分子結構                                                                                | 名稱                      | 產率 [%] | m/z [M-H <sup>+</sup> ] |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------|--------|-------------------------|
|  | 2-(6-氯-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙酸 | 88     | 264/266                 |

#### 步驟 5：N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙醯胺之合成

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙醯胺係一般性地按方法 A 步驟 4 中所述製成。

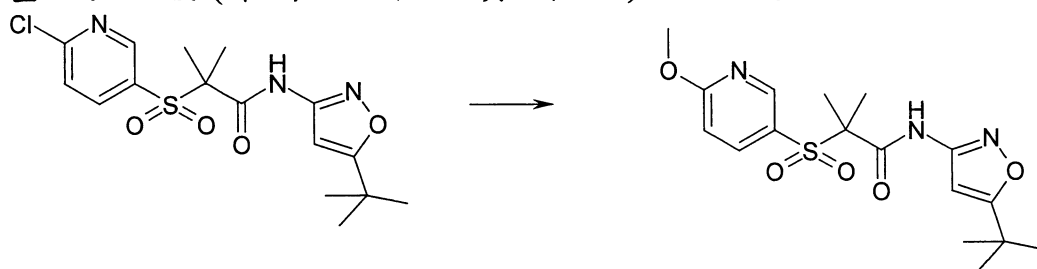
220 毫克 (0.84 毫莫耳) 2-(6-氯-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙酸之活化成其氯化鹽，係經由以二氯化亞硫鹽 (2 毫升) 於 70°C 下處理 3 小時而達成。使反應物冷卻至室溫，並在減壓下移除過量二氯化亞硫鹽。

使粗製氯化鹽溶於 DCM (2 毫升) 中，並添加至 125.6 毫克 (0.89 毫莫耳) 2-胺基-5-第三-丁基異噁唑與 N,N-二異丙基乙胺 (0.28 毫升) 在 DCM (1 毫升) 中之溶液內。將反應物於室溫下攪拌 18 小時。以 DCM (4 毫升) 稀釋反應混合物，以飽和 NaHCO<sub>3</sub> 水溶液 (2 毫升)、鹽水 (2 毫升) 洗滌，並以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 脫水乾燥。過濾，及濃縮濾液，獲得粗產物。藉管柱層析進一步純化 (矽膠，1. 管柱：溶離劑：庚烷，0-50% 醋酸乙酯；2. 管柱：溶離劑 DCM，0-20% 醋酸乙酯)，產生 127 毫克 N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙鹽胺。

於表 19 方法 J 中所列示之實例係根據此程序製成。

#### 方法 K

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙鹽胺 (在表 19 中之實例 255) 之合成



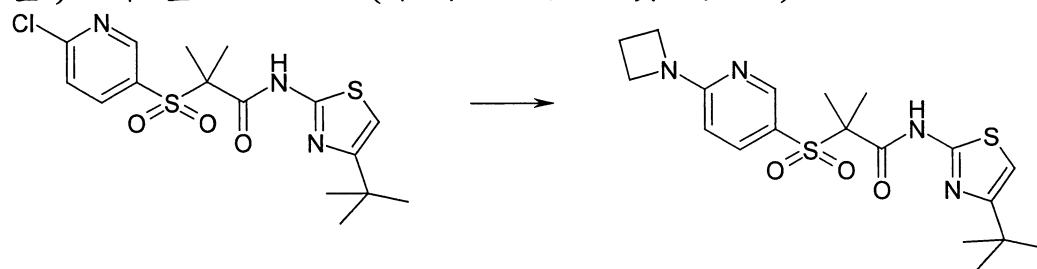
於 115 毫克 (0.30 毫莫耳) N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙鹽胺在甲醇 (3 毫升) 中之溶液內，添加 0.14 毫升 (0.6 毫莫耳，在甲醇中之 25 重量 % 溶液)

甲醇鈉溶液。將反應混合物在密封管中加熱至 60°C，歷經 4 小時。在減壓下濃縮溶液，並使殘留物藉管柱層析純化(矽膠，溶離劑 DCM，0-20% 醋酸乙酯)，而得 36 毫克 N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙醯胺。

於表 19 方法 K 中所列示之實例係根據此程序製成。

#### 方法 L

2-(6-一氮四環-1-基-吡啶-3-磺基)-N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺(在表 19 中之實例 399)之合成



於 79 毫克 (0.20 毫莫耳) N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙醯胺(實例 265，表 19)與 57.5 毫克 (0.42 毫莫耳)碳酸鉀在二氧陸圓(2 毫升)中之溶液內，添加 27 微升 (0.4 毫莫耳)一氮四環。將反應物在密封管中加熱至 70°C，歷經 3 小時。藉過濾移除固體，並以二氧陸圓(5 毫升)沖洗。於減壓下濃縮濾液，並使殘留物藉管柱層析純化(矽膠，溶離劑 DCM，5-10% 醋酸乙酯)，而得 67 毫克 2-(6-一氮四環-1-基-吡啶-3-磺基)-N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺。

於表 19 方法 L 中所列示之實例係根據此程序製成。

表 19：實例

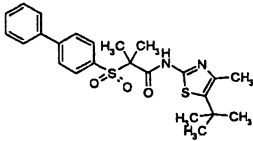
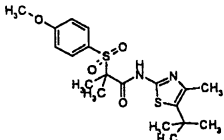
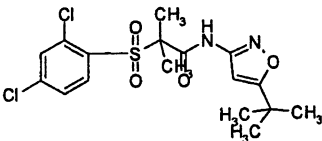
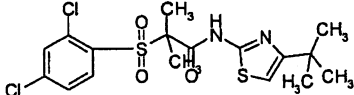
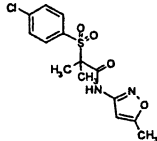
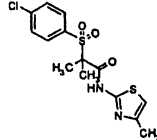
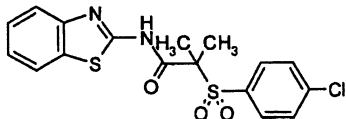
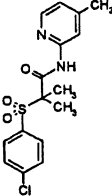
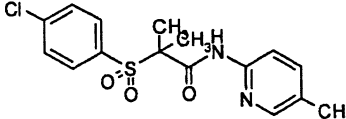
| # | 分子結構 | 名稱                                           | 產率 [%]  | 方法 |
|---|------|----------------------------------------------|---------|----|
| 1 |      | 2-甲基-N-(5-甲基-噻唑-2-基)-2-(吡啶-2-磺醯基)-丙醯胺        | 326     | A  |
| 2 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(吡啶-2-磺醯基)-丙醯胺    | 352     | A  |
| 3 |      | 2-甲基-N-(5-甲基-噻唑-2-基)-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺     | 393     | A  |
| 4 |      | 2-甲基-N-(5-甲基-噻唑-2-基)-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-磺醯基)-丙醯胺 | 394     | A  |
| 5 |      | 2-甲基-N-吡啶-3-基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺            | 373     | A  |
| 6 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺 | 419     | A  |
| 7 |      | 2-甲基-2-(吡啶-2-磺醯基)-N-吡啶-2-基-丙醯胺               | 306     | A  |
| 8 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺    | 385/387 | A  |
| 9 |      | N-異喹啉-1-基-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺           | 423     | A  |

| #  | 分子結構 | 名稱                                               | 產率 [%]  | 方法 |
|----|------|--------------------------------------------------|---------|----|
| 10 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺        | 365     | A  |
| 11 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(甲苯-2-磺醯基)-丙醯胺        | 365     | A  |
| 12 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-3-甲基-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-磺醯基)-丁醯胺 | 434     | A  |
| 13 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺          | 405     | A  |
| 14 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-乙醯胺          | 391     | A  |
| 15 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(萘-2-磺醯基)-丙醯胺         | 401     | A  |
| 16 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺      | 435     | A  |
| 17 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺         | 381     | A  |
| 18 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-2-磺醯基)-丙醯胺         | 381     | A  |
| 19 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺         | 401/403 | A  |

| #  | 分子結構 | 名稱                                               | 產率 [%]  | 方法 |
|----|------|--------------------------------------------------|---------|----|
| 20 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(萘-2-磺醯基)-丙醯胺          | 417     | A  |
| 21 |      | N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺 | 449     | A  |
| 22 |      | N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺    | 395     | A  |
| 23 |      | N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-2-磺醯基)-丙醯胺    | 395     | A  |
| 24 |      | N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺    | 415/417 | A  |
| 25 |      | N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(萘-1-磺醯基)-丙醯胺     | 431     | A  |
| 26 |      | 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺        | 431     | A  |
| 27 |      | 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺         | 447     | A  |
| 28 |      | 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺    | 461     | A  |

| #  | 分子結構 | 名稱                                           | 產率 [%]      | 方法 |
|----|------|----------------------------------------------|-------------|----|
| 29 |      | 2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺          | 351         | A  |
| 30 |      | 2-苯磺醯基-N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺           | 367         | A  |
| 31 |      | N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺 | 419         | A  |
| 32 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺  | 435         | A  |
| 33 |      | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-醯胺       | 397/399     | A  |
| 34 |      | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺        | 413/415     | A  |
| 35 |      | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺   | 427/429     | A  |
| 36 |      | N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 | 419/421/423 | A  |
| 37 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺  | 435/437/439 | A  |

| #  | 分子結構 | 名稱                                               | 產率 [%]      | 方法 |
|----|------|--------------------------------------------------|-------------|----|
| 38 |      | 2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺          | 381         | A  |
| 39 |      | N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 | 449/451/453 | A  |
| 40 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(4-甲基-噻唑-2-磺醯基)-丙醯胺   | 372         | A  |
| 41 |      | N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺        | 385.1       | A  |
| 42 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(4-甲基-噻唑-2-磺醯基)-丙醯胺    | 388         | A  |
| 43 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺      | 381         | A  |
| 44 |      | N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺 | 449         | A  |
| 45 |      | 2-(聯苯基-4-磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺       | 427         | B  |
| 46 |      | 2-(聯苯基-4-磺醯基)-N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺        | 443         | B  |

| #  | 分子結構                                                                                | 名稱                                                          | 產率 [%]          | 方法 |
|----|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------|-----------------|----|
| 47 |    | 2-(聯苯基-4-磺醯基)-<br>N-(5-第三-丁基-4-甲基<br>-噻唑-2-基)-2-甲基-丙<br>醯胺  | 457             | B  |
| 48 |    | N-(5-第三-丁基-4-甲基<br>-噻唑-2-基)-2-(4-甲氧<br>基-苯磺醯基)-2-甲基-<br>丙醯胺 | 411             | A  |
| 49 |    | N-(5-第三-丁基-異噁<br>唑-3-基)-2-(2,4-二氯-<br>苯磺醯基)-2-甲基-丙<br>醯胺    | 419/421/4<br>23 | A  |
| 50 |   | N-(4-第三-丁基-噻唑<br>-2-基)-2-(2,4-二氯-苯磺<br>醯基)-2-甲基-丙醯胺         | 435/437/4<br>39 | A  |
| 51 |  | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲<br>基-N-(5-甲基-異噁唑<br>-3-基)-丙醯胺              | 343.1           | A  |
| 52 |  | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲<br>基-N-(4-甲基-噻唑-2-<br>基)-丙醯胺               | 359.1           | A  |
| 53 |  | N-苯并噻唑-2-基-2-(4-<br>氯-苯磺醯基)-2-甲基-<br>丙醯胺                    | 395.1           | A  |
| 54 |  | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲<br>基-N-(4-甲基-吡啶-2-<br>基)-丙醯胺               | 353.2           | A  |
| 55 |  | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲<br>基-N-(5-甲基-吡啶-2-<br>基)-丙醯胺               | 353.1           | A  |

| #  | 分子結構 | 名稱                                               | 產率 [%] | 方法 |
|----|------|--------------------------------------------------|--------|----|
| 56 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺            | 353.2  | A  |
| 57 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-苯基-噻唑-2-基)-丙醯胺            | 421.1  | A  |
| 58 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺          | 407.1  | A  |
| 59 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 | 398.2  | A  |
| 60 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺          | 407.1  | A  |
| 61 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-乙基-吡啶-2-基)-2-甲基-丙醯胺            | 367.1  | A  |
| 62 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(1-甲基-1H-苯并咪唑-2-基)-丙醯胺       | 392.1  | A  |
| 63 |      | N-苯并呋唑-2-基-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺                 | 379.1  | A  |
| 64 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4,5-二甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺         | 373.1  | A  |

| #  | 分子結構 | 名稱                                            | 產率 [%] | 方法 |
|----|------|-----------------------------------------------|--------|----|
| 65 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-噁唑-2-基)-丙醯胺       | 413    | A  |
| 66 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-吡啶-2-基)-丙醯胺         | 415.2  | A  |
| 67 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺       | 407.1  | A  |
| 68 |      | N-苯并[d]異呔唑-3-基-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺          | 379.1  | A  |
| 69 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(1-甲基-5-苯基-1H-咪唑-2-基)-丙醯胺 | 418.1  | A  |
| 70 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(6-甲氧基-吡啶-3-基)-2-甲基-丙醯胺        | 369.2  | A  |
| 71 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-吡啶-3-基-丙醯胺                | 339.2  | A  |
| 72 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺                | 389.1  | A  |
| 73 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4,5,6,7-四氫-苯并噁唑-2-基)-丙醯胺 | 399.1  | A  |
| 74 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡嗪-3-基)-丙醯胺 | 418.2  | A  |

| #  | 分子結構 | 名稱                                                | 產率 [%] | 方法 |
|----|------|---------------------------------------------------|--------|----|
| 75 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-噻吩-2-基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺 | 424.1  | A  |
| 76 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-異喹啉-3-基-2-甲基-丙醯胺                   | 389.2  | A  |
| 77 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-苯氧基-吡啶-3-基)-丙醯胺            | 431.1  | A  |
| 78 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺    | 382.2  | A  |
| 79 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-磺醯基)-丙醯胺  | 420    | A  |
| 80 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-苯基-[1,2,4]噻二唑-5-基)-丙醯胺     | 422.12 | A  |
| 81 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-2-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺     | 418.2  | A  |
| 82 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-氟基-2-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺     | 429.19 | A  |
| 83 |      | N-(5-第三-丁基-[1,3,4]噻二唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺  | 402.18 | A  |

| #  | 分子結構 | 名稱                                                      | 產率 [%] | 方法 |
|----|------|---------------------------------------------------------|--------|----|
| 84 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-<br>N-(3,4-二甲基-異𪗇唑<br>-5-基)-2-甲基-丙醯胺       | 357.22 | A  |
| 85 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-<br>N-(2,5-二甲基-2H-吡唑<br>-3-基)-2-甲基-丙醯胺     | 356.21 | A  |
| 86 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-<br>N-(2,5-二苯基-2H-吡唑<br>-3-基)-2-甲基-丙醯胺     | 480.22 | A  |
| 87 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲<br>基-N-(5-苯基-2H-[1,2,4]<br>三唑-3-基)-丙醯胺 | 405.16 | A  |
| 88 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲<br>基-N-(5-苯基-[1,2,4]噻<br>二唑-3-基)-丙醯胺   | 422.14 | A  |
| 89 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲<br>基-N-(5-苯基-[1,3,4]噻<br>二唑-2-基)-丙醯胺   | 422.13 | A  |
| 90 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲<br>基-N-(4-噻吩-2-基-噻<br>唑-2-基)-丙醯胺       | 427.11 | A  |
| 91 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲<br>基-N-(3-苯基-異𪗇唑<br>-5-基)-丙醯胺          | 405.21 | A  |
| 92 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲<br>基-N-(5-甲基-4-苯基-<br>噻唑-2-基)-丙醯胺      | 435.17 | A  |

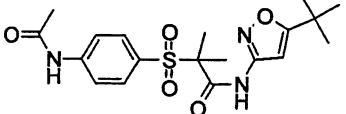
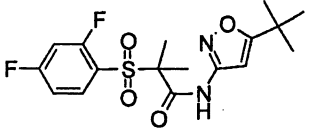
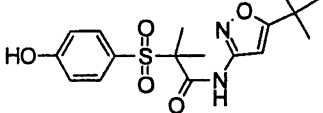
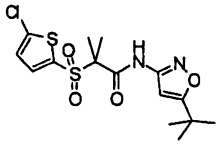
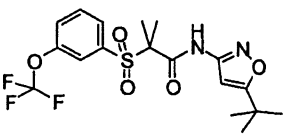
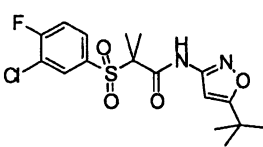
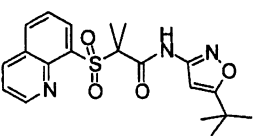
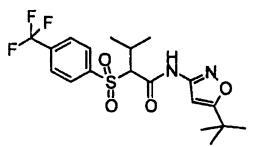
| #   | 分子結構 | 名稱                                              | 產率 [%] | 方法 |
|-----|------|-------------------------------------------------|--------|----|
| 93  |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-六氫吡啶-1-基甲基-噻唑-2-基)-丙醯胺   | 442.22 | A  |
| 94  |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-噁吩-2-基-異噁唑-5-基)-丙醯胺      | 411.13 | A  |
| 95  |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺         | 407.17 | A  |
| 96  |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-[1,3,4]噻二唑-2-基)-丙醯胺 | 414.06 | A  |
| 97  |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-[1,3,4]噻二唑-2-基)-丙醯胺   | 360.17 | A  |
| 98  |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-噻唑-2-基-丙醯胺                  | 345.13 | A  |
| 99  |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-吡啶-2-基-丙醯胺                  | 339.23 | A  |
| 100 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺           | 353.19 | A  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                         | 產率 [%]        | 方法 |
|-----|------|--------------------------------------------|---------------|----|
| 101 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(2-氯苯基)-2-甲基-丙醯胺            | 372.14/374.12 | A  |
| 102 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-三氟甲基-苯基)-丙醯胺        | 406.15        | A  |
| 103 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(3-氯苯基)-2-甲基-丙醯胺            | 372.14/374.14 | A  |
| 104 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-三氟甲基-苯基)-丙醯胺        | 406.14        | A  |
| 105 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-氯苯基)-2-甲基-丙醯胺            | 372.17/374.11 | A  |
| 106 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-2-基-丙醯胺             | 389.18        | A  |
| 107 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺 | 355.08/357.04 | A  |
| 108 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-苯基)-丙醯胺        | 406.13        | A  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                              | 產率 [%] | 方法 |
|-----|------|-------------------------------------------------|--------|----|
| 109 |      | N-(2-第三-丁基-苯基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺            | 394.24 | A  |
| 110 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-3-基-噻唑-2-基)-丙醯胺       | 422.14 | A  |
| 111 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-2-基-噻唑-2-基)-丙醯胺       | 422.14 | A  |
| 112 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-4-基-噻唑-2-基)-丙醯胺       | 422.14 | A  |
| 113 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-環丙基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺          | 385.15 | A  |
| 114 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-[1,3,4]噁二唑-2-基)-丙醯胺   | 344.19 | A  |
| 115 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 | 383    | C  |
| 116 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-3-磺醯基)-丙醯胺       | 357    | C  |
| 117 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氰基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺      | 376    | C  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                                | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|------|---------------------------------------------------|---------|----|
| 118 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,5-二甲基-噻吩-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 | 385     | C  |
| 119 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺  | 399     | C  |
| 120 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺         | 352     | B  |
| 121 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺          | 368     | B  |
| 122 |      | 2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺        | 441     | A  |
| 123 |      | 2-(4-溴-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺         | 429/431 | C  |
| 124 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-2-磺醯基)-丙醯胺         | 357     | D  |
| 125 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-異丙基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺       | 393     | C  |
| 126 |      | 2-(4-第三-丁基-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺     | 407     | C  |

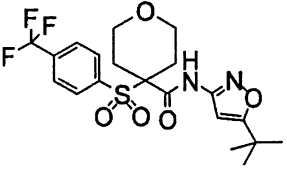
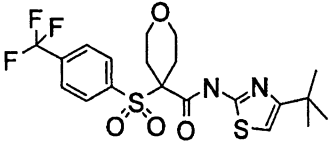
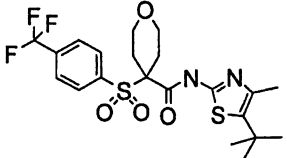
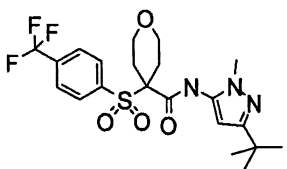
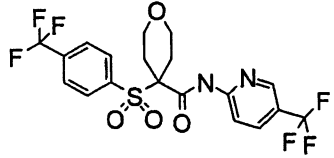
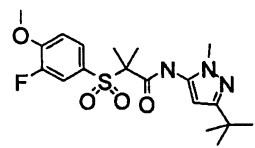
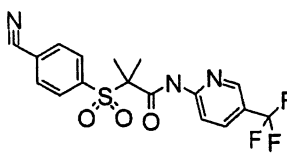
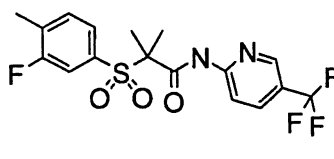
| #   | 分子結構 | 名稱                                                         | 產率 [%]      | 方法 |
|-----|------|------------------------------------------------------------|-------------|----|
| 127 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,3-二氫-苯并[1,4]二氧陸園烯-6-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 | 409         | C  |
| 128 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺             | 403/405     | C  |
| 129 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4,5-二氯-噻吩-2-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺           | 425/427/429 | C  |
| 130 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺                  | 369         | C  |
| 131 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-甲烷磺醯基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺              | 429         | C  |
| 132 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,2-二甲基-吡喃-6-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺          | 435         | C  |
| 133 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(4-吡啶-1-基-苯磺醯基)-丙醯胺             | 417         | C  |
| 134 |      | 2-(苯并[1,2,5]噻二唑-5-磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺        | 409         | C  |

| #   | 分子結構                                                                                | 名稱                                             | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------|---------|----|
| 135 |    | 2-(4-乙醯胺基-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺   | 408     | C  |
| 136 |    | N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺   | 387     | C  |
| 137 |    | N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-(4-羥基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺     | 367     | E  |
| 138 |   | N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-(5-氯-噻吩-2-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺  | 391/393 | C  |
| 139 |  | N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲氧基-苯磺醯基)-丙醯胺  | 435     | C  |
| 140 |  | N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-(3-氯基-4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 | 403/405 | C  |
| 141 |  | N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-甲基-2-(喹啉-8-磺醯基)-丙醯胺      | 402     | C  |
| 142 |  | N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丁醯胺   | 433     | A  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                                              | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|------|-----------------------------------------------------------------|---------|----|
| 143 |      | N-(4-第三-丁基-噁唑<br>-2-基)-3-甲基-2-(4-<br>三氟甲基-苯磺酰基)-<br>丁醯胺         | 449     | A  |
| 144 |      | N-(5-第三-丁基-4-甲基<br>-噁唑-2-基)-3-甲基<br>-2-(4-三氟甲基-苯磺酰<br>基)-丁醯胺    | 463     | A  |
| 145 |      | 3-甲基-2-(4-三氟甲基-<br>苯磺酰基)-N-(5-三氟<br>甲基-吡啶-2-基)-<br>丁醯胺          | 455     | A  |
| 146 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基<br>-2H-吡唑-3-基)-3-甲基<br>-2-(4-三氟甲基-苯磺酰<br>基)-丁醯胺 | 446     | A  |
| 147 |      | 3-甲基-2-(4-三氟甲基-<br>苯磺酰基)-N-(4-三氟<br>甲基-吡啶-2-基)-<br>丁醯胺          | 455     | A  |
| 148 |      | N-(2-氯苯基)-2-甲基<br>-2-(4-三氟甲基-苯磺酰<br>基)-丙醯胺                      | 406/408 | A  |
| 149 |      | N-(5-第三-丁基-異噁<br>唑-3-基)-2-甲基-2-(6-甲<br>基-吡啶-3-磺酰基)-丙<br>醯胺      | 366     | G  |
| 150 |      | 2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲<br>基-N-(5-苯基-異噁唑<br>-3-基)-丙醯胺                  | 405/407 | A  |

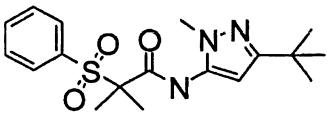
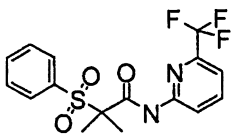
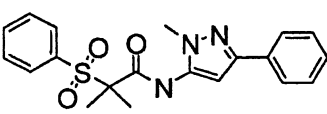
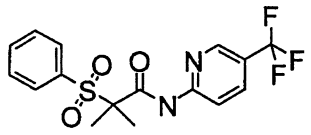
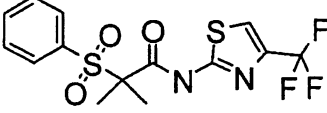
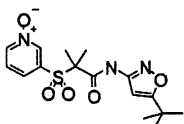
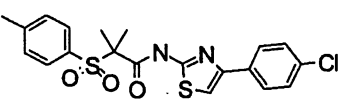
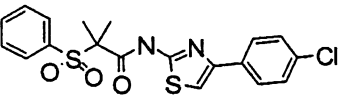
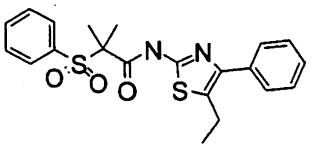
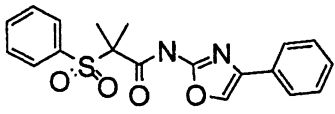
| #   | 分子結構 | 名稱                                                     | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|------|--------------------------------------------------------|---------|----|
| 151 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡啶-3-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺  | 416/418 | C  |
| 152 |      | 2-(4-溴-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡啶-3-基)-2-甲基-丙醯胺       | 442/444 | C  |
| 153 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡啶-3-基)-2-(4-氰基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺  | 389     | C  |
| 154 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡啶-3-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 | 396     | C  |
| 155 |      | 2-(4-溴-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺                | 451/453 | C  |
| 156 |      | 2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺         | 421     | C  |
| 157 |      | 2-(4-溴-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺                | 451/453 | C  |
| 158 |      | 2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺         | 421     | C  |

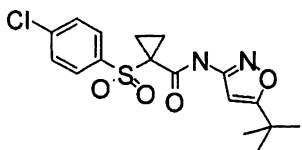
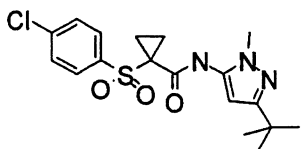
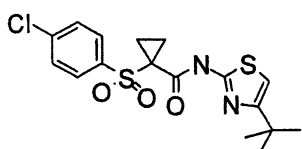
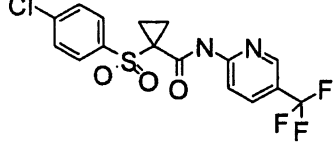
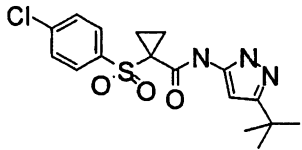
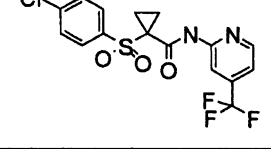
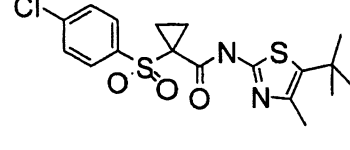
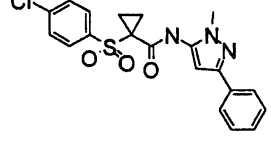
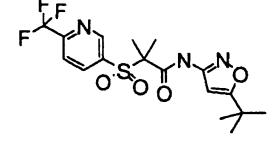
| #   | 分子結構 | 名稱                                                 | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|------|----------------------------------------------------|---------|----|
| 159 |      | 2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺      | 405     | C  |
| 160 |      | 2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺 | 436/438 | B  |
| 161 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-苯基-噁唑-2-基)-丙醯胺              | 405/407 | A  |
| 162 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-噻唑-2-基)-丙醯胺              | 421/422 | A  |
| 163 |      | N-(4-第三-丁基-5-甲基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺      | 415/417 | A  |
| 164 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4,5-二甲基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺          | 357/359 | A  |
| 165 |      | 3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丁醯胺         | 455     | A  |
| 166 |      | 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺          | 455     | A  |
| 167 |      | 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺           | 433     | F  |

| #   | 分子結構                                                                                | 名稱                                                        | 產率 [%] | 方法 |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------|--------|----|
| 168 |    | 4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呷喃-4-羧酸<br>(5-第三-丁基-異呿唑-3-基)-醯胺        | 461    | F  |
| 169 |    | 4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呷喃-4-羧酸<br>(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺         | 477    | F  |
| 170 |    | 4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呷喃-4-羧酸<br>(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺    | 491    | F  |
| 171 |   | 4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呷喃-4-羧酸<br>(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-醯胺 | 474    | F  |
| 172 |  | 4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呷喃-4-羧酸<br>(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺          | 483    | F  |
| 173 |  | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺   | 412    | C  |
| 174 |  | 2-(4-氰基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺                  | 398    | C  |
| 175 |  | 2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺             | 405    | C  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                                | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|------|---------------------------------------------------|---------|----|
| 176 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氰基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺        | 376     | C  |
| 177 |      | N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺          | 385/387 | A  |
| 178 |      | N-(5-第三-丁基-2H-吡啶-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺       | 384/386 | A  |
| 179 |      | 4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-吡喃-4-羧酸 (6-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺     | 483     | F  |
| 180 |      | 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸 (5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺    | 447     | F  |
| 181 |      | 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸 (5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡啶-3-基)-醯胺 | 430     | F  |
| 182 |      | 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸 (4-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺          | 439     | F  |
| 183 |      | 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸 (5-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺          | 439     | F  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                               | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|------|--------------------------------------------------|---------|----|
| 184 |      | 1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺          | 439     | F  |
| 185 |      | N-(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺         | 401/403 | A  |
| 186 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環己基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺   | 424/426 | A  |
| 187 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環戊基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺   | 410/412 | A  |
| 188 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺 | 378     | A  |
| 189 |      | 2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺          | 387     | A  |
| 190 |      | 2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺    | 398     | A  |
| 191 |      | 2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺          | 387     | A  |
| 192 |      | 2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-N-(4-三氟甲基-噻唑-2-基)-丙醯胺          | 393     | A  |

| #   | 分子結構                                                                                | 名稱                                             | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------|---------|----|
| 193 |    | 2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺     | 364     | A  |
| 194 |    | 2-苯磺醯基-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺              | 373     | A  |
| 195 |    | 2-苯磺醯基-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺        | 384     | A  |
| 196 |    | 2-苯磺醯基-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺              | 373     | A  |
| 197 |   | 2-苯磺醯基-2-甲基-N-(4-三氟甲基-噻唑-2-基)-丙醯胺              | 379     | A  |
| 198 |  | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(1-氧基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺 | 368     | H  |
| 199 |  | N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-2-(4-甲基磺醯基)-丙醯胺      | 435/437 | A  |
| 200 |  | 2-苯磺醯基-N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺           | 421/423 | A  |
| 201 |  | 2-苯磺醯基-N-(5-乙基-4-苯基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺           | 415     | A  |
| 202 |  | 2-苯磺醯基-2-甲基-N-(4-苯基-噁唑-2-基)-丙醯胺                | 371     | A  |

| #   | 分子結構                                                                                | 名稱                                               | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------|---------|----|
| 203 |    | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-醯胺           | 383/385 | F  |
| 204 |    | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡啶-3-基)-醯胺    | 396/398 | F  |
| 205 |    | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺            | 399/401 | F  |
| 206 |   | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺             | 405/407 | F  |
| 207 |  | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2H-吡啶-3-基)-醯胺         | 382/384 | F  |
| 208 |  | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺             | 405/407 | F  |
| 209 |  | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺       | 413/415 | F  |
| 210 |  | 1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(2-甲基-5-苯基-2H-吡啶-3-基)-醯胺       | 416/418 | F  |
| 211 |  | N-(5-第三-丁基-異呔唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺 | 420     | G  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                                      | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|------|---------------------------------------------------------|---------|----|
| 212 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺         | 436     | G  |
| 213 |      | N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺    | 450     | G  |
| 214 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺 | 433     | G  |
| 215 |      | 2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺    | 453     | G  |
| 216 |      | N-(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺      | 419     | G  |
| 217 |      | 2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺          | 442     | G  |
| 218 |      | 2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺          | 442     | G  |
| 219 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-苯基-[1,2,4]噁二唑-5-基)-丙醯胺           | 406/408 | A  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                               | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|------|--------------------------------------------------|---------|----|
| 220 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-氰基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺            | 370/372 | A  |
| 221 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺        | 369     | A  |
| 222 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 | 382     | A  |
| 223 |      | 2-(3-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺          | 391     | A  |
| 224 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺        | 369     | A  |
| 225 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 | 382     | A  |
| 226 |      | N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺    | 399     | A  |
| 227 |      | 2-(2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺          | 391     | A  |

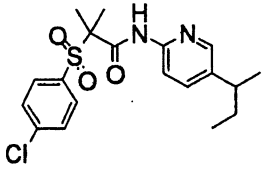
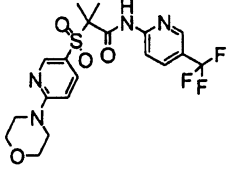
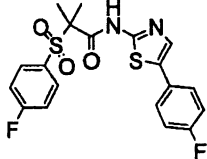
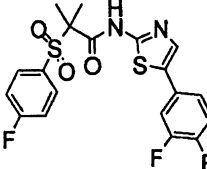
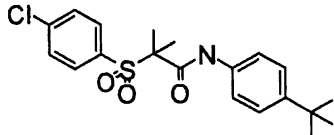
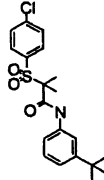
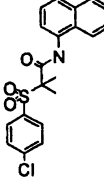
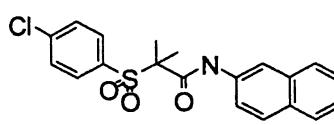
| #   | 分子結構 | 名稱                                              | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|------|-------------------------------------------------|---------|----|
| 228 |      | N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(3-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙醯胺   | 399     | A  |
| 229 |      | N-(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙醯胺     | 368     | A  |
| 230 |      | N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙醯胺  | 403/405 | B  |
| 231 |      | 2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺    | 425/427 | B  |
| 232 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙醯胺   | 419/421 | B  |
| 233 |      | 2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺    | 425/427 | B  |
| 234 |      | 2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺    | 425/427 | B  |
| 235 |      | 2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-N-(5-乙基-4-苯基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺 | 467/469 | B  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                                     | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|------|--------------------------------------------------------|---------|----|
| 236 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-異丙基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺                 | 387/389 | A  |
| 237 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺        | 387/389 | B  |
| 238 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡啶-3-基)-2-(2-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 | 396     | B  |
| 239 |      | 2-(2-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺          | 405     | B  |
| 240 |      | N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺           | 419     | A  |
| 241 |      | N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺        | 383     | B  |
| 242 |      | N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-甲基-2-(4-磺醯基)-丙醯胺                 | 365     | A  |
| 243 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡啶-3-基)-2-(4-氰基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺  | 407     | I  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                               | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|------|--------------------------------------------------|---------|----|
| 244 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氰基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺    | 410     | I  |
| 245 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-[5-(四氫-呋喃-4-基)-噻唑-2-基]-丙醯胺   | 429/431 | A  |
| 246 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氰基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺   | 394     | I  |
| 247 |      | 2-(4-氰基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺     | 416     | I  |
| 248 |      | N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺        | 369     | A  |
| 249 |      | 2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺          | 391     | A  |
| 250 |      | 2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺          | 391     | A  |
| 251 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 | 382     | A  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                                     | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|------|--------------------------------------------------------|---------|----|
| 252 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺               | 385     | A  |
| 253 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺          | 386/388 | J  |
| 254 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡嗪-3-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺   | 399/401 | J  |
| 255 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺        | 382     | K  |
| 256 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡嗪-3-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 | 395     | K  |
| 257 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺         | 398     | K  |
| 258 |      | 2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺            | 408/410 | J  |
| 259 |      | 2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺            | 408/410 | J  |

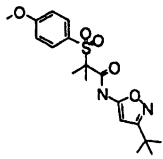
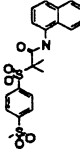
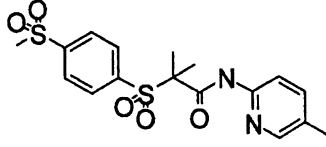
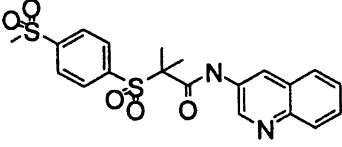
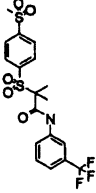
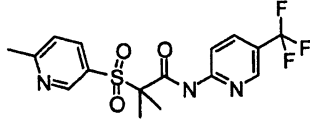
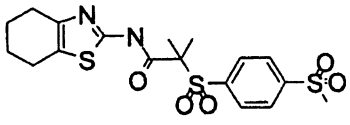
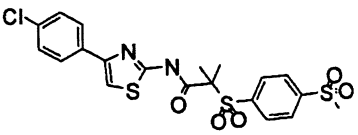
| #   | 分子結構 | 名稱                                                 | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|------|----------------------------------------------------|---------|----|
| 260 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺基)-2-甲基-丙基胺        | 402/403 | J  |
| 261 |      | N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,5-二氟-苯磺基)-2-甲基-丙基胺        | 387     | B  |
| 262 |      | N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(2,5-二氟-苯磺基)-2-甲基-丙基胺        | 387     | B  |
| 263 |      | 2-(2,5-二氟-苯磺基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙基胺          | 409     | B  |
| 264 |      | 2-(2,5-二氟-苯磺基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙基胺          | 409     | B  |
| 265 |      | N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(2,5-二氟-苯磺基)-2-甲基-丙基胺         | 403     | B  |
| 266 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2,5-二氟-苯磺基)-2-甲基-丙基胺 | 400     | B  |
| 267 |      | 2-(4-氯-苯磺基)-N-[4-(3,4-二氟-苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙基胺      | 457/459 | A  |

| #   | 分子結構                                                                                | 名稱                                                | 產率 [%]  | 方法 |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------|---------|----|
| 268 |    | N-(5-第二-丁基-吡啶-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺          | 395/397 | A  |
| 269 |    | 2-甲基-2-(6-嗎福啉-4-基-吡啶-3-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺 | 459     | L  |
| 270 |    | 2-(4-氟-苯磺醯基)-N-[5-(4-氟苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺        | 423     | A  |
| 271 |   | N-[5-(3,4-二氟-苯基)-噻唑-2-基]-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺    | 441     | A  |
| 272 |  | N-(4-第三-丁基-苯基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺              | 394.2   | A  |
| 273 |  | N-(3-第三-丁基-苯基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺              | 394.2   | A  |
| 274 |  | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-1-基-丙醯胺                     | 388.2   | A  |
| 275 |  | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-2-基-丙醯胺                     | 388.2   | A  |

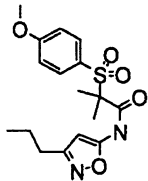
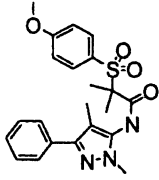
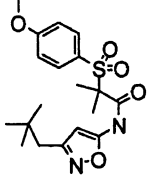
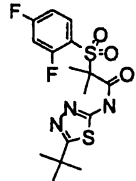
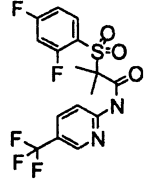
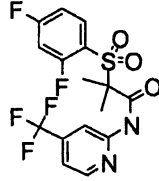
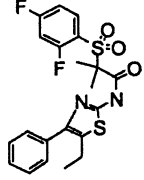
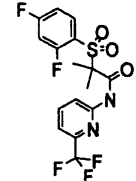
| #   | 分子結構 | 名稱                                               | 產率 [%] | 方法 |
|-----|------|--------------------------------------------------|--------|----|
| 276 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-<br>N-(4,5-二苯基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺     | 422.1  | A  |
| 277 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-乙基-4-苯基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺       | 447.2  | A  |
| 278 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-環己基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺           | 427.1  | A  |
| 279 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-甲基-4-苯基-異噁唑-5-基)-丙醯胺      | 419    | A  |
| 280 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-丙基-異噁唑-5-基)-丙醯胺           | 371.1  | A  |
| 281 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(2,4-二甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺 | 432.1  | A  |
| 282 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-甲基-3-苯基-異噁唑-5-基)-丙醯胺      | 419.3  | A  |
| 283 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[3-(2,2-二甲基-丙基)-異噁唑-5-基]-2-甲基-丙醯胺 | 399.1  | A  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                                  | 產率 [%] | 方法 |
|-----|------|-----------------------------------------------------|--------|----|
| 284 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-乙基-3-甲基-異噁唑-5-基)-2-甲基-丙醯胺         | 371    | A  |
| 285 |      | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-異丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺      | 384.1  | A  |
| 286 |      | 2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺                   | 391.1  | A  |
| 287 |      | N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺       | 457    | A  |
| 288 |      | 2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺    | 420.1  | A  |
| 289 |      | N-(5-環丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺   | 384.2  | A  |
| 290 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺 | 400.2  | A  |
| 291 |      | 2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-N-異喹啉-3-基-2-甲基-丙醯胺                  | 391.1  | A  |
| 292 |      | 2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-3-基-噻唑-2-基)-丙醯胺        | 424    | A  |

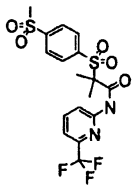
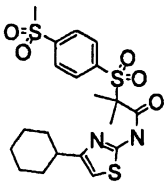
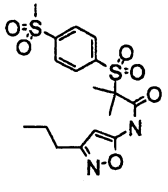
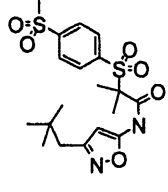
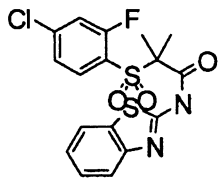
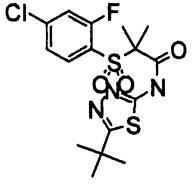
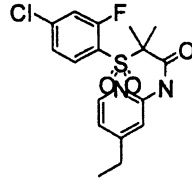
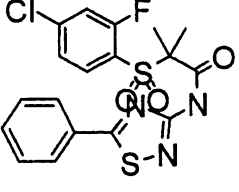
| #   | 分子結構 | 名稱                                                  | 產率 [%] | 方法 |
|-----|------|-----------------------------------------------------|--------|----|
| 293 |      | 2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-2-基-噻唑-2-基)-丙醯胺        | 424.1  | A  |
| 294 |      | N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺        | 387.1  | A  |
| 295 |      | 2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-1-基-丙醯胺                    | 384.1  | A  |
| 296 |      | 2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺                    | 385.2  | A  |
| 297 |      | N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺        | 451.1  | A  |
| 298 |      | 2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺     | 414.2  | A  |
| 299 |      | N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺  | 394.3  | A  |
| 300 |      | 2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-噻吩-2-基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺 | 420.1  | A  |
| 301 |      | 2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-噻唑-2-基)-丙醯胺           | 409    | A  |

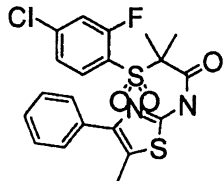
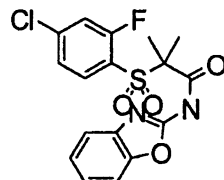
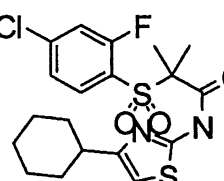
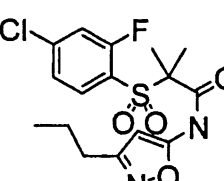
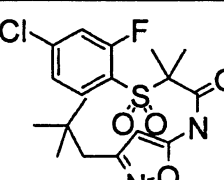
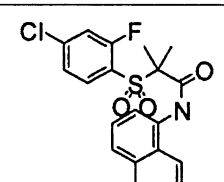
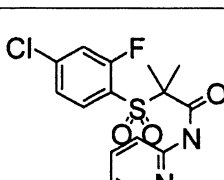
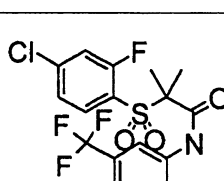
| #   | 分子結構                                                                                | 名稱                                                                  | 產率 [%] | 方法 |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------|--------|----|
| 302 |    | N-(3-第三-丁基-異<br>噁唑-5-基)-2-(4-甲氧基-<br>苯磺醯基)-2-甲基-丙<br>醯胺             | 381.2  | A  |
| 303 |    | 2-(4-甲烷磺醯基-苯磺<br>醯基)-2-甲基-N-萘-1-<br>基-丙醯胺                           | 432.1  | B  |
| 304 |    | 2-(4-甲烷磺醯基-苯磺<br>醯基)-2-甲基-N-(5-甲<br>基-吡啶-2-基)-丙醯胺                   | 397.1  | B  |
| 305 |   | 2-(4-甲烷磺醯基-苯磺<br>醯基)-2-甲基-N-喹啉<br>-3-基-丙醯胺                          | 433.1  | B  |
| 306 |  | 2-甲基-2-{[4-(甲磺醯<br>基)苯基]磺醯<br>基}-N-[3-(三氟甲基)苯<br>基]丙醯胺              | 450.1  | B  |
| 307 |  | 2-甲基-2-(6-甲基-吡<br>啶-3-磺醯基)-N-(5-三<br>氟甲基-吡啶-2-基)-<br>丙醯胺            | 388    | G  |
| 308 |  | 2-甲基-2-{[4-(甲磺醯<br>基)苯基]磺醯基}-<br>N-(4,5,6,7-四氫-1,3-苯并<br>噁唑-2-基)丙醯胺 | 443.1  | B  |
| 309 |  | N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噻<br>唑-2-基]-2-甲基<br>-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]<br>磺醯基}丙醯胺    | 499    | B  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                                     | 產率 [%] | 方法 |
|-----|------|--------------------------------------------------------|--------|----|
| 310 |      | 2-甲基-N-(1-甲基-3-苯基-1H-吡唑-5-基)-2-[[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺    | 462.1  | B  |
| 311 |      | N-(3-第三-丁基-1-甲基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-[[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺 | 442.2  | B  |
| 312 |      | 2-甲基-2-[[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-[4-(三氟甲基)-1,3-噻唑-2-基]丙醯胺    | 457    | B  |
| 313 |      | N-(4-環丙基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基-2-[[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺       | 429    | B  |
| 314 |      | N-(4-第三-丁基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺         | 397.1  | A  |
| 315 |      | N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺       | 403.1  | A  |
| 316 |      | 2-[(4-甲氧苯基)磺醯基]-2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙醯胺             | 403.1  | A  |
| 317 |      | N-(4-環己基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺           | 423.1  | A  |

| #   | 分子結構                                                                                | 名稱                                                  | 產率 [%] | 方法 |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------|--------|----|
| 318 |    | 2-[(4-甲氧苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(3-丙基異呔唑-5-基)丙醯胺             | 367.1  | A  |
| 319 |    | N-(1,4-二甲基-3-苯基-1H-吡唑-5-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺  | 428.1  | A  |
| 320 |    | N-[3-(2,2-二甲基丙基)異呔唑-5-基]-2-[(4-甲氧苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺    | 395.1  | A  |
| 321 |   | N-(5-第三-丁基-1,3,4-噻二唑-2-基)-2-[(2,4-二氟苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺 | 404.1  | A  |
| 322 |  | 2-[(2,4-二氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-[5-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙醯胺        | 409    | A  |
| 323 |  | 2-[(2,4-二氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙醯胺        | 409.1  | A  |
| 324 |  | 2-[(2,4-二氟苯基)磺醯基]-N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基丙醯胺  | 451.1  | A  |
| 325 |  | 2-[(2,4-二氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙醯胺        | 409    | A  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                                   | 產率 [%] | 方法 |
|-----|------|------------------------------------------------------|--------|----|
| 326 |      | 2-[(2,4-二氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(3-丙基異𪗇唑-5-基)丙醯胺            | 373.1  | A  |
| 327 |      | 2-[(2,4-二氟苯基)磺醯基]-N-[3-(2,2-二甲基丙基)異𪗇唑-5-基]-2-甲基丙醯胺   | 401.1  | A  |
| 328 |      | 2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-[5-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙醯胺       | 451    | B  |
| 329 |      | 2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙醯胺       | 451    | B  |
| 330 |      | N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺           | 411.1  | B  |
| 331 |      | N-1,3-苯并𪗇唑-2-基-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺           | 423.1  | B  |
| 332 |      | 2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺 | 479    | B  |
| 333 |      | N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺 | 493    | B  |

| #   | 分子結構                                                                                | 名稱                                                    | 產率 [%] | 方法 |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------|--------|----|
| 334 |    | 2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙醯胺        | 451    | B  |
| 335 |    | N-(4-環己基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺      | 471.1  | B  |
| 336 |    | 2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-(3-丙基異𪗇唑-5-基)丙醯胺           | 415.1  | B  |
| 337 |   | N-[3-(2,2-二甲基丙基)異𪗇唑-5-基]-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺  | 443.1  | B  |
| 338 |  | N-1,3-苯并噁唑-2-基-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺            | 413    | B  |
| 339 |  | N-(5-第三-丁基-1,3,4-噻二唑-2-基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺 | 420    | B  |
| 340 |  | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基丙醯胺            | 385.1  | B  |
| 341 |  | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(5-苯基-1,2,4-噻二唑-3-基)丙醯胺    | 440    | B  |

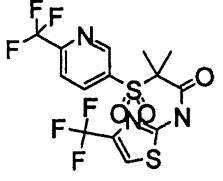
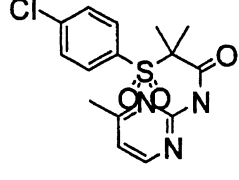
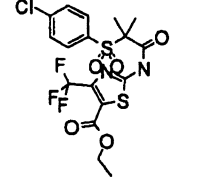
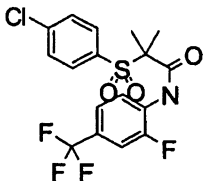
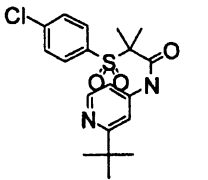
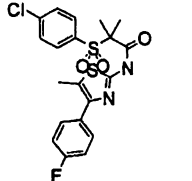
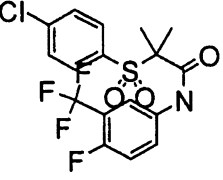
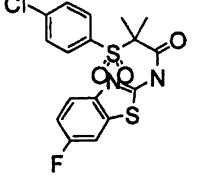
| #   | 分子結構                                                                                | 名稱                                                   | 產率 [%] | 方法 |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------|--------|----|
| 342 |    | N-1,3-苯并噁唑-2-基-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺           | 397    | B  |
| 343 |    | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噁唑-2-基)丙醯胺 | 453.1  | B  |
| 344 |    | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-(4-環己基-1,3-噁唑-2-基)-2-甲基丙醯胺     | 445.1  | B  |
| 345 |   | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(3-丙基異噁唑-5-基)丙醯胺          | 389.1  | B  |
| 346 |  | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-甲基丙醯胺 | 417.1  | B  |
| 347 |  | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-1-萘基丙醯胺                   | 406.1  | B  |
| 348 |  | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(5-甲基吡啶-2-基)丙醯胺           | 371.1  | B  |
| 349 |  | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-[3-(三氟甲基)苯基]丙醯胺           | 424    | B  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                                   | 產率 [%]      | 方法 |
|-----|------|------------------------------------------------------|-------------|----|
| 350 |      | N-(4-第三-丁基苯基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺            | 412.1       | B  |
| 351 |      | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-喹啉-2-基丙醯胺                 | 407.1       | B  |
| 352 |      | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基丙醯胺 | 473.0/475.0 | B  |
| 353 |      | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-[4-(三氟甲基)苯基]丙醯胺           | 424         | B  |
| 354 |      | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-異喹啉-3-基-2-甲基丙醯胺                | 407.1       | B  |
| 355 |      | N-(3-第三-丁基苯基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺            | 412.1       | B  |
| 356 |      | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-[4-(三氟甲基)-1,3-噻唑-2-基]丙醯胺  | 431         | B  |
| 357 |      | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-(4-環丙基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基丙醯胺     | 403.1       | B  |

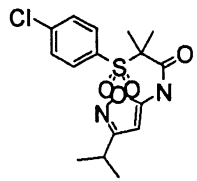
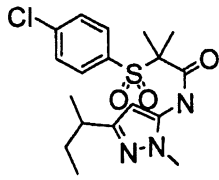
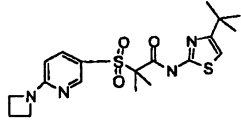
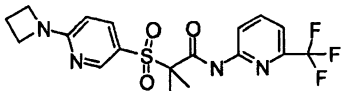
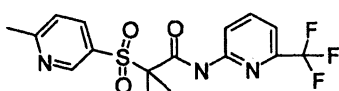
| #   | 分子結構 | 名稱                                                        | 產率 [%] | 方法 |
|-----|------|-----------------------------------------------------------|--------|----|
| 358 |      | N-1,3-苯并噁唑-2-基-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺            | 380    | G  |
| 359 |      | 2-甲基-N-(4-苯基-1,3-噁唑-2-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺       | 456.1  | G  |
| 360 |      | N-(5-第三-丁基-1,3,4-噁二唑-2-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺 | 437.1  | G  |
| 361 |      | N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺            | 402.2  | G  |
| 362 |      | 2-甲基-N-(5-苯基-1,2,4-噁二唑-3-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺    | 457.1  | G  |
| 363 |      | N-1,3-苯并噁唑-2-基-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺            | 414.1  | G  |
| 364 |      | 2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噁唑-2-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺  | 470.1  | G  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                                         | 產率 [%] | 方法 |
|-----|------|------------------------------------------------------------|--------|----|
| 365 |      | N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}丙酰胺   | 484.1  | G  |
| 366 |      | 2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}丙酰胺         | 442.1  | G  |
| 367 |      | 2-甲基-N-(3-丙基異噁唑-5-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}丙酰胺            | 406.1  | G  |
| 368 |      | N-(3-異丙基-1-甲基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}丙酰胺   | 419.2  | G  |
| 369 |      | N-(1,4-二甲基-3-苯基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}丙酰胺 | 467.2  | G  |
| 370 |      | N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}丙酰胺   | 434.1  | G  |
| 371 |      | 2-甲基-N-1-萘基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}丙酰胺                     | 423.1  | G  |
| 372 |      | 2-甲基-N-(5-甲基吡啶-2-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}丙酰胺             | 388.2  | G  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                                                   | 產率 [%] | 方法 |
|-----|------|----------------------------------------------------------------------|--------|----|
| 373 |      | 2-甲基-N-喹啉-3-基<br>-2-[[6-(三氟甲基)吡啶<br>-3-基]磺醯基}丙醯胺                     | 424.2  | G  |
| 374 |      | 2-甲基-N-[3-(三氟甲<br>基)苯基]-2-[[6-(三氟甲<br>基)吡啶-3-基]磺醯基}<br>丙醯胺           | 441.1  | G  |
| 375 |      | N-(4-第三-丁基苯<br>基)-2-甲基-2-[[6-(三氟<br>甲基)吡啶-3-基]磺醯<br>基}丙醯胺            | 429.2  | G  |
| 376 |      | 2-甲基-N-喹啉-2-基<br>-2-[[6-(三氟甲基)吡啶<br>-3-基]磺醯基}丙醯胺                     | 424.1  | G  |
| 377 |      | N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噻<br>唑-2-基]-2-甲基-2-[[6-<br>(三氟甲基)吡啶-3-基]<br>磺醯基}丙醯胺 | 490    | G  |
| 378 |      | 2-甲基-N-[4-(三氟甲<br>基)苯基]-2-[[6-(三氟甲<br>基)吡啶-3-基]磺醯基}<br>丙醯胺           | 441.1  | G  |
| 379 |      | N-異喹啉-3-基-2-甲基<br>-2-[[6-(三氟甲基)吡啶<br>-3-基]磺醯基}丙醯胺                    | 424.1  | G  |
| 380 |      | N-(3-第三-丁基苯<br>基)-2-甲基-2-[[6-(三氟<br>甲基)吡啶-3-基]磺醯<br>基}丙醯胺            | 429.2  | G  |

| #   | 分子結構                                                                                | 名稱                                                     | 產率 [%] | 方法 |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------|--------|----|
| 381 |    | 2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺基}-N-[4-(三氟甲基)-1,3-噻唑-2-基]丙酰胺 | 448    | G  |
| 382 |    | 2-[(4-氯苯基)磺基]-2-甲基-N-(4-甲基咪唑-2-基)丙酰胺                   | 354.1  | A  |
| 383 |    | 2-({2-[(4-氯苯基)磺基]-2-甲基丙酰基}胺基)-4-(三氟甲基)-1,3-噻唑-5-羧酸乙酯   | 485    | A  |
| 384 |   | 2-[(4-氯苯基)磺基]-N-[2-氟基-4-(三氟甲基)苯基]-2-甲基丙酰胺              | 424    | A  |
| 385 |  | N-(2-第三-丁基吡啶-4-基)-2-[(4-氯苯基)磺基]-2-甲基丙酰胺                | 395.1  | A  |
| 386 |  | 2-[(4-氯苯基)磺基]-N-[4-(4-氟苯基)-5-甲基-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基丙酰胺    | 453.1  | A  |
| 387 |  | 2-[(4-氯苯基)磺基]-N-[4-氟基-3-(三氟甲基)苯基]-2-甲基丙酰胺              | 424.1  | A  |
| 388 |  | 2-[(4-氯苯基)磺基]-N-(6-氟基-1,3-苯并噻唑-2-基)-2-甲基丙酰胺            | 413    | A  |

| #   | 分子結構 | 名稱                                                 | 產率 [%] | 方法 |
|-----|------|----------------------------------------------------|--------|----|
| 389 |      | 2-[(4-氯苯基)磺醯基]-N-[3-氟基-4-(三氟甲基)苯基]-2-甲基丙醯胺         | 424    | A  |
| 390 |      | N-(4-第三-丁基-5-氟基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-氯苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺 | 426.1  | A  |
| 391 |      | 2-[(4-氯苯基)磺醯基]-N-[4-(4-氟苯基)-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基丙醯胺    | 439    | A  |
| 392 |      | 2-[(4-氯苯基)磺醯基]-N-(4-氟基-1,3-苯并噻唑-2-基)-2-甲基丙醯胺       | 413    | A  |
| 393 |      | N-(3-第三-丁基異噁唑-5-基)-2-甲基-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基]丙醯胺 | 420.1  | G  |
| 394 |      | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(4-苯基-1,3-噻唑-2-基)丙醯胺    | 439    | B  |
| 395 |      | 2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-喹啉-3-基丙醯胺               | 406.9  | B  |
| 396 |      | N-(3-第二-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺          | 385.2  | A  |

| #   | 分子結構                                                                                | 名稱                                                  | 產率 [%] | 方法 |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------|--------|----|
| 397 |    | 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(3-異丙基-異呋唑-5-基)-2-甲基-丙醯胺             | 371.3  | A  |
| 398 |    | N-(5-第二-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺    | 398.4  | A  |
| 399 |    | 2-(6-一氮四環-1-基-吡啶-3-磺醯基)-N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺 | 423    | L  |
| 400 |   | 2-(6-一氮四環-1-基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺  | 429    | L  |
| 401 |  | 2-甲基-2-(6-甲基-吡啶-3-磺醯基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺        | 388    | G  |

### 生物學性質之評估

式I化合物之生物學性質係使用下文所述之檢測評估。

#### A. 人類 CB1 與 CB2 受體結合：

實驗方法：

CB2 細胞膜係購買且製自安定地以人類 CB2 受體 cDNA 轉染之 HEK293 細胞 (Perkin Elmer 生命與分析科學)。CB1 細胞膜係單離自安定地以人類 CB1 受體與 Gα16 cDNA 共轉染之 HEK 細胞。使細胞膜製劑結合至閃爍珠粒 (Ysi-聚-L-離胺酸 SPA 珠粒, GE 保健)，在含有 50mM Tris, pH 7.5, 2.5mM EDTA

5mM  $\text{MgCl}_2$ , 0.8% 不含脂肪酸之牛血清白蛋白之檢測緩衝液中，於室溫下歷經4小時。未結合之細胞膜係藉由在檢測緩衝液中洗滌而被移除。將細胞膜-珠粒混合物以每井15微克細胞膜(CB2)或每井2.5微克(CB1)及每井1毫克SPA珠粒之量，添加至96井檢測板中。將化合物以劑量-回應濃度添加至細胞膜-珠粒混合物中，該濃度範圍為 $1 \times 10^{-5} \text{M}$ 至 $1 \times 10^{-10} \text{M}$ ，具有最後0.25% DMSO。藉由添加 $^3\text{H}$ -CP55940 (Perkin Elmer 生命與分析科學)，在最後濃度為1.5nM (CB2)或2.5nM (CB1)下，引發競爭反應。反應物係在室溫下培養18小時，並在TopCount NXT板讀取器上讀取。總計與非專一性結合係於1.25uM Win 55212 (Sigma)不存在與存在下測定。對各化合物之 $\text{IC}_{50}$ 值係以抑制放射性標識配位體對受體之專一性結合達50%之化合物濃度，使用XLFit4.1四參數計算術模式計算。使用Cheng-Prusoff方程式，將 $\text{IC}_{50}$ 值轉化成抑制常數( $\text{K}_i$ )值。

#### **B. cAMP 合成之 CB2R 所媒介之調節：**

根據下述實驗方法，評估本發明化合物關於其CB2催動劑或逆催動劑活性。藉由上述結合檢測証實會結合至CB2，但其藉此檢測未証實顯示cAMP合成之CB2R所媒介調節之化合物，係被假設為CB2拮抗劑。

#### **實驗方法：**

將表現人類CB2R之CHO細胞(Euroscreen)，於每井5000個細胞之密度下，覆蓋在384井板中，並於37°C下培養過夜。在移除培養基後，將細胞以被稀釋於含有1mM IBMX, 0.25% BSA及10uM 弗斯科林(forskolin)之刺激緩衝劑中之待測化合

物處理。此檢測係在 37°C 下培養 30 分鐘。使細胞溶解，並使用 DiscoverX-XS cAMP 套件，按照製造者之擬案，度量 cAMP 濃度。在此環境中，催動劑將會降低弗斯科林所引致之 cAMP 生產，而逆催動劑將進一步增加弗斯科林所引致之 cAMP 生產。催動劑之 EC50 係按下述計算。藉由弗斯科林所產生 cAMP 之最大量，與藉由 1uM CP55940 所抑制 cAMP 之含量比較，係被定義為 100%。各試驗化合物之 EC50 值係以抑制弗斯科林所刺激 cAMP 合成之 50% 下之濃度測得。數據係使用四參數計算術模式分析 (XLfit 4.0 之模式 205)。

#### C. cAMP 合成之 CB1R 所媒介之調節：

根據下述實驗方法，評估本發明化合物關於其 CB1 催動劑或逆催動劑活性。藉由上述結合檢測証實會結合至 CB1，但藉此檢測未証實顯示 cAMP 合成之 CB1R 所媒介調節之化合物，係被假設為 CB1 拮抗劑。

##### 實驗方法：

將表現人類 CB1R 之 CHO 細胞 (Euroscreen)，於每井 5000 個細胞之密度下，覆蓋在 384 井板中，並於 37°C 下培養過夜。在移除培養基後，將細胞以被稀釋於含有 1 mM IBMX, 0.25% BSA 及 10uM 弗斯科林之刺激緩衝劑中之待測化合物處理。此檢測係在 37°C 下培養 30 分鐘。使細胞溶解，並使用 DiscoverX-XS cAMP 套件，按照製造者之擬案，度量 cAMP 濃度。在此環境中，催動劑將會降低弗斯科林所引致之 cAMP 生產，而逆催動劑將進一步增加弗斯科林所引致之 cAMP 生產。催動劑之 EC50 係按下述計算。藉由弗斯科林產生 cAMP

之最大量，與藉由 1uM CP55940 所抑制 cAMP 之含量比較，係被定義為 100%。各試驗化合物之 EC50 值係以抑制弗斯科林所刺激 cAMP 合成之 50% 下之濃度測得。數據係使用四參數計算術模式分析 (XLfit 4.0 之模式 205)。

#### 具有催動劑活性之化合物

經由利用上述檢測，發現下列化合物顯示催動劑活性，且因此特別良好地適合用於治療疼痛以及治療發炎。

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(吡啶-2-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-N-(5-甲基-噁唑-2-基)-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺  
2-甲基-N-(5-甲基-噁唑-2-基)-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-N-吡啶-3-基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-3-甲基-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-磺醯基)-丁醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-乙

## 醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(萘-2-磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-2-磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(萘-2-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-2-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(萘-2-磺醯基)-丙醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-異噁唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-甲基-噻唑-2-基)-丙醯胺

N-苯并噻唑-2-基-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-苯基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-乙基-吡啶-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(1-甲基-1H-苯并咪唑-2-基)-丙醯胺

N-苯并噁唑-2-基-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4,5-二甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-苯并[d]異呋唑-3-基-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(6-甲氧基-吡啶-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-吡啶-3-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4,5,6,7-四氫-苯并噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-噻吩-2-基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-異喹啉-3-基-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-苯氧基-吡啶-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異呋唑-3-基)-2-甲基-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-磺醯基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-苯基-[1,2,4]噻二唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-2-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-[1,3,4]噻二唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(3,4-二甲基-異呋唑-5-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(2,5-二甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-2H-[1,2,4]三唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-[1,2,4]噁二唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-[1,3,4]噁二唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-噁吩-2-基-噁唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-苯基-異噁唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-噁唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-六氫吡啶-1-基-甲基-噁唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-噁吩-2-基-異噁唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-[1,3,4]噁二唑-2-基)-

丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-吡啶-2-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(2-氯苯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-三氟甲基-苯基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(3-氯苯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-三氟甲基-苯基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-氯苯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-2-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[4-(4-氯苯基)-噁唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-苯基)-丙醯胺

N-(2-第三-丁基-苯基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-3-基-噁唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-2-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-4-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-環丙基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-  
甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-3-磺醯基)-丙  
醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-  
丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯  
基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙  
醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-  
丙醯胺

2-(4-溴-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙  
醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-2-磺醯基)-丙  
醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-異丙基-苯磺醯基)-2-甲基  
-丙醯胺

2-(4-第三-丁基-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-  
甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4,5-二氯-噻吩-2-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-甲烷磺醯基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,2-二甲基-吡-6-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(苯并[1,2,5]噻二唑-5-磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(5-氯-噻吩-2-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲氧基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氯基-4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(喹啉-8-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丁醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丁醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丁醯胺

3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丁醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丁醯胺

N-(2-氯苯基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-異噁唑-3-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-溴-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-溴-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-溴-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-苯基-噁唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-噻唑-2-基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-5-甲基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4,5-二甲基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丁醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-哌喃-4-羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-哌喃-4-羧酸(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-哌喃-4-羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-哌喃-4-羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-哌喃-4-羧酸(5-三氟甲基-吡

啉-2-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡啶-3-基)-2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2H-吡啶-3-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呋喃-4-羧酸(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡啶-3-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環己基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環戊基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺  
2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺  
2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-N-(4-三氟甲基-噁唑-2-基)-丙醯胺  
2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(4-三氟甲基-噁唑-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(1-氧基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噁唑-2-基]-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-[4-(4-氯苯基)-噁唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-乙基-4-苯基-噁唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(4-苯基-噁唑-2-基)-丙醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-

## 醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺酰基)-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺酰基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-N-(3-苯基-[1,2,4]噁二唑-5-基)-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-N-(5-氟基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(3-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(3-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-  
丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-  
丙醯胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-  
丙醯胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-  
丙醯胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-N-(5-乙基-4-苯基-噻唑-2-基)-2-甲  
基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-異丙基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-  
甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟基-4-甲基-苯磺  
醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-  
基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯  
基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-  
甲基-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙  
醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯

基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-N-[5-(四氫-哌喃-4-基)-噻唑-2-基]-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-氟基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-氟基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(6-氯-吡啶-3-磺酰基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(6-氯-吡啶-3-磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,5-二氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(2,5-二氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(2,5-二氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(2,5-二氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(2,5-二氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2,5-二氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-N-[4-(3,4-二氟-苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第二-丁基-吡啶-2-基)-2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-甲基-2-(6-嗎福啉-4-基-吡啶-3-磺酰基)-N-(5-三氟甲基-吡

啉-2-基)-丙 醯 胺

2-(4-氟-苯磺醯基)-N-[5-(4-氟苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙 醯 胺

N-[5-(3,4-二氟-苯基)-噻唑-2-基]-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙  
醯 胺

N-(4-第三-丁基-苯基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙 醯 胺

N-(3-第三-丁基-苯基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙 醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-1-基-丙 醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-2-基-丙 醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4,5-二苯基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙 醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-乙基-4-苯基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙 醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-環己基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙 醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-甲基-4-苯基-異噁唑-5-基)-丙  
醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-丙基-異噁唑-5-基)-丙 醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(2,4-二甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-甲  
基-丙 醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-甲基-3-苯基-異噁唑-5-基)-丙  
醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[3-(2,2-二甲基-丙基)-異噁唑-5-基]-2-甲  
基-丙 醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-乙基-3-甲基-異噁唑-5-基)-2-甲基-丙  
醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-異丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-  
丙 醯 胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

N-(5-環丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-N-異喹啉-3-基-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-3-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-2-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-1-基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-噁吩-2-基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-噁唑-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-1-基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-[3-(三氟甲基)苯基]丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-(4,5,6,7-四氫-1,3-苯并噁唑-2-基)丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噁唑-2-基]-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(1-甲基-3-苯基-1H-吡唑-5-基)-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

N-(3-第三-丁基-1-甲基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-[4-(三氟甲基)-1,3-噁唑-2-基]丙醯胺

N-(4-環丙基-1,3-噁唑-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙酰胺

N-(4-環己基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(3-丙基異噁唑-5-基)丙酰胺

N-(1,4-二甲基-3-苯基-1H-吡唑-5-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基-丙酰胺

N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-1,3,4-噻二唑-2-基)-2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[5-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙酰胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙酰胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基丙酰胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙酰胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(3-丙基異噁唑-5-基)丙

## 醯胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺醯基]-N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-甲基-丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-[5-(三氟甲基)吡啶-2-基]-丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]-丙醯胺

N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

N-1,3-苯并噁唑-2-基-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噁唑-2-基)-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-丙醯胺

N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噁唑-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]-丙醯胺

N-(4-環己基-1,3-噁唑-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-(3-丙基異噁唑-5-基)丙醯胺

N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-丙醯胺

N-1,3-苯并噁唑-2-基-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基丙

醯胺

N-(5-第三-丁基-1,3,4-噻二唑-2-基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(5-苯基-1,2,4-噻二唑-3-基)-丙醯胺

N-1,3-苯并呋唑-2-基-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-(4-環己基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(3-丙基異呋唑-5-基)丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-[3-(2,2-二甲基丙基)異呋唑-5-基]-2-甲基-丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-1-萘基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(5-甲基吡啶-2-基)丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-[3-(三氟甲基)苯基]丙醯胺

N-(4-第三-丁基苯基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-喹啉-2-基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基-丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[4-(三氟甲基)苯基]丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-異喹啉-3-基-2-甲基丙酰胺

N-(3-第三-丁基苯基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[4-(三氟甲基)-1,3-噻唑-2-基]-丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-(4-環丙基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基-丙酰胺

N-1,3-苯并噻唑-2-基-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}丙酰胺

2-甲基-N-(4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-1,3,4-噻二唑-2-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}-丙酰胺

N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}丙酰胺

2-甲基-N-(5-苯基-1,2,4-噻二唑-3-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}-丙酰胺

N-1,3-苯并呋唑-2-基-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}丙酰胺

2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-磺醯基}-丙醯胺

N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-磺醯基}-丙醯胺

2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-磺醯基}-丙醯胺

2-甲基-N-(3-丙基異噁唑-5-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-磺醯基}-丙醯胺

N-(3-異丙基-1-甲基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-磺醯基}-丙醯胺

N-(1,4-二甲基-3-苯基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-磺醯基}-丙醯胺

N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-磺醯基}-丙醯胺

2-甲基-N-1-萘基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-磺醯基}-丙醯胺

2-甲基-N-(5-甲基吡啶-2-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-磺醯基}-丙醯胺

2-甲基-N-喹啉-3-基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-磺醯基}-丙醯胺

2-甲基-N-[3-(三氟甲基)苯基]-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-磺醯基}-丙醯胺

N-(4-第三-丁基苯基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-磺醯基}-丙醯胺

2-甲基-N-喹啉-2-基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-磺醯基}-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]-磺酰基}丙酰胺

2-甲基-N-[4-(三氟甲基)苯基]-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}-丙酰胺

N-異喹啉-3-基-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}丙酰胺

N-(3-第三-丁基苯基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}丙酰胺

2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基}-N-[4-(三氟甲基)-1,3-噻唑-2-基]丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(4-甲基嘧啶-2-基)丙酰胺

2-({2-[(4-氯苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰基}胺基)-4-(三氟甲基)-1,3-噻唑-5-羧酸乙酯

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[2-氟基-4-(三氟甲基)苯基]-2-甲基丙酰胺

N-(2-第三-丁基吡啶-4-基)-2-[(4-氯苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[4-(4-氯苯基)-5-甲基-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基-丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[4-氟基-3-(三氟甲基)苯基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-(6-氟基-1,3-苯并噻唑-2-基)-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[3-氟基-4-(三氟甲基)苯基]-2-甲基丙酰胺

N-(4-第三-丁基-5-氟基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-氯苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯苯基)磺醯基]-N-[4-(4-氟苯基)-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯苯基)磺醯基]-N-(4-氟基-1,3-苯并噻唑-2-基)-2-甲基丙醯胺

N-(3-第三-丁基異噁唑-5-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}-丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(4-苯基-1,3-噻唑-2-基)丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-喹啉-3-基丙醯胺

N-(3-第二-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(3-異丙基-異噁唑-5-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第二-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(6-一氣四環-1-基-吡啶-3-磺醯基)-N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(6-一氣四環-1-基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-甲基-2-(6-甲基-吡啶-3-磺醯基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-甲基-2-(6-甲基-吡啶-3-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(6-甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

於上述化合物中，下列為較佳：

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-2-磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-2-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(苯-2-磺醯基)-丙醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙  
醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基  
-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯  
磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-  
甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-  
丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙  
醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-異噁唑-3-基)-丙醯胺

N-苯并噁唑-2-基-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-苯基-噁唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲  
基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-乙基-吡啶-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-苯并噁唑-2-基-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4,5-二甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4,5,6,7-四氫-苯并噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-噻吩-2-基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-異喹啉-3-基-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-苯氧基-吡啶-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-苯基-[1,2,4]噻二唑-5-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-[1,3,4]噻二唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-2H-[1,2,4]三唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-[1,2,4]噻二唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-[1,3,4]噻二唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-噻吩-2-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-苯基-異呋唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-吡啶-2-基-丙醯胺

- 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(2-氯苯基)-2-甲基-丙醯胺
- 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-三氟甲基-苯基)-丙醯胺
- 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(3-氯苯基)-2-甲基-丙醯胺
- 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-三氟甲基-苯基)-丙醯胺
- 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-氯苯基)-2-甲基-丙醯胺
- 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-2-基-丙醯胺
- 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺
- 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-苯基)-丙醯胺
- 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-3-基-噻唑-2-基)-丙醯胺
- 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-2-基-噻唑-2-基)-丙醯胺
- 2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-4-基-噻唑-2-基)-丙醯胺
- 2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-環丙基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺
- N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺
- N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-3-磺醯基)-丙醯胺
- N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺
- N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺
- N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺
- N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺
- 2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-

丙 醯 胺

2-(4-溴 - 苯 磺 醯 基 )-N-(5-第 三 - 丁 基 - 異 噁 唑 -3-基 )-2-甲 基 - 丙  
醯 胺

N-(5-第 三 - 丁 基 - 異 噁 唑 -3-基 )-2-甲 基 -2-(噻 吩 -2-磺 醯 基 )-丙  
醯 胺

N-(5-第 三 - 丁 基 - 異 噁 唑 -3-基 )-2-(4-異 丙 基 - 苯 磺 醯 基 )-2-甲 基  
- 丙 醯 胺

2-(4-第 三 - 丁 基 - 苯 磺 醯 基 )-N-(5-第 三 - 丁 基 - 異 噁 唑 -3-基 )-2-  
甲 基 - 丙 醯 胺

N-(5-第 三 - 丁 基 - 異 噁 唑 -3-基 )-2-(4-氯 基 -2-氟 - 苯 磺 醯 基 )-2-甲  
基 - 丙 醯 胺

N-(5-第 三 - 丁 基 - 異 噁 唑 -3-基 )-2-(4,5-二 氯 - 噻 吩 -2-磺 醯 基 )-2-  
甲 基 - 丙 醯 胺

N-(5-第 三 - 丁 基 - 異 噁 唑 -3-基 )-2-(4-氟 - 苯 磺 醯 基 )-2-甲 基 - 丙  
醯 胺

N-(5-第 三 - 丁 基 - 異 噁 唑 -3-基 )-2-(4-甲 烷 磺 醯 基 - 苯 磺 醯 基 )-2-  
甲 基 - 丙 醯 胺

2-(苯 并 [1,2,5]噻 二 唑 -5-磺 醯 基 )-N-(5-第 三 - 丁 基 - 異 噁 唑 -3-  
基 )-2-甲 基 - 丙 醯 胺

N-(5-第 三 - 丁 基 - 異 噁 唑 -3-基 )-2-(2,4-二 氟 - 苯 磺 醯 基 )-2-甲 基 -  
丙 醯 胺

N-(5-第 三 - 丁 基 - 異 噁 唑 -3-基 )-2-(5-氯 - 噻 吩 -2-磺 醯 基 )-2-甲 基 -  
丙 醯 胺

N-(5-第 三 - 丁 基 - 異 噁 唑 -3-基 )-2-甲 基 -2-(3-三 氟 甲 氧 基 - 苯 磺

醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氯基-4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(喹啉-8-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丁醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丁醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-溴-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氯基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-溴-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(3-氯基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-溴-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(3-氯基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(3-氯基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-

基)-丙醯胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-苯基-噁唑-2-基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-5-甲基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丁醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呋喃-4-羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呋喃-4-羧酸(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呋喃-4-羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-

## 丙 醯 胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呷喃-4-羧酸(6-三氟-甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環己基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環戊基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-乙基-4-苯基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(4-苯基-噁唑-2-基)-丙醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-

基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(3-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(3-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-N-(5-乙基-4-苯基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-N-(5-異丙基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2-氟基-4-甲基-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-N-[5-(四氫-呋喃-4-基)-噻唑-2-基]-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(6-氯-吡啶-3-磺酰基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(6-氯-吡啶-3-磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,5-二氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(2,5-二氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(2,5-二氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙

醯胺

2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙

醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙

醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[4-(3,4-二氟-苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙

醯胺

N-(5-第二-丁基-吡啶-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-甲基-2-(6-嗎福啉-4-基-吡啶-3-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氟-苯磺醯基)-N-[5-(4-氟苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺

N-[5-(3,4-二氟-苯基)-噻唑-2-基]-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-苯基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-苯基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-1-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-2-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4,5-二苯基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-乙基-4-苯基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-環己基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-丙基-異噁唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(2,4-二甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-甲

基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[3-(2,2-二甲基-丙基)-異噁唑-5-基]-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-異丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

N-(5-環丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-N-異喹啉-3-基-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-3-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-2-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-噻吩-2-基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-噻唑-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-噻吩-3-基-丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-(4,5,6,7-四氫-1,3-苯并噻唑-2-基)丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(1-甲基-3-苯基-1H-吡唑-5-基)-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

N-(3-第三-丁基-1-甲基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

N-(4-環丙基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

N-(4-第三-丁基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺

N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧基)磺醯基]-2-甲

基丙醯胺

2-[(4-甲氧苯基)磺醯基]-2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]

丙醯胺

N-(4-環己基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺醯基]-2-甲基

丙醯胺

2-[(4-甲氧苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(3-丙基異噁唑-5-基)丙醯胺

N-(1,4-二甲基-3-苯基-1H-吡唑-5-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺

N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-[(4-甲氧苯基)磺醯

基]-2-甲基丙醯胺

N-(5-第三-丁基-1,3,4-噻二唑-2-基)-2-[(2,4-二氟苯基)磺醯

基]-2-甲基丙醯胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-[5-(三氟甲基)吡啶-2-基]

丙醯胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]

丙醯胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺醯基]-N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-

甲基丙醯胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]

丙醯胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(3-丙基異噁唑-5-基)丙

醯胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺醯基]-N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-

基]-2-甲基丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-[5-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙醯胺

N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噁唑-2-基)-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噁唑-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙醯胺

N-(4-環己基-1,3-噁唑-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

N-1,3-苯并噁唑-2-基-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺

N-(5-第三-丁基-1,3,4-噁二唑-2-基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(5-苯基-1,2,4-噁二唑-3-基)丙醯胺

N-1,3-苯并呋唑-2-基-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基丙  
 磺胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噻  
 唑-2-基)丙磺胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-(4-環己基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲  
 基丙磺胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(3-丙基異呋唑-5-基)  
 丙磺胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-[3-(2,2-二甲基丙基)異呋唑  
 -5-基]-2-甲基丙磺胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-1-萘基丙磺胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(5-甲基吡啶-2-基)丙  
 磺胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[3-(三氟甲基)苯基]  
 丙磺胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-喹啉-2-基丙磺胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-  
 基]-2-甲基丙磺胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[4-(三氟甲基)苯基]  
 丙磺胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-異喹啉-3-基-2-甲基丙磺胺

N-(3-第三-丁基苯基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基丙  
 磺胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-(4-環丙基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲

基丙醯胺

N-1,3-苯并噻唑-2-基-2-甲基-2-{{6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-{{6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-(5-第三-丁基-1,3,4-噻二唑-2-基)-2-甲基-2-{{6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基-2-{{6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(5-苯基-1,2,4-噻二唑-3-基)-2-{{6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-1,3-苯并呋唑-2-基-2-甲基-2-{{6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-{{6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基-2-{{6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]-2-{{6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(3-丙基異呋唑-5-基)-2-{{6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-(3-異丙基-1-甲基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-{{6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-(1,4-二甲基-3-苯基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-{{6-(三氟甲基)

吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)

吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-1-萘基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(5-甲基吡啶-2-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-喹啉-3-基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-[3-(三氟甲基)苯基]-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-(4-第三-丁基苯基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-喹啉-2-基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噁唑-2-基]-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-[4-(三氟甲基)苯基]-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-異喹啉-3-基-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-(3-第三-丁基苯基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}-N-[4-(三氟甲基)-1,3-噁唑-2-基]丙醯胺

2-({2-[(4-氯苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯基}胺基)-4-(三氟甲基)-1,3-噁唑-5-羧酸乙酯

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[2-氟基-4-(三氟甲基)苯基]-2-甲基  
丙酰胺

N-(2-第三-丁基吡啶-4-基)-2-[(4-氯苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺  
2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[4-(4-氟苯基)-5-甲基-1,3-噻唑-2-  
基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[4-氟基-3-(三氟甲基)苯基]-2-甲基  
丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-(6-氟基-1,3-苯并噻唑-2-基)-2-甲基  
丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[3-氟基-4-(三氟甲基)苯基]-2-甲基  
丙酰胺

N-(4-第三-丁基-5-氟基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-氯苯基)磺酰  
基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[4-(4-氟苯基)-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基  
丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-(4-氟基-1,3-苯并噻唑-2-基)-2-甲基  
丙酰胺

N-(3-第三-丁基异噁唑-5-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-  
基]磺酰基}丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(4-苯基-1,3-噻唑-2-基)  
丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-喹啉-3-基丙酰胺

N-(3-第二-丁基-异噁唑-5-基)-2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙  
酰胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(3-異丙基-異噁唑-5-基)-2-甲基-丙醯胺  
 N-(5-第二-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲  
 基-丙醯胺

2-(6-一氣四圓-1-基-吡啶-3-磺醯基)-N-(4-第三-丁基-噻唑-2-  
 基)-2-甲基-丙醯胺

2-甲基-2-(6-甲基-吡啶-3-磺醯基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-  
 丙醯胺

2-甲基-2-(6-甲基-吡啶-3-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-  
 丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(6-甲基-吡啶-3-磺醯  
 基)-丙醯胺

於上述化合物中，下列為最佳：

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯  
 基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙  
 醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙  
 醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯  
 基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-2-磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺酰基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺酰基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-2-磺酰基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(萘-2-磺酰基)-丙酰胺

1-(4-三氟甲基-苯磺酰基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-酰胺

2-苯磺酰基-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙酰胺

2-苯磺酰基-N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺酰基)-丙酰胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺酰基)-丙酰胺

1-(4-氯-苯磺酰基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-酰胺

1-(4-氯-苯磺酰基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-酰胺

1-(4-氯-苯磺酰基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-酰胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3,4-二氯-苯磺酰基)-2-甲基-

## 丙 醯 胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙  
醯 胺

2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-  
甲 基-丙 醯 胺

N-(3-第三-丁基-異呋唑-5-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙  
醯 胺

N-(5-第三-丁基-異呋唑-3-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基  
-丙 醯 胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯  
磺醯基)-丙 醯 胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-  
甲 基-丙 醯 胺

N-(5-第三-丁基-異呋唑-3-基)-2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-  
丙 醯 胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙  
醯 胺

N-苯并噻唑-2-基-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-苯基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲  
基-丙 醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-乙基-吡啶-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-苯并呋唑-2-基-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4,5-二甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4,5,6,7-四氫-苯并噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-噻吩-2-基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-異喹啉-3-基-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-苯基-[1,2,4]噻二唑-5-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-[1,3,4]噻二唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-2H-[1,2,4]三唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-[1,2,4]噻二唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-噻吩-2-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-苯基-異呋唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-三氟甲基-苯基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-氯苯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-2-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-苯基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-4-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-環丙基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-溴-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-2-磺醯基)-丙醯胺

2-(4-第三-丁基-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-

甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4,5-二氯-噻吩-2-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-甲烷磺醯基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(苯并[1,2,5]噻二唑-5-磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(5-氯-噻吩-2-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氯基-4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(喹啉-8-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丁醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-溴-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲

基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-溴-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-溴-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-5-甲基-噁唑-2-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丁醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-吡喃-4-羧酸(5-第三-丁基-異

噁唑-3-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呋喃-4-羧酸(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呋喃-4-羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環己基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環戊基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺  
2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噁唑-2-基]-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-[4-(4-氯苯基)-噁唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-乙基-4-苯基-噁唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(4-苯基-噁唑-2-基)-丙醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-

磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(3-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺  
 N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(3-氟-苯磺酰基)-2-甲基-  
 丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙  
 酰胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲  
 基-丙酰胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-  
 丙酰胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-  
 丙酰胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-  
 丙酰胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-  
 丙酰胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-N-(5-乙基-4-苯基-噻唑-2-基)-2-甲  
 基-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-N-(5-異丙基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2-氟基-4-甲基-苯磺酰基)-2-  
 甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟基-4-甲基-苯磺  
 酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(2-氟基-4-甲基-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-  
 基)-丙酰胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-氟-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-氟-吡啶-3-磺醯

基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[4-(3,4-二氟-苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第二-丁基-吡啶-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-甲基-2-(6-嗎福啉-4-基-吡啶-3-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-苯基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-1-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-2-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4,5-二苯基-噁唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-乙基-4-苯基-噁唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-環己基-噁唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-丙基-異噁唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(2,4-二甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[3-(2,2-二甲基-丙基)-異噁唑-5-基]-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-異丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噁唑-2-基]-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-3-基-噁唑-2-基)-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-2-基-噁唑-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噁唑-2-基]-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-噁吩-2-基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-甲基-2-{{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-(4,5,6,7-四氫-1,3-苯并噁唑-2-基)丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噁唑-2-基]-2-甲基-2-{{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

N-(4-第三-丁基-1,3-噁唑-2-基)-2-[(4-甲氧基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺

N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噁唑-2-基)-2-[(4-甲氧基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺

2-[(4-甲氧基)磺醯基]-2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙醯胺

N-(4-環己基-1,3-噁唑-2-基)-2-[(4-甲氧基)磺醯基]-2-甲基

丙 醯 胺

N-[3-(2,2-二 甲 基 丙 基)異 呔 啞 -5-基]-2-[(4-甲 氧 苯 基)磺 醯 基]-2-甲 基 丙 醯 胺

N-(5-第 三 -丁 基 -1,3,4-噻 二 啞 -2-基)-2-[(2,4-二 氟 苯 基)磺 醯 基]-2-甲 基 丙 醯 胺

2-[(2,4-二 氟 苯 基)磺 醯 基]-2-甲 基 -N-[5-(三 氟 甲 基)吡 啞 -2-基] 丙 醯 胺

2-[(2,4-二 氟 苯 基)磺 醯 基]-2-甲 基 -N-[4-(三 氟 甲 基)吡 啞 -2-基] 丙 醯 胺

2-[(2,4-二 氟 苯 基)磺 醯 基]-2-甲 基 -N-[6-(三 氟 甲 基)吡 啞 -2-基] 丙 醯 胺

2-[(2,4-二 氟 苯 基)磺 醯 基]-2-甲 基 -N-(3-丙 基 異 呔 啞 -5-基)丙 醯 胺

2-[(2,4-二 氟 苯 基)磺 醯 基]-N-[3-(2,2-二 甲 基 丙 基)異 呔 啞 -5-基]-2-甲 基 丙 醯 胺

2-甲 基 -2-{[4-(甲 磺 醯 基)苯 基]磺 醯 基}-N-[5-(三 氟 甲 基)吡 啞 -2-基]丙 醯 胺

N-(4-乙 基 吡 啞 -2-基)-2-甲 基 -2-{[4-(甲 磺 醯 基)苯 基]磺 醯 基} 丙 醯 胺

2-甲 基 -N-(5-甲 基 -4-苯 基 -1,3-噻 啞 -2-基)-2-{[4-(甲 磺 醯 基)苯 基]磺 醯 基}丙 醯 胺

N-(5-乙 基 -4-苯 基 -1,3-噻 啞 -2-基)-2-甲 基 -2-{[4-(甲 磺 醯 基)苯 基]磺 醯 基}丙 醯 胺

2-甲 基 -2-{[4-(甲 磺 醯 基)苯 基]磺 醯 基}-N-[6-(三 氟 甲 基)吡 啞

-2-基]丙醯胺

N-(4-環己基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基-2-[[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基]丙醯胺

N-1,3-苯并噻唑-2-基-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺

N-(5-第三-丁基-1,3,4-噻二唑-2-基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(5-苯基-1,2,4-噻二唑-3-基)丙醯胺

N-1,3-苯并呋唑-2-基-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-(4-環己基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(3-丙基異呋唑-5-基)丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-[3-(2,2-二甲基丙基)異呋唑-5-基]-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-1-萘基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(5-甲基吡啶-2-基)丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[3-(三氟甲基)苯基]  
丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-喹啉-2-基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[4-(三氟甲基)苯基]  
丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-異喹啉-3-基-2-甲基丙酰胺

N-(3-第三-丁基苯基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基丙  
酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-(4-環丙基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲  
基丙酰胺

N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰  
基}丙酰胺

2-甲基-N-(5-苯基-1,2,4-噻二唑-3-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-  
基]磺酰基}丙酰胺

2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡  
啶-3-基]磺酰基}丙酰胺

N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡  
啶-3-基]磺酰基}丙酰胺

2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-  
基]磺酰基}丙酰胺

2-甲基-N-(3-丙基異噁唑-5-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺  
酰基}丙酰胺

N-(3-異丙基-1-甲基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-(1,4-二甲基-3-苯基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(5-甲基吡啶-2-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-[3-(三氟甲基)苯基]-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-(4-第三-丁基苯基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-喹啉-2-基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噁唑-2-基]-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-[4-(三氟甲基)苯基]-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-(3-第三-丁基苯基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-({2-[(4-氯苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯基}胺基)-4-(三氟甲基)-1,3-噁唑-5-羧酸乙酯

2-[(4-氯苯基)磺醯基]-N-[2-氟基-4-(三氟甲基)苯基]-2-甲基丙醯胺

N-(2-第三-丁基吡啶-4-基)-2-[(4-氯苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[4-(4-氯苯基)-5-甲基-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[4-氟基-3-(三氟甲基)苯基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-(6-氟基-1,3-苯并噻唑-2-基)-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[3-氟基-4-(三氟甲基)苯基]-2-甲基丙酰胺

N-(4-第三-丁基-5-氟基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-氯苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-(4-氟基-1,3-苯并噻唑-2-基)-2-甲基丙酰胺

N-(3-第三-丁基異噁唑-5-基)-2-甲基-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺酰基]丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(4-苯基-1,3-噻唑-2-基)丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-喹啉-3-基丙酰胺

N-(3-第二-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-N-(3-異丙基-異噁唑-5-基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第二-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(6-一 氮 四 環 -1-基 -吡 啶 -3-磺 醯 基 )-N-(4-第 三 -丁 基 -噻 唑 -2-基 )-2-甲 基 -丙 醯 胺

### 治療用途

正如可藉由上述檢測所証實，本發明化合物可使用於調節CB2受體功能。由於此項事實，故此等化合物具有治療藉由CB2受體功能所媒介或將得利於調節CB2受體功能之疾病狀態與症狀之治療用途。

由於本發明化合物會調節CB2受體功能，故其具有極有用之消炎與免疫壓抑活性，且其可以藥物被使用於病患中，特別是以如下文所提出之醫藥組合物形式，以治療疾病狀態與症狀。

根據本發明之催動劑、拮抗劑及逆催動劑化合物可以藥物使用於病患中，以治療下列伴隨著炎性過程之疾病狀態或適應徵：

- (i) 肺病：例如氣喘、枝氣管炎、過敏性鼻炎、氣腫、成人呼吸困難徵候簇(ARDS)、養鴿者疾病、農民肺、慢性阻塞肺病(COPD)；
- (ii) 風濕疾病或自身免疫疾病或肌骨疾病：所有形式之風濕疾病，尤其是風濕性關節炎、急性風濕熱及多肌痛風濕病；反應性關節炎；風濕柔軟組織疾病；其他起源之炎性柔軟組織疾病；變性關節疾病中之關節炎病徵(關節病)；腱炎、黏液囊炎、骨關節炎、外傷性關節炎；任何起源之成膠質病，例如系統性紅斑狼瘡、硬皮病、多肌炎、皮膚炎、Sjogren徵候簇、

Still 氏病、Felty 徵候簇；及骨質疏鬆症，以及其他骨質耗損疾病；

- (iii) 過敏性疾病：所有形式之過敏性反應，例如血管神經性水腫、乾草熱、昆蟲咬傷，對藥物、血液衍生物、對比劑等之過敏性反應，過敏性休克(過敏性反應)、蕁麻疹、血管神經性水腫及接觸性皮膚炎；
- (iv) 血管疾病：節結性全動脈炎、節結性多動脈炎、節結性動脈周圍炎、顳肌動脈炎、Wegner 肉芽腫病、巨細胞關節炎、動脈粥瘤硬化、再灌注損傷及結節性紅斑；
- (v) 皮膚病：例如皮膚炎、牛皮癬；晒斑、灼傷、濕疹；
- (vi) 腎病：例如腎病徵候簇；及所有類型之腎炎，例如絲球體性腎炎；
- (vii) 肝病：例如急性肝細胞崩解；各種起源之急性肝炎，例如病毒、毒性、藥物所引致者；及慢性攻擊性及/或慢性間歇性肝炎；
- (viii) 胃腸疾病：例如炎性腸疾病、刺激性腸徵候簇、區域性腸炎(克隆氏病)、潰瘍性結腸炎；胃炎；口瘡潰瘍、腹腔疾病、區域性迴腸炎、胃與食管回流疾病；
- (ix) 神經保護：例如在中風後之神經變性治療上；心動停止；肺旁通；外傷性腦部傷害；脊髓損傷或其類似情況；
- (x) 眼睛疾病：過敏性角膜炎、葡萄膜炎或虹膜炎；結

合膜炎；瞼炎；視神經神經炎；脈絡膜炎；青光眼及共感性眼炎；

- (xi) 耳部、鼻子及咽喉(ENT)區域之疾病：例如耳鳴；過敏性鼻炎或乾草熱；外耳炎；因接觸性濕疹、感染等所造成者；及中耳炎；
- (xii) 神經病學疾病：例如腦水腫，特別是腫瘤相關之腦水腫；多發性硬化；急性腦脊髓炎；腦膜炎；急性脊髓損傷；創傷；癡呆症，特別是變性癡呆症(包括老年癡呆症，阿耳滋海默氏病；巴金森氏病及Creutzfeldt-Jacob疾病；亨丁頓氏舞蹈症，Pick氏病；運動神經元疾病)、血管癡呆症(包括多梗塞癡呆症)以及與顱內空間佔據損傷有關聯之癡呆症；感染及相關症狀(包括HIV感染)；Guillain-Barre徵候簇；重症肌無力、中風；及各種形式之猝發，例如點頭痙攣；
- (xiii) 血液疾病：後天溶血性貧血；再生障礙性貧血及原發性血小板減少症；
- (xiv) 腫瘤疾病：急性淋巴白血病；霍奇金(Hodgkin)氏疾病、惡性淋巴瘤；淋巴肉芽腫病；淋巴肉瘤；固體惡性腫瘤；外延性轉移，
- (xv) 內分泌疾病：內分泌眼病；內分泌眼眶病；甲狀腺毒危象；de Quervain氏甲狀腺炎；橋本氏甲狀腺炎；Basedow氏病；肉芽腫甲狀腺炎；淋巴瘤性甲狀腺腫；及Grave氏病；第I型糖尿病(胰島素依賴性糖尿病)；
- (xvi) 器官與組織移植及移植物-對-宿主疾病；

- (xvii) 休克之嚴重狀態，例如敗血性休克、過敏性休克及系統炎症反應徵候簇(SIRS)；
- (xviii) 神經病原性疼痛：例如多發性硬化疼痛、糖尿病之神經病、非疱疹神經痛、三叉神經痛、由於身體外傷所造成之疼痛、截肢、癌症、手術後疼痛，
- (xix) 炎症與慢性疼痛，例如與風濕性關節炎、骨關節炎、幼年關節炎、脊椎炎、痛風性關節炎、牛皮癬關節炎有關聯之疼痛，肌骨疼痛、纖維肌痛、下背與頸部疼痛、扭傷與勞傷、交感神經上保持之疼痛、肌炎、與偏頭痛有關聯之疼痛、痛經、頭痛、牙痛，流行性感冒及其他病毒感染，譬如一般感冒、風濕熱，與功能性腸疾病有關聯之疼痛，譬如非潰瘍性消化不良、非心臟病胸痛及刺激性腸徵候簇，與心肌絕血有關聯之疼痛，
- (xx) 各種其他疾病狀態或症狀，包括經皮經管腔冠狀血管造形術後之再狹窄、急性與慢性疼痛、動脈粥瘤硬化、再灌注損傷、鬱血性心衰竭、心肌梗塞、熱損傷、創傷續發之多重器官傷害、壞死性小腸結腸炎及血液透析、白血球電泳及粒性血球輸血有關聯之徵候簇，肉狀瘤病、齒齦炎、發熱。

關於上述疾病與症狀之治療，治療上有效劑量通常係在每劑量約 0.01 毫克至約 100 毫克/公斤體重範圍內之本發明化合物；較佳為每劑量約 0.1 毫克至約 20 毫克/公斤體重。例如，對於投予 70 公斤人們，劑量範圍為每劑量約 0.7 毫克

至約7000毫克之本發明化合物，較佳為每劑量約7.0毫克至約1400毫克。可能需要某種程度之例行劑量最佳化，以決定最適宜服藥含量與型式。活性成份可一天投予1至6次。

### 一般投藥與醫藥組合物

當作為醫藥使用時，本發明化合物典型上係以醫藥組合物之形式投藥。此種組合物可使用醫藥技藝上習知之程序製備，且包含至少一種本發明化合物。本發明化合物亦可單獨投藥，或併用佐劑，該佐劑係提高本發明化合物之安定性，在某些具體實施例中幫助含有彼等之醫藥組合物投藥，提供經增加之溶解或分散、經增加之抑制活性，提供附加療法等。根據本發明之化合物可獨自使用，或搭配根據本發明之其他活性物質，視情況亦搭配其他具藥理學活性之物質。一般而言，本發明化合物係以治療上或藥學上有效量投藥，但對於診斷或其他目的，可以較低量投藥。

呈純形式或在適當醫藥組合物中之本發明化合物，其投藥可使用任何所接受之醫藥組合物投藥模式進行。因此，投藥可為例如以經口方式、面頰方式(例如舌下方式)、經鼻方式、非經腸方式、局部方式、經皮方式、陰道方式或直腸方式，呈固體、半固體、經凍乾粉末或液體劑型形式，例如片劑、栓劑、丸劑、軟彈性與硬明膠膠囊、粉末、溶液、懸浮液或氣溶膠或其類似物，較佳係在適合精確劑量之簡易投藥之單位劑型中。醫藥組合物將一般性地包含習用醫藥載劑或賦形劑，及作為活性劑之本發明化合物，且此外，可包含其他醫療劑、藥劑、載劑、佐劑、稀釋劑、

媒劑或其組合。此種藥學上可接受之賦形劑、載劑或添加劑，以及製造醫藥組合物供各種模式或投藥用之方法，係為熟諳此藝者所習知。此項技藝之目前狀態，係例如由 *Remington：製藥科學與實務*，第 20 版，A. Gennaro（編著），Lippincott Williams & Wilkins, 2000；*醫藥添加劑手冊*，Michael & Irene Ash（編著），Gower, 1995；*醫藥賦形劑手冊*，A.H. Kibbe（編著），美國醫藥協會，2000；H.C. Ansel 與 N.G. Popovich, *醫藥劑型與藥物傳輸系統*，第 5 版，Lea 與 Febiger, 1990 加以証實，其每一件均以其全文併於本文供參考，以更良好地說明此項技藝之目前狀態。

正如熟諳此藝者所預期者，被利用於特定醫藥配方中之本發明化合物形式係經選擇（例如鹽），其具有配方欲有效所需要之適當物理特性（例如水溶解度）。

適合面頰（舌下）投藥之醫藥組合物，包括錠劑，其包含本發明化合物在矯味基料中，經常為蔗糖與阿拉伯膠，或西黃蓍樹膠，與軟錠劑，其包含化合物在惰性基料中，譬如明膠與甘油或蔗糖與阿拉伯膠。

適合非經腸投藥之醫藥組合物，包括本發明化合物之無菌含水製劑。此等製劑較佳係以靜脈內方式投藥，惟投藥亦可藉由皮下、肌內或皮內注射達成。可注射醫藥配方通常係以可注射無菌鹽水、磷酸鹽緩衝之鹽水、油質懸浮液或此項技藝中已知之其他可注射載劑為基料，且一般係使其無菌且與血液等滲。因此，可注射醫藥配方可以無毒性非經腸上可接受之稀釋劑或溶劑中之無菌可注射溶液或懸

浮液提供，包括 1,3-丁二醇、水、林格氏溶液、等滲氯化鈉溶液，不揮發油，譬如合成甘油單酯或二酯，脂肪酸類，譬如油酸等。此種可注射醫藥配方係根據已知技藝，使用適當分散或固定劑與懸浮劑調配。可注射組合物一般將含有 0.1 至 5% w/w 之本發明化合物。

供化合物口服投藥之固體劑型，包括膠囊、片劑、丸劑、粉末及顆粒。對於此種口服投藥，係將含本發明化合物之藥學上可接受組合物藉由摻入任何通常採用之賦形劑而形成，該賦形劑例如醫藥級甘露醇、乳糖、澱粉、預凝膠化澱粉、硬脂酸鎂、糖精鈉、滑石粉、纖維素醚衍生物、葡萄糖、明膠、蔗糖、檸檬酸鹽、沒食子酸丙酯等。此種固體醫藥配方可包括如此項技藝中所習知之配方，以藉任何數目之機制，提供藥物之長期或持續傳輸至胃腸道，其包括但不限於以小腸之改變中 pH 值為基礎自劑型之 pH 值敏感性釋出，片劑或膠囊之緩慢侵蝕，以配方之物理性質為基礎在胃中之滯留，劑型對腸道黏膜內襯之生物黏著性，或活性藥物自劑型之酵素釋出。

供化合物口服投藥之液體劑型，包括乳化液、微乳化液、溶液、懸浮液、糖漿及酏劑，視情況含有醫藥佐劑在載劑中，例如水、鹽水、右旋糖水溶液、甘油、乙醇等。此等組合物亦可含有其他佐劑，譬如潤濕、乳化、懸浮、增甜、矯味及芳香劑。

化合物之局部劑型，包括軟膏、糊劑、乳膏、洗劑、凝膠、粉末、溶液、噴霧劑、吸藥、眼用軟膏、眼睛或耳部

滴藥、浸漬敷料及氣溶膠，且可含有適當習用添加劑，譬如防腐劑、幫助藥物穿透之溶劑及在軟膏與乳膏中之軟化劑。局部塗敷可為每天一次或超過一次，依常用醫療考量而定。再者，本發明之較佳化合物可以鼻內形式，經由適當鼻內媒劑之局部使用投藥。配方亦可含有可相容習用載劑，譬如乳膏或軟膏基料，及乙醇或油醇，供洗劑用。此種載劑可以配方之約1%至高達約98%存在，其更通常係形成高達配方之約80%。

經皮投藥亦可行。適合經皮投藥之醫藥組合物，可以適合保持與接受者之表皮層密切接觸歷經長期時間之不連續貼藥呈現。為以經皮傳輸系統形式投藥，劑量投藥在整個劑量服法中當然是連續的，而非間歇性的。此種貼藥適當地含有本發明之化合物在視情況經緩衝之水溶液中，溶解及/或分散於黏著劑中，或分散於聚合體中。活性化合物之適當濃度為約1%至35%，較佳為約3%至15%。

對於藉吸入投藥而言，本發明化合物可合宜地以氣溶膠噴霧形式，自泵送噴霧劑裝置傳輸，不需要推進劑氣體，或自加壓包裝或霧化器傳輸，並利用適當推進劑，例如二氯二氟甲烷、三氯氟甲烷、二氯四氟乙烷、四氟基乙烷、七氟基丙烷、二氧化碳或其他適當氣體。於任何情況下，氣溶膠噴霧劑量單位可藉由提供閥而測定，該閥係傳輸經計量之量，以致使所形成之經計量之劑量吸入器(MDI)係以可重現性與受控方式，用以投予本發明化合物。此種吸入器、霧化罐或霧化器裝置係為先前技藝中所已知，例如在

PCT 國際公報 WO 97/12687 (特別是其圖 6, 其係為市售 RESPIMAT<sup>®</sup> 霧化罐之基礎); WO 94/07607; WO 97/12683; 及 WO 97/20590 中, 其係據此給予參考, 且其每一件均以其全文併於本文供參考。

直腸投藥可利用單位劑量栓劑達成, 其中化合物係與低熔點水溶性或不溶性固體互混, 譬如脂肪類、可可豆脂、甘油化明膠、氫化植物油、各種分子量之聚乙二醇之混合物或聚乙二醇之脂肪酸酯類或其類似物。活性化合物通常為較少成份, 經常為約 0.05 至 10 重量%, 而其餘部份為基底成份。

在所有上述醫藥組合物中, 本發明化合物係與可接受之載劑或賦形劑一起調配。所使用之載劑或賦形劑當然必須是可接受的, 其意義是可與組合物之其他成份相容, 且不得對病患有害。載劑或賦形劑可為固體或液體或兩者, 且較佳係與本發明化合物調配成單位劑量組合物, 例如片劑, 其可含有 0.05% 至 95% 重量比之活性化合物。此種載劑或賦形劑包括惰性填料或稀釋劑、黏合劑、潤滑劑、崩解劑、溶液阻滯劑、吸收加速劑、吸收劑及著色劑。適當黏合劑包括澱粉、明膠, 天然糖類, 譬如葡萄糖或  $\beta$ -乳糖、玉米增甜劑, 天然與合成膠質, 譬如阿拉伯膠、西黃蓍樹膠或海藻酸鈉、羧甲基纖維素、聚乙二醇、蠟類等。潤滑劑, 包括油酸鈉、硬脂酸鈉、硬脂酸鎂、苯甲酸鈉、醋酸鈉、氯化鈉等。崩解劑包括澱粉、甲基纖維素、瓊脂、膨土、三仙膠(xanthan gum)等。

藥學上可接受之載劑與賦形劑係涵蓋所有前述添加劑及其類似物。

#### 醫藥配方之實例

| A. 片劑     |           |
|-----------|-----------|
| 成份        | 每片劑之量(毫克) |
| 活性物質      | 100       |
| 乳糖        | 140       |
| 玉米澱粉      | 240       |
| 聚乙烯基四氫吡咯酮 | 15        |
| 硬脂酸鎂      | 5         |
| 總計        | 500       |

將微細研磨過之活性物質、乳糖及一部份玉米澱粉混合在一起。將混合物篩濾，然後以聚乙烯基四氫吡咯酮在水中之溶液濕潤，捏合，濕式造粒，及乾燥。將此等顆粒、其餘玉米澱粉及硬脂酸鎂篩濾，並混合在一起。將混合物壓縮，以製造適當形狀與大小之片劑。

| B. 片劑     |           |
|-----------|-----------|
| 成份        | 每片劑之量(毫克) |
| 活性物質      | 80        |
| 乳糖        | 55        |
| 玉米澱粉      | 190       |
| 聚乙烯基四氫吡咯酮 | 15        |
| 硬脂酸鎂      | 2         |
| 微晶性纖維素    | 35        |
| 羧甲基澱粉鈉    | 23        |
| 總計        | 400       |

將微細研磨過之活性物質、一部份玉米澱粉、乳糖、微

晶性纖維素及聚乙烷基四氫吡咯酮混合在一起，將混合物篩濾，並與其餘玉米澱粉和水一起作業，以形成顆粒，使其乾燥與篩濾。添加羧甲基澱粉鈉與硬脂酸鎂，並混合在一起，及將混合物壓縮，以形成適當大小之片劑。

| C. 塗層片劑   |           |
|-----------|-----------|
| 成份        | 每片劑之量(毫克) |
| 活性物質      | 5         |
| 乳糖        | 30        |
| 玉米澱粉      | 41.5      |
| 聚乙烷基四氫吡咯酮 | 3         |
| 硬脂酸鎂      | 0.5       |
| 總計        | 90        |

將活性物質、玉米澱粉、乳糖及聚乙烷基四氫吡咯酮充分混合，並以水濕潤。將潮濕團塊推送經過具有1毫米網目大小之篩網，於約45°C下乾燥，然後使顆粒通過相同篩網。將硬脂酸鎂混入之後，在製錠機中壓縮具有直徑6毫米之凸片劑核芯。將經如此製成之片劑核芯以已知方式，使用基本上含糖與滑石之覆蓋物塗覆。將最後完成之塗層片劑以蠟拋光。

| D. 膠囊 |           |
|-------|-----------|
| 成份    | 每膠囊之量(毫克) |
| 活性物質  | 50        |
| 玉米澱粉  | 268.5     |
| 硬脂酸鎂  | 1.5       |
| 總計    | 320       |

將物質與玉米澱粉混合，並以水濕潤。將潮濕團塊篩濾，

並乾燥。將乾燥顆粒篩濾，並與硬脂酸鎂混合。將最後完成之混合物裝填至1號硬明膠膠囊中。

| E. 安瓿瓶溶液 |        |
|----------|--------|
| 成份       | 每安瓿瓶之量 |
| 活性物質     | 50 毫克  |
| 氯化鈉      | 50 毫克  |
| 注射用水     | 5 毫升   |

使活性物質溶於水中，在其自有之pH下，或視情況在pH 5.5至6.5下，並添加氯化鈉，使其成為等滲性。將所獲得之溶液過濾，除去熱原，並將濾液在無菌條件下轉移至安瓿瓶中，然後殺菌，並藉由熔融密封。此等安瓿瓶含有5毫克、25毫克及50毫克活性物質。

| F. 栓劑 |           |
|-------|-----------|
| 成份    | 每栓劑之量(毫克) |
| 活性物質  | 50        |
| 固體脂肪  | 1650      |
| 總計    | 1700      |

使硬質脂肪熔解。於40℃下，使經磨碎之活性物質均勻地分散在其中。使混合物冷卻至38℃，並倒入稍微急冷之栓劑模具中。

| G. 計量氣溶膠                |       |
|-------------------------|-------|
| 成份                      | 量     |
| 活性物質                    | 0.005 |
| 三油酸花楸聚糖酯                | 0.1   |
| 單氟基三氯甲烷與<br>二氟二氯甲烷(2:3) | 至 100 |

將此懸浮液轉移至具有計量閥之習用氣溶膠容器中。每

次噴霧較佳係傳輸50微升懸浮液。若需要，活性物質亦可以較高劑量(例如0.02重量%)計量加入。

| H. 吸入用粉末 |         |
|----------|---------|
| 成份       | 量       |
| 活性物質     | 1.0 毫克  |
| 乳糖單水合物   | 至 25 毫克 |

| I. 吸入用粉末 |         |
|----------|---------|
| 成份       | 量       |
| 活性物質     | 2.0 毫克  |
| 乳糖單水合物   | 至 25 毫克 |

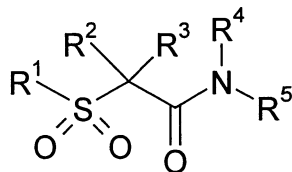
| J. 吸入用粉末 |        |
|----------|--------|
| 成份       | 量      |
| 活性物質     | 1.0 毫克 |
| 乳糖單水合物   | 至 5 毫克 |

| K. 吸入用粉末 |        |
|----------|--------|
| 成份       | 量      |
| 活性物質     | 2.0 毫克 |
| 乳糖單水合物   | 至 5 毫克 |

於實例H、I、J及K中，吸入用粉末係以常用方式，藉由將個別成份混合在一起而製成。

## 五、中文發明摘要：

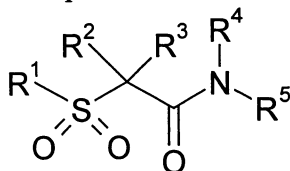
本發明係揭示式(I)化合物



根據本發明之化合物會結合至且係為 CB2 受體之催動劑、拮抗劑或逆催動劑，並可用於治療發炎。作為催動劑之化合物另外可用於治療疼痛。

## 六、英文發明摘要：

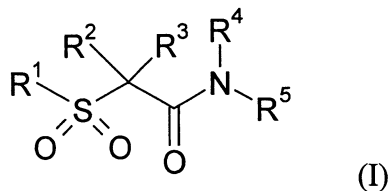
Compounds of formula (I)



are disclosed. Compounds according to the invention bind to and are agonists, antagonists or inverse agonists of the CB2 receptor, and are useful for treating inflammation. Those compounds which are agonists are additionally useful for treating pain.

## 十、申請專利範圍：

### 1. 一種下式化合物



其中：

$R^1$  為芳基或雜芳基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自  $C_1$ - $C_6$  烷基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、 $C_1$ - $C_6$  環烷基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、 $C_1$ - $C_6$  烷硫基、 $C_1$ - $C_6$  烷基磺醯基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧羰基、 $C_1$ - $C_6$  烷胺基、 $C_3$ - $C_6$  環烷胺基、 $C_1$ - $C_6$  二烷胺基、 $C_1$ - $C_6$  烷胺基羰基、醯基胺基、 $C_1$ - $C_6$  二烷胺基羰基、羥基、鹵素、氰基、硝基、酮基、雜環基、芳基及雜芳基；

$R^2$  與  $R^3$  係獨立為氫或  $C_1$ - $C_6$  烷基；或  $R^2$  與  $R^3$  和彼等所連接之碳一起，以形成3-至6-員環烷基或雜環；

$R^4$  為氫或甲基；

$R^5$  為芳基或雜芳基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自  $C_1$ - $C_6$  烷基(其係視情況被1至3個鹵原子或被雜環基取代)、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、 $C_1$ - $C_6$  環烷基、雜環基、苯氧基、鹵素、氰基、二甲胺基烷基、苯基(其係視情況被1至2個鹵原子或視情況被鹵素取代之  $C_1$ - $C_4$  烷基取代)、噻吩基(其係視情況被1至2個鹵原子或視情況被鹵素取代之  $C_1$ - $C_4$  烷基取代)及吡啶基(其係視情況被1至2個視情況被鹵素取代之  $C_1$ - $C_4$  烷基取代)；

其中當  $R^5$  為 5-烷氧基苯并噻唑基、3-烷基 2-吡啶基、未經取代之 3-吡啶基、1-苯基 5-吡唑基、2-噻唑基、2,3-二氫-苯并[1,4]二氧陸園烯及苯并[1,3]二氧伍園烯，且  $R^1$  為苯基、4-氯苯基或 4-甲基苯基時， $R^2$  與  $R^3$  和彼等所連接之碳原子一起，並未形成環丙基環；

或其互變異構物或藥學上可接受之鹽。

2. 如請求項 1 之化合物，其中

$R^1$  為苯基、萘基、吡啶基、吡咯基、噻吩基、苯并噁唑基、苯并吡唑基、苯并異噁唑基、苯并噻唑基、苯并異噻唑基、苯并咪唑基、苯并噻二唑基、苯并噁二唑基、二氫苯并二氧陸園烯、二甲基吡基、喹啉基、異喹啉基，各視情況獨立地被 1 至 3 個取代基取代，取代基選自  $C_1$ - $C_6$  烷基（其係視情況被 1 至 3 個鹵原子取代）、 $C_1$ - $C_6$  環烷基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基（其係視情況被 1 至 3 個鹵原子取代）、 $C_1$ - $C_6$  烷硫基、 $C_1$ - $C_6$  烷基磺醯基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧羰基、 $C_1$ - $C_6$  烷基胺基、 $C_3$ - $C_6$  環烷基胺基、 $C_1$ - $C_6$  二烷基胺基、 $C_1$ - $C_6$  烷基胺基羰基、醯基胺基、 $C_1$ - $C_6$  二烷基胺基羰基、羥基、鹵素、氰基、硝基、酮基、苯基、吡唑基、嗎福啉基及一氮四園基；

$R^2$  與  $R^3$  係獨立為氫、甲基、乙基、正-丙基、異丙基、異丁基、第三-丁基，或  $R^2$  與  $R^3$  和彼等所連接之碳一起，以形成環丙基、環丁基、環戊基、環己基或四氫吡喃基環；  
 $R^4$  為氫；

$R^5$  為苯基、萘基、吡啶基、嘧啶基、喹啉基、異喹啉基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、噁唑基、異噁唑基、噻唑基、

異噻唑基、三唑基、嘮二唑基、噻二唑基、吡啶基、苯并嘮唑基、苯并吡唑基、苯并異嘮唑基、苯并噻唑基、苯并異噻唑基、苯并咪唑基、四氫苯并嘮唑基、四氫苯并噻唑基或四氫苯并咪唑基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自 $C_1$ - $C_6$ 烷基(其係視情況被1至3個鹵原子或六氫吡啶基取代)、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、烷氧羰基、 $C_1$ - $C_6$ 環烷基、四氫吡喃基、苯氧基、鹵素、氰基、二甲胺基烷基、苯基(其係視情況被1至2個鹵原子、視情況被鹵素取代之 $C_1$ - $C_4$ 烷基取代)、噻吩基(其係視情況被1至2個鹵原子、視情況被鹵素取代之 $C_1$ - $C_4$ 烷基取代)及吡啶基(其係視情況被1至2個視情況被鹵素取代之 $C_1$ - $C_4$ 烷基取代)。

3. 如請求項2之化合物，其中

$R^1$  為苯基或萘基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自 $C_1$ - $C_6$ 烷基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、 $C_1$ - $C_6$ 環烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基(其係視情況被1至3個鹵原子取代)、 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺醯基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷胺基羰基、羧基胺基、 $C_1$ - $C_6$ 二烷胺基羰基、羥基、鹵素、氰基、硝基、苯基、吡唑基、嗎福啉基及一氮四環基；

$R^2$ 與 $R^3$  係獨立為氫、甲基、乙基、正-丙基、異丙基、異丁基、第三-丁基，或 $R^2$ 與 $R^3$ 和彼等所連接之碳一起，以形成環丙基、環丁基、環戊基、環己基或四氫吡喃基環；

$R^4$  為氫；

$R^5$  為苯基、萘基、吡啶基、喹啉基、異喹啉基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、呋唑基、異呋唑基、噻唑基、異噻唑基、三唑基、呋二唑基、噻二唑基、吲哚基、苯并呋唑基、苯并吡唑基、苯并異呋唑基、苯并噻唑基、苯并異噻唑基、苯并咪唑基、四氫苯并呋唑基、四氫苯并噻唑基或四氫苯并咪唑基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自  $C_1$ - $C_6$  烷基（其係視情況被1至3個鹵原子取代）、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基（其係視情況被1至3個鹵原子取代）、烷氧羰基、 $C_1$ - $C_6$  環烷基、四氫吡喃基、苯氧基、鹵素、氰基、二甲胺基烷基、苯基（其係視情況被1至2個鹵原子、視情況被鹵素取代之  $C_1$ - $C_4$  烷基取代）、噻吩基（其係視情況被1至2個鹵原子、視情況被鹵素取代之  $C_1$ - $C_4$  烷基取代）及吡啶基（其係視情況被1至2個視情況被鹵素取代之  $C_1$ - $C_4$  烷基取代）。

4. 如請求項3之化合物，其中

$R^1$  為吡啶基、吲哚基、噻吩基、苯并呋唑基、苯并吡唑基、苯并異呋唑基、苯并噻唑基、苯并異噻唑基、苯并咪唑基、苯并噻二唑基、苯并呋二唑基、喹啉基、異喹啉基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自  $C_1$ - $C_6$  烷基（其係視情況被1至3個鹵原子取代）、 $C_1$ - $C_6$  環烷基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基（其係視情況被1至3個鹵原子取代）、 $C_1$ - $C_6$  烷硫基、 $C_1$ - $C_6$  烷基磺醯基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧羰基、 $C_1$ - $C_6$  烷胺基羰基、醯基胺基、 $C_1$ - $C_6$  二烷胺基羰基、羥基、鹵素、氰基、硝基、嗎福啉基、一氮四環基、苯基及吡唑基；

$R^2$  與  $R^3$  係獨立為氫、甲基、乙基、正-丙基、異丙基、異丁基、第三-丁基，或  $R^2$  與  $R^3$  和彼等所連接之碳一起，以形成環丙基、環丁基、環戊基、環己基或四氫呋喃基環； $R^4$  為氫；

$R^5$  為苯基、萘基、吡啶基、喹啉基、異喹啉基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、呋唑基、異呋唑基、噻唑基、異噻唑基、三唑基、呋二唑基、噻二唑基、吡啶基、苯并呋唑基、苯并吡唑基、苯并異呋唑基、苯并噻唑基、苯并異噻唑基、苯并咪唑基、四氫苯并呋唑基、四氫苯并噻唑基或四氫苯并咪唑基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自  $C_1$ - $C_6$  烷基（其係視情況被1至3個鹵原子取代）、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基（其係視情況被1至3個鹵原子取代）、烷氧羰基、 $C_1$ - $C_6$  環烷基、苯氧基、鹵素、氰基、二甲胺基烷基、苯基（其係視情況被1至2個鹵原子、視情況被鹵素取代之  $C_1$ - $C_4$  烷基取代）、噻吩基（其係視情況被1至2個鹵原子、視情況被鹵素取代之  $C_1$ - $C_4$  烷基取代）及吡啶基（其係視情況被1至2個視情況被鹵素取代之  $C_1$ - $C_4$  烷基取代）。

5. 如請求項4之化合物，其中

$R^1$  為苯基、萘基、3-吡啶基、噻吩基、苯并噻二唑基、喹啉基或異喹啉基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自甲基、乙基、正-丙基、異丙基、環丙基、第三-丁基、三氟甲基、三氟乙基、甲氧基、三氟甲氧基、甲磺醯基、氟基、氯基、溴基、氰基硝基、嗎福啉及一氮四環；

$R^2$  與  $R^3$  係獨立為氫、甲基、異丙基、第三-丁基，或  $R^2$  與  $R^3$  和彼等所連接之碳一起，以形成環丙基或環丁基環；  
 $R^4$  為氫；

$R^5$  為苯基、吡啶基、喹啉基、異喹啉基、吡唑基、咪唑基、異噁唑基、噁唑基、噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、苯并噁唑基、苯并異噻唑基、苯并噻唑基或四氫苯并噻唑基，各視情況獨立地被1至3個取代基取代，取代基選自甲基、乙基、環丙基、第三-丁基、三氟甲基、苯氧基、乙氧羰基、氯基、苯基(其係視情況被氯基取代)、噻吩基及吡啶基。

6. 一種化合物，其係選自

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(吡啶-2-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-N-(5-甲基-噻唑-2-基)-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-N-(5-甲基-噻唑-2-基)-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-N-吡啶-3-基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-3-甲基-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-磺酰基)-丁醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-三氟甲基-苯磺酰基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-三氟甲基-苯磺酰基)-乙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(萘-2-磺酰基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺酰基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺酰基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-2-磺酰基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(萘-2-磺酰基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺酰基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺酰基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-2-磺酰基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(萘-2-磺酰基)-丙醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺酰基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-異噁

唑-3-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-

甲基-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-異噁唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-甲基-噁唑-2-基)-丙醯胺

N-苯并噁唑-2-基-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-苯基-噁唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-

丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-

丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-乙基-吡啶-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(1-甲基-1H-苯并咪唑-2-基)-丙

醯胺

N-苯并呋唑-2-基-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4,5-二甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-噁唑-2-基)-

丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-

丙醯胺

N-苯并[d]異呋唑-3-基-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(6-甲氧基-吡啶-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-吡啶-3-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4,5,6,7-四氫-苯并噁唑-2-基)-

丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-

丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-噁吩-2-基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-異喹啉-3-基-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-苯氧基-吡啶-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(5-三氟甲基-吡啶-2-磺醯基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-苯基-[1,2,4]噻二唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-2-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-[1,3,4]噻二唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(3,4-二甲基-異噁唑-5-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(2,5-二甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-2H-[1,2,4]三唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-[1,2,4]噻二唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-[1,3,4]噻二唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-噻吩-2-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-苯基-異噁唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-六氫吡啶-1-基甲基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-噻吩-2-基-異噁唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-[1,3,4]噻二唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-吡啶-2-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(2-氯苯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-三氟甲基-苯基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(3-氯苯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-三氟甲基-苯基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-氯苯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-2-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-苯基)-丙醯胺

N-(2-第三-丁基-苯基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-3-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-2-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-4-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-環丙基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-3-磺醯基)-丙

醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-

丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯

基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙

醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-

基)-丙醯胺

2-(4-溴-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙

醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噁吩-2-磺醯基)-丙

醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-異丙基-苯磺醯基)-2-甲

基-丙醯胺

2-(4-第三-丁基-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-

甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-

甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4,5-二氟-噁吩-2-磺醯基)-2-

甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙

醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-甲烷磺醯基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,2-二甲基-吡-6-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(苯并[1,2,5]噻二唑-5-磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(5-氟-噻吩-2-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲氧基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(喹啉-8-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丁醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丁醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丁醯胺

3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丁醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺酰基)-丙酰胺

N-(2-氯苯基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺酰基)-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-苯基-異噁唑-3-基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(4-溴-苯磺酰基)-N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氟基-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(4-溴-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(4-溴-苯磺酰基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺酰基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(3-氟基-4-甲基-苯磺酰基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-N-(4-苯基-噁唑-2-基)-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-苯基-噻唑-2-基)-丙酰胺

N-(4-第三-丁基-5-甲基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4,5-二甲基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丁醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-哌喃-4-羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-哌喃-4-羧酸(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-哌喃-4-羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-哌喃-4-羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-哌喃-4-羧酸(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-

基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氯基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呷喃-4-羧酸(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺  
2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環己基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環戊基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺

醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-(甲苯-4-磺醯基)-

丙醯胺

2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-N-(4-三氟甲基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-

丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(4-三氟甲基-噻唑-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(1-氧基-吡啶-3-磺

醯基)-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-乙基-4-苯基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(4-苯基-噁唑-2-基)-丙醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-

醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡

唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-

醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-  
醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-  
基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-  
醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑  
-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-  
基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶  
-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-  
磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-  
吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲  
基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-三氟甲基-吡  
啶-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶  
-3-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺醯基)-N-(4-三氟甲基-吡啶  
-2-基)-丙醯胺

2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺酰基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-N-(3-苯基-[1,2,4]噁二唑-5-基)-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-N-(5-氟基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(3-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(3-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-

基)-丙 醯 胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲  
基-丙 醯 胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-  
基)-丙 醯 胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-  
基)-丙 醯 胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-N-(5-乙基-4-苯基-噻唑-2-基)-2-甲  
基-丙 醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-異丙基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙 醯 胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2-氟基-4-甲基-苯磺醯  
基)-2-甲基-丙 醯 胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟基-4-甲基-苯  
磺醯基)-2-甲基-丙 醯 胺

2-(2-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-  
基)-丙 醯 胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺  
醯基)-丙 醯 胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯  
基)-2-甲基-丙 醯 胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙  
醯 胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺  
醯基)-2-甲基-丙 醯 胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-N-[5-(四氫-呋喃-4-基)-噻唑-2-基]-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-氟基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-氟基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺醯基)-2-

甲基-丙醯胺

2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-  
丙醯胺

2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-  
丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-  
丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基  
-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基  
-丙醯胺

2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙  
醯胺

2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙  
醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-  
丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2,5-二氟-苯磺醯  
基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[4-(3,4-二氟-苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-  
丙醯胺

N-(5-第二-丁基-吡啶-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-甲基-2-(6-嗎福啉-4-基-吡啶-3-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡  
啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[5-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺

N-[5-(3,4-二氯-苯基)-噻唑-2-基]-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-苯基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-苯基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-1-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-2-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4,5-二苯基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-乙基-4-苯基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-環己基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-甲基-4-苯基-異噁唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-丙基-異噁唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(2,4-二甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-甲基-3-苯基-異噁唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[3-(2,2-二甲基-丙基)-異噁唑-5-基]-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-乙基-3-甲基-異噁唑-5-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-異丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

N-(5-環丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-N-異喹啉-3-基-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-3-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-2-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-1-基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-噻吩-2-基-2H-吡唑-3-基)-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-噻唑-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-1-基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-[3-(三氟甲基)苯基]丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-(4,5,6,7-四氫-1,3-苯并噻唑-2-基)丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(1-甲基-3-苯基-1H-吡唑-5-基)-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

N-(3-第三-丁基-1-甲基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-[4-(三氟甲基)-1,3-噻唑-2-基]丙醯胺

N-(4-環丙基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}丙醯胺

N-(4-第三-丁基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙酰胺

N-(4-環己基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(3-丙基異噁唑-5-基)丙酰胺

N-(1,4-二甲基-3-苯基-1H-吡唑-5-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

N-(5-第三-丁基-1,3,4-噻二唑-2-基)-2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[5-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙酰胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙酰胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基丙酰胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙酰胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(3-丙基異噁唑-5-基)丙  
 磺胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-  
 基]-2-甲基丙磺胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺酰基)苯基]磺酰基}-N-[5-(三氟甲基)吡  
 啶-2-基]丙磺胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺酰基)苯基]磺酰基}-N-[4-(三氟甲基)吡  
 啶-2-基]丙磺胺

N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺酰基)苯基]磺酰基}  
 丙磺胺

N-1,3-苯并噁唑-2-基-2-甲基-2-{[4-(甲磺酰基)苯基]磺酰基}  
 丙磺胺

2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噁唑-2-基)-2-{[4-(甲磺酰基)苯  
 基]磺酰基}丙磺胺

N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噁唑-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺酰基)苯  
 基]磺酰基}丙磺胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺酰基)苯基]磺酰基}-N-[6-(三氟甲基)吡  
 啶-2-基]丙磺胺

N-(4-環己基-1,3-噁唑-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺酰基)苯基]  
 磺酰基}丙磺胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺酰基)苯基]磺酰基}-N-(3-丙基異噁唑-5-  
 基)丙磺胺

N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-甲基-2-{[4-(甲磺酰  
 基)苯基]磺酰基}丙磺胺

N-1,3-苯并噻唑-2-基-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基  
丙酰胺

N-(5-第三-丁基-1,3,4-噻二唑-2-基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺  
酰基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基  
丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(5-苯基-1,2,4-噻二唑  
-3-基)丙酰胺

N-1,3-苯并呋唑-2-基-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基  
丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-  
噻唑-2-基)丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-(4-環己基-1,3-噻唑-2-基)-2-  
甲基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(3-丙基異呋唑-5-  
基)丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-[3-(2,2-二甲基丙基)異呋唑  
-5-基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-1-萘基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(5-甲基吡啶-2-基)  
丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[3-(三氟甲基)苯基]  
丙酰胺

N-(4-第三-丁基苯基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基

## 丙 醯 胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-喹啉-2-基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-[4-(三氟甲基)苯基]

## 丙 醯 胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-異喹啉-3-基-2-甲基丙醯胺

N-(3-第三-丁基苯基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基

## 丙 醯 胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-2-甲基-N-[4-(三氟甲基)-1,3-噻唑-2-基]丙醯胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺醯基]-N-(4-環丙基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基丙醯胺

N-1,3-苯并噻唑-2-基-2-甲基-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-(5-第三-丁基-1,3,4-噻二唑-2-基)-2-甲基-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(5-苯基-1,2,4-噻二唑-3-基)-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-1,3-苯并呋唑-2-基-2-甲基-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺

鹽基}丙鹽胺

2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噁唑-2-基)-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺鹽基}丙鹽胺

N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噁唑-2-基)-2-甲基-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺鹽基}丙鹽胺

2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺鹽基}丙鹽胺

2-甲基-N-(3-丙基異噁唑-5-基)-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺鹽基}丙鹽胺

N-(3-異丙基-1-甲基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺鹽基}丙鹽胺

N-(1,4-二甲基-3-苯基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺鹽基}丙鹽胺

N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-甲基-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺鹽基}丙鹽胺

2-甲基-N-1-萘基-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺鹽基}丙鹽胺

2-甲基-N-(5-甲基吡啶-2-基)-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺鹽基}丙鹽胺

2-甲基-N-喹啉-3-基-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺鹽基}丙鹽胺

2-甲基-N-[3-(三氟甲基)苯基]-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺鹽基}丙鹽胺

N-(4-第三-丁基苯基)-2-甲基-2-[[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺鹽基}丙鹽胺

2-甲基-N-喹啉-2-基-2-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙  
醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基-2-[6-(三氟甲基)吡啶  
-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-[4-(三氟甲基)苯基]-2-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]  
磺醯基}丙醯胺

N-異喹啉-3-基-2-甲基-2-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}  
丙醯胺

N-(3-第三-丁基苯基)-2-甲基-2-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺  
醯基}丙醯胺

2-甲基-2-[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}-N-[4-(三氟甲  
基)-1,3-噻唑-2-基]丙醯胺

2-[(4-氯苯基)磺醯基]-2-甲基-N-(4-甲基嘧啶-2-基)丙醯胺

2-((2-[(4-氯苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯基}胺基)-4-(三氟甲  
基)-1,3-噻唑-5-羧酸乙酯

2-[(4-氯苯基)磺醯基]-N-[2-氟基-4-(三氟甲基)苯基]-2-甲基  
丙醯胺

N-(2-第三-丁基吡啶-4-基)-2-[(4-氯苯基)磺醯基]-2-甲基丙  
醯胺

2-[(4-氯苯基)磺醯基]-N-[4-(4-氟苯基)-5-甲基-1,3-噻唑-2-  
基]-2-甲基丙醯胺

2-[(4-氯苯基)磺醯基]-N-[4-氟基-3-(三氟甲基)苯基]-2-甲基  
丙醯胺

2-[(4-氯苯基)磺醯基]-N-(6-氟基-1,3-苯并噻唑-2-基)-2-甲基

丙 醯 胺

2-[(4-氯 苯 基)磺 醯 基]-N-[3-氟 基-4-(三 氟 甲 基)苯 基]-2-甲 基

丙 醯 胺

N-(4-第 三 -丁 基 -5-氟 基 -1,3-噻 唑 -2-基)-2-[(4-氯 苯 基)磺 醯 基]-2-甲 基 丙 醯 胺

2-[(4-氯 苯 基)磺 醯 基]-N-[4-(4-氟 苯 基)-1,3-噻 唑 -2-基]-2-甲 基 丙 醯 胺

2-[(4-氯 苯 基)磺 醯 基]-N-(4-氟 基 -1,3-苯 并 噻 唑 -2-基)-2-甲 基 丙 醯 胺

N-(3-第 三 -丁 基 異 噁 唑 -5-基)-2-甲 基 -2-{[6-(三 氟 甲 基)吡 啶 -3-基]磺 醯 基}丙 醯 胺

2-[(4-氯 基 -2-氟 苯 基)磺 醯 基]-2-甲 基 -N-(4-苯 基 -1,3-噻 唑 -2-基)丙 醯 胺

2-[(4-氯 基 -2-氟 苯 基)磺 醯 基]-2-甲 基 -N-喹 啉 -3-基 丙 醯 胺

N-(3-第 二 -丁 基 -異 噁 唑 -5-基)-2-(4-氯 -苯 磺 醯 基)-2-甲 基 -丙 醯 胺

2-(4-氯 -苯 磺 醯 基)-N-(3-異 丙 基 -異 噁 唑 -5-基)-2-甲 基 -丙 醯 胺

N-(5-第 二 -丁 基 -2-甲 基 -2H-吡 唑 -3-基)-2-(4-氯 -苯 磺 醯 基)-2-甲 基 -丙 醯 胺

2-(6-一 氣 四 環 -1-基 -吡 啶 -3-磺 醯 基)-N-(4-第 三 -丁 基 -噻 唑 -2-基)-2-甲 基 -丙 醯 胺

2-(6-一 氣 四 環 -1-基 -吡 啶 -3-磺 醯 基)-2-甲 基 -N-(6-三 氟 甲 基 -吡 啶 -2-基)-丙 醯 胺

2-甲 基 -2-(6-甲 基 -吡 啶 -3-磺 醯 基)-N-(6-三 氟 甲 基 -吡 啶 -2-

基)-丙醯胺

2-甲基-2-(6-甲基-吡啶-3-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(6-甲基-吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

或其互變異構物或藥學上可接受之鹽。

7. 一種化合物，其係選自

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-2-磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噁唑-2-基)-2-甲基-2-(甲苯-2-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(萘-2-磺醯基)-丙醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丁烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(3,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(3,4-二氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(3-第三-丁基-異噻唑-5-基)-2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噻唑-3-基)-2-(4-甲氧基-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(3-三氟甲基-苯磺酰基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(4-甲氧基-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噻唑-3-基)-2-(2,4-二氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(2,4-二氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-苯并噻唑-2-基-2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-N-(4-苯基-噻唑-2-基)-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-N-(4-乙基-吡啶-2-基)-2-甲基-丙酰胺

N-苯并噻唑-2-基-2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺酰基)-N-(4,5-二甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙酰胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4,5,6,7-四氫-苯并噻唑-2-基)-  
丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-  
丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-噻吩-2-基-2H-吡唑-3-  
基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-異喹啉-3-基-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲  
基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-苯基-[1,2,4]噻二唑-5-基)-丙  
醯胺

N-(5-第三-丁基-[1,3,4]噻二唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲  
基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-2H-[1,2,4]三唑-3-基)-丙  
醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-苯基-[1,2,4]噻二唑-3-基)-丙  
醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-噻吩-2-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-苯基-異噁唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-噻唑-2-基)-丙  
醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-三氟甲基-苯基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-氯苯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-2-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-苯基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-4-基-噻唑-2-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-環丙基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-3-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(吡啶-3-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-溴-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(噻吩-2-磺醯基)-丙醯胺

2-(4-第三-丁基-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-  
甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4,5-二氯-噻吩-2-磺醯基)-2-  
甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙  
醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-甲烷磺醯基-苯磺醯  
基)-2-甲基-丙醯胺

2-(苯并[1,2,5]噻二唑-5-磺醯基)-N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-  
基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基  
-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(5-氯-噻吩-2-磺醯基)-2-甲  
基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氯基-4-氟-苯磺醯基)-2-  
甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(喹啉-8-磺醯基)-丙  
醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-3-甲基-2-(4-三氟甲基-  
苯磺醯基)-丁醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺  
醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-溴-苯磺醯基)-N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-  
甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氰基-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氰基-4-甲基-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

2-(4-溴-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(3-氰基-4-甲氧基-苯磺酰基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(4-溴-苯磺酰基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(3-氰基-4-甲氧基-苯磺酰基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(3-氰基-4-甲基-苯磺酰基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-(4-氰基-2-氟-苯磺酰基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-丙酰胺

N-(4-第三-丁基-5-甲基-噁唑-2-基)-2-(4-氯-苯磺酰基)-2-甲基-丙酰胺

3-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺酰基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丁酰胺

1-(4-三氟甲基-苯磺酰基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-酰胺

1-(4-三氟甲基-苯磺酰基)-環丙烷羧酸(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-酰胺

4-(4-三氟甲基-苯磺酰基)-四氫-吡喃-4-羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-酰胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呋喃-4-羧酸(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

4-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-四氫-呋喃-4-羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氟基-4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噁唑-2-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟-苯磺醯基)-N-(5-環己基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-環戊基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-N-(5-乙基-4-苯基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-苯磺醯基-2-甲基-N-(4-苯基-噁唑-2-基)-丙醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-醯胺

1-(4-氯-苯磺醯基)-環丙烷羧酸(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酰胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酰胺

2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-丙酰胺

2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

2-甲基-2-(6-三氟甲基-吡啶-3-磺基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(3-氟-苯磺基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(3-氟-苯磺基)-2-甲基-丙酰胺

2-(3-氟-苯磺基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺基)-2-甲基-丙酰胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(2-氟-苯磺基)-2-甲

基-丙醯胺

2-(2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-4-甲基-噻唑-2-基)-2-(3-氟-苯磺醯基)-2-甲

基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙

醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-

甲基-丙醯胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-

基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲

基-丙醯胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-

基)-丙醯胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-三氟甲基-吡啶-2-

基)-丙醯胺

2-(4-氯基-2-氟-苯磺醯基)-N-(5-乙基-4-苯基-噻唑-2-基)-2-甲

基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-異丙基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2-氟基-4-甲基-苯磺醯

基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2-氟基-4-甲基-苯

磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-

基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-甲基-2-(4-三氟甲基-苯磺醯基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(3-氟基-4-甲基-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-甲基-2-(甲苯-4-磺醯基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟基-2-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(4-氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-氟-吡啶-3-磺醯基)-2-甲

基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(6-甲氧基-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-N-(6-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(6-氯-吡啶-3-磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-異噁唑-3-基)-2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-(2,5-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[4-(3,4-二氟-苯基)-噻唑-2-基]-2-甲基-

## 丙 醯 胺

N-(5-第二-丁基-吡啶-2-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-甲基-2-(6-嗎福啉-4-基-吡啶-3-磺醯基)-N-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-苯基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-1-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-萘-2-基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4,5-二苯基-噁唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-乙基-4-苯基-噁唑-2-基)-2-甲基-丙

## 醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(4-環己基-噁唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(3-丙基-異噁唑-5-基)-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(2,4-二甲基-5-苯基-2H-吡唑-3-基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-[3-(2,2-二甲基-丙基)-異噁唑-5-基]-2-

## 甲 基 - 丙 醯 胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(5-異丙基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-甲

## 基 - 丙 醯 胺

2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噁唑-2-基]-2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(2,4-二氯-苯磺醯

## 基)-2-甲 基 - 丙 醯 胺

2-(2,4-二氯-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-3-基-噁唑-2-基)-丙

醯胺

2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基-N-(4-吡啶-2-基-噻唑-2-基)-丙

醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(2,4-二氟-苯磺醯基)-2-甲基  
-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-喹啉-3-基-丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-噻唑-2-基]-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-  
丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-苯基-2H-吡唑  
-3-基)-丙醯胺

N-(5-第三-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯  
基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲基-N-(2-甲基-5-噻吩-2-基-2H-  
吡唑-3-基)-丙醯胺

N-(3-第三-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-甲氧基-苯磺醯基)-2-甲  
基-丙醯胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯基]磺醯基}-N-(4,5,6,7-四氫-1,3-苯  
并噻唑-2-基)丙醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基-2-{[4-(甲磺醯基)苯  
基]磺醯基}丙醯胺

N-(4-第三-丁基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧基)磺醯基]-2-甲  
基丙醯胺

N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧基)磺醯基]-2-  
甲基丙醯胺

2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]

丙磺胺

N-(4-環己基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]-2-甲基

丙磺胺

N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-[(4-甲氧苯基)磺酰基]

基]-2-甲基丙磺胺

N-(5-第三-丁基-1,3,4-噻二唑-2-基)-2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]

基]-2-甲基丙磺胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[5-(三氟甲基)吡啶-2-

基]丙磺胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[4-(三氟甲基)吡啶-2-

基]丙磺胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-

基]丙磺胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(3-丙基異噁唑-5-基)丙

磺胺

2-[(2,4-二氟苯基)磺酰基]-N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-

基]-2-甲基丙磺胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺酰基)苯基]磺酰基}-N-[5-(三氟甲基)吡

啶-2-基]丙磺胺

N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺酰基)苯基]磺酰基}

丙磺胺

2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-{[4-(甲磺酰基)苯

基]磺酰基}丙磺胺

N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺酰基)苯基]磺酰基}丙酰胺

2-甲基-2-{[4-(甲磺酰基)苯基]磺酰基}-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]丙酰胺

N-(4-環己基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基-2-{[4-(甲磺酰基)苯基]磺酰基}丙酰胺

N-1,3-苯并噻唑-2-基-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

N-(5-第三-丁基-1,3,4-噻二唑-2-基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(5-苯基-1,2,4-噻二唑-3-基)丙酰胺

N-1,3-苯并呋唑-2-基-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-(4-環己基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(3-丙基異呋唑-5-基)丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-[3-(2,2-二甲基丙基)異呋唑-5-基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-1-萘基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(5-甲基吡啶-2-基)

丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[3-(三氟甲基)苯基]

丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-喹啉-2-基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噻唑-2-

基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-[4-(三氟甲基)苯基]

丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-異喹啉-3-基-2-甲基丙酰胺

N-(3-第三-丁基苯基)-2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基

丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-N-(4-環丙基-1,3-噻唑-2-基)-2-

甲基丙酰胺

N-(4-乙基吡啶-2-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺

酰基}丙酰胺

2-甲基-N-(5-苯基-1,2,4-噻二唑-3-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶

-3-基]磺酰基}丙酰胺

2-甲基-N-(5-甲基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡

啶-3-基]磺酰基}丙酰胺

N-(5-乙基-4-苯基-1,3-噻唑-2-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡

啶-3-基]磺酰基}丙酰胺

2-甲基-N-[6-(三氟甲基)吡啶-2-基]-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-

基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(3-丙基異噁唑-5-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]

磺醯基}丙醯胺

N-(3-異丙基-1-甲基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)

吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-(1,4-二甲基-3-苯基-1H-吡唑-5-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲

基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

N-[3-(2,2-二甲基丙基)異噁唑-5-基]-2-甲基-2-{[6-(三氟甲

基)吡啶-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-(5-甲基吡啶-2-基)-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺

醯基}丙醯胺

2-甲基-N-[3-(三氟甲基)苯基]-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]

磺醯基}丙醯胺

N-(4-第三-丁基苯基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺

醯基}丙醯胺

2-甲基-N-喹啉-2-基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺醯基}丙

醯胺

N-[4-(4-氯苯基)-1,3-噁唑-2-基]-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶

-3-基]磺醯基}丙醯胺

2-甲基-N-[4-(三氟甲基)苯基]-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]

磺醯基}丙醯胺

N-(3-第三-丁基苯基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶-3-基]磺

醯基}丙醯胺

2-({2-[(4-氯苯基)磺醯基]-2-甲基丙醯基}胺基)-4-(三氟甲

基)-1,3-噻唑-5-羧酸乙酯

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[2-氟基-4-(三氟甲基)苯基]-2-甲基  
丙酰胺

N-(2-第三-丁基吡啶-4-基)-2-[(4-氯苯基)磺酰基]-2-甲基丙  
酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[4-(4-氟苯基)-5-甲基-1,3-噻唑-2-  
基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[4-氟基-3-(三氟甲基)苯基]-2-甲基  
丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-(6-氟基-1,3-苯并噻唑-2-基)-2-甲基  
丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[3-氟基-4-(三氟甲基)苯基]-2-甲基  
丙酰胺

N-(4-第三-丁基-5-氟基-1,3-噻唑-2-基)-2-[(4-氯苯基)磺酰  
基]-2-甲基丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-[4-(4-氟苯基)-1,3-噻唑-2-基]-2-甲基  
丙酰胺

2-[(4-氯苯基)磺酰基]-N-(4-氟基-1,3-苯并噻唑-2-基)-2-甲基  
丙酰胺

N-(3-第三-丁基异噁唑-5-基)-2-甲基-2-{[6-(三氟甲基)吡啶  
-3-基]磺酰基}丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-(4-苯基-1,3-噻唑-2-  
基)丙酰胺

2-[(4-氯基-2-氟苯基)磺酰基]-2-甲基-N-喹啉-3-基丙酰胺

N-(3-第二-丁基-異噁唑-5-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(4-氯-苯磺醯基)-N-(3-異丙基-異噁唑-5-基)-2-甲基-丙醯胺

N-(5-第二-丁基-2-甲基-2H-吡唑-3-基)-2-(4-氯-苯磺醯基)-2-甲基-丙醯胺

2-(6-一氮四環-1-基-吡啶-3-磺醯基)-N-(4-第三-丁基-噻唑-2-基)-2-甲基-丙醯胺

或其互變異構物或藥學上可接受之鹽。

8. 一種醫藥組合物，其包含治療上有效量之如請求項1之化合物。
9. 一種如請求項1之化合物於藥劑製造上之用途，該藥劑係用於治療CB2受體所媒介之疾病或症狀。
10. 如請求項9之用途，其中該CB2受體所媒介之疾病或症狀係選自包括炎性疾病與自身免疫疾病。
11. 如請求項9之用途，其中該CB2受體所媒介之疾病或症狀為疼痛。
12. 如請求項9之用途，其中該CB2受體所媒介之疾病或症狀為肺病、風濕疾病、自身免疫疾病、肌骨疾病、過敏性疾病、過敏性反應、血管疾病、皮膚病、腎病、肝病、胃腸疾病、神經變性眼睛疾病，耳朵、鼻子及喉嚨之疾病，神經病學疾病、血液疾病、腫瘤、內分泌疾病、器官與組織移植及移植物-對-宿主疾病、休克之嚴重狀態、急性疼痛、內臟疼痛、胃腸道或子宮之痙攣、絞痛、神經病原性疼痛、炎性與感受傷害疼痛、癌症疼痛、頭痛、再狹窄、動脈粥

瘤硬化、再灌注損傷、鬱血性心衰竭、心肌梗塞、熱損傷、創傷續發之多重器官傷害、壞死性小腸結腸炎，及與血液透析、白血球電泳及粒性血球輸血有關聯之徵候簇，肉狀瘤病、齒齦炎及發熱。

## 七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：( 無 )

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

## 八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

