

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利申请公布说明书

[21] 申请号 200580034451.6

[51] Int. Cl.

C07D 209/18 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

C07D 405/12 (2006.01)

C07D 409/12 (2006.01)

C07D 413/12 (2006.01)

C07D 513/04 (2006.01)

[43] 公开日 2007 年 9 月 26 日

[11] 公开号 CN 101044113A

[51] Int. Cl. (续)

A61K 31/404 (2006.01)

A61K 31/422 (2006.01)

A61K 31/429 (2006.01)

A61K 31/4709 (2006.01)

A61P 3/00 (2006.01)

A61P 25/00 (2006.01)

C07D 403/12 (2006.01)

A61K 31/4155 (2006.01)

[22] 申请日 2005.8.9

[21] 申请号 200580034451.6

[30] 优先权

[32] 2004.8.10 [33] ES [31] P200402007

[32] 2004.9.8 [33] US [31] 10/935,983

[32] 2004.9.8 [33] EP [31] 04021314.2

[86] 国际申请 PCT/EP2005/008754 2005.8.9

[87] 国际公布 WO2006/015867 英 2006.2.16

[85] 进入国家阶段日期 2007.4.9

[71] 申请人 埃斯特韦实验室有限公司

地址 西班牙巴塞罗那

[72] 发明人 R·默塞威达尔 A·多达尔祖拉斯

X·科多尼索尔德

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 庞立志 黄可峻

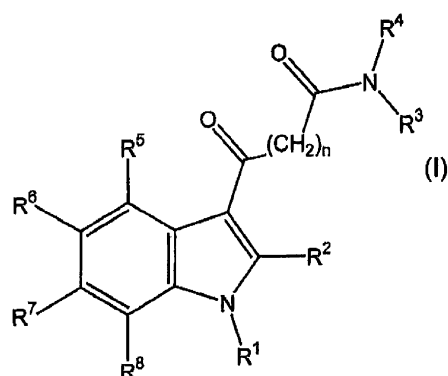
权利要求书 65 页 说明书 120 页

[54] 发明名称

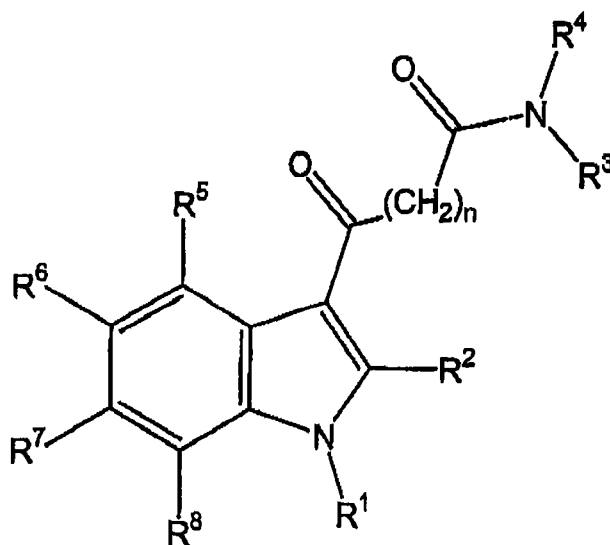
取代了的吲哚化合物、其制备和在药物中的应用

[57] 摘要

本发明涉及通式(I)的取代了的吲哚化合物,其制备方法,包含取代了的吲哚化合物的药物,以及所述吲哚化合物在制备适用于例如预防和/或治疗至少部分是由 5-HT₆受体介导的病症或疾病方面的药物的应用。



1. 通式 I 的取代了的吲哚化合物



I

其中

n 代表 0、1、2、3 或 4,

R^1 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接; $-S(=O)_2-R^9$; 或 $-C(=O)-R^{10}$,

对于 $n = 0$: R^2 代表 $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

对于 $n = 1, 2, 3$ 或 4 : R^2 代表 $-H$; $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

R^3 和 R^4 , 其是相同或不同的, 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的脂族基团, 任选至少单取代了的芳基或杂芳基基团, 所述基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合, 或者

R^3 和 R^4 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的杂环, 所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单或多环状系统稠合,

R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11})-S(=O)_2-R^{12}$; $-OR^{13}$; $-SR^{14}$; $-C(=O)-OR^{15}$; $-NR^{16}R^{17}$; $-C(=O)-R^{18}$; $-(C=O)-NR^{19}R^{20}$; $-O-(C=O)-R^{21}$; $-S(=O)_2-R^{22}$; $-S(=O)_2-NR^{23}R^{24}$; $-NR^{25}-C(=O)-NR^{26}R^{27}$; $-NR^{28}-(C=O)-R^{29}$; $-NR^{30}-(C=O)-OR^{31}$; $-NR^{32}-S(=O)NR^{33}R^{34}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35}$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

条件是取代基 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 当中的至少一个代表 $-N(R^{11})-S(=O)_2-R^{12}$ 部分,

R^9 和 R^{10} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基,

所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

R^{11} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接; 任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接; 或者 $-S(=O)_2-R^{36}$ 部分,

R^{12} 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合; 或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

$R^{13}-R^{35}$ 各自独立地代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

R^{36} 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合; 或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

所述化合物任选是一种其立体异构体, 优选对映体或非对映体、外消旋体的形式, 或者是至少两种其立体异构体, 优选对映体和/或非对映体以任何混比率的混合物, 或是其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

2. 权利要求 1 的化合物, 其特征在于

R^1 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接；任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接； $-S(=O)_2-R^9$ ；或 $-C(=O)-R^{10}$ ，

对于 $n = 0$ ： R^2 代表 $-NO_2$ ； $-NH_2$ ； $-SH$ ； $-OH$ ； $-CN$ ；卤原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

对于 $n = 1, 2, 3$ 或 4 ： R^2 代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-NH_2$ ； $-SH$ ； $-OH$ ； $-CN$ ；卤原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接；或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

R^3 和 R^4 ，其是相同或不同的，代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团；任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统耦合，

R^3 和 R^4 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的 4-9 元杂环，所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单或多环状系统耦合，

R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 ，其是相同或不同的，代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-CN$ ；

- N(R¹¹) - S(=O)₂ - R¹²; - OR¹³; - SR¹⁴; - C(=O) - OR¹⁵; - NR¹⁶R¹⁷; - C(=O) - R¹⁸; - (C=O) - NR¹⁹R²⁰; - O - (C=O) - R²¹; - S(=O)₂ - R²²; - S(=O)₂ - NR²³R²⁴; - NR²⁵ - C(=O) - NR²⁶R²⁷; - NR²⁸ - (C=O) - R²⁹; - NR³⁰ - (C=O) - OR³¹; - NR³² - S(=O)NR³³R³⁴; 或 - S(=O)₂ - OR³⁵; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C₁₋₁₀ 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C₁₋₆ - 亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C₁₋₆ 亚烷基连接,

条件是取代基 R⁵、R⁶、R⁷ 和 R⁸ 当中的至少一个代表 - N(R¹¹) - S(=O)₂ - R¹² 部分,

R⁹ 和 R¹⁰ 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C₁₋₁₀ 脂族基团; 或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C₁₋₆ 亚烷基连接,

R¹¹ 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C₁₋₁₀ 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C₁₋₆ 亚烷基、C₂₋₆ 亚烯基或 C₂₋₆ 亚炔基连接; 任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C₁₋₆ 亚烷基、C₂₋₆ 亚烯基或 C₂₋₆ 亚炔基连接; 或者 - S(=O)₂ - R³⁶ 部分,

R¹² 代表任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C₁₋₆ 亚烷基、C₂₋₆ 亚烯基或 C₂₋₆ 亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合; 或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C₁₋₆ 亚烷基、C₂₋₆ 亚烯基或 C₂₋₆ 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

R¹³ - R³⁵ 各自独立地代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和

的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

R^{36} 代表任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合; 或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合。

3. 权利要求 1 或 2 的化合物, 其特征在于 R^1 代表氢原子; 直链或支链的 C_{1-10} 烷基; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; $-S(=O)_2-R^9$; 或 $-C(=O)-R^{10}$,

优选地, R^1 代表氢原子; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$

-₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基;

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基通过-(CH₂)_{1, 2 或 3}-基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代: C₁₋₅-烷基、-O-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷基、-O-(C=O)-C₁₋₅-烷基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基;-S(=O)₂-R⁹; 或-C(=O)-R¹⁰。

4. 权利要求1-3中的一项或多项权利要求的化合物, 其特征在于对于 n = 0

R² 代表 -NO₂; -NH₂; -SH; -OH; -CN; -CF₃; -OCH₃; -O-CH₂-CH₃; F; Cl; Br; I; 直链或支链的、饱和或不饱和的 C₁₋₁₀ 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C₁₋₆-亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C₁₋₆-亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子,

优选地, R² 代表 -NO₂; -NH₂; -SH; -OH; -CN; -CF₃; -OCH₃; -O-CH₂-CH₃; F; Cl; Br; I; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过-(CH₂)_{1, 2 或 3}-基团连接和/或被

1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O$ - C_{1-5} -烷基、 $-S$ - C_{1-5} -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，并且

对于 $n=1, 2, 3$ 或 4

R^2 代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-NH_2$ ； $-SH$ ； $-OH$ ； $-CN$ ； $-CF_3$ ； $-OCH_3$ ； $-O-CH_2-CH_3$ ；F；Cl；Br；I；直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接，并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子，

优选地， R^2 代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-NH_2$ ； $-SH$ ； $-OH$ ； $-CN$ ； $-$

CF_3 ; $-\text{OCH}_3$; $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$; F ; Cl ; Br ; I ; 选自下列的烷基:
甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}$ -烷基, 氧代($=\text{O}$)、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基;
或

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: 直链或支链 C_{1-5} -烷基、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

更优选地, R^2 代表氢原子。

5. 权利要求 1-4 中的一项或多项权利要求的化合物, 其特征在于 R^3 和 R^4 , 其是相同或不同的, 代表氢原子或者直链或支链 C_{1-8} 烷基, 或者

R^3 和 R^4 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不

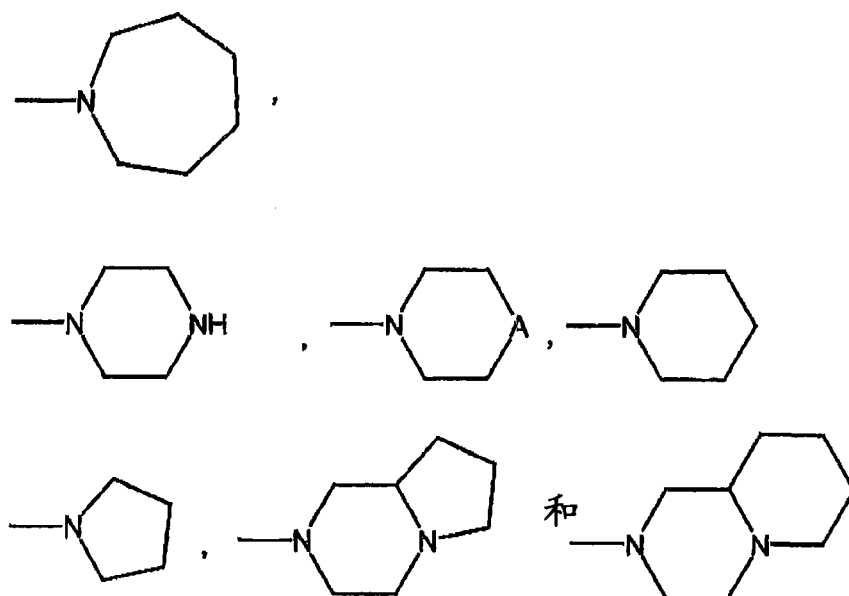
饱和的或芳族的 4-9 元杂环, 所述杂环可以与任选至少单取代了的单环或双环状系统稠合,

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环, 并且所述杂环和所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子,

优选地

R^3 和 R^4 , 其是相同或不同的, 代表氢原子或选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基; 或者

R^3 和 R^4 与桥联氮原子共同形成选自下列的部分



A 代表氧原子或硫原子, 并且每一个前述环状部分可以在包括哌嗪环的氮原子在内的任何位置上被 1、2 或 3 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

更优选地, R^3 和 R^4 , 其是相同或不同的, 代表氢原子或选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基。

6. 权利要求 1-5 中的一项或多项权利要求的化合物, 其特征在于 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11})-S(=O)_2-R^{12}$; $-OR^{13}$; $-SR^{14}$; $-C(=O)-OR^{15}$; $-NR^{16}R^{17}$; $-C(=O)-R^{18}$; $-(C=O)-NR^{19}R^{20}$; $-O-(C=O)-R^{21}$; $-S(=O)_2-R^{22}$; $-S(=O)_2-NR^{23}R^{24}$; $-NR^{25}-C(=O)-NR^{26}R^{27}$; $-NR^{28}-C(=O)-R^{29}$; $-NR^{30}-C(=O)-OR^{31}$; $-NR^{32}-S(=O)NR^{33}R^{34}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35}$; F , Cl , Br , I ; $-CF_3$; $-CHF_2$; $-CH_2F$; 直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子,

优选地, R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11})-SO_2-R^{12}$; $-OR^{13}$; $-SR^{14}$; $-C(=O)-OR^{15}$; $-NR^{16}R^{17}$; $-C(=O)-R^{18}$; $-(C=O)-NR^{19}R^{20}$; $-O-(C=O)-R^{21}$; $-S(=O)_2-R^{22}$; $-S(=O)_2-NR^{23}R^{24}$; $-NR^{25}-C(=O)-NR^{26}R^{27}$; $-NR^{28}-C(=O)-R^{29}$; $-NR^{30}-C(=O)-OR^{31}$; $-NR^{32}-S(=O)NR^{33}R^{34}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35}$; F , Cl , Br , I ; $-CF_3$; $-CHF_2$; $-CH_2F$; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、

-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基通过-(CH₂)_{1, 2 或 3}-基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代：C₁₋₅-烷基、-O-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷基、-O-(C=O)-C₁₋₅-烷基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地，R⁵、R⁶、R⁷和R⁸，其是相同或不同的，各自代表-H；-NO₂；-CN；-N(R¹¹)-SO₂-R¹²；-OR¹³；-SR¹⁴；-C(=O)-OR¹⁵；-NR¹⁶R¹⁷；-F，Cl，Br，I；-CF₃；-CHF₂；-CH₂F；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过-(CH₂)_{1, 2 或 3}-基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代：C₁₋₅-烷基、-O-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷基、-O-(C=O)-C₁₋₅-烷基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-

$C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

在每一情况下条件是取代基 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 当中的至少一个代表 $-N(R^{11})-S(=O)_2-R^{12}$ 部分。

7. 权利要求 1-6 中的一项或多项权利要求的化合物，其特征在于取代基 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 当中一个的代表 $-N(R^{11})-S(=O)_2-R^{12}$ 部分。

8. 权利要求 7 的化合物，其特征在于取代基 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 中的一个代表 $-N(R^{11})-S(=O)_2-R^{12}$ 部分，而这些取代基中的另外三个各自代表氢原子。

9. 权利要求 1-8 中的一项或多项权利要求的化合物，其特征在于 R^9 和 R^{10} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团；或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接，并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子，

优选地， R^9 和 R^{10} 各自独立地代表选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；或者选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

10. 权利要求 1-9 中的一项或多项权利要求的化合物，其特征在于

R^{11} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取

代了的 C_{1-10} -脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接，并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；或者 $-S(=O)_2-R^{36}$ 部分，

优选地， R^{11} 代表氢原子；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷$

基、 $-S(=O)_2-$ 苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或 $-S(=O)_2-R^{36}$ 部分，

更优选地， R^{11} 代表氢原子。

11. 权利要求 1-10 中的一项或多项权利要求的化合物，其特征在于

R^{12} 代表任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的、任选至少单取代了的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的单环或双环状系统稠合，

其中，所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环，并且所述杂芳基和任选所述环状系统的一个或两个环含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，或者

R^{12} 代表饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团通过直链或支链的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

其中，所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环并且所述脂环族基团和任选所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

优选地， R^{12} 代表选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)，吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基、2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基、苯并噁唑啉基、苯并噻唑啉基、苯并咪唑烷基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、色烯基和苯并二氢吡喃基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2或3}-$ 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)$ 、

-5-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过-(CH₂)_{1、2或3}-基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代：C₁₋₅-烷基、-O-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、氧代(=O)、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷基、-O-(C=O)-C₁₋₅-烷基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地，R¹²代表选自下列的芳基或杂芳基：苯基、1-萘基、2-萘基、吡唑基、噻吩基(噻吩基)、苯并[b]-噻吩基、苯并[b]呋喃基、喹啉基、异喹啉基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噻唑基和2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过-(CH₂)_{1、2或3}-基团连接和/或可以被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-CF₂H、CFH₂、-C(=O)-O-CH₃、C(=O)-O-CH₂-CH₃、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

12. 权利要求1-11中的一项或多项权利要求的化合物，其特征在于R¹³-R³⁵彼此独立地各自代表氢原子；直链或支链C₁₋₁₀烷基；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的3-9元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链C₁₋₆-亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；或者任选至少单取代了的5-10元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基通过直链或支链C₁₋₆-亚烷基连接，并且其中所述杂芳基含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；

优选地，R¹³-R³⁵彼此独立地代表氢原子；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基-(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

13. 权利要求 1-12 中的一项或多项权利要求的化合物，其特征在于 R^{36} 代表任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的、任选至少单取代了的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的单环或双环状系统稠合，

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环，并且所述杂芳基和任选所述环状系统的一个或两个环含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

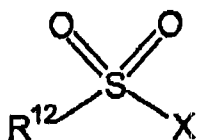
或者 R^{36} 代表饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环并且所述脂环族基团和任选所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子,

优选地, R^{36} 代表选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、2-氧代-2,3-二氢-苯并咪唑基、2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基、苯并咪唑基、苯并噻唑基、苯并咪唑烷基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、色烯基和苯并二氢吡喃基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、

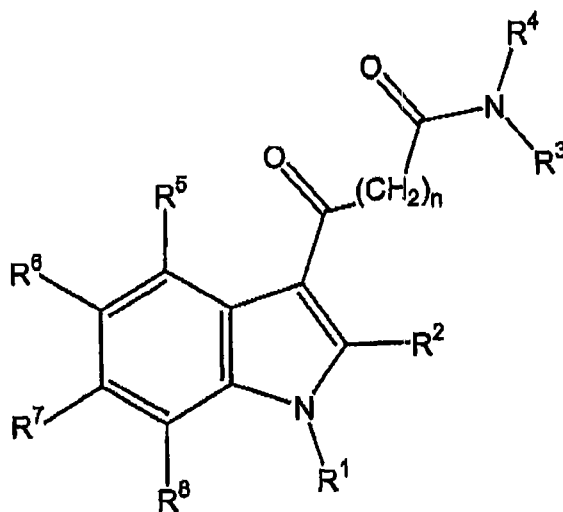
环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

14. 制备权利要求 1 - 13 中的一项或多项权利要求的化合物的方法，其特征在于使至少一种通式 II 化合物，



II

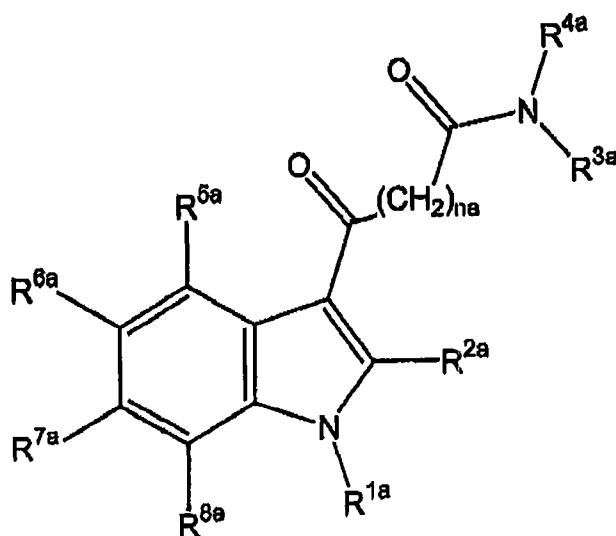
其中 R^{12} 具有权利要求 1 - 13 中的一项或多项权利要求的含义，并且 X 代表离去基团，优选卤原子，特别优选氯原子，与至少一种通式 III 化合物，



III

其中 $\text{R}^1 - \text{R}^4$ 和 n 具有权利要求 1 - 13 中的一项或多项权利要求的含义，并且 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 具有权利要求 1 - 13 中的一项或多项权利要求的含义，条件是取代基 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 中的至少一个是 $-\text{N}(\text{R}^{11})(\text{H})$ 部分，在适宜的反应介质中，优选在至少一种碱和/或至少一种辅助剂存在下，进行反应。

15. 包含至少一种通式 Ia 的取代了的吡啶化合物的药物,



Ia

其中

na 代表 0、1、2、3 或 4,

对于 na = 0: R^{1a} 代表氢原子; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团; 任选至少单取代了的芳基或杂芳基; -S(=O)₂-R^{9a}; 或 -C(=O)-R^{10a},

对于 na = 1、2、3 或 4: R^{1a} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接; -S(=O)₂-R^{9a}; 或 -C(=O)-R^{10a},

R^{2a} 代表 -H; -NO₂; -NH₂; -SH; -OH; -CN; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连

接,

R^{3a} 和 R^{4a} , 其是相同或不同的, 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的脂族基团, 任选至少单取代了的芳基或杂芳基基团, 所述基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合, 或者

R^{3a} 和 R^{4a} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的杂环, 所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单或多环状系统稠合,

R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$; $-OR^{13a}$; $-SR^{14a}$; $-C(=O)-OR^{15a}$; $-NR^{16a}R^{17a}$; $-C(=O)-R^{18a}$; $-(C=O)-NR^{19a}R^{20a}$; $-O-(C=O)-R^{21a}$; $-S(=O)_2-R^{22a}$; $-S(=O)_2-NR^{23a}R^{24a}$; $-NR^{25a}-C(=O)-NR^{26a}R^{27a}$; $-NR^{28a}-(C=O)-R^{29a}$; $-NR^{30a}-(C=O)-OR^{31a}$; $-NR^{32a}-S(=O)NR^{33a}R^{34a}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35a}$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

条件是取代基 R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 中的至少一个代表 $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$ 部分,

R^{9a} 和 R^{10a} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

R^{11a} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接; 任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或

支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接；或者 - $S(=O)_2 - R^{36a}$ 部分，

R^{12a} 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

$R^{13a} - R^{35a}$ 各自独立地代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接；或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接，

R^{36a} 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

所述化合物任选是一种其立体异构体，优选对映体或非对映体、外消旋体的形式，或者是至少两种其立体异构体，优选对映体和/或非对映体以任何混合比率的混合物，或是其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

16. 权利要求 15 的药物，其特征在于

对于 $na = 0$ ： R^{1a} 代表氢原子；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团；任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基； $-S(=O)_2 - R^{9a}$ ；或 $-C(=O) - R^{10a}$ ，

对于 $na = 1, 2, 3$ 或 4： R^{1a} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任

选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接; 任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接; $-S(=O)_2-R^{9a}$; 或 $-C(=O)-R^{10a}$,

R^{2a} 代表 $-H$; $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接,

R^{3a} 和 R^{4a} , 其是相同或不同的, 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合, 或者

R^{3a} 和 R^{4a} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的 4-9 元杂环, 所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单或多环状系统稠合,

R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$; $-OR^{13a}$; $-SR^{14a}$; $-C(=O)-OR^{15a}$; $-NR^{16a}R^{17a}$; $-C(=O)-R^{18a}$; $-(C=O)-NR^{19a}R^{20a}$; $-O-(C=O)-R^{21a}$; $-S(=O)_2-R^{22a}$; $-S(=O)_2-NR^{23a}R^{24a}$; $-NR^{25a}-C(=O)-NR^{26a}R^{27a}$; $-NR^{28a}-(C=O)-R^{29a}$; $-NR^{30a}-(C=O)-OR^{31a}$; $-NR^{32a}-S(=O)NR^{33a}R^{34a}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35a}$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的

5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接,

条件是取代基 R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 中的至少一个代表 $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$ 部分,

R^{9a} 和 R^{10a} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团; 或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接,

R^{11a} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接; 任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接; 或者 $-S(=O)_2-R^{36a}$ 部分,

R^{12a} 代表任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的、任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合; 或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

$R^{13a}-R^{35a}$ 各自独立地代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接,

R^{36a} 代表任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取

代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合。

17. 权利要求 15 或 16 的药物，其特征在于

对于 $na = 0$

R^{1a} 代表氢原子；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子； $-S(=O)_2-R^{9a}$ ；或 $-C(=O)-R^{10a}$ ，

优选地， R^{1a} 代表氢原子；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶烷基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2-苯基$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、-

NH_2 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基； $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{9a}$ ；或 $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{10a}$ ，

更优选地， R^{1a} 代表氢原子，

对于 $na = 1, 2, 3$ 或 4

R^{1a} 代表氢原子；直链或支链 C_{1-10} 烷基；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 $3-9$ 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 $1, 2$ 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；任选至少单取代了的 $5-10$ 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接并且其中所述杂芳基含有 $1, 2$ 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子； $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{9a}$ ；或 $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{10a}$ ，

优选地， R^{1a} 代表氢原子；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被 $1, 2, 3, 4$ 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： $\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、氧代($=\text{O}$)、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和

咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; $-S(=O)_2-R^{9a}$; 或 $-C(=O)-R^{10a}$ 。

18. 权利要求 15-17 中的一项或多项权利要求的药物, 其特征在于

R^{2a} 代表 $-H$; $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; $-CF_3$; $-OCH_3$; $-O-CH_2-CH_3$; F; Cl; Br; I; 直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子,

优选地, R^{2a} 代表 $-H$; $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; $-CF_3$; $-OCH_3$; $-O-CH_2-CH_3$; F; Cl; Br; I; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啉基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; $-S(=O)_2-R^{9a}$; 或 $-C(=O)-R^{10a}$ 。

-5-烷基)、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；
或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1,2\text{ 或 }3}$ -基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_{1-5}\text{-烷基}$ 、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地， R^{2a} 代表氢原子。

19. 权利要求15-18中的一项或多项权利要求的药物，其特征在于

R^{3a} 和 R^{4a} ，其是相同或不同的，代表氢原子或者直链或支链 C_{1-8} 烷基

或者

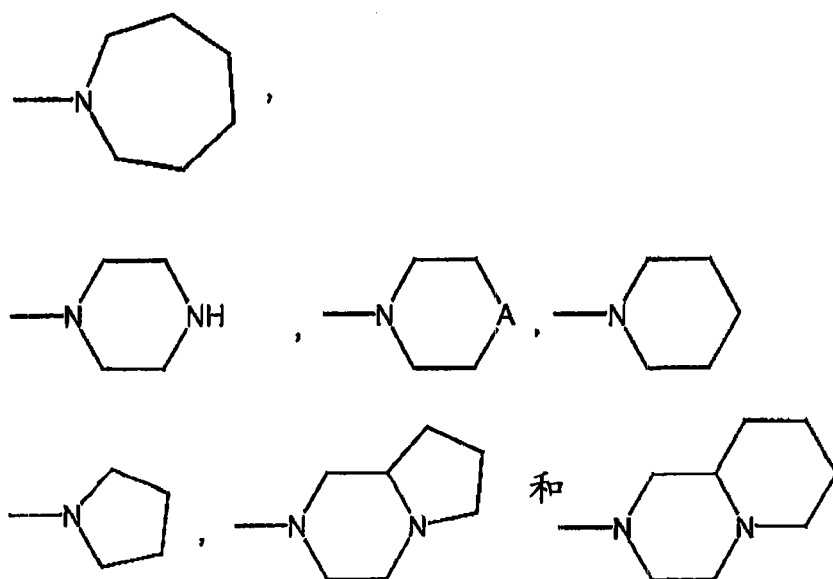
R^{3a} 和 R^{4a} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的4-9元杂环，所述杂环可以与任选至少单取代了的单环或双环状系统稠合，

所述环状系统的环是5、6或7元环，并且所述杂环和所述环状系统的一个或两个环可以含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

优选地

R^{3a} 和 R^{4a} ，其是相同或不同的，代表氢原子或选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；
或者

R^{3a} 和 R^{4a} 与桥联氮原子共同形成选自下列的部分



A 代表氧原子或硫原子，并且每一个前述环状部分可以在包括哌嗪环的氮原子在内的任何位置上被 1、2 或 3 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2-苯基$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地， R^{3a} 和 R^{4a} ，其是相同或不同的，代表氢原子或选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基。

20. 权利要求 15-19 中的一项或多项权利要求的药物，其特征在于

R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} ，其是相同或不同的，代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-CN$ ； $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$ ； $-OR^{13a}$ ； $-SR^{14a}$ ； $-C(=O)-OR^{15a}$ ； $-NR^{16a}R^{17a}$ ； $-C(=O)-R^{18a}$ ； $-(C=O)-NR^{19a}R^{20a}$ ； $-O-(C=O)-R^{21a}$ ； $-S(=O)_2-R^{22a}$ ； $-S(=O)_2-NR^{23a}R^{24a}$ ； $-NR^{25a}$ ； $-C(=O)-$

$\text{NR}^{26a}\text{R}^{27a}$; $-\text{NR}^{28a}-(\text{C}=\text{O})-\text{R}^{29a}$; $-\text{NR}^{30a}-(\text{C}=\text{O})-\text{OR}^{31a}$; $-\text{NR}^{32a}-\text{S}(=\text{O})\text{NR}^{33a}\text{R}^{34a}$; 或 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{OR}^{35a}$; F、Cl、Br、I; $-\text{CF}_3$; $-\text{CHF}_2$; $-\text{CH}_2\text{F}$; 直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子,

优选地, R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} , 其是相同或不同的, 代表 $-\text{H}$; $-\text{NO}_2$; $-\text{CN}$; $-\text{N}(\text{R}^{11a})-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{12a}$; $-\text{OR}^{13a}$; $-\text{SR}^{14a}$; $-\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^{15a}$; $-\text{NR}^{16a}\text{R}^{17a}$; $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{18a}$; $-(\text{C}=\text{O})-\text{NR}^{19a}\text{R}^{20a}$; $-\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{R}^{21a}$; $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{22a}$; $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{NR}^{23a}\text{R}^{24a}$; $-\text{NR}^{25a}-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}^{26a}\text{R}^{27a}$; $-\text{NR}^{28a}-(\text{C}=\text{O})-\text{R}^{29a}$; $-\text{NR}^{30a}-(\text{C}=\text{O})-\text{OR}^{31a}$; $-\text{NR}^{32a}-\text{S}(=\text{O})\text{NR}^{33a}\text{R}^{34a}$; 或 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{OR}^{35a}$; F, Cl, Br, I; $-\text{CF}_3$; $-\text{CHF}_2$; $-\text{CH}_2\text{F}$; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶烷基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或者

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧

啉基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

更优选地, R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} , 其是相同或不同的, 各自代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$; $-OR^{13a}$; $-SR^{14a}$; $-C(=O)-OR^{15a}$; $-NR^{16a}R^{17a}$; $-F$, Cl , Br , I ; $-CF_3$; $-CHF_2$; $-CH_2F$; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基; 或者

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

在每一情况下条件是取代基 R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 中的至少一个代表 $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$ 部分。

21. 权利要求 15-20 中的一项或多项权利要求的药物, 其特征在于取代基 R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 中的一个代表 $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$

部分。

22. 权利要求 21 的药物, 其特征在于, 其特征在于取代基 R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 中的一个代表 $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$ 部分, 而这些取代基中的另外三个各自代表氢原子。

23. 权利要求 15-22 中的一项或多项权利要求的药物, 其特征在于

R^{9a} 和 R^{10a} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子,

优选地, R^{9a} 和 R^{10a} 各自独立地代表选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基; 或者选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

24. 权利要求 15-23 中的一项或多项权利要求的药物, 其特征在于

R^{11a} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} -脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链

的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接，并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；或者 $-S(=O)_2-R^{36a}$ 部分，

优选地， R^{11a} 代表氢原子；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啉基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啉基、哒嗪基、嘧啉基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者 $-S(=O)_2-R^{36a}$ -部分，

更优选地， R^{11a} 代表氢原子。

25. 权利要求 15-24 中的一项或多项权利要求的药物，其特征在于 R^{12a} 代表任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或

杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的单环或双环状系统稠合，

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环，并且所述杂芳基和任选所述环状系统的一个或两个环含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

或者 R^{12a} 代表饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环并且所述脂环族基团和任选所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

优选地， R^{12a} 代表选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基、2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基、苯并噁唑啉基、苯并噻唑啉基、苯并咪唑烷基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、色烯基和苯并二氢吡喃基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2-苯基$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选

自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2-苯基$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地， R^{12a} 代表选自下列的芳基或杂芳基：苯基、1-萘基、2-萘基、噻吩基(噻吩基)、吡唑基、苯并[b]-噻吩基、苯并[b]呋喃基、喹啉基、异喹啉基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噻唑基和2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2或3}$ -基团连接和/或可以被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-CF_2H$ 、 CFH_2 、 $-C(=O)-O-CH_3$ 、 $C(=O)-O-CH_2-CH_3$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

26. 权利要求15-25中的一项或多项权利要求的药物，其特征在于 $R^{13a}-R^{35a}$ 彼此独立地各自代表氢原子；直链或支链 C_{1-10} 烷基；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的3-9元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；或者任选至少单取代了的5-10元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接，并且其中所述杂芳基含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；

优选地， $R^{13a}-R^{35a}$ 彼此独立地代表氢原子；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2或3}$ -基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷

基、 $-\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}$ -烷基)、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}$ -烷基)、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-\text{S}(\text{=O})_2-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}(\text{=O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基-(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}$ -烷基)、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}$ -烷基)、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-\text{S}(\text{=O})_2-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}(\text{=O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

27. 权利要求 15-26 中的一项或多项权利要求的药物，其特征在于 R^{36a} 代表任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的单环或双环状系统稠合，

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环，并且所述杂芳基和任选所述环状系统的一个或两个环含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

或者 R^{36a} 代表饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环，并且所述脂环族基团和任选

所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧或硫的杂原子，

优选地， R^{36a} 代表选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、2-氧代-2,3-二氢-苯并咪唑基、2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基、苯并咪唑啉基、苯并噻唑啉基、苯并咪唑烷基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、色烯基和苯并二氢吡喃基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

28. 权利要求 15-27 中的一项或多项权利要求的药物，其特征在于 na 是 0。

29. 权利要求 15-28 中的一项或多项权利要求的药物，其特征在于

na 是 0,

R^{1a} 代表氢原子,

R^{2a} 代表氢原子,

R^{3a} 和 R^{4a} , 其是相同或不同的, 代表选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基,

取代基 R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 中的一个代表 $-N(R^{11a})-S(=O)-R^{12a}$ 一部分, 而这些取代基中的另外三个各自代表氢原子,

R^{11a} 代表氢原子,

R^{12a} 代表选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、1-萘基、2-萘基、吡唑基、噻吩基(噻吩基)、苯并[b]-噻吩基、苯并[b]呋喃基、喹啉基、异喹啉基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基和 2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或可以被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-CF_2H$ 、 CFH_2 、 $-C(=O)-O-CH_3$ 、 $C(=O)-O-CH_2-CH_3$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

30. 权利要求 15-29 中的一项或多项权利要求的药物, 其特征在于取代了的吲哚化合物选自

[1] 2-[5-(5-氯-3-甲基-苯并[b]噻吩-2-磺酰基氨基)-1H-吲哚-3-基]-N,N-二乙基-2-氧代乙酰胺,

[2] N,N-二乙基-2-[5-(萘-2-磺酰基氨基)-1H-吲哚-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[3] N,N-二乙基-2-[5-(萘-1-磺酰基氨基)-1H-吲哚-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[4] 2-[5-(联苯-4-磺酰基氨基)-1H-吲哚-3-基]-N,N-二乙基-2-氧代-乙酰胺,

[5] N,N-二乙基-2-氧代-2-[5-(喹啉-8-磺酰基氨基)-1H-吲哚-3-基]-乙酰胺,

[6] N,N-二甲基-2-[5-(萘-2-磺酰基氨基)-1H-吲哚-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[7] N,N-二甲基-2-[5-(萘-1-磺酰基氨基)-1H-吲哚-3-

基]-2-氧代-乙酰胺,

[8] 2-[5-(5-氯-3-甲基-苯并[b]噻吩-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[9] 2-[5-(6-氯-咪唑并[2,1-b]噻唑-5-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二乙基-2-氧代-乙酰胺,

[10] 2-[5-(6-氯-咪唑并[2,1-b]噻唑-5-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[11] N,N-二甲基-2-[4-(萘-1-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[12] 2-[4-(5-氯-3-甲基-苯并[b]噻吩-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[13] 2-[4-(6-氯-咪唑并[2,1-b]噻唑-5-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[14] N,N-二甲基-2-[5-[(4-氯-3-甲基-苯基)-1-磺酰基氨基]-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[15] 5-(3-二甲基氨基草酰基-1H-吡啶-5-基氨基磺酰基)-3-甲基-苯并呋喃-2-甲酸乙基酯,

[16] 2-[5-(联苯-4-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[17] N,N-二甲基-2-氧代-2-[5-(2-氧代-2,3-二氢-苯并噻唑-6-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-乙酰胺,

[18] N,N-二甲基-2-氧代-2-[5-(2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑-6-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基]乙酰胺,

[19] 2-[5-[(4-环己基-苯基)-1-磺酰基氨基]-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[20] N,N-二甲基-2-[5-[(4-苯氧基-苯基)-1-磺酰基氨基]-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[21] 2-(5-(5-氯-3-甲基苯并[b]噻吩-2-亚磺酰氨基)-2-甲基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[22] 2-(5-(6-氯咪唑并[2,1-b]噻唑-5-亚磺酰氨基)-2-甲基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[23] 2-(6-(5-氯-3-甲基苯并[b]噻吩-2-亚磺酰氨基)-1H

- 吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[24] N,N-二甲基-2-(6-(萘-3-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺

[25] 2-(6-(联苯-4-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[26] N,N-二甲基-2-(6-(萘-1-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺,

[27] N,N-二甲基-2-(6-(2-(萘-1-基)乙基亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺,

[28] N,N-二甲基-2-氧代-2-(6-(4-苯氧基苯基亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)乙酰胺,

[29] 2-(6-(3,4-二氯噻吩-2-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[30] 2-(6-(3,5-二氯苯基亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[31] 2-(6-(1-氯萘-6-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[32] 2-(6-(6-氯咪唑并[2,1-b]噻唑-5-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[33] N,N-二乙基-2-(2-甲基-5-(5-甲基-1-苯基-1H-吡唑-4-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺和

[34] N,N-二乙基-2-(2-甲基-5-(1,3,5-三甲基-1H-吡唑-4-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺。

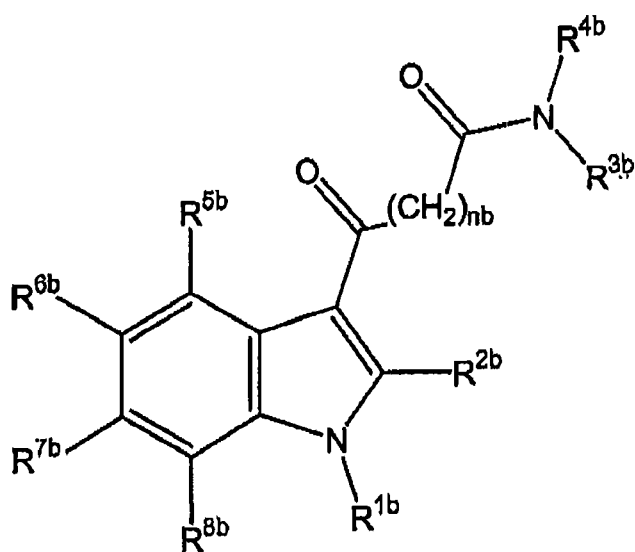
31. 权利要求 15-30 中的一项或多项权利要求的药物, 所述药物适用于预防和/或治疗至少部分是由 5-HT₆-受体介导的病症或疾病。

32. 权利要求 15-31 中的一项或多项权利要求的药物, 所述药物适用于预防和/或治疗与食物摄取有关的病症或疾病, 优选适用于调节食欲, 适用于保持、增加或减少体重, 适用于预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病), 优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病。

33. 权利要求 15-31 中的一项或多项权利要求的药物, 所述药物

适用于预防和/或治疗过敏性结肠综合征；中枢神经系统病症；焦虑；惊恐发作；抑郁；双相性精神障碍；认知障碍；记忆障碍；老年痴呆；精神病；神经变性病症,优选选自阿尔茨海默病、帕金森病、亨廷顿病和多发性硬化；精神分裂症；精神病；多动障碍(ADHD, 注意缺陷/多动障碍)或适用于改善认知(认知提高)。

34. 至少一种通式 Ib 的取代了的吲哚化合物在制备适用于预防和/或治疗至少部分是由 5-HT₆-受体介导的病症或疾病方面的药物的应用,



Ib

其中

nb 代表 0、1、2、3 或 4,

R^{1b} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接；任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接；-S(=O)₂-R^{9b}；或 -C(=O)-R^{10b},

R^{2b} 代表 -H；-NO₂；-NH₂；-SH；-OH；-CN；卤原子；

直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接；或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接，

R^{3b} 和 R^{4b} ，其是相同或不同的，代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的脂族基团，任选至少单取代了的芳基或杂芳基基团，所述基团可以通过直链或支链亚烷基连接；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，或者

R^{3b} 和 R^{4b} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的杂环，所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单或多环状系统稠合，

R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} ，其是相同或不同的，代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-CN$ ； $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ ； $-OR^{13b}$ ； $-SR^{14b}$ ； $-C(=O)-OR^{15b}$ ； $-NR^{16b}R^{17b}$ ； $-C(=O)-R^{18b}$ ； $-(C=O)-NR^{19b}R^{20b}$ ； $-O-(C=O)-R^{21b}$ ； $-S(=O)_2-R^{22b}$ ； $-S(=O)_2-NR^{23b}R^{24b}$ ； $-NR^{25b}-C(=O)-NR^{26b}R^{27b}$ ； $-NR^{28b}-(C=O)-R^{29b}$ ； $-NR^{30b}-(C=O)-OR^{31b}$ ； $-NR^{32b}-S(=O)NR^{33b}R^{34b}$ ；或 $-S(=O)_2-OR^{35b}$ ；卤原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接；或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接，

条件是取代基 R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 中的至少一个代表 $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ 部分，

R^{9b} 和 R^{10b} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团；或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接，

R^{11b} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接；任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接；或者 $-S(=O)_2 - R^{36b}$ 部分，

R^{12b} 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

$R^{13b} - R^{35b}$ 各自独立地代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接；或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接，

R^{36b} 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

所述化合物任选是一种其立体异构体，优选对映体或非对映体、外消旋体的形式，或者是至少两种其立体异构体，优选对映体和/或非对映体以任何混合比率的混合物，或是其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

35. 权利要求 34 的应用，其特征在于

R^{1b} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取

代了的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接； $-S(=O)_2-R^{9b}$ ；或 $-C(=O)-R^{10b}$ ，

R^{2b} 代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-NH_2$ ； $-SH$ ； $-OH$ ； $-CN$ ；卤原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

R^{3b} 和 R^{4b} ，其是相同或不同的，代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团；任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，或者

R^{3b} 和 R^{4b} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的 4-9 元杂环，所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单或多环状系统稠合，

R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} ，其是相同或不同的，代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-CN$ ； $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ ； $-OR^{13b}$ ； $-SR^{14b}$ ； $-C(=O)-OR^{15b}$ ； $-NR^{16b}R^{17b}$ ； $-C(=O)-R^{18b}$ ； $-(C=O)-NR^{19b}R^{20b}$ ； $-O-(C=O)-R^{21b}$ ； $-S(=O)_2-R^{22b}$ ； $-S(=O)_2-NR^{23b}R^{24b}$ ； $-NR^{25b}-C(=O)-NR^{26b}R^{27b}$ ； $-NR^{28b}-(C=O)-R^{29b}$ ； $-NR^{30b}-(C=O)-OR^{31b}$ ； $-NR^{32b}-S(=O)NR^{33b}R^{34b}$ ；或 $-S(=O)_2-OR^{35b}$ ；卤原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基

团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

条件是取代基 R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 中的至少一个代表 $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ 部分，

R^{9b} 和 R^{10b} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

R^{11b} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接；任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接；或者 $-S(=O)_2-R^{36b}$ 部分，

R^{12b} 代表任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

$R^{13b}-R^{35b}$ 各自独立地代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

R^{36b} 代表任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的、任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、

C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合。

36. 权利要求 34 或 35 的应用，其特征在于 R^{1b} 代表氢原子；直链或支链 C_{1-10} 烷基；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接，并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子； $-S(=O)_2-R^{9b}$ ；或 $-C(=O)-R^{10b}$ ，

优选地， R^{1b} 代表氢原子；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和

咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; $-S(=O)_2-R^{9b}$; 或 $-C(=O)-R^{10b}$,

更优选地, R^{1b} 代表氢原子。

37. 权利要求 34-36 中的一项或多项权利要求的应用, 其特征在于

R^{2b} 代表 $-H$; $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; $-CF_3$; $-OCH_3$; $-O-CH_2-CH_3$; F; Cl; Br; I; 直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子,

优选地, R^{2b} 代表 $-H$; $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; $-CF_3$; $-OCH_3$; $-O-CH_2-CH_3$; F; Cl; Br; I; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、

-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过-(CH₂)_{1, 2 或 3}-基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代：直链或支链C₁₋₅-烷基、-O-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷基、-O-(C=O)-C₁₋₅-烷基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地，R^{2b}代表氢原子。

38. 权利要求34-37中的一项或多项权利要求的应用，其特征在于

R^{3b}和R^{4b}，其是相同或不同的，代表氢原子或者直链或支链C₁₋₈烷基，或者

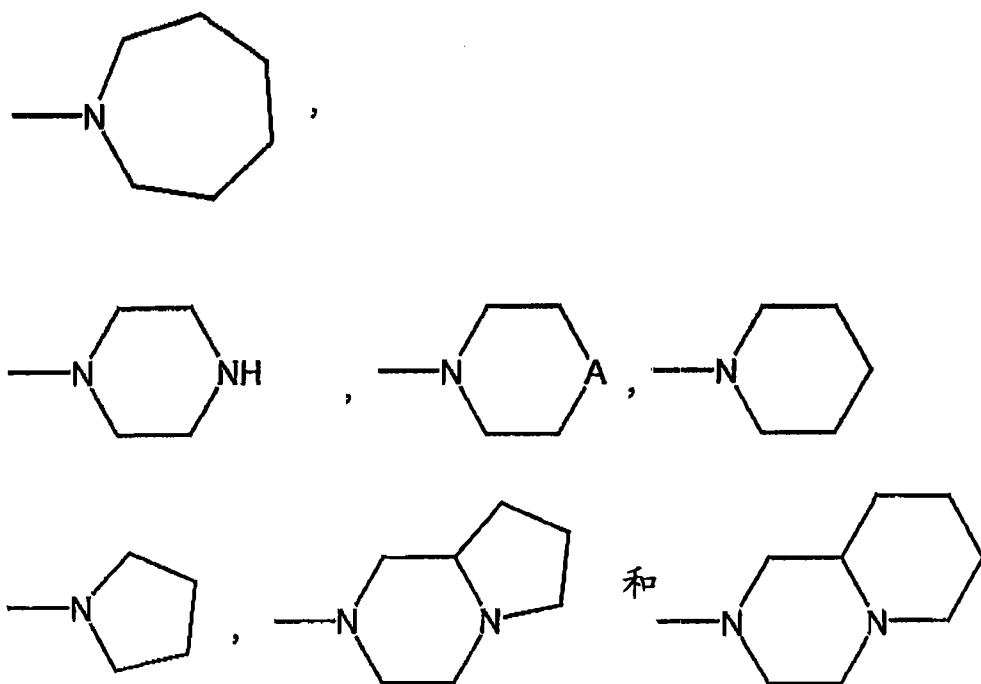
R^{3b}和R^{4b}与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的4-9元杂环，所述杂环可以与任选至少单取代了的单环或双环状系统稠合，

所述环状系统的环是5、6或7元环，并且所述杂环和所述环状系统的一个或两个环可以含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

优选地

R^{3b}和R^{4b}，其是相同或不同的，代表氢原子或选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；或者

R^{3b}和R^{4b}与桥联氮原子共同形成选自下列的部分



A 代表氧原子或硫原子，并且每一个前述环状部分可以在包括哌嗪环的氮原子在内的任何位置上被 1、2 或 3 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地， R^{3b} 和 R^{4b} ，其是相同或不同的，代表氢原子或选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基。

39. 权利要求 34-38 中的一项或多项权利要求的应用，其特征在于

R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} ，其是相同或不同的，代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-CN$ ； $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ ； $-OR^{13b}$ ； $-SR^{14b}$ ； $-C(=O)-OR^{15b}$ ； $-NR^{16b}R^{17b}$ ； $-C(=O)-R^{18b}$ ； $-(C=O)-NR^{19b}R^{20b}$ ； $-O-(C=O)-$

R^{21b} ; $-S(=O)_2-R^{22b}$; $-S(=O)_2-NR^{23b}R^{24b}$; $-NR^{25b}-C(=O)-NR^{26b}R^{27b}$; $-NR^{28b}-C(=O)-R^{29b}$; $-NR^{30b}-C(=O)-OR^{31b}$; $-NR^{32b}-S(=O)NR^{33b}R^{34b}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35b}$; F, Cl, Br, I; $-CF_3$; $-CHF_2$; $-CH_2F$; 直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子,

优选地, R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11b})-SO_2-R^{12b}$; $-OR^{13b}$; $-SR^{14b}$; $-C(=O)-OR^{15b}$; $-NR^{16b}R^{17b}$; $-C(=O)-R^{18b}$; $-(C=O)-NR^{19b}R^{20b}$; $-O-(C=O)-R^{21b}$; $-S(=O)_2-R^{22b}$; $-S(=O)_2-NR^{23b}R^{24b}$; $-NR^{25b}-C(=O)-NR^{26b}R^{27b}$; $-NR^{28b}-C(=O)-R^{29b}$; $-NR^{30b}-C(=O)-OR^{31b}$; $-NR^{32b}-S(=O)NR^{33b}R^{34b}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35b}$; F, Cl, Br, I; $-CF_3$; $-CHF_2$; $-CH_2F$; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶烷基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、

吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

更优选地, R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} , 其是相同或不同的, 各自代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11b})-SO_2-R^{12b}$; $-OR^{13b}$; $-SR^{14b}$; $-C(=O)-OR^{15b}$; $-NR^{16b}R^{17b}$; $-F$, Cl , Br , I ; $-CF_3$; $-CHF_2$; $-CH_2F$; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基; 或者

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

在每一情况下条件是取代基 R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 中的至少一个代表 $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ 部分。

40. 权利要求 34-39 中的一项或多项权利要求的应用, 其特征在

于取代基 R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 中的一个代表 $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ 部分。

41. 权利要求 40 的应用, 其特征在于取代基 R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 中的一个代表 $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ 部分, 而这些取代基中的另外三个各自代表氢原子。

42. 权利要求 34 - 41 中的一项或多项权利要求的应用, 其特征在于

R^{9b} 和 R^{10b} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 或者任选至少单取代了的 5 - 10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子,

优选地, R^{9b} 和 R^{10b} 各自独立地代表选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基; 或者选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

43. 权利要求 34 - 42 中的一项或多项权利要求的应用, 其特征在于

R^{11b} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} -脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3 - 9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 任选至少单

取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者 $-S(=O)_2-R^{36b}$ 部分,

优选地, R^{11b} 代表氢原子; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基;

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或 $-S(=O)_2-R^{36b}$ -部分,

更优选地, R^{11b} 代表氢原子。

44. 权利要求 34-43 中的一项或多项权利要求的应用, 其特征在

于 R^{12b} 代表任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的单环或双环状系统稠合,

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环, 并且所述杂芳基和任选所述环状系统的一个或两个环含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子,

或者 R^{12b} 代表饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环并且所述脂环族基团和任选所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子,

优选地, R^{12b} 代表选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基、2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基、苯并噁唑啉基、苯并噻唑啉基、苯并咪唑烷基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、色烯基和苯并二氢吡喃基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团

可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ - 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} - 烷基、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ - 烷基、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}$ - 烷基、氧代(=O)、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ - 烷基、 $-\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ - 烷基、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5} \text{ - 烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5} \text{ - 烷基})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5} \text{ - 烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5} \text{ - 烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5} \text{ - 烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ - 苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地， R^{12b} 代表选自下列的芳基或杂芳基：苯基、1 - 萘基、2 - 萘基、吡唑基、噻吩基(噻吩基)、苯并[b] - 噻吩基、苯并[b]咪唑基、喹啉基、异喹啉基、咪唑并[2,1 - b]噻唑基、2 - 氧代 - 2,3 - 二氢 - 苯并噻唑基和 2 - 氧代 - 2,3 - 二氢苯并[d]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ - 基团连接和/或可以被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 CFH_2 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_3$ 、 $\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

45. 权利要求 34 - 44 中的一项或多项的权利要求的应用，其特点是 $\text{R}^{13b} - \text{R}^{35b}$ 彼此独立地各自代表氢原子；直链或或支链的 C_{1-10} 烷基；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3 - 9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；或者任选至少单取代了的 5 - 10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；

优选地， $\text{R}^{13b} - \text{R}^{35b}$ 彼此独立地代表氢原子；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：，环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啉基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ - 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} - 烷基、 $-\text{O}$

-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、氧代(=O)、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷基、-O-(C=O)-C₁₋₅-烷基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基-(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过-(CH₂)_{1,2或3}-基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代：C₁₋₅-烷基、-O-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷基、-O-(C=O)-C₁₋₅-烷基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

46. 权利要求34-45中的一项或多项权利要求的应用，其特征在于R^{36b}代表任选至少单取代了的5-10元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的C₁₋₆-亚烷基、C₂₋₆-亚烯基或C₂₋₆-亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的单环或双环状系统稠合，

所述环状系统的环是5、6或7元环，并且所述杂芳基和任选所述环状系统的一个或两个环含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

或者R^{36b}代表饱和或不饱和的、任选至少单取代了的3-9元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链C₁₋₆-亚烷基、C₂₋₆-亚烯基或C₂₋₆-亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环并且所述脂环族基团和任选所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

优选地， R^{36b} 代表选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基、2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基、苯并噁唑啉基、苯并噻唑啉基、苯并咪唑烷基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、色烯基和苯并二氢吡喃基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基，氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

47. 权利要求 34-46 中的一项或多项权利要求的应用，其特征在于 nb 是 0。

48. 权利要求 34-47 中的一项或多项权利要求的应用，其特征在

于

nb 是 0,

R^{1b} 代表氢原子,

R^{2b} 代表氢原子,

R^{3b} 和 R^{4b} , 其是相同或不同的, 代表选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基,

取代基 R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 中的一个代表 $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ 一部分, 而这些取代基中的另外三个各自代表氢原子,

R^{11b} 代表氢原子,

R^{12b} 代表选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、1-萘基、2-萘基、吡唑基、噻吩基(噻吩基)、苯并[b]-噻吩基、苯并[b]呋喃基、喹啉基、异喹啉基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基和 2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或可以被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-CF_2H$ 、 CFH_2 、 $-C(=O)-O-CH_3$ 、 $C(=O)-O-CH_2-CH_3$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

49. 权利要求 34-48 中的一项或多项权利要求的应用, 其特征在于取代了的吡啶化合物选自

[1] 2-[5-(5-氯-3-甲基-苯并[b]噻吩-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二乙基-2-氧代乙酰胺,

[2] N,N-二乙基-2-[5-(萘-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[3] N,N-二乙基-2-[5-(萘-1-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[4] 2-[5-(联苯-4-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二乙基-2-氧代-乙酰胺,

[5] N,N-二乙基-2-氧代-2-[5-(喹啉-8-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-乙酰胺,

[6] N,N-二甲基-2-[5-(萘-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[7] N,N-二甲基-2-[5-(萘-1-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[8] 2-[5-(5-氯-3-甲基-苯并[b]噻吩-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[9] 2-[5-(6-氯-咪唑并[2,1-b]噻唑-5-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二乙基-2-氧代-乙酰胺,

[10] 2-[5-(6-氯-咪唑并[2,1-b]噻唑-5-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[11] N,N-二甲基-2-[4-(萘-1-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[12] 2-[4-(5-氯-3-甲基-苯并[b]噻吩-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[13] 2-[4-(6-氯-咪唑并[2,1-b]噻唑-5-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[14] N,N-二甲基-2-[5-[(4-氯-3-甲基-苯基)-1-磺酰基氨基]-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[15] 5-(3-二甲基氨基草酰基-1H-吡啶-5-基氨基磺酰基)-3-甲基-苯并呋喃-2-甲酸乙酯,

[16] 2-[5-(联苯-4-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[17] N,N-二甲基-2-氧代-2-[5-(2-氧代-2,3-二氢-苯并噻唑-6-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-乙酰胺,

[18] N,N-二甲基-2-氧代-2-[5-(2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑-6-亚磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]乙酰胺,

[19] 2-[5-[(4-环己基-苯基)-1-磺酰基氨基]-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[20] N,N-二甲基-2-[5-[(4-苯氧基-苯基)-1-磺酰基氨基]-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[21] 2-(5-(5-氯-3-甲基苯并[b]噻吩-2-亚磺酰基氨基)-2-甲基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[22] 2-(5-(6-氯咪唑并[2,1-b]噻唑-5-亚磺酰基氨基)-2-甲基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[23] 2-(6-(5-氯-3-甲基苯并[b]噻吩-2-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[24] N,N-二甲基-2-(6-(萘-3-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺

[25] 2-(6-(联苯-4-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[26] N,N-二甲基-2-(6-(萘-1-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺,

[27] N,N-二甲基-2-(6-(2-(萘-1-基)乙基亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺,

[28] N,N-二甲基-2-氧代-2-(6-(4-苯氧基苯基亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)乙酰胺,

[29] 2-(6-(3,4-二氯噻吩-2-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[30] 2-(6-(3,5-二氯苯基亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[31] 2-(6-(1-氯萘-6-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[32] 2-(6-(6-氯咪唑并[2,1-b]噻唑-5-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[33] N,N-二乙基-2-(2-甲基-5-(5-甲基-1-苯基-1H-吡唑-4-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺和

[34] N,N-二乙基-2-(2-甲基-5-(1,3,5-三甲基-1H-吡唑-4-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺。

50. 权利要求 34-49 中的一项或多项权利要求在制备适用于预防和/或治疗与食物摄入有关的病症或疾病, 优选适用于调节食欲, 保持、增加或减少体重, 预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病), 优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病的药物方面的应用。

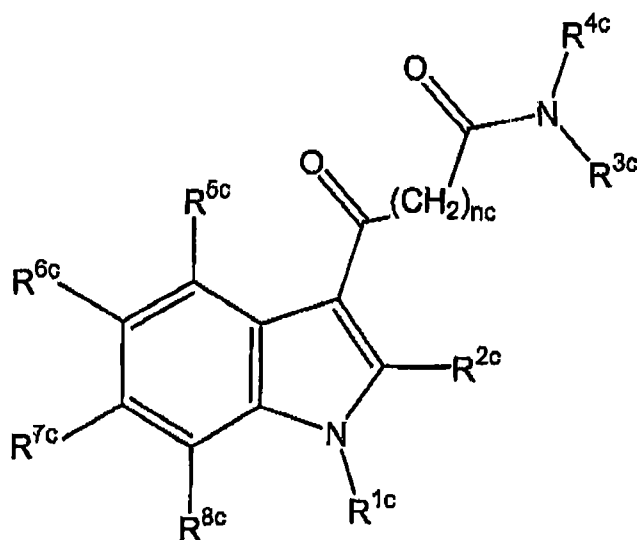
51. 权利要求 34-49 中的一项或多项权利要求在制备适用于预防和/或治疗过敏性结肠综合征; 中枢神经系统病症; 焦虑; 惊恐发作; 抑郁; 双相性精神障碍; 认知障碍; 记忆障碍; 老年痴呆; 精神病;

神经变性病症,优选选自阿尔茨海默病、帕金森病、亨廷顿病和多发性硬化;精神分裂症;精神病;多动障碍(ADHD, 注意缺陷/多动障碍)或适用于改善认知(认知提高)的药物方面的应用。

52. 权利要求 34 - 49 中的一项或多项权利要求的至少一种化合物在制备适用于预防和/或治疗与食物摄入有关的病症或疾病, 优选适用于调节食欲, 保持、增加或减少体重, 预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病), 优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病的药物方面的应用。

53. 权利要求 34 - 49 中的一项或多项权利要求的至少一种化合物在制备适用于预防和/或治疗肠道病症, 优选适用于治疗过敏性结肠综合征; 中枢神经系统病症; 焦虑; 惊恐发作; 抑郁; 双相性精神障碍; 认知障碍; 记忆障碍; 老年痴呆; 精神病; 神经变性病症, 优选选自阿尔茨海默病、帕金森病、亨廷顿病和多发性硬化; 精神分裂症; 精神病; 多动障碍(ADHD, 注意缺陷/多动障碍)或适用于改善认知(认知提高)的药物方面的应用。

54. 通式 Ic 的取代了的吲哚化合物,



Ic

其中

n_c 代表 0、1、2、3 或 4,

R^{1c} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接; $-S(=O)_2-R^{9c}$; 或 $-C(=O)-R^{10c}$,

R^{2c} 代表 $-H$; $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

R^{3c} 和 R^{4c} , 其是相同或不同的, 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的脂族基团, 任选至少单取代了的芳基或杂芳基基团, 所述基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合, 或者

R^{3c} 和 R^{4c} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的杂环, 所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单或多环状系统稠合,

R^{5c} 、 R^{6c} 、 R^{7c} 和 R^{8c} , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11c})-S(=O)_2-R^{12c}$; $-OR^{13c}$; $-SR^{14c}$; $-C(=O)-OR^{15c}$; $-NR^{16c}R^{17c}$; $-C(=O)-R^{18c}$; $-(C=O)-NR^{19c}R^{20c}$; $-O-(C=O)-R^{21c}$; $-S(=O)_2-R^{22c}$; $-S(=O)_2-NR^{23c}R^{24c}$; $-NR^{25c}-C(=O)-NR^{26c}R^{27c}$; $-NR^{28c}-(C=O)-R^{29c}$; $-NR^{30c}-(C=O)-OR^{31c}$; $-NR^{32c}-S(=O)NR^{33c}R^{34c}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35c}$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少

含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

条件是取代基 R^{5c} 、 R^{6c} 、 R^{7c} 和 R^{8c} 中的一个代表 $-N(R^{11c})-S(=O)_2-R^{12c}$ 部分,

R^{9c} 和 R^{10c} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

R^{11c} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接; 任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接; 或者 $-S(=O)_2-R^{36c}$ 部分,

R^{12c} 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合; 或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

$R^{13c}-R^{35c}$ 各自独立地代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

R^{36c} 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合; 或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链

或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

所述化合物任选是一种其立体异构体, 优选对映体或非对映体、外消旋体的形式, 或者是至少两种其立体异构体, 优选对映体和/或非对映体以任何混合比率的混合物, 或是其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

55. 权利要求 54 的化合物, 其特征在于 R^{5c} 代表 $-N(R^{11c})-SO_2-R^{12c}$ - 部分。

56. 权利要求 54 的化合物, 其特征在于 R^{6c} 代表 $-N(R^{11c})-SO_2-R^{12c}$ - 部分。

57. 权利要求 54 的化合物, 其特征在于 R^{7c} 代表 $-N(R^{11c})-SO_2-R^{12c}$ - 部分。

58. 权利要求 54 的化合物, 其特征在于 R^{8c} 代表 $-N(R^{11c})-SO_2-R^{12c}$ - 部分。

59. 权利要求 54 - 58 中的一项或多项权利要求的化合物, 其特征在于 nc 是 0。

60. 包含至少一种权利要求 54 - 59 中的一项或多项权利要求的化合物和任选至少一种辅助物质的药物。

61. 至少一种权利要求 54 - 59 中的一项或多项权利要求的化合物在制备适用于预防和/或防止至少部分是由 5-HT₆ 受体介导的病症或疾病的药物方面的应用。

62. 权利要求 61 在制备适用于预防和/或治疗与食物摄入有关的病症或疾病, 优选适用于调节食欲, 保持、增加或减少体重, 预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病), 优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病的药物方面的应用。

63. 权利要求 61 在制备适用于预防和/或治疗过敏性结肠综合征; 中枢神经系统病症; 焦虑; 惊恐发作; 抑郁; 双相性精神障碍; 认知障碍; 记忆障碍; 老年痴呆; 精神病; 神经变性病症, 优选选自阿尔茨海默病、帕金森病、亨廷顿病和多发性硬化; 精神分裂症; 精神病; 多动障碍(ADHD, 注意缺陷/多动障碍)或适用于改善认知(认知提高)的药物方面的应用。

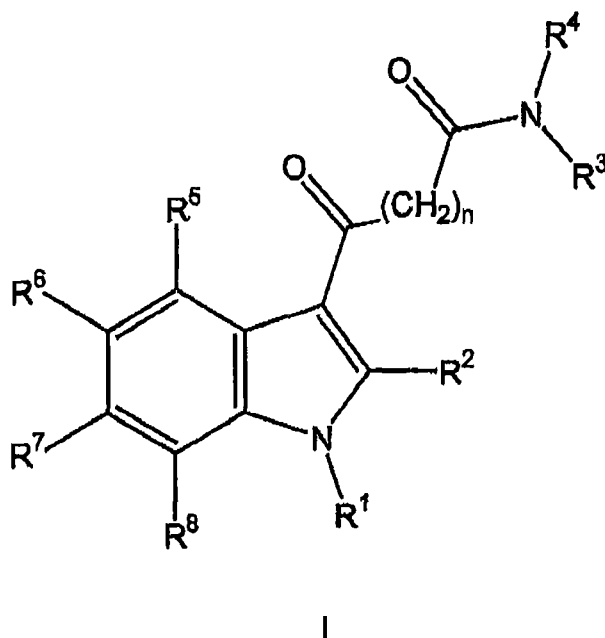
64. 至少一种权利要求 54 - 59 中的一项或多项权利要求的化合物

在预防和/或治疗与食物摄入有关的病症或疾病，优选适用于调节食欲，保持、增加或减少体重，预防或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病)，优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病方面的应用。

65. 至少一种权利要求 54 - 59 中的一项或多项权利要求的化合物在制备适用于预防和/或治疗过敏性结肠综合征；中枢神经系统病症；焦虑；惊恐发作；抑郁；双相性精神障碍；认知障碍；记忆障碍；老年痴呆；精神病；神经变性病症，优选选自阿尔茨海默病、帕金森病、亨廷顿病和多发性硬化；精神分裂症；精神病；多动障碍(ADHD，注意缺陷/多动障碍)或适用于改善认知(认知提高)的药物方面的应用。

取代了的吲哚化合物、其制备和在药物中的应用

本发明涉及通式 I 的取代了的吲哚化合物，



其制备方法，包含取代了的吲哚化合物的药物，以及取代了的吲哚化合物在制备适用于例如预防和/或治疗至少部分地由 5-HT₆ 受体介导的病症或疾病的药物方面的应用。

血清素受体(5-HT)超家族包括 7 类(5-HT₁ - 5-HT₇)，这 7 类包括 14 个人亚类[D. Hoyer, 等人, *Neuropharmacology*, 1997, 36, 419]。5-HT₆ 受体是通过在大鼠[F. J. Monsma 等人, *Mol. Pharmacol.*, 1993, 43, 320; M. Ruat 等人, *Biochem. Biophys. Res. Commun.*, 1993, 193, 268]和人[R. Kohen, 等人, *J. Neurochem.*, 1996, 66, 47]中分子克隆鉴定的最后的血清素受体。

具有 5-HT₆ 受体亲和力的化合物用于治疗各种中枢神经和胃肠道病症，例如肠易激惹综合征。具有 5-HT₆ 受体亲和力的化合物也用于治疗焦虑、抑郁和认知记忆病症[M. Yoshioka 等人, *Ann. NY Acad. Sci.*, 1998, 861, 244; A. Bourson 等人, *Br. J. Pharmacol.*, 1998, 125, 1562; D.C. Rogers 等人, *Br. J. Pharmacol. Suppl.*, 1999, 127, 22P; A. Bourson 等人, *J. Pharmacol. Exp. Ther.*, 1995, 274, 173; A. J. Sleight,

等人, *Behav. Brain Res.*, 1996, 73, 245; T.A. Branchek 等人, *Annu. Rev. Pharmacol. Toxicol.*, 2000, 40, 319; C. Routledge 等人, *Br. J. Pharmacol.*, 2000, 130, 1606]。已经证明, 治疗精神分裂症的典型和非典型抗精神病药对 5-HT₆ 受体具有高亲和力[B.L. Roth 等人, *J. Pharmacol. Exp. Ther.*, 1994, 268, 1403; C. E. Glatt 等人, *Mol. Med.*, 1995, 1, 398; F. J. Mosma, 等人, *Mol. Pharmacol.*, 1993, 43, 320; T. Shinkai 等人, *Am. J. Med. Genet.*, 1999, 88, 120]。具有 5-HT₆ 受体亲和力的化合物用于治疗婴儿多动症(ADHD、注意缺陷/多动障碍) [W.D. Hirst 等人, *Br. J. Pharmacol.*, 2000, 130, 1597; C. Gérard 等人, *Brain Research*, 1997, 746, 207; M. R. Pranzatelli, *Drugs of Today*, 1997, 33, 379]。

而且, 已经证明, 5-HT₆ 受体也在食物摄入中起着作用 [Neuropharmacology, 41, 2001, 210 - 219]。

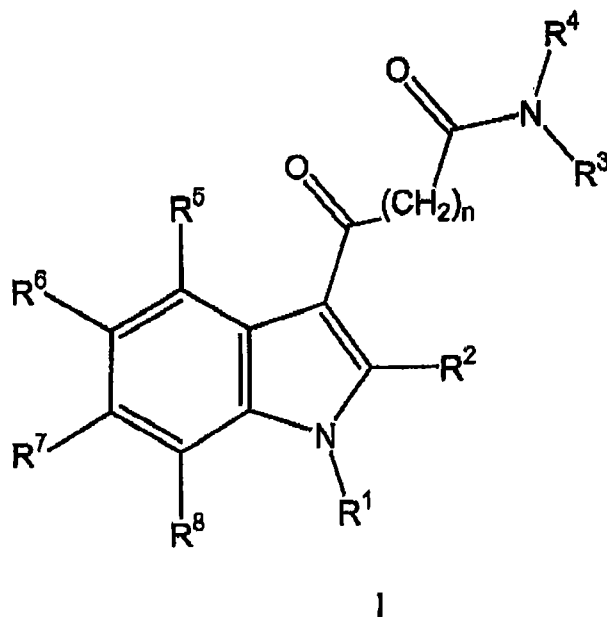
食物摄入病症, 尤其是肥胖症, 由于其增加发展为其它严重的乃至危及生命的疾病例如糖尿病或冠心病的风险, 因此对所有年龄组的人的健康是严重而迅速增长的威胁。

US 2003/0181482 A1 公开了取代了的吲哚-3-基-氧代乙酰氨基化合物, 其中像取代了的芳基或杂芳基那样的不同的取代基通过亚甲基连接到吲哚环系统的氮原子上。据报道这些化合物显示细胞毒和抗癌活性以及血管发生抑制活性。

本发明的目的是提供适用作为药物中的特别是适用于预防和/或治疗与 5-HT₆ 受体有关的病症或疾病的药物中的活性组分的化合物。

意想不到地是, 已经发现下面给定的通式 I、Ia、Ib 和 Ic 的取代了的吲哚化合物对 5-HT₆ 受体显示出好乃至极好的亲和力。因此, 这些化合物特别适合作为用于预防和/或治疗与 5-HT₆ 受体有关的病症或疾病的药物中的药物活性剂。

因此, 本发明的一个方面涉及通式 I 的取代了的吲哚化合物



其中

n 代表 0、1、2、3 或 4,

R^1 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接; $-S(=O)_2-R^9$; 或者 $-C(=O)-R^{10}$,

对于 $n=0$: R^2 代表 $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

对于 $n=1, 2, 3$ 或 4: R^2 代表 $-H$; $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者

任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

R^3 和 R^4 , 其是相同或不同的, 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的脂族基团, 任选至少单取代了的芳基或杂芳基基团, 所述基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族可以通过直链或支链亚烷基连接和/或所述脂环族可以与任选至少单取代了的单或多环状系统稠合, 或者

R^3 和 R^4 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或者芳族的杂环, 所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单或多环状系统稠合,

R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11})-S(=O)_2-R^{12}$; $-OR^{13}$; $-SR^{14}$; $-C(=O)-OR^{15}$; $-NR^{16}R^{17}$; $-C(=O)-R^{18}$; $-(C=O)-NR^{19}R^{20}$; $-O-(C=O)-R^{21}$; $-S(=O)_2-R^{22}$; $-S(=O)_2-NR^{23}R^{24}$; $-NR^{25}-C(=O)-NR^{26}R^{27}$; $-NR^{28}-(C=O)-R^{29}$; $-NR^{30}-(C=O)-OR^{31}$; $-NR^{32}-S(=O)NR^{33}R^{34}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35}$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

条件是取代基 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 中的至少一个代表 $-N(R^{11})-S(=O)_2-R^{12}$ 部分,

R^9 和 R^{10} , 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

R^{11} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接; 任

选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接；或者 -S(=O)₂-R³⁶ 部分，

R¹² 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

R¹³、R¹⁴、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、R¹⁸、R¹⁹、R²⁰、R²¹、R²²、R²³、R²⁴、R²⁵、R²⁶、R²⁷、R²⁸、R²⁹、R³⁰、R³¹、R³²、R³³、R³⁴ 和 R³⁵ 各自独立地代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接；或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接，

R³⁶ 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

所述化合物任选是一种其立体异构体，优选对映体或非对映体、外消旋体的形式，或者是至少两种其立体异构体，优选对映体和/或非对映体以任何混合比率的混合物，或是其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

优选的是上面给定的通式 I 化合物，其中

n 代表 0、1、2、3 或 4，

R¹ 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C₁₋₁₀ 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选

至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-5} -亚烷基连接; 任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接; $-S(=O)_2-R^9$; 或 $-C(=O)-R^{10}$,

对于 $n=0$: R^2 代表 $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接,

对于 $n=1, 2, 3$ 或 4 : R^2 代表 $-H$; $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接,

R^3 和 R^4 , 其是相同或不同的, 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合, 或者

R^3 和 R^4 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的 4-9 元杂环, 所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11})-S(=O)_2-R^{12}$; $-OR^{13}$; $-SR^{14}$; $-C(=O)-OR^{15}$; $-NR^{16}R^{17}$; $-C(=O)-R^{18}$; $-(C=O)-NR^{19}R^{20}$; $-O-(C=O)-R^{21}$; $-S(=O)_2-$

R^{22} ; $-S(=O)_2-NR^{23}R^{24}$; $-NR^{25}-C(=O)-NR^{26}R^{27}$; $-NR^{28}-C(=O)-R^{29}$; $-NR^{30}-C(=O)-OR^{31}$; $-NR^{32}-S(=O)NR^{33}R^{34}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35}$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接,

条件是取代基 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 中的至少一个代表 $-N(R^{11})-S(=O)_2-R^{12}$ 部分,

R^9 和 R^{10} , 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团; 或者任选至少单取代了的、5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接,

R^{11} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接; 任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接; 或 $-S(=O)_2-R^{36}$ 部分,

R^{12} 代表任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合; 或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

$R^{13}-R^{35}$, 各自独立地代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基

团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接,

R^{36} 代表任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合; 或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

所述化合物任选是一种其立体异构体, 优选对映体或非对映体、外消旋体的形式, 或者是至少两种其立体异构体, 优选对映体和/或非对映体以任何混合比率的混合物, 或是其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

还优选的是上面给定的通式 I 的化合物, 其中 R^1 代表氢原子; 直链或支链 C_{1-10} 烷基; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; $-S(=O)_2-R^9$; 或 $-C(=O)-R^{10}$,

优选地, R^1 代表氢原子; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啉基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、

-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过-(CH₂)_{1, 2 或 3}-基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代：C₁₋₅-烷基、-O-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷基、-O-(C=O)-C₁₋₅-烷基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；-S(=O)₂-R⁹；或-C(=O)-R¹⁰，

并且n和R²-R³⁶具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——以任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，上面给定的通式I这样的取代了的吡啶化合物是优选的，其中

对于n=0

R²代表-NO₂；-NH₂；-SH；-OH；-CN；-CF₃；-OCH₃；-O-CH₂-CH₃；F；Cl；Br；I；直链或支链的、饱和或不饱和的C₁₋₁₀脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的3-9元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链C₁₋₆-亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；或者任选至少单取代了的5-10元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链C₁₋₆-亚烷基连接，并且其中所述杂芳基含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子，

优选地, R^2 代表 $-\text{NO}_2$; $-\text{NH}_2$; $-\text{SH}$; $-\text{OH}$; $-\text{CN}$; $-\text{CF}_3$; $-\text{OCH}_3$; $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$; F ; Cl ; Br ; I ; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶烷基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基、和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ - 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} - 烷基、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ - 烷基、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}$ - 烷基、氧代($=\text{O}$)、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ - 烷基、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ - 烷基、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5} \text{ - 烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5} \text{ - 烷基})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5} \text{ - 烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5} \text{ - 烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}$ - 烷基、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ - 苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或者

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ - 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} - 烷基、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ - 烷基、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}$ - 烷基、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ - 烷基、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ - 烷基、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5} \text{ - 烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5} \text{ - 烷基})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5} \text{ - 烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5} \text{ - 烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}$ - 烷基、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ - 苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基, 并且

对于 $n = 1, 2, 3$ 或 4

R^2 代表 $-\text{H}$; $-\text{NO}_2$; $-\text{NH}_2$; $-\text{SH}$; $-\text{OH}$; $-\text{CN}$; $-\text{CF}_3$; $-\text{OCH}_3$; $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$; F ; Cl ; Br ; I ; 直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9

元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子,

优选地, R^2 代表 $-H$; $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; $-CF_3$; $-OCH_3$; $-O-CH_2-CH_3$; F ; Cl ; Br ; I ; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基、和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或者

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: 直链或支链 C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2$

-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地，R²代表氢原子，

并且n、R¹和R³-R³⁶具有上面定义的含义，所述化合物任选是一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者是至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

还优选的是上面给定的通式I的取代了的吡啶化合物，其中R³和R⁴，其是相同或不同的，代表氢原子或者直链或支链C₁₋₈烷基，或者

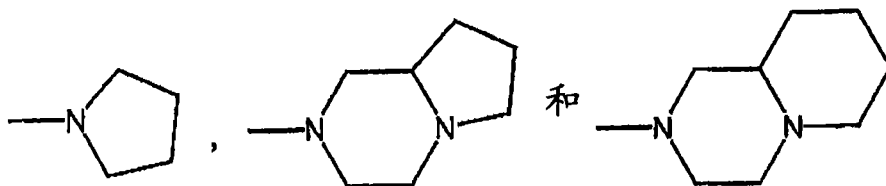
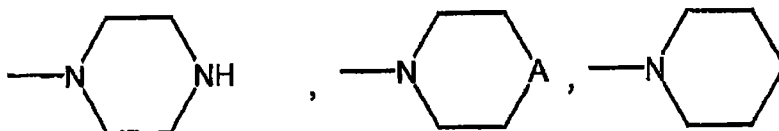
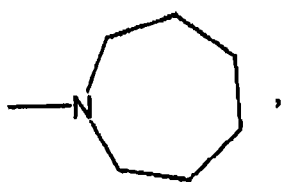
R³和R⁴与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的4-9元杂环，所述杂环可以与任选至少单取代了的单环或双环状系统稠合，

所述环状系统的环是5、6或7元环，并且所述杂环和环状系统的一个或两个环可以含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

优选地

R³和R⁴，其是相同或不同的，代表氢原子或选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；或者

R³和R⁴与桥联氮原子共同形成选自下列的部分



A 代表氧原子或硫原子，并且上述的环部分各自可以在包括哌嗪环的氮原子在内的任何位置上被 1、2 或 3 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地， R^3 和 R^4 ，其是相同或不同的，代表氢原子或选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基，

并且 n 、 R^1 、 R^2 和 R^5-R^{36} 具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，上面给定的通式 I 的这样的取代了的吡啶化合物是优选的，其中

R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 ，其是相同或不同的，代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-CN$ ； $-N(R^{11})-S(=O)_2-R^{12}$ ； $-OR^{13}$ ； $-SR^{14}$ ； $-C(=O)-OR^{15}$ ； $-NR^{16}R^{17}$ ； $-C(=O)-R^{18}$ ； $-(C=O)-NR^{19}R^{20}$ ； $-O-(C=O)-R^{21}$ ； $-S(=O)_2-R^{22}$ ； $-S(=O)_2-NR^{23}R^{24}$ ； $-NR^{25}-C(=O)-NR^{26}R^{27}$ ； $-NR^{28}-(C=O)-R^{29}$ ； $-NR^{30}-(C=O)-OR^{31}$ ； $-NR^{32}-S(=O)NR^{33}R^{34}$ ；或 $-S(=O)_2-OR^{35}$ ；F、Cl、Br、I； $-CF_3$ ； $-CHF_2$ ； $-CH_2F$ ；直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接，并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子，

优选地, R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11})-SO_2-R^{12}$; $-OR^{13}$; $-SR^{14}$; $-C(=O)-OR^{15}$; $-NR^{16}R^{17}$; $-C(=O)-R^{18}$; $-(C=O)-NR^{19}R^{20}$; $-O-(C=O)-R^{21}$; $-S(=O)_2-R^{22}$; $-S(=O)_2-NR^{23}R^{24}$; $-NR^{25}-C(=O)-NR^{26}R^{27}$; $-NR^{28}-(C=O)-R^{29}$; $-NR^{30}-(C=O)-OR^{31}$; $-NR^{32}-S(=O)NR^{33}R^{34}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35}$; F 、 Cl 、 Br 、 I ; $-CF_3$; $-CHF_2$; $-CH_2F$; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基、和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或者

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯

氧基和苄基,

更优选地, R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 , 其是相同或不同的, 各自代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11})-SO_2-R^{12}$; $-OR^{13}$; $-SR^{14}$; $-C(=O)-OR^{15}$; $-NR^{16}R^{17}$; $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$; $-CF_3$; $-CHF_2$; $-CH_2F$; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基; 或者

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

在每一情况下条件是取代基 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 中的至少一个代表 $-N(R^{11})-S(=O)_2-R^{12}$ 部分,

并且 n 、 R^1-R^4 和 R^9-R^{36} 具有上面定义的含义, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

另外优选的上面给定的通式 I 化合物是这样的化合物, 其中取代基 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 中的一个代表 $-N(R^{11})-S(=O)_2-R^{12}$ 部分, 而这些取代基中的另外三个具有上面定义的含义, 优选地, 取代基 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 中的一个代表 $-N(R^{11})-S(=O)_2-R^{12}$ 部分, 而这些取代基中的另外三个各自代表氢原子, 并且 n 、 R^1-R^4 和 R^9-R^{36} ——如果存在——具有上面定义的含义, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选

对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，上面给定的通式 I 的这样的取代了的吡啶化合物是优选的，其中

R^9 和 R^{10} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团；或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接，并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子，

优选地， R^9 和 R^{10} 各自独立地代表选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基，异丁基和叔丁基；或者选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

并且 n 、 R^1-R^8 和 $R^{11}-R^{36}$ 具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，上面给定的通式 I 的这样的取代了的吡啶化合物是优选的，其中

R^{11} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} -脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9

元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者 $-S(=O)_2-R^{36}$ 部分,

优选地, R^{11} 代表氢原子; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基;

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯

氧基和苄基；或者 $-S(=O)_2-R^{36}$ - 部分，

更优选地， R^{11} 代表氢原子，

并且 n 、 R^1-R^{10} 和 $R^{12}-R^{36}$ 具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，上面给定的通式 I 的这样的取代了的吡啶化合物是优选的，其中 R^{12} 代表任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或可以与任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的单环或双环状系统稠合，

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环，并且所述杂芳基和任选所述环状系统的一个或两个环含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

或者 R^{12} 代表饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环，并且所述脂环族基团和任选所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

优选地， R^{12} 代表选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基、2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基、苯并噁唑基、苯并噻唑基、苯并咪唑基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、色烯基和苯并二氢吡喃基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、

F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶烷基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过-(CH₂)_{1、2或3}-基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代：C₁₋₅-烷基、-O-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、氧代(=O)、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷基、-O-(C(=O)-C₁₋₅-烷基)、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地，R¹²代表选自下列的芳基或杂芳基：苯基、1-萘基、2-萘基、吡唑基、噻吩基(噻吩基)、苯并[b]-噻吩基、苯并[b]呋喃基、喹啉基、异喹啉基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噻唑基和2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过-(CH₂)_{1、2或3}-基团连接和/或可以被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-CF₂H、CFH₂、-C(=O)-O-CH₃、C(=O)-O-CH₂-CH₃、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

并且n、R¹-R¹¹和R¹³-R³⁶具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

还优选的是上面给定的通式I的这样的取代了的吡啶化合物，其中R¹³-R³⁵彼此独立地各自代表氢原子；直链或支链C₁₋₁₀烷基；饱和

或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子;

优选地, $R^{13} - R^{35}$ 彼此独立地代表氢原子; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啉基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或者

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基-(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啉基、吡嗪基、嘧啉基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基; F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯

氧基和苄基,

并且 n 、 $R^1 - R^{12}$ 和 R^{36} 具有上面定义的含义, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

而且, 上面给定的通式 I 的这样的取代了的吡啶化合物是优选的, 其中 R^{36} 代表任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的单环或双环状系统稠合,

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环, 并且所述杂芳基和任选所述环状系统的一个或两个环含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子,

或者 R^{36} 代表饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环并且所述脂环族基团和任选所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子,

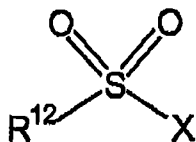
优选地, R^{36} 代表选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基、2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基、苯并噁唑啉基、苯并噻唑啉基、苯并咪唑烷基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、色烯基和苯并二氢吡喃基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-$

NH_2 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代： $\text{C}_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}\text{-烷基}$ 、氧代($=\text{O}$)、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{C}_{1-5}\text{-烷基}$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

并且 n 和 R^1-R^{35} 具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

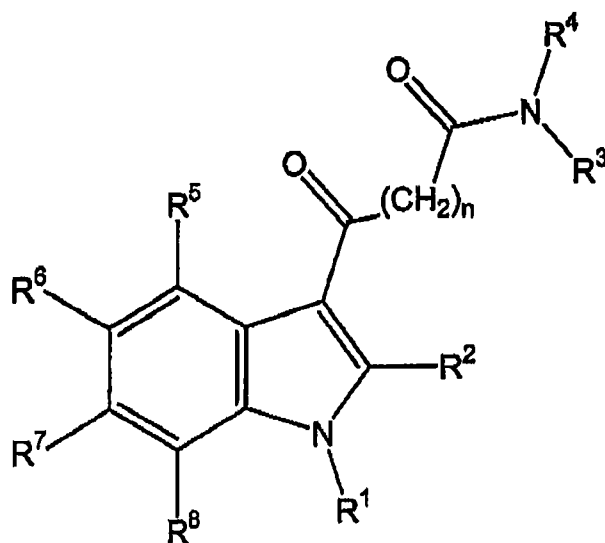
在任何前述定义中，以下条件可以适用，即 R^3 和 R^4 两者不同一地代表氢原子。

本发明的另外方面涉及上面给定的通式 I 的取代了的吡啶化合物的制备方法，按照该方法，使至少一种通式 II 化合物，



II

其中 R^{12} 具有上面给定的含义，并且 X 代表离去基团，优选卤原子，特别优选氯原子，与至少一种通式 III 化合物，



III

其中 $R^1 - R^4$ 和 n 具有上面给定的含义，并且 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 具有上面给定的含义，条件是取代基 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 中的至少一个代表 $-N(R^{11})(H)$ 部分或其保护了的衍生物，在适宜的反应介质中，优选在至少一种碱和/或至少一种辅助剂存在下，进行反应。

如果使用保护了的衍生物，在反应后必须除去各个保护基，以获得所需的通式 I 的取代了的吲哚化合物。适宜的保护基以及引入和除去这样的保护基的方法，如下面所述，是本领域的技术人员众所周知的。

用于通式(II)和(III)化合物之间反应的适宜的反应介质包括有机溶剂，例如二烷基醚，优选乙醚，或者环醚，优选四氢呋喃或二噁烷；或者卤代烃，优选二氯甲烷或氯仿；醇，优选甲醇或乙醇；偶极非质子溶剂，优选乙腈、吡啶或二甲基甲酰胺；或者任何其它适宜的反应介质。当然，也可以使用至少两种类型溶剂或一种类型的至少两种溶剂的混合物。

反应优选在至少一种适宜的碱存在下进行，所述适宜的碱例如，无机碱例如碱金属的氢氧化物或碳酸盐和/或有机碱，优选三乙胺或吡啶。

反应优选在 -10°C 至室温之间即大约 25°C 的温度进行，并且反应时间优选在 5 分钟至 24 小时之间。

可以按照本领域技术人员众所周知的方法对上面给定的通式(I)化合物进行纯化和/或分离。优选地,可以通过以下方法来分离通式(I)化合物:通过将反应介质蒸发,加入水并调节 pH 值以获得可以通过过滤分离的固体形式的化合物,或者通过用不与水溶混的溶剂例如氯仿萃取,并通过色谱法或从适宜的溶剂中重结晶进行纯化。

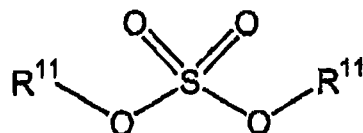
通式(II)化合物是可以从市场上买到的,或者可以按照本领域众所周知的方法例如类似于 E.E. Gilbert, *Synthesis*, 1969, 1, 3 的文献中描述的方法制备。

通式 III 化合物也可以从市场上买到,或者可以按照本领域技术人员已知的方法例如 Dillard 等人, *Journal of Medicinal Chemistry* 1996, 39(26), 5119 - 5136 中描述的方法,通过还原相应的硝基衍生物来制备,所述硝基衍生物可以从市场上买到,或者可以按照本领域技术人员已知的方法例如下列文献公开中描述的方法来制备: Primofiore 等人, *Journal of Medicinal Chemistry* 2001, 44(14), 2286 - 2297, Da Settimo 等人 *Generoso. Farmaco* 1993, 48(2), 285 - 295, Da Settimo 等人 *Journal of Medicinal Chemistry* 1996, 39(26), 5083 - 5091, Macor 等人 *Synthetic Communications* 1993, 23(1), 65 - 72., Settimo 等人 *Gazzetta Chimica Italiana* 1962, 92, 150 - 164, Primofiore 等人 *Journal of Medicinal Chemistry* 1989, 32(12), 2514 - 2518, Primofiore 等人 *European Journal of Medicinal Chemistry* 1988, 23(4), 397 - 401。

上面引用的文献描述的有关部分特此引入本文作为参考并形成本公开的部分。

或者,上面给定的通式(I)的取代了的吡啶化合物,其中 R^{11} 代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团;饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团,所述脂环族基团是通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接的;或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基,所述芳基或杂芳基是通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接的,并且所有其他取代基具有上面定义的含义,也可以通过烷基化类型反应,由相应的通式(I)化合物,其中 R^{11} 代表氢原子并且所有的其他取代基具有上面给定的含义,来制

备，例如通过与相应的卤化物 $R^{11}-X$ ，其中 X 代表卤原子，优选氯原子，或者通式 IV 的硫酸酯（盐）



IV

其中在每一情况下 R^{11} 具有前述含义，反应来制备。所述相应的卤化物和硫酸酯可以从市场上买到，或者可以按照本领域的技术人员众所周知的方法来制备。

烷基化类型反应优选在至少一种适宜的碱存在下，在适宜的反应介质存在下进行，所述适宜的碱例如碱金属的氢氧化物和/或碳酸盐，金属氢化物，烃氧基金属例如甲醇钠或叔丁醇钾，有机金属化合物例如正丁基锂或叔丁基锂，所述适宜的反应介质例如二烷基醚，优选乙醚，或环醚，优选四氢呋喃或二噁烷，烃，优选甲苯，醇，优选甲醇或乙醇，偶极非质子溶剂，优选乙腈、吡啶或二甲基甲酰胺，或任何其他适宜的反应介质。当然，也可以使用至少两种类型溶剂或一种类型的至少两种溶剂的混合物。

反应优选在 -10°C 至室温之间即大约 25°C 的温度进行，并且反应时间优选在 1 至 24 小时之间。

可以按照本领域技术人员众所周知的方法对上面给定的通式(I)化合物进行纯化和分离。优选地，可以通过以下方法来分离通式(I)化合物：通过将反应介质蒸发，加入水然后调节 pH 值以获得可以通过过滤分离的固体形式的化合物，或者通过用不与水溶混的溶剂例如氯仿萃取，并通过色谱法或从适宜的溶剂中重结晶进行纯化。

在上述某些合成反应过程中或在制备通式 II 或 III 化合物的时候，敏感性或反应性基团的保护是必须的和/或需要的。所述敏感性或反应性基团的保护可以通过使用如 Protective groups in Organic Chemistry, ed. J. F. W. McOmie, Plenum Press, 1973; T.W. Greene & P. G. M. Wuts and Protective Groups in Organic Chemistry, John Wiley &

sons, 1991 中描述的常规保护基来进行。该描述的有关部分特此引入本文作为参考并形成本公开的部分。在方便的时候可以通过本领域技术人员众所周知的方法除去该保护基。

如果通式(I)的取代了的吲哚化合物是以立体异构体特别是对映体或非对映体的混合物的形式获得的, 可以通过本领域技术人员已知的标准方法例如色谱方法或用手性试剂结晶, 将所述混合物分离。

本发明的另外方面涉及包含至少一种上面给定的通式 I 的取代了的吲哚化合物和任选至少一种辅助物质的药物, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

所述药物适用于 5-HT₆-受体调节, 尤其适用于预防和/或治疗至少部分由 5-HT₆-受体介导的病症或疾病。

特别是, 所述药物适用于预防和/或治疗与食物摄取有关的病症或疾病, 优选适用于调节食欲, 适用于保持、增加或减少体重, 适用于预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病), 优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病, 或者适用于预防和/或治疗过敏性结肠综合征; 中枢神经系统病症; 焦虑; 惊恐发作; 抑郁; 双相性精神障碍; 认知障碍; 记忆障碍; 老年痴呆; 精神病; 神经变性病症, 优选选自阿尔茨海默病、帕金森病、亨廷顿病和多发性硬化; 精神分裂症; 精神病; 或者多动障碍(ADHD, 注意缺陷/多动障碍)或者用于改善认知(认知提高)。

更优选地, 所述药物适用于预防和/或治疗与食物摄取有关的病症或疾病, 优选适用于调节食欲, 适用于保持、增加或减少体重, 适用于预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病), 优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病。

最优选地, 所述药物适用于预防和/或治疗肥胖症和/或与此有关的病症或疾病。

在另外的方面, 本发明涉及使用至少一种上面给定的通式 I 的取代了的吲哚化合物, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少两种其立体异构体

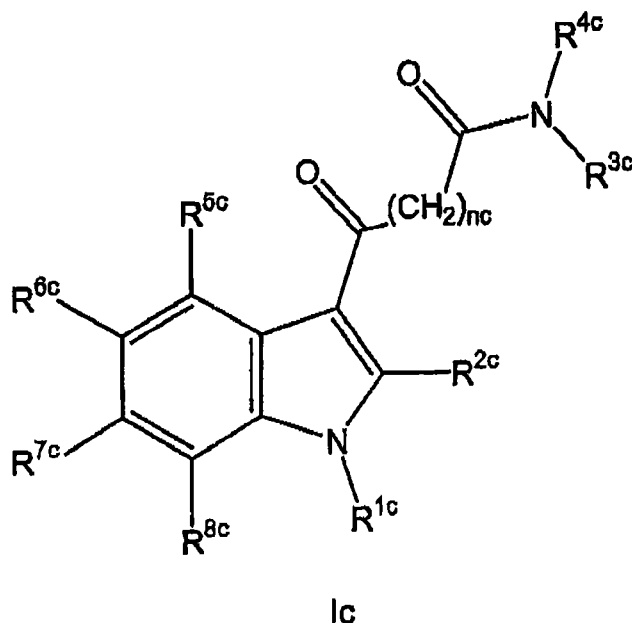
——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式，用于制备适用于 5-HT₆-受体调节、优选适用于预防和/或治疗至少部分由 5-HT₆-受体介导的病症或疾病的药物。

优选使用至少一种上面给定的通式 I 的取代了的吲哚化合物，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式，用于制备适用于预防和/或治疗与食物摄取有关的病症或疾病，优选适用于调节食欲，适用于保持、增加或减少体重，适用于预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病)，优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病，或者适用于预防和/或治疗过敏性结肠综合征；中枢神经系统病症；焦虑；惊恐发作；抑郁；双相性精神障碍；认知障碍；记忆障碍；老年痴呆；精神病；神经变性病症，优选选自阿尔茨海默病、帕金森病、亨廷顿病和多发性硬化；精神分裂症；精神病；或多动障碍(ADHD，注意缺陷/多动障碍)或者用于改善认知(认知提高)的药物。

更优选地是使用至少一种上面定义的通式 I 的取代了的吲哚化合物，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式，用于制备适用于预防和/或治疗与食物摄取有关的病症或疾病，优选适用于调节食欲，适用于保持、增加或减少体重，适用于预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病)，优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病的药物。

最优选的是使用至少一种上面定义的通式 I 的取代了的吲哚化合物，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式，用于制备适用于预防和/或治疗肥胖症和/或与此有关的病症或疾病的药物。

在还另外的方面，本发明涉及通式 Ic 的取代了的吲哚化合物



其中

nc 代表 0、1、2、3 或 4，

R^{1c} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接；任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接； $-S(=O)_2-R^{9c}$ ；或 $-C(=O)-R^{10c}$ ，

R^{2c} 代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-NH_2$ ； $-SH$ ； $-OH$ ； $-CN$ ；卤原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接；或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接，

R^{3c} 和 R^{4c} ，其是相同或不同的，代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的脂族基团，任选至少单取代了的芳基或杂芳基基团，所述基团可以通过直链或支链亚烷基连接；饱和或不饱和的、任选至少

单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，或者

R^{3c} 和 R^{4c} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的杂环，所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单或多环状系统稠合，

R^{5c} 、 R^{6c} 、 R^{7c} 和 R^{8c} ，其是相同或不同的，代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-CN$ ； $-N(R^{11c})-S(=O)_2-R^{12c}$ ； $-OR^{13c}$ ； $-SR^{14c}$ ； $-C(=O)-OR^{15c}$ ； $-NR^{16c}R^{17c}$ ； $-C(=O)-R^{18c}$ ； $-(C=O)-NR^{19c}R^{20c}$ ； $-O-(C=O)-R^{21c}$ ； $-S(=O)_2-R^{22c}$ ； $-S(=O)_2-NR^{23c}R^{24c}$ ； $-NR^{25c}-C(=O)-NR^{26c}R^{27c}$ ； $-NR^{28c}-(C=O)-R^{29c}$ ； $-NR^{30c}-(C=O)-OR^{31c}$ ； $-NR^{32c}-S(=O)NR^{33c}R^{34c}$ ；或 $-S(=O)_2-OR^{35c}$ ；卤原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接；或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接，

条件是取代基 R^{5c} 、 R^{6c} 、 R^{7c} 和 R^{8c} 中的一个代表 $-N(R^{11c})-S(=O)_2-R^{12c}$ 部分，

R^{9c} 和 R^{10c} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团；或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接，

R^{11c} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接；任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接；或 $-S(=O)_2-R^{36c}$ 部分，

R^{12c} 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连

接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

R^{13c} 、 R^{14c} 、 R^{15c} 、 R^{16c} 、 R^{17c} 、 R^{18c} 、 R^{19c} 、 R^{20c} 、 R^{21c} 、 R^{22c} 、 R^{23c} 、 R^{24c} 、 D^{25c} 、 R^{26c} 、 R^{27c} 、 R^{28c} 、 R^{29c} 、 R^{30c} 、 R^{31c} 、 R^{32c} 、 R^{33c} 、 R^{34c} 、 R^{35c} 彼此独立地代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接；或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接，

R^{36c} 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

优选的是上面给定的通式 Ic 化合物，其中

nc 代表 0、1、2、3 或 4，

R^{1c} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接； $-S(=O)_2-R^{9c}$ ；或 $-C(=O)-R^{10c}$ ，

R^{2c} 代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-NH_2$ ； $-SH$ ； $-OH$ ； $-CN$ ；卤原子；

直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

R^{3c} 和 R^{4c} ，其是相同或不同的，代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团；任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，或者

R^{3c} 和 R^{4c} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的 4-9 元杂环，所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

R^{5c} 、 R^{6c} 、 R^{7c} 和 R^{8c} ，其是相同或不同的，代表 -H；-NO₂；-CN；-N(R^{11c})-S(=O)₂- R^{12c} ；-OR^{13c}；-SR^{14c}；-C(=O)-OR^{15c}；-NR^{16c}R^{17c}；-C(=O)- R^{18c} ；-(C=O)-NR^{19c}R^{20c}；-O-(C=O)- R^{21c} ；-S(=O)₂- R^{22c} ；-S(=O)₂-NR^{23c}R^{24c}；-NR^{25c}-C(=O)-NR^{26c}R^{27c}；-NR^{28c}-(C=O)- R^{29c} ；-NR^{30c}-(C=O)-OR^{31c}；-NR^{32c}-S(=O)NR^{33c}R^{34c}；或 -S(=O)₂-OR^{35c}；卤原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

条件是取代基 R^{5c} 、 R^{6c} 、 R^{7c} 和 R^{8c} 中的一个代表 -N(R^{11c})-S(=O)₂- R^{12c} 部分，

R^{9c} 和 R^{10c} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选

至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；或者任选至少单取代了的、5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

R^{11c} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接；任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接；或者 $-S(=O)_2-R^{36c}$ 部分，

R^{12c} 代表任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的、任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

$R^{13c}-R^{35c}$ 各自独立地代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

R^{36c} 代表任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

还优选的是上面给定的通式 Ic 化合物，其中 R^{1c} 代表氢原子；直链或支链的 C_{1-10} 烷基；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子； $-S(=O)_2-R^{9c}$ ；或 $-C(=O)R^{10c}$ ，

优选地， R^{1c} 代表氢原子；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}-$

烷基、 $-\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}$ -烷基)、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}$ -烷基)、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-\text{S}(\text{=O})_2-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}(\text{=O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基； $-\text{S}(\text{=O})_2-\text{R}^{9c}$ ；或 $-\text{C}(\text{=O})-\text{R}^{10c}$ ，

更优选地， R^{1c} 代表氢原子，

并且 nc 和 $\text{R}^{2c}-\text{R}^{36c}$ 具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，上面给定的通式Ic这样的取代了的吡啶化合物是优选的，其中

R^{2c} 代表 $-\text{H}$ ； $-\text{NO}_2$ ； $-\text{NH}_2$ ； $-\text{SH}$ ； $-\text{OH}$ ； $-\text{CN}$ ； $-\text{CF}_3$ ； $-\text{OCH}_3$ ； $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$ ；F；Cl；Br；I；直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的3-9元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；或者任选至少单取代了的5-10元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接，并且其中所述杂芳基含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子，

优选地， R^{2c} 代表 $-\text{H}$ ； $-\text{NO}_2$ ； $-\text{NH}_2$ ； $-\text{SH}$ ； $-\text{OH}$ ； $-\text{CN}$ ； $-\text{CF}_3$ ； $-\text{OCH}_3$ ； $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$ ；F；Cl；Br；I；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1,2\text{或}3}$ -基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷

基、 $-\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}$ -烷基)、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}$ -烷基)、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-\text{S}(\text{=O})_2-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}(\text{=O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1,2}$ 或 3 -基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代：直链或支链 C_{1-5} -烷基、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}$ -烷基)、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}$ -烷基)、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-\text{S}(\text{=O})_2-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}(\text{=O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地， R^{2c} 代表氢原子，

并且 nc 、 R^{1c} 和 $\text{R}^{3c}-\text{R}^{36c}$ 具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

还优选的是上面给定的通式Ic的取代了的吲哚化合物，其中 R^{3c} 和 R^{4c} ，其是相同或不同的，代表氢原子或者直链或支链 C_{1-8} 烷基，或者

R^{3c} 和 R^{4c} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的4-9元杂环，所述杂环可以与任选至少单取代了的单环或双环状系统稠合，

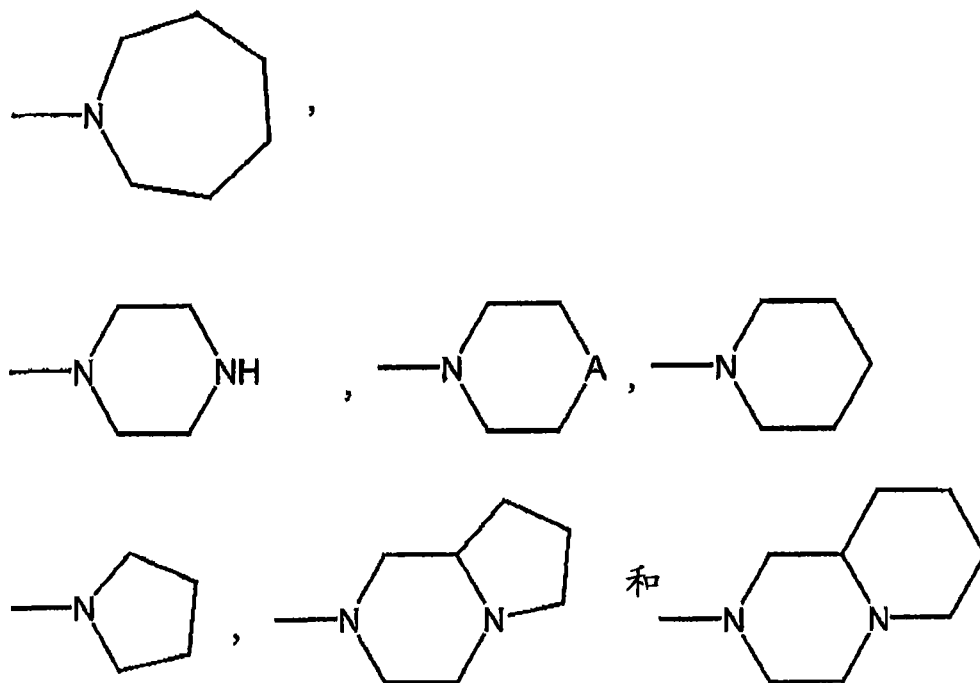
所述环状系统的环是5、6或7元环，并且所述杂环和所述环状系

统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

优选地

R^{3c} 和 R^{4c} ，其是相同或不同的，代表氢原子或选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；或者

R^{3c} 和 R^{4c} 与桥联氮原子共同形成选自下列的部分



A 代表氧原子或硫原子，并且每一个前述环状部分可以在包括哌嗪环的氮原子在内的任何位置上被 1、2 或 3 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地， R^{3c} 和 R^{4c} ，其是相同或不同的，代表氢原子或选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基

和叔丁基,

并且 nc 、 $\text{R}^{1\text{c}}$ 、 $\text{R}^{2\text{c}}$ 和 $\text{R}^{5\text{c}} - \text{R}^{36\text{c}}$ 具有上面定义的含义, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

而且, 上面给定的通式 Ic 这样的取代了的吡啶化合物是优选的, 其中

$\text{R}^{5\text{c}}$ 、 $\text{R}^{6\text{c}}$ 、 $\text{R}^{7\text{c}}$ 和 $\text{R}^{8\text{c}}$, 其是相同或不同的, 代表 $-\text{H}$; $-\text{NO}_2$; $-\text{CN}$; $-\text{N}(\text{R}^{11\text{c}}) - \text{S}(=\text{O})_2 - \text{R}^{12\text{c}}$; $-\text{OR}^{13\text{c}}$; $-\text{SR}^{14\text{c}}$; $-\text{C}(=\text{O}) - \text{OR}^{15\text{c}}$; $-\text{NR}^{16\text{c}}\text{R}^{17\text{c}}$; $-\text{C}(=\text{O}) - \text{R}^{18\text{c}}$; $-(\text{C}=\text{O}) - \text{NR}^{19\text{c}}\text{R}^{20\text{c}}$; $-\text{O} - (\text{C}=\text{O}) - \text{R}^{21\text{c}}$; $-\text{S}(=\text{O})_2 - \text{R}^{22\text{c}}$; $-\text{S}(=\text{O})_2 - \text{NR}^{23\text{c}}\text{R}^{24\text{c}}$; $-\text{NR}^{25\text{c}} - \text{C}(=\text{O}) - \text{NR}^{26\text{c}}\text{R}^{27\text{c}}$; $-\text{NR}^{28\text{c}} - (\text{C}=\text{O}) - \text{R}^{29\text{c}}$; $-\text{NR}^{30\text{c}} - (\text{C}=\text{O}) - \text{OR}^{31\text{c}}$; $-\text{NR}^{32\text{c}} - \text{S}(=\text{O})\text{NR}^{33\text{c}}\text{R}^{34\text{c}}$; 或 $-\text{S}(=\text{O})_2 - \text{OR}^{35\text{c}}$; F , Cl , Br , I ; $-\text{CF}_3$; $-\text{CHF}_2$; $-\text{CH}_2\text{F}$; 直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子,

优选地, $\text{R}^{5\text{c}}$ 、 $\text{R}^{6\text{c}}$ 、 $\text{R}^{7\text{c}}$ 和 $\text{R}^{8\text{c}}$, 其是相同或不同的, 代表 $-\text{H}$; $-\text{NO}_2$; $-\text{CN}$; $-\text{N}(\text{R}^{11\text{c}}) - \text{SO}_2 - \text{R}^{12\text{c}}$; $-\text{OR}^{13\text{c}}$; $-\text{SR}^{14\text{c}}$; $-\text{C}(=\text{O}) - \text{OR}^{15\text{c}}$; $-\text{NR}^{16\text{c}}\text{R}^{17\text{c}}$; $-\text{C}(=\text{O}) - \text{R}^{18\text{c}}$; $-(\text{C}=\text{O}) - \text{NR}^{19\text{c}}\text{R}^{20\text{c}}$; $\text{O} - (\text{C}=\text{O}) - \text{R}^{21\text{c}}$; $-\text{S}(=\text{O})_2 - \text{R}^{22\text{c}}$; $-\text{S}(=\text{O})_2 - \text{NR}^{23\text{c}}\text{R}^{24\text{c}}$; $-\text{NR}^{25\text{c}} - \text{C}(=\text{O}) - \text{NR}^{26\text{c}}\text{R}^{27\text{c}}$; $-\text{NR}^{28\text{c}} - (\text{C}=\text{O}) - \text{R}^{29\text{c}}$; $-\text{NR}^{30\text{c}} - (\text{C}=\text{O}) - \text{OR}^{31\text{c}}$; $-\text{NR}^{32\text{c}} - \text{S}(=\text{O})\text{NR}^{33\text{c}}\text{R}^{34\text{c}}$; 或 $-\text{S}(=\text{O})_2 - \text{OR}^{35\text{c}}$; F , Cl , Br , I ; $-\text{CF}_3$; $-\text{CHF}_2$; $-\text{CH}_2\text{F}$; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环

庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或者

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萆基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

更优选地, R^{5c} 、 R^{6c} 、 R^{7c} 和 R^{8c} , 其是相同或不同的, 各自代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11c})-SO_2-R^{12c}$; $-OR^{13c}$; $-SR^{14c}$; $-C(=O)-OR^{15c}$; $-NR^{16c}R^{17c}$; $-F$, Cl, Br, I; $-CF_3$; $-CHF_2$; $-CH_2F$; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基; 或者

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萆基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团

连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

在每一情况下，条件是取代基 R^{5c} 、 R^{6c} 、 R^{7c} 和 R^{8c} 中的一个代表 $-N(R^{11c})-S(=O)_2-R^{12c}$ 部分，

并且 nc 、 $R^{1c}-R^{4c}$ 和 $R^{9c}-R^{36c}$ 具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

另外优选的上面给定的通式 Ic 的取代了的吡啶化合物是这样的化合物，其中取代基 R^{5c} 、 R^{6c} 、 R^{7c} 和 R^{8c} 中的一个代表 $-N(R^{11c})-S(=O)_2-R^{12c}$ 部分，而这些取代基中的另外三个各自代表氢原子，并且 nc 、 $R^{1c}-R^{4c}$ 、 $R^{9c}-R^{12c}$ 和 R^{36c} 具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，上面给定的通式 Ic 这样的取代了的吡啶化合物是优选的，其中

R^{9c} 和 R^{10c} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团；或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接，并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子，

优选地， R^{9c} 和 R^{10c} 各自独立地代表选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基，异丁基和叔丁基；或者选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯

基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2}$ 或 3 -基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2-苯基$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

并且 nc 、 $R^{1c}-R^{8c}$ 和 $R^{11c}-R^{36c}$ 具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，上面给定的通式Ic这样的取代了的吡啶化合物是优选的，其中 R^{11c} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} -脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的3-9元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；任选至少单取代了的5-10元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接，并且其中所述杂芳基含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；或者 $-S(=O)_2-R^{36c}$ 部分，

优选地， R^{11c} 代表氢原子；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2}$ 或 3 -基团连接和/或被

1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O$ - C_{1-5} -烷基、 $-S$ - C_{1-5} -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O$ - C_{1-5} -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或 $-S(=O)_2-R^{36c}$ -部分，

更优选地， R^{11c} 代表氢原子，

并且 nc 、 $R^{1c}-R^{10c}$ 和 $R^{12c}-R^{36c}$ 具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，上面给定的通式 Ic 这样的取代了的吡啶化合物是优选的，其中 R^{12c} 代表任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的单环或双环状系统稠合，

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环，并且所述杂芳基和任选所述

环状系统的一个或两个环含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

或者 R^{12c} 代表饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环并且所述脂环族基团和任选所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

优选地， R^{12c} 代表选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基、2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基、苯并噁唑啉基、苯并噻唑啉基、苯并咪唑烷基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、色烯基和苯并二氢吡喃基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-$

CF_2H 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地， R^{12c} 代表选自下列的芳基或杂芳基：苯基、1-萘基、2-萘基、吡唑基、噻吩基(噻吩基)、苯并[b]-噻吩基、苯并[b]呋喃基、喹啉基、异喹啉基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噻唑基和 2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1,2\text{ 或 }3}$ -基团连接和/或可以被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 CFH_2 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_3$ 、 $\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

并且 nc 、 $\text{R}^{1c}-\text{R}^{11c}$ 和 $\text{R}^{13c}-\text{R}^{36c}$ 具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

还优选的是上面给定的通式 Ic 这样的取代了的吲哚化合物，其中 $\text{R}^{13c}-\text{R}^{35c}$ 彼此独立地各自代表氢原子；直链或支链 C_{1-10} 烷基；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；

优选地， $\text{R}^{13c}-\text{R}^{35c}$ 彼此独立地代表氢原子；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啉基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1,2\text{ 或 }3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-\text{O}$

-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、氧代(=O)、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷基、-O-(C=O)-C₁₋₅-烷基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基-(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过-(CH₂)_{1, 2 或 3}-基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代：C₁₋₅-烷基、-O-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷基、-O-(C=O)-C₁₋₅-烷基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

并且nc、R^{1c}-R^{12c}和R^{36c}具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，上面给定的通式Ic这样的取代了的吡啶化合物是优选的，其中R^{36c}代表任选至少单取代了的5-10元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的C₁₋₆-亚烷基、C₂₋₆-亚烯基或C₂₋₆-亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的单环或双环系统稠合，

所述环状系统的环是5、6或7元环，并且所述杂芳基和任选所述环状系统的一个或两个环含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂

原子,

或者 R^{36c} 代表饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环并且所述脂环族基团和任选所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子,

优选地, R^{36c} 代表选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基、2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基、苯并噁唑啉基、苯并噻唑啉基、苯并咪唑烷基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、色烯基和苯并二氢吡喃基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO$

-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

并且 nc 和 R^{1c}-R^{35c} 具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，上面给定的通式 Ic 这样的取代了的吡啶化合物是优选的，其中 nc 是 0 并且 R^{1c}-R^{36c} 具有上面定义的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

在任何前述定义中下面的条件可以适用，即 R^{3c} 和 R^{4c} 不能同一地代表氢原子。

特别优选的是通式 Ic 的取代了的吡啶化合物，其中

nc 是 0，

R^{1c} 代表氢原子，

R^{2c} 代表氢原子，

R^{3c} 和 R^{4c}，其是相同或不同的，代表选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基，

取代基 R^{5c}、R^{6c}、R^{7c} 和 R^{8c} 中的一个代表 -N(R^{11c})-S(=O)-R^{12c} 部分，而这些取代基的另外三个各自代表氢原子，

R^{11c} 代表氢原子，

R^{12c} 代表选自下列的芳基或杂芳基：苯基、1-萘基、2-萘基、吡唑基、噻吩基(噻吩基)、苯并[b]-噻吩基、苯并[b]呋喃基、喹啉基、异喹啉基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基和 2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 -(CH₂)_{1, 2 或 3}-基团连接和/或可以被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-CF₂H、CFH₂、-C(=O)-O-CH₃、C(=O)-O-CH₂-CH₃、环丙基、环丁基、环戊基、

环己基、苯基、苯氧基和苄基。

最优选的是选自下列的通式 Ic 的取代了的吲哚化合物

- [1] 2 - [5 - (5 - 氯 - 3 - 甲基 - 苯并[b]噻吩 - 2 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - N,N - 二乙基 - 2 - 氧代 - 乙酰胺,
- [2] N,N - 二乙基 - 2 - [5 - (萘 - 2 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - 2 - 氧代 - 乙酰胺,
- [3] N,N - 二乙基 - 2 - [5 - (萘 - 1 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - 2 - 氧代 - 乙酰胺,
- [4] 2 - [5 - (联苯 - 4 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - N,N - 二乙基 - 2 - 氧代 - 乙酰胺,
- [5] N,N - 二乙基 - 2 - 氧代 - 2 - [5 - (喹啉 - 8 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - 乙酰胺,
- [6] N,N - 二甲基 - 2 - [5 - (萘 - 2 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - 2 - 氧代 - 乙酰胺,
- [7] N,N - 二甲基 - 2 - [5 - (萘 - 1 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - 2 - 氧代 - 乙酰胺,
- [8] 2 - [5 - (5 - 氯 - 3 - 甲基 - 苯并[b]噻吩 - 2 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代 - 乙酰胺,
- [9] 2 - [5 - (6 - 氯 - 咪唑并[2,1-b]噻唑 - 5 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - N,N - 二乙基 - 2 - 氧代 - 乙酰胺,
- [10] 2 - [5 - (6 - 氯 - 咪唑并[2,1-b]噻唑 - 5 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代 - 乙酰胺,
- [11] N,N - 二甲基 - 2 - [4 - (萘 - 1 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - 2 - 氧代 - 乙酰胺,
- [12] 2 - [4 - (5 - 氯 - 3 - 甲基 - 苯并[b]噻吩 - 2 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代 - 乙酰胺,
- [13] 2 - [4 - (6 - 氯 - 咪唑并[2,1-b]噻唑 - 5 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代 - 乙酰胺,
- [14] N,N - 二甲基 - 2 - [5 - [(4 - 氯 - 3 - 甲基 - 苯基) - 1 - 磺酰基氨基] - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - 2 - 氧代 - 乙酰胺,
- [15] 5 - (3 - 二甲基氨基草酰基 - 1H - 吲哚 - 5 - 基氨基磺酰基) - 3 - 甲基 - 苯并呋喃 - 2 - 甲酸乙酯,

[16] 2-[5-(联苯-4-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[17] N,N-二甲基-2-氧代-2-[5-(2-氧代-2,3-二氢-苯并噻唑-6-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-乙酰胺,

[18] N,N-二甲基-2-氧代-2-[5-(2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑-6-亚磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]乙酰胺,

[19] 2-[5-[(4-环己基-苯基)-1-磺酰基氨基]-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[20] N,N-二甲基-2-[5-[(4-苯氧基-苯基)-1-磺酰基氨基]-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[21] 2-(5-(5-氯-3-甲基苯并[b]噻吩-2-亚磺酰基)-2-甲基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[22] 2-(5-(6-氯咪唑并[2,1-b]噻唑-5-亚磺酰基)-2-甲基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[23] 2-(6-(5-氯-3-甲基苯并[b]噻吩-2-亚磺酰基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[24] N,N-二甲基-2-(6-(萘-3-亚磺酰基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺,

[25] 2-(6-(联苯-4-亚磺酰基)-1H-吡啶-3-yl)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[26] N,N-二甲基-2-(6-(萘-1-亚磺酰基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺,

[27] N,N-二甲基-2-(6-(2-(萘-1-基)乙基亚磺酰基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺,

[28] N,N-二甲基-2-氧代-2-(6-(4-苯氧基苯基亚磺酰基)-1H-吡啶-3-基)乙酰胺,

[29] 2-(6-(3,4-二氯噻吩-2-亚磺酰基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[30] 2-(6-(3,5-二氯苯基亚磺酰基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

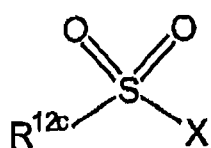
[31] 2-(6-(1-氯萘-6-亚磺酰基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[32] 2-(6-(6-氯咪唑并[2,1-b]噻唑-5-亚磺酰氨基)-1H-吲哚-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[33] N,N-二乙基-2-(2-甲基-5-(5-甲基-1-苯基-1H-吡唑-4-亚磺酰氨基)-1H-吲哚-3-基)-2-氧代乙酰胺和

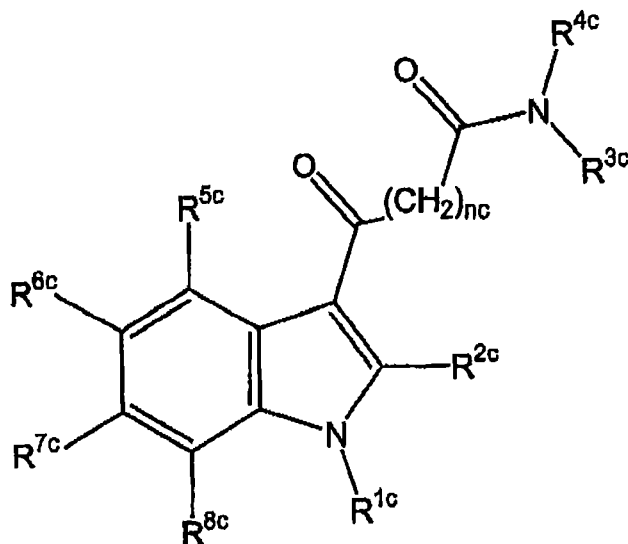
[34] N,N-二乙基-2-(2-甲基-5-(1,3,5-三甲基-1H-吡唑-4-亚磺酰氨基)-1H-吲哚-3-基)-2-氧代乙酰胺。

本发明的另外方面涉及上面给定的通式 Ic 的取代了的吲哚化合物的制备方法, 按照该方法, 使至少一种通式 IIc 化合物,



IIc

其中 R^{12c} 具有上面给定的含义, 并且 X 代表离去基团, 优选卤原子, 特别优选氯原子, 与至少一种通式 IIIc 化合物,



IIIc

其中 $R^{1c} - R^{4c}$ 和 nc 具有上面给定的含义, 并且 R^{5c} 、 R^{6c} 、 R^{7c} 和 R^{8c}

具有上面给定的含义，条件是 R^{5c} 、 R^{6c} 、 R^{7c} 和 R^{8c} 取代基中的至少一个代表 $-N(R^{11c})(H)$ 部分，或其保护了的衍生物，在适宜的反应介质中，优选在至少一种碱和/或至少一种辅助剂存在下，进行反应。

如果使用保护了的衍生物，在反应后必须除去各自的保护基以获得所需的通式 Ic 的取代了的吡啶化合物。适宜的保护基以及引入和除去这样的保护基的方法，如下面所述，是本领域的技术人员众所周知的。

用于通式 IIc 和 IIIc 化合物之间反应的适宜的反应介质包括有机溶剂，例如二烷基醚，优选乙醚，或环醚，优选四氢呋喃或二噁烷；或者卤代烃，优选二氯甲烷或氯仿；醇，优选甲醇或乙醇；偶极非质子溶剂，优选乙腈、吡啶或二甲基甲酰胺，或者任何其它适宜的反应介质。当然，也可以使用至少两种类别的溶剂或一种类别的至少两种溶剂的混合物。

反应优选在至少一种适宜的碱存在下进行，所述适宜的碱例如，无机碱例如碱金属的氢氧化物或碳酸盐和/或有机碱，优选三乙胺或吡啶。

反应优选在温度 -10°C 至室温即大约 25°C 进行，并且反应时间优选在 5 分钟至 24 小时之间。

可以按照本领域技术人员众所周知的方法，对上面给定的通式 Ic 化合物进行纯化和/或分离。优选地，可以通过以下方法来分离通式 Ic 化合物：通过蒸发反应介质，加入水并调节 pH 值以获得可以通过过滤分离的固体形式的化合物，或者通过用与水不溶混的溶剂例如氯仿萃取，并通过色谱法或从适宜的溶剂中重结晶进行纯化。

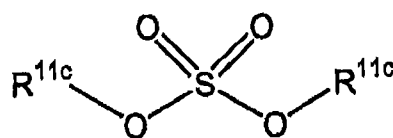
通式 IIc 化合物是可以从市场上买到的，或者可以按照本领域众所周知的方法，例如，类似于 E. E. Gilbert, *Synthesis*, 1969, 1, 3 的文献中描述的方法制备。

通式 IIIc 化合物也可以从市场上买到，或者可以按照本领域技术人员已知的方法，例如 Dillard 等人, *Journal of Medicinal Chemistry* 1996, 39(26), 5119 - 5136 中描述的方法，通过还原相应的硝基衍生物来制备，所述相应的硝基衍生物可以从市场上买到，或者可以按照本领域技术人员已知的方法，例如，下列文献公开中描述的方法来制备：Primofiore 等人, *Journal of Medicinal Chemistry* 2001, 44(14), 2286 -

2297, Da Settimo 等人 *Generoso. Farmaco* 1993, 48(2), 285 – 295, Da Settimo 等人 *Journal of Medicinal Chemistry* 1996, 39(26), 5083 – 5091, Macor 等人 *Synthetic Communications* 1993, 23(1), 65 – 72., Settimo 等人 *Gazzetta Chimica Italiana* 1962, 92, 150 – 164, Primofiore 等人 *Journal of Medicinal Chemistry* 1989, 32(12), 2514 – 2518, Primofiore 等人 *European Journal of Medicinal Chemistry* 1988, 23(4), 397 – 401.

上面引用的文献描述的有关部分特此引入本文作为参考并形成本公开的部分。

或者，上面给定的通式 Ic 的取代了的吡啶化合物——其中 R^{11c} 代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团是通过直链或支链的、任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接的；或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基是通过直链或支链的、任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接的，并且所有其它取代基具有上面定义的含义——也可以通过烷基化类型反应，由通式 Ic 的相应的化合物——其中 R^{11c} 代表氢原子并且所有其他取代基具有上面给定的含义——来制备，例如通过与相应的卤化物 $R^{11c} - X$ ——其中 X 代表卤原子，优选氯原子——，或者通式 IVc 的硫酸酯



IVc

——其中在每一情况下 R^{11c} 具有前述含义——反应。所述相应的卤化物和硫酸酯可以从市场上买到，或者可以按照本领域技术人员众所周知的方法制备。

烷基化类型反应优选在至少一种适宜的碱存在下，在适宜的反应介质存在下进行，所述适宜的碱例如碱金属的氢氧化物和/或碳酸盐，金属氢化物，烃氧基金属例如甲醇钠或叔丁醇钾，有机金属化合物例

如正丁基锂或叔丁基锂，适宜的反应介质例如二烷基醚，优选乙醚，或环醚，优选四氢呋或二噁烷，炔，优选甲苯，醇，优选甲醇或乙醇，偶极非质子溶剂，优选乙腈、吡啶或二甲基甲酰胺，或任何其它适宜的反应介质。当然，也可以使用至少两种类别的溶剂或一种类别的至少两种溶剂的混合物。

反应优选在温度 -10°C 至室温即大约 25°C 进行，并且反应时间优选 1 和 24 小时。

可以按照本领域技术人员众所周知的方法对上面给定的通式 Ic 化合物进行纯化和/或分离。优选地，可以通过以下方法来分离通式 Ic 化合物：蒸发反应介质，加入水然后调节 pH 值以获得可以通过过滤分离的固体形式的化合物，或者用不与水溶混的溶剂例如氯仿萃取，并通过色谱法或从适宜的溶剂中重结晶进行纯化。

在上述某些合成反应的过程中，或者在制备通式 IIc 或 IIIc 化合物的时候，敏感性或反应性基团的保护是必须的和/或需要的。所述敏感性或反应性基团的保护可以通过使用如 *Protective groups in Organic Chemistry*, ed. J. F. W. McOmie, Plenum Press, 1973; T.W. Greene & P.G.M. Wuts and *Protective Groups in Organic Chemistry*, John Wiley & sons, 1991 中描述的常规保护基来进行。该文献相应部分特此引入本文作为参考并形成本公开的部分。可以在方便的时候通过本领域技术人员众所周知的方法除去保护基。

如果通式 Ic 的取代了的吲哚化合物是以立体异构体——特别是对映体或非对映体——的混合物的形式获得的，所述混合物可以通过本领域技术人员已知的标准方法，例如色谱法或用手性试剂结晶来分离。

本发明的另外方面涉及包含至少一种上面给定的通式 Ic 的取代了的吲哚化合物和任选至少一种辅助物质的药物，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

所述药物适用于 5-HT_6 -受体调节，优选适用于预防和/或治疗至少部分由 5-HT_6 -受体介导的病症或疾病。

优选地，所述药物适用于预防和/或治疗与食物摄取有关的病症或疾病，优选适用于调节食欲，适用于保持、增加或减少体重，适用于预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病)，优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病，或者适用于预防和/或治疗过敏性结肠综合征；中枢神经系统病症；焦虑；惊恐发作；抑郁；双相性精神障碍；认知障碍；记忆障碍；老年痴呆；精神病；神经变性病症，优选选自阿尔茨海默病、帕金森病、亨廷顿病和多发性硬化；精神分裂症；精神病；多动障碍(ADHD，注意缺陷/多动障碍)或者适用于改善认知(或认知提高)。

更优选地，所述药物适用于预防和/或治疗与食物摄取有关的病症或疾病，优选适用于调节食欲，适用于保持、增加或减少体重，适用于预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病)，优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病。

最优选地，所述药物适用于预防和/或治疗肥胖症和/或与此有关的病症或疾病。

本发明的另外方面涉及使用至少一种上面给定的通式 Ic 的取代了的吲哚化合物，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式，用于制备适用于 5-HT₆-受体调节，优选适用于预防和/或治疗至少部分由 5-HT₆-受体介导的病症或疾病的药物。

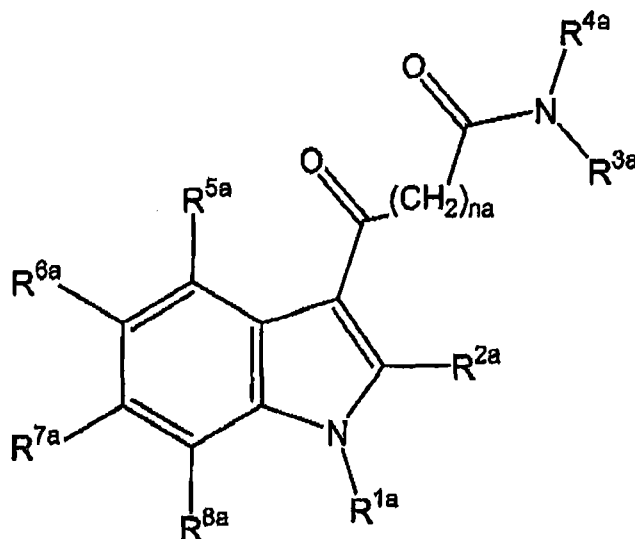
优选的是使用至少一种上面给定的通式 Ic 的取代了的吲哚化合物，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式，用于制备适用于预防和/或治疗与食物摄取有关的病症或疾病，优选适用于调节食欲，适用于保持、增加或减少体重，适用于预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病)，优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病，或者适用于预防和/或治疗过敏性结肠综合征；中枢神经系统病症；焦虑；惊恐发作；抑郁；双相性精神障碍；认知障碍；记忆障碍；

老年痴呆；精神病；神经变性病症,优选选自阿尔茨海默病、帕金森病、亨廷顿病和多发性硬化；精神分裂症；精神病；多动障碍(ADHD, 注意缺陷/多动障碍)或适用于改善认知(认知提高)的药物。

更优选的是使用至少一种上面定义的通式 Ic 的取代了的吡啶化合物, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式, 用于预防和/或治疗与食物摄取有关的病症或疾病, 优选适用于调节食欲, 适用于保持、增加或减少体重, 适用于预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病), 优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病的药物制备。

最优选的是使用至少一种上面定义的通式 Ic 的取代了的吡啶化合物, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式, 用于制备预防和/或治疗肥胖症和/或与此有关的病症或疾病的药物。

在还另外的方面, 本发明涉及包含至少一种通式 Ia 的取代了的吡啶化合物,



Ia

其中

na 代表 0、1、2、3 或 4,

对于 na = 0: R^{1a} 代表氢原子; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团; 任选至少单取代了的芳基或杂芳基; $-S(=O)_2 - R^{9a}$; 或 $-C(=O) - R^{10a}$,

对于 na = 1、2、3 或 4: R^{1a} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接; $-S(=O)_2 - R^{9a}$; 或 $-C(=O) - R^{10a}$,

R^{2a} 代表 $-H$; $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

R^{3a} 和 R^{4a} , 其是相同或不同的, 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的脂族基团, 任选至少单取代了的芳基或杂芳基基团, 所述基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合, 或者

R^{3a} 和 R^{4a} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的杂环, 所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单或多环状系统稠合,

R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11a}) - S(=O)_2 - R^{12a}$; $-OR^{13a}$; $-SR^{14a}$; $-C(=O) - OR^{15a}$; $-NR^{16a}R^{17a}$; $-C(=O) - R^{18a}$; $-(C=O) - NR^{19a}R^{20a}$; $-O - (C=O) - R^{21a}$; $-S(=O)_2 - R^{22a}$; $-S(=O)_2 - NR^{23a}R^{24a}$; $-NR^{25a} - C(=O) - NR^{26a}R^{27a}$; $-NR^{28a} - (C=O) - R^{29a}$; $-NR^{30a} - (C=O) - OR^{31a}$; $-NR^{32a}$

- S(=O)NR^{33a}R^{34a}; 或 - S(=O)₂ - OR^{35a}; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

条件是取代基 R^{5a}、R^{6a}、R^{7a} 和 R^{8a} 中的至少一个代表 - N(R^{11a}) - S(=O)₂ - R^{12a} 部分,

R^{9a} 和 R^{10a} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

R^{11a} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接; 任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接; 或者 - S(=O)₂ - R^{36a} 部分,

R^{12a} 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合; 或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

R^{13a}、R^{14a}、R^{15a}、R^{16a}、R^{17a}、R^{18a}、R^{19a}、R^{20a}、R^{21a}、R^{22a}、R^{23a}、R^{24a}、R^{25a}、R^{26a}、R^{27a}、R^{28a}、R^{29a}、R^{30a}、R^{31a}、R^{32a}、R^{33a}、R^{34a}、R^{35a} 各自独立地代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

R^{36a} 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基,所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合;或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团,所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式,或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物,或其生理可接受的盐,或其相应的溶剂化物的形式。

优选的是含有至少一种通式 Ia 的取代了的吲哚化合物的药物,其中

na 是 0、1、2、3 或 4

对于 $na = 0$: R^{1a} 代表氢原子;饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团;任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基; $-S(=O)_2-R^{9a}$; 或 $-C(=O)-R^{10a}$,

对于 $na = 1, 2, 3$ 或 4: R^{1a} 代表氢原子;直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团;饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团,所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接;任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基,所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接; $-S(=O)_2-R^{9a}$; 或 $-C(=O)-R^{10a}$,

R^{2a} 代表 $-H$; $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; 卤原子;直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团;饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团,所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接;或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基,所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接,

R^{3a} 和 R^{4a} , 其是相同或不同的,代表氢原子;直链或支链的、饱

和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团；任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，或者

R^{3a} 和 R^{4a} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的 4-9 元杂环，所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} ，其是相同或不同的，代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-CN$ ； $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$ ； $-OR^{13a}$ ； $-SR^{14a}$ ； $-C(=O)-OR^{15a}$ ； $-NR^{16a}R^{17a}$ ； $-C(=O)-R^{18a}$ ； $-(C=O)-NR^{19a}R^{20a}$ ； $-O-(C=O)-R^{21a}$ ； $-S(=O)_2-R^{22a}$ ； $-S(=O)_2-NR^{23a}R^{24a}$ ； $-NR^{25a}-C(=O)-NR^{26a}R^{27a}$ ； $-NR^{28a}-(C=O)-R^{29a}$ ； $-NR^{30a}-(C=O)-OR^{31a}$ ； $-NR^{32a}-S(=O)NR^{33a}R^{34a}$ ；或 $-S(=O)_2-OR^{35a}$ ；卤原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

条件是取代基 R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 中的至少一个代表 $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$ 部分，

R^{9a} 和 R^{10a} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

R^{11a} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯

基或 C_{2-6} 亚炔基连接；任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接；或者 $-S(=O)_2-R^{36a}$ 部分，

R^{12a} 代表任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

$R^{13a}-R^{35a}$ 各自独立地代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

R^{36a} 代表任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合。

而且，优选的是包含至少一种通式 Ia 的取代了的吲哚化合物的药物，其中

对于 $na = 0$

R^{1a} 代表氢原子；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子

作为环原子; $-S(=O)_2-R^{9a}$; 或 $-C(=O)-R^{10a}$,

优选地, R^{1a} 代表氢原子;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啉基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2-苯基$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或者

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啉基、吡嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2-苯基$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; $-S(=O)_2-R^{9a}$; 或 $-C(=O)-R^{10a}$,

更优选地, R^{1a} 代表氢原子,

对于 $na = 1, 2, 3$ 或 4

R^{1a} 代表氢原子; 直链或支链 C_{1-10} 烷基; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 任选至少单取代了的 5-10

元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; $-S(=O)_2-R^{9a}$; 或 $-C(=O)-R^{10a}$,

优选地, R^{1a} 代表氢原子; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啉基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或者

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啉基、吡嗪基、嘧啉基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; $-S(=O)_2-R^{9a}$; 或 $-C(=O)-R^{10a}$

并且 $R^{2a}-R^{36a}$ 具有上面给定的含义, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以

至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，优选的是含有至少一种通式 Ia 的取代了的吡啶化合物的药物，其中 R^{2a} 代表 -H; -NO₂; -NH₂; -SH; -OH; -CN; -CF₃; -OCH₃; -O-CH₂-CH₃; F; Cl; Br; I; 直链或支链的、饱和或不饱和的 C₁₋₁₀ 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C₁₋₆-亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C₁₋₆-亚烷基连接，并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子，

优选地， R^{2a} 代表 -H; -NO₂; -NH₂; -SH; -OH; -CN; -CF₃; -OCH₃; -O-CH₂-CH₃; F; Cl; Br; I; 选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 -(CH₂)_{1,2 或 3}-基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代：C₁₋₅-烷基、-O-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、氧代(=O)、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷基、-O-C(=O)-C₁₋₅-烷基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(C(=O))₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 -(CH₂)_{1, 2 或 3}-基

团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2-苯基$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地， R^{2a} 代表氢原子，

并且 na 、 R^{1a} 和 $R^{3a}-R^{36a}$ 具有上面给定的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，优选的是含有至少一种通式 Ia 的取代了的吡啶化合物的药物，其中

R^{3a} 和 R^{4a} ，其是相同或不同的，代表氢原子或者直链或支链 C_{1-8} 烷基，或者

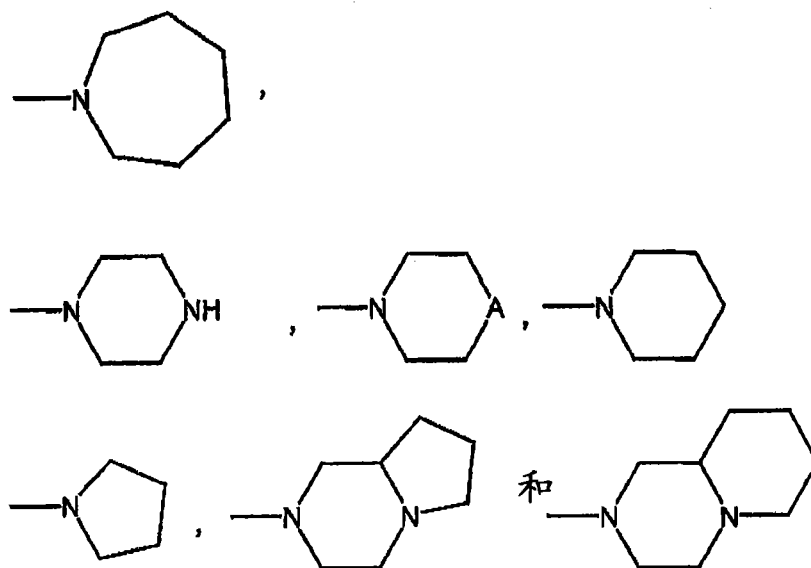
R^{3a} 和 R^{4a} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的 4-9 元杂环，所述杂环可以与任选至少单取代了的单环或双环状系统稠合，

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环，并且所述杂环和所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，

优选地

R^{3a} 和 R^{4a} ，其是相同或不同的，代表氢原子或选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基，异丁基和叔丁基；或者

R^{3a} 和 R^{4a} 与桥联氮原子共同形成选自下列的部分



A 代表氧原子或硫原子，并且每一个前述环状部分可以在包括吡嗪环的氮原子在内的任何位置上被 1、2 或 3 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}$ -烷基)、 $N(C_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}$ -烷基)、 $-CO-N(C_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}$ -烷基、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地， R^{3a} 和 R^{4a} ，其是相同或不同的，代表氢原子或选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基

并且

na 、 R^{1a} 、 R^{2a} 和 $R^{5a}-R^{36a}$ 具有上面给定的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，优选的是含有至少一种通式 Ia 的取代了的吡啶化合物的药物，其中

R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} ，其是相同或不同的，代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-$

CN; $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$; $-OR^{13a}$; $-SR^{14a}$; $-C(=O)-OR^{15a}$; $-NR^{16a}R^{17a}$; $-C(=O)-R^{18a}$; $-(C=O)-NR^{19a}R^{20a}$; $-O-(C=O)-R^{21a}$; $-S(=O)_2-R^{22a}$; $-S(=O)_2-NR^{23a}R^{24a}$; $-NR^{25a}-C(=O)-NR^{26a}R^{27a}$; $-NR^{28a}-(C=O)-R^{29a}$; $-NR^{30a}-(C=O)-OR^{31a}$; $-NR^{32a}-S(=O)NR^{33a}R^{34a}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35a}$; F, Cl, Br, I; $-CF_3$; $-CHF_2$; $-CH_2F$; 直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子,

优选地, R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$; $-OR^{13a}$; $-SR^{14a}$; $-C(=O)-OR^{15a}$; $-NR^{16a}R^{17a}$; $-C(=O)-R^{18a}$; $-(C=O)-NR^{19a}R^{20a}$; $-O-(C=O)-R^{21a}$; $-S(=O)_2-R^{22a}$; $-S(=O)_2-NR^{23a}R^{24a}$; $-NR^{25a}-C(=O)-NR^{26a}R^{27a}$; $-NR^{28a}-(C=O)-R^{29a}$; $-NR^{30a}-(C=O)-OR^{31a}$; $-NR^{32a}-S(=O)NR^{33a}R^{34a}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35a}$; F, Cl, Br, I; $-CF_3$; $-CHF_2$; $-CH_2F$; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶烷基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F, Cl, Br, I, $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地， R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} ，其是相同或不同的，各自代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-CN$ ； $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$ ； $-OR^{13a}$ ； $-SR^{14a}$ ； $-C(=O)-OR^{15a}$ ； $-NR^{16a}R^{17a}$ ； $-F$ ， Cl ， Br ， I ； $-CF_3$ ； $-CHF_2$ ； $-CH_2F$ ；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、C、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

在每一情况下条件是取代基 R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 中的至少一个代

表 $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$ 部分,

并且 na 、 $R^{1a}-R^{4a}$ 和 $R^{9a}-R^{36a}$ 具有上面给定的含义, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

而且, 优选的是含有至少一种通式 Ia 的取代了的吡啶化合物的药物, 其中取代基 R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 中的一个代表 $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$ 部分, 优选取代基 R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 中的一个代表 $-N(R^{11a})-S(=O)_2-R^{12a}$ 部分而 these 取代基的另外三个各自代表氢原子, 并且 na 、 $R^{1a}-R^{4a}$ 和 $R^{9a}-R^{36a}$ ——如果存在——具有上面给定的含义, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

而且, 优选的是含有至少一种通式 Ia 的取代了的吡啶化合物的药物, 其中 R^{9a} 和 R^{10a} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子, 优选地, R^{9a} 和 R^{10a} 各自独立地代表选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基, 异丁基和叔丁基; 或者选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷$

基)、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

并且 na 、 $\text{R}^{1a}-\text{R}^{8a}$ 和 $\text{R}^{11a}-\text{R}^{36a}$ 具有上面给定的含义, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

而且, 优选的是含有至少一种通式 Ia 的取代了的吡啶化合物的药物, 其中 R^{11a} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} -脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{36a}$ 部分,

优选地, R^{11a} 代表氢原子; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、氧代(=O)、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基;

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、

吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基,所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}-$ 烷基、 $-S-C_{1-5}-$ 烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}-$ 烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}-$ 烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-$ 烷基、 $-S(=O)_2-$ 苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基;或 $-S(=O)_2-R^{36a}-$ 部分,

更优选地, R^{11a} 代表氢原子,

并且 na 、 $R^{1a}-R^{10a}$ 和 $R^{12a}-R^{36a}$ 具有上面给定的含义,所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式,或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物,或其生理可接受的盐,或其相应的溶剂化物的形式。

而且,优选的是含有至少一种通式Ia的取代了的吡啶化合物的药物,其中 R^{12a} 代表任选至少单取代了的5-10元芳基或杂芳基,所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的、任选至少单取代了的 $C_{1-6}-$ 亚烷基、 $C_{2-6}-$ 亚烯基或 $C_{2-6}-$ 亚炔基基团连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的单环或双环状系统稠合,

所述环状系统的环是5、6或7元环,并且所述杂芳基和任选所述环状系统的一个或两个环含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子,

或者 R^{12a} 代表饱和或不饱和的、任选至少单取代了的3-9元脂环族基团,所述脂环族基团可以通过直链或支链 $C_{1-6}-$ 亚烷基、 $C_{2-6}-$ 亚烯基或 $C_{2-6}-$ 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

所述环状系统的环是5、6或7元环并且所述脂环族基团和任选所述环状系统的一个或两个环可以含有1、2或3个独立地选自氮、氧和

硫的杂原子,

优选地, R^{12a} 代表选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、2-氧代-2,3-二氢-苯并咪唑基、2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基、苯并咪唑基、苯并噻唑基、苯并咪唑烷基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、色烯基和苯并二氢吡喃基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

更优选地, R^{12a} 代表选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、1-萘基、2-萘基、吡唑基、噻吩基(噻吩基)、苯并[b]-噻吩基、苯并[b]呋喃基、喹啉基、异喹啉基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、2-氧代-2,3-二氢-苯并咪唑基和 2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或可以被 1、2、3、4 或 5 个独立地

选自下列的取代基取代：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 CFH_2 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_3$ 、 $\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

并且 na 、 $\text{R}^{1a}-\text{R}^{11a}$ 和 $\text{R}^{13a}-\text{R}^{36a}$ 具有上面给定的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

而且，优选的是含有至少一种通式 Ia 的取代了的吡啶化合物的药物，其中 $\text{R}^{13a}-\text{R}^{35a}$ 彼此独立地各自代表氢原子；直链或支链 C_{1-10} 烷基；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；

优选地， $\text{R}^{13a}-\text{R}^{35a}$ 彼此独立地代表氢原子；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1,2\text{ 或 }3}-$ 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 各个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基-(呋喃基)、噻吩

基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

并且 na 、 R^{1a} – R^{12a} 和 R^{36a} 具有上面给定的含义, 所述化合物任选以其一种立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少两种其立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

而且, 优选的是含有至少一种通式 Ia 的取代了的吲哚化合物的药物, 其中 R^{36a} 代表任选至少单取代了的 5–10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的、任选至少单取代了的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的单环或双环状系统稠合,

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环, 并且所述杂芳基和任选所述环状系统的一个或两个环含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子,

或者 R^{36a} 代表饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3–9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环并且所述脂环族基团和任选所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和

硫的杂原子,

优选地, R^{36a} 代表选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、2-氧代-2,3-二氢-苯并咪唑基、2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基、苯并咪唑基、苯并噻唑基、苯并咪唑烷基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、色烯基和苯并二氢吡喃基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

并且 na 和 $R^{1a}-R^{35a}$ 具有上面给定的含义, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

而且,优选的是含有至少一种通式 Ia 的取代了的吡啶化合物的药物,其中 na 是 0 并且 $R^{1a} - R^{36a}$ 具有上面给定的含义,所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式,或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物,或其生理可接受的盐,或其相应的溶剂化物的形式。

在任何前述定义中,下面条件可以适用,即 R^{3a} 和 R^{4a} 不同一地代表氢原子。

特别优选的是含有至少一种通式 Ia 的取代了的吡啶化合物的药物,

na 是 0,

R^{1a} 代表氢原子,

R^{2a} 代表氢原子,

R^{3a} 和 R^{4a} , 其是相同或不同的,代表选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基,

取代基 R^{5a} 、 R^{6a} 、 R^{7a} 和 R^{8a} 中的一个代表 $-N(R^{11a})-S(=O)-R^{12a}$ 一部分,而这些取代基中的另外三个各自代表氢原子,

R^{11a} 代表氢原子,

R^{12a} 代表选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、1-萘基、2-萘基、吡啶基、噻吩基(噻吩基)、苯并[b]-噻吩基、苯并[b]呋喃基、喹啉基、异喹啉基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噻唑基和 2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基,所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或可以被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-CF_2H$ 、 CFH_2 、 $-C(=O)-O-CH_3$ 、 $C(=O)-O-CH_2-CH_3$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

最特别优选的是含有至少一种选自下列的通式 Ia 的取代了的吡啶化合物的药物

[1] 2-[5-(5-氯-3-甲基-苯并[b]噻吩-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二乙基-2-氧代乙酰胺,

[2] N,N-二乙基-2-[5-(萘-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-

基]-2-氧代-乙酰胺,

[3] N,N-二乙基-2-[5-(萘-1-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[4] 2-[5-(联苯-4-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二乙基-2-氧代-乙酰胺,

[5] N,N-二乙基-2-氧代-2-[5-(喹啉-8-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-乙酰胺,

[6] N,N-二甲基-2-[5-(萘-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[7] N,N-二甲基-2-[5-(萘-1-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[8] 2-[5-(5-氯-3-甲基-苯并[b]噻吩-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[9] 2-[5-(6-氯-咪唑并[2,1-b]噻唑-5-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二乙基-2-氧代-乙酰胺,

[10] 2-[5-(6-氯-咪唑并[2,1-b]噻唑-5-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[11] N,N-二甲基-2-[4-(萘-1-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[12] 2-[4-(5-氯-3-甲基-苯并[b]噻吩-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[13] 2-[4-(6-氯-咪唑并[2,1-b]噻唑-5-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[14] N,N-二甲基-2-[5-[(4-氟-3-甲基-苯基)-1-磺酰基氨基]-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[15] 5-(3-二甲基氨基草酰基-1H-吡啶-5-基氨基磺酰基)-3-甲基-苯并呋喃-2-甲酸乙酯,

[16] 2-[5-(联苯-4-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[17] N,N-二甲基-2-氧代-2-[5-(2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑-6-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-乙酰胺,

[18] N,N-二甲基-2-氧代-2-[5-(2-氧代-2,3-二氢苯并[d]

噻唑-6-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基]乙酰胺,

[19] 2-[5-[(4-环己基-苯基)-1-磺酰基氨基]-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[20] N,N-二甲基-2-[5-[(4-苯氧基-苯基)-1-磺酰基氨基]-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[21] 2-(5-(5-氯-3-甲基苯并[b]噻吩-2-亚磺酰氨基)-2-甲基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[22] 2-(5-(6-氯咪唑并[2,1-b]噻唑-5-亚磺酰氨基)-2-甲基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[23] 2-(6-(5-氯-3-甲基苯并[b]噻吩-2-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[24] N,N-二甲基-2-(6-(萘-3-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺,

[25] 2-(6-(联苯-4-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[26] N,N-二甲基-2-(6-(萘-1-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺,

[27] N,N-二甲基-2-(6-(2-(萘-1-基)乙基亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺,

[28] N,N-二甲基-2-氧代-2-(6-(4-苯氧基苯基亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)乙酰胺,

[29] 2-(6-(3,4-二氯噻吩-2-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[30] 2-(6-(3,5-二氯苯基亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[31] 2-(6-(1-氯萘-6-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[32] 2-(6-(6-氯咪唑并[2,1-b]噻唑-5-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[33] N,N-二乙基-2-(2-甲基-5-(5-甲基-1-苯基-1H-吡唑-4-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺和

[34] N,N-二乙基-2-(2-甲基-5-(1,3,5-三甲基-1H-吡唑

-4-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺。

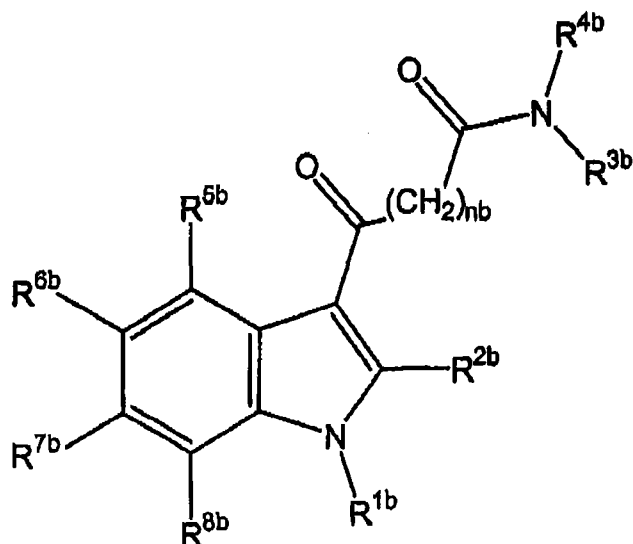
含有至少一种通式 Ia 的取代了的吡啶化合物和任选至少一种辅助物质的上述药物适用于 5-HT₆-受体调节,特别适用于预防和/或治疗至少部分由 5-HT₆-受体介导的病症或疾病,所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式,或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物,或其生理可接受的盐,或其相应的溶剂化物的形式。

优选地,所述药物适用于预防和/或治疗与食物摄取有关的病症或疾病,优选适用于调节食欲,适用于保持、增加或减少体重,适用于预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病),优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病,或者适用于预防和/或治疗过敏性结肠综合征;中枢神经系统病症;焦虑;惊恐发作;抑郁;双相性精神障碍;认知障碍;记忆障碍;老年痴呆;精神病;神经变性病症,优选选自阿尔茨海默病、帕金森病、亨廷顿病和多发性硬化;精神分裂症;精神病;多动障碍(ADHD, 注意缺陷/多动障碍),或适用于改善认知(认知提高)。

更优选地,所述药物适用于预防和/或治疗与食物摄取有关的病症或疾病,优选适用于调节食欲,适用于保持、增加或减少体重,适用于预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病),优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病。

最优选地,所述药物适用于预防和/或治疗肥胖症和/或与此有关的病症或疾病。

在还另外的方面中,本发明涉及使用至少一种通式 Ib 的取代了的吡啶化合物,



Ib

其中

nb 代表 0、1、2、3 或 4,

R^{1b} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接; $-S(=O)_2-R^{9b}$; 或 $-C(=O)-R^{10b}$,

R^{2b} 代表 $-H$; $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

R^{3b} 和 R^{4b} , 其是相同或不同的, 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的脂族基团, 任选至少单取代了的芳基或杂芳基基团, 所述基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所

述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合, 或者

R^{3b} 和 R^{4b} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的杂环, 所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单或多环状系统稠合,

R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$; $-OR^{13b}$; $-SR^{14b}$; $-C(=O)-OR^{15b}$; $-NR^{16b}R^{17b}$; $-C(=O)-R^{18b}$; $-(C=O)-NR^{19b}R^{20b}$; $-O-(C=O)-R^{21b}$; $-S(=O)_2-R^{22b}$; $-S(=O)_2-NR^{23b}R^{24b}$; $-NR^{25b}-C(=O)-NR^{26b}R^{27b}$; $-NR^{28b}-(C=O)-R^{29b}$; $-NR^{30b}-(C=O)-OR^{31b}$; $-NR^{32b}-S(=O)NR^{33b}R^{34b}$; 或者 $-S(=O)_2-OR^{35b}$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

条件是取代基 R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 中的至少一个代表 $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ 部分,

R^{9b} 和 R^{10b} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接,

R^{11b} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接; 任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的、任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接; 或者 $-S(=O)_2-R^{36b}$ 部分,

R^{12b} 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系

统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

R^{13b} 、 R^{14b} 、 R^{15b} 、 R^{16b} 、 R^{17b} 、 R^{18b} 、 R^{19b} 、 R^{20b} 、 R^{21b} 、 R^{22b} 、 R^{23b} 、 R^{24b} 、 R^{25b} 、 R^{26b} 、 p^{27b} 、 R^{28b} 、 R^{29b} 、 R^{30b} 、 R^{31b} 、 R^{32b} 、 R^{33b} 、 R^{34b} 、 R^{35b} 彼此独立地代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链亚烷基连接；或者任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链亚烷基连接，

R^{36b} 代表任选至少单取代了的芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的亚烷基、亚烯基或亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式，

用于制备适用于 5-HT₆ 受体调节，优选适用于预防和/或治疗至少部分由 5-HT₆ 受体介导的病症或疾病。

优选地，使用通式 Ib 化合物，其中

nb 是 0、1、2、3 或 4，

R^{1b} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C₁₋₁₀ 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C₁₋₆ 亚烷基连接；任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C₁₋₆ 亚烷基连接；-S(=O)₂- R^{9b} ；或 -C(=O)- R^{10b} ，

R^{2b} 代表 $-H$; $-NO_2$; $-NH_2$; $-SH$; $-OH$; $-CN$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接,

R^{3b} 和 R^{4b} , 其是相同或不同的, 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统耦合, 或者

R^{3b} 和 R^{4b} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的 4-9 元杂环, 所述杂环可以含有至少一个另外的杂原子作为环原子和/或所述杂环可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统耦合,

R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$; $-OR^{13b}$; $-SR^{14b}$; $-C(=O)-OR^{15b}$; $-NR^{16b}R^{17b}$; $-C(=O)-R^{18b}$; $-(C=O)-NR^{19b}R^{20b}$; $-O-(C=O)-R^{21b}$; $-S(=O)_2-R^{22b}$; $-S(=O)_2-NR^{23b}R^{24b}$; $-NR^{25b}-C(=O)-NR^{26b}R^{27b}$; $-NR^{28b}-(C=O)-R^{29b}$; $-NR^{30b}-(C=O)-OR^{31b}$; $-NR^{32b}-S(=O)NR^{33b}R^{34b}$; 或者 $-S(=O)_2-OR^{35b}$; 卤原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为链原子的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接; 或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接,

条件是取代基 R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 中的至少一个代表 $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ 部分,

R^{9b} 和 R^{10b} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；或者任选至少单取代了的、5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

R^{11b} 代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接；任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接；或者 $-S(=O)_2-R^{36b}$ 部分，

R^{12b} 代表任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的、任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合，

$R^{13b}-R^{35b}$ 各自独立地代表氢原子；直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} 脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接；或者任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接，

R^{36b} 代表任选至少单取代了的 5-14 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合；或者饱和或不饱和的、任选至少单取代了的、任选至少含有一个杂原子作为环原子的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链的任选至少单取代了的 C_{1-6} 亚烷基、 C_{2-6} 亚烯基或 C_{2-6} 亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至

少单取代了的单环或多环状系统稠合。

同样优选的是通式 Ib 化合物的应用, 其中 R^{1b} 代表氢原子; 直链或支链 C_{1-10} 烷基; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} 亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; $-S(=O)_2-R^{9b}$; 或 $-C(=O)-R^{10b}$,

优选地, R^{1b} 代表氢原子; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啉基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: $C_{1-5}-$ 烷基、 $-O-C_{1-5}$ 烷基、 $-S-C_{1-5}-$ 烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}-$ 烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}-$ 烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-$ 烷基、 $-S(=O)_2-$ 苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或者

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啉基、吡嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: $C_{1-5}-$ 烷基、 $-O-C_{1-5}-$ 烷基、 $-S-C_{1-5}-$ 烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}-$ 烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}-$ 烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-$ 烷基、 $-S(=O)_2-$ 苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基;

-5-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；-S(=O)₂-R^{9b}；或-C(=O)-R^{10b}，

更优选地，R^{1b}代表氢原子，并且nb和R^{2b}-R^{36b}具有上面给定的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

同样优选的是通式Ib化合物的应用，其中

R^{2b}代表-H；-NO₂；-NH₂；-SH；-OH；-CN；-CF₃；-OCH₃；-O-CH₂-CH₃；F；Cl；Br；I；直链或支链的、饱和或不饱和的C₁₋₁₀脂族基团；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的3-9元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链C₁₋₆亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；或者任选至少单取代了的5-10元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链C₁₋₆-亚烷基连接，并且其中所述杂芳基含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子，

优选地，R^{2b}代表-H；-NO₂；-NH₂；-SH；-OH；-CN；-CF₃；-OCH₃；-O-CH₂-CH₃；F；Cl；Br；I；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啉基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过-(CH₂)_{1, 2 或 3}-基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代：C₁₋₅-烷基、-O-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、氧代(=O)、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷基、-O-(C=O)-C₁₋₅-烷基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂

- 苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基;

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: 直链或支链 C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

更优选地, R^{2b} 代表氢原子,

并且 nb 、 R^{1b} 和 $R^{3b}-R^{36b}$ 具有上面给定的含义, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

同样优选的是通式 Ib 化合物的应用, 其中

R^{3b} 和 R^{4b} , 其是相同或不同的, 代表氢原子或者直链或支链 C_{1-8} 烷基, 或者

R^{3b} 和 R^{4b} 与桥联氮原子共同形成任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的 4-9 元杂环, 所述杂环可以与任选至少单取代了的单环或双环状系统稠合,

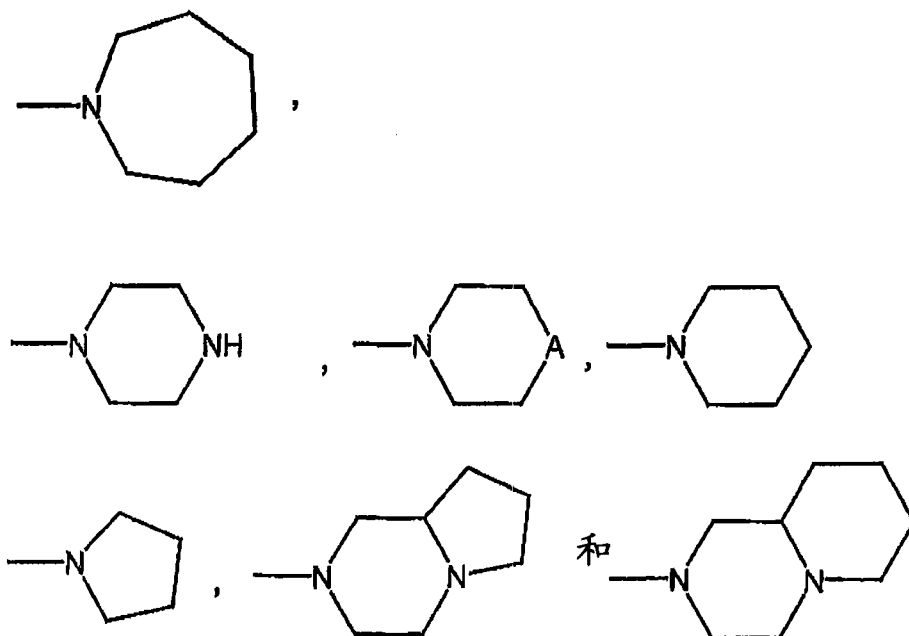
所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环, 并且所述杂环和所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子,

优选地,

R^{3b} 和 R^{4b} , 其是相同或不同的, 代表氢原子或选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基, 异丁基和叔丁基; 或

者

R^{3b} 和 R^{4b} 与桥联氮原子共同形成选自下列的部分



A 代表氧原子或硫原子，并且每一个前述环状部分可以在包括哌嗪环的氮原子在内的任何位置上被 1、2 或 3 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2-苯基$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地， R^{3b} 和 R^{4b} ，其是相同或不同的，代表氢原子或选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基，

并且 nb、 R^{1b} 、 R^{2b} 和 $R^{5b}-R^{36b}$ 具有上面给定的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

同样优选的是通式 Ib 化合物的应用, 其中

R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$; $-OR^{13b}$; $-SR^{14b}$; $-C(=O)-OR^{15b}$; $-NR^{16b}R^{17b}$; $-C(=O)-R^{18b}$; $-(C=O)-NR^{19b}R^{20b}$; $-O-(C=O)-R^{21b}$; $-S(=O)_2-R^{22b}$; $-S(=O)_2-NR^{23b}R^{24b}$; $-NR^{25b}-C(=O)-NR^{26b}R^{27b}$; $-NR^{28b}-(C=O)-R^{29b}$; $-NR^{30b}-(C=O)-OR^{31b}$; $-NR^{32b}-S(=O)NR^{33b}R^{34b}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35b}$; F , Cl , Br , I ; $-CF_3$; $-CHF_2$; $-CH_2F$; 直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子,

优选地, R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} , 其是相同或不同的, 代表 $-H$; $-NO_2$; $-CN$; $-N(R^{11b})-SO_2-R^{12b}$; $-OR^{13b}$; $-SR^{14b}$; $-C(=O)-OR^{15b}$; $-NR^{16b}R^{17b}$; $-C(=O)-R^{18b}$; $-(C=O)-NR^{19b}R^{20b}$; $-O-(C=O)-R^{21b}$; $-S(=O)_2-R^{22b}$; $-S(=O)_2-NR^{23b}R^{24b}$; $-NR^{25b}-C(=O)-NR^{26b}R^{27b}$; $-NR^{28b}-(C=O)-R^{29b}$; $-NR^{30b}-(C=O)-OR^{31b}$; $-NR^{32b}-S(=O)NR^{33b}R^{34b}$; 或 $-S(=O)_2-OR^{35b}$; F , Cl , Br , I ; $-CF_3$; $-CHF_2$; $-CH_2F$; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基; 选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代($=O$)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、

环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萆基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}-$ 烷基、 $-S-C_{1-5}-$ 烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}-$ 烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}-$ 烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-$ 烷基、 $-S(=O)_2-$ 苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

更优选地， R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} ，其是相同或不同的，各自代表 $-H$ ； $-NO_2$ ； $-CN$ ； $-N(R^{11b})-SO_2-R^{12b}$ ； $-OR^{13b}$ ； $-SR^{14b}$ ； $-C(=O)-OR^{15b}$ ； $-NR^{16b}R^{17b}$ ； $-F$ ，Cl，Br，I； $-CF_3$ ； $-CHF_2$ ； $-CH_2F$ ；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萆基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}-$ 烷基、 $-S-C_{1-5}-$ 烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}-$ 烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}-$ 烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-$ 烷基、 $-S(=O)_2-$ 苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

在每一情况下，条件是取代基 R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 中的至少一个代表 $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ 部分，

并且 nb 、 $R^{1b}-R^{4b}$ 和 $R^{9b}-R^{36b}$ 具有上面给定的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

同样优选的是通式 Ib 化合物的应用，其中取代基 R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 中的一个代表 $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ 部分，优选地取代基 R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 中的一个代表 $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ 部分，而这些取代基中的另外三个各自代表氢原子，并且 nb 、 $R^{1b}-R^{4b}$ 和 $R^{9b}-R^{36b}$ ——如果存在——具有上面给定的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

同样优选的是通式 Ib 化合物的应用，其中 R^{9b} 和 R^{10b} 各自独立地代表直链或支链的、饱和或不饱和的 C_{1-10} 脂族基团；或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基连接，并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子，

优选地， R^{9b} 和 R^{10b} 各自独立地代表选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基，异丁基和叔丁基；或者选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代： C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$

基)、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

并且 nb、 $\text{R}^{1b}-\text{R}^{8b}$ 和 $\text{R}^{11b}-\text{R}^{36b}$ 具有上面给定的含义, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

同样优选的是通式 Ib 化合物的应用, 其中

R^{11b} 代表氢原子; 直链或支链的、饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 C_{1-10} -脂族基团; 饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接, 并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子; 或者 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{36b}$ 部分,

优选地, R^{11b} 代表氢原子; 选自下列的烷基: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基;

选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(\text{CH}_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、氧代(=O)、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基;

选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、

吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基,所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1,2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基;或 $-S(=O)_2-R^{36b}$ -部分,

更优选地, R^{11b} 代表氢原子,

并且nb、 $R^{1b}-R^{10b}$ 和 $R^{12b}-R^{36b}$ 具有上面给定的含义,所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式,或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物,或其生理可接受的盐,或其相应的溶剂化物的形式。

同样优选的是通式Ib化合物的应用,其中 R^{12b} 代表任选至少单取代了的5-10元芳基或杂芳基,所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的、任选至少单取代了的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的单环或双环状系统稠合,

所述环状系统的环是5、6或7元环,并且所述杂芳基和任选所述环状系统的一个或两个环含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子,

或者 R^{12b} 代表饱和或不饱和的、任选至少单取代了的3-9元脂环族基团,所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

所述环状系统的环是5、6或7元环并且所述脂环族基团和任选所述环状系统的一个或两个环可以含有1、2或3个独立地选自氮、氧和硫的杂原子,

优选地, R^{12b} 代表选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基、2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基、苯并噁唑基、苯并噻唑基、苯并咪唑基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、色烯基和苯并二氢吡喃基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}\text{-烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

更优选地, R^{12b} 代表选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、1-萘基、2-萘基、吡唑基、噻吩基(噻吩基)、苯并[b]-噻吩基、苯并[b]呋喃基、喹啉基、异喹啉基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基和 2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或可以被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲

丁基、异丁基、叔丁基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-CF₂H、CFH₂、-C(=O)-O-CH₃、C(=O)-O-CH₂-CH₃、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，

并且 nb、R^{1b}-R^{11b} 和 R^{13b}-R^{36b} 具有上面给定的含义，所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

同样优选的是通式 Ib 化合物的应用，其中 R^{13b}-R^{35b} 彼此独立地各自代表氢原子；直链或支链 C₁₋₁₀ 烷基；饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团，所述脂环族基团可以通过直链或支链 C₁₋₆ 亚烷基连接和/或所述脂环族基团可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；或者任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基，所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链 C₁₋₆-亚烷基连接并且其中所述杂芳基含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子作为环原子；

优选地，R^{13b}-R^{35b} 彼此独立地代表氢原子；选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基；

选自下列的脂(杂)环族基团：环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啉基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基，所述脂(杂)环族基团可以通过 -(CH₂)_{1, 2 或 3}-基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代：C₁₋₅-烷基、-O-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、氧代(=O)、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷基、-O-C(=O)-C₁₋₅-烷基、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-烷基)、-N(C₁₋₅-烷基)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-烷基)、-CO-N(C₁₋₅-烷基)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-烷基、-S(=O)₂-苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基；或者

选自下列的芳基或杂芳基：苯基、萘基、呋喃基-(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、

吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2-\text{苯基}$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

并且 nb、 R^{1b} 、 R^{12b} 和 R^{36b} 具有上面给定的含义, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

同样优选的是通式 Ib 化合物的应用, 其中 R^{36b} 代表任选至少单取代了的 5-10 元芳基或杂芳基, 所述芳基或杂芳基可以通过直链或支链的、任选至少单取代了的 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述芳基或杂芳基可以与任选至少单取代了的、饱和的、不饱和的或芳族的单环或双环状系统稠合,

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环, 并且所述杂芳基和任选所述环状系统的一个或两个环含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子,

或者 R^{36b} 代表饱和或不饱和的、任选至少单取代了的 3-9 元脂环族基团, 所述脂环族基团可以通过直链或支链 C_{1-6} -亚烷基、 C_{2-6} -亚烯基或 C_{2-6} -亚炔基连接和/或所述脂环族基团可以与任选至少单取代了的单环或多环状系统稠合,

所述环状系统的环是 5、6 或 7 元环并且所述脂环族基团和任选所述环状系统的一个或两个环可以含有 1、2 或 3 个独立地选自氮、氧和硫的杂原子,

优选地, R^{36b} 代表选自下列的芳基或杂芳基: 苯基、萘基、呋喃基

(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基、2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基、苯并噁唑啉基、苯并噻唑啉基、苯并咪唑烷基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、色烯基和苯并二氢吡喃基, 所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基; 或选自下列的脂(杂)环族基团: 环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基, 所述脂(杂)环族基团可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}$ -基团连接和/或被1、2、3、4或5个独立地选自下列的取代基取代: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、氧代(=O)、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-\text{烷基})$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-\text{烷基})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-\text{烷基}$ 、 $-S(=O)_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基,

并且 nb 和 $R^{1b}-R^{35b}$ 具有上面给定的含义, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选对映体或非对映体、外消旋体——的形式, 或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物, 或其生理可接受的盐, 或其相应的溶剂化物的形式。

同样优选的是通式 Ib 化合物的应用, 其中 nb 是 0 并且 $R^{1b}-R^{36b}$ 具有上面给定的含义, 所述化合物任选以一种其立体异构体——优选

对映体或非对映体、外消旋体——的形式，或者以至少其两种立体异构体——优选对映体和/或非对映体——的任何混合比率的混合物，或其生理可接受的盐，或其相应的溶剂化物的形式。

在任何前述定义中，下面的条件可以适用，即 R^{3b} 和 R^{4b} 不同一地代表氢原子。

特别优选的是通式 Ib 化合物的应用，其中

nb 是 0，

R^{1b} 代表氢原子，

R^{2b} 代表氢原子，

R^{3b} 和 R^{4b} ，其是相同或不同的，代表选自下列的烷基：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基和叔丁基，

取代基 R^{5b} 、 R^{6b} 、 R^{7b} 和 R^{8b} 中的一个代表 $-N(R^{11b})-S(=O)_2-R^{12b}$ 一部分，而这些取代基的另外三个各自代表氢原子，

R^{11b} 代表氢原子，

R^{12b} 代表选自下列的芳基或杂芳基：苯基、1-萘基、2-萘基、吡唑基、噻吩基(噻吩基)、苯并[b]-噻吩基、苯并[b]呋喃基、喹啉基、异喹啉基、咪唑并[2,1-b]噻唑基、2-氧代-2,3-二氢-苯并噁唑基和 2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑基，所述芳基或杂芳基可以通过 $-(CH_2)_{1, 2 \text{ 或 } 3}-$ 基团连接和/或可以被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自下列的取代基取代：甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-CF_2H$ 、 CFH_2 、 $-C(=O)-O-CH_3$ 、 $C(=O)-O-CH_2-CH_3$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基。

最特别优选的是选自下列的通式 Ib 化合物的应用

[1] 2-[5-(5-氯-3-甲基-苯并[b]噻吩-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二乙基-2-氧代乙酰胺，

[2] N,N-二乙基-2-[5-(萘-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺，

[3] N,N-二乙基-2-[5-(萘-1-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺，

[4] 2-[5-(联苯-4-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二乙基-2-氧代-乙酰胺，

[5] N,N-二乙基-2-氧代-2-[5-(喹啉-8-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-乙酰胺,

[6] N,N-二甲基-2-[5-(萘-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[7] N,N-二甲基-2-[5-(萘-1-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[8] 2-[5-(5-氯-3-甲基-苯并[b]噻吩-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[9] 2-[5-(6-氯-咪唑并[2,1-b]噻唑-5-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二乙基-2-氧代-乙酰胺,

[10] 2-[5-(6-氯-咪唑并[2,1-b]噻唑-5-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[11] N,N-二甲基-2-[4-(萘-1-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[12] 2-[4-(5-氯-3-甲基-苯并[b]噻吩-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[13] 2-[4-(6-氯-咪唑并[2,1-b]噻唑-5-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[14] N,N-二甲基-2-[5-[(4-氯-3-甲基-苯基)-1-磺酰基氨基]-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[15] 5-(3-二甲基氨基草酰基-1H-吡啶-5-基氨基磺酰基)-3-甲基-苯并呋喃-2-甲酸乙酯,

[16] 2-[5-(联苯-4-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[17] N,N-二甲基-2-氧代-2-[5-(2-氧代-2,3-二氢-苯并噻唑-6-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-乙酰胺,

[18] N,N-二甲基-2-氧代-2-[5-(2-氧代-2,3-二氢苯并[d]噻唑-6-亚磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]乙酰胺,

[19] 2-[5-[(4-环己基-苯基)-1-磺酰基氨基]-1H-吡啶-3-基]-N,N-二甲基-2-氧代-乙酰胺,

[20] N,N-二甲基-2-[5-[(4-苯氧基-苯基)-1-磺酰基氨基]-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺,

[21] 2-(5-(5-氯-3-甲基苯并[b]噻吩-2-亚磺酰氨基)-2-甲基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[22] 2-(5-(6-氯咪唑并[2,1-b]噻唑-5-亚磺酰氨基)-2-甲基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[23] 2-(6-(5-氯-3-甲基苯并[b]噻吩-2-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[24] N,N-二甲基-2-(6-(萘-3-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺,

[25] 2-(6-(联苯-4-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[26] N,N-二甲基-2-(6-(萘-1-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺,

[27] N,N-二甲基-2-(6-(2-(萘-1-基)乙基亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺,

[28] N,N-二甲基-2-氧代-2-(6-(4-苯氧基苯基亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)乙酰胺,

[29] 2-(6-(3,4-二氯噻吩-2-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[30] 2-(6-(3,5-二氯苯基亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[31] 2-(6-(1-氯萘-6-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[32] 2-(6-(6-氯咪唑并[2,1-b]噻唑-5-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺,

[33] N,N-二乙基-2-(2-甲基-5-(5-甲基-1-苯基-1H-吡唑-4-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺和

[34] N,N-二乙基-2-(2-甲基-5-(1,3,5-三甲基-1H-吡唑-4-亚磺酰氨基)-1H-吡啶-3-基)-2-氧代乙酰胺。

优选的是在制备适用于预防和/或治疗与食物摄取有关的病症或疾病, 优选适用于调节食欲, 适用于保持、增加或减少体重, 适用于预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或 II 型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病), 优选由肥胖症引起的 II 型糖尿病, 或适用于预防和/

或治疗过敏性结肠综合征；中枢神经系统病症；焦虑；惊恐发作；抑郁；双相性精神障碍；认知障碍；记忆障碍；老年痴呆；精神病；神经变性病症，优选选自阿尔茨海默病、帕金森病、亨廷顿病和多发性硬化；精神分裂症；精神病；多动障碍(ADHD，注意缺陷/多动障碍)，或适用于改善认知(认知提高)方面的药物的上述应用。

特别优选的是在制备适用于预防和/或治疗与食物摄取有关的病症或疾病，优选适用于调节食欲，适用于保持、增加或减少体重，适用于预防和/或治疗肥胖症、贪食症、厌食症、恶病质或II型糖尿病(非胰岛素依赖型糖尿病)，优选由肥胖症引起的II型糖尿病方面的药物的上述应用。

最特别优选的是在制备适用于预防和/或治疗肥胖症和/或与此有关的病症或疾病方面的药物的上述应用。

用类似于上述制备通式I和Ic的取代了的吡啶化合物的方法，可以获得通式Ia和Ib的取代了的吡啶化合物和相应的立体异构体。以类似于US 2003/0181482 A1中描述的方法，可以获得任何通式I、Ia、Ib和Ic的取代了的吡啶化合物。该描述的有关部分特此引入作为参考并形成本公开的部分。

本发明的单或多环状系统——如果不另外定义——意指可以是饱和、不饱和或芳族的单或多环烃环状系统。如果该环状系统是多环，例如双环，每一个不同的环可以显示不同的饱和度，即，所述环可以是饱和的、不饱和的或芳族的。该单或多环状系统的每一个环可以任选含有一个或多个，优选1、2或3个杂原子作为环原子，所述杂原子可以是相同或不同的，并且可以优选选自N、O、S和P，更优选选自N、O和S。该多环状系统可以优选包含稠合的两个环。该单或多环状系统的环优选是5、6或7元环。

按照本发明，术语“稠合的”意指环或环状系统是连接到另外的环或环状系统上，本领域的技术人员也使用术语“成环的(annulated)”或“增环的(annelated)”以指明这种连接。

这样的单或多环状系统可以——如不另外定义——是未取代的或被一个或多个取代基取代了的，优选未取代的或被1、2、3、4或5个取代基取代了的。所述取代基可以优选独立地选自C₁₋₅-烷基、-O-C₁₋₅-烷基、-S-C₁₋₅-烷基、氧代(=O)、-C(=O)-O-C₁₋₅-烷

基、 $-\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}$ -烷基)、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}$ -烷基)、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-\text{S}(\text{=O})_2-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}(\text{=O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，在每一次出现的情况下 C_{1-5} -烷基可以是直链或支链的，并且所述环式取代基可以是未取代或被 1、2 或 3 个独立地选自下列的取代基取代了的：甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、F、Cl、Br、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 和 NO_2 。

如果任何取代基代表包含脂环族基团(脂环族基团)，所述脂环族基团可以——如果不另外定义——是未取代的或被一个或多个取代基取代了的，优选未取代的或被 1、2、3、4 或 5 个取代基取代了的。所述取代基可以优选独立地选自： C_{1-5} -烷基、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{O}-(\text{C}=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ -烷基、氧代($=\text{O}$)、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}$ -烷基)、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}$ -烷基)、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_{1-5}$ -烷基) $_2$ 、 $-\text{S}(\text{=O})_2-\text{C}_{1-5}$ -烷基、 $-\text{S}(\text{=O})_2$ -苯基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基，在每一次出现的情况下 C_{1-5} -烷基可以是直链或支链的，并且所述环式取代基可以是未取代的或被 1、2 或 3 个独立地选自下列的取代基取代了的：甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、F、Cl、Br、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 和 NO_2 。

如果任何取代基代表包含脂环族基团，所述脂环族基团含有一个或多个，优选 1、2 或 3 个杂原子作为环原子，除非另外定义，这些杂原子中的每一个可以优选选自 N、O 和 S。

适宜的脂环族基团，其可以是未取代的或至少单取代了的，包括环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基、环壬基、咪唑烷基、吡丙啶基、氮杂环丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、吗啉基、硫代吗啉基、哌嗪基、吡唑烷基和氮杂环庚烷基。

如果任何取代基代表或包含芳基(芳基)，包括苯基或萘基，所述芳基可以——如果不另外定义——是未取代的或被一个或多个取代基取

代了的, 优选未取代的或被 1、2、3、4 或 5 个取代基取代了的。所述取代基可以优选独立地选自 C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2-苯基$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基, 在每一次出现的情况下 C_{1-5} -烷基可以是直链或支链的, 并且所述环式取代基可以是未取代的或被 1、2 或 3 个独立地选自下列的取代基取代: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、F、Cl、Br、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 和 NO_2 。

优选的芳基, 其可以任选是至少单取代了的, 是苯基和萘基。

如果任何取代基代表或包含杂芳基(杂芳基), 所述杂芳基可以——如果不另外定义——是未取代的或被一个或多个取代基取代了的, 优选未取代的或被 1、2、3、4 或 5 个取代基取代了的。所述取代基可以优选独立地选自: C_{1-5} -烷基、 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-烷基)$ 、 $-CO-N(C_{1-5}-烷基)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-烷基$ 、 $-S(=O)_2-苯基$ 、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、苯基、苯氧基和苄基, 在每一次出现的情况下 C_{1-5} -烷基可以是直链或支链的, 并且所述环式取代基可以是未取代的或被 1、2 或 3 个独立地选自下列的取代基取代了的: 甲基、乙基、正丙基、异丙基、甲氧基、乙氧基、F、Cl、Br、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 和 NO_2 。

杂原子, 其是作为杂芳基中的环原子存在的, 可以——除非另外定义——独立地选自氮、氧和硫。优选地, 杂芳基含有 1、2 或 3 个杂原子。

适宜的杂芳基, 其可以是任选至少单取代了的, 可以优选选自呋喃基-(呋喃基)、噻吩基(噻吩基)、吡咯基、咪唑基、异咪唑基、噻唑

基、异噻唑基、咪唑基、吡唑基、噁二唑基、噻二唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、喹啉基、异喹啉基、苯并[b]呋喃基、苯并[b]噻吩基和咪唑并[2,1-b]噻唑基。

如果任何取代基代表饱和或不饱和的脂族基团(脂族基团),即烷基、烯基或炔基,所述脂族基团可以-如果不另外定义-是未取代的或被一个或多个取代基取代了的,优选未取代的或被1、2、3、4或5取代基取代了的。所述取代基可以优选独立地选自: $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-(C=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、 $-F$ 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 和 $-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$,在每一次出现的情况下 C_{1-5} -烷基可以是直链或支链的。烯基包含至少一个碳-碳双键,炔基包含至少一个碳-碳三键。

适宜的脂族基团,其可以被一个或多个取代基取代,可以优选选自甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、正戊基、正己基、正庚基、正辛基、正壬基、正癸基,乙烯基、乙炔基、丙烯基、丙炔基、丁烯基和丁炔基。

如果任何取代基代表亚烷基、亚烯基或亚炔基,其可以是取代了的,所述亚烷基、亚烯基或亚炔基可以-如果不另外定义-是未取代的或被一个或多个取代基取代了的,优选未取代的或被1、2或3个取代基取代了的。所述取代基可以优选独立地选自 $-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-S-C_{1-5}$ -烷基、 $-(C=O)-O-C_{1-5}$ -烷基、 $-O-(C=O)-C_{1-5}$ -烷基、 $-F$ 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-烷基})$ 和 $-N(C_{1-5}\text{-烷基})_2$,在每一次出现的情况下 C_{1-5} -烷基可以是直链或支链的。亚烯基包含至少一个碳-碳双键,亚炔基包含至少一个碳-碳三键。

适宜的亚烷基包括 $-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)_2-$ 、 $-(CH_2)_3-$ 、 $-(CH_2)_4-$ 、 $-(CH_2)_5-$ 、 $-(CH_2)_6-$,适宜的亚烯基包括 $-CH=CH-$ 、 $-CH_2-CH=CH-$ 和 $-CH=CH-CH_2-$,而适宜的亚炔基包括 $-C\equiv C-$ 、 $-CH_2-C\equiv C-$ 和 $-C\equiv C-CH_2-$ 。

通式 I、Ia、Ib 和 Ic 的取代了的吡啶化合物及其在每一情况下的立体异构体可以按照本领域技术人员众所周知的方法,例如通过使所述化合物与至少一种无机和/或有机酸,优选在适宜的反应介质中,进

行反应，以相应的盐的形式获得。适宜的反应介质包括例如任何上面给定的介质。适宜的无机酸包括但不限于盐酸、氢溴酸、磷酸、硫酸、硝酸，适宜的有机酸包括但不限于柠檬酸、马来酸、富马酸、酒石酸或其衍生物、对甲苯磺酸、甲磺酸或樟脑磺酸。

通式 I、Ia、Ib 和 Ic 的取代了的吡啶化合物的或在相应立体异构体的每一情况下的溶剂化物，优选水合物，也可以通过本领域技术人员已知的标准方法制备。

本发明的任何药物可以是以任何适合应用于人和/或动物——优选人包括婴儿、儿童和成人——的形式。所述药物可以通过本领域技术人员已知的标准方法，例如下列文献目录中的方法来制备："药物 (Pharmaceutics): 剂型科学(The Science of Dosage Forms)", 第二版, Aulton, M. E. (ED. Churchill Livingstone, Edinburgh (2002); "药学大全 (Encyclopedia of Pharmaceutical Technology)", 第二版, Swarbrick, J. and Boylan J.C. (Eds.), Marcel Dekker, Inc. 纽约(2002); "现代药物 (Modern Pharmaceutics)", 第 4 版, Banker G. S. 和 Rhodes C. T. (Eds.) Marcel Dekker, Inc. 纽约 2002, "工业制药的理论和实践(The Theory and Practice of Industrial Pharmacy)", Lachman L., Lieberman H.和 Kanig J. (Eds.), Lea & Febiger, Philadelphia (1986)。该文献的有关描述特此引入本文作为参考并形成本公开的部分。该药物的组成可以根据给药途径而变化。

本发明药物可以，例如，与像水或适宜的醇一类的常规可注射液载体联合在一起肠胃外(parentally)给药。用于注射的常规药物赋形剂，例如稳定剂、增溶剂和缓冲剂，可以包含于这样的可注射组合物中。这些药物可以例如肌肉内、腹膜内或静脉内注射。

本发明药物也可以配制成固体或液体形式的含有一种或多种生理可相容的载体或赋形剂的口服给药组合物。这些组合物可以含有常规组分例如结合剂、填充剂、滑润剂和可接受的湿润剂。该组合物可以采取任何方便的立即或迟缓释放的形式，例如片剂、小丸、颗粒、胶囊、锭剂、水或油的溶液、悬浮液、乳液、或者适用于在使用前与水或其它适宜的液体介质进行再构成的干燥粉末形式。可以把多微粒形式，例如小丸或颗粒，例如装填在胶囊中，压制成片剂或悬浮在适宜的液体中。

适宜的控释制剂、材料及其制备方法在现有技术中，例如在下列文献的目录中是已知的：“改进释放的药物释放技术(Modified - Release Drug Delivery Technology)", Rathbone, M. J. Hadgraft, J.和 Roberts, M.S. (Eds.), Marcel Dekker, Inc., 纽约(2002); "药物控制释放技术手册(Handbook of Pharmaceutical Controlled Release Technology)", Wise, D.L. (Ed.), Marcel Dekker, Inc. 纽约, (2000); "受控药物释放(Controlled Drug Delivery)", 第 I 卷, Basic Concepts, Bruck, S.D. (Ed.), CRD Press Inc., Boca Raton (1983) y de Takada, K.和 Yoshikawa, H., "口服药物释放(Oral Drug Delivery)", 受控药物释放大全(Encyclopedia of Controlled Drug Delivery), Mathiowitz, E. (Ed.), John Wiley & Sons, Inc., 纽约(1999), 第 2 卷, 728 - 742; Fix, J., "Oral drug delivery, small intestine and colon", 受控药物释放大全(Encyclopedia of Controlled Drug Delivery), Mathiowitz, E. (Ed.), John Wiley & Sons, Inc., 纽约(1999), 第 2 卷, 698 - 728。该文献的有关描述特此引用作为参考并形成本公开的部分。

本发明药物也可以有肠溶性包衣，以便药物的溶解依赖于 pH - 值。由于所述包衣，药物能够通过胃部而不溶解，并且有关的吡啶化合物在肠道中被释放。优选地，肠溶性包衣在 pH 值在 5 - 7.5 之间是可溶的。适宜的材料和制备方法在现有技术中是已知的。通常，本发明药物可以含有 1 - 60%重量本文定义的一种或多种取代了的吡啶化合物，和 40 - 99%重量一种或多种辅助物质(添加剂)。

给药的液体口服形式也可以含有像甜味剂、调味剂、防腐剂 and 乳化剂一类的某些添加剂。也可以配制用于口服给药的含有食用油的非水液体组合物。可以将这样的液体组合物以单位剂量的量方便地包装在例如明胶胶囊中。

本发明组合物也可以局部或通过栓剂给药。

用于人和动物的日剂量可以根据基于各自相应的种类的因素或其它因素例如年龄、性别、体重和疾病的程度等而变化。用于人的日剂量可以优选在 1 - 2000、优选 1 - 1500、更优选 1 - 1000 毫克活性物质的范围之间，以每日一次或几次摄入给药。

下面描述测定取代了的吡啶化合物的药理学活性的方法。

药理学方法:

I) 与血清素受体 5-HT₆ 的结合

表达 5-HT₆ 人重组受体的 HEK-293 细胞的细胞膜是由 Receptor Biology 提供的。在所述细胞膜中, 受体浓度为 2.18 pmol/mg 蛋白, 并且蛋白的浓度为 9.17 mg/ml。实验方案按照下述的略有改变的 B. L. Roth 等人 [B. L. Roth, S. C. Craigo, M. S. Choudhary, A. Uluer, F. J. Monsma, Y. Shen, H. Y. Meltzer, D. R. Sibley: Binding of Typical and Atypical Antipsychotic Agents to 5-Hydroxytryptamine-6 and Hydroxytryptamine-7 Receptors. The Journal of Pharmacology and Experimental Therapeutics, 1994, 268, 1403] 的方法。该文献的有关部分特此引用作为参考并形成本公开的部分。

把商购的细胞膜用结合缓冲液: 50 mM Tris-HCl, 10 mM MgCl₂, 0.5 mM EDTA (pH 7.4), 稀释(1:40 稀释)。使用的放射性配体是最终体积为 200 μ l、浓度 2.7 nM 的 [³H]-LSD。培养是通过加入 100 μ l 膜悬浮液($\approx$ 22.9 μ g 膜蛋白)开始的, 并且在 37°C 温度下持续 60 分钟。通过在 Brandel Cell Harvester 中经由用 0.5% 聚氮丙啶溶液预处理的 Schleicher & Schuell GF 3362 制造的玻璃纤维过滤器快速过滤来结束培养。将过滤器用三毫升缓冲液 Tris-HCl 50 mM pH 7.4 洗涤三次。把过滤器转移到烧瓶中, 并向每个烧瓶中加入 5 ml Ecoscint H 液体闪烁混合物。在用 Wallac Winspectral 1414 闪烁计数器计数之前, 用几个小时使烧瓶达到平衡。在 100 μ M 血清素存在下测定非特异性结合。测试以一式三份进行。用 Munson 和 Rodbard, Analytical Biochemistry, 1980, 107, 220 中描述的 EBDA/LIGAND 程序, 通过非线性回归分析来计算抑制常数(K_i, nM), 该文献的有关部分特此引用作为参考并形成本公开的部分。

II) 食物摄取测定(行为模式):

使用得自 Harlan, S.A. 的雄性 W 大鼠(200-270 g)。在经受任何治疗之前, 使动物适应动物设施至少 5 天。在此期间, 把动物在半透明的笼子中饲养(每五支组成一组), 并且提供食物和水让其任意获得。在开始处置之前, 使动物适应单个饲养条件至少 24 小时。

然后按如下所述, 在禁食的大鼠中测定本发明取代的吲哚化合物

的急性作用:

把大鼠在其单个饲养笼子中禁食 23 小时。在此期间后, 给大鼠口服或腹膜内给药包含取代的吲哚化合物的组合物或没有所述取代的吲哚化合物的相应组合物(载体)。给药之后马上供给大鼠预先称重的食物, 并在 1、2、4 和 6 小时后测定累积食物摄取。

所述测定食物摄取的方法也描述于 Kask 等人, *European Journal of Pharmacology* 414 (2001), 215 - 224 和 Turnbull 等人, *Diabetes*, Vol. 51, August 2002 文献出版物中。

下面用实施例来举例说明本发明。这些说明只是以实施例的方式给出, 而不是限制本发明的一般精神。

实施例:

实施例 1. 制备 2 - [5 - (5 - 氯 - 3 - 甲基 - 苯并[b]噻吩 - 2 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - N,N - 二乙基 - 2 - 氧代乙酰胺。

把 155 mg (0.60 mmol) 2 - (5 - 氨基 - 1H - 吲哚 - 3 - 基) - N,N - 二乙基 - 2 - 氧代乙酰胺和 116 mg N - 二异丙基乙胺溶解在 2 ml 二甲基甲酰胺中, 并缓慢加入 185.5 mg (0.66 mmol) 5 - 氯 - 3 - 甲基苯并[b]噻吩 - 2 - 磺酰氯。将该反应混合物在室温(大约 20℃)搅拌 3 小时, 并在真空中除去溶剂。将该残余物用 NaHCO₃ 水溶液处理, 并用氯仿萃取。把合并的有机相随后用水和 NaHCO₃ 水溶液洗涤, 并用 Na₂SO₄ 干燥。除去溶剂后, 获得固体残余物, 将其通过惯用柱色谱法纯化, 获得 121 mg (理论产率 40 %) 固体形式的所需产物。

实施例 2. 制备 N,N - 二乙基 - 2 - [5 - (萘 - 2 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - 2 - 氧代 - 乙酰胺。

本反应是按照实施例 1 中给定的方法进行。由 155 mg (0.60 mmol) 2 - (5 - 氨基 - 1H - 吲哚 - 3 - 基) - N,N - 二乙基 - 2 - 氧代乙酰胺和 149.5 mg (0.66 mmol) 萘 - 2 - 磺酰氯开始, 获得 138 mg (理论产率 51 %) 固体形式的所需产物。

实施例 3. 制备 N,N - 二乙基 - 2 - [5 - (萘 - 1 - 磺酰基氨基) - 1H - 吲哚 - 3 - 基] - 2 - 氧代 - 乙酰胺。

本反应是按照实施例1中给定的方法进行的。由155 mg (0.60 mmol) 2-(5-氨基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二乙基-2-氧代乙酰胺和149,5 mg (0.66 mmol) 萘-1-磺酰氯开始, 获得120 mg (理论产率49%) 固体形式的所需产物。

实施例4. 制备2-[5-(联苯-4-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-N,N-二乙基-2-氧代-乙酰胺。

本反应是按照实施例1中给定的方法进行的。由155 mg (0.60 mmol) 2-(5-氨基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二乙基-2-氧代乙酰胺和167 mg (0.66 mmol) 苯基-苯-4-磺酰氯开始, 获得126 mg (理论产率46%) 固体形式的所需产物。

实施例5. 制备N,N-二乙基-2-氧代-2-[5-(喹啉-8-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-乙酰胺。

本反应是按照实施例1中给定的方法进行的。由155 mg (0.60 mmol) 2-(5-氨基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二乙基-2-氧代乙酰胺和168 mg (0.66 mmol) 喹啉-8-磺酰氯开始, 获得72 mg (理论产率26%) 固体形式的所需产物。

实施例6. 制备N,N-二甲基-2-[5-(萘-2-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺。

本反应是按照实施例1中给定的方法进行的。由138 mg (0.60 mmol) 2-(5-氨基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺和149,5 mg (0.66 mmol) 萘-2-磺酰氯开始, 获得100 mg (理论产率40%) 固体形式的所需产物。

实施例7. 制备N,N-二甲基-2-[5-(萘-1-磺酰基氨基)-1H-吡啶-3-基]-2-氧代-乙酰胺。

本反应是按照实施例1中给定的方法进行的。由138 mg (0.60 mmol) 2-(5-氨基-1H-吡啶-3-基)-N,N-二甲基-2-氧代乙酰胺和149,5 mg (0.66 mmol) 萘-1-磺酰氯开始, 获得71 mg (理论产率28%) 固体形式的所需产物。

实施例 8. 制备 2 - [5 - (5 - 氯 - 3 - 甲基 - 苯并[b]噻吩 - 2 - 磺酰基 - 氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基] - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代 - 乙酰胺。

本反应是按照实施例 1 中给定的方法进行的。由 138 mg (0.60 mmol) 2 - (5 - 氨基 - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代乙酰胺和 185 mg (0.66 mmol) 5 - 氯 - 3 - 甲基 - 苯并[b]噻吩 - 2 - 磺酰氯开始, 获得 120 mg (理论产率 42 %) 固体形式的所需产物。

实施例 9. 制备 2 - [5 - (6 - 氯 - 咪唑并[2,1-b]噻唑 - 5 - 磺酰基氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基] - N,N - 二乙基 - 2 - 氧代 - 乙酰胺。

本反应是按照实施例 1 中给定的方法进行的。由 155 mg (0.60 mmol) 2 - (5 - 氨基 - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - N,N - 二乙基 - 2 - 氧代乙酰胺和 170 mg (0.66 mmol) 6 - 氯 - 咪唑并[2,1-b]噻唑 - 5 - 磺酰氯开始, 获得 71 mg (理论产率 25 %) 固体形式的所需产物。

实施例 10. 制备 2 - [5 - (6 - 氯 - 咪唑并[2,1-b]噻唑 - 5 - 磺酰基氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基] - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代 - 乙酰胺。

本反应是按照实施例 1 中给定的方法进行的。由 138 mg (0.60 mmol) 2 - (5 - 氨基 - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代乙酰胺和 170 mg (0.66 mmol) 6 - 氯 - 咪唑并[2,1-b]噻唑 - 5 - 磺酰氯开始, 获得 35 mg (理论产率 13 %) 固体形式的所需产物。

没有做提高化合物的产率的尝试。

照此制备了实施例 11 - 34 的化合物。本领域的技术人员将会认识到使用何种起始材料来获得相应的化合物。

实施例 11:

N,N - 二甲基 - 2 - [4 - (萘 - 1 - 磺酰基氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基] - 2 - 氧代 - 乙酰胺。

实施例 12:

2 - [4 - (5 - 氯 - 3 - 甲基 - 苯并[b]噻吩 - 2 - 磺酰基氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基] - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代 - 乙酰胺。

实施例 13:

2 - [4 - (6 - 氯 - 咪唑并[2,1 - b]噻唑 - 5 - 磺酰基氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基] - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代 - 乙酰胺。

实施例 14:

N,N - 二甲基 - 2 - [5 - [(4 - 氟 - 3 - 甲基 - 苯基) - 1 - 磺酰基氨基] - 1H - 吡啶 - 3 - 基] - 2 - 氧代 - 乙酰胺。

实施例 15:

5 - (3 - 二甲基氨基草酰基 - 1H - 吡啶 - 5 - 基氨基磺酰基) - 3 - 甲基 - 苯并呋喃 - 2 - 甲酸乙酯。

实施例 16:

2 - [5 - (联苯 - 4 - 磺酰基氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基] - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代 - 乙酰胺。

实施例 17:

N,N - 二甲基 - 2 - 氧代 - 2 - [5 - (2 - 氧代 - 2,3 - 二氢 - 苯并噻唑 - 6 - 磺酰基氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基] - 乙酰胺。

实施例 18:

N,N - 二甲基 - 2 - 氧代 - 2 - [5 - (2 - 氧代 - 2,3 - 二氢苯并[d]噻唑 - 6 - 亚磺酰氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基]乙酰胺。

实施例 19:

2 - [5 - [(4 - 环己基 - 苯基) - 1 - 磺酰基氨基] - 1H - 吡啶 - 3 - 基] - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代 - 乙酰胺。

实施例 20:

N,N - 二甲基 - 2 - [5 - [(4 - 苯氧基 - 苯基) - 1 - 磺酰基氨基] - 1H - 吡啶 - 3 - 基] - 2 - 氧代 - 乙酰胺。

实施例 21:

2 - (5 - (5 - 氯 - 3 - 甲基苯并[b]噻吩 - 2 - 亚磺酰氨基) - 2 - 甲基 - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代乙酰胺

实施例 22:

2 - (5 - (6 - 氯咪唑并[2,1-b]噻唑 - 5 - 亚磺酰氨基) - 2 - 甲基 - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代乙酰胺。

实施例 23:

2 - (6 - (5 - 氯 - 3 - 甲基苯并[b]噻吩 - 2 - 亚磺酰氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代乙酰胺。

实施例 24:

N,N - 二甲基 - 2 - (6 - (萘 - 3 - 亚磺酰氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - 2 - 氧代乙酰胺。

实施例 25:

2 - (6 - (联苯 - 4 - 亚磺酰氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代乙酰胺。

实施例 26:

N,N - 二甲基 - 2 - (6 - (萘 - 1 - 亚磺酰氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - 2 - 氧代乙酰胺。

实施例 27:

N,N - 二甲基 - 2 - (6 - (2 - (萘 - 1 - 基)乙基亚磺酰氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - 2 - 氧代乙酰胺。

实施例 28:

N,N - 二甲基 - 2 - 氧代 - 2 - (6 - (4 - 苯氧基苯基亚磺酰氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基)乙酰胺。

实施例 29:

2 - (6 - (3,4 - 二氯噻吩 - 2 - 亚磺酰氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代乙酰胺。

实施例 30:

2 - (6 - (3,5 - 二氯苯基亚磺酰氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代乙酰胺。

实施例 31:

2 - (6 - (1 - 氯萘 - 6 - 亚磺酰氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代乙酰胺。

实施例 32:

2 - (6 - (6 - 氯咪唑并[2,1-b]噻唑 - 5 - 亚磺酰氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - N,N - 二甲基 - 2 - 氧代乙酰胺。

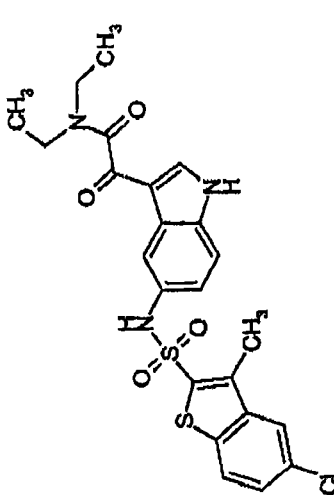
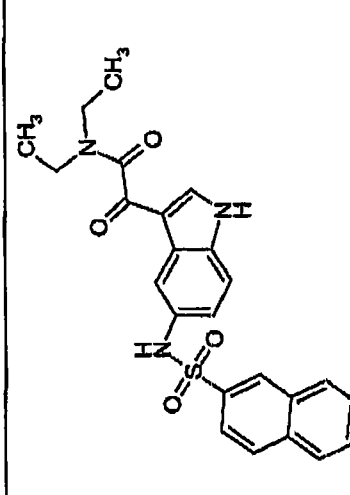
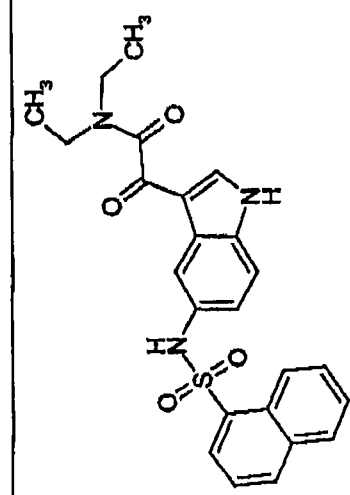
实施例 33:

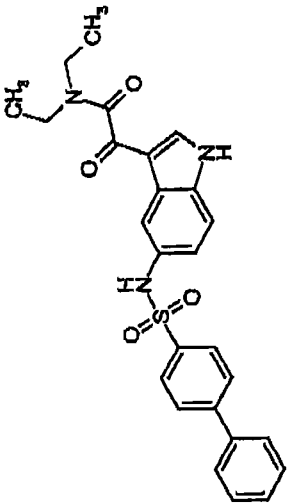
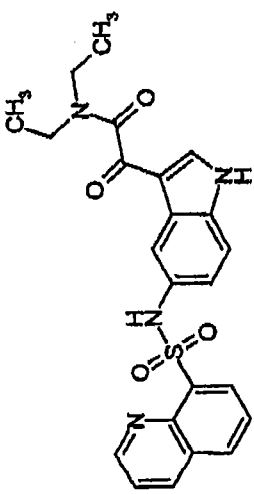
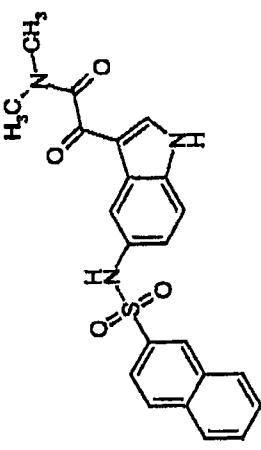
N,N - 二乙基 - 2 - (2 - 甲基 - 5 - (5 - 甲基 - 1 - 苯基 - 1H - 吡唑 - 4 - 亚磺酰氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - 2 - 氧代乙酰胺。

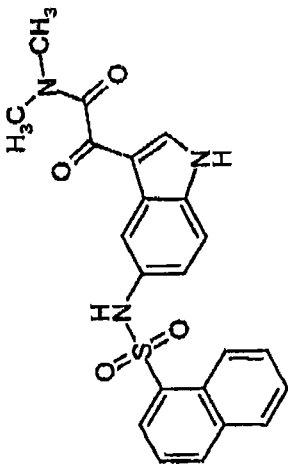
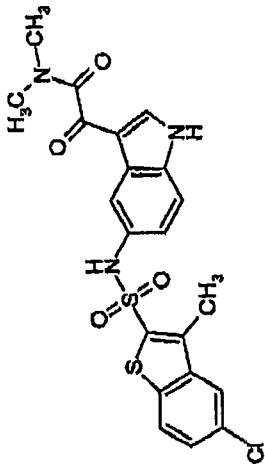
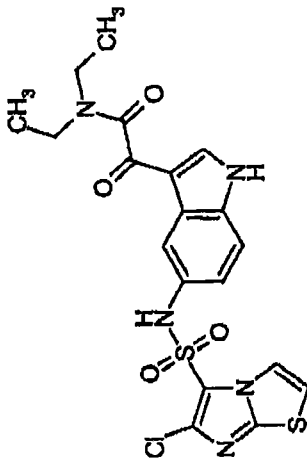
实施例 34:

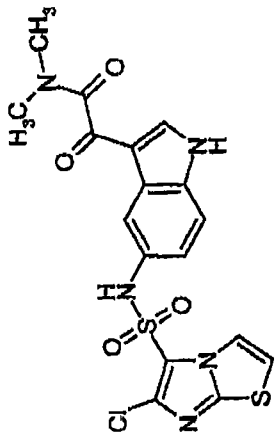
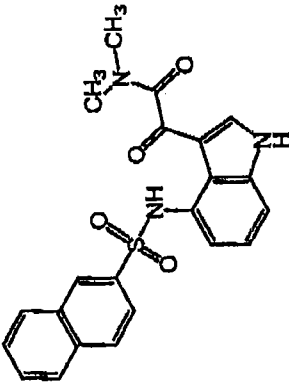
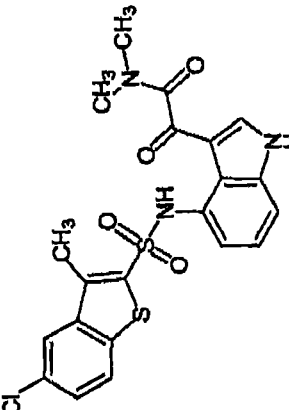
N,N - 二乙基 - 2 - (2 - 甲基 - 5 - (1,3,5 - 三甲基 - 1H - 吡唑 - 4 - 亚磺酰氨基) - 1H - 吡啶 - 3 - 基) - 2 - 氧代乙酰胺。

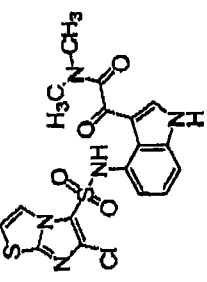
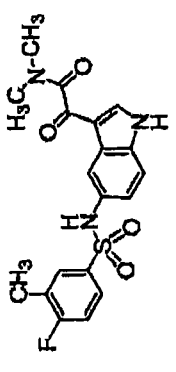
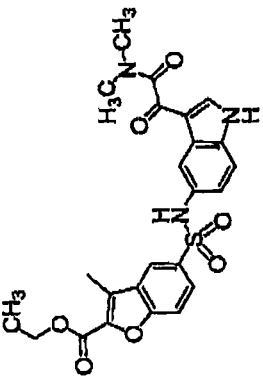
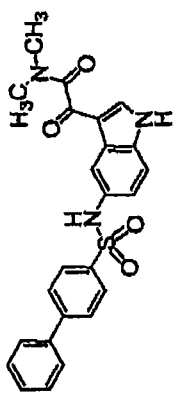
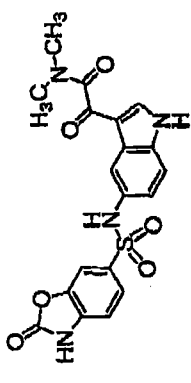
实施例 1 - 34 的化合物的熔点和 ^1H - NMR 数据提供于下面的表格中:

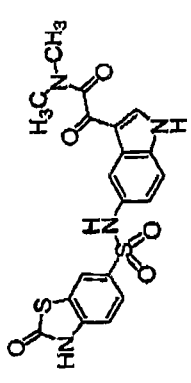
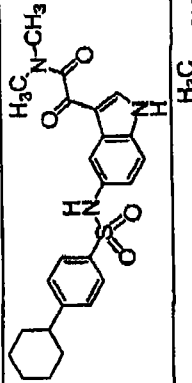
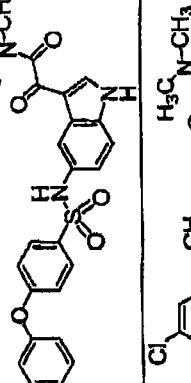
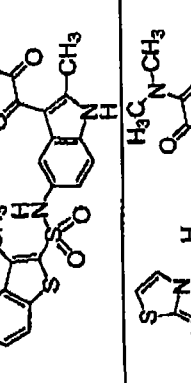
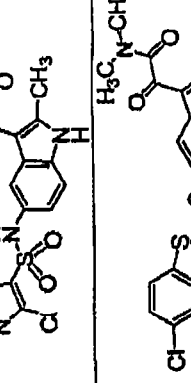
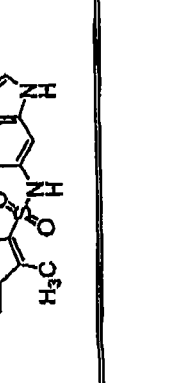
实施例	化合物	mp °C	¹ H-NMR (300 MHz), δ (溶剂)
1		220-222	0,98(t, 3H, J=7,0 Hz); 1,12 (t, 3H, J=7,0 Hz); 2,39(s, 3H); 3,11(m, 2H); 3,38(m, 2H); 7,06(dd, 1H, J=8,6 Hz, J'=2,1 Hz); 7,39(d, 1H, J=8,4 Hz); 7,50(dd, 1H, J=8,8 Hz, J'=2,0 Hz); 7,84(s, 1H); 7,94(d, 1H, J=1,8 Hz); 8,00(m, 2H); 10,51(s, 1H); 12,24(s, 1H). (DMSO-d6)
2		224-226	0,97(t, 3H, J=6,9 Hz); 1,12 (t, 3H, J=6,9 Hz); 3,12(m, 2H); 3,37(m, 2H); 7,04(dd, 1H, J=8,9 Hz, J'=1,8 Hz); 7,33(d, 1H, J=8,6 Hz); 7,53-7,68(m, 2H); 7,75(d, 1H, J=8,4 Hz); 7,85(s, 1H); 7,95(m, 2H); 8,04(m, 2H); 8,34(s, 1H); 10,21(s, 1H); 12,17(s, 1H). (DMSO-d6)
3		275-277	0,99(t, 3H, J=7,0 Hz); 1,12 (t, 3H, J=7,0 Hz); 3,14(m, 2H); 3,36(m, 2H); 6,94(dd, 1H, J=8,6 Hz, J'=2,0 Hz); 7,27(d, 1H, J=9,0 Hz); 7,54(t, 1H, J=7,7 Hz); 7,63(m, 1H); 7,70(m, 2H); 7,92(s, 1H); 8,03(d, 1H, J=7,3 Hz); 8,13(m, 2H); 8,76(d, 1H, J=8,8 Hz); 10,49(s, 1H); 12,14(s, 1H). (DMSO-d6)

实施例	化合物	mp °C	¹ H-NMR (300 MHz), δ (溶剂)
4		138-140	0,99(t, 3H, J=7,0 Hz); 1,14 (t, 3H, J=7,1 Hz); 3,15(q, 2H, J=7,2 Hz); 3,39(q, 2H, J=7,0 Hz); 7,09(d, 1H, J=8,6 Hz); 7,38-7,48(m, 4H); 7,66(m, 2H, J=6,8 Hz); 7,77(AB sys, 2H, J=8,8 Hz); 7,80(AB sys, 2H, J=8,8 Hz); 7,86 (m, 1H); 7,98(s, 1H); 10,15(s, 1H); 12,22(s, 1H). (DMSO-d6)
5		227-232	0,99(t, 3H, J=6,9 Hz); 1,13 (t, 3H, J=6,9 Hz); 3,13(m, 2H); 3,36(m, 2H); 6,92(dd, 1H, J=8,8 Hz, J'=1,8 Hz); 7,21(d, 1H, J=8,6 Hz); 7,63(t, 1H, J=7,6 Hz); 7,72(m, 2H); 7,88(s, 1H); 8,23(m, 2H); 8,49(d, 1H, J=7,4 Hz); 9,18(dd, 1H, J=7,4 Hz, J'=1,4 Hz); 9,9(s, 1H); 12,10(s, 1H). (DMSO-d6)
6		168-172	2,79(s, 3H); 2,93(s, 3H); 7,04(d, 1H, J=9,0 Hz); 7,32(d, 1H, J=8,5 Hz); 7,55-7,68(m, 2H); 7,75(d, 1H, J=8,3 Hz); 7,84(s, 1H); 7,95(d, 1H, J=8,0 Hz); 8,03(m, 3H); 8,34(s, 1H); 10,22(b, 1H); 12,22(b, 1H). (DMSO-d6)

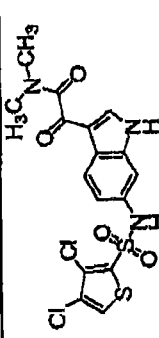
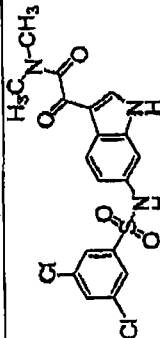
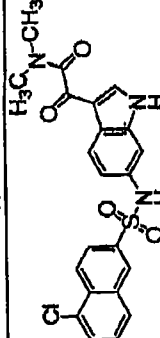
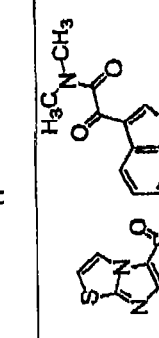
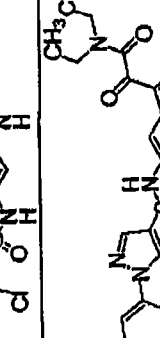
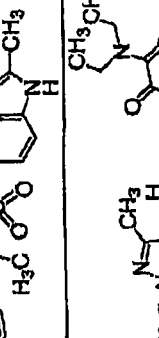
实施例	化合物	mp °C	¹ H-NMR (300 MHz), δ (溶剂)
7		230-232	2,80(s, 3H); 2,91(s, 3H); 6,94(dd, 1H, J=8,8 Hz, J'=2,0 Hz); 7,27(d, 1H, J=8,8 Hz); 7,53(m, 1H); 7,63(m, 1H); 7,71(m, 2H); 7,99(s, 1H); 8,02(d, 1H, J=7,9 Hz); 8,13(m, 2H); 8,76(d, 1H, J=8,6 Hz); 10,49(s, 1H); 12,19(s, 1H); (DMSO-d6)
8		272	2,40(s, 3H); 2,80(s, 3H); 2,93(s, 3H); 7,06(dd, 1H, J=8,7 Hz, J'=1,9 Hz); 7,39(d, 1H, J=8,8 Hz); 7,50(dd, 1H, J=8,8 Hz, J=2,0 Hz); 7,85(s, 1H); 7,94(d, 1H, J=1,7 Hz); 8,00(d, 1H, J=8,5 Hz); 8,05(d, 1H, J=3,1 Hz); 10,53(s, 1H); 12,30(s, 1H); (DMSO-d6)
9		249-251	1,02(t, 3H, J=7,0 Hz); 1,14 (t, 3H, J=7,0 Hz); 3,17(m, 2H); 3,39(m, 2H); 7,02(dd, 1H, J=8,8 Hz, J'=2,0 Hz); 7,39(d, 1H, J=8,8 Hz); 7,56(d, 1H, J=4,4 Hz); 7,79(d, 1H, J=1,6 Hz); 7,87(d, 1H, J=4,4 Hz); 7,99(d, 1H, J=2,5 Hz); 10,67(s, 1H); 12,24(s, 1H); (DMSO-d6)

实施例	化合物	mp °C	¹ H-NMR (300 MHz), δ (溶剂)
10		161-164	2,84(s, 3H); 2,94(s, 3H); 7,02(d, 1H, J=7,6 Hz); 7,39(d, 1H, J=8,5 Hz); 7,56(d, 1H, J=4,4 Hz); 7,79(s, 1H); 7,88(d, 1H, J=4,4 Hz); 8,06(s, 1H); 10,68(s, 1H); 12,29(s, 1H). (DMSO-d6)
11		69-72	2,93(s, 3H); 3,05(s, 3H); 6,41(s, 2H); 6,46(m, 1H); 7,08(m, 2H); 7,73(m, 2H); 7,93(d, 1H, J=8,7 Hz); 8,02(d, 1H, J=7,7 Hz); 8,15(d, 1H, J=8,7 Hz); 8,26(d, 1H, J=7,7 Hz); 8,35(s, 1H); 9,00(s, 1H). (DMSO-d6)
12		199-207	2,62(s, 3H); 2,94(s, 3H); 3,03(s, 3H); 6,45(b, 2H); 6,51(d, 1H, J=8,0 Hz); 6,98(d, 1H, J=8,2 Hz); 7,11(t, 1H, J=8,1 Hz); 7,65(dd, 1H, J=8,8 Hz, J'=1,7 Hz); 8,11(d, 1H, J=1,7 Hz); 8,16(d, 1H, J=8,8 Hz); 8,32(s, 1H). (DMSO-d6)

实施例	化合物	mp °C	¹ H-NMR (300 MHz), δ (溶剂)
13		278	2.83(s, 3H); 2.97(s, 3H); 7.21(m, 3H); 7.58(d, 1H, J=3.0 Hz); 7.92(d, 1H, J=3.0 Hz); 8.21(s, 1H); 12.15(b, 1H); 12.79(b, 1H). (DMSO-d6)
14		127-133	2.20(s, 3H); 2.85(s, 3H); 2.95(s, 3H); 7.02(m, 1H); 7.27(m, 1H); 7.37(m, 1H); 7.53(m, 1H); 7.66(m, 1H); 7.80(m, 1H); 8.04(m, 1H); 10.07(s, 1H); 12.27(s, 1H). (DMSO-d6)
15		215-218	1.30(t, 3H, J=7.0 Hz); 2.5(s, 3H); 2.82(s, 3H); 2.94(s, 3H); 4.32(q, 2H, J=7.0 Hz); 7.03(m, 1H); 7.34(m, 1H); 7.82(m, 3H); 8.02(m, 1H); 8.16(s, 1H); 10.15(s, 1H); 12.24(s, 1H). (DMSO-d6)
16		247-250	2.82(s, 3H); 2.94(s, 3H); 7.09(m, 1H); 7.36-7.47(m, 4H); 7.65(m, 2H); 7.78(m, 4H); 7.83(m, 1H); 8.03(m, 1H); 10.16(s, 1H); 12.26(s, 1H). (DMSO-d6)
17		>280	2.84(s, 3H); 2.95(s, 3H); 7.04(m, 1H); 7.14(d, 1H, J=8.2 Hz); 7.36(d, 1H, J=8.7 Hz); 7.48(d, 1H, J=8.2 Hz); 7.54(s, 1H); 7.78(s, 1H); 8.03(m, 1H); 10.04(s, 1H); 12.26(s, 1H). (DMSO-d6)

实施例	化合物	mp °C	¹ H-NMR (300 MHz), δ (溶剂)
18		202-205	2,84(s, 3H); 2,95(s, 3H); 7,03(m, 1H); 7,16(d, 1H, J=8,5 Hz); 7,36(d, 1H, J=8,6 Hz); 7,58(dd, 1H, J=8,5 Hz, J'=1,3 Hz); 7,78(s, 1H); 7,95(d, 1H, J=1,3 Hz); 8,03(m, 1H); 10,04(s, 1H); 12,26(s, 1H). (DMSO-d6)
19		219-222	1,30(m, 6H); 1,69(m, 4H); 2,84(s, 3H); 2,95(s, 3H); 7,05(d, 1H, J=8,7 Hz); 7,34(m, 3H); 7,60(d, 2H, J=8,0 Hz); 7,80(s, 1H); 8,03(s, 1H); 10,04(s, 1H); 12,25(s, 1H). (DMSO-d6)
20		149-151	2,85(s, 3H); 2,95(s, 3H); 6,98-7,07(m, 5H); 7,20(t, 1H, J=7,3 Hz); 7,39(m, 3H); 7,66(d, 2H, J=8,6 Hz); 7,77(s, 1H); 8,04(m, 1H); 10,01(s, 1H); 12,26(s, 1H). (DMSO-d6)
21			2,36(s, 3H); 2,48(s, 3H); 2,71(s, 3H); 2,90(s, 3H); 6,95(d, 1H, J=8,0 Hz); 7,26(d, 1H, J=8,3 Hz); 7,52(m, 2H); 7,93(s, 1H); 7,99(d, 1H, J=8,5 Hz); 10,42(s, 1H); 12,22(s, 1H). (DMSO-d6)
22			2,48(s, 3H); 2,79(s, 3H); 2,93(s, 3H); 6,93(d, 1H, J=7,0 Hz); 7,27(d, 1H, J=8,6 Hz); 7,54(m, 2H); 7,85(d, 1H, J=4,4 Hz); 10,60(s, 1H); 12,22(s, 1H). (DMSO-d6)
23		>280	2,45(s, 3H); 2,85(s, 3H); 2,93(s, 3H); 7,01(dd, 1H, J=8,6 Hz, J'=1,9 Hz); 7,33(d, 1H, J=1,6 Hz); 7,51(dd, 1H, J=8,6 Hz, J'=1,9 Hz); 7,89(d, 1H, J=8,6 Hz); 7,95-8,03(m, 3H); 10,70(s, 1H); 12,18(s, 1H). (DMSO-d6)

实施例	化合物	mp °C	¹ H-NMR (300 MHz), δ (溶剂)
24		278	2,82(s, 3H); 2,92(s, 3H); 7,00(dd, 1H, J=8,6 Hz, J'=1,9 Hz); 7,30(d, 1H, J=1,6 Hz); 7,62(m, 2H); 7,74(dd, 1H, J=8,8 Hz, J'=1,7 Hz); 7,85(d, 1H, J=8,5 Hz); 7,94-8,08(m, 4H); 8,37(s, 1H); 10,37(s, 1H); 12,11(s, 1H). (DMSO-d6)
25		>280	2,85(s, 3H); 2,94(s, 3H); 7,03(m, 1H); 7,34-7,46(m, 4H); 7,65(m, 2H); 7,80(m, 4H); 7,91(m, 1H); 8,02(s, 1H); 10,31(s, 1H); 12,15(s, 1H). (DMSO-d6)
26		256-258	2,81(s, 3H); 2,91(s, 3H); 6,92(dd, 1H, J=8,6 Hz, J'=1,8 Hz); 7,19(d, 1H, J=1,6 Hz); 7,55(m, 1H); 7,64(m, 1H); 7,65(m, 1H); 7,70-7,80(m, 2H); 7,95(s, 1H); 8,03(d, 1H, J=7,6 Hz); 8,14(m, 2H); 8,76(d, 1H, J=8,5 Hz); 10,66(s, 1H); 12,04(s, 1H). (DMSO-d6)
27		237-238	2,90(s, 3H); 2,97(s, 3H); 3,40(s, 4H); 7,23(m, 2H); 7,38(m, 3H); 7,55(m, 2H); 7,76(m, 1H); 7,86(d, 1H, J=8,0 Hz); 8,04(d, 1H, J=8,6 Hz); 8,08(s, 1H); 10,07(b, 1H); 12,23(b, 1H). (DMSO-d6)
28		264	2,86(s, 3H); 2,94(s, 3H); 6,95-7,08(m, 5H); 7,21(t, 1H, J=7,3 Hz); 7,29(d, 1H, J=1,5 Hz); 7,41(m, 2H); 7,69(d, 2H, J=8,9 Hz); 7,88(d, 1H, J=8,5 Hz); 8,02(m, 1H); 10,20(s, 1H); 12,16(s, 1H). (DMSO-d6)

实施例	化合物	mp °C	¹ H-NMR (300 MHz), δ (溶剂)
29		250	2.88(s, 3H); 2.96(s, 3H); 7.03(dd, 1H, J=8.5 Hz, J'=1.6 Hz); 7.34(d, 1H, J=1.3 Hz); 7.58(m, 1H); 7.98(d, 2H, J=8.5 Hz); 8.09(d, 1H, J=3.1 Hz); 10.68(s, 1H); 12.23(s, 1H). (DMSO-d6)
30		>280	2.86(s, 3H); 2.95(s, 3H); 6.98(dd, 1H, J=8.5 Hz, J'=1.4 Hz); 7.28(s, 1H); 7.67(m, 2H); 7.93(m, 2H); 8.06(d, 1H, J=2.8 Hz); 10.47(b, 1H); 12.18(s, 1H). (DMSO-d6)
31		>280	2.82(s, 3H); 2.92(s, 3H); 7.00(dd, 1H, J=8.5 Hz, J'=1.6 Hz); 7.27(d, 1H, J=1.5 Hz); 7.60(m, 1H); 7.82-7.94(m, 1H); 7.99(s, 1H); 8.10(d, 1H, J=8.2 Hz); 8.30(d, 1H, J=9.1 Hz); 8.45(d, 1H, J=1.3 Hz); 10.44(b, 1H); 12.11(s, 1H). (DMSO-d6)
32		240	2.85(s, 3H); 2.94(s, 3H); 6.96(dd, 1H, J=8.5 Hz, J'=1.6 Hz); 7.27(d, 1H, J=1.5 Hz); 7.59(d, 1H, J=4.5 Hz); 7.92(m, 2H); 8.04(d, 1H, J=3.1 Hz); 10.86(b, 1H); 12.22(s, 1H). (DMSO-d6)
33		177-179	1.00(t, 3H, J=7.0 Hz); 1.15(t, 3H); 2.17(s, 3H); 3.18(m, 2H); 3.40(m, 2H); 7.10(dd, 1H, J=8.6 Hz, J'=2.0 Hz); 7.37-7.51(m, 6H); 7.81(m, 2H); 8.00(s, 1H); 10.00(b, 1H); 12.20(b, 1H). (DMSO-d6)
34		224-227	1.03(t, 3H, J=7.0 Hz); 1.14(t, 3H, J=7.0 Hz); 2.13(s, 3H); 2.26(s, 3H); 3.18(q, 2H, J=7.0 Hz); 3.39(q, 2H, J=7.0 Hz); 3.55(s, 3H); 7.00(dd, 1H, J=8.7 Hz, J'=2.1 Hz); 7.37(d, 1H, J=8.6 Hz); 7.82(d, 1H, 1.6 Hz); 7.96(s, 1H); 9.87(b, 1H); 12.19(b, 1H). (DMSO-d6)

包含取代了的吲哚化合物的片剂。

每个片剂的配方:

实施例 1 的化合物	5 mg
乳糖	60 mg
结晶纤维素	25 mg
K 90 Povidone	5 mg
(聚乙烯吡咯烷酮)	
预胶化淀粉	3 mg
胶态二氧化硅	1 mg
硬脂酸镁	1 mg
每个片剂的总重量	100 mg

药理学数据:

取代了的吲哚化合物与 5-HT₆ 受体的结合是如上面所述测定的。

这些化合物中的某些化合物的结合结果提供在下面表格中:

化合物 实施例 No:	K _i (nM)
9	224
10	18.4
13	161.3
20	113.1
22	52.8