



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本

(11)證書號數：TW I478922 B

(45)公告日：中華民國 104 (2015) 年 04 月 01 日

(21)申請案號：098141713

(22)申請日：中華民國 98 (2009) 年 12 月 07 日

(51)Int. Cl.：

*C07D487/04 (2006.01)**A61K31/4985 (2006.01)**A61P37/00 (2006.01)**A61P29/00 (2006.01)**A61P37/08 (2006.01)**A61P19/02 (2006.01)**A61P35/00 (2006.01)*

(30)優先權：2008/12/08 美國

61/120,587

2008/12/23 美國

61/140,514

2009/09/09 美國

61/240,979

(71)申請人：吉李德康乃狄克公司 (美國) GILEAD CONNENTICUT, INC. (US)

美國

(72)發明人：米特歇爾 史考特 MITCHELL, SCOTT A. (US)；柯里 凱文 CURRIE, KEVIN S.

(GB)；布朗格恩 彼得 BLOMGREN, PETER A. (US)；柯洛夫 傑弗瑞 KROPF,

JEFFREY E. (US)；李承勳 LEE, SEUNG HOON (US)；許建軍 XU, JIANJUN

(CN)；史坦佛德 道格拉斯 STAFFORD, DOUGLAS GREGORY (US)；哈迪 詹

姆士 HARDING, JAMES P. (US)；小巴布薩 安東尼歐 BARBOSA, JR. ANTONIO

J. (US)；趙仲冬 ZHAO ZHONGDONG (CA)；艾米斯泰 大衛 ARMISTEAD

DAVID M. (US)

(74)代理人：林志剛

(56)參考文獻：

US 2006/183746A1

WO 02/060492A1

WO 2005/085252

WO 2009/102468A1

審查人員：李淑禎

申請專利範圍項數：23 項 圖式數：0 共 309 頁

(54)名稱

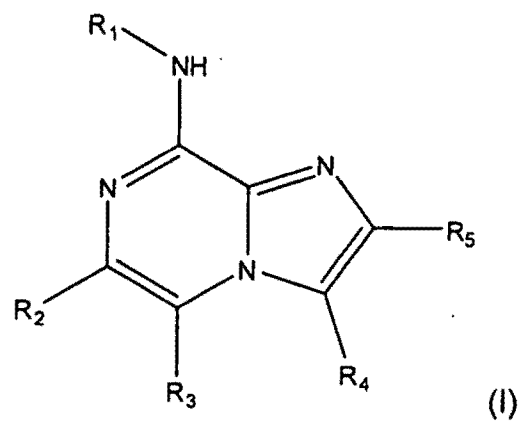
作為脾臟酪胺酸激酶 (Syk) 抑制劑之咪唑並吡嗪化合物

IMIDAZOPYRAZINE SYK INHIBITORS

(57)摘要

本發明提供某些咪唑並吡嗪類及彼等之醫藥組成物。本發明提供治療罹患對抑制 Syk 活性有反應的某些疾病和病症的病患之方法，該方法包含對該病患給予至少一種化學實體，該至少一種化學實體之給予量為能有效減緩該疾病或病症之症狀或徵候者。本發明亦提供測定樣品中存在或不存在 Syk 激酶之方法。

Certain imidazopyrazines and pharmaceutical compositions thereof are provided herein. Methods of treating patients suffering from certain diseases and disorders responsive to the inhibition of Syk activity, which comprises administering to such patients an amount of at least one chemical entity effective to reduce signs or symptoms of the disease or disorder are provided. Also provided are methods for determining the presence or absence of Syk kinase in a sample.



發明專利說明書

(本申請書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：98141713

※申請日：98年12月07日

※IPC分類：

一、發明名稱：(中文／英文)

作為脾臟酪胺酸激酶 (Syk) 抑制劑之咪唑並吡啶化合物

Imidazopyrazine Syk inhibitors

二、中文發明摘要：

本發明提供某些咪唑並吡啶類及彼等之醫藥組成物。

本發明提供治療罹患對抑制 Syk 活性有反應的某些疾病和病症的病患之方法，該方法包含對該病患給予至少一種化學實體，該至少一種化學實體之給予量為能有效減緩該疾病或病症之症狀或徵候者。本發明亦提供測定樣品中存在或不存在 Syk 激酶之方法。

C07D 487/04

A61K 31/4985

A61P 37/00 (2006.01)

A61P 29/00 (2006.01)

A61P 37/08 (2006.01)

A61P 19/02 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

三、英文發明摘要：

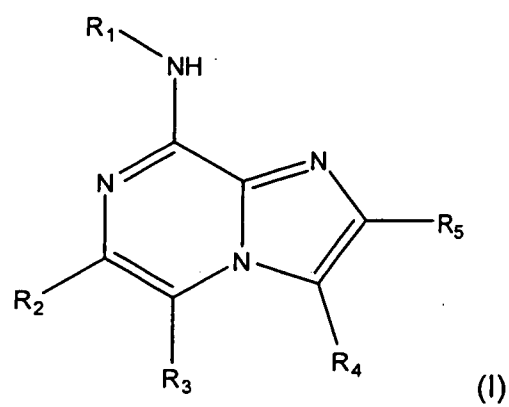
Certain imidazopyrazines and pharmaceutical compositions thereof are provided herein. Methods of treating patients suffering from certain diseases and disorders responsive to the inhibition of Syk activity, which comprises administering to such patients an amount of at least one chemical entity effective to reduce signs or symptoms of the disease or disorder are provided. Also provided are methods for determining the presence or absence of Syk kinase in a sample.

四、指定代表圖：

(一)、本案指定代表圖為：無

(二)、本代表圖之元件符號簡單說明：無

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：式 I



六、發明說明：

本申請案請求美國專利臨時申請案號 61/120,587 (2008 年 12 月 8 日申請) 、 61/140,514 (2008 年 12 月 23 日申請) 及 61/240,979 (2009 年 9 月 9 日申請) 之權益，該等臨時申請案之內容係併入本文作為參考。

【發明所屬之技術領域】

本發明提供某些咪唑並吡嗪類、組成物、製造彼等之方法及用途。

【先前技術】

蛋白質激酶係人體酶之最大家族且包含超過 500 種蛋白質。脾臟酪胺酸激酶 (Syk) 係酪胺酸激酶的 Syk 家族之一員且係早期 B 細胞發育及成熟 B 細胞之活化、傳訊及存活的調節者。

Syk 係屬非受體性酪胺酸激酶，其係於各種不同之細胞類型 (其包括 B 細胞、巨噬細胞、單核細胞、肥大細胞、嗜伊紅白血球、嗜鹼白血球、嗜中性白血球、樹突細胞、T 細胞、天然殺手細胞、血小板及破骨細胞) 的經免疫受體媒介和經整合蛋白媒介之傳訊上扮演關鍵性角色。此處所描述之免疫受體包括典型之免疫受體和似免疫受體分子。典型之免疫受體包括 B 細胞抗原受體和 T 細胞抗原受體以及各種不同之免疫球蛋白受體 (Fc 受體) 。似免疫受體分子係於結構上與免疫受體相關或參與相似之訊號

轉導途徑且係主要涉及非適應性免疫功能（其包括嗜中性白血球活化、天然殺手細胞辨識及破骨細胞活性）。整合蛋白係細胞表面受體，其於控制白血球黏附和活化天然和適應性免疫上扮演主要角色。

配體結合導致免疫受體和整合蛋白之活化，該活化致使 Src 家族激酶被活化且致使於與受體有關之跨膜連接子蛋白的細胞質面上之免疫受體的以酪胺酸為底質之活化模體（ITAMs）的磷酸化。Syk 結合該連接子之經磷酸化的 ITAM 模體，其導致 Syk 活化及隨後下端傳訊途徑之磷酸化和活化。

Syk 對 B 細胞經由 B 細胞受體（BCR）傳訊之活化係必要的。Syk 與磷酸化之 BCR 結合而被活化並因此起始在 BCR 活化後之早期傳訊。經由 BCR 之 B 細胞傳訊可導致廣泛之生物輸出，該生物輸出取決於 B 細胞之發育階段。BCR 訊號之大小和期間必須被嚴密地調控。異常之 BCR 媒介的傳訊可引起未受調控之 B 細胞活化及／或形成導致多重自體免疫疾病及／或發炎疾病之致病性自體抗體。缺乏 Syk 之小鼠顯現 B 細胞之成熟受到損害、減少之免疫球蛋白產生、減損之與 T 細胞無關之免疫反應及經 BCR 刺激之持續性鈣訊號的顯著減緩。

大量證據支持 B 細胞和體液免疫系統於自體免疫疾病及／或發炎疾病之致病性上的角色。經開發以耗盡 B 細胞之以蛋白質為底質的治療劑（諸如單株抗體 Rituxan）代表一種治療許多自體免疫疾病和發炎疾病之方法。已知自

體抗體及彼等所生成之免疫複合物於自體免疫疾病及／或發炎疾病上扮演致病性角色。對此等抗體之致病性反應係取決於經由 Fc 受體 (FcR) 之傳訊，該傳訊進而係取決於 Syk。基於 Syk 於 B 細胞活化及取決於 FcR 之傳訊上的角色，Syk 之抑制劑可作為 B 細胞媒介之致病性活性（其包括自體抗體之產製）的抑制劑。因此，透過 Syk 對自體抗體之產製上的作用，提出抑制細胞內 Syk 之酶催化活性以治療自體免疫疾病。

Syk 於 FC ϵ RI 媒介之肥大細胞去顆粒化及嗜伊紅白血球活化上亦扮演主要角色。因此，Syk 涉及過敏性疾病（其包括氣喘）。Syk 經由其 SH2 結構區與 FC ϵ RI 之磷酸化 γ 鏈結合且對下端傳訊係必要的。缺乏 Syk 之肥大細胞證實缺陷型去顆粒化及花生四烯酸和細胞因子之分泌。抑制肥大細胞之 Syk 活性的藥理作用劑亦顯示相同之結果。於氣喘之動物模式中，利用 Syk 反義寡核苷酸所進行之治療抑制嗜伊紅白血球和嗜中性白血球由抗原所引起之浸潤。缺乏 Syk 之嗜伊紅白血球於反應 FC ϵ RI 刺激上亦顯示受損之活性。因此，Syk 之小分子抑制劑係用於治療由過敏引起之發炎疾病（其包括氣喘）。

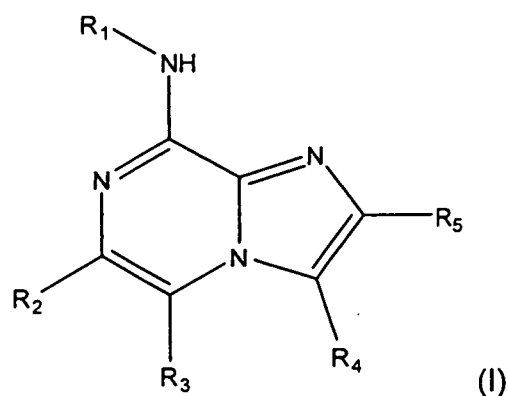
肥大細胞和單核細胞亦表現 Syk 且已顯示 Syk 對該等細胞之功能的重要性。例如，小鼠缺乏 Syk 係與受損之 IgE 媒介的肥大細胞活化有關，該受損之 IgE 媒介的肥大細胞活化係顯著地減少 TNF- α 和其他發炎性細胞因子之釋出。於細胞為底質之測定中，Syk 激酶抑制劑亦已顯示能

抑制肥大細胞去顆粒化。此外，Syk 抑制劑已顯示能抑制大鼠由抗原引起之被動皮膚過敏、支氣管縮窄及支氣管水腫。

因此，抑制 Syk 活性可用於治療過敏性疾病、自體免疫疾病及發炎疾病，諸如系統性紅斑狼瘡（SLE）、類風濕性關節炎、多發性脈管炎、特發性血栓性血小板減少症紫癜（ITP）、重症肌無力、過敏性鼻炎、慢性阻塞性肺疾病（COPD）、成人呼吸窘迫徵候群（ARDS）及氣喘。此外，已報告 Syk 於經由 B 細胞受體之與配體無關的強直性傳訊（其已知為 B 細胞之重要存活訊號）上扮演重要角色。因此，抑制 Syk 活性可用於治療某些類型之癌症，其包括 B 細胞淋巴瘤和白血病。

【發明內容】

提供至少一種化學實體，其選自式 I 化合物：



及彼等之藥學上可接受之鹽，其中

R₁ 係經 1 或 2 個基團取代之苯基，該等基團選自

鹵素；

羥基；

羧基；

氰基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之環烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之環烷氧基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團選自醯基、鹵素、可選擇地經取代之胺基、羥基、低碳烷氧基、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、經低碳烷氧基取代之低碳烷基、經 1、2 或 3 個鹵素基取代之低碳烷基、可選擇地經取代之胺基、可選擇地經取代之雜環烷基、或側氧基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷氧基，該等基團選自鹵素、可選擇地經取代之胺基、羥基、低碳烷氧基、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、經低碳烷氧基取代之低碳烷基、經 1、2 或 3 個鹵素基取代之低碳烷基、可選擇地經取代之胺基、可選擇地經取代之雜環烷基、或側氧基；

雜芳基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之胺基，該等基團選自低碳烷基、經鹵素取代之低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、或經低碳烷氧基取代之低碳烷基；

$-C(O)NR_6R_7$ ，其中 R_6 和 R_7 係各別選自氫、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、經可選擇地經取代之胺

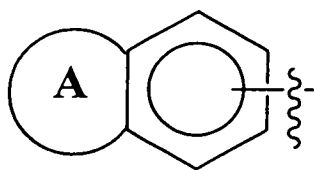
基取代之低碳烷基、環烷基、芳基、雜芳基或雜環烷基，或 R_6 和 R_7 及與彼等鍵結之氮一起形成 3 至 7 員雜環烷基環，該雜環烷基環可選擇地經 1 或 2 個基團取代，該等基團選自羥基、低碳烷基或經羥基取代之低碳烷基；

$-S(O)_2NR_6R_7$ ，其中 R_6 和 R_7 係各別選自氫、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、經可選擇地經取代之胺基取代之低碳烷基、環烷基、芳基、雜芳基或雜環烷基，或 R_6 和 R_7 及與彼等鍵結之氮一起形成 3 至 7 員雜環烷基環，該雜環烷基環可選擇地經 1 或 2 個基團取代，該等基團選自羥基、低碳烷基或經羥基取代之低碳烷基，唯其 R_6 和 R_7 中至少一者不為氫；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷氧基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、可選擇地經取代之胺基羰基、可選擇地經取代之胺基、羧基、胺基羰基或雜環烷基；

雜芳氧基；或

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、鹵素、三氟甲基、可選擇地經取代之胺基、或可選擇地經低碳烷基取代之雜環烷基；或



R_1 係 其中 A 係選自芳基、環烷基或雜環烷基，每個該等基團含有 5 至 7 個環原子且該等環原子包括與該 6 員芳香族環共有之原子，且每個該等基團係可選擇地經取代；

R_2 係選自可選擇地經取代之芳基或可選擇地經取代之雜芳基；

R_3 係選自氫、低碳烷基或鹵素；

R_4 係選自氫或低碳烷基；且

R_5 係氫；

唯其

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係 3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基羰基)苯基、4-(嗎啉-4-基)苯基、3,4-二乙氧基苯基、3-氟-4-甲氧基苯基、4-(4-乙基哌啶-1-基)苯基、4-(3-側氧基哌啶-1-基)苯基、4-(嗎啉-4-基)苯基、3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基、3-甲氧基-4-甲基苯基、4-甲氧基-3-甲基苯基、2-(二甲基胺基)乙氧基-3-甲氧基苯基、3-乙氧基-4-甲氧基苯基或 4-乙氧基-3-甲氧基苯基，則 R_2 不為經 $-(CO)NHR_6$ 取代之苯基，其中 R_6 係可選擇地經取代之芳基；

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係 3,4-二甲氧基苯基，則 R_2 不為經 $-(CO)NR_8R_9$ 或 $-(SO_2)NHR_{10}$ 取代之苯基，其中 R_8 和 R_9 一起形成可選擇地經取代之雜環烷基或可選

擇地經取代之雜芳基，或其中 R_8 係氫、甲基或乙基，且 R_9 係氫、可選擇地經取代之芳基、可選擇地經取代之環烷基、可選擇地經取代之雜環烷基、可選擇地經取代之烷基或可選擇地經取代之雜芳基，其中該苯基係進一步可選擇地經選自甲基、甲氧基或鹵素之基取代，且其中 R_{10} 係可選擇地經取代之苯基；

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係 4-（嗎啉-4-基）苯基，則 R_2 不為吡啶基、2-氟苯基、苯並[d][1,3]二噁呋基、2-甲氧基苯基、2,6-二甲氧基苯基、3-乙醯胺基苯基、3-羧基苯基、2-（羥基甲基）苯基、呋喃基或 3-（羥基乙基胺甲醯基）苯基；

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係氯苯基，則 R_2 不為經哌啶-1-基-羰基或 $NH(CO)NHR_{12}$ 取代之苯基，其中 R_{12} 係經三氟甲基或一或多個鹵素取代之苯基；

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係經可選擇地經取代之哌啶基取代之苯基，則 R_2 不為 3-胺基苯基；

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係 4-氯苯基，則 R_2 不為 4-羧基苯基、3-（2-（二甲基胺基）乙基胺甲醯基）苯基或 4-（2-（二甲基胺基）乙基胺甲醯基）苯基；

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係 4-（2-羥基-乙基）苯基或 4-（羥基乙基）苯基，則 R_2 不為 2-甲氧基苯基或 2-氟苯基；

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係 4-[(4-乙基哌啶-1-基)甲基]苯

基或 4-(2-羥基丙-2-基) 苯基，則 R_2 不為經
 $-(CO)NR_8R_9$ 取代之苯基，其中 R_8 係氫且 R_9 係氫、
 甲基或可選擇地經取代之芳基，其中該苯基係可選
 擇地進一步經選自甲基之基取代；

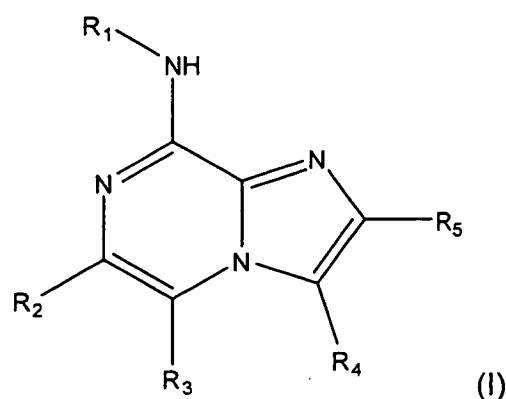
若 R_3 和 R_4 係氫且 R_2 係 4-胺甲醯基苯基，則 R_1 不為 4-(
 羥基甲基) 苯基、3-(1-羥基乙基) 苯基、4-(1H-
 咪唑-2-基)-3-甲基苯基、3-甲氧基-4-(哌啶-4-基
 氧) 苯基、3-甲氧基-4-(2-甲氧基乙氧基) 苯基、
 4-[2-(二甲基胺基) 乙氧基]-3-甲氧基苯基、4-(
 2-羥基乙氧基)-3-甲氧基苯基、3-甲氧基-4-(丙-
 2-基氧) 苯基、3-甲氧基-4-丙氧基苯基、4-(丙基
 胺甲醯基) 苯基、4-乙氧基-3-甲氧基苯基、4-(
 1H-咪唑-2-基) 苯基或 3-甲氧基-4-(1H-吡唑-5-基
) 苯基；

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_2 係經胺甲醯基取代之吡啶-3-基，則
 R_1 不為 3,4-二甲氧基苯基；

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係 4-乙氧基-3-甲氧基苯基，則 R_2
 不為經甲基取代且進一步經 $-(CO)NR_8R_9$ 取代之苯基
 ，其中 R_8 係氫且 R_9 係 4-(甲基胺甲醯基) 苯基；
 且

進一步唯其 R_2 不為經 $-NHC(O)R_{11}$ 取代之苯基，其
 中 R_{11} 係可選擇地經取代之芳基。

亦提供至少一種化學實體，其選自式 I 化合物：



及彼等之藥學上可接受之鹽，其中

R_1 係經 1 或 2 個基團取代之苯基，該等基團選自

鹵素；

羥基；

羧基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之環烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、可選擇地經取代之胺基、或側氧基；

雜芳基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之胺基，該等基團選自低碳烷基、經鹵素取代之低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基或經低碳烷氧基取代之低碳烷基；

$-C(O)NR_6R_7$ ，其中 R_6 和 R_7 係各別選自氫、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、經可選擇地經取代之胺基取代之低碳烷基、環烷基、芳基、雜芳基或雜環烷基，或 R_6 和 R_7 及與彼等鍵結之氮一起形成 3 至

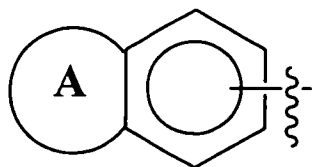
7 員雜環烷基環，該雜環烷基環可選擇地經 1 或 2 個基團取代，該等基團選自羥基、低碳烷基或經羥基取代之低碳烷基；

-S(O)₂NR₆R₇，其中 R₆ 和 R₇ 係各別選自氫、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、經可選擇地經取代之胺基取代之低碳烷基、環烷基、芳基、雜芳基或雜環烷基，或 R₆ 和 R₇ 及與彼等鍵結之氮一起形成 3 至 7 員雜環烷基環，該雜環烷基環可選擇地經 1 或 2 個基取代，該等基選自羥基、低碳烷基或經羥基取代之低碳烷基，唯其 R₆ 和 R₇ 中至少一者不為氫；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷氧基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、可選擇地經取代之胺基、羧基、胺基羧基或雜環烷基；

雜芳氧基；或

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、鹵素、三氟甲基、可選擇地經取代之胺基或可選擇地經低碳烷基取代之雜環烷基；或



R₁ 係

其中 A 係選自芳基、環烷基或雜環

烷基，每個該等基團含有 5 至 7 個環原子且該等環原子包括與該 6 員芳香族環共有之原子，且每個該等基團係可選擇地經取代；

R_2 係選自可選擇地經取代之芳基或可選擇地經取代之雜芳基；

R_3 係氫；

R_4 係氫；且

R_5 係氫，

唯其

若 R_1 係 3-甲氧基-4-甲基苯基、4-甲氧基-3-甲基苯基、2-(二甲基胺基)乙氧基-3-甲氧基苯基、3-乙氧基-4-甲氧基苯基或 4-乙氧基-3-甲氧基苯基，則 R_2 不為經 $-(CO)NHR_6$ 取代之苯基，其中 R_6 係可選擇地經取代之芳基；

若 R_1 係 3,4-二甲氧基苯基，則 R_2 不為經 $-(CO)NR_8R_9$ 或 $-(SO_2)NHR_{10}$ 取代之苯基，其中 R_8 和 R_9 一起形成可選擇地經取代之雜環烷基或可選擇地經取代之雜芳基，或其中 R_8 係氫且 R_9 係可選擇地經取代之芳基、可選擇地經取代之環烷基、可選擇地經取代之雜環烷基、可選擇地經取代之烷基或可選擇地經取代之雜芳基，且其中 R_{10} 係可選擇地經取代之苯基；

若 R_1 係 4-(嗎啉-4-基)苯基，則 R_2 不為吡啶基、2-氟苯基、苯並[d][1,3]二噁呋基、2-甲氧基苯基、2,6-二甲氧基苯基、3-乙醯胺基苯基、3-羧基苯基、2-(羥基甲基)苯基、呋喃基或 3-(羥基乙基胺甲醯基)苯基；

若 R_1 係氫苯基，則 R_2 不為經哌啶-1-基-羰基或

$\text{NH}(\text{CO})\text{NR}_{12}$ 取代之苯基，其中 R_{12} 係經三氟甲基
或一或多個鹵素取代之苯基；

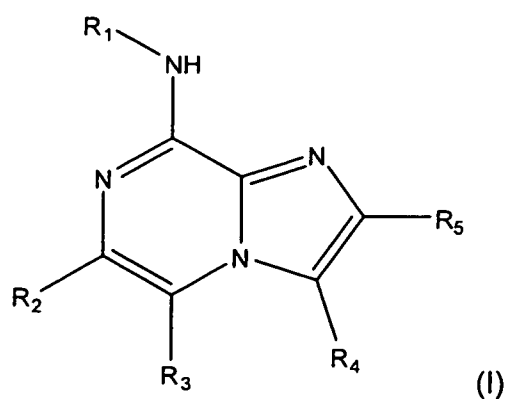
若 R_1 係可選擇地經取代之哌啶基，則 R_2 不為 3-胺基苯基
；

若 R_1 係 4-氯苯基，則 R_2 不為 4-羧基苯基、3-(2-(二甲基
胺基)乙基胺甲醯基)苯基或 4-(2-(二甲基
胺基)乙基胺甲醯基)苯基；且

若 R_1 係 4-(2-羥基-乙基)苯基或 4-(羥基乙基)苯基，
則 R_2 不為 2-甲氧基苯基或 2-氟苯基；且

進一步唯其 R_2 不為經 $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}_{11}$ 取代之苯基，其中 R_{11}
係可選擇地經取代之芳基。

亦提供至少一種化學實體，其選自式 I 化合物：



及彼等之藥學上可接受之鹽，其中

R_1 係經 1 或 2 個基團取代之苯基，該等基團選自
鹵素；

羥基；

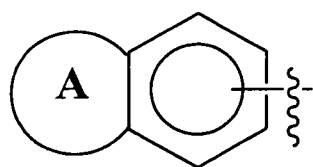
可選擇地經 1 或 2 個基團取代之環烷基，該等基團選
自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之胺基，該等基團選自低碳烷基、經鹵素取代之低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基或經低碳烷氧基取代之低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷氧基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基或可選擇地經取代之胺基；或

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、鹵素、三氟甲基或可選擇地經取代之胺基；或



R_1 係 其中 A 係選自芳基、環烷基或雜環烷基，每個該等基團含有 5 至 7 個環原子且該等環原子包括與該 6 員芳香族環共有之原子，且每個該等基團係可選擇地經取代；

R_2 係選自可選擇地經取代之芳基或可選擇地經取代之雜芳基；

R_3 係氫；

R_4 係氫；且

R_5 係氫，

唯其

若 R_1 係 3-甲氧基-4-甲基苯基、4-甲氧基-3-甲基苯基、2-

(二甲基胺基)乙氧基-3-甲氧基苯基、3-乙氧基-4-甲氧基苯基或4-乙氧基-3-甲氧基苯基，則 R_2 不為經 $-(CO)NHR_6$ 取代之苯基，其中 R_6 係可選擇地經取代之芳基；

若 R_1 係 3,4-二甲氧基苯基，則 R_2 不為經 $-(CO)NR_8R_9$ 或 $-(SO_2)NHR_{10}$ 取代之苯基，其中 R_8 和 R_9 一起形成可選擇地經取代之雜環烷基或可選擇地經取代之雜芳基，或其中 R_8 係氫且 R_9 係可選擇地經取代之芳基、可選擇地經取代之環烷基、可選擇地經取代之雜環烷基、可選擇地經取代之烷基或可選擇地經取代之雜芳基，且其中 R_{10} 係可選擇地經取代之苯基；

若 R_1 係 4-(嗎啉-4-基)苯基，則 R_2 不為吡啶基、2-氟苯基、苯並[d][1,3]二噁呋基、2-甲氧基苯基、2,6-二甲氧基苯基、3-乙醯胺基苯基、3-羧基苯基、2-(羥基甲基)苯基、呋喃基或 3-(羥基乙基胺甲醯基)苯基；

若 R_1 係氯苯基，則 R_2 不為經哌啶-1-基-羰基或 $NH(CO)NR_{12}$ 取代之苯基，其中 R_{12} 係經三氟甲基或一或多個鹵素取代之苯基；

若 R_1 係可選擇地經取代之哌啶基，則 R_2 不為 3-胺基苯基；

若 R_1 係 4-氯苯基，則 R_2 不為 4-羧基苯基、3-(2-(二甲基胺基)乙基胺甲醯基)苯基或 4-(2-(二甲基

胺基) 乙基胺甲醯基) 苯基; 且

若 R_1 係 4-(2-羥基-乙基) 苯基或 4-(羥基乙基) 苯基,

則 R_2 不為 2-甲氧基苯基或 2-氟苯基; 且

進一步唯其 R_2 不為經 $-NHC(O)R_{11}$ 取代之苯基, 其中 R_{11}

係可選擇地經取代之芳基。

亦提供一種醫藥組成物, 其包含本發明所描述之至少一種化學實體及至少一種藥學上可接受之媒介物, 該媒介物選自載體、佐劑或賦形劑。

亦提供一種治療病患之方法, 該病患罹患對抑制 Syk 活性有反應之疾病, 該方法包含對該病患給予有效量的本發明所描述之至少一種化學實體。

亦提供一種治療病患之方法, 該病患罹患選自癌症、自體免疫疾病、發炎疾病、急性發炎反應或過敏性疾病之疾病, 該方法包含對該病患給予有效量的本發明所描述之至少一種化學實體。亦提供一種治療病患之方法, 該病患罹患多囊性腎疾, 該方法包含對該病患給予有效量的本發明所描述之至少一種化學實體。

亦提供一種增加癌細胞對化學治療的敏感性之方法, 其包含對利用化學治療劑進行化學治療之病患給予足以增加癌細胞對該化學治療劑的敏感性之量的本發明所描述之至少一種化學實體。

亦提供一種抑制 ATP 水解之方法, 該方法包含令表現 Syk 之細胞與本發明所描述之至少一種化學實體接觸, 該至少一種化學實體之量係足以於活體外可偵測性地降低

ATP 水解之程度。

亦提供一種測定樣品中是否存在 Syk 之方法，該方法包含令該樣品於允許偵測 Syk 活性之條件下與本發明所描述之至少一種化學實體接觸，偵測該樣品中 Syk 活性及因此決定該樣品中存在或不存在 Syk。

亦提供一種抑制 B 細胞活性之方法，該方法包含令表現 Syk 之細胞與本發明所描述之至少一種化學實體接觸，該至少一種化學實體之量係足以於活體外可偵測性地降低 B 細胞活性。

如本發明所使用者，當任何變數於化學式中出現超過一次時，該變數於每次出現時之定義係獨立於該變數於其他每次出現時之定義。依據專利中“(一)”和“該”之一般意義，例如“(一)”激酶或“該”激酶係包括一或多種激酶。

除非本說明書另有指明之內容，本文所使用之下述字、詞及符號通常欲表示下述之意義。下述之簡稱和用語於全文中具有所指之意義：

非兩個字母或符號間之長劃符號(“-”)係用於表示取代基之連接位置。例如，-CONH₂係經由碳原子連接。

“可選擇”或“可選擇地”表示隨後所描述之事件或環境/狀態可發生或不可發生且該敘述包括該事件或環境/狀態發生之情況及該事件或環境/狀態不發生之情況。例如，“可選擇地經取代之烷基”包含“烷基”和如下述定義的“經取代之烷基”。對於含有一或多個取代基之任何基，熟習此

技藝之人士當能瞭解的是，該等基非欲導入立體上不可能、合成上不可行及／或本質上不穩定之任何取代或取代型式。

“烷基”包含具有所指之碳原子數（通常 1 至 20 個碳原子，例如 1 至 8 個碳原子，諸如 1 至 6 個碳原子）之直鏈和支鏈。例如 C_1 - C_6 烷基包含 1 至 6 個碳原子之直鏈和支鏈烷基。烷基之實例包括甲基、乙基、丙基、異丙基、正丁基、二級丁基、三級丁基、戊基、2-戊基、異戊基、新戊基、己基、2-己基、3-己基、3-甲基戊基及類似基。伸烷基係烷基之另一個子集，其係指與烷基相同之殘基但具有 2 個連接位點。伸烷基通常含有 2 至 20 個碳原子，例如 2 至 8 個碳原子，諸如 2 至 6 個碳原子。例如， C_0 伸烷基表示共價鍵且 C_1 伸烷基係伸甲基。當含有特定碳原子數之烷基殘基被指名時，欲包含的是含有該等碳原子數之所有幾何異構物；因此，例如，“丁基”意指包括正丁基、二級丁基、異丁基及三級丁基；“丙基”包括正丙基和異丙基。“低碳烷基”係指含有 1 至 4 個碳原子之烷基。

“烯基”係指具有至少一個碳碳雙鍵之不飽和支鏈或直鏈烷基，該碳碳雙鍵係衍生自去除母烷基之相鄰碳原子上的 1 分子氫。該烯基對該（等）雙鍵可呈順式或反式構形。典型之烯基包括但不限於乙烯基、丙烯基（諸如丙-1-烯-1-基、丙-1-烯-2-基、丙-2-烯-1-基（烯丙基）及丙-2-烯-2-基）、丁烯基（諸如丁-1-烯-1-基、丁-1-烯-2-基、2-甲基-丙-1-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、丁-

2-烯-2-基、丁-1,3-二烯-1-基及丁-1,3-二烯-2-基)及類似基。於某些較佳體系中，烯基含有2至20個碳原子且於其他較佳體系中含有2至6個碳原子。

“環烷基”係指含有特定碳原子數(通常3至7個環碳原子)之飽和烴環基。環烷基之實例包括環丙基、環丁基、環戊基及環己基以及橋聯和籠型之飽和環基(諸如降萜烷)。

“烷氧基”表示經由氧橋聯連接之具有所指碳原子數的烷基，諸如例如甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、二級丁氧基、三級丁氧基、戊氧基、2-戊氧基、異戊氧基、新戊氧基、己氧基、2-己氧基、3-己氧基、3-甲基戊氧基及類似基。烷氧基通常含有與氧橋聯連接之1至6個碳原子。“低碳烷氧基”係指含有1至4個碳原子之烷氧基。

“胺基羰基”包含式 $-(C=O)NR_aR_b$ 之基，其中 R_a 和 R_b 係各別選自氫或下述“經取代之胺基”的可選擇之取代基。

“醯基”係指(烷基)-C(O)-、(環烷基)-C(O)-、(芳基)-C(O)-、(雜芳基)-C(O)-及(雜環烷基)-C(O)-等基，其中該醯基係經由羰基官能基與母結構連接且其中烷基、環烷基、芳基、雜芳基及雜環烷基係如本文中所定義者。醯基含有所指之碳原子數且該等碳原子包括該酮基之碳。例如， C_2 醯基係式 $CH_3(C=O)-$ 之乙醯基。

“烷氧羰基”表示經由羰基碳連接之式(烷氧基)(C=O)-的酯基，其中該烷氧基含有所指之碳原子數。因此

， C_1-C_6 烷氧羰基係經由烷氧基之氧與羰基連接基連接的含有 1 至 6 個碳原子之烷氧基。

“胺基”表示 $-NH_2$ 基。

“芳基”包含：

5 和 6 員碳環芳香族環，例如苯；

雙環系統，其中至少一個環係碳環且屬芳香族，例如萘、二氫萘及四氫萘；及

三環系統，其中至少一個環係碳環且屬芳香族，例如蒽。

例如，芳基包括與含有一或多個選自 N、O 或 S 之雜原子的 5 至 7 員雜環烷基環稠合之 5 和 6 員碳環芳香族環。對該稠合之雙環系統（其中僅有一個環係碳環芳香族環），連接點可位於該碳環芳香族環或雜環烷基環上。由經取代之苯衍生物所形成且於環原子上具有自由價之二價基被稱為經取代之伸苯基。衍生自單價多環烴基（其名稱終端為“基”）並藉由去除具有自由價之碳原子上的一個氫原子所形成之二價基之名稱係該對應之單價基名稱的“亞基”，例如具有兩個連接點之萘基係亞二氫萘基。然而，芳基並不包含分別定義如下之雜芳基或與該分別定義如下之雜芳基以任何方式重疊。因此，若一或多個碳環芳香族環係與雜環烷基芳香族環稠合，則所生成之環系統係本文所定義之雜芳基而非芳基。

“芳氧基”係指 $-O-$ 芳基。

“鹵素（halo）”包括氟、氯、溴及碘，且“鹵素（

halogen) ”包括氟、氯、溴及碘。

“雜芳基”包含：

5 至 7 員芳香族單環，其含有一或多個（例如 1 至 4 個或於某些較佳體系中 1 至 3 個）選自 N、O 或 S 之雜原子且其餘之環原子係碳；及

雙環雜環烷基環，其含有一或多個（例如 1 至 4 個或於某些較佳體系中 1 至 3 個）選自 N、O 或 S 之雜原子且其餘之環原子係碳，且其中至少一個雜原子係存在於芳香族環上。

例如，雜芳基包括與 5 至 7 員環烷基環稠合之 5 至 7 員雜環烷基芳香族環。對該稠合之雙環雜芳基環系統（其中僅有一個環含有一或多個雜原子），連接點可位於該雜芳香族環或環烷基環上。當該雜芳基上之 S 和 O 原子的總數目超過 1 時，該等雜原子彼此不相鄰。於某些較佳體系中，該雜芳基上之 S 和 O 原子的總數目不超過 2。於某些較佳體系中，該芳香族雜環上之 S 和 O 原子的總數目不超過 1。雜芳基之實例包括但不限於（自優先被指定為 1 之連接位置編號） 2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、2,3-吡嗪基、3,4-吡嗪基、2,4-嘧啶基、3,5-嘧啶基、2,3-吡唑基、2,4-咪唑基、異噁唑基、噁唑基、噻唑基、噻二唑基、四唑基、噻吩基、苯並噻吩基、呋喃基、苯並呋喃基、苯並咪唑基、吲哚基、噻吩基、三唑基、喹啉基、吡唑基及 5,6,7,8-四氫異喹啉。衍生自單價雜芳基（其名稱終端為“基”）並藉由去除具有自由價之

原子上的一個氫原子所形成之二價基之名稱係該對應之單價基名稱的“伸基”，例如具有兩個連接點之吡啶基係伸二氫吡啶基。雜芳基不包含上述定義之芳基或與該芳基重疊。

經取代之雜芳基亦包括經一或多個氧化物（ $-O^-$ ）取代基取代之環系統，諸如吡啶基 N-氧化物。

“雜芳氧基”係指 $-O-$ 雜芳基。

“雜環烷基”表示通常具有 3 至 7 個環原子之單一脂肪族環，該脂肪族環含有至少 2 個碳原子和 1 至 3 個各別選自氧、硫或氮之雜原子以及包含至少一個上述雜原子之多種組合。適當之雜環烷基包括例如（自優先被指定為 1 之連接位置編號）2-吡咯啉基、2,4-咪唑啉基、2,3-吡啶基、2-哌啶基、3-哌啶基、4-哌啶基及 2,5-哌嗪基。亦包括嗎啉基，其包括 2-嗎啉基和 3-嗎啉基（其中氧之編號被優先指定為 1）。經取代之雜環烷基亦包括經一或多個側氧基部分取代之環系統，諸如哌啶基 N-氧化物、嗎啉基-N-氧化物、1-側氧基-1-硫代嗎啉基及 1,1-二側氧基-1-硫代嗎啉基。

“雜環烷基”亦包括雙環系統，其中該兩個環皆非芳香族且其中該雙環系統之至少一個環含有至少 2 個碳原子和 1 至 3 個各別選自氧、硫或氮之雜原子。

“雜環烷氧基”係指 $-O-$ 雜環烷基。

“硝基”係指 $-NO_2$ 。

“膦醯基”係指 $-PO_3H_2$ 。

“硫羰基”係指 $-C(=O)SH$ 。

“可選擇地經取代之硫羰基”包括下述之基： $-C(=O)S-$ （可選擇地經取代之（ C_1-C_6 ）烷基）、 $-C(=O)S-$ （可選擇地經取代之芳基）、 $-C(=O)S-$ （可選擇地經取代之雜芳基）及 $C(=O)S-$ （可選擇地經取代之雜環烷基）。

“硫基”包括 $-S-$ （可選擇地經取代之（ C_1-C_6 ）烷基）、 $-S-$ （可選擇地經取代之芳基）、 $-S-$ （可選擇地經取代之雜芳基）及 $-S-$ （可選擇地經取代之雜環烷基）。因此，硫基包括 C_1-C_6 烷基硫基。

“亞磺醯基”包括 $-S(O)-H$ 、 $-S(O)-$ （可選擇地經取代之（ C_1-C_6 ）烷基）、 $-S(O)-$ （可選擇地經取代之芳基）、 $-S(O)-$ （可選擇地經取代之雜芳基）、 $-S(O)-$ （可選擇地經取代之雜環烷基）及 $-S(O)-$ （可選擇地經取代之胺基）。

“磺醯基”包括 $-S(O_2)-H$ 、 $-S(O_2)-$ （可選擇地經取代之（ C_1-C_6 ）烷基）、 $-S(O_2)-$ （可選擇地經取代之芳基）、 $-S(O_2)-$ （可選擇地經取代之雜芳基）、 $-S(O_2)-$ （可選擇地經取代之雜環烷基）、 $-S(O_2)-$ （可選擇地經取代之烷氧基）、 $-S(O_2)-$ （可選擇地經取代之芳氧基）、 $-S(O_2)-$ （可選擇地經取代之雜芳氧基）、 $-S(O_2)-$ （可選擇地經取代之雜環氧基）及 $-S(O_2)-$ （可選擇地經取代之胺基）。

本文所稱之“經取代”表示指定之原子或基上的任一或多個氫係經選自所指定之基替代，唯其不超過該指定之原子的正常價。當取代基係側氧基（即 $=O$ ）時，該原子上

之 2 個氫係被替代。若且唯若取代基及／或變數之組合將產生安定之化合物或有用之合成中間產物，則該等組合係可被允許的。安定之化合物或安定之結構係意謂某種化合物，其係強韌而足以自反應混合物之分離中且於隨後作為具有至少實際用途的劑之調製劑中殘存。除非另有特別說明，取代基之名稱將併入核心結構中。例如，應當瞭解的是當（環烷基）烷基係列為可能之取代基時，該取代基與核心結構之連接點係位於烷基部分。

除非另有明確界定，“經取代之”烷基、環烷基、芳基、雜環烷基及雜芳基（其未限制地包括二氫苯並嘔啉基、二氫喹嘔啉基、二氫苯並二唑基、二氫吲哚基、嘧啶基、喹啉基、吲唑基、吲哚基、苯並咪唑基、苯並噻唑基、苯並三唑基、喹嘔啉基、喹唑啉基、嗎啉基、四氫吡啶基、吡咯啶基、嘔烷基、吡啶基、嘔唑基、哌啶基及嗒啶基）分別係指烷基、環烷基、芳基、雜環烷基及雜芳基（其未限制地包括二氫苯並嘔啉基、二氫喹嘔啉基、二氫苯並二唑基、二氫吲哚基、嘧啶基、喹啉基、吲唑基、吲哚基、苯並咪唑基、苯並噻唑基、苯並三唑基、喹嘔啉基、喹唑啉基、嗎啉基、四氫吡啶基、吡咯啶基、嘔烷基、吡啶基、嘔唑基、哌啶基及嗒啶基），其中一或多個（諸如達至 5 個，例如達至 3 個）氫原子係經各別選自下述之取代基替代：

-R^a、-OR^b、-O（C₁-C₂ 烷基）O-（例如 -甲二氧基-）、-SR^b、胍、胍（其中該胍之一或多個氫係經低碳烷基

替代)、 $-\text{NR}^b\text{R}^c$ 、鹵素、氰基、側氧基(作為雜環烷基之取代基)、硝基、 $-\text{COR}^b$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^b$ 、 $-\text{CONR}^b\text{R}^c$ 、 $-\text{OCOR}^b$ 、 $-\text{OCO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{OCONR}^b\text{R}^c$ 、 $-\text{NR}^c\text{COR}^b$ 、 $-\text{NR}^c\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^c\text{CONR}^b\text{R}^c$ 、 $-\text{SOR}^a$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^b\text{R}^c$ 及 $-\text{NR}^c\text{SO}_2\text{R}^a$ ，

其中 R^a 係選自可選擇地經取代之 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、可選擇地經取代之環烷基、可選擇地經取代之芳基、可選擇地經取代之雜環烷基或可選擇地經取代之雜芳基；

R^b 係選自 H 、可選擇地經取代之 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、可選擇地經取代之芳基或可選擇地經取代之雜芳基；且

R^c 係選自氫或可選擇地經取代之 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基；或

R^b 和 R^c 及與彼等鍵結之氮形成可選擇地經取代之雜環烷基；且

其中每個可選擇地經取代之基係未經取代或各別經一或多個(諸如 1、2 或 3 個)取代基取代，該等取代基各別選自 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 環烷基、芳基、雜芳基、芳基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、雜芳基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基、 $-\text{OC}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $-\text{OC}_1\text{-C}_4$ 烷基苯基、 $-\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基- OH 、 $-\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基- $\text{O-C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $-\text{OC}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基、鹵素、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基- NH_2 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{ 烷基})(\text{C}_1\text{-C}_4\text{ 烷基})$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{ 烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{ 烷基})(\text{C}_1\text{-C}_4\text{ 烷基苯基})$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{ 烷基苯基})$ 、氰基、硝基、側氧基(作為雜芳基之取代基)、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OC}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $-\text{CON}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{ 烷基})(\text{C}_1\text{-C}_4\text{ 烷基})$ 、 $-\text{CONH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{ 烷基})$ 、

基)、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})$ (C_1 - C_4 烷基)、 $-\text{NHC}(\text{O})$ (苯基)、 $-\text{N}$ (C_1 - C_4 烷基) $\text{C}(\text{O})$ (C_1 - C_4 烷基)、 $-\text{N}$ (C_1 - C_4 烷基) $\text{C}(\text{O})$ (苯基)、 $-\text{C}(\text{O})\text{C}_1$ - C_4 烷基、 $-\text{C}(\text{O})\text{C}_1$ - C_4 苯基、 $-\text{C}(\text{O})\text{C}_1$ - C_4 鹵烷基、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_1$ - C_4 烷基、 $-\text{SO}_2$ (C_1 - C_4 烷基)、 $-\text{SO}_2$ (苯基)、 $-\text{SO}_2$ (C_1 - C_4 鹵烷基)、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}$ (C_1 - C_4 烷基)、 $-\text{SO}_2\text{NH}$ (苯基)、 $-\text{NHSO}_2$ (C_1 - C_4 烷基)、 $-\text{NHSO}_2$ (苯基) 或 $-\text{NHSO}_2$ (C_1 - C_4 鹵烷基)。

“經取代之醯基”係指(經取代之烷基)- $\text{C}(\text{O})$ -、(經取代之環烷基)- $\text{C}(\text{O})$ -、(經取代之芳基)- $\text{C}(\text{O})$ -、(經取代之雜芳基)- $\text{C}(\text{O})$ -及(經取代之雜環烷基)- $\text{C}(\text{O})$ -，其中該經取代之醯基係經由羰基官能基與母結構連接且其中經取代之烷基、環烷基、芳基、雜芳基及雜環烷基係如本文所描述者。

“經取代之烷氧基”係指其中烷基成分係經取代之烷氧基(即 $-\text{O}-$ (經取代之烷基))，其中“經取代之烷基”係如本文所描述者。

“經取代之烷氧羰基”係指(經取代之烷基)- $\text{O}-\text{C}(\text{O})$ -，其中該經取代之烷氧羰基係經由羰基官能基與母結構連接且其中“經取代之烷基”係如本文所描述者。

“經取代之芳氧基”係指其中芳基成分係經取代之芳氧基(即 $-\text{O}-$ (經取代之芳基))，其中“經取代之芳基”係如本文所描述者。

“經取代之雜芳氧基”係指其中芳基成分係經取代之雜

芳氧基（即 -O-（經取代之雜芳基）），其中“經取代之雜芳基”係如本文所描述者。

“經取代之環烷氧基”係指其中環烷基成分係經取代之環烷氧基（即 -O-（經取代之環烷基）），其中“經取代之環烷基”係如本文所描述者。

“經取代之雜環烷氧基”係指其中環烷基成分係經取代之雜環烷氧基（即 -O-（經取代之雜環烷基）），其中“經取代之雜環烷基”係如本文所描述者。

“經取代之胺基”係指 -NHR^d 或 $\text{-NR}^d\text{R}^d$ ，其中每個 R^d 係各別選自羥基、可選擇地經取代之烷基、可選擇地經取代之環烷基、可選擇地經取代之醯基、胺基羰基、可選擇地經取代之芳基、可選擇地經取代之雜芳基、可選擇地經取代之雜環烷基、烷氧羰基、亞磺醯基或磺醯基，唯其僅有一個 R^d 可為羥基，且其中經取代之烷基、環烷基、芳基、雜環烷基及雜芳基各別係指其中一或多個（諸如達至 5 個，例如達至 3 個）氫原子係經各別選自下述之取代基替代的烷基、環烷基、芳基、雜環烷基及雜芳基：

-R^a 、 -OR^b 、 $\text{-O}(\text{C}_1\text{-C}_2\text{ 烷基})\text{O-}$ （例如 -甲二氧基-）、 -SR^b 、胍、胍（其中該胍之一或多個氫係經低碳烷基替代）、 $\text{-NR}^b\text{R}^c$ 、鹵素、氰基、硝基、 -COR^b 、 $\text{-CO}_2\text{R}^b$ 、 $\text{-CONR}^b\text{R}^c$ 、 -OCOR^b 、 $\text{-OCO}_2\text{R}^a$ 、 $\text{-OCONR}^b\text{R}^c$ 、 $\text{-NR}^c\text{COR}^b$ 、 $\text{-NR}^c\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $\text{-NR}^c\text{CONR}^b\text{R}^c$ 、 -SOR^a 、 $\text{-SO}_2\text{R}^a$ 、 $\text{-SO}_2\text{NR}^b\text{R}^c$ 及 $\text{-NR}^c\text{SO}_2\text{R}^a$ ，

其中 R^a 係選自可選擇地經取代之 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、可選

擇地經取代之芳基或可選擇地經取代之雜芳基；

R^b 係選自 H、可選擇地經取代之 C_1-C_6 烷基、可選擇地經取代之芳基或可選擇地經取代之雜芳基；且

R^c 係選自氫或可選擇地經取代之 C_1-C_4 烷基；或

R^b 和 R^c 及與彼等鍵結之氮形成可選擇地經取代之雜環烷基；且

其中每個可選擇地經取代之基係未經取代或各別經一或多個（諸如 1、2 或 3 個）取代基取代，該等取代基各別選自 C_1-C_4 烷基、芳基、雜芳基、芳基- C_1-C_4 烷基、雜芳基- C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 $-OC_1-C_4$ 烷基、 $-OC_1-C_4$ 烷基苯基、 $-C_1-C_4$ 烷基-OH、 $-OC_1-C_4$ 鹵烷基、鹵素、-OH、 $-NH_2$ 、 $-C_1-C_4$ 烷基- NH_2 、 $-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ (C_1-C_4 烷基)、 $-NH(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ (C_1-C_4 烷基苯基)、 $-NH(C_1-C_4 \text{ 烷基苯基})$ 、氰基、硝基、側氧基（作為雜芳基之取代基）、 $-CO_2H$ 、 $-C(O)OC_1-C_4$ 烷基、 $-CON(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ (C_1-C_4 烷基)、 $-CONH(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NHC(O)$ (C_1-C_4 烷基)、 $-NHC(O)$ (苯基)、 $-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})C(O)$ (C_1-C_4 烷基)、 $-N(C_1-C_4 \text{ 烷基})C(O)$ (苯基)、 $-C(O)C_1-C_4$ 烷基、 $-C(O)C_1-C_4$ 苯基、 $-C(O)C_1-C_4$ 鹵烷基、 $-OC(O)C_1-C_4$ 烷基、 $-SO_2(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $-SO_2$ (苯基)、 $-SO_2(C_1-C_4 \text{ 鹵烷基})$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NH(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $-SO_2NH$ (苯基)、 $-NHSO_2(C_1-C_4 \text{ 烷基})$ 、 $-NHSO_2$ (苯基) 或 $-NHSO_2(C_1-C_4 \text{ 鹵烷基})$ ；且

其中可選擇地經取代之醯基、胺基羰基、烷氧羰基、亞磺醯基及磺醯基係如本文所定義者。

“經取代之胺基”亦指 $-NHR^d$ 和 $-NR^dR^d$ 之 N-氧化物，其中 $-NHR^d$ 和 $-NR^dR^d$ 皆如上述所描述者。製備 N-氧化物可藉由令對應之胺基與例如過氧化氫或間氯過氧苯甲酸反應。熟習此技術之人士習知實施該 N-氧化作用之反應條件。

本發明所描述之化合物包括但不限於該等化合物之光學異構物、消旋混合物及彼等之其他混合物。於彼等情況下，藉由非對稱性合成或藉由消旋混合物之解析，可得單一鏡像異構物或非鏡像異構物（即光學活性型式）。藉由例如慣用之方法（諸如在解析劑之存在下進行結晶或利用例如手性高壓液相層析（HPLC）管柱進行層析），可完成消旋混合物之解析。此外，該等化合物包括具有碳碳雙鍵之化合物的 Z 型和 E 型（或順式型和反式型）。當本發明所描述之化合物係以各種不同之互變異構型式存在時，化學實體包括該化合物之所有互變異構型式。該等化合物亦包括結晶型式，該結晶型式包括多晶型物和晶籠化合物。

式 I 化合物亦包括該等化合物之結晶型式和無定形型式，其包括例如該等化合物之多晶型物、假多晶型物、溶劑化物、水合物、未溶劑化之多晶型物（其包括無水物）、構形多晶型物及無定形型式以及彼等之混合物。“結晶型式”、“多晶型物”及“新穎型式”於本文中可交換地使用

，且除非係指某一特定之結晶型式或無定形型式，則意謂包括該化合物之所有結晶型式和無定形型式，其包括例如多晶型物、假多晶型物、溶劑化物、水合物、未溶劑化之多晶型物（其包括無水物）、構形多晶型物及無定形型式以及彼等之混合物。式 I 化合物亦包括所述化合物之藥學上可接受之型式，其包括螯合物、非共價之複合物、前藥及彼等之混合物。

化學實體包括但不限於本文所描述之化合物及彼等之所有藥學上可接受之型式。因此，“一化學實體”和“化學實體”亦包含藥學上可接受之鹽。

“藥學上可接受之鹽”包括但不限於無機酸之鹽（諸如氫氨酸鹽、磷酸鹽、焦磷酸鹽、氫溴酸鹽、硫酸鹽、亞磺酸鹽、硝酸鹽及類似鹽）和有機酸之鹽（諸如蘋果酸鹽、順式丁烯二酸鹽、反式丁烯二酸鹽、酒石酸鹽、琥珀酸鹽、檸檬酸鹽、乙酸鹽、乳酸鹽、甲磺酸鹽、對甲苯磺酸鹽、2-羥基乙磺酸鹽、苯甲酸鹽、水楊酸鹽、硬脂酸鹽、烷酸鹽（諸如乙酸鹽）、 $\text{HOOC}-(\text{CH}_2)_n-\text{COOH}$ （其中 n 係 0 至 4）及類似鹽）。同樣地，藥學上可接受之陽離子包括但不限於鈉、鉀、鈣、鋁、鋰及銨。

此外，若所得之本發明所描述之化合物係酸加成鹽，則藉由使該酸鹽之溶液鹼性化可得到自由鹼。相反地，若產物係自由鹼，則依據自鹼化合物製備酸加成鹽之慣用方法，藉由溶解該自由鹼於適當之有機溶劑中並利用酸處理所生成之溶液，可製備加成鹽（特別是藥學上可接受之加

成鹽)。熟習此技藝之人士當能確認可用於製備非毒性的藥學上可接受之加成鹽的各種不同之合成方法。

如上所述，前藥亦落入式 I 化合物之範圍。於某些較佳體系中，本發明所描述之“前藥”包括當投予至病患體內經例如代謝過程後轉變為式 I 化合物之任何化合物。前藥之實例包括式 I 化合物之官能基（諸如羧酸基）的衍生物。羧酸基前藥之實例包括但不限於羧酸酯，諸如烷酯、羧基烷酯、芳基烷酯及芳氧基烷酯。

“溶劑化物”係經由溶劑與化合物之交互作用所形成。“化合物”一詞欲包括化合物之溶劑化物。同樣地，“鹽”包括鹽之溶劑化物。適當之溶劑化物係藥學上可接受之溶劑化物，諸如水合物，其包括單水合物和半水合物。

“螯合物”係經由化合物於兩個（或多個）位置對金屬離子之配位所形成。“化合物”一詞欲包括化合物之螯合物。同樣地，“鹽”包括鹽之螯合物。

“非共價複合物”係經由化合物與另一分子之交互作用所形成，其中該化合物與該分子之間並未形成共價鍵。例如，複合之發生可經由凡得瓦（van der Waals）交互作用、氫鍵及靜電交互作用（亦稱為離子鍵結）。該非共價複合物亦含括於該“化合物”之範圍內。

“氫鍵”係指負電性原子（亦稱為氫鍵接受者）與第二個相對上負電性原子（亦稱為氫鍵供給者）所連接的氫原子之間的締合型式。適當之氫鍵供給者和接受者係為藥物化學所習知（參閱文獻 G. C. Pimentel and A. L.

McClellan, The Hydrogen Bond, Freeman, San Francisco, 1960; R. Taylor and O. Kennard, "Hydrogen Bond Geometry in Organic Crystals", Accounts of Chemical Research, 17, pp. 320-326 (1984) 。

“氫鍵接受者”係指包含氧或氮（特別係 sp^2 混成之氧或氮）、醚氧、或亞砷或 N-氧化物之氧之基。

“氫鍵供給者”係指氧、氮或雜芳香族碳，該雜芳香族碳包含含有環氮之氫基或含有環氮之雜芳基。

本文所使用之“基”、“基團”或“片段”係同義字且欲指可與鍵結或分子之其他片段連接之分子的官能基或片段。

“活性劑”係用以指明具有生物活性之化學實體。於某些較佳體系中，“活性劑”係具有醫藥用途之化合物。例如，活性劑可為抗癌治療劑。

本發明所描述之化學實體的“治療上有效量”表示當投服至人或非人之病患體內時能有效提供治療益處（諸如徵狀改善、遲緩疾病進展或預防疾病）之量，例如治療上有效量可為足以減低對抑制 Syk 活性有反應之疾病的徵狀之量。於某些較佳體系中，治療上有效量係足以減低癌症徵狀、過敏性疾病徵狀、自體免疫及／或發炎疾病徵狀或急性發炎反應徵狀之量。於某些較佳體系中，治療上有效量係足以減低有機體內可偵測之癌細胞數目、可偵測地緩慢或停止癌腫瘤生長之量。於某些較佳體系中，治療上有效量係足以使癌腫瘤縮小之量。於某些情況下，罹癌之病患可能不會呈現受罹犯之徵狀。於某些較佳體系中，化學實

體之治療上有效量係足以防止病患之血液、血清或組織中癌細胞或癌標記物顯著增加或足以顯著降低該癌細胞或癌標記物的可偵測量之量。於本發明所描述之用於治療過敏性疾病及／或自體免疫及／或發炎疾病及／或急性發炎反應之方法中，治療上有效量亦可為當投服至病患體內時足以可偵測地遲緩疾病進展或預防經給予該化學實體之病患免於呈現該過敏性疾病及／或自體免疫及／或發炎疾病及／或急性發炎反應的徵狀之量。於本發明所描述之用於治療過敏性疾病及／或自體免疫及／或發炎疾病及／或急性發炎反應之某些方法中，治療上有效量亦可為足以於病患之血液或血清中可偵測地降低標的蛋白質或細胞型態量之量。例如，於某些較佳體系中，治療上有效量係足以顯著地降低 B 細胞活性之本發明所描述的化學實體之量。於另一實例中，於某些較佳體系中，治療上有效量係足以顯著地減少 B 細胞數目之本發明所描述的化學實體之量。於另一實例中，於某些較佳體系中，治療上有效量係足以於患有重症肌無力之病患的血液中降低抗乙醯膽鹼受體抗體量之本發明所描述的化學實體之量。

“抑制”表示顯著降低生物活性或製程之基礎活性。“抑制 Syk 活性”係指相對於不存在本發明所描述之至少一種化學實體的情況下之 Syk 活性，直接或間接反應該至少一種化學實體的存在之 Syk 活性的降低。活性降低可歸因於化合物與 Syk 之直接相互作用或歸因於本發明所描述之化學實體與一或多種其他因子之相互作用，該一或多種其

他因子進而影響 Syk 活性。例如，該（等）化學實體之存在可藉由直接與 Syk 結合、直接或間接致使產生降低 Syk 活性之另一因子或直接或間接降低細胞或有機體內之 Syk 量以降低 Syk 活性。

抑制 Syk 活性亦指於 Syk 活性之標準生化測定（諸如下述之 ATP 水解測定）中可觀察到之 Syk 活性的抑制作用。於某些較佳體系中，本發明所描述之化學實體具有低於或等於 1 微莫耳之 IC_{50} 值。於某些較佳體系中，該化學實體具有低於或等於 100 奈莫耳之 IC_{50} 值。於某些較佳體系中，該化學實體具有低於或等於 10 奈莫耳之 IC_{50} 值。

“抑制 B 細胞活性”係指相對於不存在本發明所描述之至少一種化學實體的情況下之 B 細胞活性，直接或間接反應該至少一種化學實體的存在之 B 細胞活性的降低。活性降低可歸因於化合物與 Syk 或與一或多種其他因子之直接相互作用，該一或多種其他因子進而影響 B 細胞活性。

抑制 B 細胞活性亦指於標準測定（諸如下述之測定）中對 CD86 表現之可觀察到的抑制作用。於某些較佳體系中，本發明所描述之化學實體具有低於或等於 10 微莫耳之 IC_{50} 值。於某些較佳體系中，該化學實體具有低於或等於 1 微莫耳之 IC_{50} 值。於某些較佳體系中，該化學實體具有低於或等於 500 奈莫耳之 IC_{50} 值。

“B 細胞活性”亦包括一或多個不同之 B 細胞細胞膜受體或與細胞膜結合之免疫球蛋白（例如 IgM、IgG 及 IgD

）之活化、再分佈、再組織或覆蓋。大多數之 B 細胞亦具有對 IgG 之 Fc 部分的細胞膜受體，該 IgG 係呈抗原抗體複合物或聚集 IgG 之型式。B 細胞亦載有對補體之活化成分（例如 C3b、C3d、C4 及 C1q）的細胞膜受體。此等不同之細胞膜受體和與細胞膜結合之免疫球蛋白具有細胞膜移動性且可進行能起始訊號轉導之再分佈和覆蓋。

B 細胞活性亦包括抗體或免疫球蛋白之合成或產製。免疫球蛋白係藉由 B 細胞系列所合成且具有共同之結構特徵和結構單位。基於免疫球蛋白之重鏈的結構差異（其包括胺基酸序列和多肽鏈長度之差異），可鑑別為 5 類免疫球蛋白（即 IgG、IgA、IgM、IgD 及 IgE）。於所有或數類免疫球蛋白中可偵測出針對給予抗原之抗體或該抗體可限於單一類或次類之免疫球蛋白。自體抗體或自體免疫抗體同樣地可屬於一或數類免疫球蛋白。例如，類風濕性因子（抗 IgG 抗體）大多通常被鑑別為 IgM 免疫球蛋白，但亦可由 IgG 或 IgA 所構成。

此外，B 細胞活性亦欲包括導致 B 細胞自前驅物 B 淋巴細胞之選殖性擴張（增殖）及分化成合成抗體之漿細胞的一系列事件，該分化係與抗原結合及來自其他細胞之細胞因子訊號之同時發生。

“抑制 B 細胞增殖”係指抑制異常 B 細胞（諸如癌性 B 細胞，例如 B 細胞淋巴瘤）之增殖及／或抑制正常非害病之 B 細胞。“抑制 B 細胞增殖”表示活體外或活體內 B 細胞數目之顯著減少。因此，活體外抑制 B 細胞增殖表示與

未與本發明所描述之至少一種化學實體接觸的樣品相比較，與該（等）化學實體接觸之活體外配對樣品中的 B 細胞數目之顯著減少。

抑制 B 細胞增殖亦指於對 B 細胞增殖之標準胸苷併入測定（諸如下述之測定）中對 B 細胞增殖之可觀察到的抑制作用。於某些較佳體系中，該化學實體具有低於或等於 10 微莫耳之 IC_{50} 值。於某些較佳體系中，該化學實體具有低於或等於 1 微莫耳之 IC_{50} 值。於某些較佳體系中，該化學實體具有低於或等於 500 奈莫耳之 IC_{50} 值。

“過敏”或“過敏性疾病”係指對某一物質（過敏原）之後天性過度敏感。過敏症狀包括濕疹、過敏性鼻炎或鼻炎、枯草熱、枝氣管氣喘、蕁麻疹及食物過敏以及其他異位性病徵。

“氣喘”係指呼吸系統之疾病，其特徵係發炎、呼吸道窄縮及呼吸道對吸入劑之增強的反應性。氣喘係通常（雖非完全）與異位性或過敏性徵狀有關。

“顯著的/地”表示任何可偵測之改變，該改變係於具有統計意義之標準參數試驗（諸如 Student 氏 T 試驗）中顯現統計上顯著性（其中 $p < 0.05$ ）。

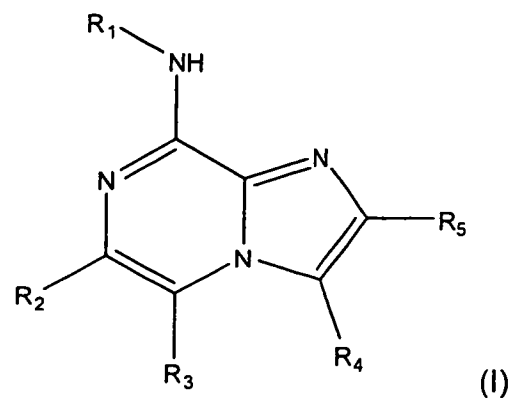
“對抑制 Syk 活性有反應之疾病”係指某一疾病，其中抑制 Syk 激酶提供治療益處，諸如改善徵狀、遲緩疾病進展、預防或遲延疾病開始或抑制某些細胞類型（單核細胞、B 細胞及肥大細胞）之異常活性。

“治療”表示對病患疾病之任何處理，其包括：

- a) 預防疾病，即致使不會發展該疾病之臨床徵狀；
- b) 抑制該疾病；
- c) 使該臨床徵狀之發展緩慢或停止；及／或
- d) 緩和該疾病，即致使該臨床徵狀退行。

“病患”係指動物（諸如哺乳動物），該動物已經是或將會是治療、觀察或實驗之對象。本發明所描述之方法可用於人體治療和獸醫應用。於某些較佳體系中，該病患係哺乳動物；於某些較佳體系中，該病患係人；且，於某些較佳體系中，該病患係選自貓或狗。

提供至少一種化學實體，其選自式 I 化合物：



及彼等之藥學上可接受之鹽，其中

R₁ 係經 1 或 2 個基團取代之苯基，該等基團選自

鹵素；

羥基；

羧基；

氰基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之環烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之環烷氧基，該等基團

選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團選自醯基、鹵素、可選擇地經取代之胺基、羥基、低碳烷氧基、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、經低碳烷氧基取代之低碳烷基、經 1、2 或 3 個鹵素基取代之低碳烷基、可選擇地經取代之胺基、可選擇地經取代之雜環烷基、或側氧基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷氧基，該等基團選自鹵素、可選擇地經取代之胺基、羥基、低碳烷氧基、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、經低碳烷氧基取代之低碳烷基、經 1、2 或 3 個鹵素基取代之低碳烷基、可選擇地經取代之胺基、可選擇地經取代之雜環烷基、或側氧基；

雜芳基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之胺基，該等基團選自低碳烷基、經鹵素取代之低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基或經低碳烷氧基取代之低碳烷基；

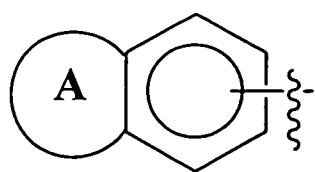
$-C(O)NR_6R_7$ ，其中 R_6 和 R_7 係各別選自氫、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、經可選擇地經取代之胺基取代之低碳烷基、環烷基、芳基、雜芳基或雜環烷基，或 R_6 和 R_7 及與彼等鍵結之氮一起形成 3 至 7 員雜環烷基環，該雜環烷基環可選擇地經 1 或 2 個基團取代，該等基團選自羥基、低碳烷基或經羥基取代之低碳烷基；

$-S(O)_2NR_6R_7$ ，其中 R_6 和 R_7 係各別選自氫、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、經可選擇地經取代之胺基取代之低碳烷基、環烷基、芳基、雜芳基或雜環烷基，或 R_6 和 R_7 及與彼等鍵結之氮一起形成 3 至 7 員雜環烷基環，該雜環烷基環可選擇地經 1 或 2 個基團取代，該等基團選自羥基、低碳烷基或經羥基取代之低碳烷基，唯其 R_6 和 R_7 中至少一者不為氫；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷氧基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、可選擇地經取代之胺基羰基、可選擇地經取代之胺基、羧基、胺基羰基或雜環烷基；

雜芳氧基；或

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、鹵素、三氟甲基、可選擇地經取代之胺基或可選擇地經低碳烷基取代之雜環烷基；或



R_1 係

其中 A 係選自芳基、環烷基或雜環烷基，每個該等基團含有 5 至 7 個環原子且該等環原子包括與該 6 員芳香族環共有之原子，且每個該等基團係可選擇地經取代；

R_2 係選自可選擇地經取代之芳基或可選擇地經取代之雜

芳基；

R_3 係選自氫、低碳烷基或鹵素；

R_4 係選自氫或低碳烷基；且

R_5 係氫，

唯其

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係 3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基羰基)苯基、4-(嗎啉-4-基)苯基、3,4-二乙氧基苯基、3-氟-4-甲氧基苯基、4-(4-乙基哌啶-1-基)苯基、4-(3-側氧基哌啶-1-基)苯基、4-(嗎啉-4-基)苯基、3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基、3-甲氧基-4-甲基苯基、4-甲氧基-3-甲基苯基、2-(二甲基胺基)乙氧基-3-甲氧基苯基、3-乙氧基-4-甲氧基苯基或4-乙氧基-3-甲氧基苯基，則 R_2 不為經 $-(CO)NHR_6$ 取代之苯基，其中 R_6 係可選擇地經取代之芳基；

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係 3,4-二甲氧基苯基，則 R_2 不為經 $-(CO)NR_8R_9$ 或 $-(SO_2)NHR_{10}$ 取代之苯基，其中 R_8 和 R_9 一起形成可選擇地經取代之雜環烷基或可選擇地經取代之雜芳基，或其中 R_8 係氫、甲基或乙基，且 R_9 係氫、可選擇地經取代之芳基、可選擇地經取代之環烷基、可選擇地經取代之雜環烷基、可選擇地經取代之烷基或可選擇地經取代之雜芳基，其中該苯基係進一步可選擇地經選自甲基、甲氧基或鹵素之基取代，且其中 R_{10} 係可選擇地經取代之苯基；

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係 4- (嗎啉 -4-基) 苯基 , 則 R_2 不為吡啶基、2-氟苯基、苯並[d][1,3]二嘔呢基、2-甲氧基苯基、2,6-二甲氧基苯基、3-乙醯胺基苯基、3-羧基苯基、2- (羥基甲基) 苯基、呋喃基或 3- (羥基乙基胺甲醯基) 苯基 ;

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係氯苯基 , 則 R_2 不為經吡啶 -1-基 - 羰基或 $\text{NH}(\text{CO})\text{NHR}_{12}$ 取代之苯基 , 其中 R_{12} 係經三氟甲基或一或多個鹵素取代之苯基 ;

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係經可選擇地經取代之哌啶基取代之苯基 , 則 R_2 不為 3-胺基苯基 ;

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係 4-氯苯基 , 則 R_2 不為 4-羧基苯基、3- (2- (二甲基胺基) 乙基胺甲醯基) 苯基或 4- (2- (二甲基胺基) 乙基胺甲醯基) 苯基 ;

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係 4- (2-羥基 -乙基) 苯基或 4- (羥基乙基) 苯基 , 則 R_2 不為 2-甲氧基苯基或 2-氟苯基 ;

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係 4- [(4-乙基哌啶 -1-基) 甲基] 苯基或 4- (2-羥基丙 -2-基) 苯基 , 則 R_2 不為經 $-(\text{CO})\text{NR}_8\text{R}_9$ 取代之苯基 , 其中 R_8 係氫且 R_9 係氫、甲基或可選擇地經取代之芳基 , 其中該苯基係可選擇地進一步經選自甲基之基取代 ;

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_2 係 4-胺甲醯基苯基 , 則 R_1 不為 4- (羥基甲基) 苯基、3- (1-羥基乙基) 苯基、4- (1H-咪唑 -2-基) -3-甲基苯基、3-甲氧基 -4- (吡啶 -4-基

氧) 苯基、3-甲氧基-4-(2-甲氧基乙氧基) 苯基、
4-[2-(二甲基胺基) 乙氧基]-3-甲氧基苯基、4-(
2-羥基乙氧基)-3-甲氧基苯基、3-甲氧基-4-(丙-
2-基氧) 苯基、3-甲氧基-4-丙氧基苯基、4-(丙基
胺甲醯基) 苯基、4-乙氧基-3-甲氧基苯基、4-(
1H-咪唑-2-基) 苯基或 3-甲氧基-4-(1H-吡唑-5-基
) 苯基；

若 R_3 和 R_4 係氫且 R_2 係經胺甲醯基取代之吡啶-3-基，則
 R_1 不為 3,4-二甲氧基苯基；

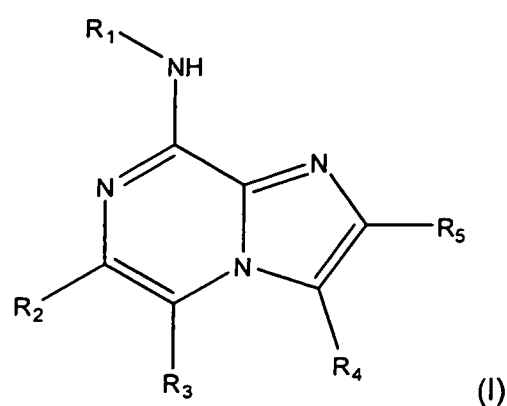
若 R_3 和 R_4 係氫且 R_1 係 4-乙氧基-3-甲氧基苯基，則 R_2
不為經甲基取代且進一步經 $-(CO)NR_8R_9$ 取代之苯基
，其中 R_8 係氫且 R_9 係 4-(甲基胺甲醯基) 苯基；
且

進一步唯其 R_2 不為經 $-NHC(O)R_{11}$ 取代之苯基，其中 R_{11}
係可選擇地經取代之芳基。

於某些較佳體系中， R_3 係選自氫、甲基、乙基或氯。
於某些較佳體系中， R_3 係氫。

於某些較佳體系中， R_4 係選自氫或甲基。於某些較
佳體系中， R_4 係氫。

亦提供至少一種化學實體，其選自式 I 化合物：



及彼等之藥學上可接受之鹽，其中

R_1 係經 1 或 2 個基團取代之苯基，該等基團選自

鹵素；

羥基；

羧基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之環烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、可選擇地經取代之胺基、或側氧基；

雜芳基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之胺基，該等基團選自低碳烷基、經鹵素取代之低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基或經低碳烷氧基取代之低碳烷基；

$-C(O)NR_6R_7$ ，其中 R_6 和 R_7 係各別選自氫、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、經可選擇地經取代之胺基取代之低碳烷基、環烷基、芳基、雜芳基或雜環烷基，或 R_6 和 R_7 及與彼等鍵結之氮一起形成 3 至

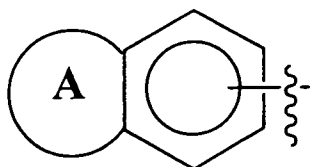
7 員雜環烷基環，該雜環烷基環可選擇地經 1 或 2 個基團取代，該等基團選自羥基、低碳烷基或經羥基取代之低碳烷基；

$-S(O)_2NR_6R_7$ ，其中 R_6 和 R_7 係各別選自氫、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、經可選擇地經取代之胺基取代之低碳烷基、環烷基、芳基、雜芳基或雜環烷基，或 R_6 和 R_7 及與彼等鍵結之氮一起形成 3 至 7 員雜環烷基環，該雜環烷基環可選擇地經 1 或 2 個基團取代，該等基團選自羥基、低碳烷基或經羥基取代之低碳烷基，唯其 R_6 和 R_7 中至少一者不為氫；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷氧基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、可選擇地經取代之胺基、羧基、胺基羧基或雜環烷基；

雜芳氧基；或

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、鹵素、三氟甲基、可選擇地經取代之胺基或可選擇地經低碳烷基取代之雜環烷基；或



R_1 係

其中 A 係選自芳基、環烷基或雜環烷基，每個該等基團含有 5 至 7 個環原子且該等環原子包括與該 6 員芳香族環共有之原子，且每個該

等基團係可選擇地經取代；

R_2 係選自可選擇地經取代之芳基或可選擇地經取代之雜芳基；

R_3 係氫；

R_4 係氫；且

R_5 係氫，

唯其

若 R_1 係 3-甲氧基-4-甲基苯基、4-甲氧基-3-甲基苯基、2-(二甲基胺基)乙氧基-3-甲氧基苯基、3-乙氧基-4-甲氧基苯基或 4-乙氧基-3-甲氧基苯基，則 R_2 不為經 $-(CO)NHR_6$ 取代之苯基，其中 R_6 係可選擇地經取代之芳基；

若 R_1 係 3,4-二甲氧基苯基，則 R_2 不為經 $-(CO)NR_8R_9$ 或 $-(SO_2)NHR_{10}$ 取代之苯基，其中 R_8 和 R_9 一起形成可選擇地經取代之雜環烷基或可選擇地經取代之雜芳基，或其中 R_8 係氫且 R_9 係可選擇地經取代之芳基、可選擇地經取代之環烷基、可選擇地經取代之雜環烷基、可選擇地經取代之烷基或可選擇地經取代之雜芳基，且其中 R_{10} 係可選擇地經取代之苯基；

若 R_1 係 4-(嗎啉-4-基)苯基，則 R_2 不為吡啶基、2-氟苯基、苯並[d][1,3]二噁呋基、2-甲氧基苯基、2,6-二甲氧基苯基、3-乙醯胺基苯基、3-羧基苯基、2-(羥基甲基)苯基、呋喃基或 3-(羥基乙基胺甲醯

基) 苯基；

若 R_1 係氯苯基，則 R_2 不為經哌啶-1-基-羰基或 $NH(CO)NR_{12}$ 取代之苯基，其中 R_{12} 係經三氟甲基或一或多個鹵素取代之苯基；

若 R_1 係可選擇地經取代之哌啶基，則 R_2 不為 3-胺基苯基；

若 R_1 係 4-氯苯基，則 R_2 不為 4-羧基苯基、3-(2-(二甲基胺基)乙基胺甲醯基)苯基或 4-(2-(二甲基胺基)乙基胺甲醯基)苯基；且

若 R_1 係 4-(2-羥基-乙基)苯基或 4-(羥基乙基)苯基，則 R_2 不為 2-甲氧基苯基或 2-氟苯基；且

進一步唯其 R_2 不為經 $-NHC(O)R_{11}$ 取代之苯基，其中 R_{11} 係可選擇地經取代之芳基。

於某些較佳體系中， R_1 係經 1 或 2 個基團取代之苯基，該等基團選自

鹵素；

羥基；

羧基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之環烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、可選擇地經取代之胺基、或側氧基；

雜芳基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之胺基，該等基團選自
 低碳烷基、經鹵素取代之低碳烷基、經羥基取代之
 低碳烷基或經低碳烷氧基取代之低碳烷基；

$-C(O)NR_6R_7$ ，其中 R_6 和 R_7 係各別選自氫、低碳烷基
 、經羥基取代之低碳烷基、經可選擇地經取代之胺
 基取代之低碳烷基、環烷基、芳基、雜芳基或雜環
 烷基，或 R_6 和 R_7 及與彼等鍵結之氮一起形成 3 至
 7 員雜環烷基環，該雜環烷基環可選擇地經 1 或 2
 個基取代，該等基選自羥基、低碳烷基或經羥基取
 代之低碳烷基；

$-S(O)_2NR_6R_7$ ，其中 R_6 和 R_7 係各別選自氫、低碳烷
 基、經羥基取代之低碳烷基、經可選擇地經取代之
 胺基取代之低碳烷基、環烷基、芳基、雜芳基或雜
 環烷基，或 R_6 和 R_7 及與彼等鍵結之氮一起形成 3
 至 7 員雜環烷基環，該雜環烷基環可選擇地經 1 或
 2 個基團取代，該等基團選自羥基、低碳烷基或經
 羥基取代之低碳烷基，唯其 R_6 和 R_7 中至少一者不
 為氫；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷氧基，該等基
 團選自羥基、低碳烷氧基、可選擇地經取代之胺基
 、羧基、胺基羧基或雜環烷基；

雜芳氧基；或

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團
 選自羥基、低碳烷氧基、鹵素、三氟甲基、可選擇

地經取代之胺基或可選擇地經低碳烷基取代之雜環烷基。

於某些較佳體系中， R_1 係經 1 或 2 個基團取代之苯基，該等基團選自

鹵素；

羥基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、低碳烷基或經羥基取代之低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之胺基，該等基團選自低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基或經低碳烷氧基取代之低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷氧基，該等團基選自羥基、低碳烷氧基或可選擇地經取代之胺基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、三氟甲基、可選擇地經取代之胺基、或雜環烷基；或

$-C(O)NR_6R_7$ ，其中 R_6 和 R_7 係各別選自氫、低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基、經可選擇地經取代之胺基取代之低碳烷基、環烷基、芳基、雜芳基或雜環烷基，或 R_6 和 R_7 及與彼等鍵結之氮一起形成 3 至 7 員雜環烷基環，該雜環烷基環可選擇地經 1 或 2 個基團取代，該等基團選自羥基、低碳烷基或經羥

基取代之低碳烷基。

於某些較佳體系中， R_1 係經 1 或 2 個基團取代之苯基，該等基團選自

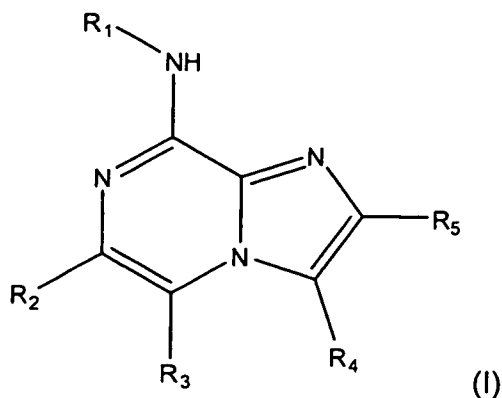
羥基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、低碳烷基或經羥基取代之低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷氧基，該等基團選自羥基或低碳烷氧基；或

經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、三氟甲基、可選擇地經取代之胺基、或雜環烷基。

亦提供至少一種化學實體，其選自式 I 化合物：



及彼等之藥學上可接受之鹽，其中

R_1 係經 1 或 2 個基團取代之苯基，該等基團選自

鹵素；

羥基；

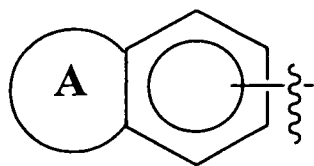
可選擇地經 1 或 2 個基團取代之環烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之胺基，該等基團選自低碳烷基、經鹵素取代之低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基或經低碳烷氧基取代之低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷氧基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基或可選擇地經取代之胺基；或

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基、鹵素、三氟甲基或可選擇地經取代之胺基；或



R₁ 係

其中 A 係選自芳基、環烷基或雜環烷基，每個該等基團含有 5 至 7 個環原子且該等環原子包括與該 6 員芳香族環共有之原子，且每個該等基團係可選擇地經取代；

R₂ 係選自可選擇地經取代之芳基或可選擇地經取代之雜芳基；

R₃ 係氫；

R₄ 係氫；且

R₅ 係氫，

唯其

若 R₁ 係 3-甲氧基-4-甲基苯基、4-甲氧基-3-甲基苯基、2-(二甲基胺基)乙氧基-3-甲氧基苯基、3-乙氧基-

4-甲氧基苯基或 4-乙氧基-3-甲氧基苯基，則 R_2 不為經 $-(CO)NHR_6$ 取代之苯基，其中 R_6 係可選擇地經取代之芳基；

若 R_1 係 3,4-二甲氧基苯基，則 R_2 不為經 $-(CO)NR_8R_9$ 或 $-(SO_2)NHR_{10}$ 取代之苯基，其中 R_8 和 R_9 一起形成可選擇地經取代之雜環烷基或可選擇地經取代之雜芳基，或其中 R_8 係氫且 R_9 係可選擇地經取代之芳基、可選擇地經取代之環烷基、可選擇地經取代之雜環烷基、可選擇地經取代之烷基或可選擇地經取代之雜芳基，且其中 R_{10} 係可選擇地經取代之苯基；

若 R_1 係 4-(嗎啉-4-基)苯基，則 R_2 不為吡啶基、2-氟苯基、苯並[d][1,3]二噁呋基、2-甲氧基苯基、2,6-二甲氧基苯基、3-乙醯胺基苯基、3-羧基苯基、2-(羥基甲基)苯基、呋喃基或 3-(羥基乙基胺甲醯基)苯基；

若 R_1 係氯苯基，則 R_2 不為經哌啶-1-基-羰基或 $NH(CO)NR_{12}$ 取代之苯基，其中 R_{12} 係經三氟甲基或一或多個鹵素取代之苯基；

若 R_1 係可選擇地經取代之哌啶基，則 R_2 不為 3-胺基苯基；

若 R_1 係 4-氯苯基，則 R_2 不為 4-羧基苯基、3-(2-(二甲基胺基)乙基胺甲醯基)苯基或 4-(2-(二甲基胺基)乙基胺甲醯基)苯基；且

若 R_1 係 4-(2-羥基-乙基) 苯基或 4-(羥基乙基) 苯基，

則 R_2 不為 2-甲氧基苯基或 2-氟苯基；且

進一步唯其 R_2 不為經 $-NHC(O)R_{11}$ 取代之苯基，其中 R_{11}

係可選擇地經取代之芳基。

於某些較佳體系中， R_1 係經 1 或 2 個基團取代之苯基，該等基團選自

鹵素；

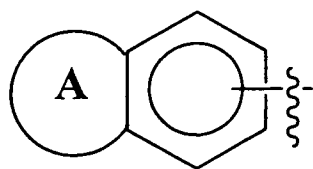
羥基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團

選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

可選擇地經可選擇地經取代之胺基取代之低碳烷氧基；或

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基或可選擇地經取代之胺基；或



R_1 係

其中 A 係選自芳基、環烷基或雜環烷基，每個該等基團含有 5 至 7 個環原子且該等環原子包括與該 6 員芳香族環共有之原子，且每個該等基團係可選擇地經取代。

於某些較佳體系中， R_1 係經 1 或 2 個基團取代之苯基，該等基團選自

羥基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團

選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之胺基，該等基團選自
低碳烷基、經羥基取代之低碳烷基或經低碳烷氧基
取代之低碳烷基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷氧基，該等基
團選自羥基或可選擇地經取代之胺基；或

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團
選自羥基、低碳烷氧基、三氟甲基或可選擇地經取
代之胺基。

於某些較佳體系中， R_1 係經 1 或 2 個基團取代之苯
基，該等基團選自
羥基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團
選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

低碳烷氧基；或

經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團選自羥基
、低碳烷氧基、三氟甲基或可選擇地經取代之胺基
。

於某些較佳體系中， R_1 係選自（1-羥基環丁基）苯基
、（1,1,1-三氟-2-羥基丙-2-基）苯基、（2,2,2-三氟-1-羥
基乙基）苯基、（1,1,1,3,3,3-六氟-2-羥基丙-2-基）苯基
、（2-羥基-2-甲基丙氧基）-3-甲氧基苯基、（2-羥基乙
基）（甲基）胺基）-3-甲氧基苯基、（2-甲氧基乙基）
（甲基）胺基）-3-甲氧基苯基、（1-羥基乙基）苯基、

3,4-二甲氧基苯基、3-甲氧基苯基、4-乙氧基-3-甲氧基苯基、4-羥基甲基-3-甲氧基苯基、3-羥基甲基-4-甲氧基苯基、2-氟-4-甲氧基苯基、4-(二甲基胺基)丙氧基-3-甲氧基苯基、4-羥基丙氧基-3-甲氧基苯基、4-(2-羥基-1,1-二甲基乙基)苯基、4-(1-羥基-1-甲基乙基)苯基、4-甲氧基-3-(吡咯啉-1-基)苯基、3-甲氧基-4-(吡咯啉-1-基)苯基、3-甲氧基-4-(丙-2-基氧)苯基、3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基、4-(吡咯啉-1-基)苯基、4-(3-羥基吡咯啉基)苯基、4-(4-羥基哌啶基)-3-甲氧基苯基、4-(3-羥基四氫吡啶基)-3-甲氧基苯基、4-(3-羥基吡咯啉基)-3-甲氧基苯基、4-(2-甲氧基丙-2-基)苯基、4-(4-乙基哌啶-1-基)-3-甲氧基苯基、4-(4-乙基哌啶-1-基)苯基、4-(3-羥基-3-甲基哌啶基)苯基或3-羥基甲基苯基。

於某些較佳體系中， R_1 係經 1 或 2 個基團取代之苯基，該等基團選自

羥基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團

選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

可選擇地經可選擇地經取代之胺基取代之低碳烷氧基；或

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團

選自羥基、低碳烷氧基或可選擇地經取代之胺基。

於某些較佳體系中， R_1 係經 1 或 2 個基團取代之苯

基，該等基團選自

羥基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基或低碳烷基；

低碳烷氧基；或

經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團選自羥基、低碳烷氧基或可選擇地經取代之胺基。

於某些較佳體系中， R_1 係經 1 或 2 個基團取代之苯基，該等基團選自

羥基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之雜環烷基，該等基團選自羥基或低碳烷基；

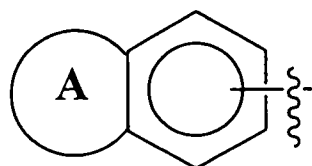
低碳烷氧基；或

經 1 或 2 個基團取代之低碳烷基，該等基團選自羥基或低碳烷氧基。

於某些較佳體系中， R_1 係選自（1-羥基乙基）苯基、3,4-二甲氧基苯基、3-甲氧基苯基、4-乙氧基-3-甲氧基苯基、4-羥基甲基-3-甲氧基苯基、3-羥基甲基-4-甲氧基苯基、2-氟-4-甲氧基苯基、4-（二甲基胺基）丙氧基-3-甲氧基苯基、4-羥基丙氧基-3-甲氧基苯基、4-（2-羥基-1,1-二甲基乙基）苯基、4-（1-羥基-1-甲基乙基）苯基、4-甲氧基-3-（吡咯啉-1-基）苯基、3-甲氧基-4-（吡咯啉-1-基）苯基、3-甲氧基-4-（丙-2-基氧）苯基、3-甲氧基-4-（嗎啉-4-基）苯基、4-（吡咯啉-1-基）苯基、4-（3-羥基

吡咯啉基) 苯基、4-(4-羥基哌啉基)-3-甲氧基苯基、4-(3-羥基四氫吡啶基)-3-甲氧基苯基、4-(3-羥基吡咯啉基)-3-甲氧基苯基、4-(2-甲氧基丙-2-基) 苯基、4-(4-乙基哌啶-1-基)-3-甲氧基苯基、4-(4-乙基哌啶-1-基) 苯基、4-(3-羥基-3-甲基哌啉基) 苯基或 3-羥基甲基苯基。

於某些較佳體系中， R_1 係



於某些較佳體系中， A 係可選擇地經取代之雜環烷基，其包含一或多個選自 O 或 N 之雜原子。於某些較佳體系中，該雜環烷基係經一或多個選自低碳烷基或側氧基之基取代。於某些較佳體系中，該雜原子 N 係經低碳烷基取代。

於某些較佳體系中， R_1 係選自 3,4-二氫-2H-苯並[b][1,4]噁啉-6-基、4-甲基-3,4-二氫-2H-苯並[b][1,4]噁啉-6-基、2,3,4,5-四氫苯並[b][1,4]噁氮吡-7-基、5-甲基-2,3,4,5-四氫苯並[b][1,4]噁氮吡-7-基、2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮-6-基或 2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮-5-基。

於某些較佳體系中， R_2 係選自

可選擇地經取代之雜芳基；

可選擇地經一或多個基團取代之二氫苯並噁啉基，該

等基團選自低碳烷基、鹵素或側氧基；

可選擇地經一或多個基團取代之二氫喹啉基，該等基團選自低碳烷基或側氧基；

可選擇地經側氧基取代之二氫苯並二唑基；

可選擇地經一或多個基團取代之二氫吲哚基，該等基團選自低碳烷基或側氧基；或

經一或多個基團取代之苯基，該等基團選自可選擇地經取代之烷基、氰基、硝基、低碳烷氧基、鹵素、磺醯基、可選擇地經取代之胺基或可選擇地經取代之雜芳基。

於某些較佳體系中， R_2 係選自

可選擇地經取代之吡啶基；

嘧啶基；

噻吩基；

可選擇地經胺基取代之喹啉基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之吲唑基，該等基團選自胺甲醯基、鹵素、低碳烷基或胺基；

可選擇地經 1 或 2 個基團取代之吲哚基，該等基團選自低碳烷基或胺甲醯基；

可選擇地經甲基或胺基取代之苯並咪唑基；

可選擇地經低碳烷基取代之苯並噻唑基；

苯並呋唑基；

苯並三唑基；

可選擇地經胺基取代之喹啉基；

可選擇地經胺基取代之喹唑啉基；

可選擇地經一或多個基團取代之二氫苯並嘔咩基，該等基團選自甲基、鹵素或側氧基；

1H-吡咯並[3,2-b]吡啶基；

可選擇地經一或多個基團取代之二氫苯並嘔咩基，該等基團選自低碳烷基、鹵素或側氧基；

可選擇地經一或多個基團取代之二氫吲哚基，該等基團選自低碳烷基或側氧基；或

經一或多個基團取代之苯基，該等基團選自可選擇地經取代之烷基、氰基、氯、氟、硝基、甲氧基、磺醯基、雜芳基、胺基或 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}_{12}$ ，其中 R_{12} 係低碳烷基。

於某些較佳體系中， R_2 係選自 2,3-二氫-1,4-苯並二嘔咩-6-基、4-甲基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔咩-6-基、1,3-苯並嘔啞-5-基、2H-1,3-苯並二嘔啞-5-基、2,3-二氫-1H-吲哚-6-基、2-甲基-1,2,3,4-四氫異喹啉-6-基、1-甲基-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮-6-基、1,2,3,4-四氫異喹啉-2-基-乙-1-酮-6-基、2-乙基-1,2,3,4-四氫異喹啉-7-基、2-胺基喹啉-6-基、2-羥基乙基-2H-吲啞-6-基、1-羥基乙基-2H-吲啞-6-基、1H-吲啞-7-基、1,2,3,4-四氫異喹啉-6-基、3-(二乙基胺基)甲基-1H-吲啞-6-基、1,2-二氫喹啉-2-酮-6-基、1,2-二氫喹啉-2-酮-6-基、1H-吡啞-4-基、1,3-噻啞-5-基、2-甲基-1,3-苯並噻啞-5-基、1'2'-二氫螺[環丙烷-1,3'-吲哚]-2'-酮-6-基、3,3-二甲基-2-側氧基-2,3-二氫-1H-吲哚-6-基、3-(1,3-噻啞-4-基亞甲基)-2,3-二氫-1H-

吡啶 -2-酮 -6-基、1-甲基 -1H-吡啶 -6-基、(N,N-二甲基胺基羰基) 吡啶 -6-基、1,3-苯並噻吩 -5-基、1,3-苯並噻吩 -6-基、1H,2H,3H-吡啶並[2,3-b][1,4]噁吩 -2-酮 -6-基、2,2-二氟 -3,4-二氫 -2H-1,4-苯並噁吩 -3-酮 -6-基、3-乙基 -1H-吡啶 -6-基、1H-吡啶 -2-基、1H-吡啶 -3-基、4-氟 -1H-吡啶 -6-基、1H-1,2,3-苯並三唑 -6-基、2,3-二氫 -1H-1,3-苯並二唑 -2-酮 -6-基、1H-1,3-苯並二唑 -6-基、1H-吡啶 -6-基、1H-吡咯並[3,2-b]吡啶 -6-基、1-甲基 -1H-1,3-苯並二唑 -5-基、1-甲基 -1H-1,3-苯並二唑 -6-基、1-甲基 -1H-苯並[d]咪唑 -5-基、2-甲基 -1H-苯並[d]咪唑 -5-基、2-側氧基吡啶 -6-基、3,3-二甲基 -2-側氧基吡啶 -6-基、3,4-二氫 -2H-1,4-苯並噁吩 -6-基、3,4-二氫 -2H-1,4-苯並噁吩 -7-基、3-胺基 -1H-吡啶 -5-基、3-胺基 -1H-吡啶 -6-基、3-胺甲醯基 -1H-吡啶 -6-基、3-甲基 -1H-吡啶 -6-基、3-側氧基 -3,4-二氫 -2H-苯並[b][1,4]噁吩 -6-基、4-(1-羥基 -2-甲基丙 -2-基) 苯基、5-氟 -1H-吡啶 -6-基或吡啶 -6-基。

於某些較佳體系中， R_2 係選自可選擇地經取代之雜芳基、可選擇地經低碳烷基或側氧基取代之二氫苯並噁吩基、或經一或多個基團取代之苯基，該等基團選自可選擇地經取代之烷基、氰基、硝基、低碳烷氧基、鹵素、磺醯基、可選擇地經取代之胺基、或可選擇地經取代之雜芳基。

於某些較佳體系中， R_2 係選自可選擇地經取代之吡啶基、嘧啶基、噻吩基、可選擇地經胺基取代之噻吩基、

可選擇地經鹵素、胺甲醯基、甲基或胺基取代之吡啶基、吡啶基、可選擇地經 1 或 2 個選自低碳烷基或側氧基之基取代之吡啶基、可選擇地經甲基或胺基取代之苯並咪唑基、苯並噻唑基、苯並呋喃基、苯並三唑基、可選擇地經胺基取代之噻吩基、可選擇地經胺基取代之噻唑基、可選擇地經甲基或側氧基取代之二氫苯並呋喃基、1H-吡咯並[3,2-b]吡啶基、或經一或多個基團取代之苯基，該等基團選自可選擇地經取代之烷基、氰基、氯、氟、硝基、甲氧基、磺醯基、雜芳基、胺基或 NHC(O)R_{12} ，其中 R_{12} 係低碳烷基。

於某些較佳體系中， R_2 係選自 1H-1,3-苯並二唑-6-基、1H-吡啶-6-基、1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基、1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基、1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基、1-甲基-1H-苯並[d]咪唑-5-基、2-甲基-1H-苯並[d]咪唑-5-基、2-側氧基吡啶-6-基、3,3-二甲基-2-側氧基吡啶-6-基、3,4-二氫-2H-1,4-苯並呋喃-6-基、3,4-二氫-2H-1,4-苯並呋喃-7-基、3-胺基-1H-吡啶-5-基、3-胺基-1H-吡啶-6-基、3-胺甲醯基-1H-吡啶-6-基、3-甲基-1H-吡啶-6-基、3-側氧基-3,4-二氫-2H-苯並[b][1,4]呋喃-6-基、4-(1-羥基-2-甲基丙-2-基)苯基、5-氟-1H-吡啶-6-基或吡啶-6-基。

於某些較佳體系中， R_2 係選自可選擇地經取代之吡啶基、嘧啶基、噻吩基、可選擇地經胺基取代之噻吩基、可選擇地經甲基或胺基取代之吡啶基、吡啶基、可選擇地

經甲基或胺基取代之苯並咪唑基、苯並噻唑基、苯並噁唑基、苯並三唑基、可選擇地經胺基取代之喹啉基、可選擇地經胺基取代之喹唑啉基、可選擇地經甲基或側氧基取代之二氫苯並噁吡基、或經一或多個基取代之苯基，該等基選自可選擇地經取代之烷基、氰基、氯、氟、硝基、甲氧基、磺醯基、雜芳基、胺基或 NHC(O)R_{12} ，其中 R_{12} 係低碳烷基。

於某些較佳體系中， R_2 係選自 3-甲基苯基、4-甲基苯基、3-硝基苯基、3-[(乙基胺基)甲基]苯基、4-[(乙基胺基)甲基]苯基、3-(三氟甲基)苯基、3-甲氧基苯基、4-吡啶基、3-吡啶基、4-氰基苯基、3-氰基苯基、4-氯苯基、3-氯苯基、4-氯-3-甲基苯基、3-氯-4-甲基苯基、4-氟苯基、3-氟苯基、4-氟-3-甲基苯基、3-氟-4-甲基苯基、3,4-二氟苯基、4-磺醯胺基苯基、3-磺醯胺基苯基、4-甲磺醯基苯基、3-甲磺醯基苯基、2-氟吡啶-4-基、5-甲基吡啶-3-基、5-氯吡啶-3-基、嘧啶-5-基、(4-乙醯基哌啶-1-基)甲基苯基、(3-乙醯基哌啶-1-基)甲基苯基、(3-哌啶-1-基甲基)苯基、(4-哌啶-1-基甲基)苯基、3-乙醯胺基苯基、4-乙醯胺基苯基、4-胺基苯基、3-胺基苯基、噻吩-3-基、噻吩-2-基、1H-吡啶-5-基、1H-吡啶-6-基、3-胺基-1H-吡啶-5-基、1-甲基-1H-吡啶-5-基、1-甲基-1H-吡啶-6-基、3-甲基-1H-吡啶-5-基、2,3-二甲基-2H-吡啶-5-基、3-胺基-1H-吡啶-6-基、3-胺基-1H-吡啶-5-基、4-(1H-咪唑-2-基)苯基、4-(1H-咪唑-5-基)苯基、3-

(1H-咪唑 -5-基) 苯基、喹啉 -6-基、2-胺基喹啉 -6-基、3-胺基喹啉 -6-基、1,3-苯並噻唑 -5-基、1,3-苯並噻唑 -6-基、2-胺基噻唑啉 -6-基、3-(1,3-噻唑 -2-基) 苯基、4-(1,3-噻唑 -2-基) 苯基、3-(1,3-噻唑 -2-基) 苯基、1,2-二氫吡啶 -2-酮 -5-基、4-(1,3-噁唑 -2-基) 苯基、3-(1,3-噁唑 -2-基) 苯基、2-胺基吡啶 -5-基、1H-1,2,3-苯並三唑 -6-基、1H-咪唑並 [4,5-b] 吡啶 -6-基、1,3-苯並噁唑 -5-基、1,3-苯並噁唑 -6-基、1H-吡啶 -6-基、1H-吡啶 -5-基、1-甲基 -1H-1,3-苯並二唑 -5-基、2-胺基 -1H-1,3-苯並二唑 -6-基、1-甲基 -1H-1,3-苯並二唑 -6-基、2H,3H,4H-吡啶並 [3,2-b][1,4] 噁吡 -3-酮 -6-基、1H,2H,3H-吡啶並 [3,2-b][1,4] 噁吡 -3-酮 -6-基、3,4-二氫 -2H-1,4-苯並噁吡 -3-酮 -6-基、3,4-二氫 -2H-1,4-苯並噁吡 -3-酮 -7-基、4-甲基 -3,4-二氫 -2H-1,4-苯並噁吡 -3-酮 -6-基、2-甲基 -3,4-二氫 -2H-1,4-苯並噁吡 -3-酮 -6-基、2,2-二甲基 -3,4-二氫 -2H-1,4-苯並噁吡 -3-酮 -6-基、2-羥基喹啉 -6-基、1-甲基 -1,2-二氫吡啶 -2-酮 -5-基或噻噁啉 -2-醇 -7-基。

亦提供至少一種化學實體，其選自：

N-(3,4-二甲氧基苯基) -6-(3-甲基苯基) 咪唑並 [1,2-a] 吡啶 -8-胺；

N-(3,4-二甲氧基苯基) -6-(3-硝基苯基) 咪唑並 [1,2-a] 吡啶 -8-胺；

N-(3,4-二甲氧基苯基) -6-{3-[(乙基胺基) 甲基] 苯基 } 咪唑並 [1,2-a] 吡啶 -8-胺；

N- (3,4-二 甲 氧 基 苯 基) -6-[3- (三 氟 甲 基) 苯 基]咪
啞 並 [1,2-a]吡 咍 -8-胺 ；

N- (3,4-二 甲 氧 基 苯 基) -6- (3-甲 氧 基 苯 基) 咪 啞 並
[1,2-a]吡 咍 -8-胺 ；

N- (3,4-二 甲 氧 基 苯 基) -6- (吡 啶 -4-基) 咪 啞 並
[1,2-a]吡 咍 -8-胺 ；

N- (3,4-二 甲 氧 基 苯 基) -6- (吡 啶 -3-基) 咪 啞 並
[1,2-a]吡 咍 -8-胺 ；

N- (3,4-二 甲 氧 基 苯 基) -6-苯 基 咪 啞 並 [1,2-a]吡 咍 -8-
胺 ；

3-{8-[(3,4-二 甲 氧 基 苯 基) 胺 基]咪 啞 並 [1,2-a]吡 咍 -
6-基 }苳 脞 ；

N- (3,4-二 甲 氧 基 苯 基) -6- (4-氟 苯 基) 咪 啞 並 [1,2-
a]吡 咍 -8-胺 ；

4-{8-[(3,4-二 甲 氧 基 苯 基) 胺 基]咪 啞 並 [1,2-a]吡 咍 -
6-基 }苳 -1-磺 醯 胺 ；

N- (3,4-二 甲 氧 基 苯 基) -6-{4-[(乙 基 胺 基) 甲 基]
苳 基 }咪 啞 並 [1,2-a]吡 咍 -8-胺 ；

6- (4-氯 苳 基) -N- (3,4-二 甲 氧 基 苳 基) 咪 啞 並 [1,2-
a]吡 咍 -8-胺 ；

6- (3-氯 苳 基) -N- (4-乙 氧 基 -3-甲 氧 基 苳 基) 咪 啞
並 [1,2-a]吡 咍 -8-胺 ；

N- (3,4-二 甲 氧 基 苳 基) -6- (4-甲 磺 醯 基 苳 基) 咪 啞
並 [1,2-a]吡 咍 -8-胺 ；

4-{8-[(3,4-二甲氧基苯基) 胺基]咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -
6-基 }苜 脞 ；

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6- (4-甲基苯基) 咪唑並
[1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

N- (4-乙氧基 -3-甲氧基苯基) -6- (3-甲基苯基) 咪
唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

N- (4-乙氧基 -3-甲氧基苯基) -6- (3-氟苯基) 咪唑
並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

6- (3,4-二氟苯基) -N- (4-乙氧基 -3-甲氧基苯基)
咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

6- (4-氯 -3-甲基苯基) -N- (4-乙氧基 -3-甲氧基苯基
) 咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

3-{8-[(4-乙氧基 -3-甲氧基苯基) 胺基]咪唑並 [1,2-
a]吡 咩 -6-基 }苜 -1-磺 醯 胺 ；

N- (4-乙氧基 -3-甲氧基苯基) -6- (3-甲磺 醯 基苯基
) 咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

N- (4-乙氧基 -3-甲氧基苯基) -6- (4-氟 -3-甲基苯基
) 咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

N- (4-乙氧基 -3-甲氧基苯基) -6- (3-氟 -4-甲基苯基
) 咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

6- (3-氯 -4-甲基苯基) -N- (4-乙氧基 -3-甲氧基苯基
) 咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

N- (4-乙氧基 -3-甲氧基苯基) -6- (2-氟吡 咩 -4-基)
咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

N- (4-乙氧基-3-甲氧基苯基) -6- (5-甲基吡啶-3-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-胺 ;

6- (5-氯吡啶-3-基) -N- (4-乙氧基-3-甲氧基苯基) 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-胺 ;

N- (4-乙氧基-3-甲氧基苯基) -6- (嘧啶-5-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-胺 ;

1- { 4- [(4- { 8- [(4-乙氧基-3-甲氧基苯基) 胺基] 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-6-基 } 苯基) 甲基] 哌嗪-1-基 } 乙-1-酮 ;

1- { 4- [(3- { 8- [(3,4-二甲氧基苯基) 胺基] 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-6-基 } 苯基) 甲基] 哌嗪-1-基 } 乙-1-酮 ;

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6- [3- (哌嗪-1-基甲基) 苯基] 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-胺 ;

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6- [4- (哌嗪-1-基甲基) 苯基] 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-胺 ;

6- (2,3-二氫-1,4-苯並二噁嗪-6-基) -N- (3,4-二甲氧基苯基) 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-胺 ;

N- (3- { 8- [(3,4-二甲氧基苯基) 胺基] 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-6-基 } 苯基) 乙醯胺 ;

6- (3-胺基苯基) -N- (3,4-二甲氧基苯基) 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-胺 ;

N- (4- { 8- [(3,4-二甲氧基苯基) 胺基] 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-6-基 } 苯基) 乙醯胺 ;

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6- (噻吩-3-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-胺 ;

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6- (1H-吡啶 -5-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-胺 ；

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6-[4- (1H-咪唑 -2-基) 苯基]咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-胺 ；

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6- (喹 啉 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-胺 ；

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6- (1H-吡啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-胺 ；

6- { 8-[(3,4-二甲氧基苯基) 胺基]咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -6-基 } -3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嘔 啞 -3-酮 ；

6- (1,3-苯 並 噻 啶 -5-基) -N- (3,4-二甲氧基苯基) 咪 啶 並 [1,2-a]吡 啞 -8-胺 ；

6- (1,3-苯 並 噻 啶 -6-基) -N- (3,4-二甲氧基苯基) 咪 啶 並 [1,2-a]吡 啞 -8-胺 ；

6- { 8-[(3,4-二甲氧基苯基) 胺基]咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -6-基 } 喹 啶 啉 -2-胺 ；

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6- (噻 吩 -2-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-胺 ；

3-胺基 -5- { 8-[(3,4-二甲氧基苯基) 胺基]咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -6-基 } -1-甲基 -1,2-二 氫 吡 啶 -2-酮 ；

6- { 8-[(3,4-二甲氧基苯基) 胺基]咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -6-基 } 喹 啉 -2-胺 ；

6- (4-胺基苯基) -N- (3,4-二甲氧基苯基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-胺 ；

6- (1H-1,3-苯並二唑-5-基) -N- (3,4-二甲氧基苯基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6-[3- (1H-咪唑-5-基) 苯基]咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

7-{8-[(3,4-二甲氧基苯基) 胺基]咪唑並 [1,2-a]吡啶-6-基 }-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁啶-3-酮 ;

N- (4-乙氧基-3-甲氧基苯基) -6- (1H-吡唑-5-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6-[4- (1H-咪唑-5-基) 苯基]咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

N- (4-乙氧基-3-甲氧基苯基) -6- (1H-吡唑-6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

6- (1,3-苯並噻唑-5-基) -N- (4-乙氧基-3-甲氧基苯基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6-[3- (1,3-噻唑-2-基) 苯基]咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6- (1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

5-{8-[(3,4-二甲氧基苯基) 胺基]咪唑並 [1,2-a]吡啶-6-基 }-1,2-二氫吡啶-2-酮 ;

6- (1,3-苯並噻唑-5-基) -N- (4-乙氧基-3-甲氧基苯基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6-[4- (1,3-噁唑-2-基) 苯基]咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

(3 - { [6 - (1H-吡啶 - 6 - 基) 咪唑 並 [1,2 - a] 吡 啶 - 8 - 基] 胺基 } 苯基) 甲 醇 ；

5 - { 8 - [(3,4 - 二 甲 氧 基 苯 基) 胺 基] 咪 唑 並 [1,2 - a] 吡 啶 - 6 - 基 } 吡 啶 - 2 - 胺 ；

N - (3,4 - 二 甲 氧 基 苯 基) - 6 - [3 - (1,3 - 嘔 啶 - 2 - 基) 苯基] 咪 唑 並 [1,2 - a] 吡 啶 - 8 - 胺 ；

N - [6 - (1H-吡 啶 - 6 - 基) 咪 唑 並 [1,2 - a] 吡 啶 - 8 - 基] - 3,4 - 二 氫 - 2H - 1,4 - 苯 並 嘔 啶 - 6 - 胺 ；

1 - (4 - { [6 - (1H-吡 啶 - 6 - 基) 咪 唑 並 [1,2 - a] 吡 啶 - 8 - 基] 胺基 } 苯基) 乙 - 1 - 醇 ；

N - (3,4 - 二 甲 氧 基 苯 基) - 6 - [4 - (1,3 - 噻 啶 - 2 - 基) 苯基] 咪 唑 並 [1,2 - a] 吡 啶 - 8 - 胺 ；

(5 - { [6 - (1H-吡 啶 - 6 - 基) 咪 唑 並 [1,2 - a] 吡 啶 - 8 - 基] 胺基 } - 2 - 甲 氧 基 苯 基) 甲 醇 ；

N - (3,4 - 二 甲 氧 基 苯 基) - 6 - (1H-吡 啶 - 6 - 基) 咪 唑 並 [1,2 - a] 吡 啶 - 8 - 胺 ；

N - (3,4 - 二 甲 氧 基 苯 基) - 6 - (1 - 甲 基 - 1H - 1,3 - 苯 並 二 噻 - 6 - 基) 咪 唑 並 [1,2 - a] 吡 啶 - 8 - 胺 ；

N - (4 - 乙 氧 基 - 3 - 甲 氧 基 苯 基) - 6 - (1 - 甲 基 - 1H - 吡 啶 - 5 - 基) 咪 唑 並 [1,2 - a] 吡 啶 - 8 - 胺 ；

N - (4 - 乙 氧 基 - 3 - 甲 氧 基 苯 基) - 6 - (1 - 甲 基 - 1H - 吡 啶 - 6 - 基) 咪 唑 並 [1,2 - a] 吡 啶 - 8 - 胺 ；

N - (3,4 - 二 甲 氧 基 苯 基) - 6 - (1 - 甲 基 - 1H - 吡 啶 - 5 - 基) 咪 唑 並 [1,2 - a] 吡 啶 - 8 - 胺 ；

6- (1H-1,2,3-苯並三唑-6-基) -N- (3,4-二甲氧基苯基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6- { 1H-咪唑並 [4,5-b]吡啶-6-基 } 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

6- (1,3-苯並噁唑-5-基) -N- (3,4-二甲氧基苯基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

6- (1,3-苯並噁唑-6-基) -N- (3,4-二甲氧基苯基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

6- { 8- [(3,4-二甲氧基苯基) 胺基] 咪唑並 [1,2-a]吡啶-6-基 } -4-甲基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡啶-3-酮 ;

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6- (1-甲基-1H-噁唑-6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6- (1H-噁唑-5-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

6- { 8- [(3,4-二甲氧基苯基) 胺基] 咪唑並 [1,2-a]吡啶-6-基 } 喹啉-3-胺 ;

2- (4- { [6- (1H-噁唑-6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基] 胺基 } 苯基) 丙-2-醇 ;

5- { 8- [(3,4-二甲氧基苯基) 胺基] 咪唑並 [1,2-a]吡啶-6-基 } -1H-噁唑-3-胺 ;

6- { 8- [(3,4-二甲氧基苯基) 胺基] 咪唑並 [1,2-a]吡啶-6-基 } -1H-1,3-苯並二唑-2-胺 ;

6- { 8- [(3,4-二甲氧基苯基) 胺基] 咪唑並 [1,2-a]吡啶-6-基 } -2H,3H,4H-吡啶並 [3,2-b] [1,4]噁吡啶-3-酮 ;

6-{8-[(3,4-二甲氧基苯基) 胺基]咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -
6-基 }-2-甲基 -3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 喹 咩 -3-酮 ；

6-{8-[(3,4-二甲氧基苯基) 胺基]咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -
6-基 }-2,2-二 甲基 -3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 喹 咩 -3-酮 ；

7-{8-[(3,4-二甲氧基苯基) 胺基]咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -
6-基 }喹 咩 -2-醇 ；

2- (4-{[6- (1H-咩 咩 -6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]
胺基 }苯基) -2-甲基 丙 -1-醇 ；

6-{8-[(3,4-二甲氧基苯基) 胺基]咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -
6-基 }-1H-咩 咩 -3-胺 ；

(4-{[6- (1H-咩 咩 -6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺
基 }-2-甲氧基苯基) 甲醇 ；

6- (2,3-二 氫 -1H-咩 咩 -6-基) -N- (3,4-二甲氧基苯基
) 咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

N-[6- (3-胺基 -1H-咩 咩 -5-基) 咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-
基]-3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 喹 咩 -6-胺 ；

N-{4-[3- (二 甲基 胺基) 丙氧基]-3-甲氧基苯基 }-6- (
1H-咩 咩 -6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

3- (4-{[6- (1H-咩 咩 -6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]
胺基 }-2-甲氧基苯氧基) 丙 -1-醇 ；

6- (1H-咩 咩 -6-基) -N-[4-甲氧基 -3- (吡 咯 啉 -1-基)
苯基]咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

5-{[6- (1H-咩 咩 -6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基
}-2,3-二 氫 -1H-咩 咩 -2-酮 ；

7-{8-[(3,4-二甲氧基苯基) 胺基]咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -6-基 }喹 啉 -2-醇 ；

7-{8-[(3,4-二甲氧基苯基) 胺基]咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -6-基 }-1H,2H,3H-吡 啶 並 [2,3-b][1,4]喹 咩 -2-酮 ；

N-[6- (1H-吡 啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]-4-甲基 -3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 喹 咩 -7-胺 ；

N- (2-氟 -4-甲氧基苯基) -6- (1H-吡 啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

6- (1H-吡 啶 -6-基) -N-[3-甲氧基 -4- (吡 咯 啶 -1-基) 苯基]咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

N-[6- (1H-吡 啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]-2,3,4,5-四 氫 -1,5-苯 並 喹 氮 呋 -7-胺 ；

1- (4-{[6- (3-胺基 -1H-吡 啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基 }苯基) 乙 -1-醇 ；

6- (3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 喹 咩 -6-基) -N- (3,4-二甲氧基苯基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

N-[6- (1H-吡 啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]-4-甲基 -3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 喹 咩 -6-胺 ；

6-{[6- (1H-吡 啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基 }-2,3-二 氫 -1H-吡 啶 -2-酮 ；

N- (3,4-二甲氧基苯基) -6-{1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -6-基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

N-[6- (1H-吡 啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]-3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 喹 咩 -7-胺 ；

6-{8-[(4-乙氧基-3-甲氧基苯基) 胺基]咪唑並 [1,2-a]吡啶-6-基}-1H-吡啶-3-胺 ;

N-[6-(2-胺基喹啉-6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]-4-甲基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-6-胺 ;

2-甲基-2-(4-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基) 丙-1-醇 ;

6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-6-基) -N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

N-[6-(2,3-二氫-1H-吡啶-6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-6-胺 ;

(2-甲氧基-5-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基) 甲醇 ;

6-(1H-吡啶-6-基) -N-{4-[2-甲基-1-(嗎啉-4-基) 丙-2-基]苯基}咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

N-[6-(1H-吡啶-6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-6-胺 ;

7-{8-[(4-甲基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-7-基) 胺基]咪唑並 [1,2-a]吡啶-6-基}喹啉-2-醇 ;

1-(4-{[6-(1,3-苯並噻唑-5-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基) 乙-1-醇 ;

6-(1H-1,2,3-苯並三唑-6-基) -N-[3-甲氧基-4-(丙-2-基氧) 苯基]咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

5-(8-{[3-甲氧基-4-(吡咯啉-1-基) 苯基]胺基}咪唑並 [1,2-a]吡啶-6-基) -1H-吡啶-3-胺 ;

2- (4- {[6- (2-胺基噻唑啉 -6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基 } 苯基) 丙 -2-醇 ;

6- (1H-吲 咩 -6-基) -N-[3-甲 氧基 -4- (嗎 咩 -4-基) 苯基]咪 咩 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

2- (4- {[6- (1,3-苯 並 噻 咩 -5-基) 咪 咩 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基 } 苯基) 丙 -2-醇 ;

6- (8- {[4- (2-羥基 丙 -2-基) 苯基]胺基 }咪 咩 並 [1,2-a]吡 咩 -6-基) -3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嗎 咩 -3-酮 ;

6- (1H-吲 咩 -6-基) -N- (3-甲 氧基 苯基) 咪 咩 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

6- (1H-吲 咩 -6-基) -N- (4-甲 氧基 苯基) 咪 咩 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

2- (4- {[6- (1-甲 基 -1H-1,3-苯 並 二 咩 -5-基) 咪 咩 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基 } 苯基) 丙 -2-醇 ;

2- (4- {[6- (1-甲 基 -1H-1,3-苯 並 二 咩 -6-基) 咪 咩 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基 } 苯基) 丙 -2-醇 ;

1- (4- {[6- (1H-吲 咩 -6-基) 咪 咩 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基 } -2-甲 氧基 苯基) 哌 啶 -4-醇 ;

6- (1H-吲 咩 -6-基) -N-[4- (吡 咯 啶 -1-基) 苯基]咪 咩 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

1- (4- {[6- (1H-吲 咩 -6-基) 咪 咩 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基 } 苯基) 吡 咯 啶 -3-醇 ;

2- (4- {[6- (4-甲 基 -3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嗎 咩 -7-基) 咪 咩 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基 } 苯基) 丙 -2-醇 ;

2- (4- { [6- (3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔咭-6-基) 咪唑並
[1,2-a] 吡咭-8-基] 胺基 } 苯基) 丙-2-醇 ;

2- (4- { [6- (1,4-二甲基-1,2,3,4-四氫喹咭-6-基) 咪
唑並 [1,2-a] 吡咭-8-基] 胺基 } 苯基) 丙-2-醇 ;

1- (4- { [6- (1H-吲咭-6-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡咭-8-基]
胺基 } -2-甲氧基苯基) 四氫吡啶-3-醇 ;

2- (4- { [6- (1H-吲咭-6-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡咭-8-基]
胺基 } 苯基) 丙-2-醇 ;

2- (4- { [6- (3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔咭-7-基) 咪唑並
[1,2-a] 吡咭-8-基] 胺基 } 苯基) 丙-2-醇 ;

2- (4- { [6- (4-甲基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔咭-6-基)
咪唑並 [1,2-a] 吡咭-8-基] 胺基 } 苯基) 丙-2-醇 ;

2- (4- { [6- (2,3-二甲基-2H-吲咭-5-基) 咪唑並 [1,2-
a] 吡咭-8-基] 胺基 } 苯基) 丙-2-醇 ;

2- (4- { [6- (3-甲基-1H-吲咭-5-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡
咭-8-基] 胺基 } 苯基) 丙-2-醇 ;

N-[3-甲氧基-4- (嗎咭-4-基) 苯基]-6- (1-甲基-1H-
1,3-苯並二咭-6-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡咭-8-胺 ;

6- (8- { [3-甲氧基-4- (嗎咭-4-基) 苯基] 胺基 } 咪唑並
[1,2-a] 吡咭-6-基) 喹咭-2-胺 ;

1- (4- { [6- (1H-吲咭-6-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡咭-8-基]
胺基 } 苯基) 四氫吡啶-3-醇 ;

1- (4- { [6- (1H-吲咭-6-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡咭-8-基]
胺基 } -2-甲氧基苯基) 吡咯啉-3-醇 ;

6- (3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔咭-6-基) -N-[3-甲氧基-4- (嗎啉-4-基) 苯基]咪唑並[1,2-a]吡咭-8-胺 ;

6- (1H-嘔咭-6-基) -N-[4- (2-甲氧基丙-2-基) 苯基]咪唑並[1,2-a]吡咭-8-胺 ;

N- (4-乙氧基-3-甲氧基苯基) -6- (1H-嘔咭-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡咭-8-胺 ;

N-[3-甲氧基-4- (嗎啉-4-基) 苯基]-6- (1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基) 咪唑並[1,2-a]吡咭-8-胺 ;

N-[4- (4-乙基哌咭-1-基) -3-甲氧基苯基]-6- (1H-嘔咭-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡咭-8-胺 ;

1- (4- {[6- (1H-嘔咭-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡咭-8-基]胺基} 苯基) -3-甲基哌啶-3-醇 ; 及

N-[4- (4-乙基哌咭-1-基) 苯基]-6- (1H-嘔咭-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡咭-8-胺 ,

及彼等之藥學上可接受之鹽。

亦提供至少一種化學實體，其選自：

6- (8- {[3-甲氧基-4- (嗎啉-4-基) 苯基]胺基} 咪唑並[1,2-a]吡咭-6-基) -1H-嘔咭-3-胺 ;

5- (8- {[3-甲氧基-4- (嗎啉-4-基) 苯基]胺基} 咪唑並[1,2-a]吡咭-6-基) -1H-嘔咭-3-胺 ;

6- (8- {[4- (2-羥基丙-2-基) 苯基]胺基} 咪唑並[1,2-a]吡咭-6-基) -2,3-二氫-1H-嘔咭-2-酮 ;

1- (4- {[6- (1H-嘔咭-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡咭-8-基]胺基} 苯基) 哌啶-4-醇 ;

1- (4- { [6- (1H- 吡啶 - 6- 基) 咪唑 並 [1, 2- a] 吡 啶 - 8- 基]
胺基 } - 2- 甲氧基 苯氧基) - 2- 甲基 丙 - 2- 醇 ;

1- (4- { [6- (1H- 吡啶 - 6- 基) 咪唑 並 [1, 2- a] 吡 啶 - 8- 基]
胺基 } - 2- 甲氧基 苯基) - 4- 甲基 哌 啶 - 4- 醇 ;

2- [(4- { [6- (1H- 吡啶 - 6- 基) 咪唑 並 [1, 2- a] 吡 啶 - 8- 基
] 胺基 } - 2- 甲氧基 苯基) (甲基) 胺基] 乙 - 1- 醇 ;

1- (4- { [6- (1H- 吡啶 - 6- 基) 咪唑 並 [1, 2- a] 吡 啶 - 8- 基]
胺基 } 苯基) - 4- 甲基 哌 啶 - 4- 醇 ;

4- { [6- (1H- 吡啶 - 6- 基) 咪唑 並 [1, 2- a] 吡 啶 - 8- 基] 胺基
} 酚 ;

2- (4- { [6- (2, 3- 二 氫 - 1H- 吡 啶 - 6- 基) 咪唑 並 [1, 2- a]
吡 啶 - 8- 基] 胺基 } 苯基) 丙 - 2- 醇 ;

1- (4- { [6- (1H- 吡啶 - 6- 基) 咪唑 並 [1, 2- a] 吡 啶 - 8- 基]
胺基 } 苯基) - 3- 甲基 吡 咯 啶 - 3- 醇 ;

N- [3- 甲氧基 - 4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯基] - 6- (2- 甲基 - 1H-
1, 3- 苯 並 二 唑 - 5- 基) 咪唑 並 [1, 2- a] 吡 啶 - 8- 胺 ;

N- (4- 乙氧基 - 3- 甲氧基 苯基) - 6- (1- 甲基 - 1H- 1, 3- 苯
並 二 唑 - 5- 基) 咪唑 並 [1, 2- a] 吡 啶 - 8- 胺 ;

(3R) - 1- (4- { [6- (1H- 吡啶 - 6- 基) 咪唑 並 [1, 2- a] 吡
啶 - 8- 基] 胺基 } 苯基) 吡 咯 啶 - 3- 醇 ;

(3R) - 1- (4- { [6- (1H- 吡啶 - 6- 基) 咪唑 並 [1, 2- a] 吡
啶 - 8- 基] 胺基 } - 2- 甲氧基 苯基) 吡 咯 啶 - 3- 醇 ;

(3S) - 1- (4- { [6- (1H- 吡啶 - 6- 基) 咪唑 並 [1, 2- a] 吡
啶 - 8- 基] 胺基 } - 2- 甲氧基 苯基) 吡 咯 啶 - 3- 醇 ;

[4-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)嗎啉-2-基]甲醇；

N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)-6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

6-(5-氟-1H-吡啶-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

2-[1-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)哌啶-4-基]丙-2-醇；

(3S)-1-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)吡咯啶-3-醇；

N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(3-甲基-1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

1-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)-3-甲基吡咯啶-3-醇；

6-(1H-1,3-苯並二唑-6-基)-N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

6-(8-{[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮；

6-(8-{[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,3-二甲基-2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮；

N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)-6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

4-N-[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]-2-甲氧基-1-N-(2-甲氧基乙基)-1-N-甲基苯-1,4-二胺；

4-甲基-1-(4-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)哌啶-4-醇；

6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔吡-7-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺；

6-(8-{[4-(1-羥基-2-甲基丙-2-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔吡-3-酮；

1-(4-{[6-(1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)-2-甲基丙-2-醇；

N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺；

2-(4-{[6-(1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)-1,1,1,3,3,3-六氟丙-2-醇；

2-甲基-2-(4-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)丙-1-醇；

2-甲基-2-{4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基)胺基]苯基}丙-1-醇；

2,2,2-三氟-1-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)乙-1-醇；

2-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔吡-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)-2-甲基丙-1-醇；

6-(8-{[4-(4-羥基-4-甲基哌啶-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔吡-3-酮；

4-甲基-1-{4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基)胺基]苯基}哌啶-4-醇；

1- (4- { [6- (1H-1,3-苯並二唑-6-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡
 嗪-8-基] 胺基 } 苯基) -4-甲基哌啶-4-醇 ;

6- (1H-吡嗪-6-基) -N-[4- (1-甲氧基-2-甲基丙-2-基
) 苯基] 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-胺 ;

4-甲基-1- (4- { [6- (1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基)
 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-基] 胺基 } 苯基) 哌啶-4-醇 ;

6- (1H-1,3-苯並二唑-6-基) -N-[3-甲氧基-4- (嗎啉-
 4-基) 苯基] 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-胺 ;

1,1,1-三氟-2- (4- { [6- (1H-吡嗪-6-基) 咪唑並 [1,2-
 a] 吡嗪-8-基] 胺基 } 苯基) 丙-2-醇 ;

1- (4- { [6- (1H-吡嗪-6-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-基]
 胺基 } 苯基) -2-甲基丙-2-醇 ;

1- (4- { [6- (1H-吡嗪-6-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-基]
 胺基 } 苯基) 環丁-1-醇 ;

1- (4- { [6- (1H-吡嗪-6-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-基]
 胺基 } -2-甲氧基苯基) -3-甲基哌啶-3-醇 ;

4-N-[6- (1H-吡嗪-6-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-基]-1-
 N- (2-甲氧基乙基) -1-N-甲基苯-1,4-二胺 ;

6- { 8- [(4-乙氧基-3-甲氧基苯基) 胺基] 咪唑並 [1,2-
 a] 吡嗪-6-基 } -1H-吡嗪-3-羧醯胺 ;

2- [(4- { [6- (1H-吡嗪-6-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡嗪-8-基
] 胺基 } 苯基) (甲基) 胺基] 乙-1-醇 ;

1- (4- { [6- (3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔嗪-6-基) 咪唑並
 [1,2-a] 吡嗪-8-基] 胺基 } 苯基) -4-甲基哌啶-4-醇 ;

6- (1H-吡啶 -6-基) -N-[4- (嗎啉 -4-基) 苯基]咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

N-[4- (嗎啉 -4-基) 苯基]-6-{1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -6-基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

1- (4-{[6- (1H-吡 啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基 }苯基) 哌 啶 -3-醇 ；

6- (1H-吡 啶 -6-基) -N-[4- (嗎啉 -4-基) 苯基]咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

2- (4-{[6- (1H-1,3-苯 並 二 呋 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基 }苯基) -2-甲 基 丙 -1-醇 ；

6- (8-{[4- (1-羥 基 -2-甲 基 丙 -2-基) 苯基]胺基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -6-基) -2,3-二 氫 -1H-吡 啶 -2-酮 ；

2- (4-{[6- (1H-吡 啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基 }苯基) -2-甲 基 丙 -1-醇 ；

6-{8-[(4-乙 氧 基 -3-甲 氧 基 苯基) 胺基]咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -6-基 }-2,3-二 氫 -1H-吡 啶 -2-酮 ；

2- (4-{[6- (3-胺 基 -1H-吡 啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基 }苯基) -2-甲 基 丙 -1-醇 ；

5-{8-[(4-乙 氧 基 -3-甲 氧 基 苯基) 胺基]咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -6-基 }-1H-吡 啶 -3-胺 ； 及

2- (4-{[6- (3-胺 基 -1H-吡 啶 -5-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺基 }苯基) -2-甲 基 丙 -1-醇 ，

及彼等之藥學上可接受之鹽。

亦提供至少一種化學實體，其選自：

(3S) -1-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡
 嗪-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)-3-甲基吡咯啉-3-醇；

(3R) -1-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡
 嗪-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)-3-甲基吡咯啉-3-醇；

7-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡
 嗪-6-基)-1,2-二氫喹啉-2-酮；

N,N-二甲基-6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑
 並[1,2-a]吡嗪-6-基)-1H-吡啶-3-羧醯胺；

5-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡
 嗪-6-基)-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮；

1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並吡嗪-6-基)咪唑並
 [1,2-a]吡嗪-8-基]胺基}苯基)-2-甲基丙-2-醇；

N-甲基-2-(4-{[6-(2-側氧基-2,3-二氫-1H-吡啶-6-
 基)咪唑並[1,2-a]吡嗪-8-基]胺基}苯氧基)乙醯胺；

N-[3-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]
 吡嗪-6-基)苯基]甲磺醯胺；

N-[4-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]
 吡嗪-6-基)苯基]甲磺醯胺；

[(2S) -4-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡
 嗪-8-基]胺基}苯基)嗎啉-2-基]甲醇；

[(2R) -4-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]
 吡嗪-8-基]胺基}苯基)嗎啉-2-基]甲醇；

6-(8-{[4-(2-羥基-2-甲基丙基)苯基]胺基}咪唑並
 [1,2-a]吡嗪-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並吡嗪-3-酮；

1- (4- { [6- (3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔咩-7-基) 咪唑並
[1,2-a]吡咩-8-基]胺基 }-2-甲氧基苯基) -4-甲基哌啶-4-醇
;

N- (2-羥基乙基) -N-甲基-6- (8- { [4- (嗎啉-4-基)
苯基]胺基 }咪唑並 [1,2-a]吡咩-6-基) -1H-吲哚-3-羧醯胺
;

6'- (8- { [4- (嗎啉-4-基) 苯基]胺基 }咪唑並 [1,2-a]吡
咩-6-基) -1',2'-二氫螺 [環丙烷-1,3'-吲哚] -2'-酮 ;

3-甲基-1- (4- { [6- (1-甲基-1H-吲哚-6-基) 咪唑並
[1,2-a]吡咩-8-基]胺基 }苯基) 四氫吡啶-3-醇 ;

4- { [6- (1H-吲哚-6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡咩-8-基]胺基
}-2-甲氧基酚 ;

N- [3-甲氧基-4- (嗎啉-4-基) 苯基]-6- (6-甲氧基吡
啶-3-基) 咪唑並 [1,2-a]吡咩-8-胺 ;

6- (1H-1,2,3-苯並三唑-6-基) -N- [4- (嗎啉-4-基)
苯基]咪唑並 [1,2-a]吡咩-8-胺 ;

N,N-二甲基-6- (8- { [4- (嗎啉-4-基) 苯基]胺基 }咪唑
並 [1,2-a]吡咩-6-基) -1H-吲哚-3-羧醯胺 ;

N- [3-甲氧基-4- (嗎啉-4-基) 苯基]-6- (5-甲氧基吡
啶-3-基) 咪唑並 [1,2-a]吡咩-8-胺 ;

6- (8- { [4- (嗎啉-4-基) 苯基]胺基 }咪唑並 [1,2-a]吡
咩-6-基) -1H-吲哚-3-胺 ;

7- [8- ({ 4- [(3S) -3-羥基吡咯啶-1-基] 苯基 }胺基)
咪唑並 [1,2-a]吡咩-6-基]-1H,2H,3H-吡啶並 [2,3-

b][1,4]噁吡-2-酮；

4- {[6- (1H-吡啶-6-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡啶-8-基] 胺基 }-N-甲基-N- (噁烷-4-基) 苯醯胺；

6- (3-乙基-1H-吡啶-6-基) -N-{4-[2-甲基-1- (嗎啉-4-基) 丙-2-基] 苯基} 咪唑並 [1,2-a] 吡啶-8-胺；

2,2-二氟-6- (8-{[4- (嗎啉-4-基) 苯基] 胺基} 咪唑並 [1,2-a] 吡啶-6-基) -3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-3-酮；

1- (4-{[6- (3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-7-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡啶-8-基] 胺基 }-2-甲氧基苯基) -3-甲基四氫吡啶-3-醇；

6- (1H-吡啶-2-基) -N-[4- (嗎啉-4-基) 苯基] 咪唑並 [1,2-a] 吡啶-8-胺；

(3S) -1- (4-{[6- (3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-7-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡啶-8-基] 胺基 }-2-甲氧基苯基) 吡咯啉-3-醇；

1- (4-{[6- (4-氟-1H-吡啶-6-基) 咪唑並 [1,2-a] 吡啶-8-基] 胺基 } 苯基) -3-甲基四氫吡啶-3-醇；

6- (1H-吡啶-6-基) -N-[4- (2H-1,2,3,4-四唑-5-基) 苯基] 咪唑並 [1,2-a] 吡啶-8-胺；

7- (8-{[4- (3-羥基-3-甲基四氫吡啶-1-基) 苯基] 胺基 } 咪唑並 [1,2-a] 吡啶-6-基) -1H,2H,3H-吡啶並 [2,3-b][1,4]噁吡-2-酮；

6- (1H-吡啶-6-基) -N-[3-甲氧基-4- (2-甲氧基乙氧基) 苯基] 咪唑並 [1,2-a] 吡啶-8-胺；

6- (2-乙基-1,2,3,4-四氫異喹啉-6-基) -N-[4- (嗎啉-4-基) 苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺 ;

4- {[6- (3,3-二甲基-2-側氧基-2,3-二氫-1H-吲哚-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基} -N-丙基苯醯胺 ;

6- (8- {[3-乙氧基-4- (嗎啉-4-基) 苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基) -3,3-二甲基-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮 ;

6- (1H-吲哚-3-基) -N-[4- (嗎啉-4-基) 苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺 ;

6- (1,3-苯並噻唑-5-基) -N-{4-[2-甲基-1- (嗎啉-4-基) 丙-2-基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺 ;

(3E) -6- (8- {[4- (嗎啉-4-基) 苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基) -3- (1,3-噻唑-4-基亞甲基) -2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮 ;

4- {[6- (1H-吲哚-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基} -N- (喹烷-4-基) 苯醯胺 ;

6- (2-甲基-1,3-苯並噻唑-5-基) -N-{4-[2-甲基-1- (嗎啉-4-基) 丙-2-基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺 ;

6- (2,3-二氫-1,4-苯並二噁啶-6-基) -N-[3-甲氧基-4- (嗎啉-4-基) 苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺 ;

6- (1H-吲哚-6-基) -N-[4- (2-甲氧基乙氧基) 苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺 ;

6- (8- {[4- (嗎啉-4-基) 苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基) 喹啉-2-胺 ;

6- (8- {[4- (4-羥基-4-甲基哌啶-1-基) 苯基]胺基}咪

唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,3-二甲基-2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮；

6-(1H-吡啶-6-基)-N-{4-[(2S)-四氫呋喃-2-基甲氧基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

6-(3-乙基-1H-吡啶-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

N-(2,3-二氫-1,4-苯並二嘔啶-6-基)-6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

N-(2H-1,3-苯並二嘔啶-5-基)-6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

1-(2-乙氧基-4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-4-甲基哌啶-4-醇；

6-[8-({4-[(3S)-3-羥基吡咯啶-1-基]苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基]-3,3-二甲基-2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮；

6-(8-{[4-(3-羥基-3-甲基四氫吡啶-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,3-二甲基-2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮；

6-(2H-1,3-苯並二嘔啶-5-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

6-(1H-吡啶-6-基)-N-{4-[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

6-(1H-吡啶-6-基)-N-[4-(吡啶-4-基氧)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

(3E) -6- (8- { [4- (嗎 啉 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -6-基) -3- (吡 啶 -4-基 亞 甲 基) -2,3-二 氫 -1H- 吲 哚 -2-酮 ；

4- { [6- (1H-吲 哚 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺 基 }-N- (環 氧 丙 烷 -3-基) 苯 醯 胺 ；

6- { 3- [(二 乙 基 胺 基) 甲 基]-1H-吲 哚 -6-基 }-N- [4- (嗎 啉 -4-基) 苯 基]咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

1- [(4- { [6- (1H-吲 哚 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺 基 } 苯 基) 羧 基]-3-甲 基 四 氫 吡 啶 -3-醇 ；

[6- (8- { [4- (嗎 啉 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -6-基) -1H-吲 哚 -3-基]甲 醇 ；

N- [4- (嗎 啉 -4-基) 苯 基]-6- (1H-吡 啶 -4-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

6- (4-氟 -1H-吲 哚 -6-基) -N- [4- (嗎 啉 -4-基) 苯 基] 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

N- [4- (嗎 啉 -4-基) 苯 基]-6- { 1H,2H,3H-吡 啶 並 [2,3-b] [1,4]噁 咩 -6-基 }咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

N- [4- (嗎 啉 -4-基) 苯 基]-6- (1,3-噻 唑 -5-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

{ 4- [(4- { [6- (1H-吲 哚 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺 基 } 苯 基) 羧 基]嗎 啉 -2-基 }甲 醇 ；

1- [(4- { [6- (1H-吲 哚 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺 基 } 苯 基) 羧 基]哌 啶 -4-醇 ；

N-乙 基 -N- (2-羥 基 乙 基) -4- { [6- (1H-吲 哚 -6-基)

咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯醯胺；

2-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-甲氧基苯氧基)-N-甲基乙醯胺；

7-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1,2-二氫喹啉-2-酮；

6-(2-乙基-1,2,3,4-四氫異喹啉-7-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

1-[(4-{[6-(1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)羰基]-4-甲基哌啶-4-醇；

4-{[6-(1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-甲氧基苯甲酸；

6-(1H-吲唑-6-基)-N-{4-[(4-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

1-[(4-{[6-(1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)羰基]四氫吡啶-3-醇；

3,3-二甲基-6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮；

6-(1H-吲唑-6-基)-N-[4-(1-甲基哌啶-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

2-(4-{[6-(4-氟-1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-2-甲基丙-1-醇；

2-[乙基(4-{[6-(4-氟-1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)胺基]乙-1-醇；

6- (1H-吡啶 -7-基) -N-[4- (嗎啉 -4-基) 苯基]咪唑 並 [1,2-a]吡 啶-8-胺 ；

6-[8- ({4-[乙基 (2-羥基 乙基) 胺基]苯基 }胺基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 啶-6-基]-3,3-二 甲基 -2,3-二 氫 -1H-吡 啶 -2-酮 ；

N-{4-[2- (二 甲基 胺基) 乙 氧基]苯基 }-6- (1H-吡 啶 - 6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 啶-8-胺 ；

6- (3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嘔 啶-6-基) -N-{4-[2- (二 甲基 胺基) 乙 氧基]苯基 }咪 唑 並 [1,2-a]吡 啶-8-胺 ；

1- (4-{[6- (3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嘔 啶-6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 啶-8-基]胺基 }苯基) -3-甲 基 四 氫 吡 啶 -3-醇 ；

2-[6- (8-{[4- (嗎 啉 -4-基) 苯基]胺基 }咪 唑 並 [1,2-a] 吡 啶-6-基) -2H-吡 啶 -2-基]乙 -1-醇 ；

3- (2-乙 氧基 -4-{[6- (1H-吡 啶 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 啶-8-基]胺基 }苯 氧基) -2,2-二 甲基 丙 -1-醇 ；

3- (4-{[6- (1H-吡 啶 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 啶-8-基] 胺基 }苯 氧基) -2,2-二 甲基 丙 -1-醇 ；

2- (4-{[6- (1H-吡 啶 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 啶-8-基] 胺基 }-2-甲 氧基 苯 氧基) -N-甲 基 乙 醯 胺 ；

2- (4-{[6- (3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嘔 啶-6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 啶-8-基]胺基 }苯 氧基) -N-甲 基 乙 醯 胺 ；

2- (4-{[6- (1H-吡 啶 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 啶-8-基] 胺基 }苯 氧基) -N-甲 基 乙 醯 胺 ；

2- (4-{[6- (1H-吡 啶 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 啶-8-基]

胺基 } 苯氧基) 乙酸 ;

N- (2-羥基乙基) -4- { [6- (1H-吡啶 -6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]胺基 } -2-甲氧基苯醯胺 ;

6- (1,3-苯並噻唑 -5-基) -N- [3-乙氧基 -4- (嗎啉 -4-基) 苯基]咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

6- (1H-吡啶 -6-基) -N- {3-甲氧基 -4- [(2R) -四氫呋喃 -2-基甲氧基]苯基 }咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

6- (1H-吡啶 -6-基) -N- {4- [(2R) -四氫呋喃 -2-基甲氧基]苯基 }咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

6- (8- { [4- (3-羥基 -3-甲基四氫吡喃 -1-基) 苯基]胺基 }咪唑並 [1,2-a]吡啶-6-基) -3,4-二氫 -2H-1,4-苯並嘔吩-3-酮 ;

6- (1H-吡啶 -6-基) -N- [4- (嗎啉 -4-基羰基) 苯基]咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺 ;

N- (2-羥基乙基) -4- { [6- (1H-吡啶 -6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]胺基 } -N-甲基苯醯胺 ;

2- [(2-乙氧基 -4- { [6- (1H-吡啶 -6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]胺基 }苯基) (甲基) 胺基]乙 -1-醇 ;

N- [2- (二甲基胺基) 乙基] -4- { [6- (1H-吡啶 -6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]胺基 } -N-甲基苯醯胺 ;

1- (2-氟 -4- { [6- (1H-吡啶 -6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]胺基 }苯基) -3-甲基四氫吡喃 -3-醇 ;

(3S) -1- (4- { [6- (4-氟 -1H-吡啶 -6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]胺基 }苯基) 吡咯啉 -3-醇 ;

2-[6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基)-1H-吲唑-1-基]乙-1-醇；

6-(8-{[4-(3-羥基-3-甲基四氫吡啶-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基)-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮；

N-[6-(1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]-2-甲基-1,2,3,4-四氫異喹啉-6-胺；

N-[3-乙氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(4-氟-1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-胺；

1-(2-乙氧基-4-{[6-(1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基}苯氧基)-2-甲基丙-2-醇；

(3R)-3-(4-{[6-(1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基}苯基)-1,4-二甲基哌啶-2-酮；

N-(2-羥基乙基)-4-{[6-(1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基}苯醯胺；

6-(8-{[3-乙氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基)-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮；

6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔咩-6-基)-N-[3-乙氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡咩-8-胺；

1-(4-{[6-(1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基}苯基)-N,N-二甲基哌啶-4-胺；

1-(4-{[6-(1,3-苯並噻唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基}苯氧基)-2-甲基丙-2-醇；

(3R)-1-(2-乙氧基-4-{[6-(1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基}苯基)吡咯啉-3-醇；

2- (4- {[6- (1H-吲唑 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-基]
胺 基 } 苯 氧 基) 乙 -1-醇 ;

1- (2-乙 氧 基 -4- {[6- (1H-吲唑 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]
吡 咩 -8-基]胺 基 } 苯 基) -3-甲 基 四 氫 吡 啶 -3-醇 ;

1- (4- {[6- (1H-吲唑 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-基]
胺 基 } -2-甲 氧 基 苯 基) -3-甲 基 四 氫 吡 啶 -3-醇 ;

4- {[6- (1H-吲唑 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-基]胺 基
} 苯 甲 酸 ;

N-[3-乙 氧 基 -4- (4-乙 基 哌 咩 -1-基) 苯 基]-6- (1H-吲
唑 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-胺 ;

4- {[6- (1H-吲唑 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-基]胺 基
}-N-丙 基 苯 醯 胺 ;

1- (4- {[6- (4-氟 -1H-吲唑 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -
8-基]胺 基 } 苯 基) -4-甲 基 哌 啶 -4-醇 ;

3- (4- {[6- (1H-吲唑 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-基]
胺 基 } -2-甲 氧 基 苯 氧 基) -2,2-二 甲 基 丙 -1-醇 ;

6- (4-氟 -1H-吲唑 -6-基) -N-[4- (1,4-氧 雜 氮 吡 咩 -4-基
) 苯 基]咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-胺 ;

6- (8- {[3-乙 氧 基 -4- (嗎 咭 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 唑 並
[1,2-a] 吡 咩 -6-基) -3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嗎 咭 -3-酮 ;

1- (4- {[6- (3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嗎 咭 -6-基) 咪 唑 並
[1,2-a] 吡 咩 -8-基]胺 基 } 苯 氧 基) -2-甲 基 丙 -2-醇 ;

2-甲 基 -1- (4- {[6- (1-甲 基 -1H-1,3-苯 並 二 唑 -6-基)
咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-基]胺 基 } 苯 氧 基) 丙 -2-醇 ;

6- (8- { [4- (2-羥基-2-甲基丙氧基) 苯基] 胺基 } 咪唑
並 [1,2-a] 吡 咩 -6-基) -2,3-二 氫 -1H-吲 哚 -2-酮 ；

N- [3-氟 -4- (嗎 啉 -4-基) 苯基] -6- (1H-吲 哚 -6-基)
咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-胺 ；

1- (4- { [6- (1,3-苯 並 噻 唑 -5-基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -
8-基] 胺基 } 苯基) -3-甲基 四 氫 吡 啶 -3-醇 ；

N- [6- (1H-吲 哚 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-基] -
1,2,3,4-四 氫 異 喹 啉 -6-胺 ；

N- [6- (1H-吲 哚 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-基] -2,3-
二 氫 -1H-吲 哚 -6-胺 ；

1- [6- (8- { [4- (嗎 啉 -4-基) 苯基] 胺基 } 咪 唑 並 [1,2-a]
吡 咩 -6-基) -1,2,3,4-四 氫 異 喹 啉 -2-基] 乙 -1-酮 ；

1- [7- (8- { [4- (嗎 啉 -4-基) 苯基] 胺基 } 咪 唑 並 [1,2-a]
吡 咩 -6-基) -1,2,3,4-四 氫 異 喹 啉 -2-基] 乙 -1-酮 ；

N- [4- (嗎 啉 -4-基) 苯基] -6- { 1H,2H,3H-吡 啶 並 [2,3-
b] [1,4] 嘔 咩 -7-基 } 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-胺 ；

6- (1-甲基 -1H-吲 哚 -6-基) -N- [4- (嗎 啉 -4-基) 苯基
] 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-胺 ；

N- [4- (嗎 啉 -4-基) 苯基] -6- { 2H,3H,4H-吡 啶 並 [3,2-
b] [1,4] 嘔 咩 -7-基 } 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-胺 ；

6- (8- { [4- (嗎 啉 -4-基) 苯基] 胺基 } 咪 唑 並 [1,2-a] 吡
咩 -6-基) -1H,2H,3H-吡 啶 並 [2,3-b] [1,4] 嘔 咩 -2-酮 ；

(3S) -1- (4- { [6- (3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嘔 咩 -7-基
) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8-基] 胺基 } 苯基) -3-甲基 哌 啶 -3-醇

;

5- (8- { [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] 胺 基 } 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 啶 - 6- 基) - 2, 3- 二 氫 - 1 H- 吡 啶 - 2- 酮 ;

1- 甲 基 - 6- (8- { [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] 胺 基 } 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 啶 - 6- 基) - 2, 3- 二 氫 - 1 H- 吡 啶 - 2- 酮 ;

6- (8- { [4- (2- 羥 基 - 2- 甲 基 丙 氧 基) 苯 基] 胺 基 } 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 啶 - 6- 基) - 3, 4- 二 氫 - 2 H- 1, 4- 苯 並 嘧 啶 - 3- 酮 ;

2- [4- (4- { [6- (1 H- 吡 啶 - 6- 基) 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 啶 - 8- 基] 胺 基 } 苯 基) 嘧 啶 - 1- 基] 乙 - 1- 醇 ;

6- (1 H- 吡 啶 - 4- 基) - N- [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 啶 - 8- 胺 ;

N- [3- 乙 氧 基 - 4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] - 6- (1- 甲 基 - 1 H- 1, 3- 苯 並 二 唑 - 6- 基) 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 啶 - 8- 胺 ;

6- (1 H- 吡 啶 - 6- 基) - N- [4- (嘧 啶 - 1- 基) 苯 基] 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 啶 - 8- 胺 ;

N- [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] - 6- (1, 2, 3, 4- 四 氫 異 喹 啉 - 7- 基) 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 啶 - 8- 胺 ;

N- [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] - 6- (1, 2, 3, 4- 四 氫 異 喹 啉 - 6- 基) 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 啶 - 8- 胺 ;

7- (8- { [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] 胺 基 } 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 啶 - 6- 基) - 1 H, 2 H, 3 H- 吡 啶 並 [2, 3- b] [1, 4] 嘧 啶 - 2- 酮 ;

6- { 1- 甲 基 - 1 H- 吡 咯 並 [3, 2- b] 吡 啶 - 6- 基 } - N- [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 啶 - 8- 胺 ;

6- (1- 甲 基 - 1 H- 吡 啶 - 6- 基) - N- [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基

]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

6-(1,3-苯並噁唑-5-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

6-(4-甲基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-7-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

6-(4-甲基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

6-[8-({4-[(3S)-3-羥基吡咯啉-1-基]苯基 } 胺基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基]-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-3-酮；

(3R)-1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-7-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-3-甲基哌啶-3-醇；

6-[8-({4-[(3S)-3-羥基-3-甲基哌啶-1-基]苯基 } 胺基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基]-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-3-酮；

6-[8-({4-[(3R)-3-羥基-3-甲基哌啶-1-基]苯基 } 胺基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基]-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-3-酮；

6-[8-({4-[(3S)-3-羥基-3-甲基哌啶-1-基]苯基 } 胺基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基]-2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮；

6-[8-({4-[(3R)-3-羥基-3-甲基哌啶-1-基]苯基 } 胺基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基]-2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮；

(3R)-1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-6-基

) 咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-3-甲基哌啶-3-醇
;

(3S)-3-甲基-1-(4-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二
唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)哌啶-3-醇
;

(3R)-3-甲基-1-(4-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二
唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)哌啶-3-醇
;

(3R)-3-甲基-1-(4-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二
唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)哌啶-3-醇
;

6-(8-{[4-(4-乙基哌啶-1-基)苯基]胺基}咪唑並
[1,2-a]吡啶-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁啶-3-酮;

6-(1,3-苯並噻唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]
咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺;

6-(1,3-苯並噻唑-5-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]
咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺;

6-(1,3-苯並噁唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪
唑並[1,2-a]吡啶-8-胺;

6-(1H-吲唑-5-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並
[1,2-a]吡啶-8-胺;

(3S)-1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁啶-6-基
)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-3-甲基哌啶-3-醇
;

(3S) -3- 甲基 -1- (4- { [6- (1- 甲基 -1H-1,3- 苯 並 二
 唑 -6- 基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8- 基] 胺 基 } 苯 基) 哌 啶 -3- 醇
 ;

1- (4- { [6- (1H- 吡 啶 -6- 基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8- 基]
 胺 基 } 苯 基) -3- 甲基 四 氫 吡 啶 -3- 醇 ;

N- { 4- [(4- 乙 基 哌 咩 -1- 基) 甲 基] 苯 基 } -6- (1- 甲 基 -
 1H-1,3- 苯 並 二 唑 -6- 基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8- 胺 ;

2- [乙 基 (4- { [6- (1H- 吡 啶 -6- 基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -
 8- 基] 胺 基 } 苯 基) 胺 基] 乙 -1- 醇 ;

1- (4- { [6- (3,4- 二 氫 -2H-1,4- 苯 並 嘧 咩 -7- 基) 咪 唑 並
 [1,2-a] 吡 咩 -8- 基] 胺 基 } 苯 基) 四 氫 吡 啶 -3- 醇 ;

7- (8- { [4- (嗎 啉 -4- 基) 苯 基] 胺 基 } 咪 唑 並 [1,2-a] 吡
 咩 -6- 基) -2H,3H,4H- 吡 啶 並 [3,2-b] [1,4] 嘧 咩 -3- 酮 ;

6- (1- 甲 基 -1H- 吡 啶 -5- 基) -N- [4- (嗎 啉 -4- 基) 苯 基
] 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8- 胺 ;

1- (4- { [6- (1H- 吡 啶 -6- 基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8- 基]
 胺 基 } 苯 氧 基) -2- 甲 基 丙 -2- 醇 ;

6- (3,4- 二 氫 -2H-1,4- 苯 並 嘧 咩 -6- 基) -N- [4- (嗎 啉 -
 4- 基) 苯 基] 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8- 胺 ;

4- (4- { [6- (1H- 吡 啶 -6- 基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8- 基]
 胺 基 } 苯 基) 哌 咩 -2- 酮 ;

6- (1- 甲 基 -1H-1,3- 苯 並 二 唑 -6- 基) -N- [4- (嗎 啉 -4-
 基 甲 基) 苯 基] 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8- 胺 ;

6- (1H-1,3- 苯 並 二 唑 -6- 基) -N- [4- (嗎 啉 -4- 基) 苯

基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)四氫吡啶-3-醇；

6-(1H-吡啶-6-基)-N-[4-(1,4-氧雜氮吡-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

(3S)-1-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-3-甲基哌啶-3-醇；

(3R)-1-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-3-甲基哌啶-3-醇；

(3S)-1-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-3-甲基吡咯啶-3-醇；

(3R)-1-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-3-甲基吡咯啶-3-醇；

6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-3-酮；

6-(8-{[4-(3-羥基四氫吡啶-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮；

6-(8-{[4-(3-羥基-3-甲基吡咯啶-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-3-酮；

6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-7-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

1- (4- { [6- (3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔咩-7-基) 咪唑並
[1,2-a]吡咩-8-基]胺基 } 苯基) -4-甲基哌啶-4-醇 ;

1- (4- { [6- (1H-吲哚-6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡咩-8-基]
胺基 } 苯基) -4-甲基哌啶-4-醇 ;

1- (4- { [6- (1H-吲哚-6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡咩-8-基]
胺基 } 苯基) 四氫吡啶-3-醇 ;

1- (4- { [6- (1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基) 咪唑並
[1,2-a]吡咩-8-基]胺基 } 苯基) 四氫吡啶-3-醇 ;

1- (4- { [6- (1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基) 咪唑並
[1,2-a]吡咩-8-基]胺基 } 苯基) 四氫吡啶-3-醇 ;

6- (1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基) -N-[4- (嗎啉-4-
基) 苯基]咪唑並 [1,2-a]吡咩-8-胺 ;

6- (8- { [4- (嗎啉-4-基) 苯基]胺基 } 咪唑並 [1,2-a]吡
咩-6-基) -2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮 ;

6- (8- { [4- (3-羥基四氫吡啶-1-基) 苯基]胺基 } 咪唑
並 [1,2-a]吡咩-6-基) -3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔咩-3-酮 ;

5- (8- { [4- (嗎啉-4-基) 苯基]胺基 } 咪唑並 [1,2-a]吡
咩-6-基) -2,3-二氫-1,3-苯並嘔咩-2-酮 ;

4- { [6- (1H-吲哚-6-基) 咪唑並 [1,2-a]吡咩-8-基]胺基
} -N,N-二甲基苯-1-磺醯胺 ;

6- (1H-吲哚-6-基) -N- { 4-[4- (丙-2-基) 哌咩-1-基]
苯基 } 咪唑並 [1,2-a]吡咩-8-胺 ;

2- (4- { [6- (3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔咩-7-基) 咪唑並
[1,2-a]吡咩-8-基]胺基 } 苯基) -2-甲基丙-1-醇 ;

4- (4- { [6- (1H-吡啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啶 -8-基] 胺基 } 苯基) 硫代嗎啉 -1,1-二 酮 ; 及

6- (1H-吡啶 -6-基) -N-[4- (2-甲 基嗎啉 -4-基) 苯基] 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啶 -8-胺 ,

及彼等之藥學上可接受之鹽。

亦提供至少一種化學實體，其選自：

N- (4-乙 氧基 -3-甲 氧基 苯基) -6- (1H-吡啶 -6-基) -5-甲 基咪唑 並 [1,2-a] 吡 啶 -8-胺 ;

1- (4- { [6- (1H-吡啶 -6-基) -5-甲 基咪唑 並 [1,2-a] 吡 啶 -8-基] 胺基 } 苯基) -4-甲 基哌啶 -4-醇 ;

N,6-雙 [4- (嗎啉 -4-基) 苯基] 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啶 -8-胺

;

2-[1- (4- { [6- (1H-吡啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啶 -8-基] 胺基 } 苯基) 哌啶 -4-基] 乙 -1-醇 ;

6-[3- (嗎啉 -4-基) 苯基] -N-[4- (嗎啉 -4-基) 苯基] 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啶 -8-胺 ;

2-[6- (8- { [4- (嗎啉 -4-基) 苯基] 胺基 } 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啶 -6-基) -1H-吡 啶 -3-基] 乙 -1-醇 ;

[1- (4- { [6- (1H-吡啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啶 -8-基] 胺基 } 苯基) 哌啶 -4-基] 甲 醇 ;

1-[4- (4- { [6- (1H-吡啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啶 -8-基] 胺基 } 苯基) 哌 啶 -1-基] 乙 -1-酮 ;

6- (5-氯 -8- { [3-甲 氧基 -4- (嗎啉 -4-基) 苯基] 胺基 } 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啶 -6-基) -2,3-二 氯 -1H-吡 啶 -2-酮 ;

5-氯-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

N-甲基-5-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)吡啶-3-胺；

6-(1H-吲唑-6-基)-N-(4-{7-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基}苯基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

6-(2-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

5-(8-{[4-(3-羥基-3-甲基四氫吡啶-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1-甲基-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮；

N-{4-[(2R,6S)-2,6-二甲基嗎啉-4-基]苯基}-6-(1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

N-[6-(1H-吲唑-6-基)-5-甲基咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]-5-(嗎啉-4-基)吡啶-2-胺；

[(2R)-6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-2-基]甲醇；

6-(1H-吲唑-6-基)-N-[3-(甲氧基甲基)-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

7-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1,2,3,4-四氫喹啉-2-酮；

5-氯-6-(1H-吲唑-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

1- (4- { [6- (1H- 吲 唑 - 6- 基) 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 - 8- 基] 胺 基 } 苯 基) - 3- 甲 基 四 氫 吡 啶 - 3- 胺 ;

[(2S) - 6- (8- { [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] 胺 基 } 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 - 6- 基) - 3, 4- 二 氫 - 2H- 1, 4- 苯 並 嘧 啶 - 2- 基] 甲 醇 ;

7- (8- { [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] 胺 基 } 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 - 6- 基) - 1, 2, 3, 4- 四 氫 喹 啉 - 2- 酮 ;

5- { [6- (1H- 吲 唑 - 6- 基) 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 - 8- 基] 胺 基 } - 2- (嗎 啉 - 4- 基) 苄 腈 ;

6- (3, 4- 二 氫 - 2H- 1, 4- 苯 並 嘧 啶 - 6- 基) - 3- 甲 基 - N- [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 - 8- 胺 ;

N- [3- 甲 氧 基 - 4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] - 3- 甲 基 - 6- { 1H- 吡 咯 並 [3, 2- b] 吡 啶 - 6- 基 } 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 - 8- 胺 ;

5- 甲 基 - 6- (2- 甲 基 - 1H- 1, 3- 苯 並 二 唑 - 6- 基) - N- [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 - 8- 胺 ;

5- 乙 基 - 6- (1H- 吲 唑 - 6- 基) - N- [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 - 8- 胺 ;

1- 甲 基 - 6- (8- { [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] 胺 基 } 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 - 6- 基) - 2, 3- 二 氫 - 1H- 1, 3- 苯 並 二 唑 - 2- 酮 ;

6- (3- 甲 基 - 8- { [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] 胺 基 } 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 - 6- 基) - 2, 3- 二 氫 - 1H- 吲 哚 - 2- 酮 ;

1, 3- 二 甲 基 - 5- (8- { [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] 胺 基 } 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 - 6- 基) - 2, 3- 二 氫 - 1H- 1, 3- 苯 並 二 唑 - 2- 酮 ;

2- [6- (8- { [4- (嗎 啉 - 4- 基) 苯 基] 胺 基 } 咪 唑 並 [1, 2- a] 吡 嘧 - 6- 基) - 2, 3- 二 氫 - 1H- 1, 3- 苯 並 二 唑 - 2- 酮]

吡 咩 -6-基) -1H-吲 咭 -3-基]丙 -2-醇 ;

6- (4-氟 -1H-吲 咭 -6-基) -N-[4- (嗎 咭 -4-基) 苯 基]
咪 咭 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

5- {[6- (1H-吲 咭 -6-基) 咪 咭 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺 基
}-2- (嗎 咭 -4-基) 苯 醯 胺 ;

5- (8- {[3-甲 氧 基 -4- (嗎 咭 -4-基) 苯 基]胺 基 }-5-甲
基 咪 咭 並 [1,2-a]吡 咩 -6-基) -2,3-二 氫 -1H-1,3-苯 並 二 咭 -2-
酮 ;

5- (5-甲 基 -8- {[4- (嗎 咭 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 咭 並
[1,2-a]吡 咩 -6-基) -2,3-二 氫 -1H-1,3-苯 並 二 咭 -2-酮 ;

[2- (8- {[4- (嗎 咭 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 咭 並 [1,2-a]吡
咩 -6-基) 苯 基]甲 醇 ;

1-甲 基 -5- (8- {[4- (嗎 咭 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 咭 並
[1,2-a]吡 咩 -6-基) -2,3-二 氫 -1H-1,3-苯 並 二 咭 -2-酮 ;

2-[6- (8- {[4- (嗎 咭 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 咭 並 [1,2-a]
吡 咩 -6-基) -3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嗎 咩 -4-基]乙 -1-醇 ;

(3R) -2,2-二 甲 基 -6- (8- {[4- (嗎 咭 -4-基) 苯 基]胺
基 }咪 咭 並 [1,2-a]吡 咩 -6-基) -2,3-二 氫 -1H-吲 咭 -3-醇 ;

6- (1H-吲 咭 -6-基) -N- {3-甲 氧 基 -4-[4- (2-甲 氧 基 乙
基) 哌 咩 -1-基]苯 基 }咪 咭 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

2- (4- {2-甲 氧 基 -4-[(6- {1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -6-基
}咪 咭 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基) 胺 基]苯 基 }哌 咩 -1-基) 乙 -1-醇
;

1-[6- (8- {[4- (嗎 咭 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 咭 並 [1,2-a]

吡 咩 -6-基) -1H-吲 啉 -3-基]乙 -1-醇 ;

2-[6-(8-{[4-(嗎 咭 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 啉 並 [1,2-a]

吡 咩 -6-基) -1H-吲 啉 -3-基]乙 -1-醇 ;

2-{[5-(8-{[4-(嗎 咭 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 啉 並 [1,2-a]吡 咩 -6-基) 吡 啶 -3-基]胺 基 }乙 -1-醇 ;

N-[3-甲 氧 基 -4-(嗎 咭 -4-基) 苯 基]-5-甲 基 -6-{1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -6-基 }咪 啉 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

(3S)-2,2-二 甲 基 -6-(8-{[4-(嗎 咭 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 啉 並 [1,2-a]吡 咩 -6-基) -2,3-二 氫 -1H-吲 啉 -3-醇 ;

N-{4-[4-(3-氟 丙 基) 哌 咩 -1-基]苯 基 }-6-(1H-吲 啉 -6-基) 咪 啉 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

6-(1H-吲 啉 -6-基) -N-[4-(嗎 烷 -4-基) 苯 基]咪 啉 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

N-[4-(4-氟 哌 啶 -1-基) 苯 基]-6-(1H-吲 啉 -6-基) 咪 啉 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

6-(1H-吲 啉 -6-基) -N-[3-(2-甲 氧 基 乙 氧 基) -4-(嗎 咭 -4-基) 苯 基]咪 啉 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

6-(1H-吲 啉 -6-基) -N-[4-(4H-1,2,4-三 唑 -4-基) 苯 基]咪 啉 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

N-[4-(3,3-二 氟 吡 咯 啶 -1-基) 苯 基]-6-(1H-吲 啉 -6-基) 咪 啉 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

6-(1H-吲 啉 -6-基) -N-[3-甲 氧 基 -4-(嗎 咭 -4-基) 苯 基]-5-甲 基 咪 啉 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

2,2-二 甲 基 -6-(8-{[4-(嗎 咭 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 啉

並 [1,2-a]吡 咩 -6-基) -2,3-二 氫 -1H-吲 哚 -3-酮 ；

6- (1H-吲 哚 -6-基) -N-[3-甲 氧 基 -4- (甲 氧 基 甲 基)
苯 基]咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

1- (4- {[6- (1H-吲 哚 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]
胺 基 }-2-甲 氧 基 苯 基) -2-甲 基 丙 -2-醇 ；

[(2S) -4- (4- {[6- (3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嗎 咩 -6-基)
咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺 基 }苯 基) 嗎 咩 -2-基]甲 醇 ；

N-[4- (4,4-二 氟 哌 啶 -1-基) 苯 基]-6- (1H-吲 哚 -6-基)
咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

6- (1H-吲 哚 -6-基) -N-{3-甲 氧 基 -4-[(2-甲 氧 基 乙 氧
基) 甲 基]苯 基 }咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

2-[2- (嗎 咩 -4-基) -5-[(6-{1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -
6-基 }咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基) 胺 基]苯 氧 基]乙 -1-醇 ；

6- (1H-吲 哚 -6-基) -N-[4- (3-甲 氧 基 -3-甲 基 四 氫 吡
啶 -1-基) 苯 基]咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

5- (8- {[4- (嗎 咩 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 唑 並 [1,2-a]吡
咩 -6-基) 吡 啶 -3-胺 ；

N-[4- (嗎 咩 -4-基) 苯 基]-6- (1,5-萘 啶 -3-基) 咪 唑
並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

3-乙 基 -1- (4- {[6- (1H-吲 哚 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡
咩 -8-基]胺 基 }苯 基) 四 氫 吡 啶 -3-醇 ；

N-[4- (3-氟 -3-甲 基 四 氫 吡 啶 -1-基) 苯 基]-6- (1H-吲
哚 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ；

N-[4- (3,3-二 氟 哌 啶 -1-基) 苯 基]-6- (1H-吲 哚 -6-基

) 咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

[(2R) -4- (4- { [6- (3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-6-基

) 咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)嗎啉-2-基]甲醇；

N-[4- (3,3-二氟四氫吡啶-1-基)苯基]-6- (1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

(3S) -1- (4- { [6- (3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基} -2-甲氧基苯基)吡咯啉-3-醇；

(3R) -1- (4- { [6- (3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基} -2-甲氧基苯基)吡咯啉-3-醇；

N-[4- (3-氟四氫吡啶-1-基)苯基]-6- (1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

6- (3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-6-基) -N-[3-甲氧基-4- (嗎啉-4-基)苯基]-5-甲基咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

N,N-二乙基-6- (8- { [4- (嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基) -1H-吡啶-3-胺；

(3S) -3-羥基-3-甲基-6- (8- { [4- (嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基) -2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮；

N-[4- (嗎啉-4-基)苯基]-6- (喹啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

(3R) -3-羥基-3-甲基-6- (8- { [4- (嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基) -2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮

;

6- (1H-吡啶 -6-基) -N- { 3-甲氧基 -4- [(2S) -四氫呋喃 -2-基 甲氧基] 苯基 } 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啞 -8-胺 ;

6- (8- { [3-甲氧基 -4- (嗎啉 -4-基) 苯基] 胺基 } -5-甲基 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啞 -6-基) -2,3-二氫 -1H-吡 啶 -2-酮 ;

6- (8- { [3-甲氧基 -4- (嗎啉 -4-基) 苯基] 胺基 } -5-甲基 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啞 -6-基) -3,4-二氫 -2H-1,4-苯 並 嗎 啞 -3-酮 ;

(3S) -1- { 4- [(6- { 1H,2H,3H-吡 啶 並 [2,3-b] [1,4] 嗎 啞 -7-基 } 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啞 -8-基) 胺基] 苯基 } 吡 咯 啶 -3-醇 ;

(3R) -1- (4- { [6- (3,4-二氫 -2H-1,4-苯 並 嗎 啞 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啞 -8-基] 胺基 } 苯基) 吡 咯 啶 -3-醇 ;

6- [8- ({ 4- [(3R) -3-羥基 吡 咯 啶 -1-基] -3-甲氧基 苯基 } 胺基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啞 -6-基] -2,3-二氫 -1H-吡 啶 -2-酮 ;

N- [4- (1H-咪唑 -1-基) 苯基] -6- (1H-吡 啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啞 -8-胺 ;

6- (1H-吡 啶 -6-基) -N- [4- (1H-咪唑 -1-基) 苯基] 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啞 -8-胺 ;

6- [8- ({ 4- [(3R) -3-羥基 吡 咯 啶 -1-基] 苯基 } 胺基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啞 -6-基] -2,3-二氫 -1H-吡 啶 -2-酮 ;

6- [8- ({ 4- [(3S) -3-羥基 吡 咯 啶 -1-基] 苯基 } 胺基) 咪唑 並 [1,2-a] 吡 啞 -6-基] -2,3-二氫 -1H-吡 啶 -2-酮 ;

1- (4- { [6- (1H-吡 啶 -6-基) -5-甲基 咪唑 並 [1,2-a] 吡

吡-8-基]胺基}苯基)-3-甲基四氫吡啶-3-醇；

(3S)-1-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡
吡-8-基]胺基}苯基)哌啶-3-醇；

(3R)-1-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡
吡-8-基]胺基}苯基)哌啶-3-醇；

2-[3-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]
吡吡-6-基)苯基]丙-2-醇；

6-(5-甲基-8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並
[1,2-a]吡吡-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-3-酮；

N-乙基-6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並
[1,2-a]吡吡-6-基)-1H-吡啶-3-胺；

2-[4-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡吡-8-
基]胺基}-2-甲氧基苯基)哌啶-1-基]乙-1-醇；

6-[8-(4-{(3S)-3-羥基吡咯啶-1-基}-3-甲氧基苯
基]胺基)咪唑並[1,2-a]吡吡-6-基]-2,3-二氫-1H-吡啶-2-
酮；

2-(5-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡吡-8-基]
胺基}-2-(嗎啉-4-基)苯氧基)乙-1-醇；

(3S)-1-(4-{[6-(1-甲基-1H-吡啶-6-基)咪唑並
[1,2-a]吡吡-8-基]胺基}苯基)吡咯啶-3-醇；

6-(5-甲基-8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並
[1,2-a]吡吡-6-基)-2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮；

2-甲基-1-[6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑
並[1,2-a]吡吡-6-基)-2H-吡啶-2-基]丙-2-醇；

2-甲基-1-{4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基)胺基]苯基}丙-2-醇；

(3S)-1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)吡咯啉-3-醇；

2-[4-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)苯基]丙-2-醇；

6-(1H-吲唑-6-基)-3-甲基-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

N-(2-羥基乙基)-N-甲基-6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-吲唑-3-羧醯胺；

5-氯-6-(1H-吲唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

N-(2-羥基乙基)-2-(4-{[6-(1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯氧基)乙醯胺；

1-(4-{[6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)-3-甲基四氫吡啶-3-醇；

1-(4-{[6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-3-甲基四氫吡啶-3-醇；

2-甲基-1-[6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-吲唑-1-基]丙-2-醇；

6-(1H-吲唑-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基氧)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺；

N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(1-甲基-1H-

咧啞 -6-基) 咪啞 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

6- (3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 喹 咩 -6-基) -5-甲 基 -N-[4-
(嗎 咻 -4-基) 苯 基]咪 啞 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

2-甲 基 -2- (4-{[6- (1-甲 基 -1H-咧 啞 -6-基) 咪 啞 並
[1,2-a]吡 咩 -8-基]胺 基 } 苯 基) 丙 -1-醇 ;

1- (3-羥 基 -3-甲 基 四 氫 吡 啶 -1-基) -2- (4-{[6- (1H-
咧 啞 -6-基) 咪 啞 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺 基 } 苯 氧 基) 乙 -1-
酮 ;

1-[6- (1,3-苯 並 噻 啞 -5-基) 咪 啞 並 [1,2-a]吡 啶 -8-基
]-3-甲 基 脲 ;

1-[6- (1,3-苯 並 噻 啞 -5-基) 咪 啞 並 [1,2-a]吡 啶 -8-基
]-3-乙 基 脲 ;

1-{2-乙 氧 基 -4-[(6-{1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -6-基 }咪
啞 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基) 胺 基] 苯 基 }-3-甲 基 四 氫 吡 啶 -3-醇
;

1-{2-甲 氧 基 -4-[(6-{1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -6-基 }咪
啞 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基) 胺 基] 苯 基 }-3-甲 基 四 氫 吡 啶 -3-醇
;

6- (1H-咧 啞 -6-基) -N-[3-甲 氧 基 -4- (嗎 咻 -4-基) 苯
基]咪 啞 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

6- (1H-咧 啞 -6-基) -N-[4- (喹 烷 -4-基 氧) 苯 基]咪 啞
並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

6- (8-{[3-甲 氧 基 -4- (嗎 咻 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 啞 並
[1,2-a]吡 咩 -6-基) -3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 喹 咩 -3-酮 ;

6- (1H-吡啶 -6-基) -N-[3- (嗎啉 -4-基) 苯基]咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-胺 ；

2- (4-{[6- (1H-吡啶 -6-基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-基]胺基 }苯氧基) -N,N-二 甲基 乙 醯 胺 ；

3-甲 基 -1-{4-[(6-{1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -6-基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-基) 胺基]苯基 }四 氫 吡 啶 -3-醇 ；

1-甲 基 -5- (5-甲 基 -8-{[4- (嗎啉 -4-基) 苯基]胺基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -6-基) -2,3-二 氫 -1H-1,3-苯 並 二 唑 -2-酮 ；

1-乙 基 -5- (8-{[4- (嗎啉 -4-基) 苯基]胺基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -6-基) -2,3-二 氫 -1H-1,3-苯 並 二 唑 -2-酮 ；

6- (3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嘧 啶 -6-基) -5-乙 基 -N-[4- (嗎啉 -4-基) 苯基]咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-胺 ；

6- (5-乙 基 -8-{[4- (嗎啉 -4-基) 苯基]胺基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -6-基) -2,3-二 氫 -1H-吡 啶 -2-酮 ；

(3S) -1-{4-[(6-{1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -6-基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-基) 胺基]苯基 }哌 啶 -3-醇 ；

(3S) -1-{2-甲 氧 基 -4-[(6-{1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -6-基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-基) 胺基]苯基 }哌 啶 -3-醇 ；

2- (1-{4-[(6-{1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -6-基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-基) 胺基]苯基 }哌 啶 -4-基) 乙 -1-醇 ；

2-[6- (5-甲 基 -8-{[4- (嗎啉 -4-基) 苯基]胺基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -6-基) -1H-吡 啶 -3-基]乙 -1-醇 ；

1-[4- ({6-[3- (2-羥 基 乙 基) -1H-吡 啶 -6-基]咪唑 並

[1,2-a]吡 咩 -8-基 }胺 基) 苯 基]-3-甲 基 四 氫 吡 啶 -3-醇 ;

6-[8-({4-[(2R) -2-(羥 基 甲 基) 嗎 啶 -4-基] 苯 基 }
胺 基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -6-基]-2,3-二 氫 -1H-吡 啶 -2-酮 ;

6-[8-({4-[(2S) -2-(羥 基 甲 基) 嗎 啶 -4-基] 苯 基 }
胺 基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -6-基]-2,3-二 氫 -1H-吡 啶 -2-酮 ;

5-(5-乙 基 -8-{[4-(嗎 啶 -4-基) 苯 基]胺 基 }咪 唑 並
[1,2-a]吡 咩 -6-基) -1-甲 基 -2,3-二 氫 -1H-1,3-苯 並 二 唑 -2-
酮 ;

5-乙 基 -N-[4-(嗎 啶 -4-基) 苯 基]-6-{1H-吡 咯 並 [3,2-
b]吡 啶 -6-基 }咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

(3R) -1-(4-{[6-(3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嘧 咩 -6-基
) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺 基 }-2-甲 氧 基 苯 基) 哌 啶 -3-
醇 ;

N-[4-(嗎 啶 -4-基) 苯 基]-6-(1,2,3,5-四 氫 -4,1-苯 並
嘧 氮 呋 -8-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-胺 ;

[(3R) -4-(4-{[6-(1H-吡 啶 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]
吡 咩 -8-基]胺 基 } 苯 基) 嗎 啶 -3-基]甲 醇 ;

[(3S) -4-(4-{[6-(1H-吡 啶 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡
咩 -8-基]胺 基 } 苯 基) 嗎 啶 -3-基]甲 醇 ;

(3S) -1-(4-{[6-(3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嘧 咩 -6-基
) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咩 -8-基]胺 基 }-2-甲 氧 基 苯 基) 哌 啶 -3-
醇 ;

(1-{4-[(6-{1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -6-基 }咪 唑 並
[1,2-a]吡 咩 -8-基) 胺 基] 苯 基 }哌 啶 -4-基) 甲 醇 ;

[(2R) -4- (4- { [6- (3,4-二氫 -2H-1,4-苯 並 嘔 咭 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咭 -8-基]胺 基 } -2-甲 氧 基 苯 基) 嗎 啉 -2-基]甲 醇 ;

[(2S) -4- (4- { [6- (3,4-二氫 -2H-1,4-苯 並 嘔 咭 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咭 -8-基]胺 基 } -2-甲 氧 基 苯 基) 嗎 啉 -2-基]甲 醇 ;

4- (4- { [6- (1H-嘔 咭 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咭 -8-基]胺 基 } 苯 氧 基) 環 己 -1-醇 ;

6- (1H-嘔 咭 -6-基) -N- (4- { 2-氧 雜 -6-氮 雜 螺 [3.3]庚 -6-基 } 苯 基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咭 -8-胺 ;

2- [6- (8- { [3-甲 氧 基 -4- (嗎 啉 -4-基) 苯 基]胺 基 } 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咭 -6-基) -1H-嘔 咭 -3-基]乙 -1-醇 ;

[(2S) -4- (4- { [6- (1H-嘔 咭 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咭 -8-基]胺 基 } -2-甲 氧 基 苯 基) 嗎 啉 -2-基]甲 醇 ;

[(2R) -4- (4- { [6- (1H-嘔 咭 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咭 -8-基]胺 基 } -2-甲 氧 基 苯 基) 嗎 啉 -2-基]甲 醇 ;

2- [1- (4- { [6- (3,4-二氫 -2H-1,4-苯 並 嘔 咭 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咭 -8-基]胺 基 } 苯 基) 哌 啶 -4-基]乙 -1-醇 ;

6- (1H-嘔 咭 -6-基) -N- (4- { 8-氧 雜 -3-氮 雜 雙 環 [3.2.1]辛 -3-基 } 苯 基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咭 -8-胺 ;

[(3R) -1- (4- { [6- (1H-嘔 咭 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咭 -8-基]胺 基 } 苯 基) 吡 咯 啶 -3-基]甲 醇 ;

[(3S) -1- (4- { [6- (1H-嘔 咭 -6-基) 咪 唑 並 [1,2-a]吡 咭 -8-基]胺 基 } 苯 基) 吡 咯 啶 -3-基]甲 醇 ;

5-氯-6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔咩-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡咩-8-胺；

2-[6-(8-{[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基)-1H-吲哚-3-基]乙-1-醇；

(3R)-1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔咩-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基}苯基)哌啶-3-醇；

[1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔咩-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基}苯基)哌啶-4-基]甲醇；

(3S)-1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔咩-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基}苯基)哌啶-3-醇；

[(2S)-4-{4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基]咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基)胺基}苯基]嗎啉-2-基]甲醇；

[(2R)-4-{4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基]咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基)胺基}苯基]嗎啉-2-基]甲醇；

2-[1-(4-{[6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基}苯基)吡咯啶-3-基]乙-1-醇；

6-(1H-吲哚-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基甲氧基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡咩-8-胺；

N-[5-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基)吡啶-3-基]乙醯胺；

6-(8-{[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基氧)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基)-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮；

6-(1H-吲哚-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-5-甲基咪唑並[1,2-a]吡咩-8-胺；

6- (1H-吡啶 -6-基) -5-甲基 -N-[4- (嗎啉 -4-基) 苯基]咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-胺 ;

1- (4- { [6- (3,4-二 氫 -2H-1,4-苯 並 嗎啞 -6-基) -5-甲基 咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-基]胺基 } 苯基) -4-甲基 哌 啶 -4-醇 ;

N-[3-甲 氧基 -4- (嗎 烷 -4-基 氧) 苯基]-6- { 1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -6-基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-胺 ;

6- (1H-吡 啶 -6-基) -N- (4- { 2-氧 雜 -7-氮 雜 螺 [3.5] 壬 -7-基 } 苯基) 咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-胺 ;

6- (1H-吡 啶 -6-基) -N-[3-甲 氧基 -4- (嗎 烷 -4-基 甲 氧基) 苯基]咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-胺 ;

1- (4- { 4- [(6- { 1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -6-基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-基) 胺基] 苯基 } 哌 啞 -1-基) 乙 -1-酮 ;

5- (8- { [3- (2-羥 基 乙 氧基) -4- (嗎 啉 -4-基) 苯基] 胺基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -6-基) -1-甲基 -2,3-二 氫 -1H-1,3-苯 並 二 啶 -2-酮 ;

[(3S) -1- { 2-甲 氧基 -4- [(6- { 1H-吡 咯 並 [3,2-b]吡 啶 -6-基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -8-基) 胺基] 苯基 } 吡 咯 啶 -3-基]甲 醇 ;

5- (8- { [3-甲 氧基 -4- (嗎 啉 -4-基) 苯基]胺基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -6-基) -N-甲基 吡 啶 -3-胺 ;

5- (8- { [3-甲 氧基 -4- (嗎 啉 -4-基) 苯基]胺基 }咪唑 並 [1,2-a]吡 啞 -6-基) -1-甲基 -2,3-二 氫 -1H-1,3-苯 並 二 啶 -2-酮 ;

5-[8- ({ 4- [(3R) -3-羥 基 哌 啶 -1-基] 苯基 } 胺基) 咪

唑並[1,2-a]吡咩-6-基]-1-甲基-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮；

(3R)-1-{2-甲氧基-4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基)胺基]苯基}哌啶-3-醇；

4-甲基-7-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基)-1,2,3,4-四氫喹啉-2-酮；

[(2R)-4-{2-甲氧基-4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基)胺基]苯基}嗎啉-2-基]甲醇； 及

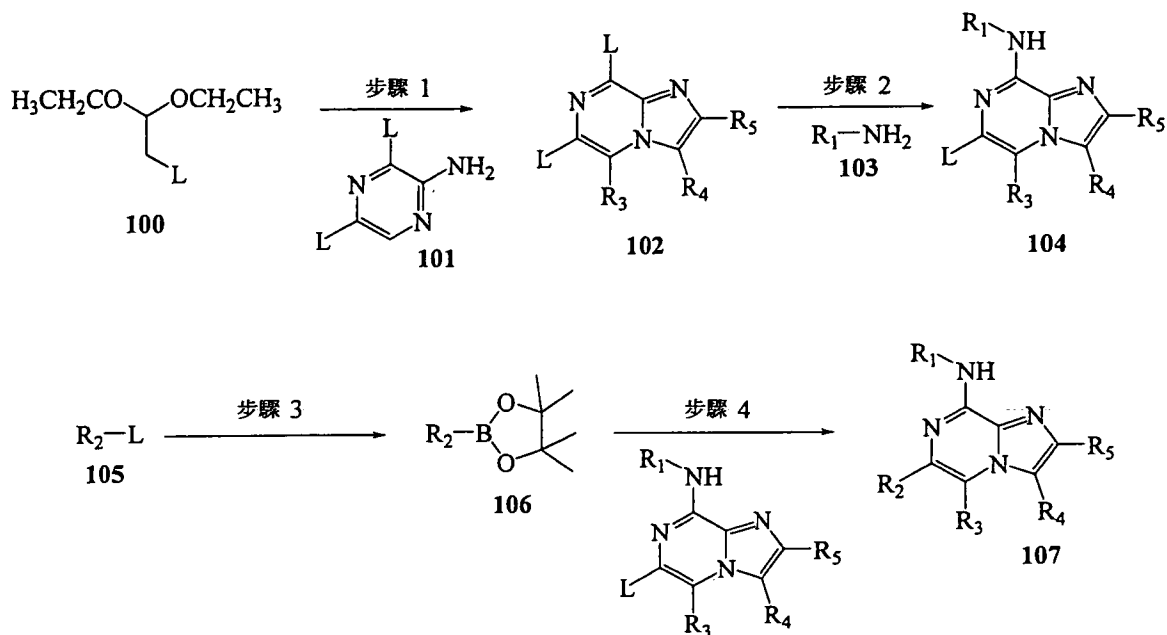
(3R)-1-{4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基)胺基]苯基}哌啶-3-醇，

及彼等之藥學上可接受之鹽。

於所有上述實例中，該化學實體可經單獨給予或以混合物之方式給予或與其他活性劑之組合方式給予。

得到本發明所描述之新穎化合物之方法對熟習此技藝之人士而言係顯而易見，適當之方法係描述於例如下述之反應圖和實施例及本文所引述之參考文獻中。

反應圖1



參照反應圖 1 之步驟 1，令過量（諸如約 3.5 當量）之式 100 化合物（其中 L 係離去基，諸如溴化物）與酸之水溶液（諸如 48% 溴化氫水溶液）混合，並令混合物於回流下經攪拌約 2 小時。冷卻該混合物至約 40°C 並加入鹼（諸如碳酸氫鈉固體）。令反應混合物經過濾並加入式 101 化合物（其中 L 係離去基，諸如溴化物），且令反應混合物於回流下經攪拌約 16 小時。產物（即式 102 化合物）係經分離且可選擇地經純化。

參照反應圖 1 之步驟 2，將過量（諸如約 1.3 當量）之式 103 化合物於極性溶劑（諸如 N,N-二甲基甲醯胺）中的溶液加入至式 102 化合物（其中 L 係離去基，諸如溴化物）中。加入有機鹼（諸如 N,N-二異丙基乙胺）並令混合物於約 120°C 下經攪拌約 13 小時。產物（即式 104 化合物）係經分離且可選擇地經純化。

參照反應圖 1 之步驟 3，令式 105 化合物（其中 L 係離去基，諸如溴化物）與於極性溶劑（諸如二甲亞砜）中之過量（諸如約 1.1 當量）之雙（2,3-二甲基-2,3-丁二醇根（pinacolato））二硼和過量（諸如約 3.0 當量）之無機鹼（諸如乙酸鉀）混合。令反應混合物經氮氣噴霧並經攪拌約 5 分鐘。令該反應混合物與約 0.2 當量之 1,1-二（二苯膦基）二茂鐵二氯鈹（II）二氯甲烷反應並於約 80℃ 下經攪拌約 3 小時。產物（即式 106 化合物）係經分離且可選擇地經純化。

參照反應圖 1 之步驟 4，令過量（諸如約 1.1 當量）之式 106 化合物和式 104 化合物（其中 L 係離去基，諸如溴化物）置於鹼之水溶液（諸如 1M 碳酸鈉溶液）和惰性溶劑（諸如 1,4-二噁烷）中。令反應混合物經氮氣噴霧並經攪拌約 5 分鐘。令所生成之混合物與約 0.1 當量之四（三苯膦）鈹（0）反應並於約 135℃ 和微波照射下經反應約 30 分鐘。所生成之產物（即式 107 化合物）係經分離且可選擇地經純化。

於是，提供一種治療病患（例如哺乳動物，諸如人）之方法，該病患罹患對抑制 Syk 活性有反應之疾病，該方法包含對該罹患該疾病之病患給予有效量之本發明所描述之至少一種化學實體。

於某些較佳體系中，本發明所描述之化學實體亦可抑制其他激酶，因而亦能治療與此等激酶有關之疾病、疾病徵狀及病症。

治療方法亦包括於罹患對抑制 Syk 活性有反應之疾病的病患活體內藉由 Syk 抑制 ATP 結合或水解或藉由某些其他機轉以抑制 Syk 活性及／或抑制 B 細胞活性，該治療方法係藉由給予有效濃度之本發明所描述之經選擇的至少一種化學實體。有效濃度之實例係於活體外足以抑制 Syk 活性之濃度。有效濃度可經實驗（例如藉由測定該化學實體之血液濃度）確定或可為藉由計算生物可利用性而理論上確定。

於某些較佳體系中，對抑制 Syk 活性及／或 B 細胞活性有反應之病症係癌症、過敏性疾病及／或自體免疫及／或發炎疾病及／或急性發炎反應。

亦提供一種治療罹患癌症、過敏性疾病及／或自體免疫及／或發炎疾病及／或急性發炎反應的病患之方法，其係藉由給予有效量之本發明所描述之至少一種化學實體。

於某些較佳體系中，利用本發明所描述之化學實體而可受影響之病症和疾病包括但不限於：過敏性疾病，其包括但不限於濕疹、過敏性鼻炎或鼻炎、枯草熱、枝氣管氣喘、蕁麻疹及食物過敏以及其他異位性徵狀；自體免疫及／或發炎疾病，其包括但不限於銀屑病、Crohn 氏疾病、應激性腸徵候群、Sjogren 氏疾病、組織移植排斥及移植器官之超急性排斥、氣喘、全身性紅斑狼瘡（和相關之血管球性腎炎）、皮膚炎、多發性硬化症、硬皮病、脈管炎（與 ANCA 相關及其他之脈管炎）、自體免疫溶血性和血小板減少性狀態、Goodpasture 氏徵候群（及相關之血管

球性腎炎和肺出血）、動脈粥樣硬化、類風濕性關節炎、慢性特發性血栓性血小板減少症紫癜（ITP）、Addison氏疾病、Parkinson氏疾病、Alzheimer氏疾病、糖尿病、敗血性休克、重症肌無力、及類似疾病；急性發炎反應，其包括但不限於皮膚曬傷、骨盆發炎疾病、腸發炎疾病、尿道炎、葡萄膜炎、鼻竇炎、肺炎、腦炎、腦膜炎、心肌炎、腎炎、骨髓炎、肌炎、肝炎、胃炎、腸炎、皮膚炎、齒齦炎、闌尾炎、胰腺炎及膽囊炎；多囊性腎疾；及癌，其包括但不限於B細胞淋巴瘤、淋巴瘤（其包括Hodgkin氏和非Hodgkin氏淋巴瘤）、毛樣細胞白血病、多發性骨髓瘤、慢性和急性骨髓性白血病及慢性和急性淋巴細胞白血病。

Syk係B細胞淋巴瘤之細胞凋亡的習知抑制劑。缺陷型細胞凋亡成為人白血病和淋巴瘤之致病性和抗藥性的原因。因此，進一步提供一種促進或誘導能表現Syk之細胞的細胞凋亡之方法，其包含令該細胞與本發明所描述之至少一種化學實體接觸。

亦提供治療方法（其中本發明所描述之至少一種化學實體係給予病患僅有之活性劑）且亦包括治療方法（其中本發明所描述之至少一種化學實體係與一或多種額外之活性劑組合給予病患）。

因此，於某些較佳體系中，一種治療癌症、過敏性疾病及／或自體免疫及／或發炎疾病及／或急性發炎反應之方法包含對需要治療之病患給予有效量之本發明所描述之

至少一種化學實體及可用於治療癌症、過敏性疾病及／或自體免疫及／或發炎疾病及／或急性發炎反應之第二活性劑。例如，該第二劑可為抗發炎劑。可在利用本發明所描述之至少一種化學實體進行治療之前、同時或之後利用第二活性劑進行治療。於某些較佳體系中，本發明所描述之至少一種化學實體係於單一劑型中與另一活性劑混合。可用於與本發明所描述之至少一種化學實體組合的適當抗腫瘤治療劑包括但不限於化學治療劑，例如絲裂黴素 C、碳鉑、紫杉醇（taxol）、順鉑、紫杉醇（paclitaxel）、鬼臼亞乙苷、阿黴素、或包含上述化學治療劑中至少一種的組合。亦可單獨使用放射性治療抗腫瘤劑或與化學治療劑組合併用。

本發明所描述之化學實體可作為化學敏化劑並因此可用於與其他化學治療藥物（特別是誘導細胞凋亡之藥物）組合。

本發明亦提供一種增加癌細胞對化學治療敏感性之方法，其包含對進行化學治療之病患給予化學治療劑及本發明所描述之至少一種化學實體，該化學實體之量係足以增加癌細胞對該化學治療劑之敏感性。

可用於與本發明所描述之化學實體組合的其他化學治療藥物之實例包括拓撲異構酶 I 抑制劑（喜樹鹼或拓撲酶抑制劑）、拓撲異構酶 II 抑制劑（例如柔紅黴素和鬼臼亞乙苷）、烷化劑（例如環磷醯胺、苯丙胺酸氮芥及 BCNU）、微管蛋白導向劑（例如紫杉醇（taxol）和長春

花鹼）、及生物作用劑（例如抗體，諸如抗 CD20 抗體、IDEC 8、免疫毒素及細胞因子）。

於某些較佳體系中，本發明所描述之化學實體係用於與 Rituxan®（單株抗體 Rituximab）或作用為選擇性除去 CD20+ B 細胞之其他劑組合。

本發明包括治療方法，其中本發明所描述之至少一種化學實體係與抗發炎劑一併給予。抗發炎劑包括但不限於 NSAIDs、非特異性和 COX-2 特異性環加氧酶抑制劑、金化合物、腎上腺皮質類固醇、氨甲蝶呤、腫瘤壞死因子（TNF）受體拮抗劑、免疫抑制劑及氨甲蝶呤。

NSAIDs 之實例包括但不限於異丁苯丙酸、氟比洛芬（flurbiprofen）、奈普生（naproxen）和奈普生鈉、待克菲那（diclofenac）、待克菲那鈉與米索比啉（misoprostol）之組合、舒林酸（sulindac）、噁丙吡（oxaprozin）、氟苯水楊酸（diflunisal）、吡羅昔康（piroxicam）、吲哚美辛（indomethacin）、樂達克定（etodolac）、非諾洛芬苯氧苯丙酸鈣（fenoprofen calcium）、可多普洛芬（ketoprofen）、蔡丁美酮鈉（sodium nabumetone）、柳氮磺胺吡啶（sulfasalazine）、甲苯啉乙酸鈉（tolmetin sodium）及羥氯喹啉。NSAIDs 之實例亦包括 COX-2 特異性抑制劑（即抑制 COX-2 之 IC_{50} 值比抑制 COX-1 之 IC_{50} 值至少低 50 倍的化合物），諸如塞來昔布（celecoxib）、伐地昔布（valdecoxib）、羅美昔布（lumiracoxib）、萬克適錠（etoricoxib）及／或偉克適

錠 (rofecoxib) 。

於另一較佳體系中，該抗發炎劑係水楊酸 (鹽) 。水楊酸 (鹽) 包括但不限於乙醯水楊酸或阿斯匹林、水楊酸鈉、及膽鹼和水楊酸鎂。

該抗發炎劑亦可為腎上腺皮質類固醇。例如，該腎上腺皮質類固醇可選自可體松、地塞米松、甲基去氫氧化可的松、氫化潑尼松、氫化潑尼松磷酸鈉及潑尼松。

於某些較佳體系中，該抗發炎治療劑係金化合物，諸如硫代蘋果酸金鈉或醋硫葡金。

於某些較佳體系中，該抗發炎劑係代謝抑制劑，諸如二氫葉酸還原酶抑制劑，諸如氨甲蝶呤或二氫乳清酸脫氫酶抑制劑，諸如雅努麻錠 (leflunomide) 。

於某些較佳體系中，使用組合物，其中至少一種抗發炎化合物係抗 C5 單株抗體 (諸如艾庫組單抗 (eculizumab) 或佩克里茲單抗 (pexelizumab)) 、TNF 拮抗劑 (諸如 entanercept) 或英利昔單抗 (infliximab ; 其係為抗 TNF α 單株抗體) 。

於某些較佳體系中，使用組合物，其中至少一種活性劑係免疫抑制劑化合物，諸如氨甲蝶呤、雅努麻錠、環孢黴素、藤黴素、硝基咪唑硫嘌呤或霉酚酸酯 (mycophenolate mofetil) 。

可用於治療上述病症之劑量係例如 0.1 至 140 mg/kg 體重/天 (0.5 mg 至 7 g/病患/天) 。可與媒介物組合以製造單一劑型之活性化合物的量將依據被治療之宿主和特定

之給藥模式而加以改變。劑量單位型式通常含有 1 至 500 mg 之活性成分。

給藥頻率亦可依據所使用之化合物和被治療之特定疾病而加以改變。於某些較佳體系中，例如為治療過敏性疾病及／或自體免疫及／或發炎疾病，使用每天 4 次或低於每天 4 次之劑量攝取。於某些較佳體系中，使用每天 1 或 2 次之劑量攝取。然而，當能瞭解的是，對特定病患之特定劑量將取決於各種不同之因素，其包括所使用之特定化合物之活性、年齡、體重、一般健康狀態、性別、飲食、給藥時間、給藥途徑及排泄率、藥物組合及進行治療之病患的特定疾病之嚴重性。

本發明所描述之化學實體的標記型式可作為供鑑別及／或得到化合物之診斷劑，該等化合物具有調整本發明所描述之激酶活性的功能。此外，本發明所描述之化學實體可用於有效性、最適化及標準化生物檢定。

“經標記”表示化合物係直接或間接經能提供可偵測之訊號的標記物標記，該標記物係例如放射性同位素、螢光標記、酶、抗體、粒子（諸如磁性粒子）、化學發光標記或特異性結合分子等。特異性結合分子包括成對物，諸如生物素和鏈黴抗生物素蛋白、地高辛和抗地高辛等。對該特異性結合者，依據如上述之習知方法，互補體正常地係經能提供偵測之分子標記。該標記物可直接或間接提供可偵測之訊號。

【實施方式】

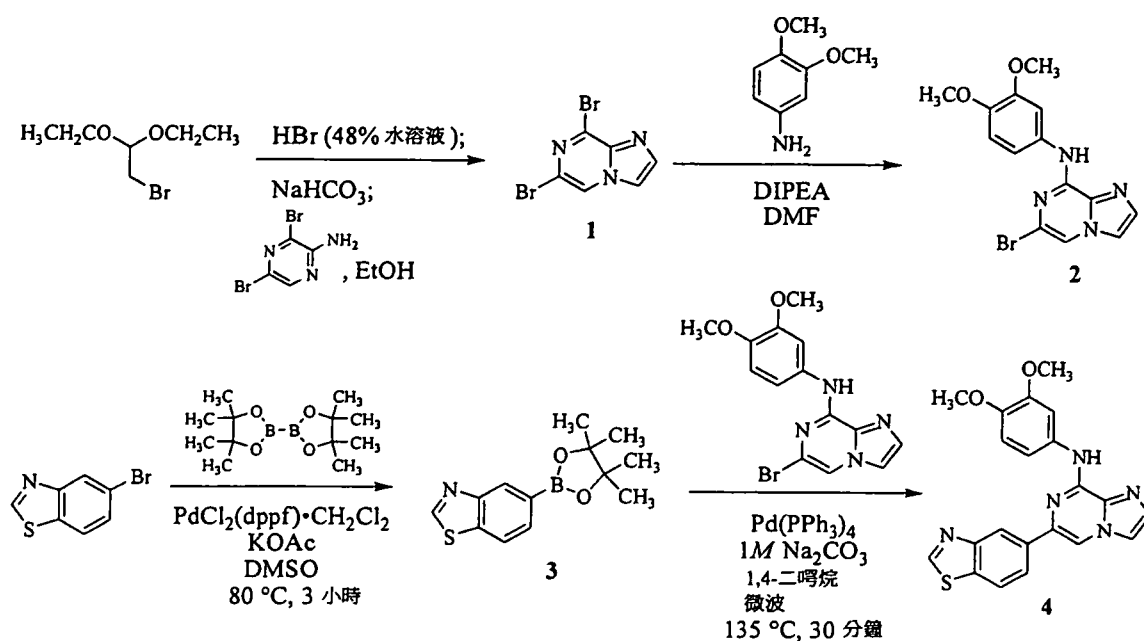
本發明係藉由下述之非限制性實施例加以進一步說明。

下述實施例中，下列之簡稱具有下述之意義。若有未定義之簡稱，則該簡稱具有一般可接受之意義。

DME	=	二甲醚
DMEM	=	Dulbecco 之經改質之 Eagle 氏培養基
DMF	=	N,N-二甲基甲醯胺
DMSO	=	二甲亞砜
Et ₂ O	=	二乙醚
g	=	克
h	=	小時
mg	=	毫克
min	=	分鐘
mL	=	毫升
mmol	=	毫莫耳
mM	=	毫莫耳（濃度）
ng	=	奈克
nm	=	奈米
nM	=	奈莫耳（濃度）
PBS	=	磷酸鹽緩衝鹽水
μL	=	微升
μM	=	微莫耳（濃度）

實施例 1

製備 6-（苯並[d]噻唑-5-基）-N-（3,4-二甲氧基苯基）咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺（4）



製備 6,8-二溴咪唑並[1,2-a]吡啉（1）：將 2-溴-1,1-二乙氧基乙烷（68.1 g，346 毫莫耳）和 48% 溴化氫水溶液（11.3 ml，99.2 毫莫耳）載入至配備溫度探針、機械攪拌器及回流冷凝器之四頸圓底燒瓶（1L）中，並令反應混合物於回流下經攪拌 2 小時。令所生成之混合物冷卻至 40 °C 並小量地加入碳酸氫鈉固體（8.50 g，101 毫莫耳）直至觀察到氣體釋出中止。警告：起初加入碳酸氫鈉至該溫溶液中產生劇烈之氣體釋出（發泡）。過濾所生成之懸浮液至四頸圓底燒瓶（1L）中並令濾餅經乙醇（200 ml）沖洗。該燒瓶配備溫度探針、機械攪拌器及回流冷凝器。加入 3,5-二溴吡啉-2-胺（50.0 g，198 毫莫耳）並於回流和激烈攪拌下加熱該反應混合物達 16 小時。隨後令該懸

浮液冷卻至 0℃ 並經過濾。令濾餅經冰乙醇 (50 ml) 沖洗，經真空下乾燥且加入至配備機械攪拌器之三頸圓底燒瓶 (1L) 中。加入水 (200 ml) 並令經激烈攪拌之懸浮液與分批之碳酸鉀固體 (27.4 g , 198 毫莫耳) 反應。警告：當加入碳酸鉀時觀察到氣體釋出。經攪拌 30 分鐘後，藉由過濾以分離所生成之沉澱物並令濾餅先後經水 (100 ml) 和乙醇 (50 ml) 沖洗。令濾餅於真空和 50℃ 下經乾燥至一定重量以生成淡黃色固體之 6,8-二溴咪唑並 [1,2-a] 吡啶 (1) (52.0 g , 94 %) : ^1H NMR (300 MHz , $\text{DMSO}-d_6$) δ 9.02 (s , 1H) , 8.23 (s , 1H) , 7.90 (s , 1H) 。

製備 6-溴-N-(3,4-二甲氧基苯基)咪唑並 [1,2-a] 吡啶-8-胺 (2) : 於 120℃ 下隔夜攪拌 3,4-二甲氧基苯胺 (18.0 g , 118 毫莫耳) 、 6,8-二溴咪唑並 [1,2-a] 吡啶 (25.0 g , 90.4 毫莫耳) 及 N,N-二異丙基乙胺 (11.7 g , 90.4 毫莫耳) 於 DMF (500 ml) 中之混合物。隨後，令反應物冷卻至室溫並於減壓下經濃縮至約 100 ml。將暗褐色反應混合物倒入至冰-冰水 (300 ml) 中並經攪拌 10 分鐘。過濾所生成之褐色沉澱物並令濾餅經水 (100 ml) 沖洗。令濾餅經真空下乾燥並自甲醇 (約 800 ml) 中再結晶析出以生成淡褐色針形固體之 6-溴-N-(3,4,5-三甲氧基苯基)咪唑並 [1,2-a] 吡啶-8-胺 (2) (23.3 g , 74 %) : ^1H NMR (300MHz , $\text{DMSO}-d_6$) 9.81 (s , 1H) , 8.22 (s , 1H) , 7.93 (s , 1H) , 7.75 (d , $J=2.4\text{Hz}$, 1H) , 7.62 (s , 1H) , 7.53 (dd , $J=8.7$, 2.4 , 1H) , 6.94 (d , $J=8.7\text{Hz}$,

1H) , 3.77 (s , 3H) , 3.75 (s , 3H) ; ESIMS m/z 349.2 $[M+H]^+$; HPLC , 6.92min , >99% (AUC) 。

製備 5- (4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜蒗烷-2-基) 苯並[d]噻唑 (3) : 對 5-溴苯並[d]噻唑 (428 mg , 2.00 毫莫耳) 、 雙 (2,3-二甲基-2,3-丁二醇根) 二硼 (558 mg , 2.20 毫莫耳) 及乙酸鉀 (588 mg , 6.00 毫莫耳) 於二甲亞砜 (7 mL) 中之混合物噴霧氮氣並同時攪拌達 5 分鐘。隨後加入 1,1-二 (二苯磷基) 二茂鐵二氯鈹 (II) 二氯甲烷 (293 mg , 0.40 毫莫耳) 並令反應物於 85°C 下經攪拌 3 小時。隨後, 令混合物經通過寅氏鹽墊過濾並令濾餅先後經乙酸乙酯 (75 mL) 和水 (20 mL) 沖洗。令濾液經乙酸乙酯 (100 mL) 稀釋並先後經水 (2×75 mL) 和鹽水 (75 mL) 沖洗。令有機相置於無水硫酸鈉上乾燥, 經過濾及減壓下濃縮。令所生成之殘餘物經層析 (矽膠, 0% 至 50% 乙酸乙酯之二氯甲烷梯度溶液) 純化以生成淡褐色固體之 5- (4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜蒗烷-2-基) 苯並[d]噻唑 (3) (200 mg , 38%) : ^1H NMR (300MHz , DMSO- d_6) δ 9.41 (s , 1H) , 8.32 (s , 1H) , 8.18 (d , 1H , $J=8.0Hz$) , 7.72 (d , 1H , $J=8.0Hz$) , 1.33 (s , 12H) ; ESIMS m/z 262.1 $[M+H]^+$ 。

製備 6- (苯並[d]噻唑-5-基) -N- (3,4-二甲氧基苯基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺 (4) : 對 6-溴-N- (3,4-二甲氧基苯基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺 (2) (209 mg , 0.601 毫莫耳) 和 5- (4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜蒗烷-2-基)

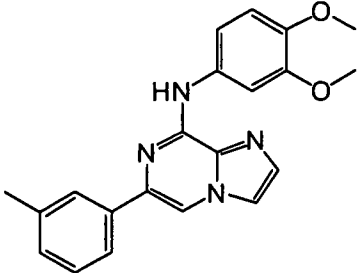
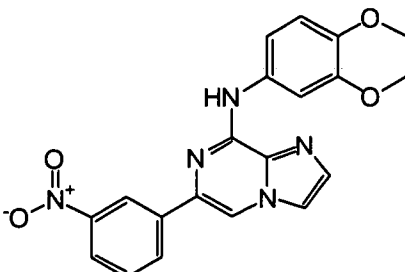
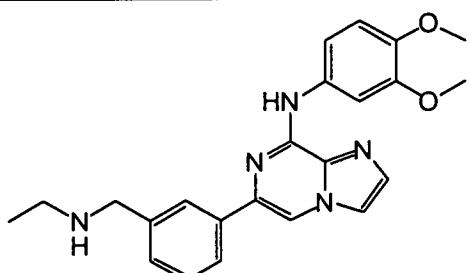
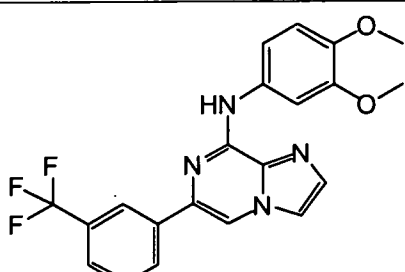
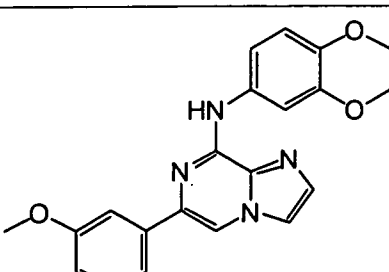
苯並[d]噻唑 (3) (180 mg, 0.689 毫莫耳) 於 1M 碳酸鈉水溶液 (0.76 ml) 和 1,4-二噁烷 (2.4 ml) 中之混合物噴霧氮氣並同時攪拌達 5 分鐘。隨後加入四(三苯膦)鈀(0) (69 mg, 0.06 毫莫耳) 並令所生成之混合物於 135 °C 和微波照射下進行反應 30 分鐘。隨後, 令反應物冷卻至周溫, 經 1:9 甲醇/乙酸乙酯 (75 ml) 稀釋並先後經水 (50 ml) 和鹽水 (50 ml) 沖洗。令有機相置於無水硫酸鈉上乾燥, 經過濾及減壓下濃縮。令所生成之殘餘物經層析 (矽膠, 0% 至 10% 甲醇之二氯甲烷梯度溶液) 純化以生成灰白色固體之 6-(苯並[d]噻唑-5-基)-N-(3,4-二甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺 (4) (169 mg, 70%) : 熔點 (mp) 179-181 °C ; ¹H NMR (300MHz, DMSO-d₆) δ 9.56 (s, 1H) , 9.45 (s, 1H) , 8.78 (s, 1H) , 8.76 (d, 1H, J=1.2Hz) , 8.26 (d, 1H, J=8.7Hz) , 8.14 (m, 2H) , 8.00 (s, 1H) , 7.66 (s, 1H) , 7.58 (dd, 1H, J=8.7, 2.4Hz) , 6.99 (d, 1H, J=8.7Hz) , 3.87 (s, 3H) , 3.76 (s, 3H) ; MS m/z 404.6 [M+H]⁺ ; HPLC, 6.475 分鐘, 98.6% (AUC) 。

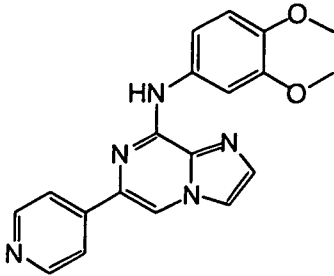
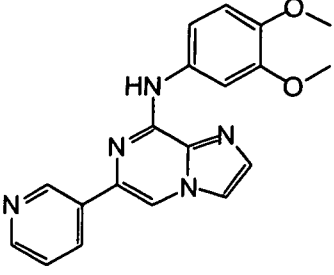
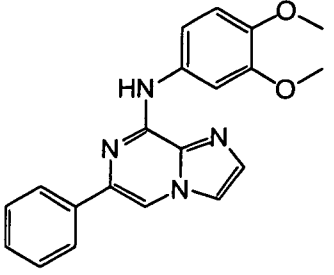
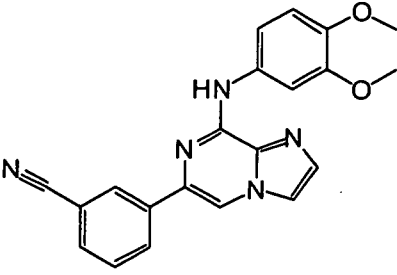
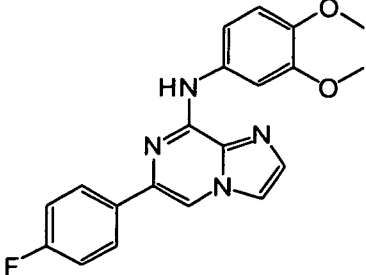
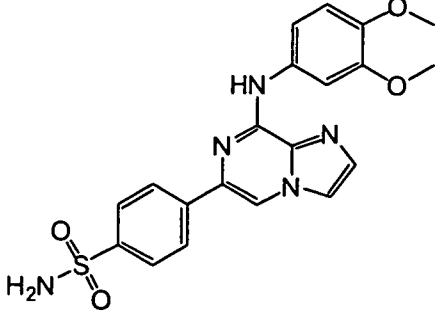
實施例 2

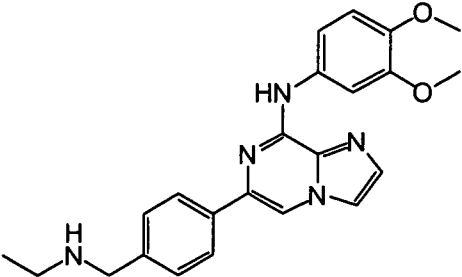
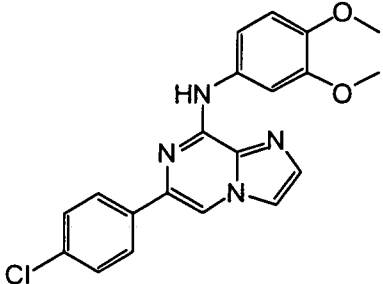
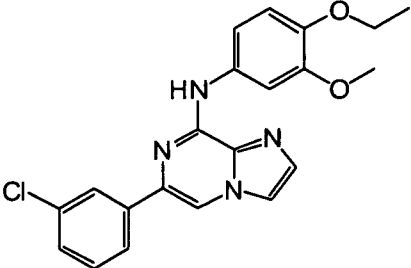
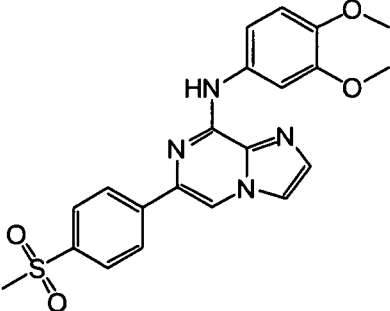
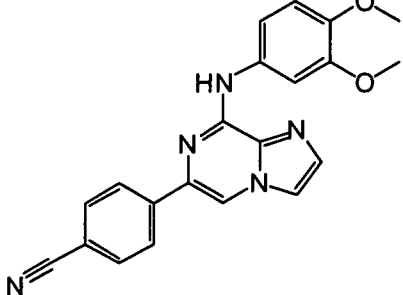
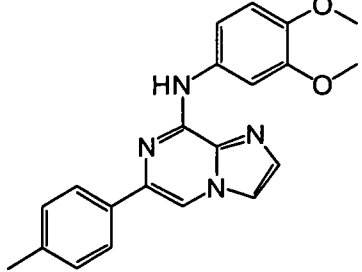
利用類似上述之方法製備下述之化合物。有機合成技藝之一般人士當能瞭解何時應改變起始物或反應條件以得到所欲之化合物。

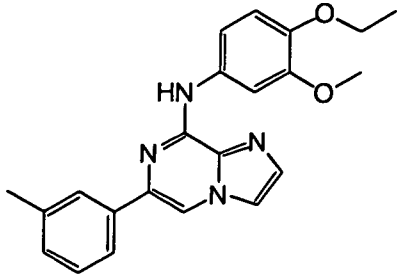
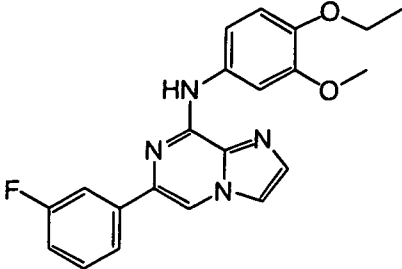
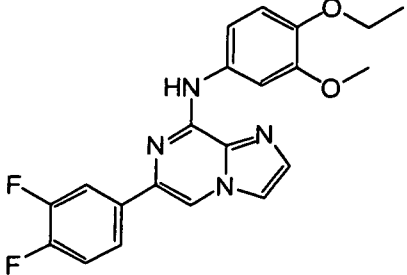
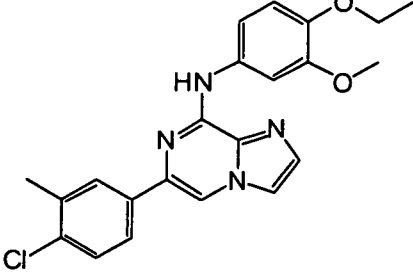
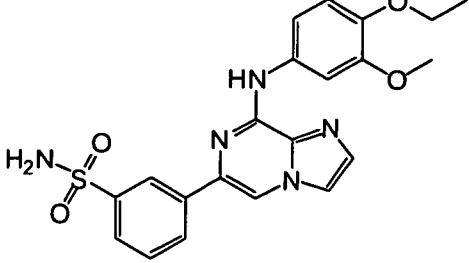
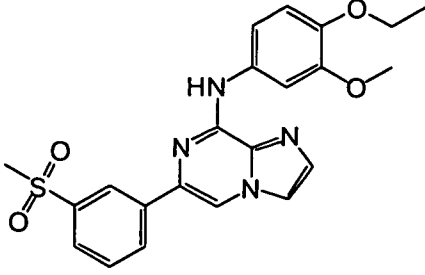
此實施例所記載之 MS 數據係以下述之方式得到：

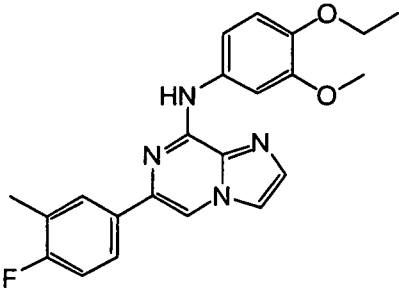
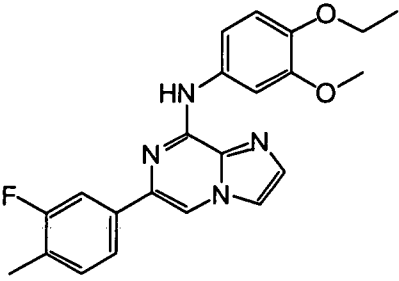
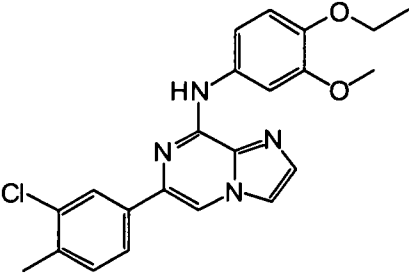
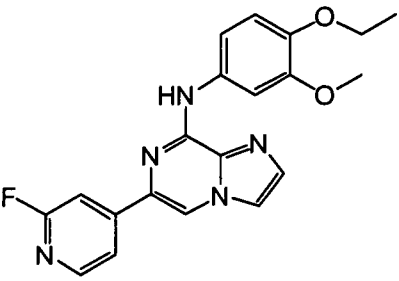
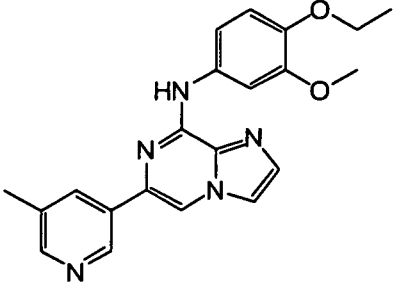
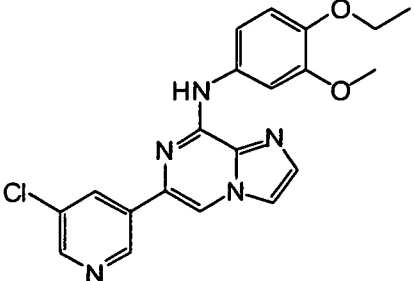
MS 條件：電噴霧 MS 係利用供精確質量測量之配備 LockSpray 源的 MICROMASS LCT 實施。利用 100 至 1000 Da 之正離子模式於 1 光譜/0.9 秒及 0.1 秒間隔掃描遲延之獲取速率下得到光譜。該儀器係經調整至解析度 5000 (FWHM)。每第 5 次掃描係取自 LockSpray 源之參考位置。亮啡肽 (556.2771 [M+H]⁺) 係作為參考或鎖質。

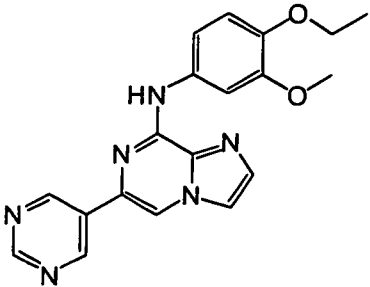
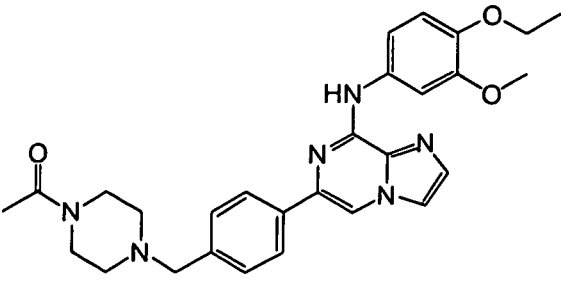
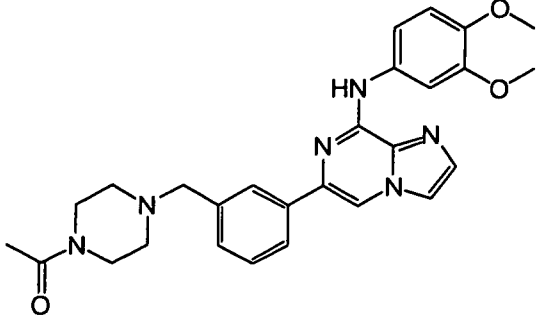
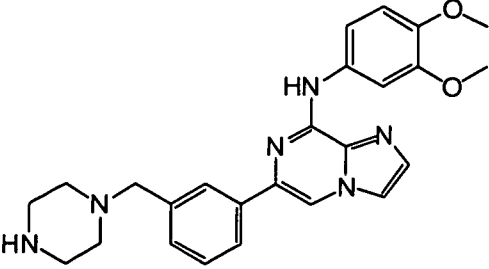
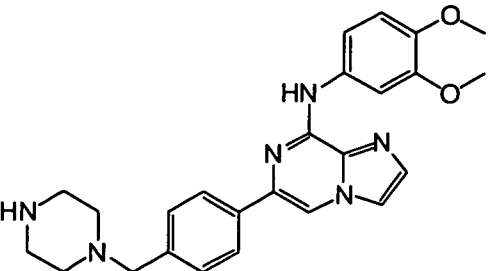
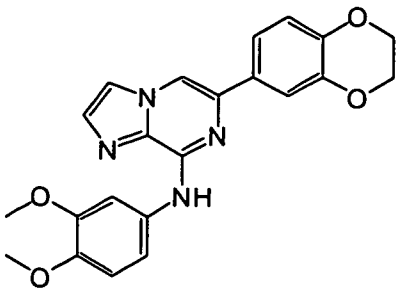
結構	名稱	[M+H] ⁺
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(3-甲基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	361.2
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(3-硝基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	392.1
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-{3-[(乙基胺基)甲基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	404.7
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-[3-(三氟甲基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	415.5
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(3-甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	377.5

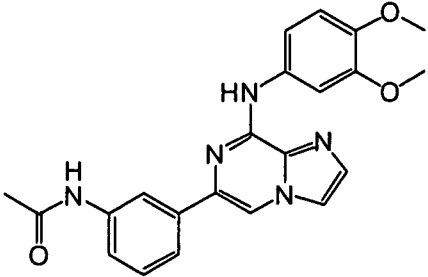
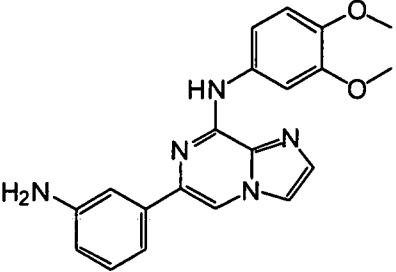
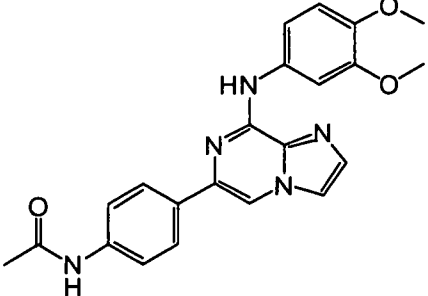
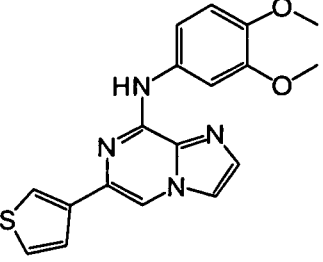
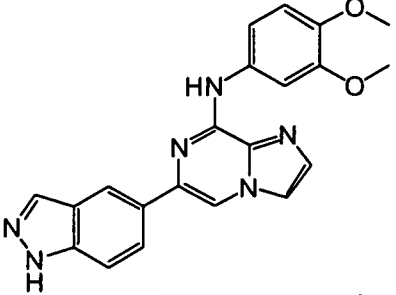
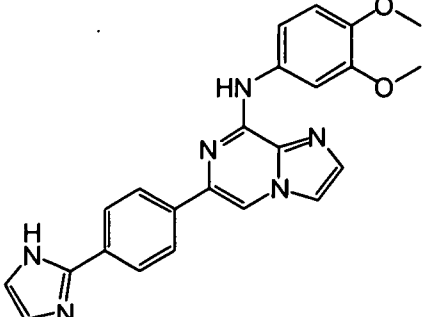
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(吡啶-4-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	348.3
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(吡啶-3-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	348.2
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-苯基咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	347
	3-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基}苄腈	372
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(4-氟苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	365.2
	4-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基}苯-1-磺醯胺	426.2

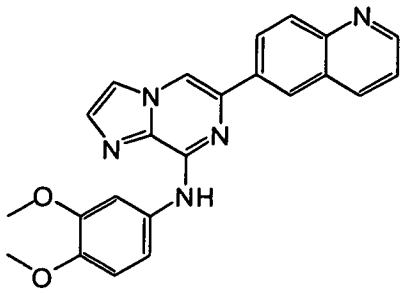
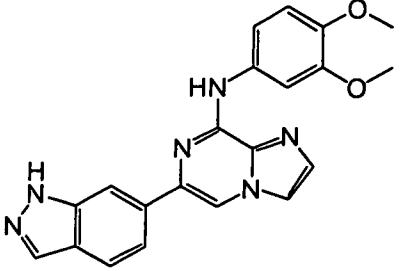
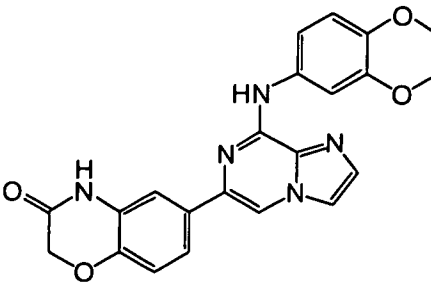
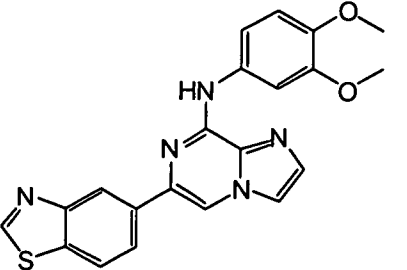
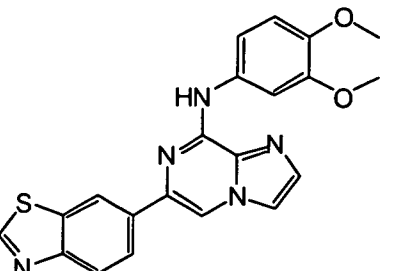
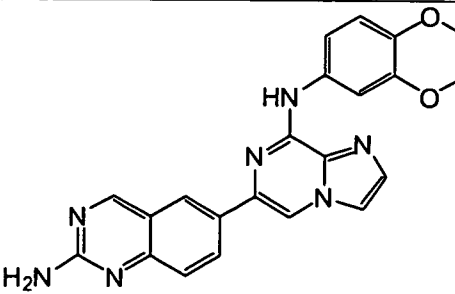
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-{4-[(乙基胺基)甲基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	404.7
	6-(4-氯苯基)-N-(3,4-二甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	381.2
	6-(3-氯苯基)-N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	395.2
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(4-甲磺醯基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	425.2
	4-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基}苯腈	372.1
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(4-甲基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	361.2

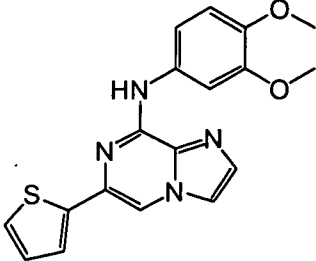
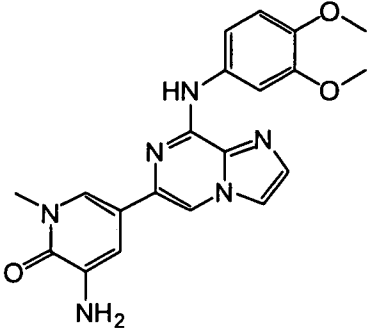
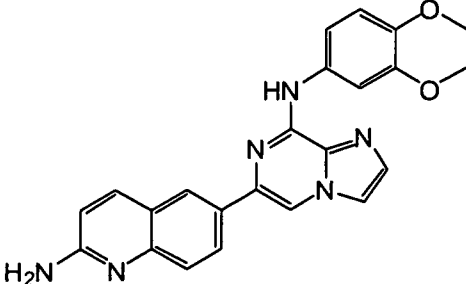
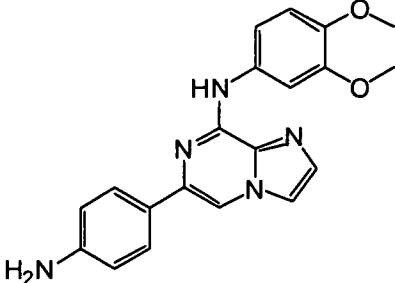
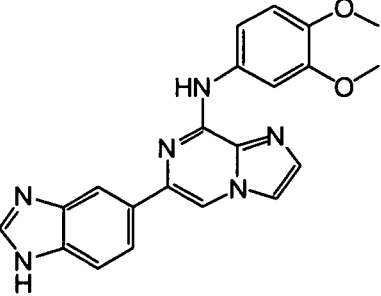
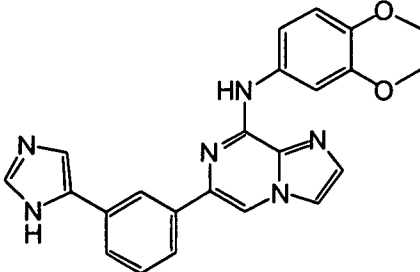
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)- 6-(3-甲基苯基)咪唑並[1,2-a] 吡啶-8-胺	375.2
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)- 6-(3-氟苯基)咪唑並[1,2-a]吡 啶-8-胺	379.1
	6-(3,4-二氟苯基)-N-(4-乙氧 基-3-甲氧基苯基)咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺	397.1
	6-(4-氯-3-甲基苯基)-N-(4-乙 氧基-3-甲氧基苯基)咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺	409
	3-{8-[(4-乙氧基-3-甲氧基苯 基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啶- 6-基}苯-1-磺醯胺	440.1
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)- 6-(3-甲磺醯基苯基)咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺	439.3

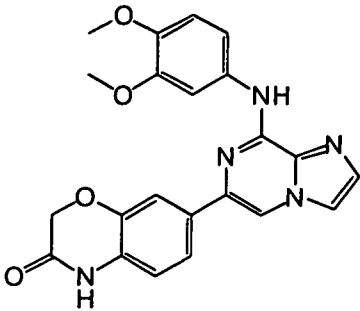
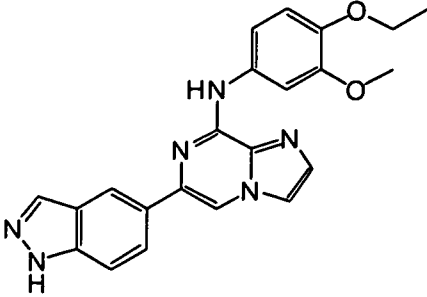
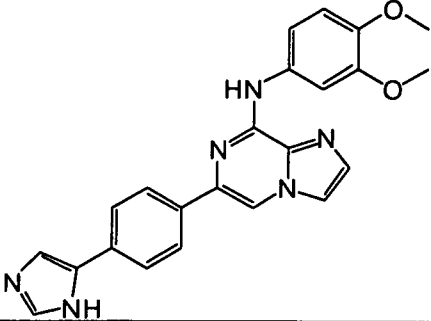
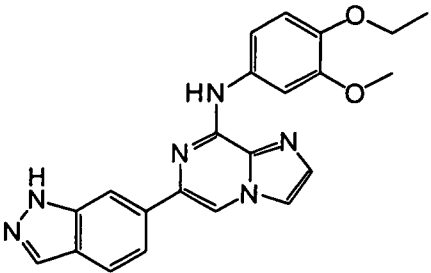
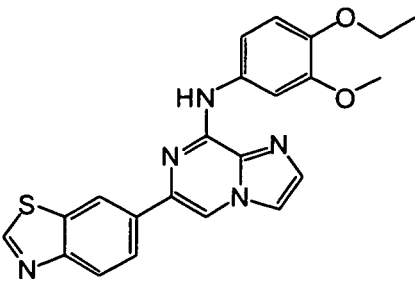
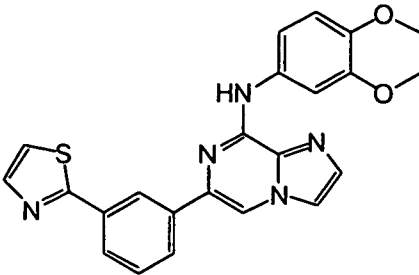
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)- 6-(4-氟-3-甲基苯基)咪唑並 [1,2-a]吡嗪-8-胺	393.2
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)- 6-(3-氟-4-甲基苯基)咪唑並 [1,2-a]吡嗪-8-胺	393.2
	6-(3-氯-4-甲基苯基)-N-(4-乙 氧基-3-甲氧基苯基)咪唑並 [1,2-a]吡嗪-8-胺	409.2
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)- 6-(2-氟吡啶-4-基)咪唑並 [1,2-a]吡嗪-8-胺	380.3
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)- 6-(5-甲基吡啶-3-基)咪唑並 [1,2-a]吡嗪-8-胺	376.5
	6-(5-氯吡啶-3-基)-N-(4-乙氧 基-3-甲氧基苯基)咪唑並 [1,2-a]吡嗪-8-胺	396.2

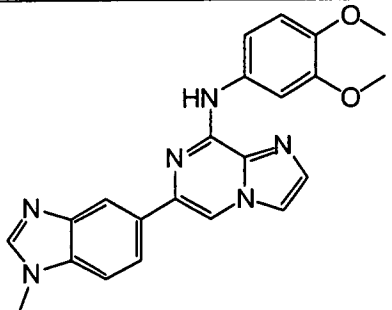
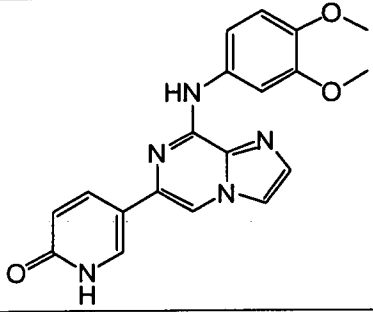
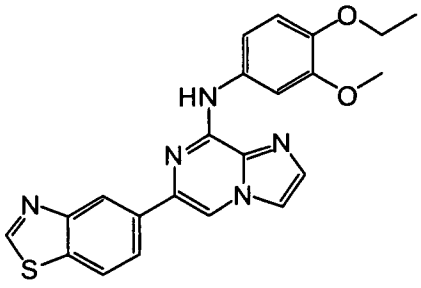
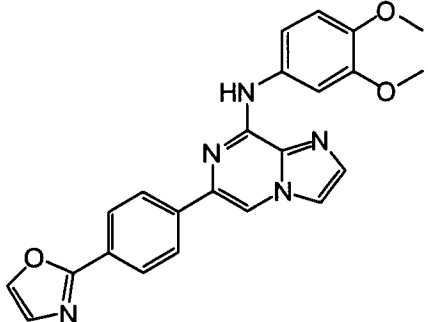
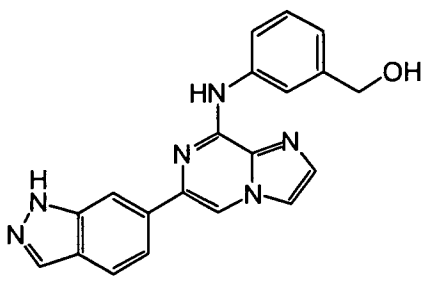
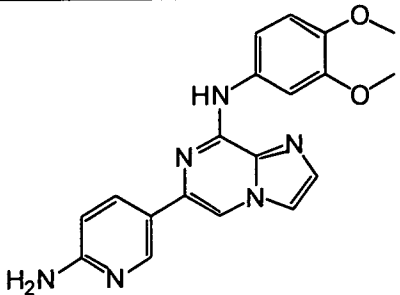
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)- 6-(嘧啶-5-基)咪唑並[1,2-a] 吡啶-8-胺	363.5
	1-{4-[(4-{8-[(4-乙氧基-3-甲 氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2- a]吡啶-6-基}苯基)甲基]哌 啶-1-基}乙-1-酮	487.5
	1-{4-[(3-{8-[(3,4-二甲氧基 苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡 啶-6-基}苯基)甲基]哌啶-1- 基}乙-1-酮	487.1
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-[3-(哌啶-1-基甲基)苯基]咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺	445.3
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-[4-(哌啶-1-基甲基)苯基]咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺	445.3
	6-(2,3-二氫-1,4-苯並二噁吩- 6-基)-N-(3,4-二甲氧基苯基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	404.42

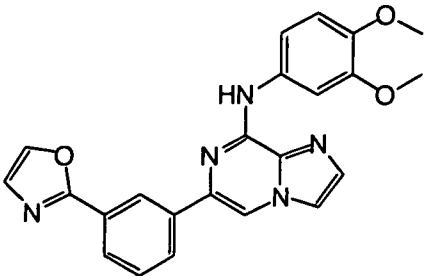
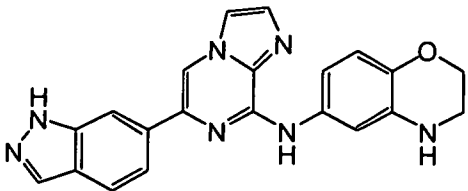
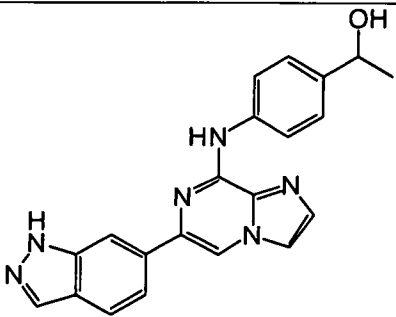
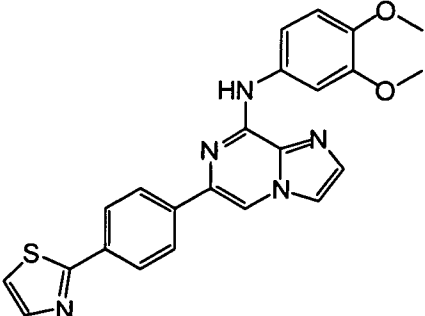
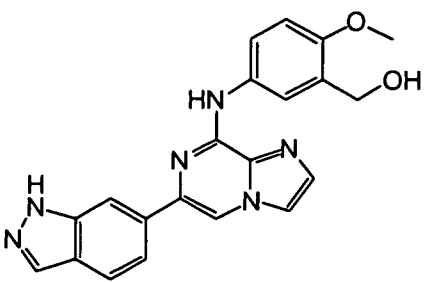
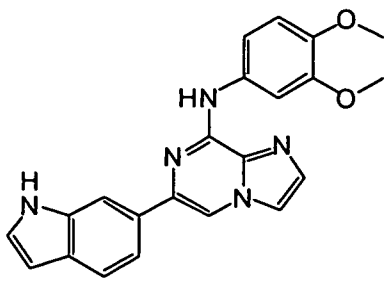
	N-(3-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)氨基]咪唑並[1,2-a]吡啞-6-基}苯基)乙醯胺	404.9
	6-(3-胺基苯基)-N-(3,4-二甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啞-8-胺	362.8
	N-(4-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)氨基]咪唑並[1,2-a]吡啞-6-基}苯基)乙醯胺	404.6
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(噻吩-3-基)咪唑並[1,2-a]吡啞-8-胺	353.5
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(1H-吡啞-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啞-8-胺	387.2
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-[4-(1H-咪唑-2-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啞-8-胺	413.3

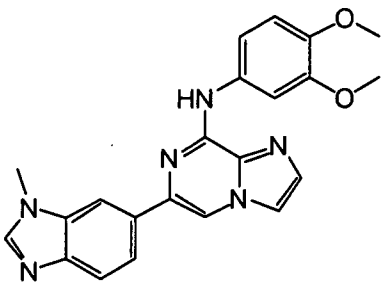
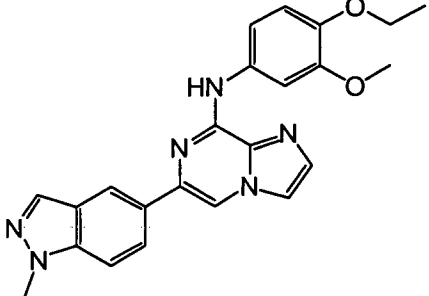
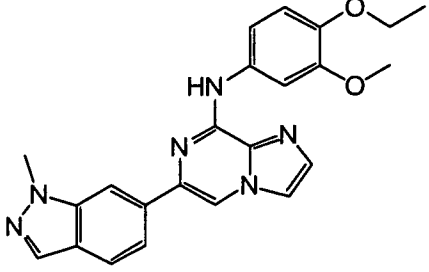
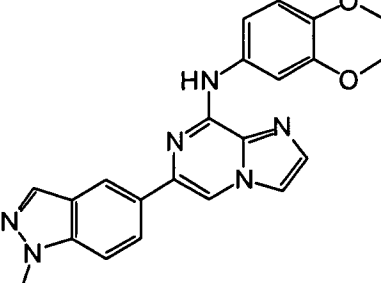
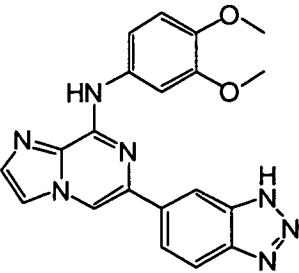
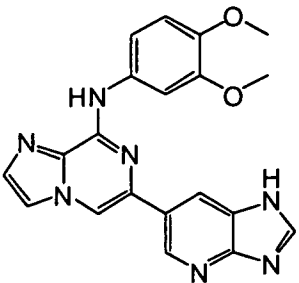
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(喹啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	398
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(1H-吡唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	387.4
	6-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基}-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡啉-3-酮	418.6
	6-(1,3-苯並噁唑-5-基)-N-(3,4-二甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	404.6
	6-(1,3-苯並噁唑-5-基)-N-(3,4-二甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	404.9
	6-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基}喹唑啉-2-胺	414.4

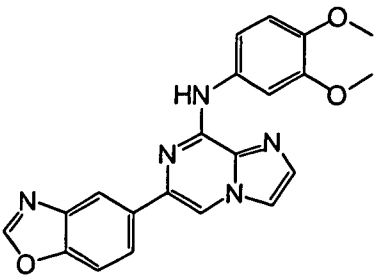
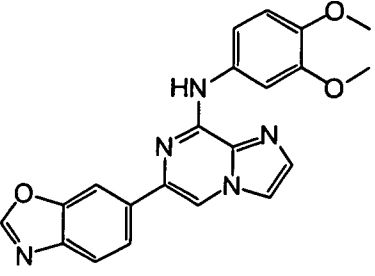
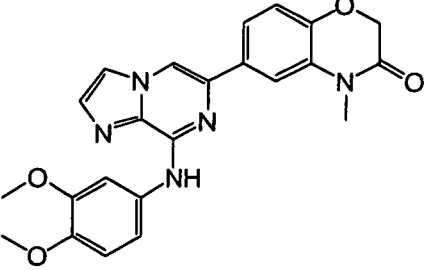
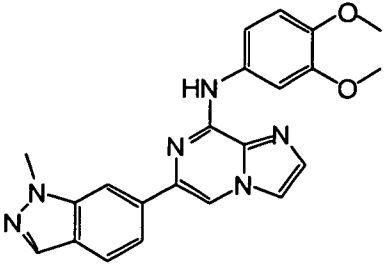
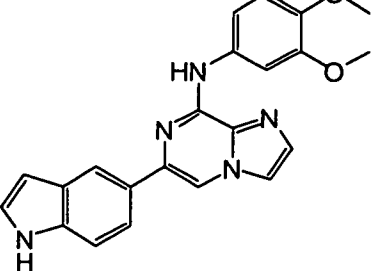
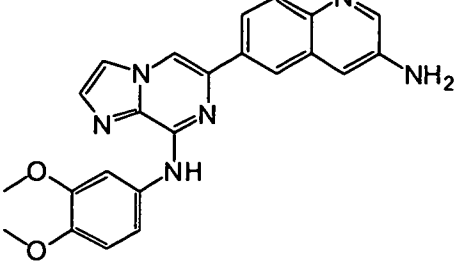
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(噻吩-2-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	353.4
	3-胺基-5-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基}-1-甲基-1,2-二氫吡啶-2-酮	393.3
	6-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基}喹啉-2-胺	413.3
	6-(4-胺基苯基)-N-(3,4-二甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	362.6
	6-(1H-1,3-苯並二唑-5-基)-N-(3,4-二甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	387.1
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-[3-(1H-咪唑-5-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	413.3

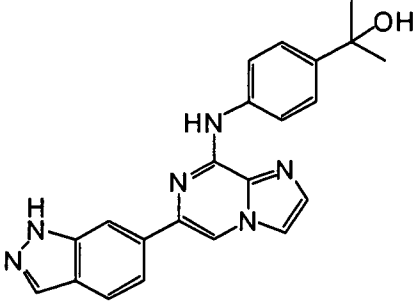
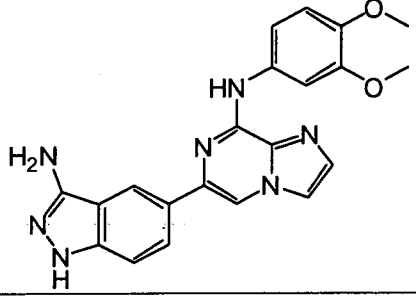
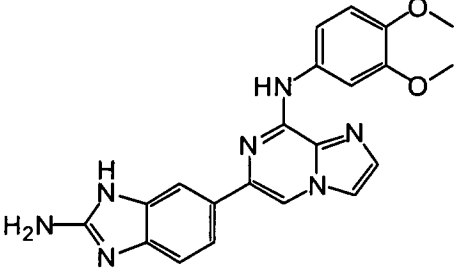
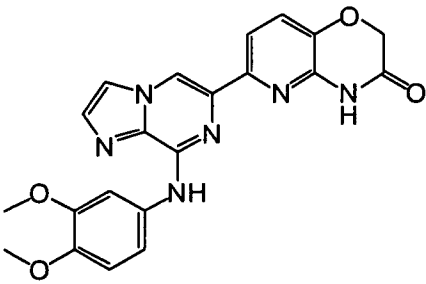
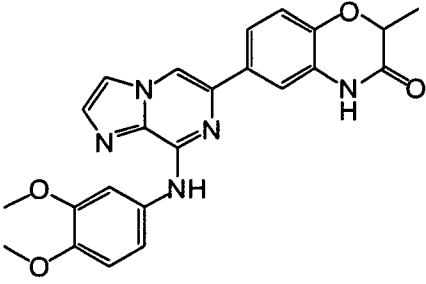
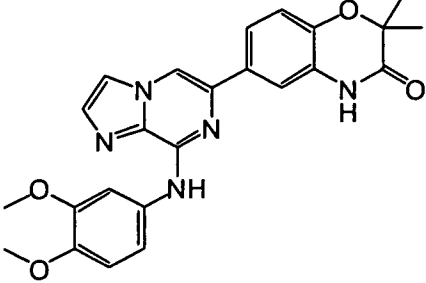
	7-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基}-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吩-3-酮	418.7
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)-6-(1H-吲唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	401.2
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-[4-(1H-咪唑-5-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	413.4
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)-6-(1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	401.1
	6-(1,3-苯並噁唑-5-基)-N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	418.7
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-[3-(1,3-噁唑-2-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	430.5

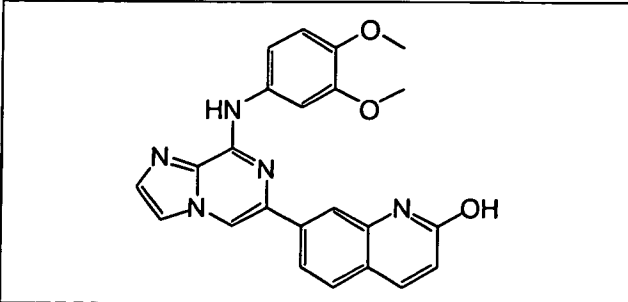
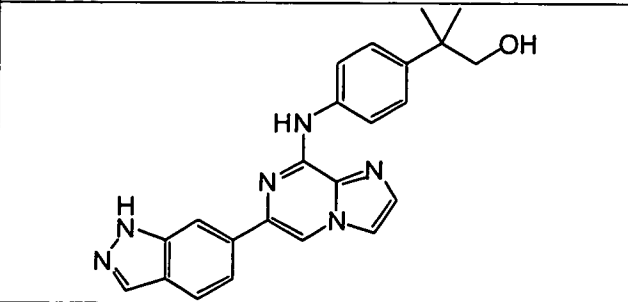
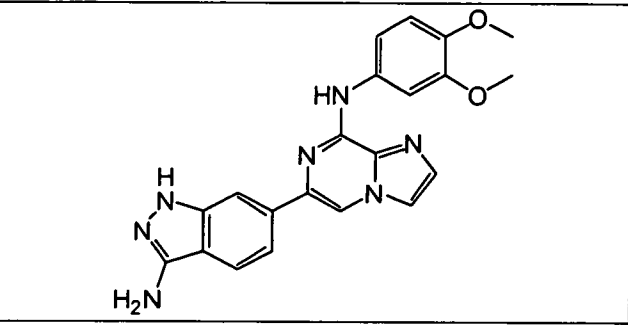
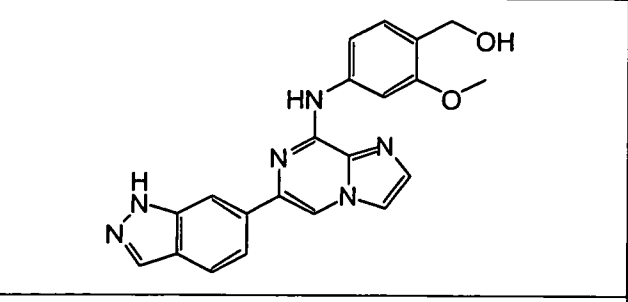
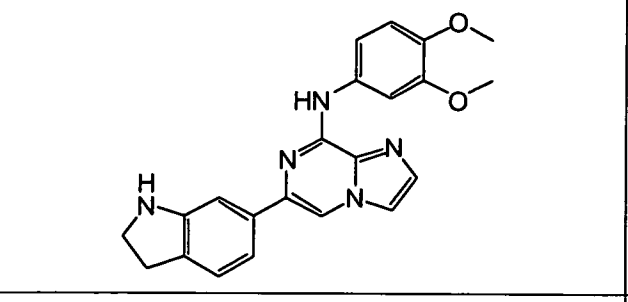
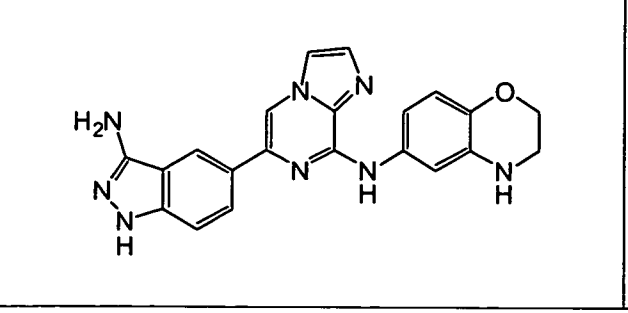
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	401.3
	5-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基}-1,2-二氫吡啶-2-酮	364.5
	6-(1,3-苯並噻唑-5-基)-N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	418.7
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-[4-(1,3-噁唑-2-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	414.1
	(3-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)甲醇	357
	5-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基}吡啶-2-胺	363.2

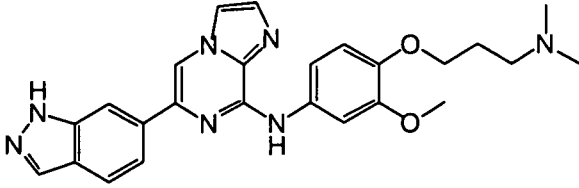
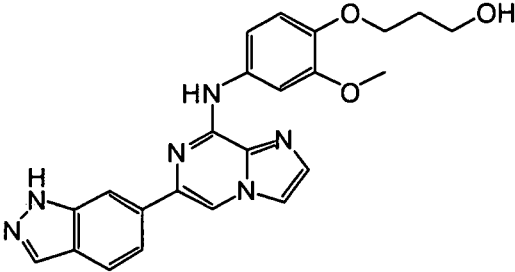
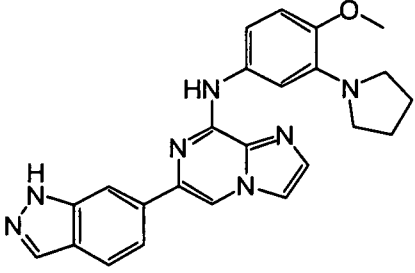
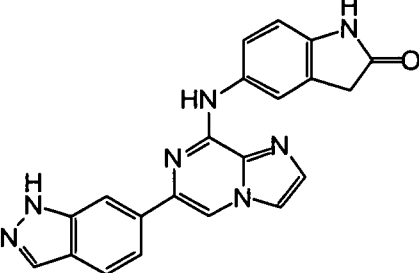
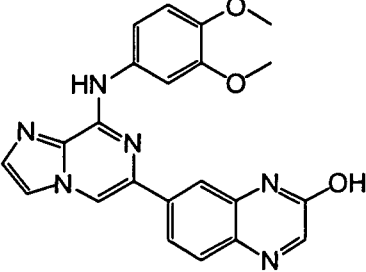
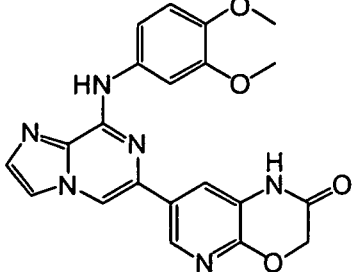
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-[3-(1,3-噁唑-2-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	414.3
	N-[6-(1H-𠵽啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]-3,4-二氫-2H-1,4-苯並𠵽啉-6-胺	384
	1-(4-{[6-(1H-𠵽啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)乙-1-醇	371.1
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-[4-(1,3-噻唑-2-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	430.5
	(5-{[6-(1H-𠵽啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)甲醇	387.2
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(1H-𠵽啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	386.3

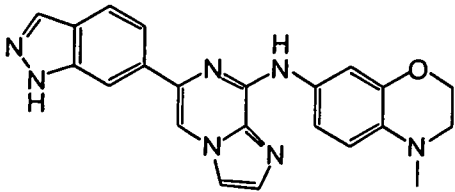
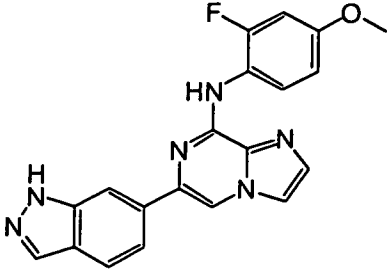
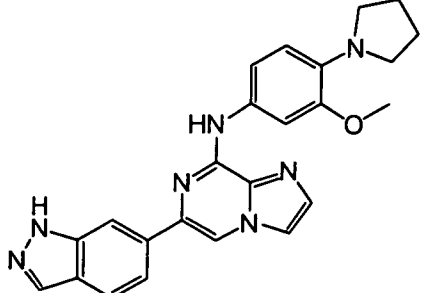
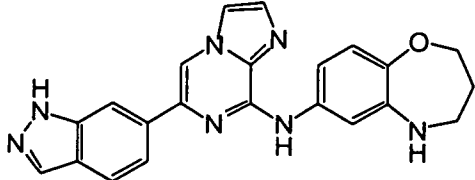
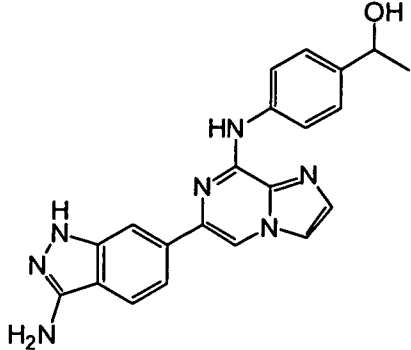
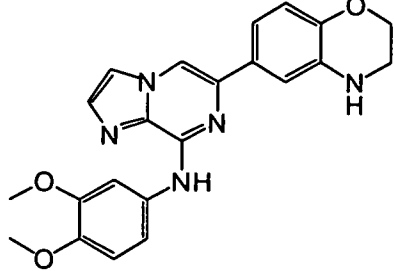
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(1- 甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	401.2
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)- 6-(1-甲基-1H-咪唑-5-基)咪 唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	415.6
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)- 6-(1-甲基-1H-咪唑-6-基)咪 唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	415.5
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(1- 甲基-1H-咪唑-5-基)咪唑並 [1,2-a]吡啉-8-胺	401.3
	6-(1H-1,2,3-苯並三唑-6-基)- N-(3,4-二甲氧基苯基)咪唑 並[1,2-a]吡啉-8-胺	388.2
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6- {1H-咪唑並[4,5-b]吡啶-6-基 }咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	388.3

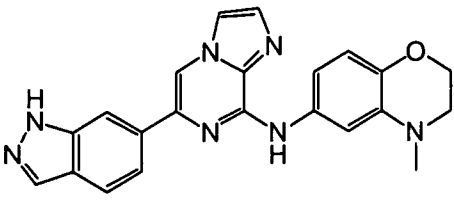
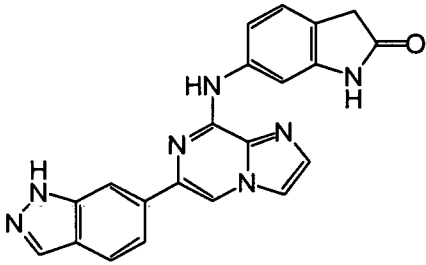
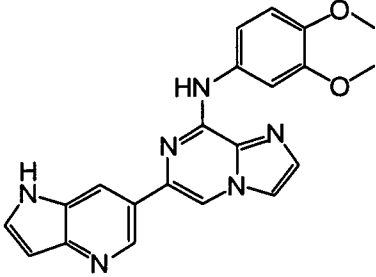
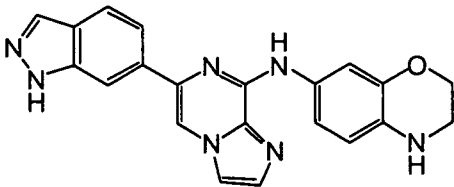
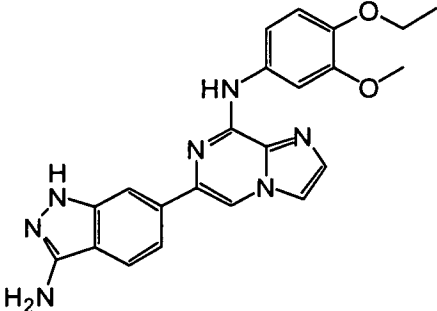
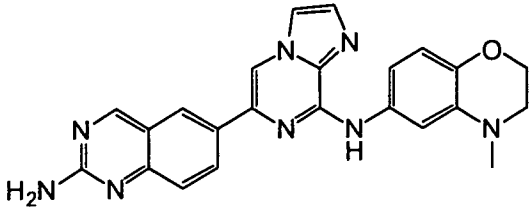
	6-(1,3- 苯並噁唑 -5- 基)-N-(3,4-二甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	388.7
	6-(1,3- 苯並噁唑 -6- 基)-N-(3,4-二甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	388.3
	6-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基}-4-甲基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁嗪-3-酮	432.4
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(1-甲基-1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	400.3
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6-(1H-吲哚-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	386.4
	6-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基}喹啉-3-胺	413.7

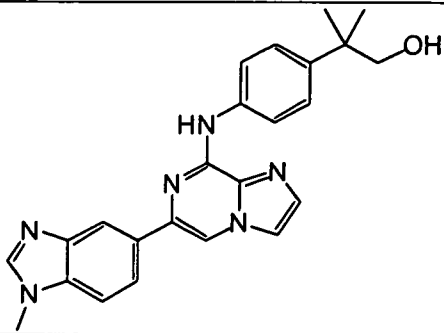
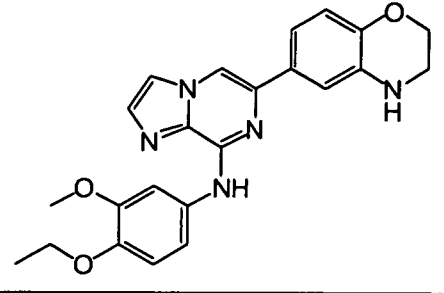
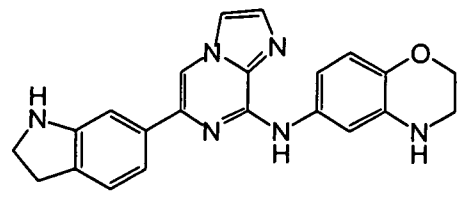
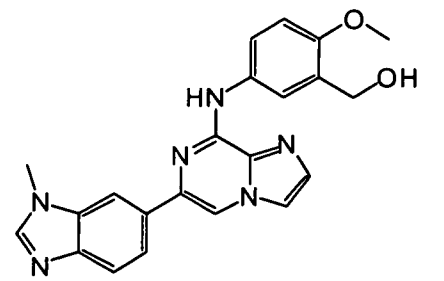
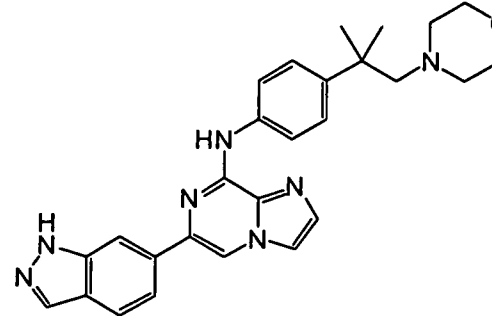
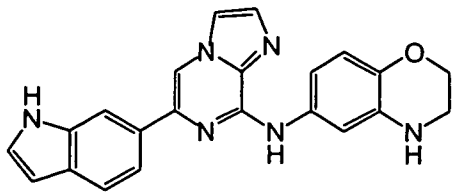
	2-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑 並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯 基)丙-2-醇	385.1
	5-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺 基]咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基}- 1H-咪唑-3-胺	402.1
	6-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺 基]咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基}- 1H-1,3-苯並二唑-2-胺	402.3
	6-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺 基]咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基}- 2H,3H,4H- 吡 啶 並 [3,2-b] [1,4]噁吡-3-酮	419.5
	6-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺 基]咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基}- 2- 甲基-3,4- 二氫-2H-1,4- 苯 並噁吡-3-酮	432.5
	6-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺 基]咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基}- 2,2-二甲基-3,4-二氫-2H-1,4- 苯並噁吡-3-酮	446.4

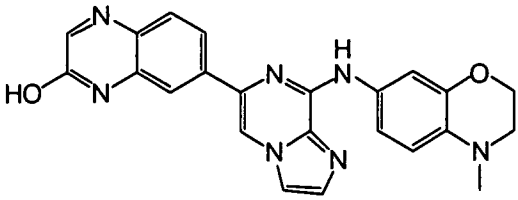
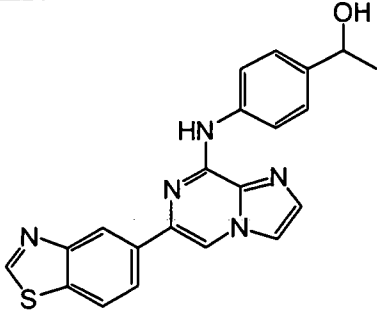
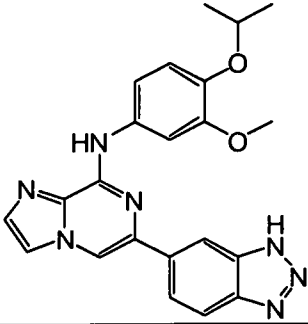
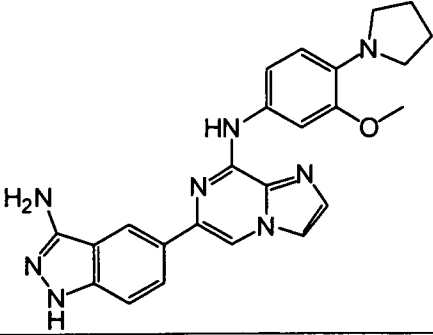
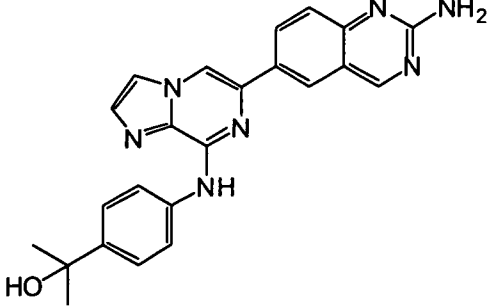
	7-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基}喹啉-2-醇	414.3
	2-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-2-甲基丙-1-醇	399.3
	6-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基}-1H-咪唑-3-胺	400.2
	(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)甲醇	385.3
	6-(2,3-二氫-1H-咪唑-6-基)-N-(3,4-二甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	388.8
	N-[6-(3-胺基-1H-咪唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡啶-6-胺	399.2

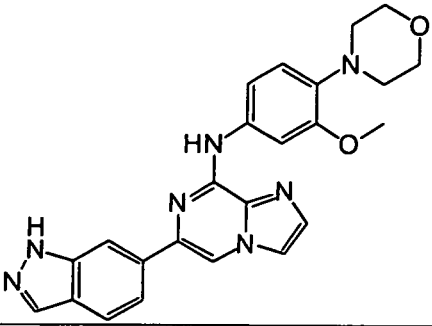
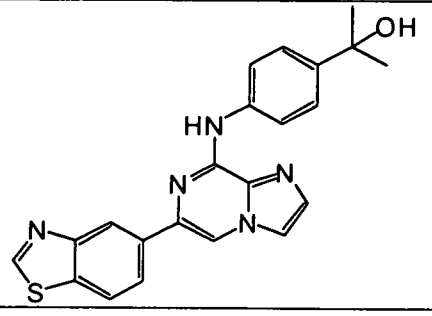
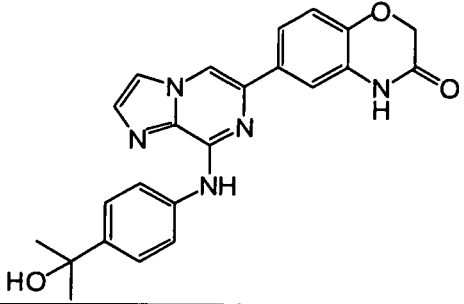
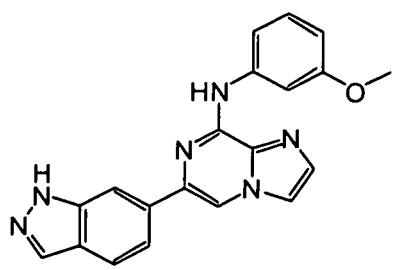
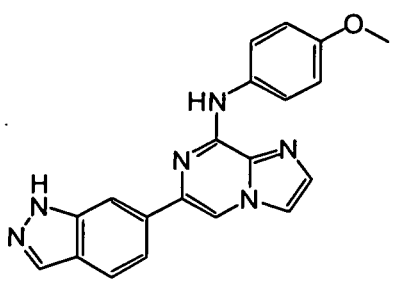
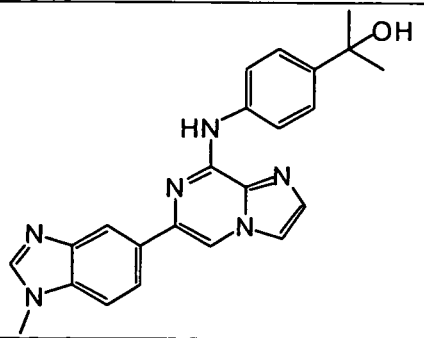
	N-{4-[3-(二甲基氨基)丙氧基]-3-甲氧基苯基}-6-(1H-咪唑啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	458.7
	3-(4-{[6-(1H-咪唑啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}-2-甲氧基苯氧基)丙-1-醇	431.6
	6-(1H-咪唑啉-6-基)-N-[4-甲氧基-3-(吡咯啉-1-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	426.3
	5-{[6-(1H-咪唑啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}-2,3-二氫-1H-咪唑啉-2-酮	382.3
	7-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基}咪唑啉-2-醇	413.5
	7-{8-[(3,4-二甲氧基苯基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基}-1H,2H,3H-吡啶並[2,3-b][1,4]咪唑啉-2-酮	419.5

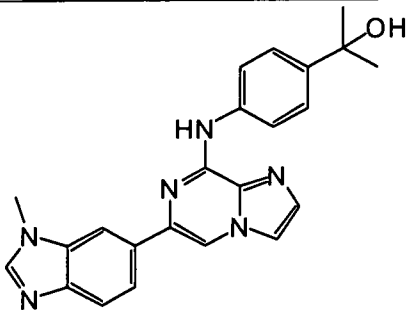
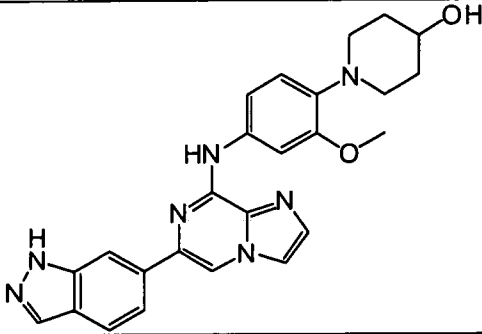
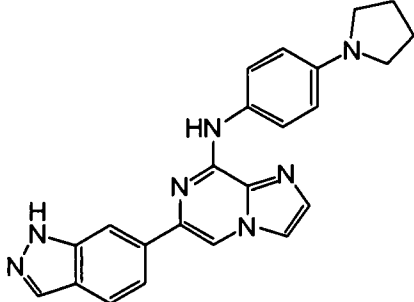
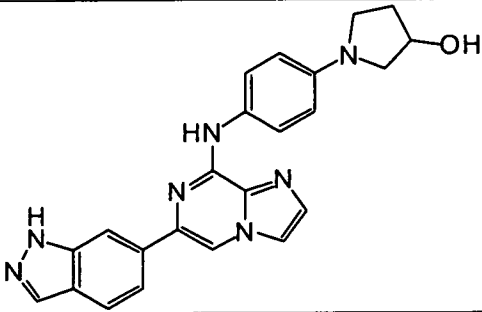
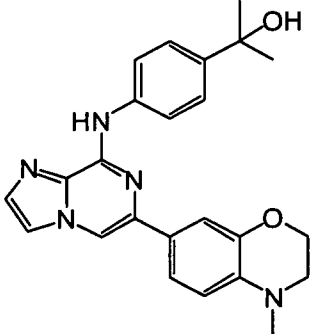
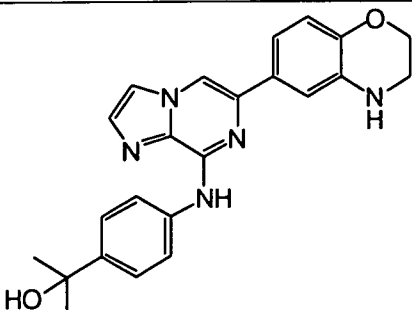
	N-[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]-4-甲基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁啉-7-胺	398.3
	N-(2-氟-4-甲氧基苯基)-6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	375.3
	6-(1H-咪唑-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(吡咯啶-1-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	425.5
	N-[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]-2,3,4,5-四氫-1,5-苯並噁氮呋-7-胺	398.5
	1-(4-{[6-(3-胺基-1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)乙-1-醇	386.4
	6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁啉-6-基)-N-(3,4-二甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	404.5

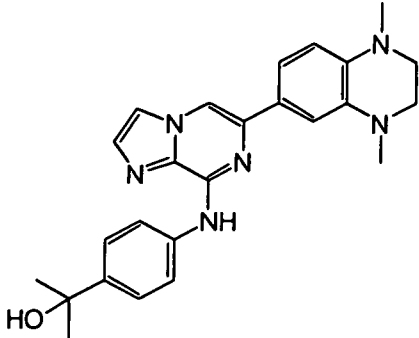
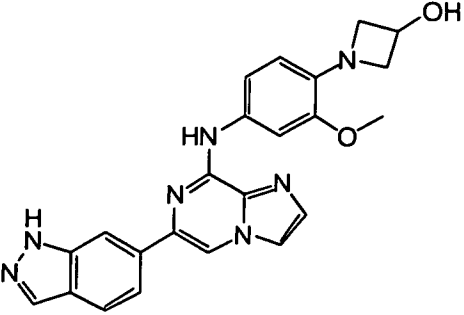
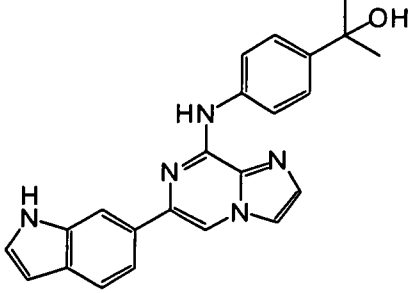
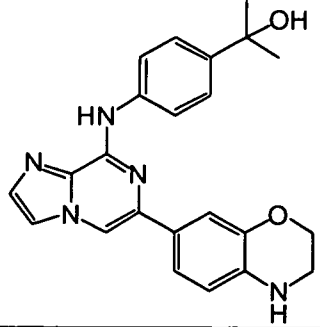
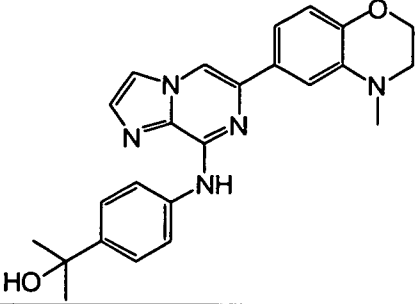
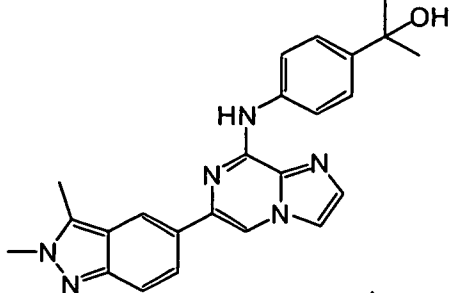
	N-[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]-4-甲基- 3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘧啶- 6-胺	396.3
	6-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2,3- 二氫-1H-吡啶-2-酮	382.3
	N-(3,4-二甲氧基苯基)-6- {1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基 }咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	387.6
	N-[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]-3,4-二氫- 2H-1,4-苯並嘧啶-7-胺	384.3
	6-{8-[(4-乙氧基-3-甲氧基苯 基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啶- 6-基}-1H-吡啶-3-胺	416.8
	N-[6-(2-胺基喹啉-6-基)咪 唑並[1,2-a]吡啶-8-基]-4-甲 基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並 嘧啶-6-胺	425.2

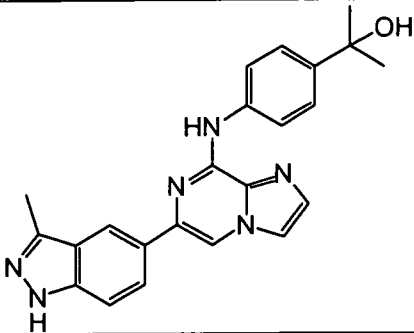
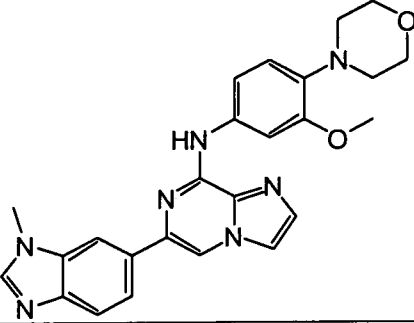
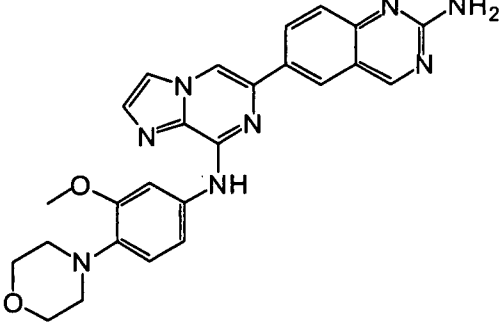
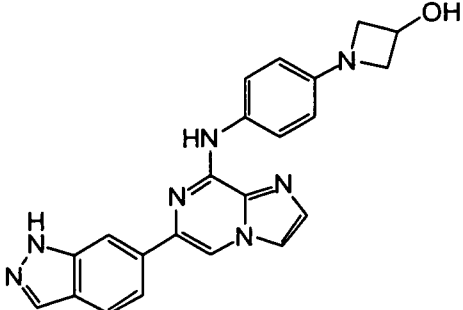
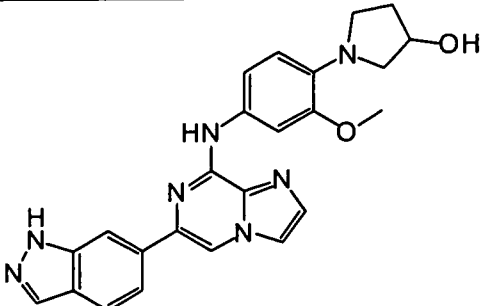
	2-甲基-2-(4-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)丙-1-醇	413.7
	6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡啉-6-基)-N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	418.4
	N-[6-(2,3-二氫-1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡啉-6-胺	385.3
	(2-甲氧基-5-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)甲醇	401.2
	6-(1H-吲哚-6-基)-N-{4-[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	468.6
	N-[6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡啉-6-胺	383.4

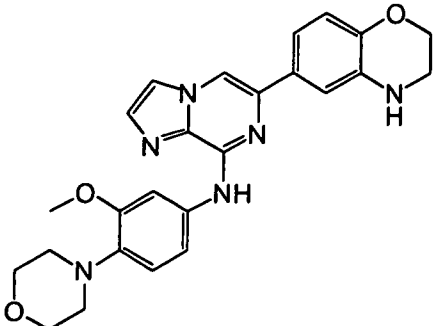
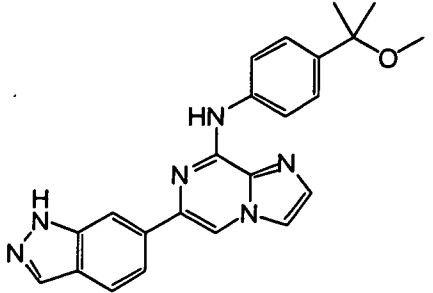
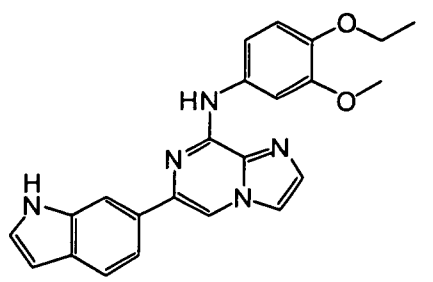
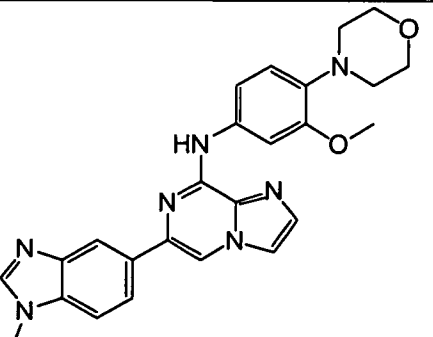
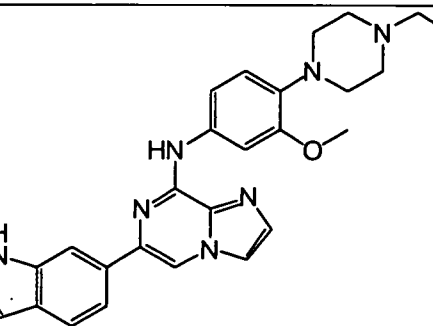
	7-{8-[(4-甲基-3,4-二氢-2H-1,4-苯並噁吡-7-基)氨基]咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基}噻唑啉-2-醇	426.2
	1-(4-{[6-(1,3-苯並噁唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)乙-1-醇	388.7
	6-(1H-1,2,3-苯並三唑-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(丙-2-基氧)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	416.6
	5-(8-{[3-甲氧基-4-(吡咯啉-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-吲唑-3-胺	441.4
	2-(4-{[6-(2-胺基噻唑啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)丙-2-醇	412.4

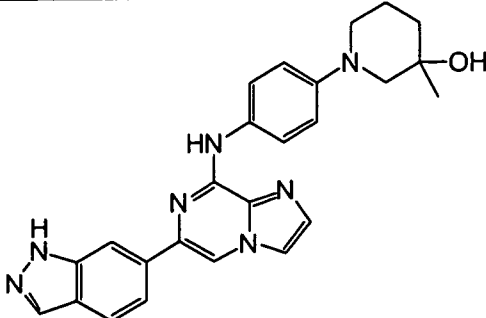
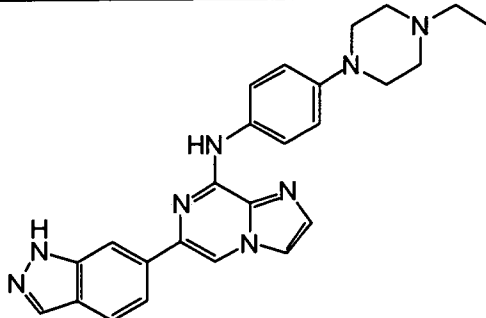
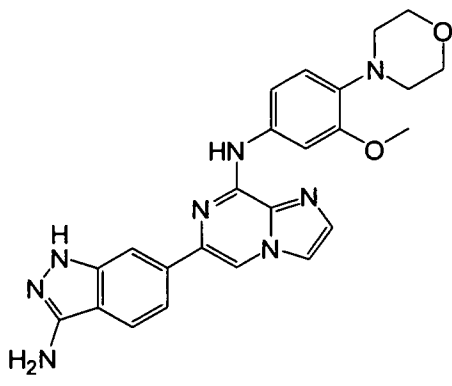
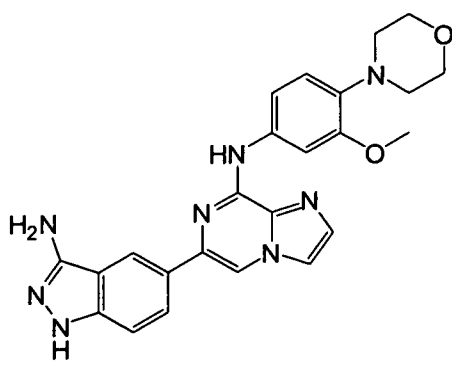
	6-(1H-吡啶-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	442.5
	2-(4-{[6-(1,3-苯並噻唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)丙-2-醇	402.3
	6-(8-{[4-(2-羥基丙-2-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-3-酮	416.7
	6-(1H-吡啶-6-基)-N-(3-甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	357.3
	6-(1H-吡啶-6-基)-N-(4-甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	357.3
	2-(4-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)丙-2-醇	399.1

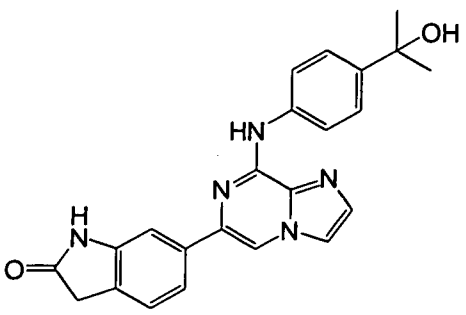
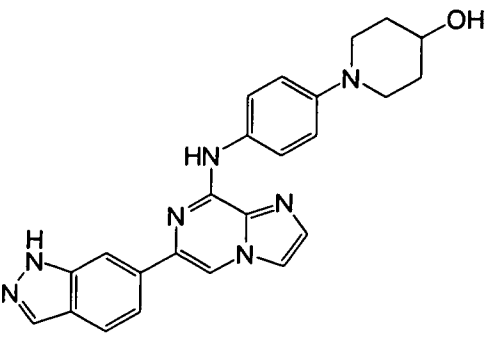
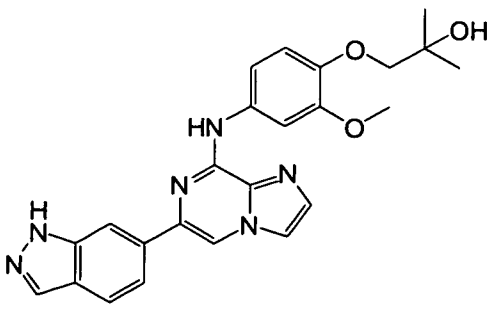
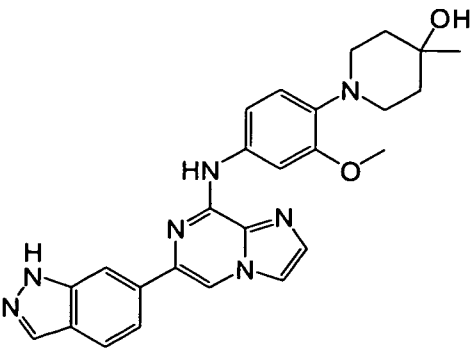
	2-(4-{[6-(1- 甲基 -1H-1,3- 苯 並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a] 吡啶-8-基]胺基} 苯基)丙-2- 醇	399.2
	1-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑 並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2- 甲氧基苯基)哌啶-4-醇	456.5
	6-(1H- 咪唑 -6- 基)-N-[4-(吡 咯啶-1-基)苯基]咪唑並[1,2- a]吡啶-8-胺	396.1
	1-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑 並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基} 苯 基)吡咯啶-3-醇	412.3
	2-(4-{[6-(4- 甲基 -3,4- 二氫 - 2H-1,4- 苯並噁啶-7-基)咪唑 並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基} 苯 基)丙-2-醇	416.5
	2-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4- 苯 並噁啶-6-基)咪唑並[1,2-a] 吡啶-8-基]胺基} 苯基)丙-2- 醇	402.5

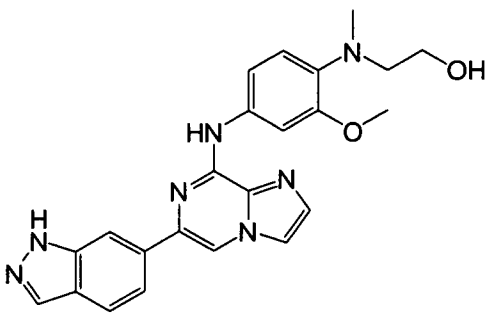
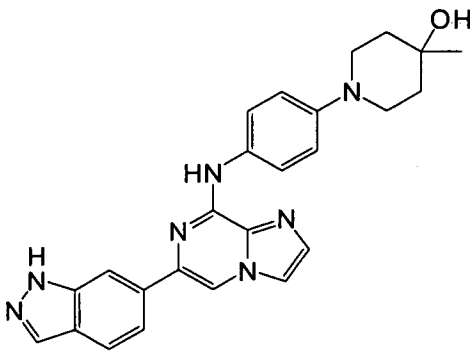
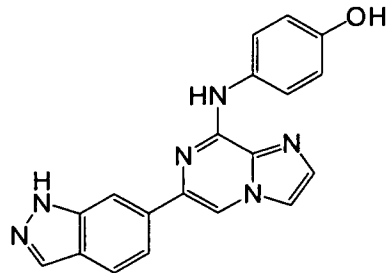
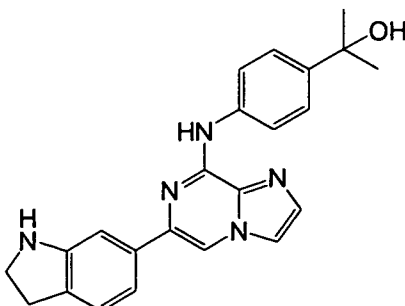
	2-(4- {[6-(1,4-二甲基-1,2,3,4-四氢喹啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)丙-2-醇	429.4
	1-(4- {[6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)四氫吡啶-3-醇	428.3
	2-(4- {[6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)丙-2-醇	384.2
	2-(4- {[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並咪唑-7-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)丙-2-醇	402.5
	2-(4- {[6-(4-甲基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)丙-2-醇	416.7
	2-(4- {[6-(2,3-二甲基-2H-吲哚-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)丙-2-醇	413.4

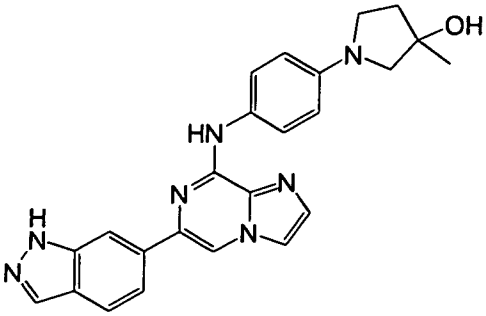
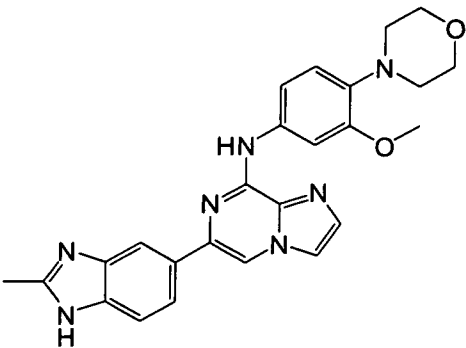
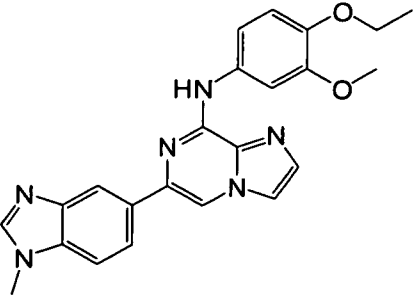
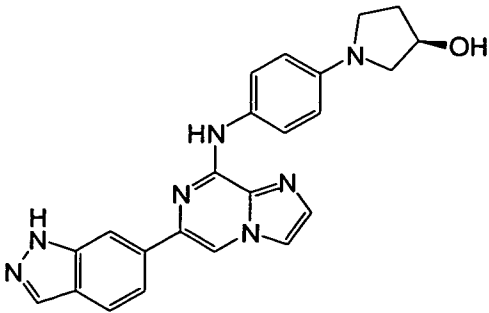
	2-(4-{{6-(3-甲基-1H-咪唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基}胺基}苯基)丙-2-醇	399.2
	N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	456.3
	6-(8-{{3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)喹唑啉-2-胺	469.4
	1-(4-{{6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基}胺基}苯基)四氫吡啶-3-醇	398.3
	1-(4-{{6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基}胺基}-2-甲氧基苯基)吡咯啉-3-醇	442.5

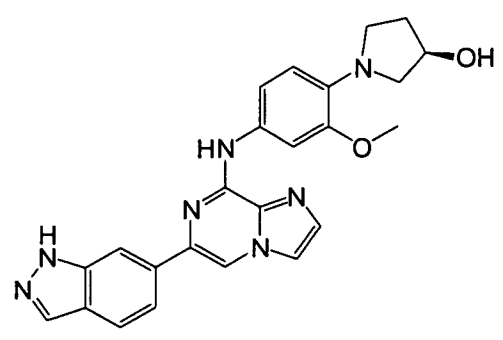
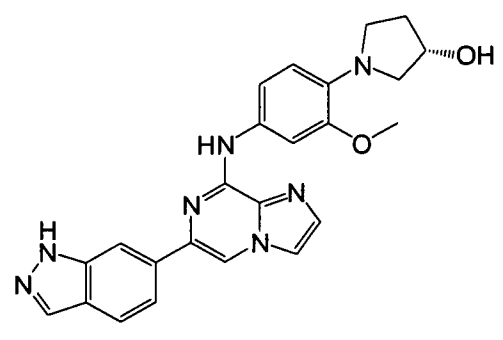
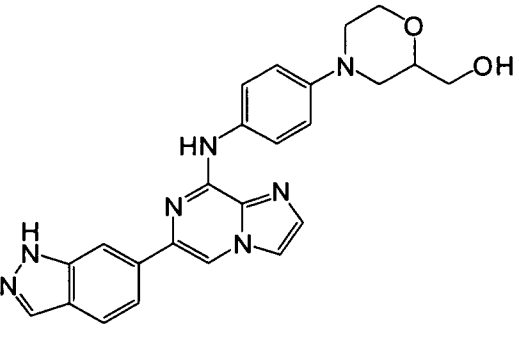
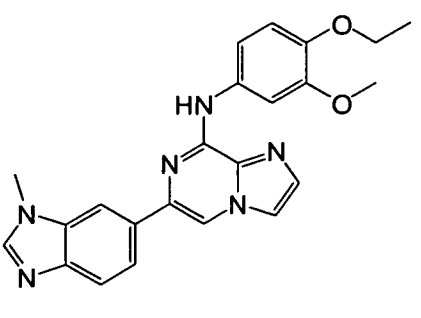
	6-(3,4- 二 氫 -2H-1,4- 苯 並 噁 咩 -6- 基)-N-[3- 甲 氧 基 -4-(嗎 啉 -4- 基) 苯 基] 咪 唑 並 [1,2- a] 吡 咩 -8- 胺	459.7
	6-(1H- 咩 咩 -6- 基)-N-[4-(2- 甲 氧 基 丙 -2- 基) 苯 基] 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8- 胺	399.4
	N-(4- 乙 氧 基 -3- 甲 氧 基 苯 基)- 6-(1H- 咩 咩 -6- 基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8- 胺	400.1
	N-[3- 甲 氧 基 -4-(嗎 啉 -4- 基) 苯 基]-6-(1- 甲 基 -1H-1,3- 苯 並 二 咩 -5- 基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8- 胺	456.4
	N-[4-(4- 乙 基 哌 咩 -1- 基)-3- 甲 氧 基 苯 基]-6-(1H- 咩 咩 -6- 基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩 -8- 胺	469.7

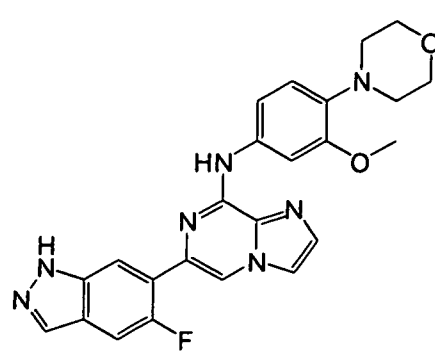
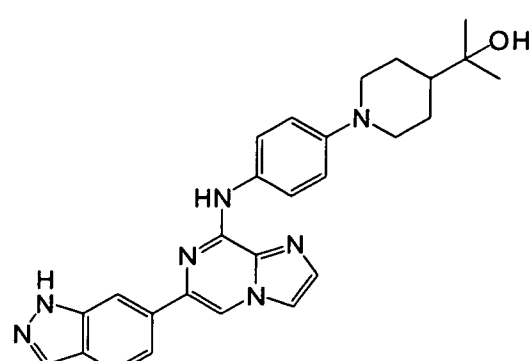
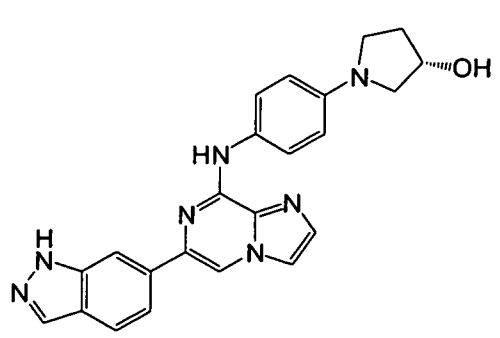
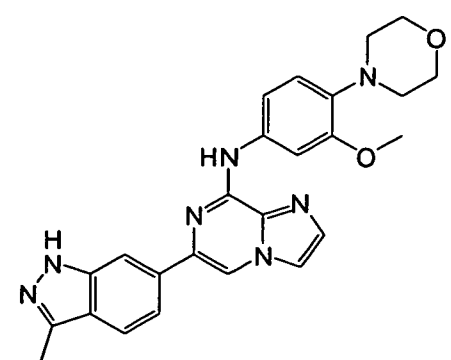
	1-(4-{{6-(1H-吡唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基}胺基}苯基)-3-甲基哌啶-3-醇	440.5
	N-[4-(4-乙基哌啶-1-基)苯基]-6-(1H-吡唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	439.4
	6-(8-{{3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-1H-吡唑-3-胺	457.6
	5-(8-{{3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-1H-吡唑-3-胺	457.5

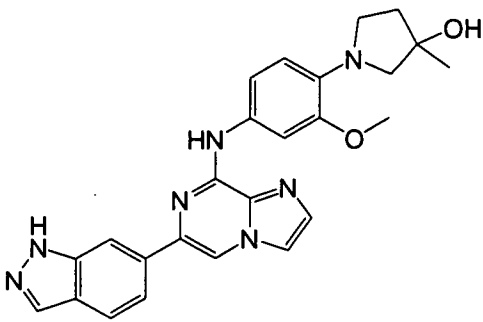
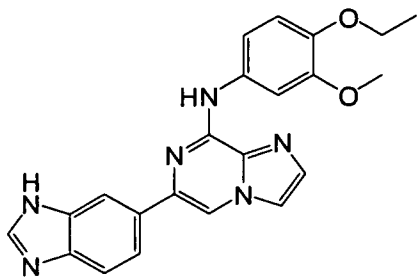
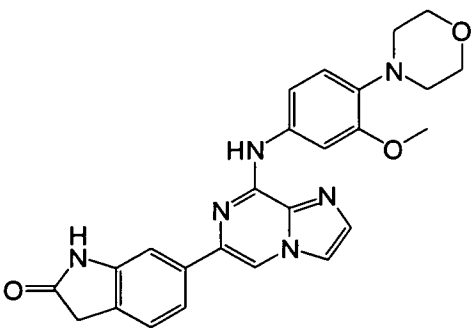
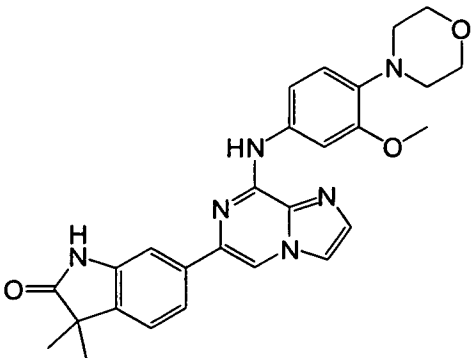
	6-(8-([4-(2-羟基丙-2-基)苯基]氨基)咪唑并[1,2-a]吡啉-6-基)-2,3-二氢-1H-吲哚-2-酮	399.45
	1-(4-([6-(1H-咪唑并[1,2-a]吡啉-6-基]氨基)苯基)哌啶-4-醇	426.2
	1-(4-([6-(1H-咪唑并[1,2-a]吡啉-6-基]氨基)-2-甲氧基苯氧基)-2-甲基丙-2-醇	443.6
	1-(4-([6-(1H-咪唑并[1,2-a]吡啉-6-基]氨基)-2-甲氧基苯基)-4-甲基哌啶-4-醇	470.9

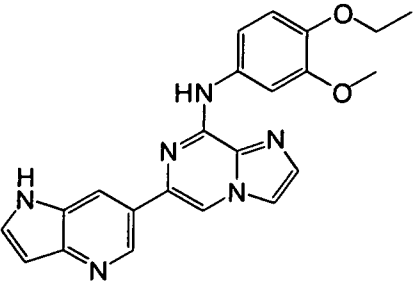
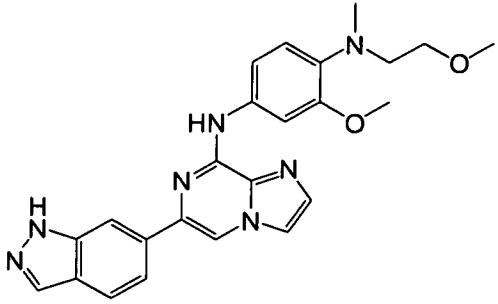
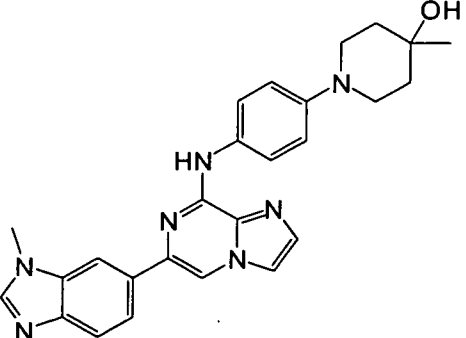
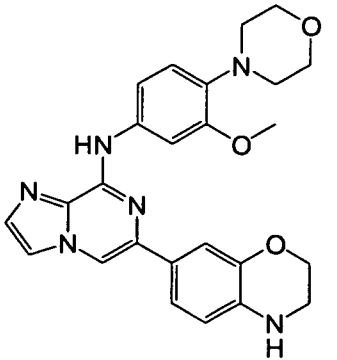
	2-[(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)(甲基)胺基]乙-1-醇	430.5
	1-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-4-甲基哌啶-4-醇	440.4
	4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}酚	343.2
	2-(4-{[6-(2,3-二氫-1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)丙-2-醇	386.2

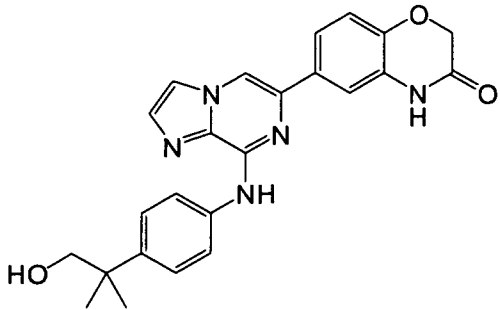
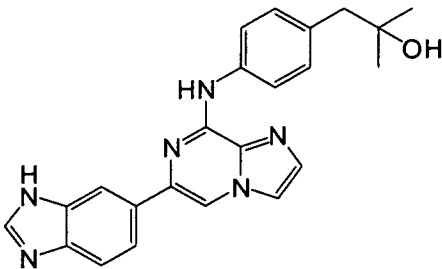
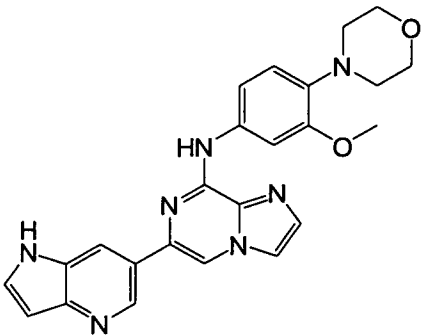
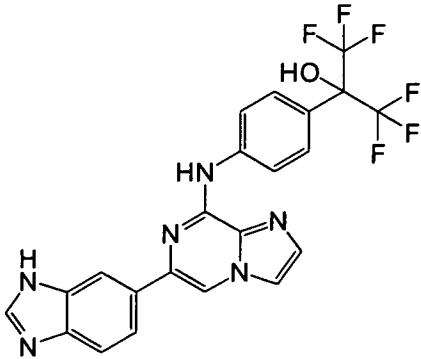
	1-(4-{{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)-3-甲基吡咯啉-3-醇	426.2
	N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(2-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	456.3
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)-6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	415.6
	(3R)-1-(4-{{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)吡咯啉-3-醇	412.2

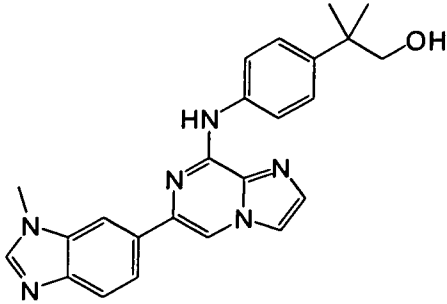
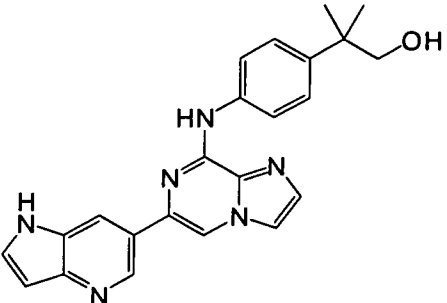
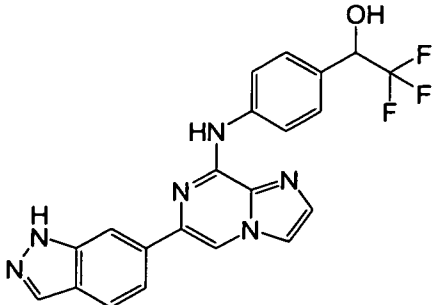
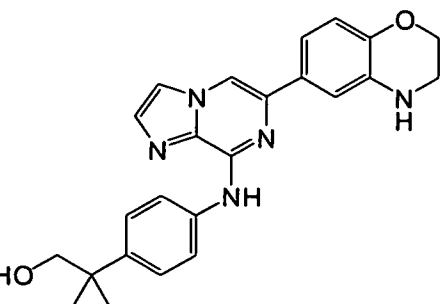
	(3R)-1-(4-([6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基)-2-甲氧基苯基)吡咯啉-3-醇	442.7
	(3S)-1-(4-([6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基)-2-甲氧基苯基)吡咯啉-3-醇	442.7
	[4-(4-([6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基)苯基)嗎啉-2-基]甲醇	442.7
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)-6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	415.4

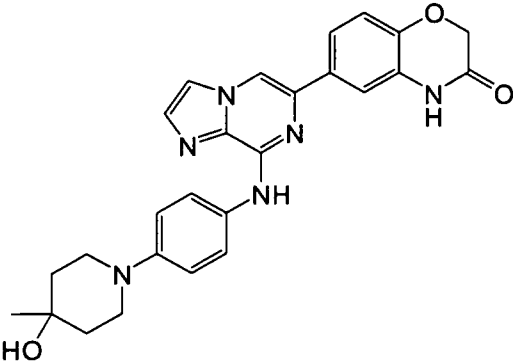
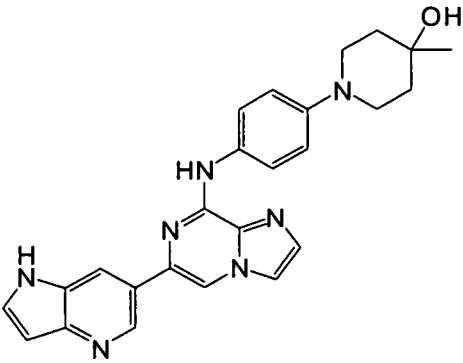
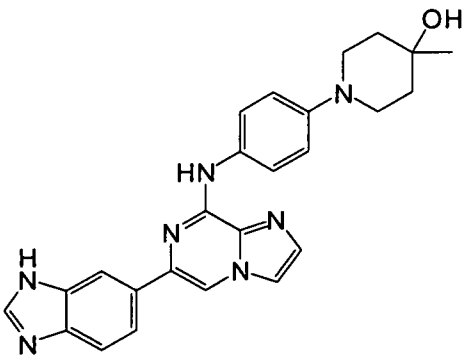
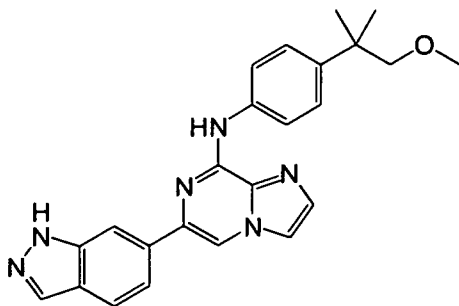
	6-(5-氟-1H-吡唑-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	460.6
	2-[1-(4-{[6-(1H-吡唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)哌啶-4-基]丙-2-醇	468.5
	(3S)-1-(4-{[6-(1H-吡唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)吡咯啉-3-醇	412.1
	N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(3-甲基-1H-吡唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	456.2

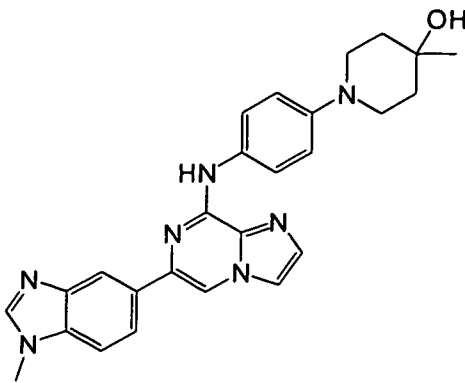
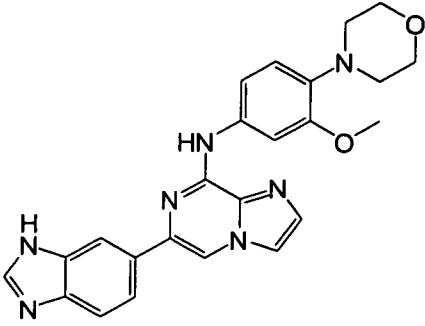
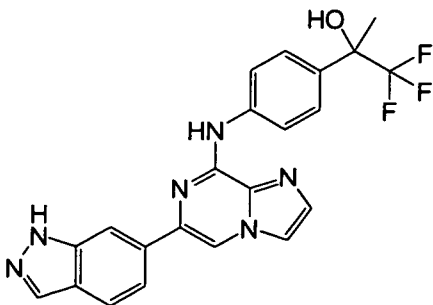
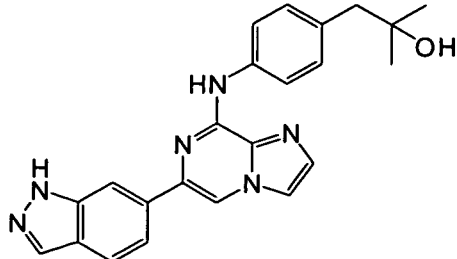
	1-(4-([6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基)-2-甲氧基苯基)-3-甲基吡咯啉-3-醇	456.2
	6-(1H-1,3-苯並二唑-6-基)-N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	401.2
	6-(8-([3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基)咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-2,3-二氫-1H-咪唑-2-酮	457.7
	6-(8-([3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基)咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-3,3-二甲基-2,3-二氫-1H-咪唑-2-酮	485.7

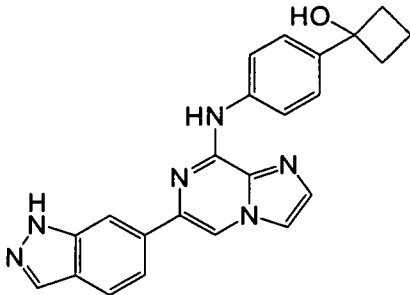
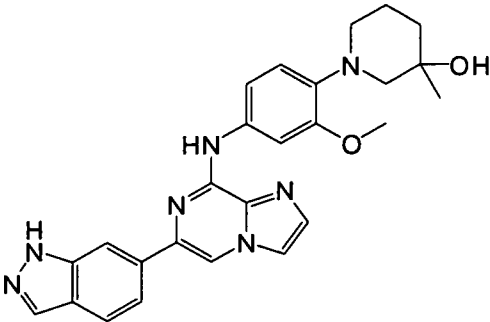
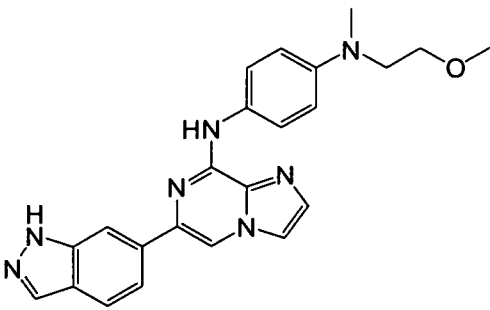
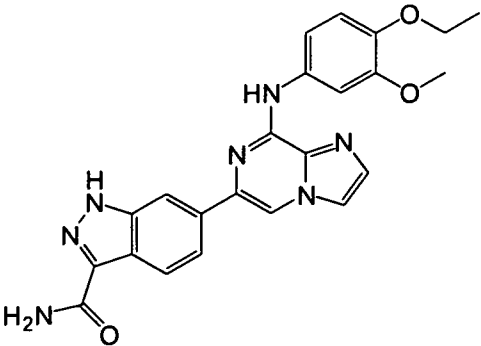
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)- 6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6- 基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	401.2
	4-N-[6-(1H-咪唑並[6,5-b]吡啶-6-基)咪唑 並[1,2-a]吡啶-8-基]-2-甲氧 基-1-N-(2-甲氧基乙基)-1-N- 甲基苯-1,4-二胺	444.3
	4-甲基-1-(4-{[6-(1-甲基-1H- 1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基) 哌啶-4-醇	454.1
	6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並 嗎啉-7-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2- a]吡啶-8-胺	459.4

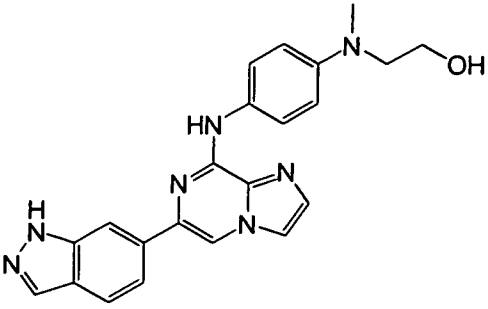
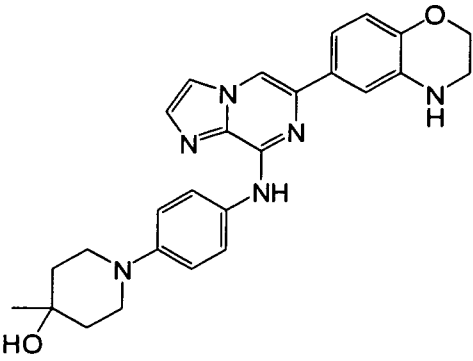
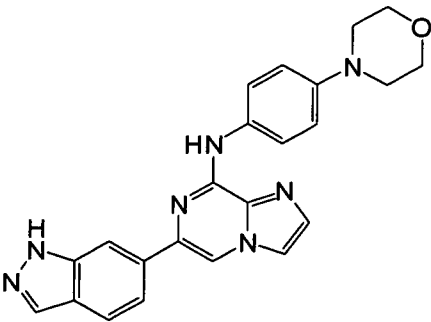
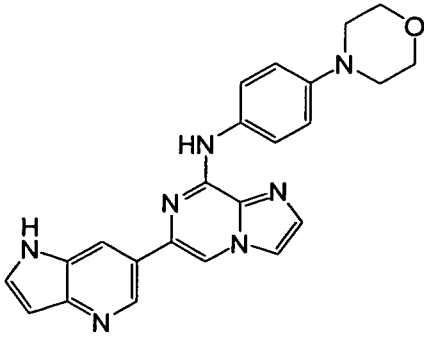
	6-(8-([4-(1-羟基-2-甲基丙-2-基)苯基]胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,4-二氢-2H-1,4-苯並噁啉-3-酮	430.2
	1-(4-([6-(1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基)苯基)-2-甲基丙-2-醇	397.2
	N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	442.7
	2-(4-([6-(1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基)苯基)-1,1,1,3,3,3-六氟丙-2-醇	493.5

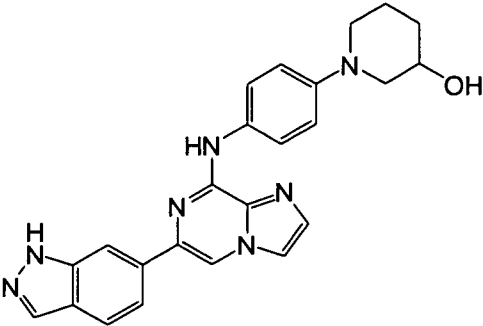
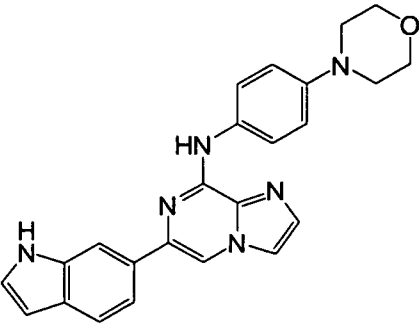
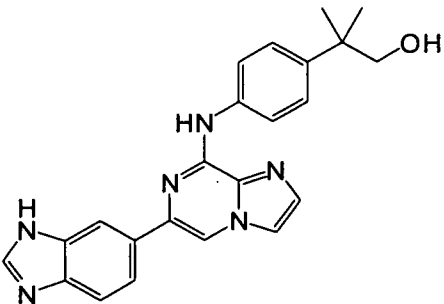
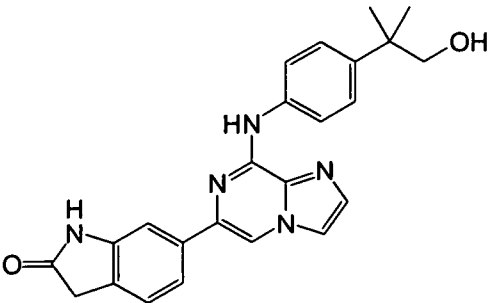
	2-甲基-2-(4-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)丙-1-醇	413.4
	2-甲基-2-{4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基)胺基]苯基}丙-1-醇	399.2
	2,2,2-三氟-1-(4-{[6-(1H-咪唑並[5,4-b]吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)乙-1-醇	425.3
	2-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)-2-甲基丙-1-醇	416.8

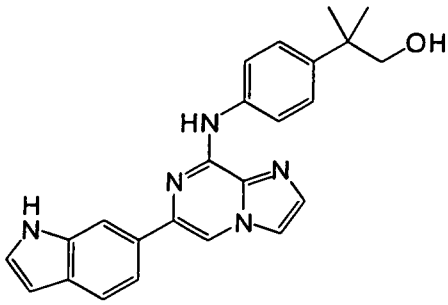
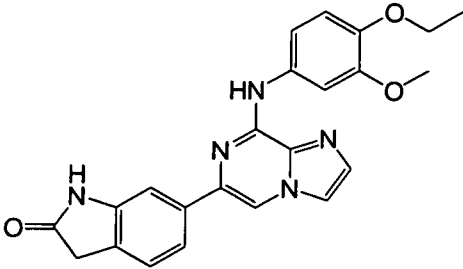
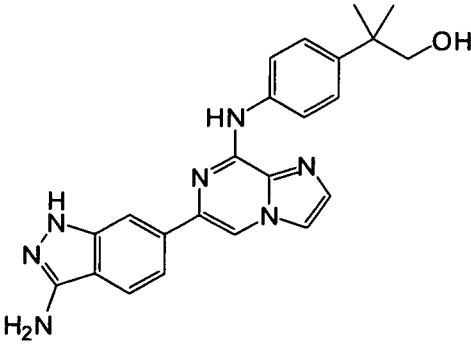
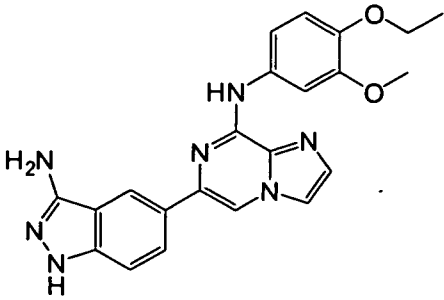
	6-(8-([4-(4- 羥基 -4- 甲基哌啶-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-3,4- 二氫-2H-1,4-苯並嘔啉-3-酮	471.7
	4-甲基-1-{4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基)胺基]苯基}哌啶-4-醇	440.5
	1-(4-{[6-(1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)-4-甲基哌啶-4-醇	438.2
	6-(1H-呔啉-6-基)-N-[4-(1-甲氧基-2-甲基丙-2-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	413.3

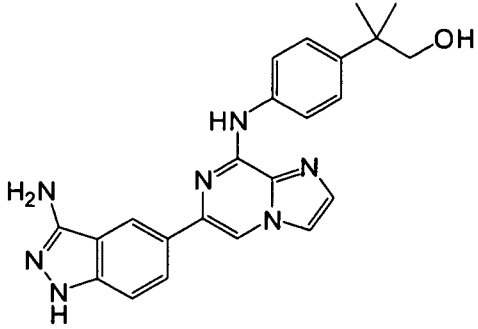
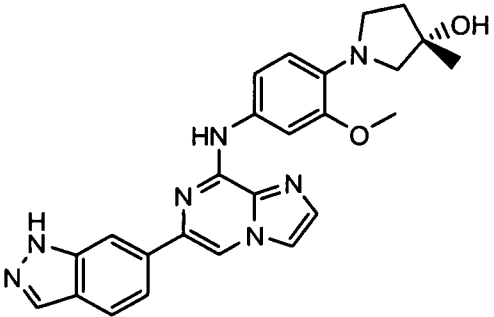
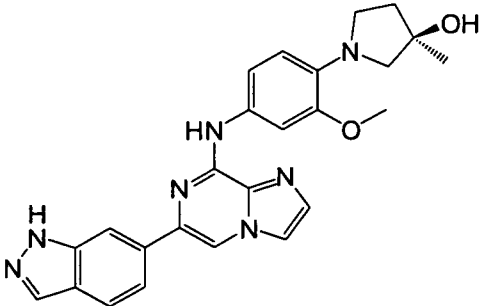
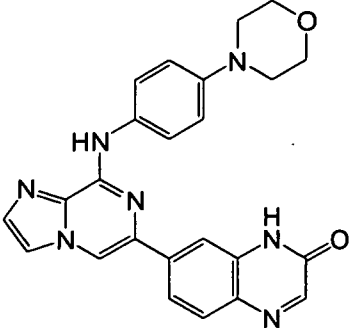
	4-甲基-1-(4-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)哌啶-4-醇	454.1
	6-(1H-1,3-苯並二唑-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啶-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	442.8
	1,1,1-三氟-2-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)丙-2-醇	437.4
	1-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-2-甲基丙-2-醇	399.3

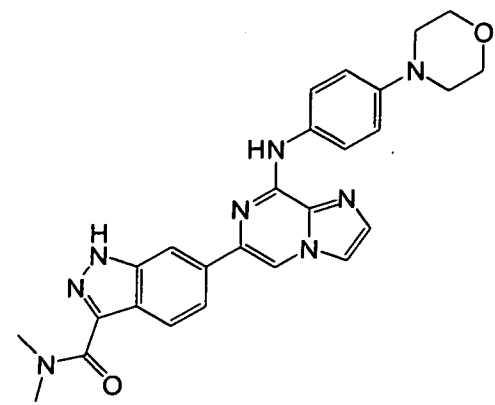
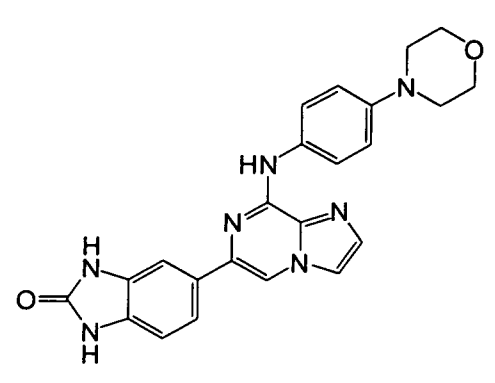
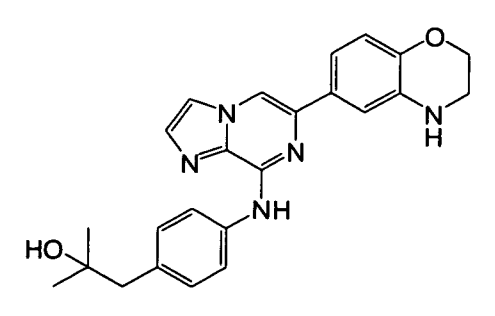
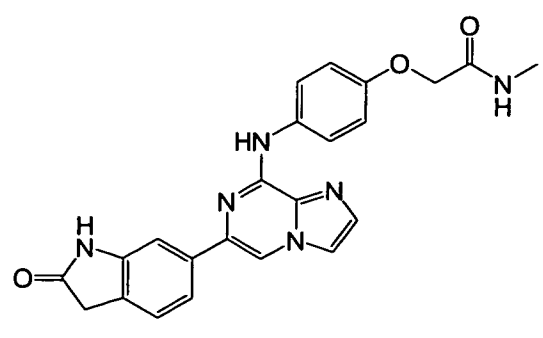
	1-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑 並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯 基)環丁-1-醇	397.2
	1-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑 並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}-2- 甲氧基苯基)-3-甲基哌啶-3- 醇	470.9
	4-N-[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑 並[1,2-a]吡啉-8-基]-1-N-(2- 甲氧基乙基)-1-N-甲基苯- 1,4-二胺	414.5
	6-{8-[(4-乙氧基-3-甲氧基苯 基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啉- 6-基}-1H-咪唑-3-羧醯胺	444.8

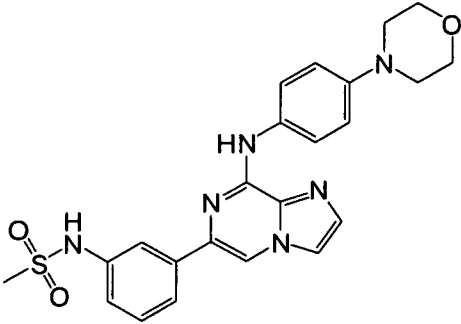
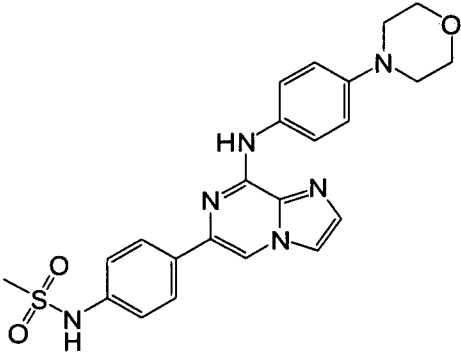
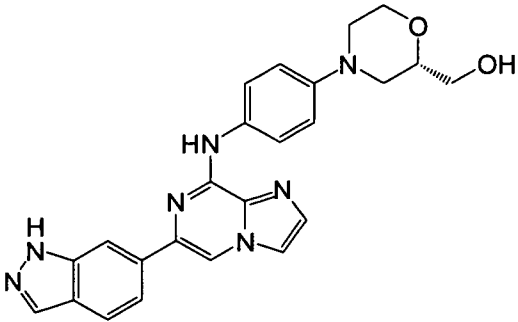
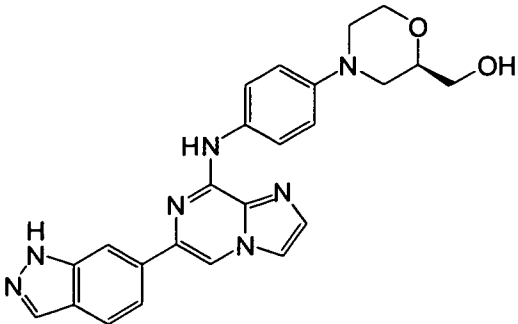
	2-[(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)(甲基)胺基]乙-1-醇	400.2
	1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘓啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)-4-甲基哌啶-4-醇	457.6
	6-(1H-咪唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	412.4
	N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	412.5

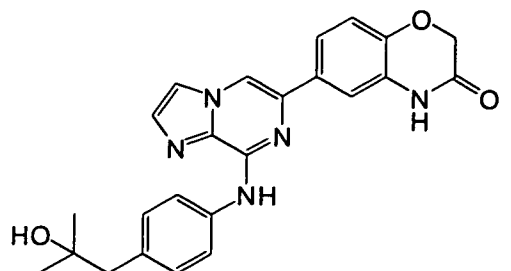
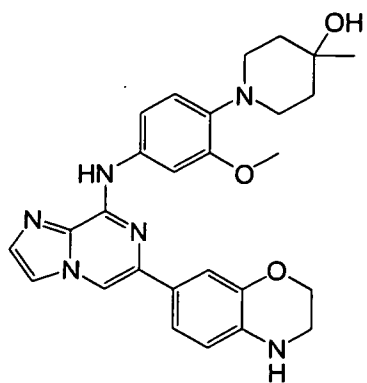
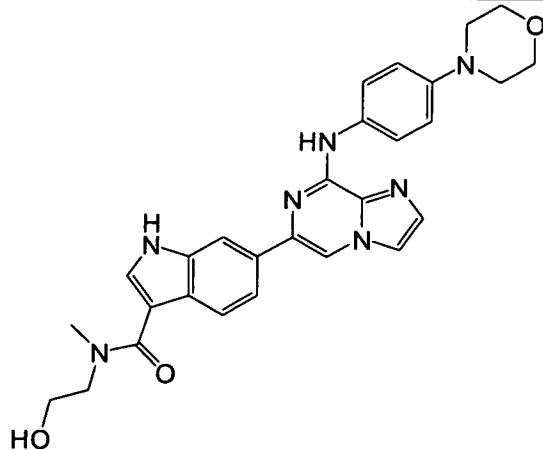
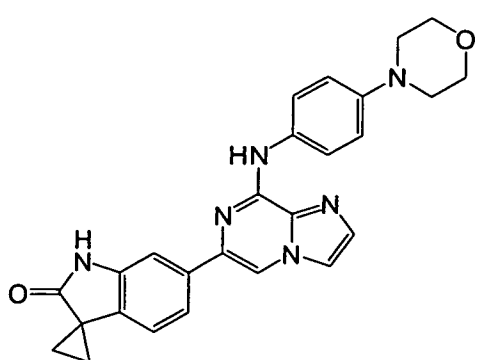
	1-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑 並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯 基)哌啶-3-醇	426.2
	6-(1H-咪唑-6-基)-N-[4-(嗎 啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a] 吡啶-8-胺	411.2
	2-(4-{[6-(1H-1,3-苯並二唑- 6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-2-甲基丙-1-醇	399.1
	6-(8-{[4-(1-羥基-2-甲基丙- 2-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2- a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-咪 唑-2-酮	414.5

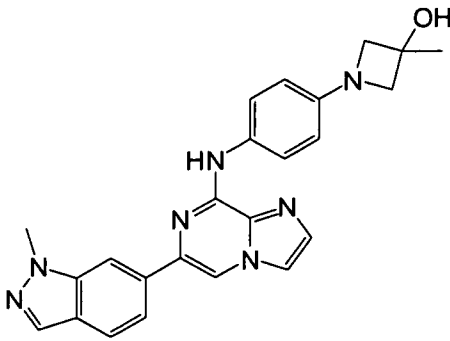
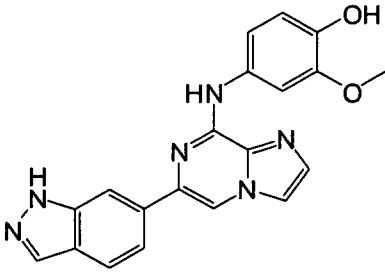
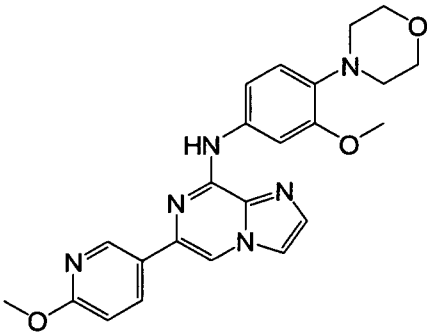
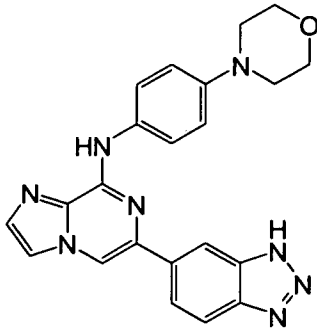
	2-(4-{{6-(1H-吡啶-6-基)咪唑 並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯 基)-2-甲基丙-1-醇	398.2
	6-{8-[(4-乙氧基-3-甲氧基苯 基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啶- 6-基}-2,3-二氫-1H-吡啶-2- 酮	416.7
	2-(4-{{6-(3-胺基-1H-吡啶-6- 基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基] 胺基}苯基)-2-甲基丙-1-醇	414.4
	5-{8-[(4-乙氧基-3-甲氧基苯 基)胺基]咪唑並[1,2-a]吡啶- 6-基}-1H-吡啶-3-胺	416.7

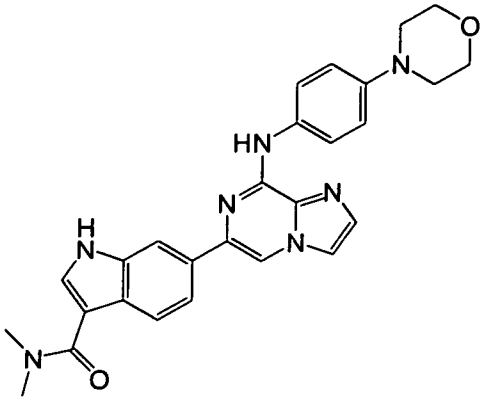
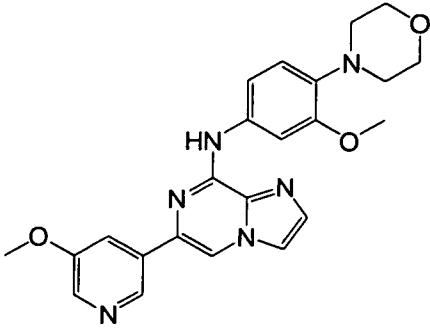
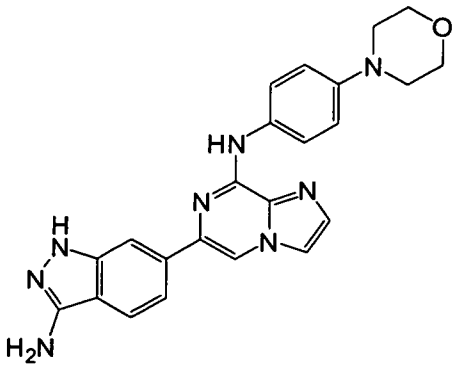
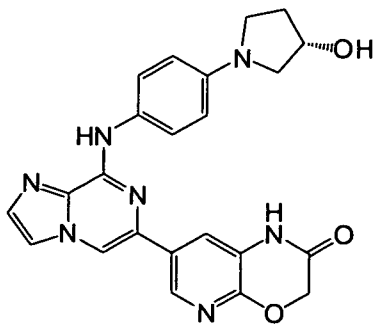
	2-(4-([6-(3-氨基-1H-咪唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]氨基)苯基)-2-甲基丙-1-醇	414.6
	(3S)-1-(4-([6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]氨基)-2-甲氧基苯基)-3-甲基吡咯啉-3-醇	456.1
	(3R)-1-(4-([6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]氨基)-2-甲氧基苯基)-3-甲基吡咯啉-3-醇	456.2
	7-(8-([4-(嗎啉-4-基)苯基]氨基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1,2-二氫喹啉-2-酮	440.5

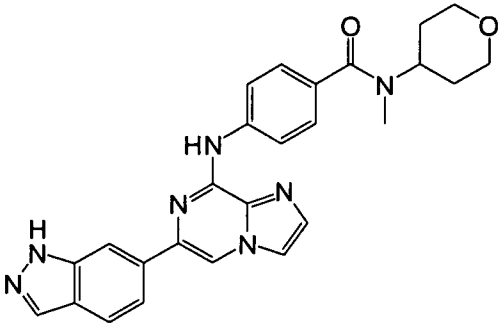
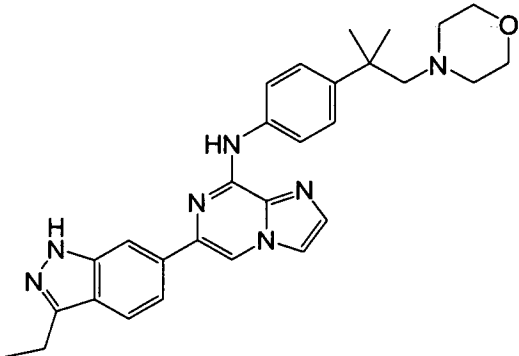
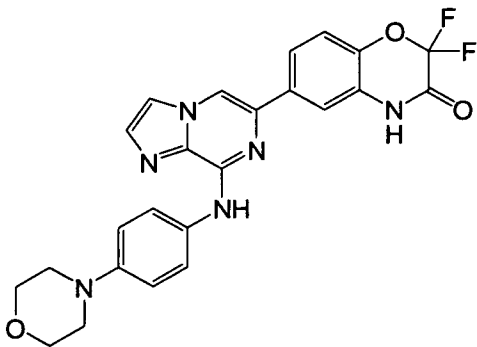
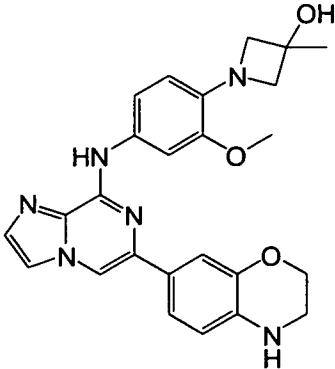
	N,N-二甲基-6-(8-{{4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-吲唑-3-羧醯胺	483.4
	5-(8-{{4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮	428.3
	1-(4-{{6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基}胺基}苯基)-2-甲基丙-2-醇	416.8
	N-甲基-2-(4-{{6-(2-側氧基-2,3-二氫-1H-噁咪啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基}胺基}苯氧基)乙醯胺	429.4

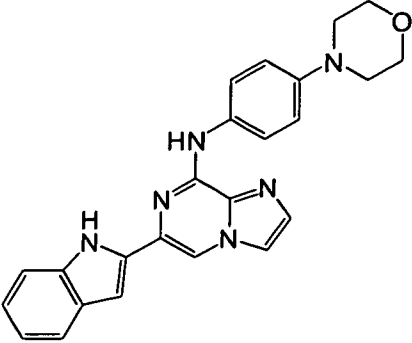
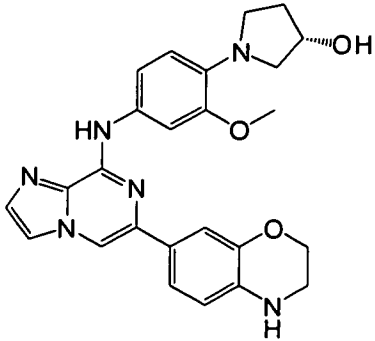
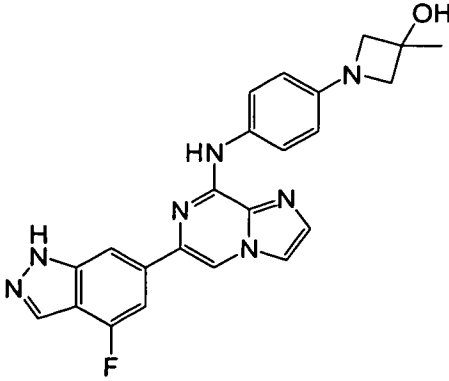
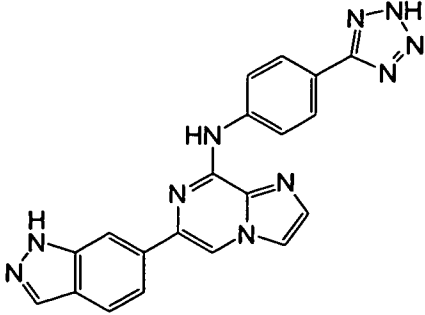
	N-[3-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6- 基)苯基]甲磺醯胺	465.4
	N-[4-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6- 基)苯基]甲磺醯胺	465.4
	[(2S)-4-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)]胺基}苯基)嗎啉-2-基]甲醇	442.3
	[(2R)-4-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)]胺基}苯基)嗎啉-2-基]甲醇	442.3

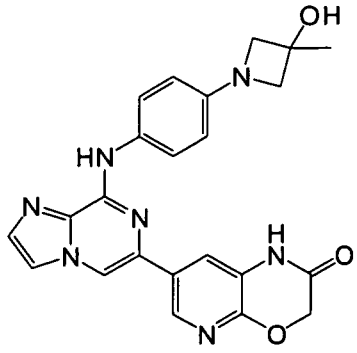
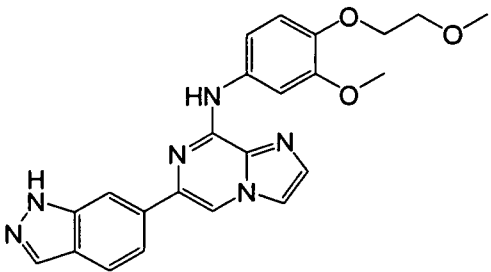
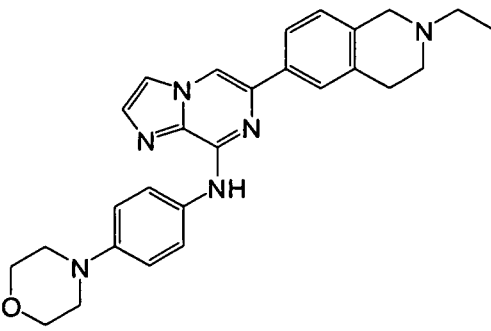
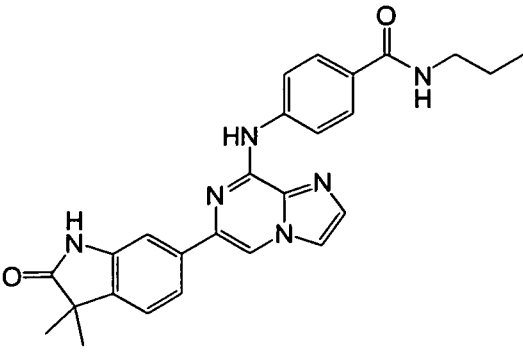
	6-(8-([4-(2-羥基-2-甲基丙基)苯基]胺基)咪唑並[1,2-a]吡 啉-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯 並噁啉-3-酮	430.4
	1-(4-([6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯 並噁啉-7-基)咪唑並[1,2-a] 吡啉-8-基]胺基)-2-甲氧基 苯基)-4-甲基哌啶-4-醇	487.5
	N-(2-羥基乙基)-N-甲基-6- (8-([4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基)咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)- 1H-吲哚-3-羧醯胺	512.7
	6'-(8-([4-(嗎啉-4-基)苯基]胺 基)咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)- 1',2'-二氫螺[環丙烷-1,3'-吲 哚]-2'-酮	453.1

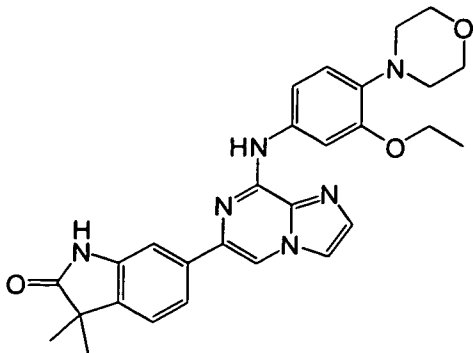
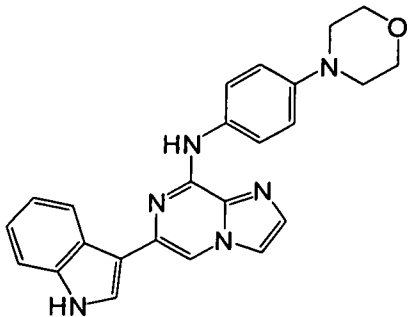
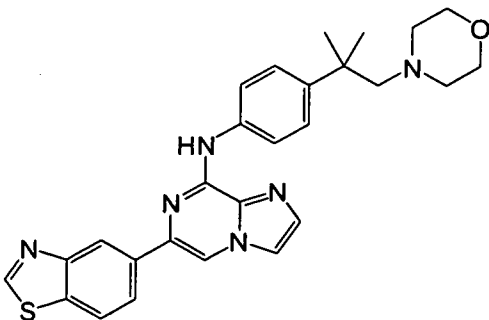
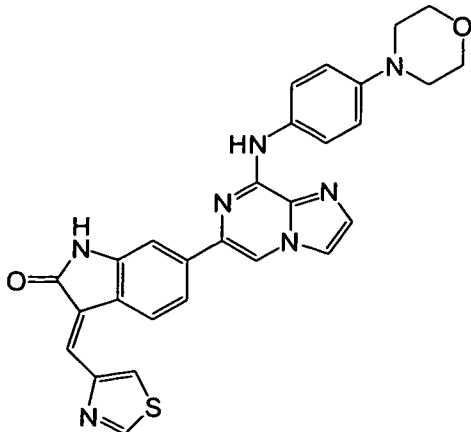
	3-甲基-1-(4-{{[6-(1-甲基-1H- 咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡 啉-8-基]胺基}苯基)四氫呋 啉-3-醇	426.3
	4-{{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並 [1,2-a]吡啉-8-基]胺基}-2-甲 氧基酚	373.2
	N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基) 苯基]-6-(6-甲氧基吡啶-3-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	433.5
	6-(1H-1,2,3-苯並三唑-6-基)- N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑 並[1,2-a]吡啉-8-胺	413.5

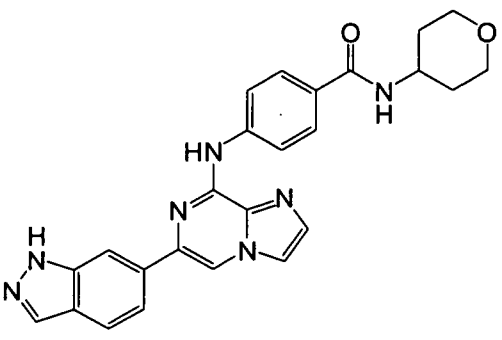
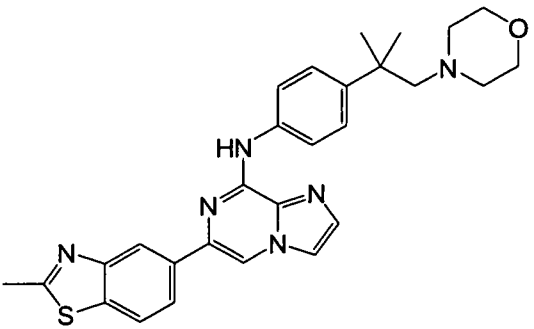
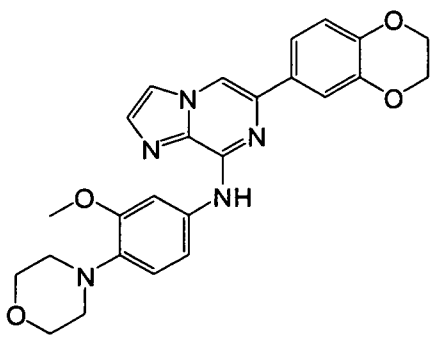
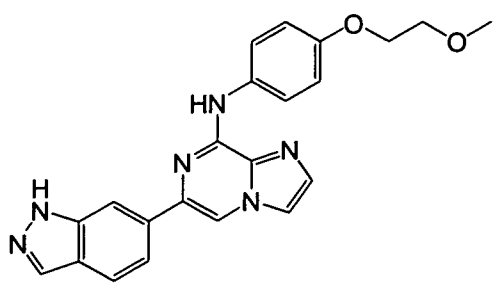
	N,N-二甲基-6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-吲哚-3-羧醯胺	482.4
	N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(5-甲氧基吡啶-3-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	433.4
	6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-吲哚-3-胺	427.4
	7-[8-({4-[(3S)-3-羥基吡咯啉-1-基]苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基]-1H,2H,3H-吡啶並[2,3-b][1,4]噁嗪-2-酮	444.8

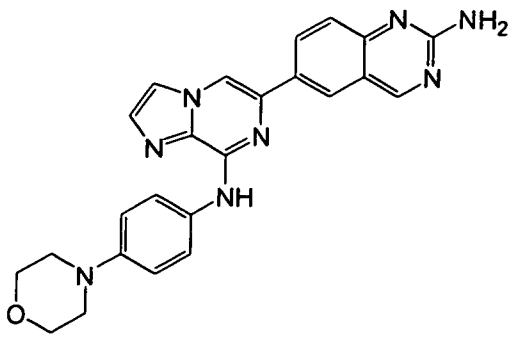
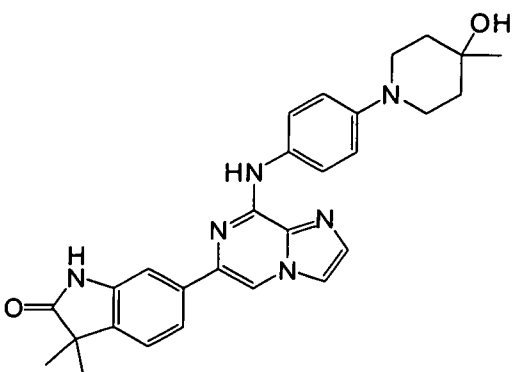
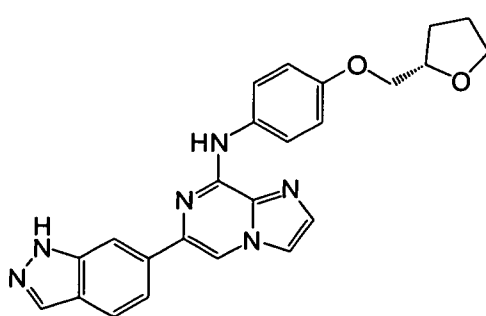
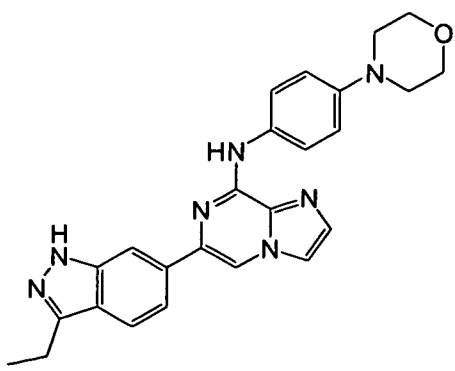
	4-([6-(1H-咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}-N-甲基-N-(四氫呋喃-4-基)苯醯胺	468.2
	6-(3-乙基-1H-咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基)-N-{4-[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	496.9
	2,2-二氟-6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嗎啉-3-酮	479.1
	1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嗎啉-7-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)-3-甲基四氫吡啶-3-醇	459.3

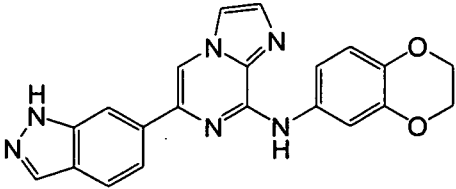
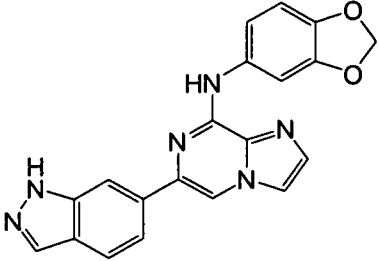
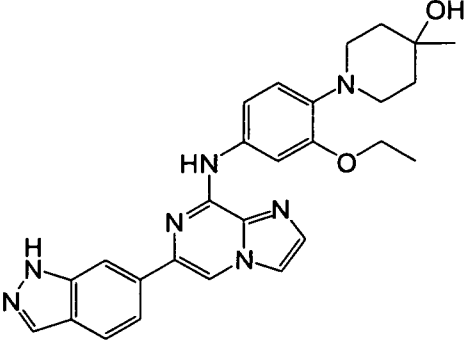
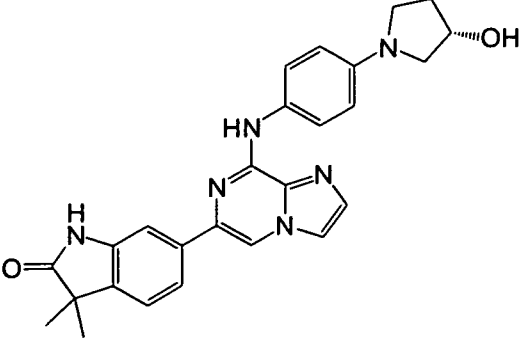
	6-(1H-吲哚-2-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	411.3
	(3S)-1-(4-{{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-7-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基}吡咯啉-3-醇	459.6
	1-(4-{{[6-(4-氟-1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基}-3-甲基四氫吡啶-3-醇	430.2
	6-(1H-吲哚-6-基)-N-[4-(2H-1,2,3,4-四唑-5-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	395.1

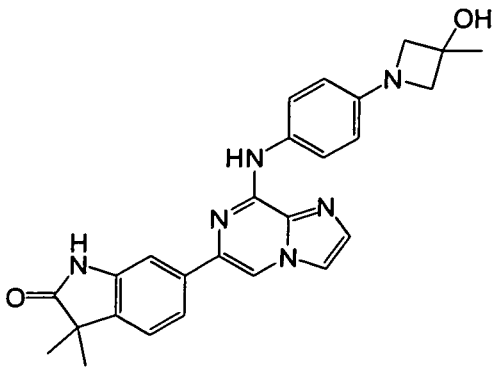
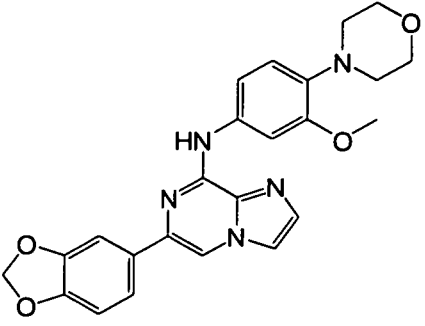
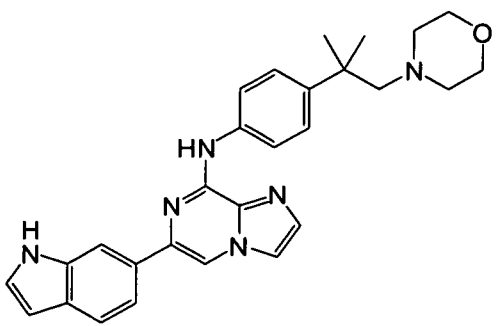
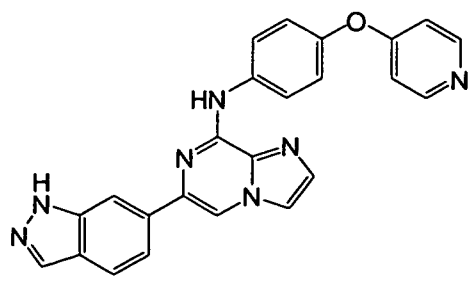
	7-(8-{[4-(3-羥基-3-甲基四氫 吡啶-1-基)苯基]胺基}咪唑 並 [1,2-a] 吡 啶-6- 基)- 1H,2H,3H- 吡 啶 並 [2,3- b][1,4]嘔啉-2-酮	444.2
	6-(1H-咪唑-6-基)-N-[3-甲氧 基-4-(2-甲氧基乙氧基)苯基] 咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	431.5
	6-(2-乙基-1,2,3,4-四氫異喹 啉-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯 基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	455.4
	4-{[6-(3,3-二甲基-2-側氧基- 2,3-二氫-1H-咪啉-6-基)咪唑 並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-N- 丙基苯醯胺	455.3

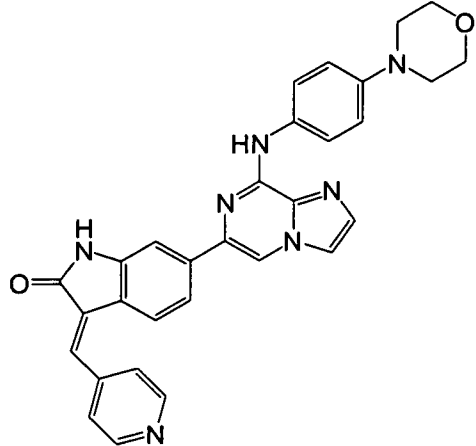
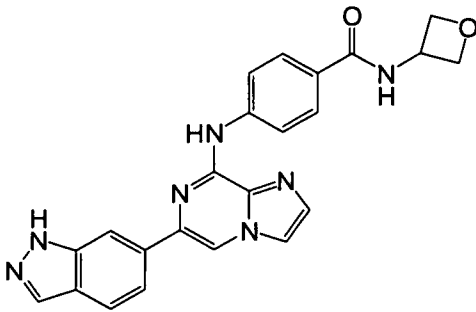
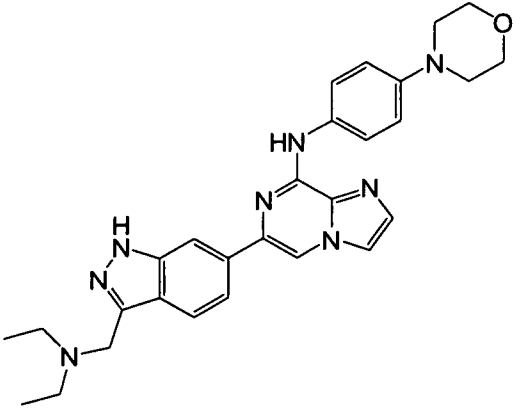
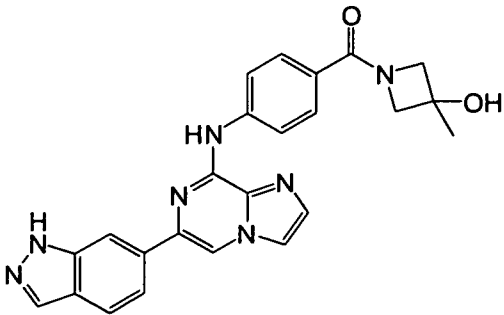
	6-(8-([3-乙氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,3-二甲基-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮	499.7
	6-(1H-吲哚-3-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	411.2
	6-(1,3-苯並噁唑-5-基)-N-{4-[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	485.7
	(3E)-6-(8-([4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3-(1,3-噻唑-4-基亞甲基)-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮	522.6

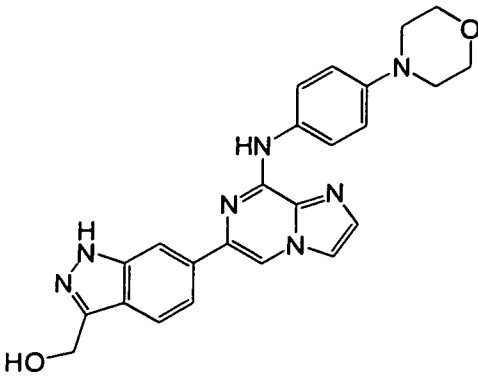
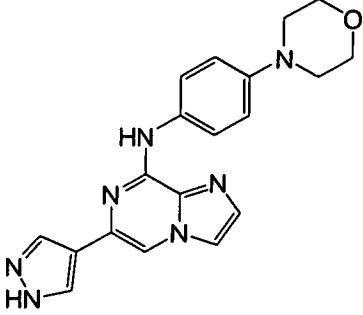
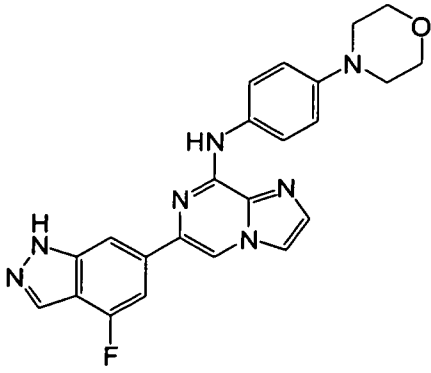
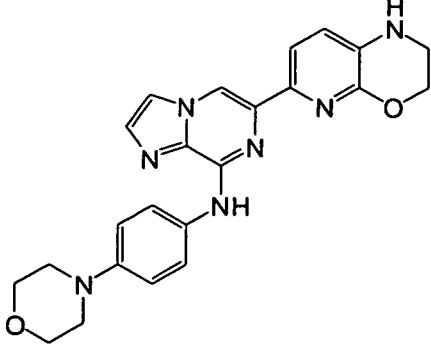
	4-{{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}-N-(呋喃-4-基)苯醯胺	454
	6-(2-甲基-1,3-苯並噁唑-5-基)-N-{4-[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	499.5
	6-(2,3-二氫-1,4-苯並二呋喃-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	460.6
	6-(1H-咪唑-6-基)-N-[4-(2-甲氧基乙氧基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	401.1

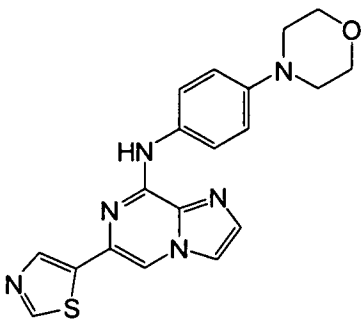
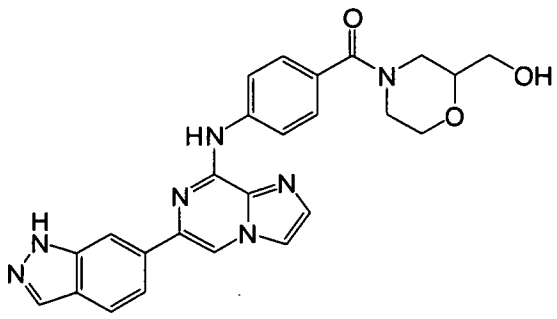
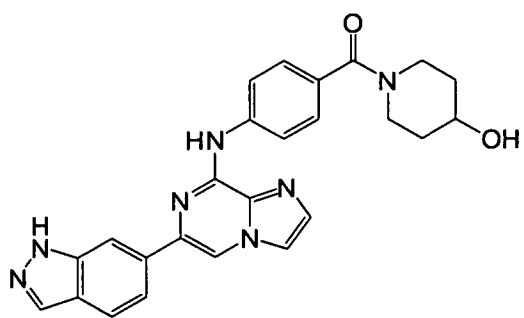
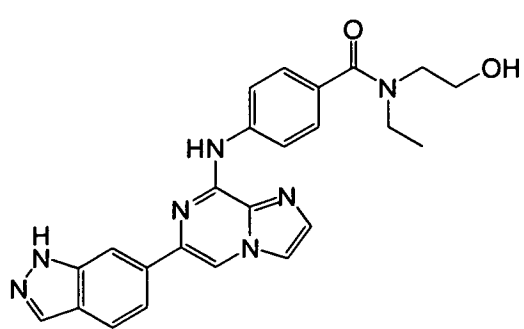
	6-(8-{{[4-(4-氨基-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基}喹啉-2-胺	439.7
	6-(8-{{[4-(4-羟基-4-甲基哌啶-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基)-3,3-二甲基-2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮	483.5
	6-(1H-吡啶-6-基)-N-{{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲氧基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡咩-8-胺	427.1
	6-(3-乙基-1H-吡啶-6-基)-N-{{[4-(4-氨基-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡咩-8-胺	440.5

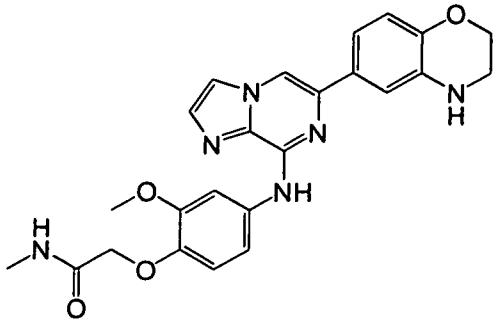
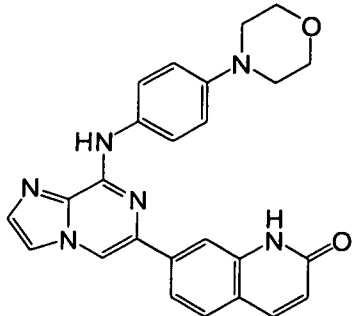
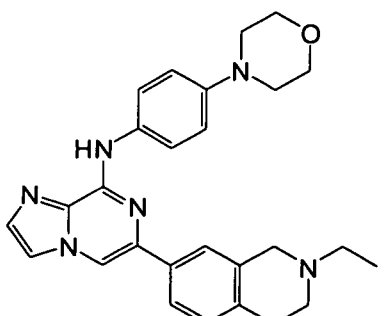
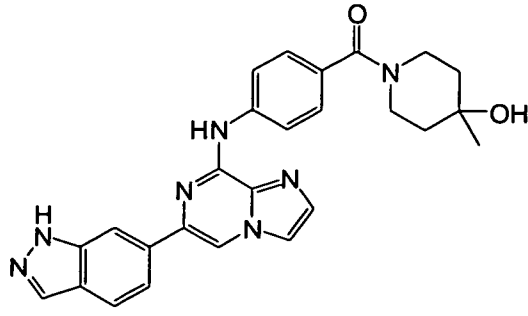
	N-(2,3- 二 氫 -1,4- 苯 並 二 噁 咭-6-基)-6-(1H-噁 咭-6-基) 咪 咭 並[1,2-a]吡 咭-8-胺	385.3
	N-(2H-1,3- 苯 並 二 噁 呢-5-基)-6-(1H-噁 咭-6-基)咪 咭 並 [1,2-a]吡 咭-8-胺	371.2
	1-(2-乙 氧 基-4- {[6-(1H-噁 咭- 6-基)咪 咭 並[1,2-a]吡 咭-8-基]胺 基} 苯 基)-4-甲 基 哌 啶-4- 醇	484.7
	6-[8-({4-[(3S)-3- 羟 基 吡 咯 啶-1-基]苯 基}胺 基)咪 咭 並 [1,2-a]吡 咭-6-基]-3,3- 二 甲 基-2,3-二 氫-1H-噁 咭-2-酮	455.2

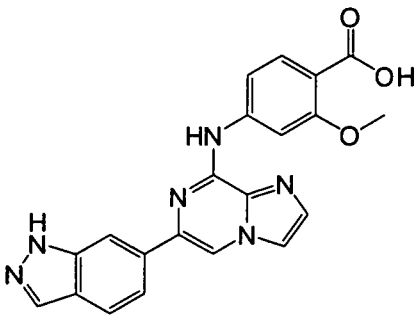
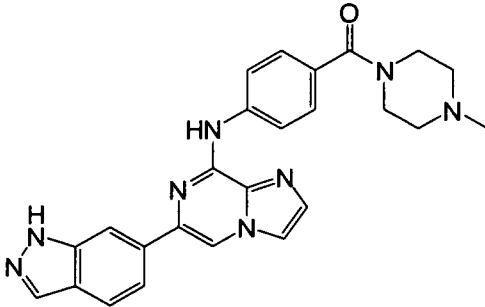
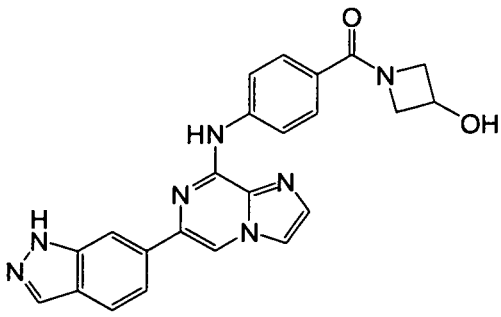
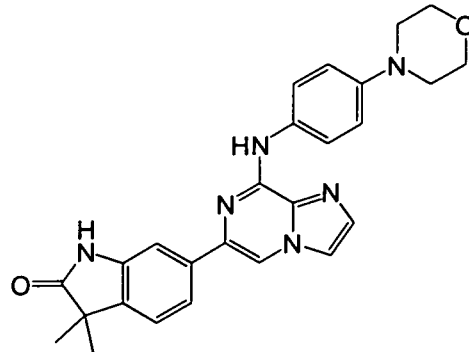
	6-(8-([4-(3-羟基-3-甲基四氢吡啶-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,3-二甲基-2,3-二氢-1H-吡啶-2-酮	455.3
	6-(2H-1,3-苯並二噁呋-5-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	446.3
	6-(1H-吡啶-6-基)-N-{4-[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	467.4
	6-(1H-吡啶-6-基)-N-[4-(吡啶-4-基氧)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	420.3

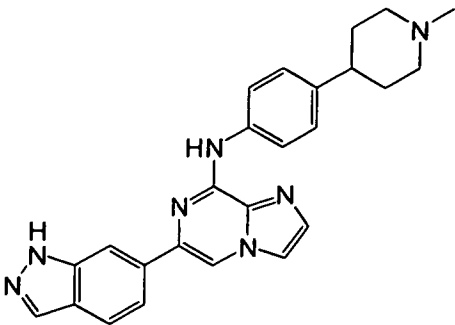
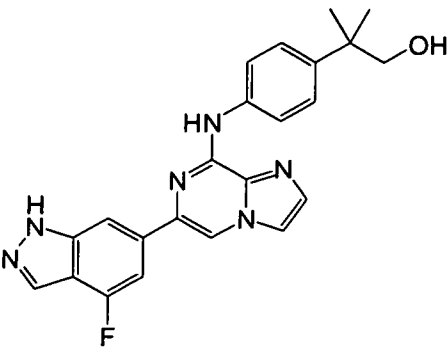
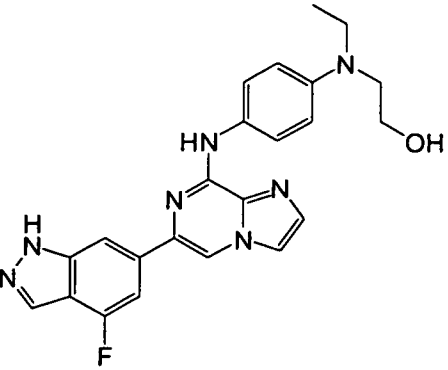
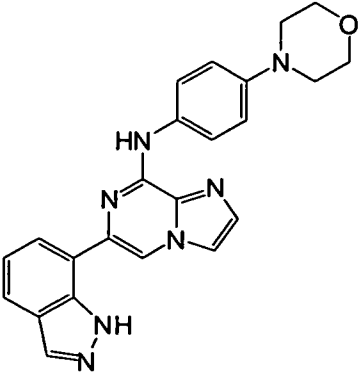
	(3E)-6-(8-{{4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-3-(吡啶-4-基亞甲基)-2,3-二氫-1H-吡啶-2-酮	516.4
	4-{{6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基}胺基}-N-(環氧丙烷-3-基)苯醯胺	426.1
	6-{3-[(二乙基胺基)甲基]-1H-吡啶-6-基}-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	497.3
	1-[(4-{{6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基}胺基}苯基)羰基]-3-甲基四氫吡啶-3-醇	440.2

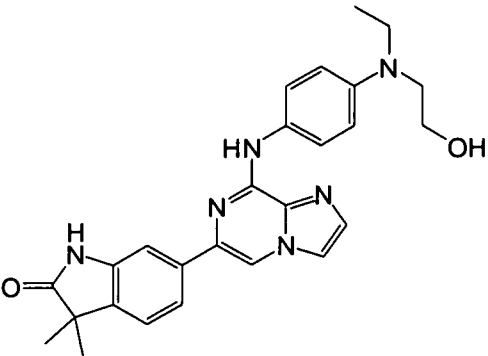
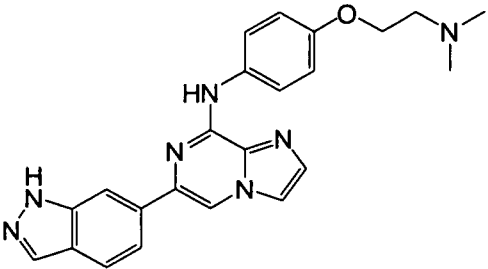
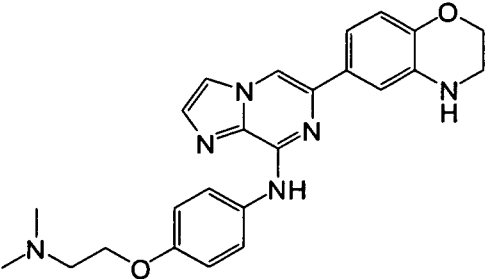
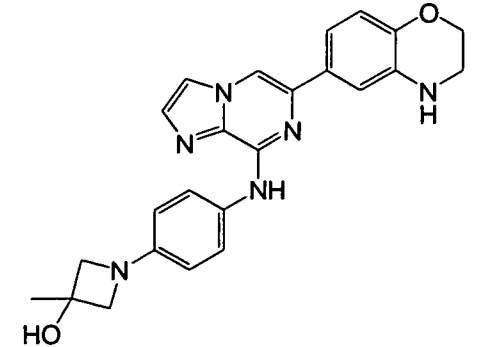
	[6-(8-([4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-咪唑-3-基]甲醇	442.3
	N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(1H-吡唑-4-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	362.6
	6-(4-氟-1H-咪唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	430.3
	N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-{1H,2H,3H-吡啶並[2,3-b][1,4]噁嗪-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	430.3

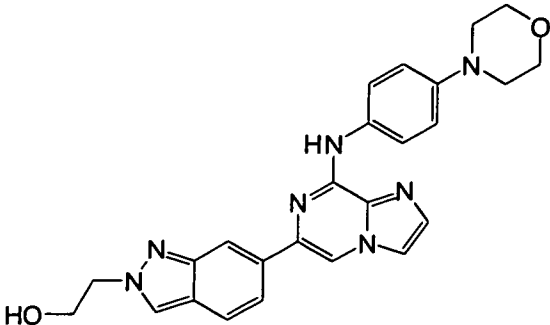
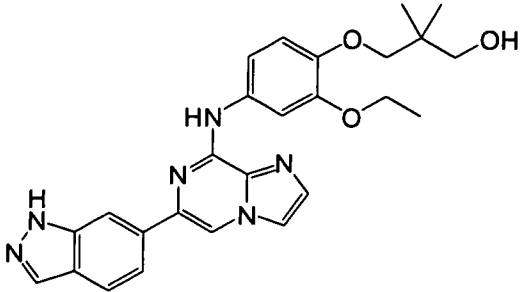
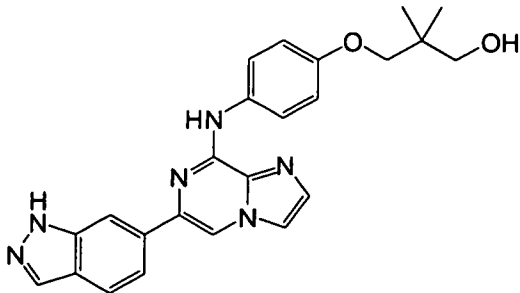
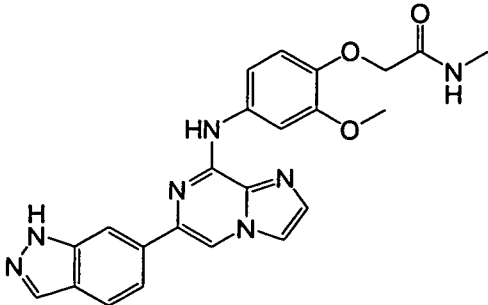
	N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(1,3-噻唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	379.2
	{4-[(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)羰基]嗎啉-2-基}甲醇	470.8
	1-[(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)羰基]哌啶-4-醇	454.1
	N-乙基-N-(2-羥基乙基)-4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯醯胺	440.2

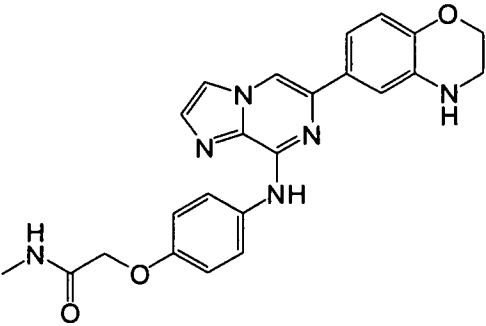
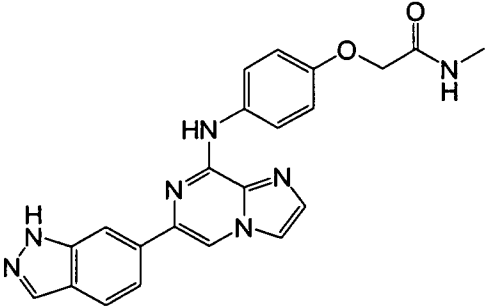
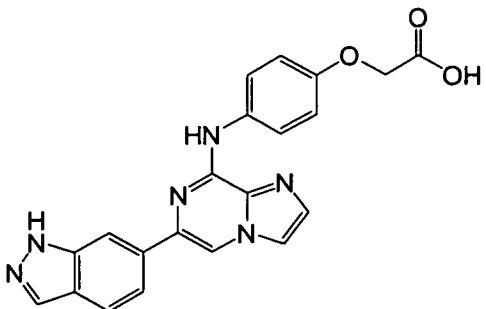
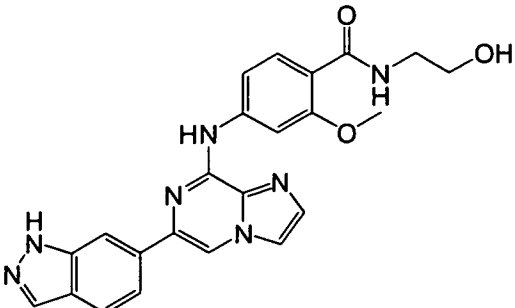
	2-(4-{{6-((3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘧啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基)胺基}-2-甲氧基苯氧基)-N-甲基乙醯胺	461.4
	7-(8-{{4-(嗎啉-4-基)苯基)胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1,2-二氫喹啉-2-酮	439.5
	6-(2-乙基-1,2,3,4-四氫異喹啉-7-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	455.4
	1-[(4-{{6-(1H-咪唑[4,5-b]吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基)胺基}苯基)羰基]-4-甲基哌啶-4-醇	468.4

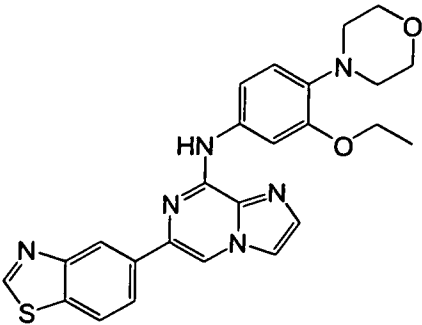
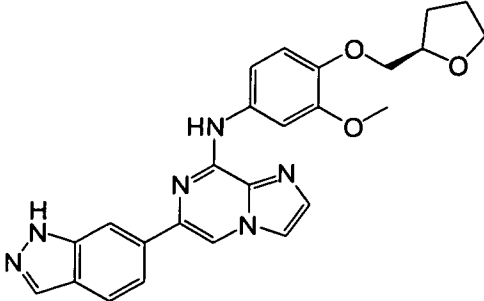
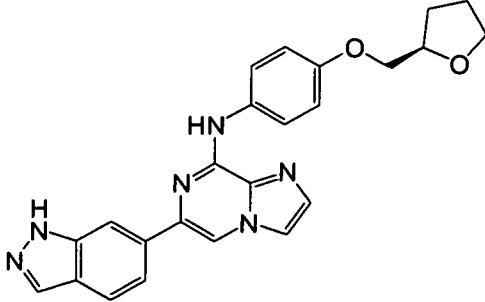
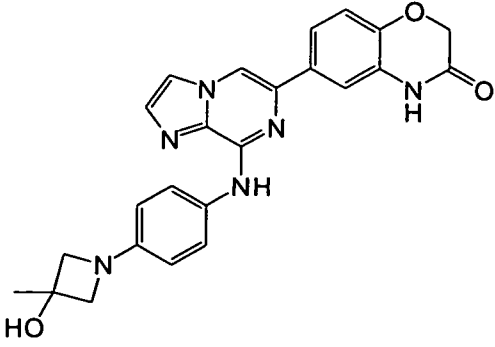
	4- {[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並 [1,2-a]吡啉-8-基]胺基}-2-甲 氧基苯甲酸	401.1
	6-(1H-咪唑-6-基)-N-{4-[(4- 甲基哌啶-1-基)羰基]苯基} 咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	453.1
	1-[(4- {[6-(1H-咪唑-6-基)咪 唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基} 苯基)羰基]四氫吡啶-3-醇	426.3
	3,3-二甲基-6-(8- {[4-(嗎啉-4- 基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a] 吡啉-6-基)-2,3-二氫-1H-咪 唑-2-酮	455.4

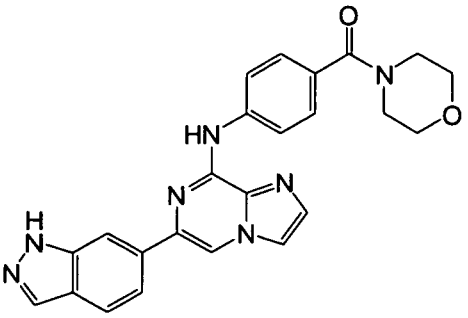
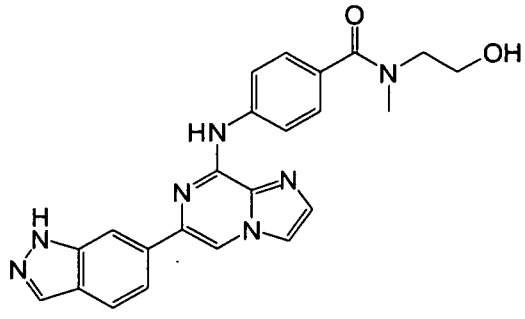
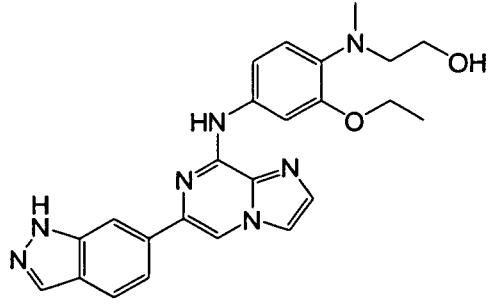
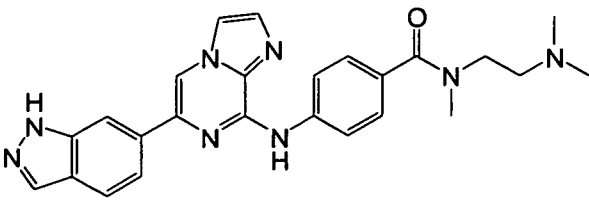
	6-(1H-咪唑-6-基)-N-[4-(1-甲基哌啶-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	424.2
	2-(4-{[6-(4-氟-1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)-2-甲基丙-1-醇	417.7
	2-[乙基(4-{[6-(4-氟-1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)胺基]乙-1-醇	431.47
	6-(1H-咪唑-7-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	412.2

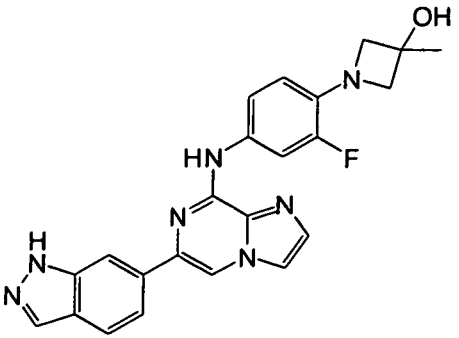
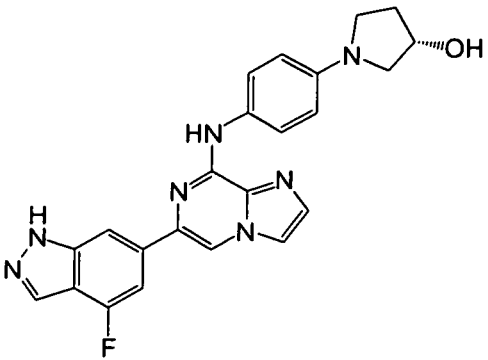
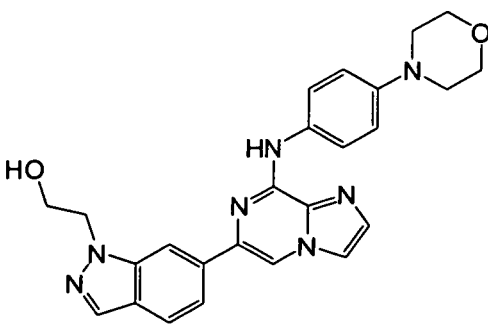
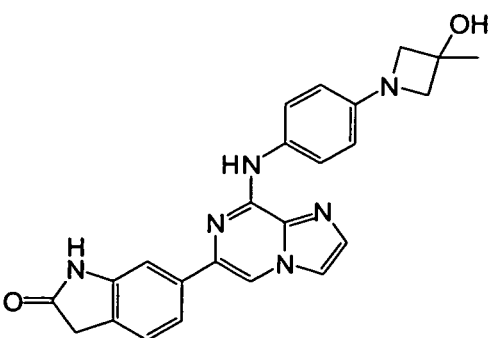
	6-[8-({4-[2-(2-羟基乙基)氨基]苯基}氨基)咪唑并[1,2-a]吡啉-6-基]-3,3-二甲基-2,3-二氢-1H-吲哚-2-酮	457.6
	N-{4-[2-(二甲基氨基)乙氧基]苯基}-6-(1H-咪唑并[1,2-a]吡啉-6-基)咪唑并[1,2-a]吡啉-8-胺	414.6
	6-(3,4-二氢-2H-1,4-苯並噁吡啉-6-基)-N-{4-[2-(二甲基氨基)乙氧基]苯基}咪唑并[1,2-a]吡啉-8-胺	431.4
	1-(4-({6-(3,4-二氢-2H-1,4-苯並噁吡啉-6-基)咪唑并[1,2-a]吡啉-8-基}氨基)苯基)-3-甲基四氢吲哚-3-醇	429.3

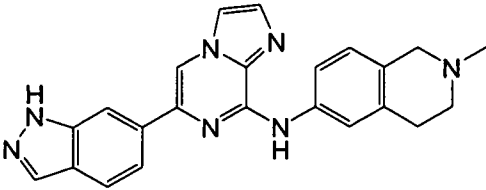
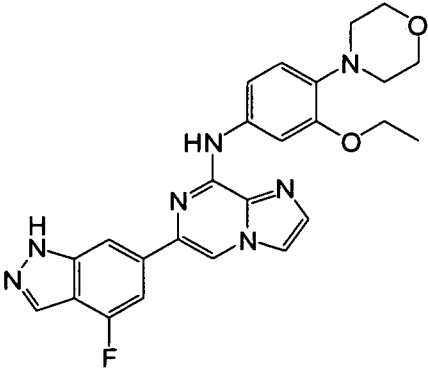
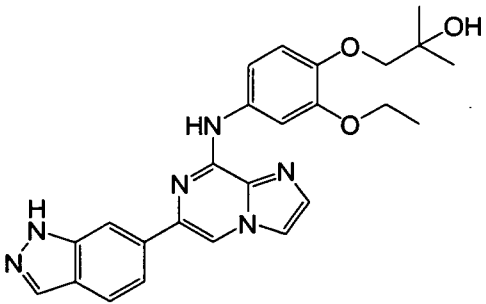
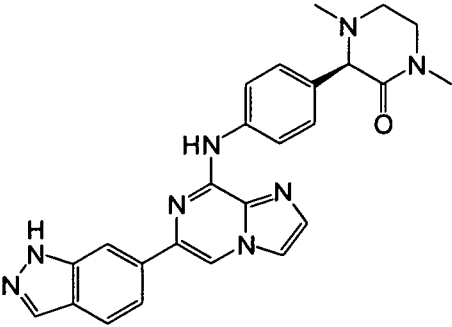
	2-[6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基] 胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6- 基)-2H-呋唑-2-基]乙-1-醇	456.3
	3-(2-乙氧基-4-{[6-(1H-呋唑- 6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯氧基)-2,2-二甲基 丙-1-醇	473.4
	3-(4-{[6-(1H-呋唑-6-基)咪唑 並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯 氧基)-2,2-二甲基丙-1-醇	429.5
	2-(4-{[6-(1H-呋唑-6-基)咪唑 並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2- 甲氧基苯氧基)-N-甲基乙醯 胺	444.8

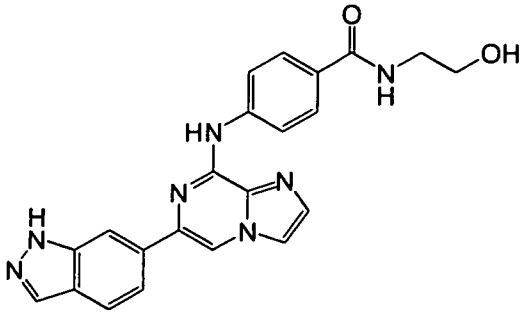
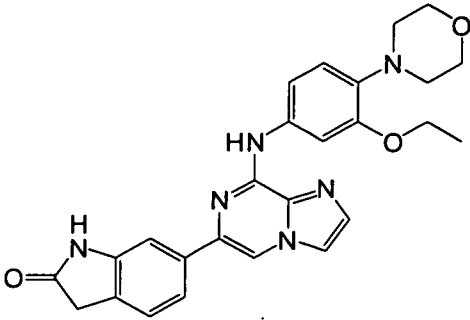
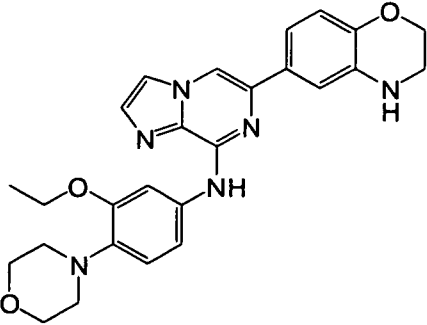
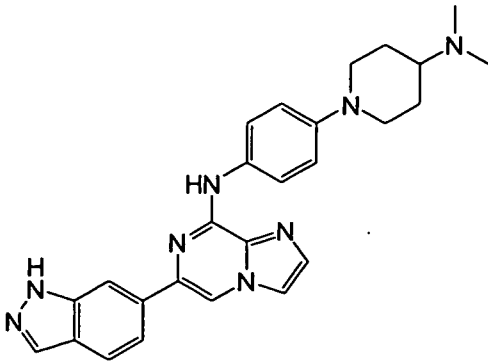
	2-(4-{{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯氧基)-N-甲基乙醯胺	431.4
	2-(4-{{[6-(1H-噁唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯氧基)-N-甲基乙醯胺	414.4
	2-(4-{{[6-(1H-噁唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯氧基)乙酸	401.1
	N-(2-羥基乙基)-4-{{[6-(1H-噁唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-甲氧基苯醯胺	442.1

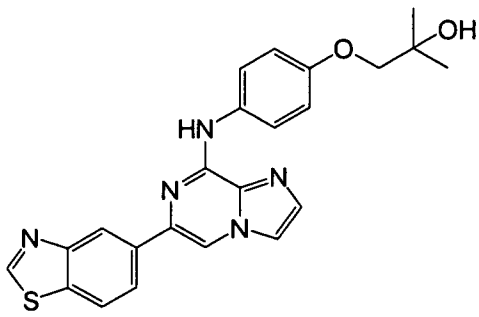
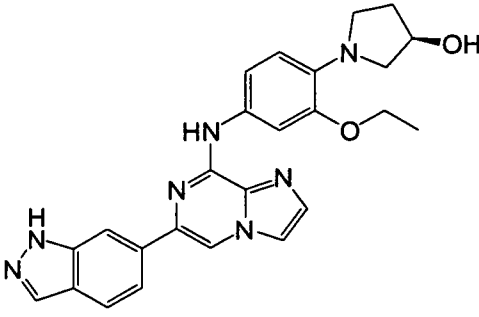
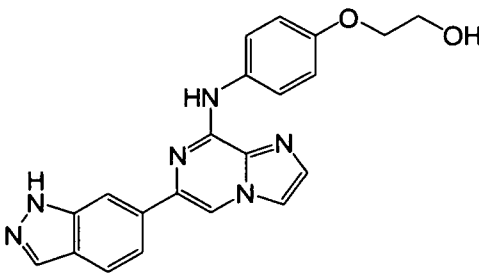
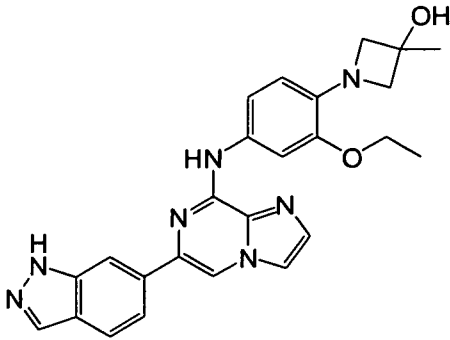
	6-(1,3-苯並噁唑-5-基)-N-[3-乙氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	473.2
	6-(1H-咪唑啶-6-基)-N-{3-甲氧基-4-[(2R)-四氫呋喃-2-基甲氧基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	457.4
	6-(1H-咪唑啶-6-基)-N-{4-[(2R)-四氫呋喃-2-基甲氧基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	427
	6-(8-{[4-(3-羥基-3-甲基四氫吡嗪-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘮啉-3-酮	443.2

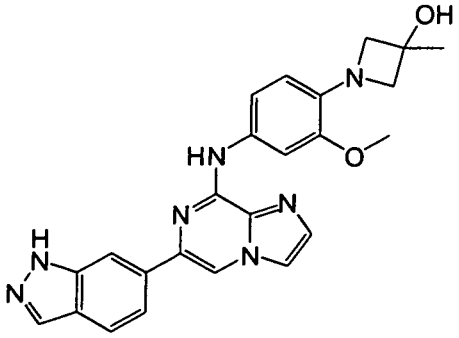
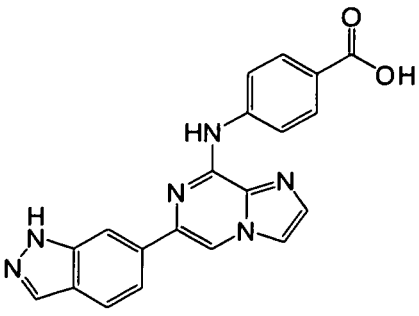
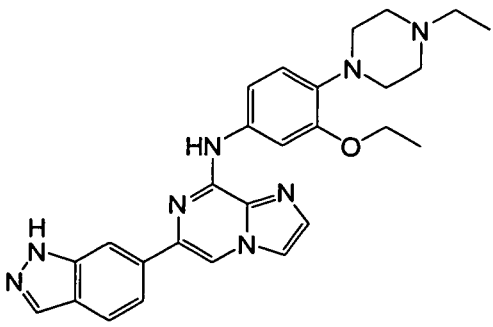
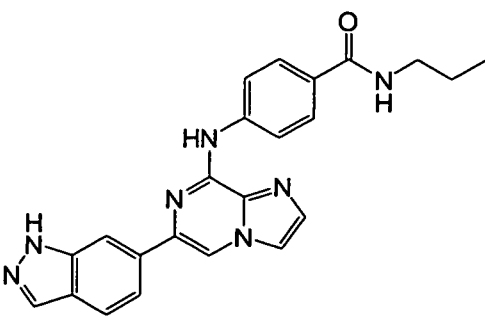
	6-(1H-吲哚-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基羰基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	440.3
	N-(2-羥基乙基)-4-[[6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}-N-甲基苯醯胺	428.2
	2-[(2-乙氧基-4-[[6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)(甲基)胺基]乙-1-醇	444.6
	N-[2-(二甲基胺基)乙基]-4-[[6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}-N-甲基苯醯胺	455.3

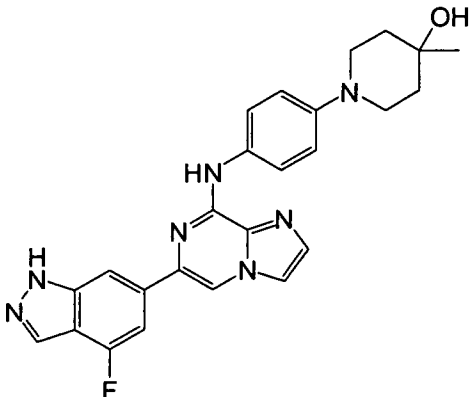
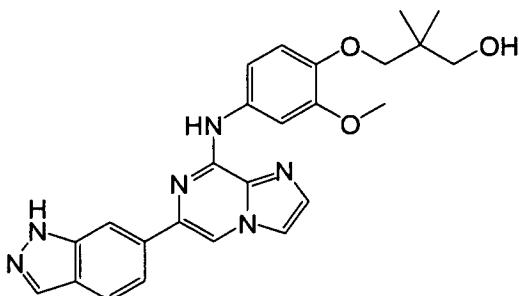
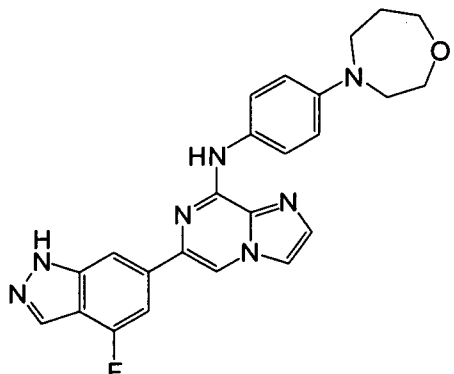
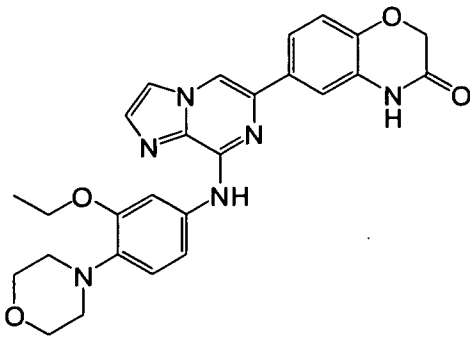
	1-(2-氟-4-{{6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基}苯基)-3-甲基四氫吲哚-3-醇	430.4
	(3S)-1-(4-{{6-(4-氟-1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基}苯基)吡咯啉-3-醇	430.4
	2-[6-(8-{{4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-咪唑-1-基]乙-1-醇	456.3
	6-(8-{{4-(3-羥基-3-甲基四氫吲哚-1-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-咪唑-2-酮	427.2

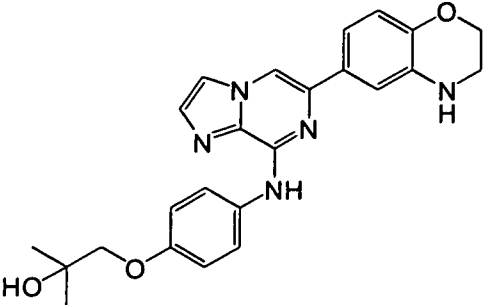
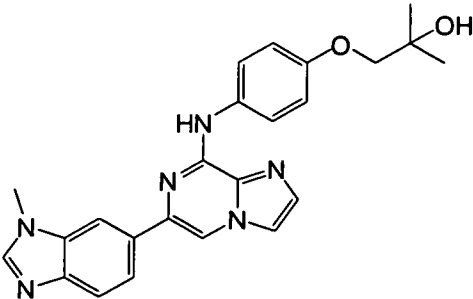
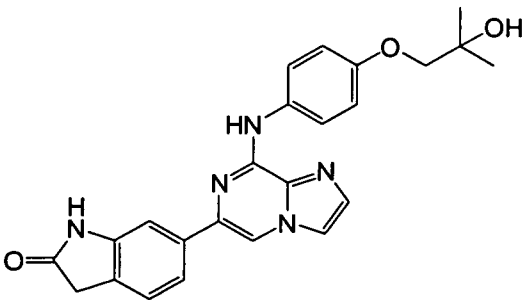
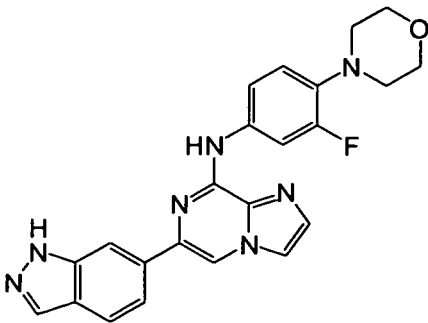
	N-[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]-2-甲基- 1,2,3,4-四氫異喹啉-6-胺	396.1
	N-[3-乙氧基-4-(嗎啉-4-基) 苯基]-6-(4-氟-1H-咪唑-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	474.2
	1-(2-乙氧基-4-{{6-(1H-咪唑- 6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基 }胺基}苯氧基)-2-甲基丙-2- 醇	459.4
	(3R)-3-(4-{{6-(1H-咪唑-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基}胺 基}苯基)-1,4-二甲基哌啶-2- 酮	453.4

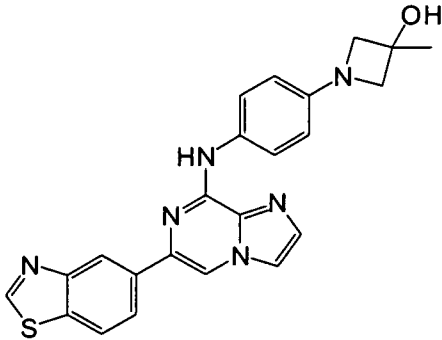
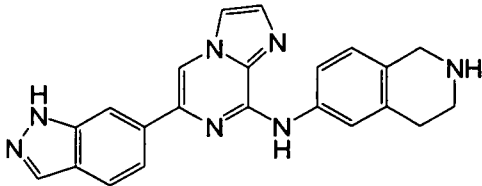
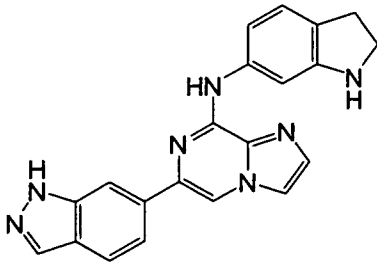
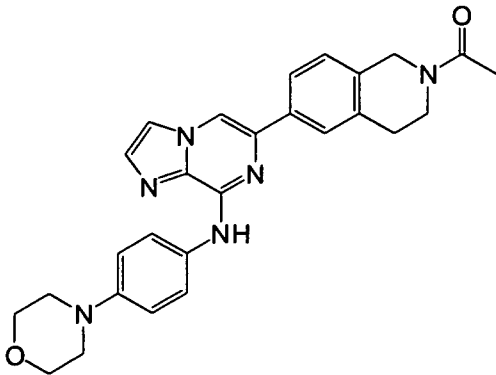
	N-(2-羟基乙基)-4-{{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯醯胺}	414.5
	6-(8-{{[3-乙氧基-4-(吗啉-4-基)苯基]胺基}咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基})-2,3-二氢-1H-吡啶-2-酮	471.7
	6-(3,4-二氢-2H-1,4-苯并吗啉-6-基)-N-[3-乙氧基-4-(吗啉-4-基)苯基]咪唑并[1,2-a]吡啶-8-胺	473.2
	1-(4-{{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-N,N-二甲基哌啶-4-胺	453.1

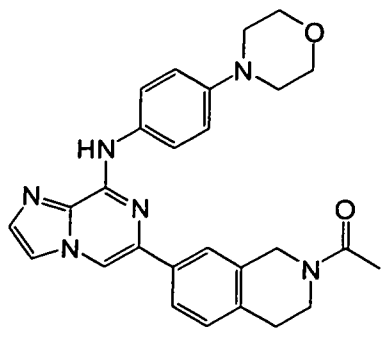
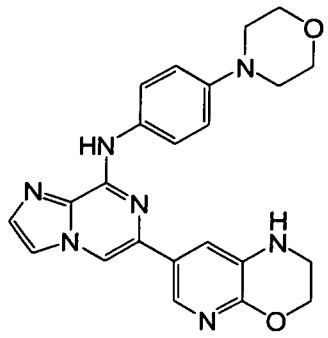
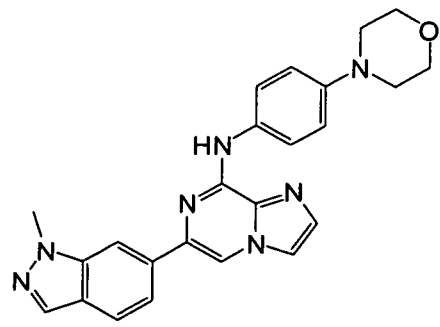
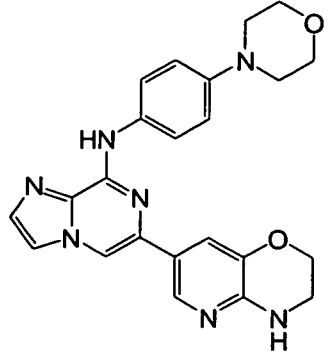
	1-(4-({[6-(1,3-苯並噻唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯氧基)-2-甲基丙-2-醇	432.4
	(3R)-1-(2-乙氧基-4-({[6-(1H-咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)吡咯啉-3-醇	456.4
	2-(4-({[6-(1H-咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯氧基)乙-1-醇	387.3
	1-(2-乙氧基-4-({[6-(1H-咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)-3-甲基四氫吡啶-3-醇	456.2

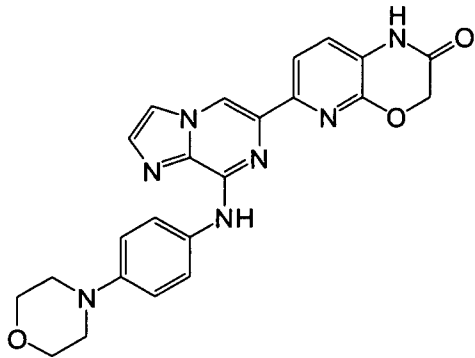
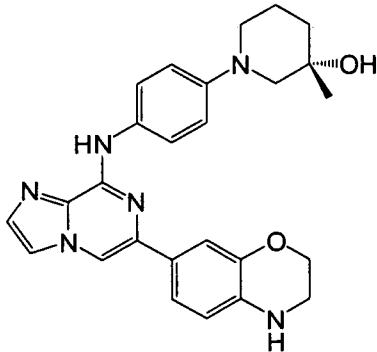
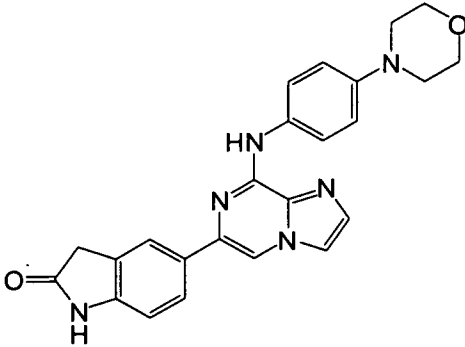
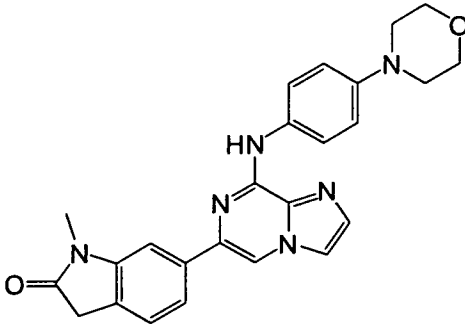
	1-(4-{{6-(1H-咪唑-6-基)咪唑 並[1,2-a]吡啉-8-基}胺基}-2- 甲氧基苯基)-3-甲基四氫吡 啶-3-醇	442.2
	4-{{6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並 [1,2-a]吡啉-8-基}胺基}苯甲 酸	371
	N-[3-乙氧基-4-(4-乙基哌啶- 1-基)苯基]-6-(1H-咪唑-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	483.3
	4-{{6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並 [1,2-a]吡啉-8-基}胺基}-N-丙 基苯醯胺	412.1

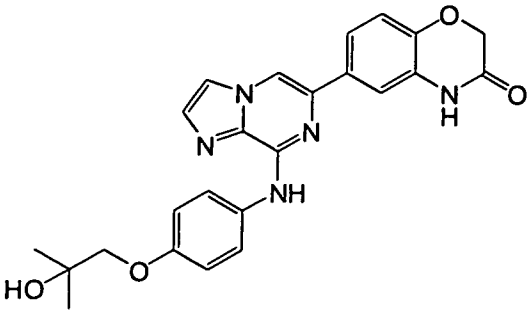
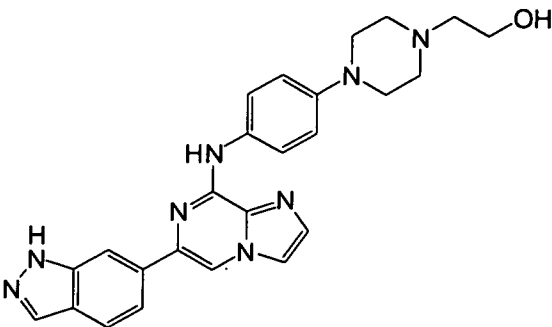
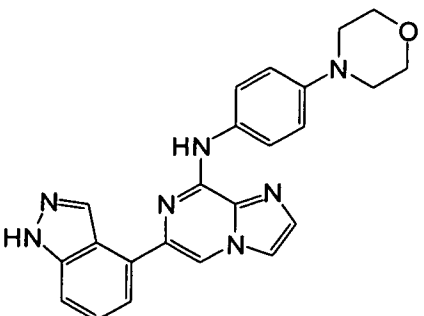
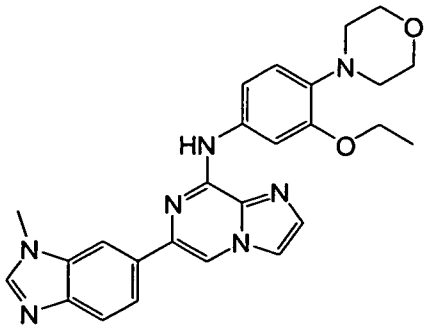
	1-(4-{{6-(4-氟-1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基}胺基}苯基)-4-甲基哌啶-4-醇	458.6
	3-(4-{{6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基}胺基}-2-甲氧基苯氧基)-2,2-二甲基丙-1-醇	459.5
	6-(4-氟-1H-咪唑-6-基)-N-[4-(1,4-氧雜氮吡-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	444.7
	6-(8-{{3-乙氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嗎啉-3-酮	487.5

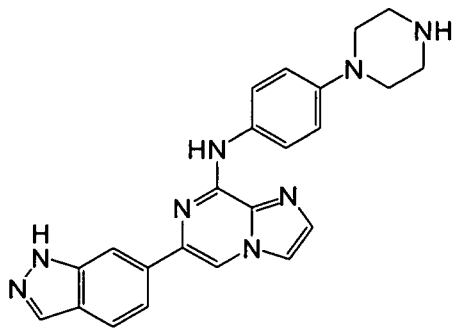
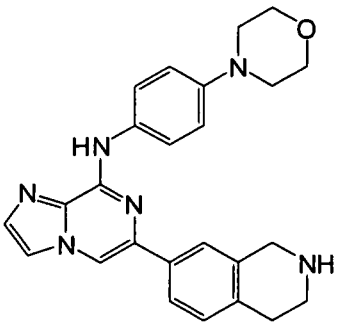
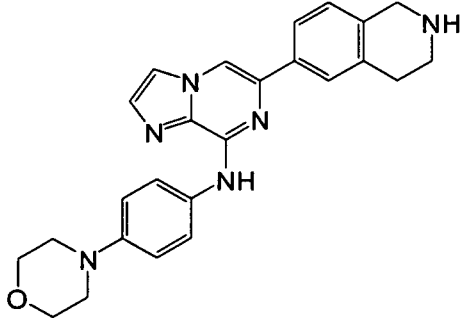
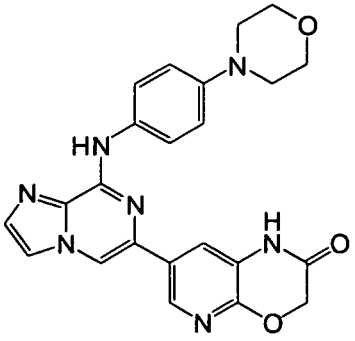
	1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯氧基)-2-甲基丙-2-醇	432.4
	2-甲基-1-(4-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯氧基)丙-2-醇	429.3
	6-(8-{[4-(2-羥基-2-甲基丙氧基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮	430.2
	N-[3-氟-4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	430.4

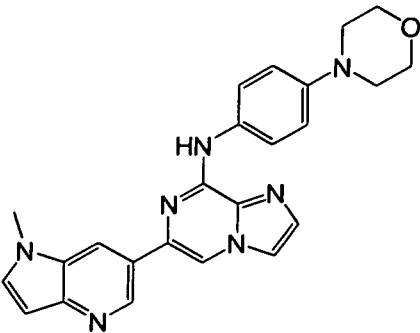
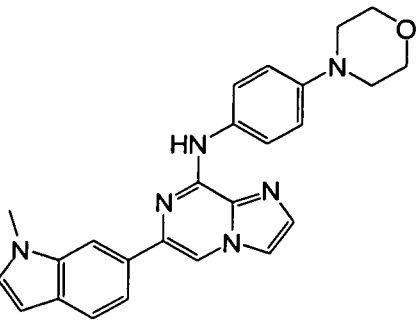
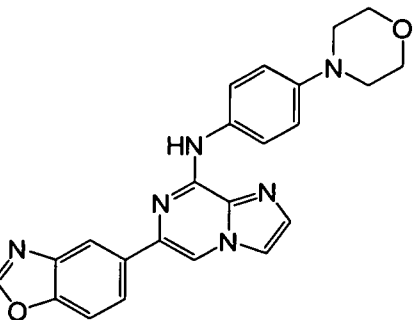
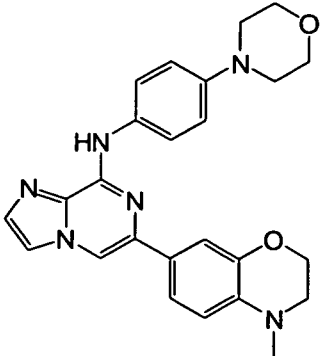
	1-(4-{[6-(1,3-苯並噻唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)-3-甲基四氫吡啶-3-醇	429.1
	N-[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]-1,2,3,4-四氫異喹啉-6-胺	382.2
	N-[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]-2,3-二氫-1H-吲哚-6-胺	368.2
	1-[6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-1,2,3,4-四氫異喹啉-2-基]乙-1-酮	469.6

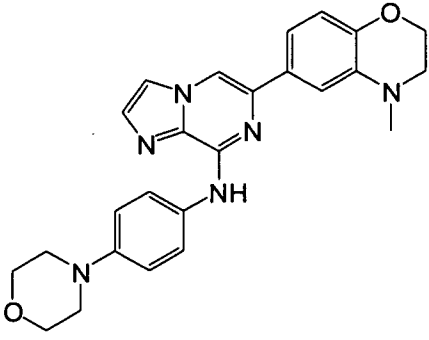
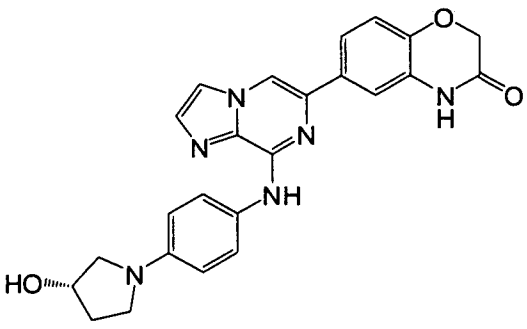
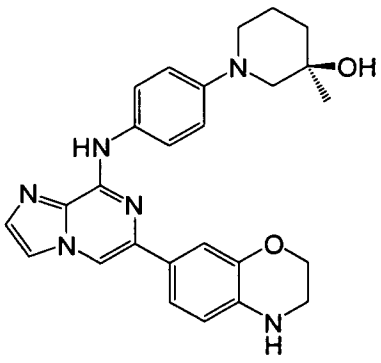
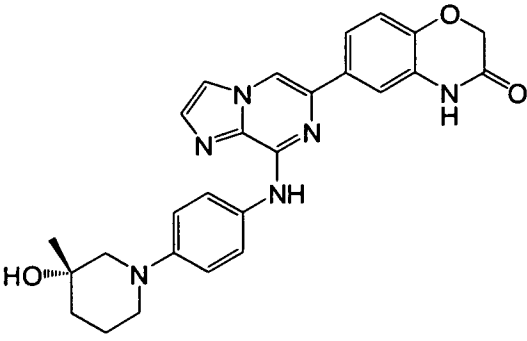
	1-[7-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1,2,3,4-四氫異喹啉-2-基]乙-1-酮	469.7
	N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-{1H,2H,3H-吡啶並[2,3-b][1,4]嘮啶-7-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	430.4
	6-(1-甲基-1H-吲唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	426.1
	N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-{2H,3H,4H-吡啶並[3,2-b][1,4]嘮啶-7-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	430.4

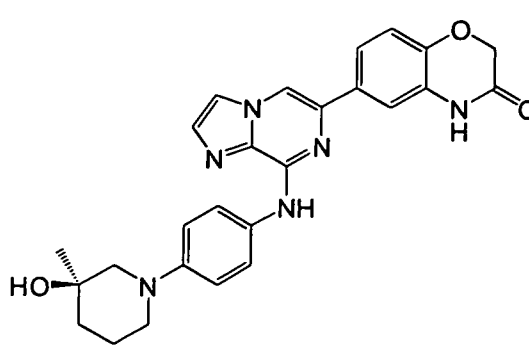
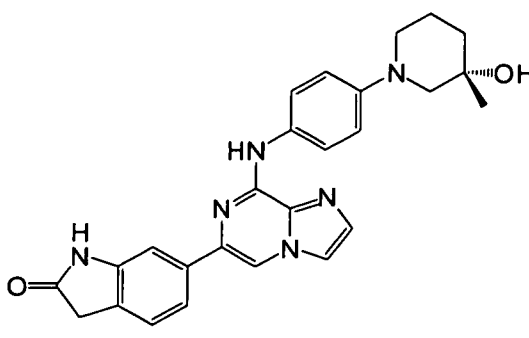
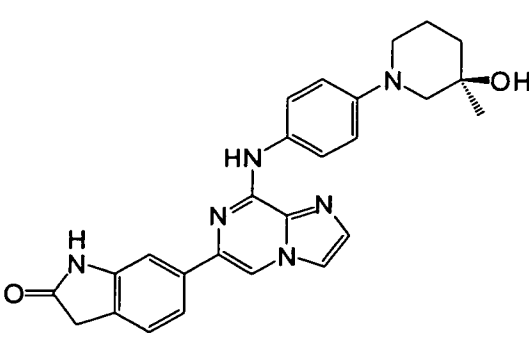
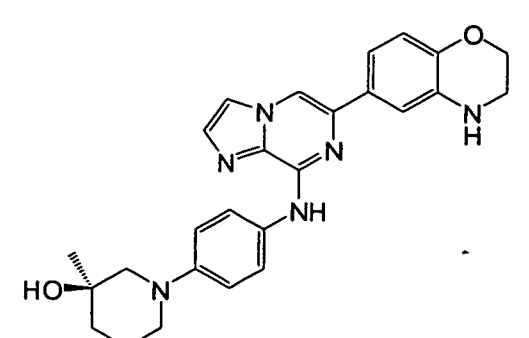
	6-(8-({[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啞-6-基)-1H,2H,3H-吡啶並[2,3-b][1,4]嗎啞-2-酮	444.2
	(3S)-1-(4-({[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嗎啞-7-基)咪唑並[1,2-a]吡啞-8-基]胺基}苯基)-3-甲基哌啶-3-醇	457.2
	5-(8-({[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啞-6-基)-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮	427
	1-甲基-6-(8-({[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啞-6-基)-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮	441.4

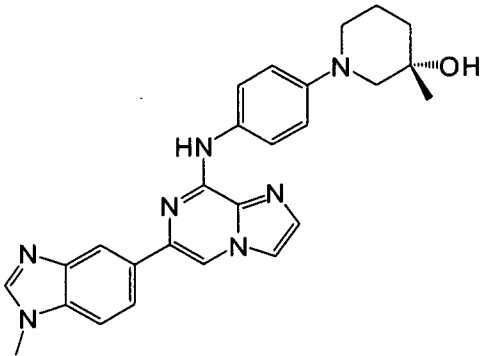
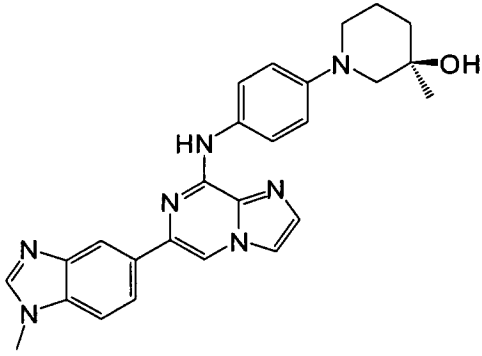
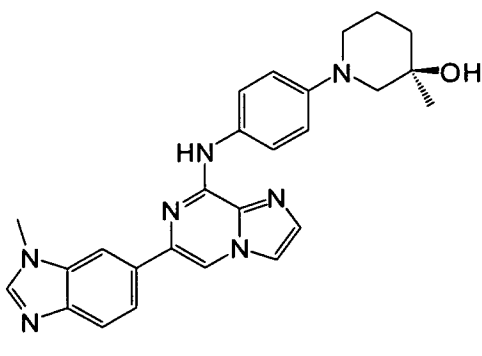
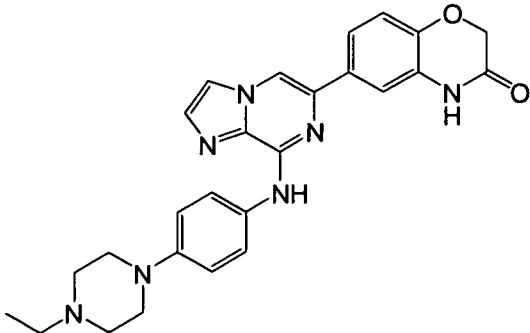
	6-(8-{{4-(2-羟基-2-甲基丙氧基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,4-二氢-2H-1,4-苯並噁吡-3-酮	446.3
	2-[4-(4-{{6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基}胺基}苯基)哌啶-1-基]乙-1-醇	455.2
	6-(1H-咪唑-4-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	412.2
	N-[3-乙氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	470.2

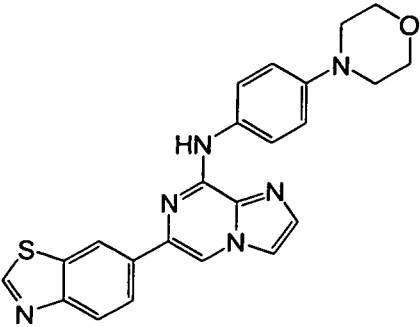
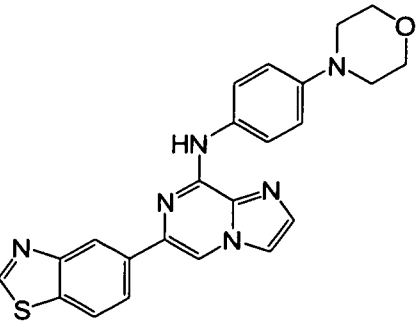
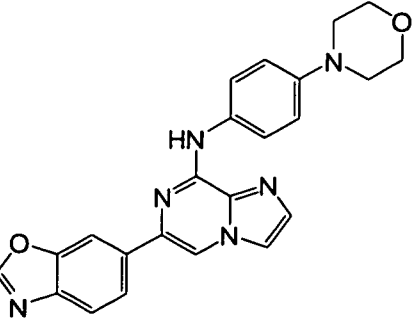
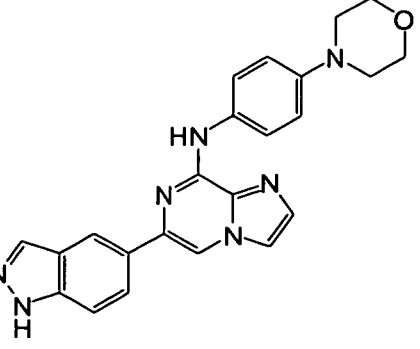
	6-(1H-吡啶-6-基)-N-[4-(哌啶-1-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	411.2
	N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(1,2,3,4-四氫異喹啉-7-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	427.1
	N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(1,2,3,4-四氫異喹啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	427
	7-(8-([4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H,2H,3H-吡啶並[2,3-b][1,4]噁嗪-2-酮	444.8

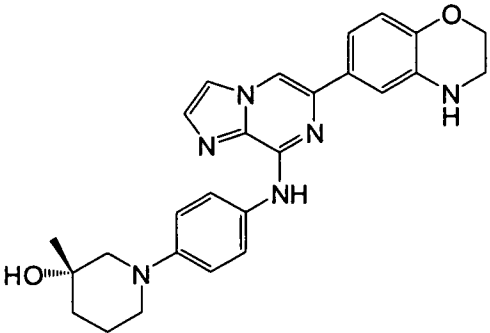
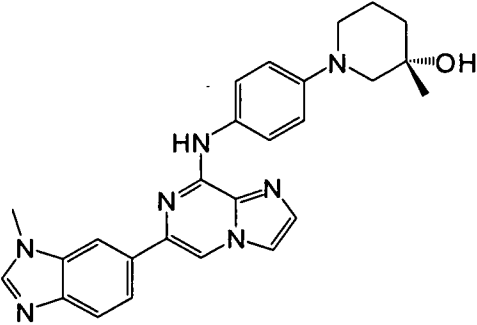
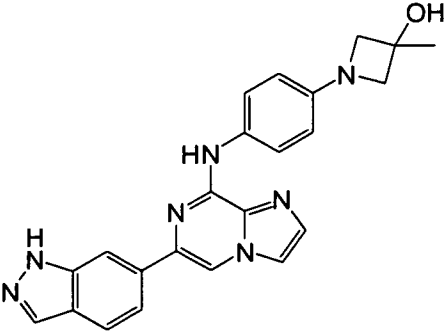
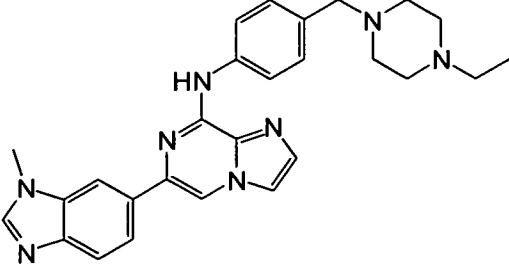
	6-{1-甲基-1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	426.2
	6-(1-甲基-1H-吡咯並[6,5-b]吡啶-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	425.3
	6-(1,3-苯並噁唑並[5,4-b]吡啶-5-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	413.5
	6-(4-甲基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡啶-7-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	443.6

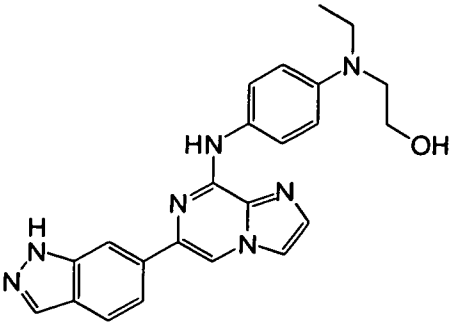
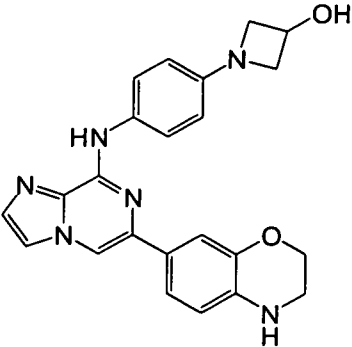
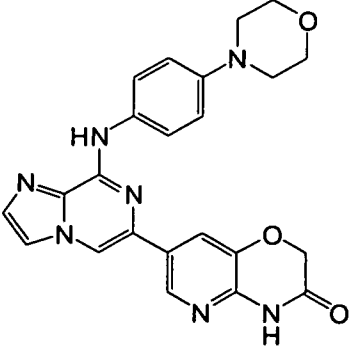
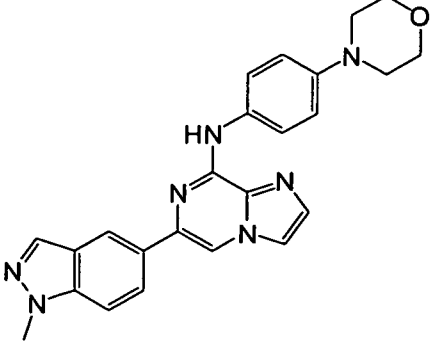
	6-(4-甲基-3,4-二氫-2H-1,4- 苯並噁吡-6-基)-N-[4-(嗎啉- 4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡 吡-8-胺	443.9
	6-[8-({4-[(3S)-3- 羥基吡咯 啉-1-基]苯基}胺基)咪唑並 [1,2-a]吡吡-6-基]-3,4-二氫- 2H-1,4-苯並噁吡-3-酮	443.7
	(3R)-1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H- 1,4-苯並噁吡-7-基)咪唑並 [1,2-a]吡吡-8-基]胺基}苯基)-3-甲基哌啶-3-醇	457.2
	6-[8-({4-[(3S)-3-羥基-3-甲基 哌啶-1-基]苯基}胺基)咪唑 並[1,2-a]吡吡-6-基]-3,4-二 氫-2H-1,4-苯並噁吡-3-酮	471.7

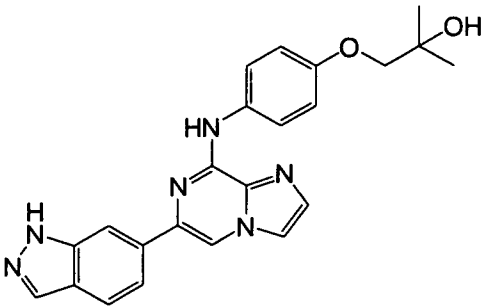
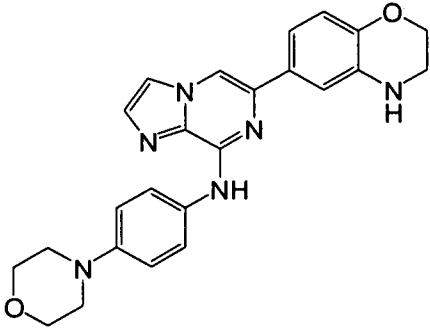
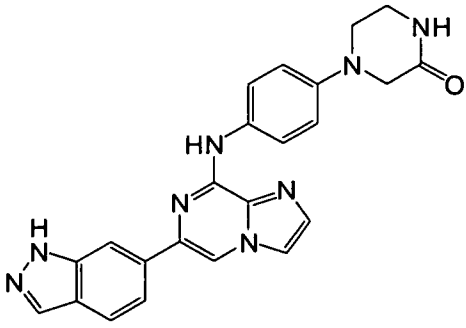
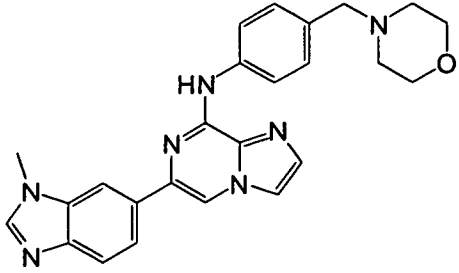
	6-[8-({4-[(3R)-3- 羥基 -3- 甲基哌啶-1-基]苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基]-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-3-酮	471.6
	6-[8-({4-[(3S)-3-羥基-3-甲基哌啶-1-基]苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基]-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮	455.4
	6-[8-({4-[(3R)-3- 羥基 -3- 甲基哌啶-1-基]苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基]-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮	455.2
	(3R)-1-(4-{{6-(3,4- 二氫 -2H-1,4- 苯並噁吡-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基}胺基}苯基)-3-甲基哌啶-3-醇	457.2

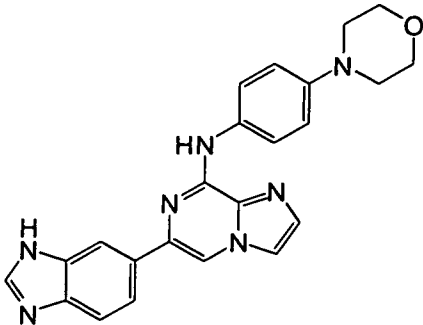
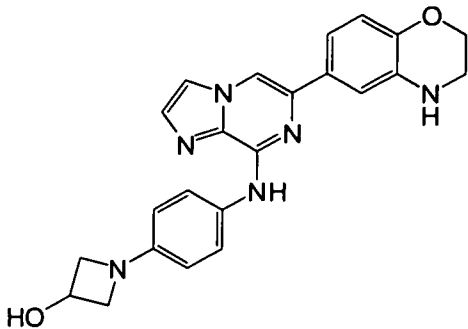
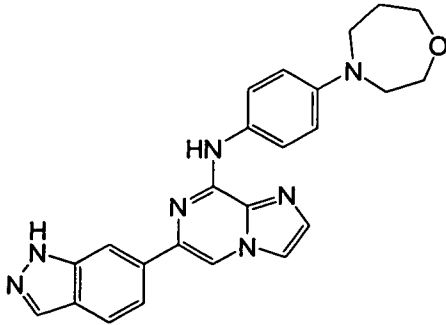
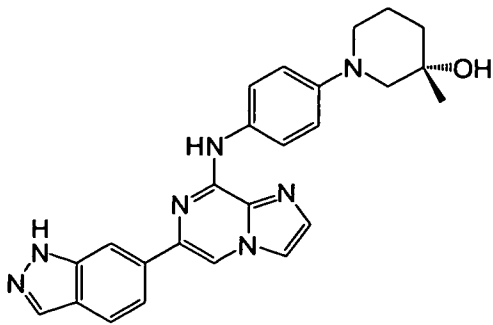
	(3S)-3- 甲 基 -1-(4-{{6-(1- 甲 基-1H-1,3-苯並二唑-5-基)咪 唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基} 苯基)哌啶-3-醇	454.6
	(3R)-3- 甲 基 -1-(4-{{6-(1- 甲 基-1H-1,3-苯並二唑-5-基)咪 唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基} 苯基)哌啶-3-醇	454.2
	(3R)-3- 甲 基 -1-(4-{{6-(1- 甲 基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪 唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基} 苯基)哌啶-3-醇	454.1
	6-(8-{{4-(4- 乙 基哌咩-1- 基) 苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡 咩-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯 並哌咩-3-酮	470.8

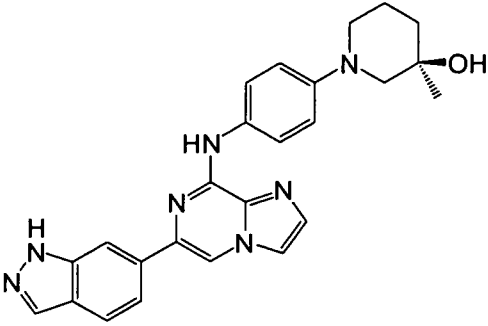
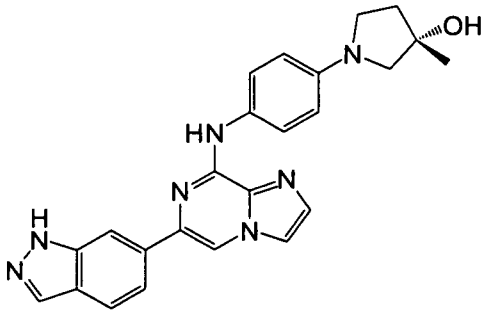
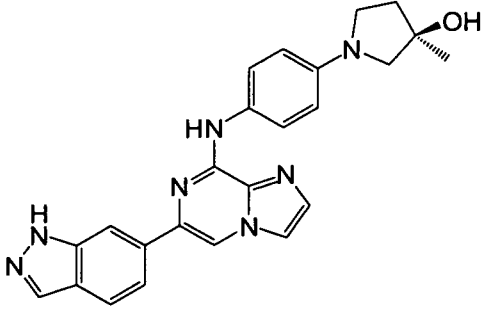
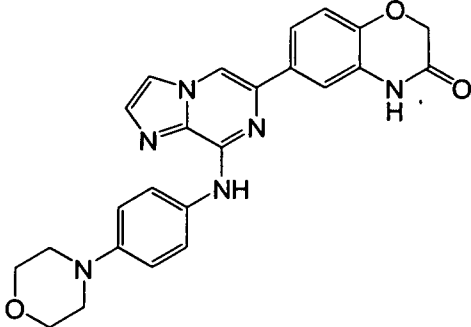
	6-(1,3-苯並噁唑-5-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	429.3
	6-(1,3-苯並噻唑-5-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	429.4
	6-(1,3-苯並噁唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	413.5
	6-(1H-吲唑-5-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	412.3

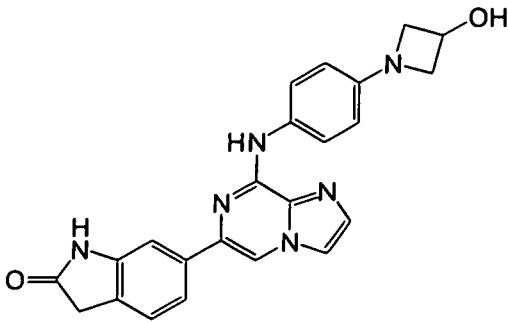
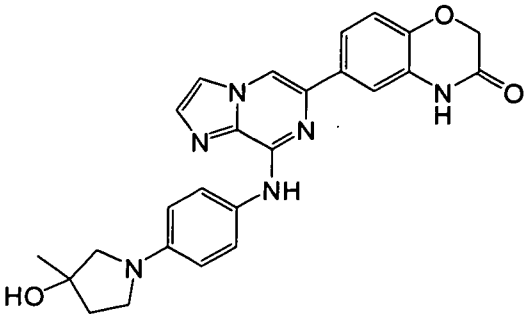
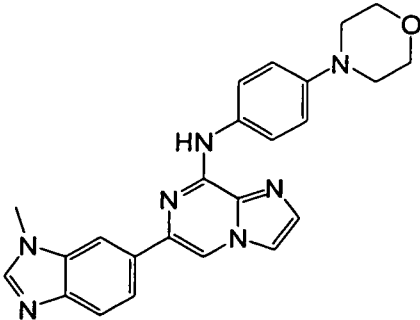
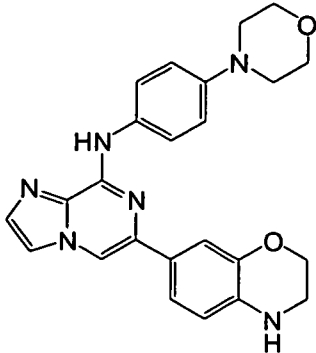
	(3S)-1-(4-{[6-(3,4- 二氢 -2H-1,4- 苯並噁吡-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基} 苯基)-3-甲基哌啶-3-醇	457.6
	(3S)-3- 甲 基 -1-(4-{[6-(1- 甲 基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基} 苯基)哌啶-3-醇	450.4
	1-(4-{[6-(1H-噁唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基} 苯基)-3-甲基四氫吡啶-3-醇	412.3
	N-{4-[(4-乙基哌啶-1-基)甲基]苯基}-6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	467.5

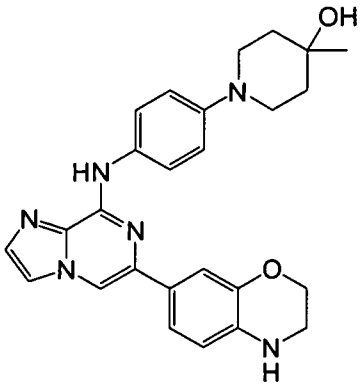
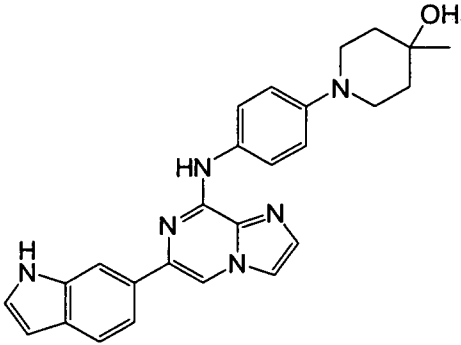
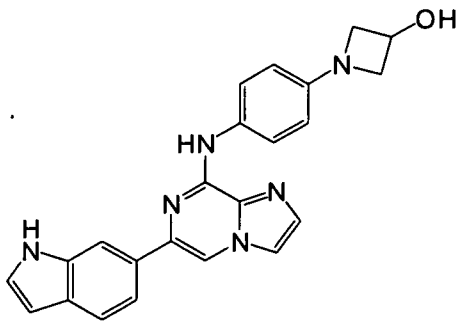
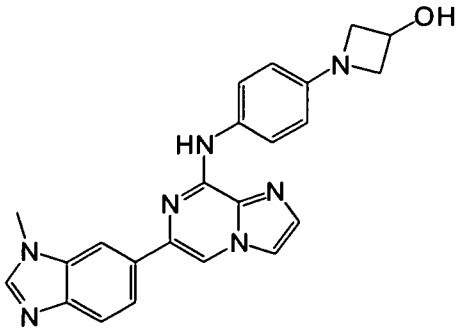
	2-[乙基(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)胺基]乙-1-醇	414.4
	1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並呿啉-7-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)四氫吡啶-3-醇	415.2
	7-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2H,3H,4H-吡啶並[3,2-b][1,4]呿啉-3-酮	444.8
	6-(1-甲基-1H-咪唑-5-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	426.1

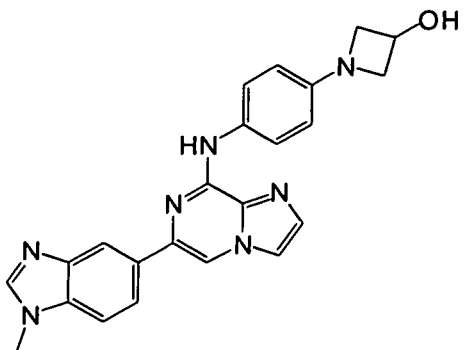
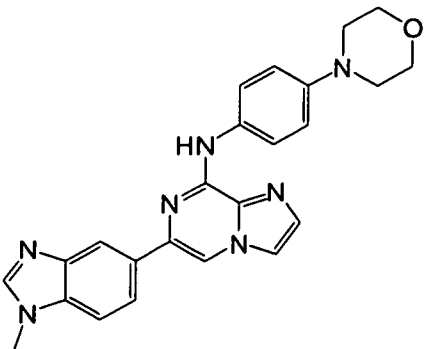
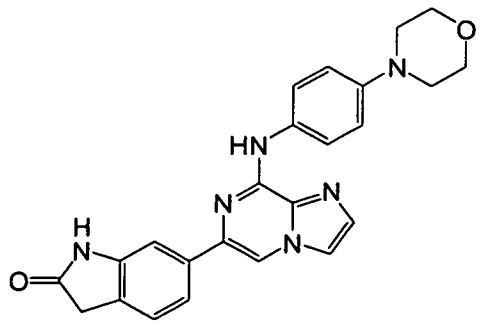
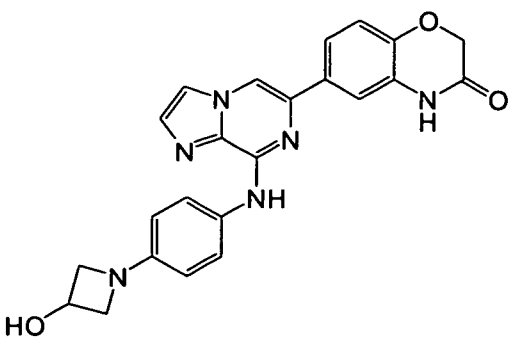
	1-(4-{{[6-(1H-吡唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯氧基}-2-甲基丙-2-醇	415.4
	6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啉-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	429.3
	4-(4-{{[6-(1H-吡唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基}哌啶-2-酮	425.1
	6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基甲基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	440.4

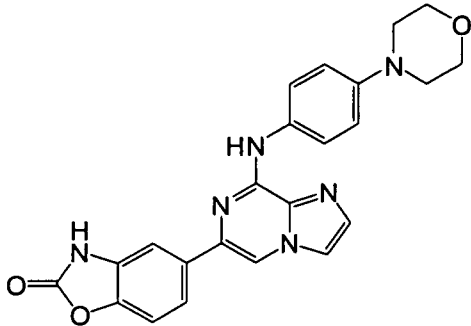
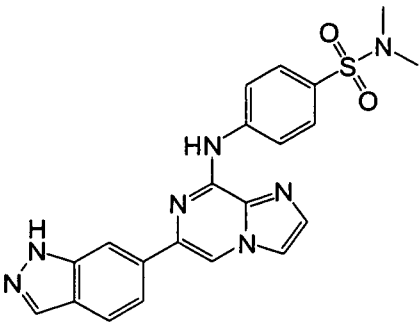
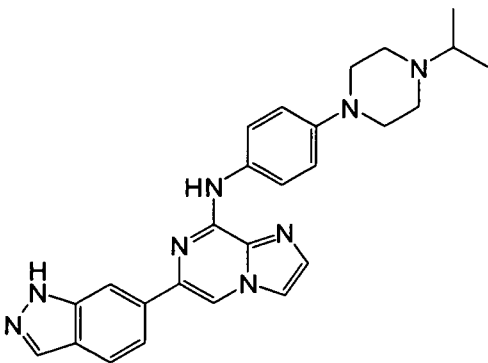
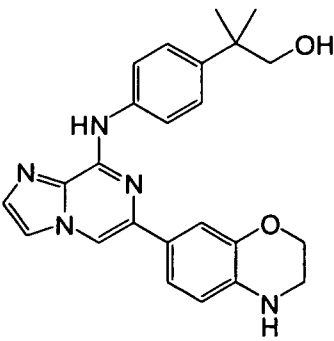
	6-(1H-1,3- 苯並二唑-6-基)- N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑 並[1,2-a]吡啶-8-胺	412.2
	1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4- 苯 並嘓啶-6-基)咪唑並[1,2-a] 吡啶-8-基]胺基}苯基)四氫 吲哚-3-醇	415.4
	6-(1H-吲唑-6-基)-N-[4-(1,4- 氧雜氮䓗-4-基)苯基]咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-胺	426.1
	(3S)-1-(4-{[6-(1H-吲唑-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺 基}苯基)-3-甲基哌啶-3-醇	440.3

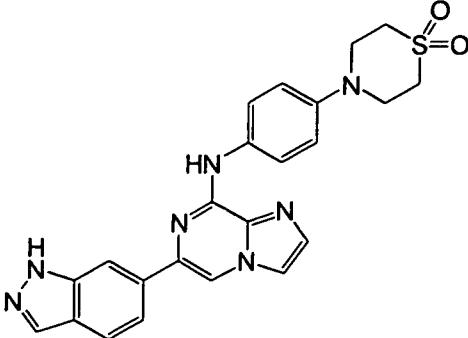
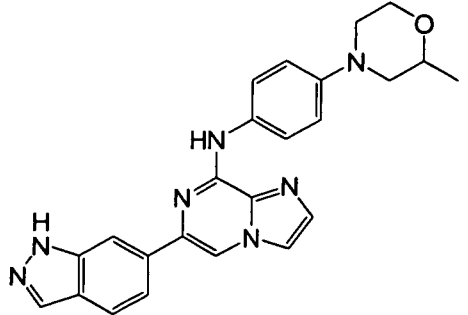
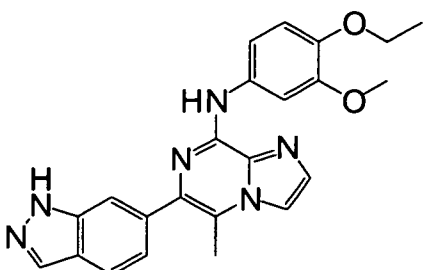
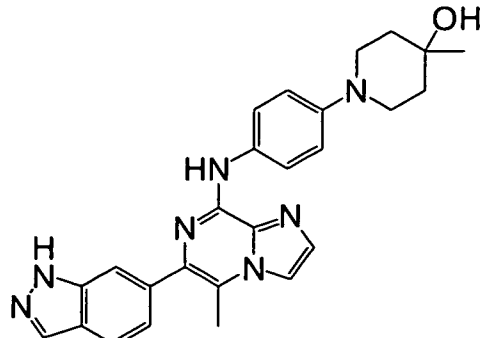
	(3R)-1-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)-3-甲基哌啶-3-醇	440.3
	(3S)-1-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)-3-甲基吡咯啉-3-醇	426.1
	(3R)-1-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)-3-甲基吡咯啉-3-醇	426.2
	6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁啉-3-酮	443.7

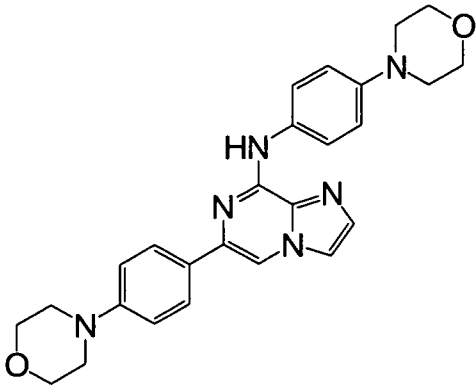
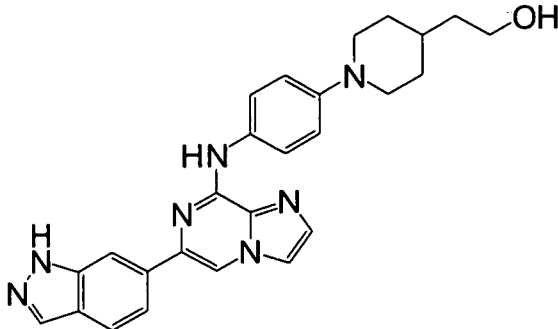
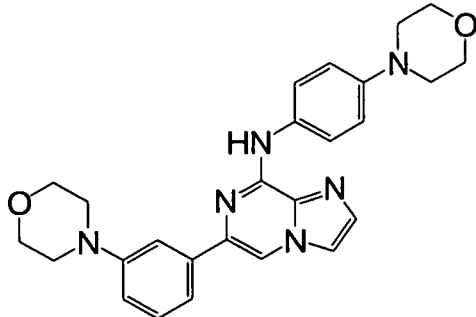
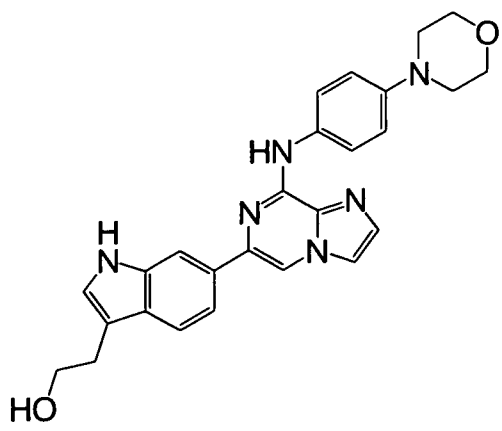
	6-(8-{{[4-(3-羟基四氢吡啶-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氢-1H-咪唑-2-酮	413.4
	6-(8-{{[4-(3-羟基-3-甲基吡咯啉-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,4-二氢-2H-1,4-苯並噁吡啶-3-酮	457.6
	6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	426.2
	6-(3,4-二氢-2H-1,4-苯並噁吡啶-7-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	429.2

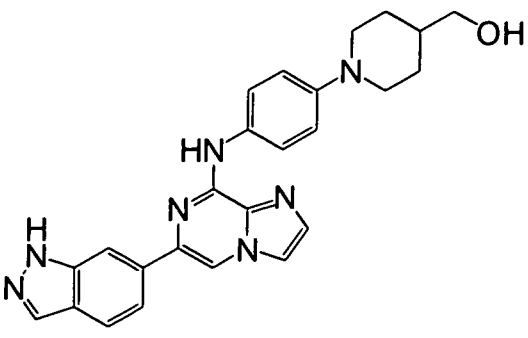
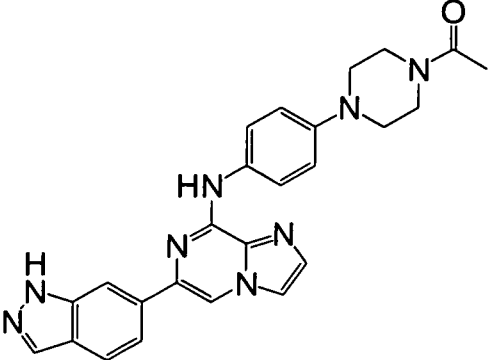
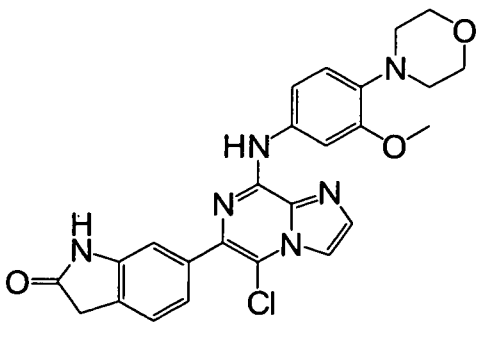
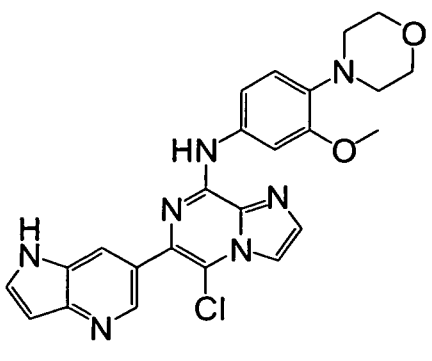
	1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並咪唑-7-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-4-甲基哌啶-4-醇	457.2
	1-(4-{[6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)-4-甲基哌啶-4-醇	439.7
	1-(4-{[6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)四氫吡啶-3-醇	397.1
	1-(4-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)四氫吡啶-3-醇	412.3

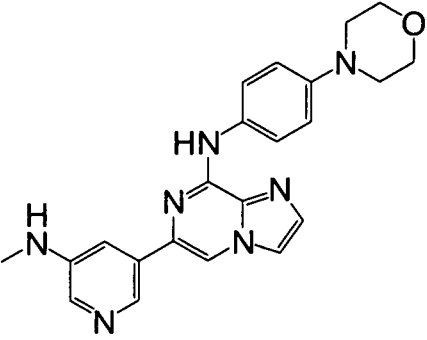
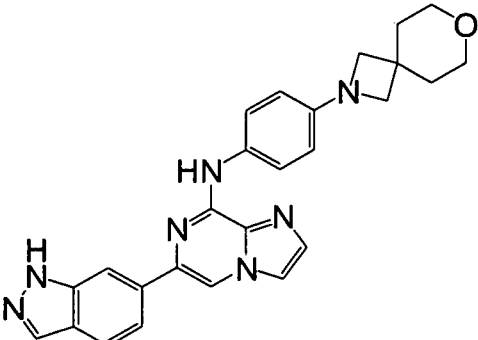
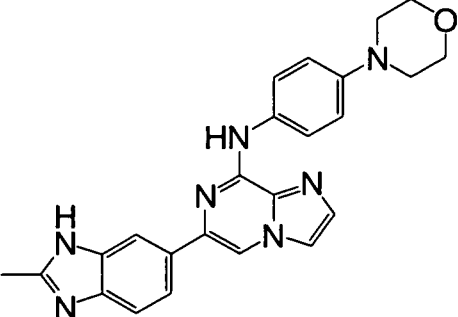
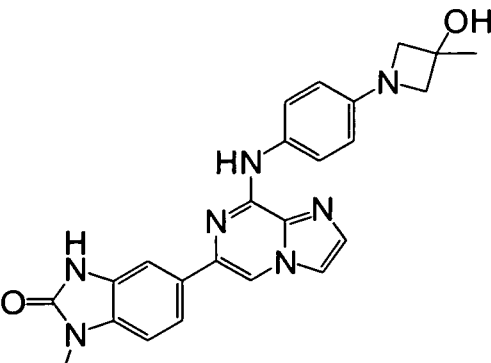
	1-(4-{[6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)四氫吡啶-3-醇	412.2
	6-(1-甲基-1H-1,3-苯並二唑-5-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	426.1
	6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮	427.1
	6-(8-{[4-(3-羥基四氫吡啶-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嗎啉-3-酮	429.3

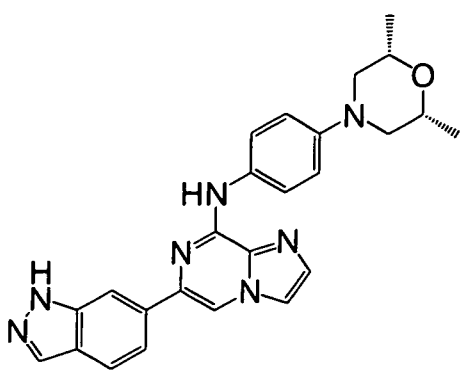
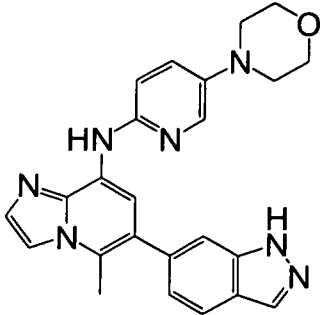
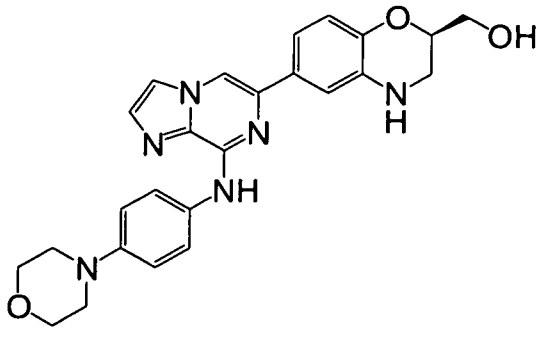
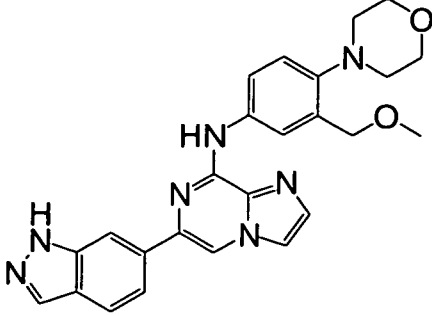
	5-(8-([4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基)咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基)-2,3-二氫-1,3-苯並呯唑-2-酮	429.3
	4-([6-(1H-呋咩-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基)-N,N-二甲基苯-1-磺醯胺	434.3
	6-(1H-呋咩-6-基)-N-{4-[4-(丙-2-基)嘧咩-1-基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡咩-8-胺	453.9
	2-(4-([6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並呯咩-7-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基)苯基)-2-甲基丙-1-醇	416.8

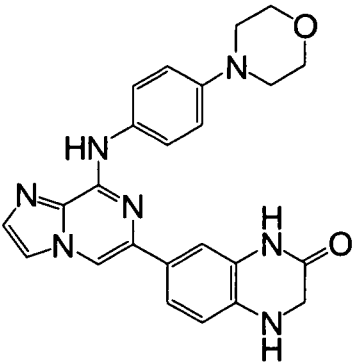
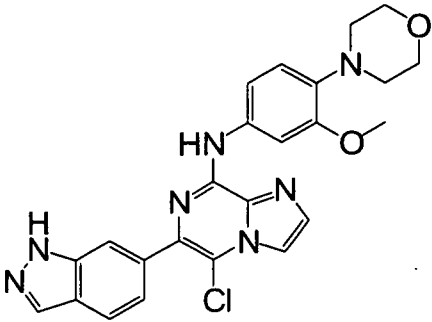
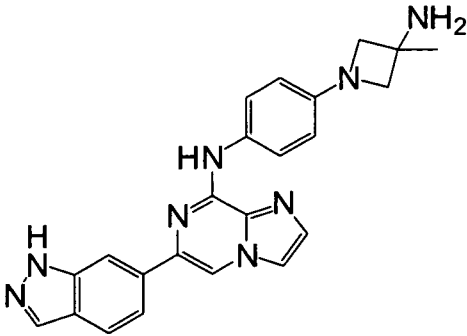
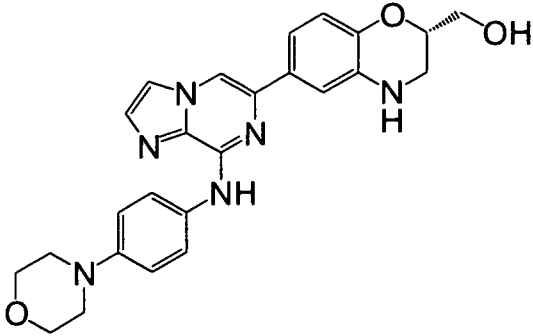
	4-(4-{{6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基}胺基}苯基)硫代嗎啉-1,1-二酮	460.4
	6-(1H-咪唑-6-基)-N-[4-(2-甲基嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡咩-8-胺	426.1
	N-(4-乙氧基-3-甲氧基苯基)-6-(1H-咪唑-6-基)-5-甲基咪唑並[1,2-a]吡咩-8-胺	415.3
	1-(4-{{6-(1H-咪唑-6-基)-5-甲基咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基}胺基}苯基)-4-甲基哌啶-4-醇	454.2

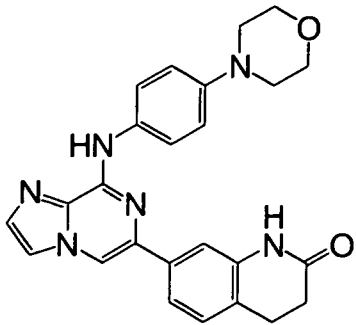
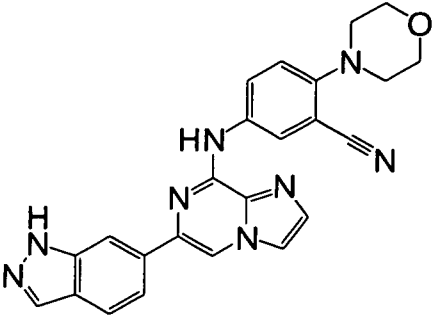
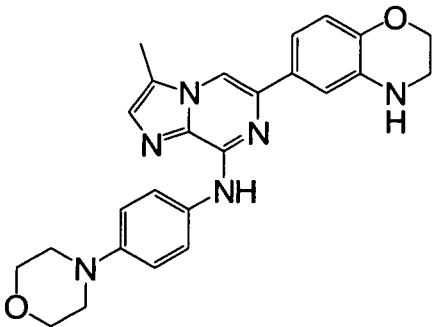
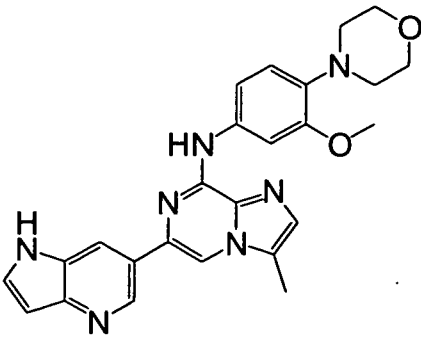
	N,6-雙[4-(嗎啉-4-基)苯基] 咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	457.3
	2-[1-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基) 咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺 基}苯基)哌啶-4-基]乙-1-醇	454.1
	6-[3-(嗎啉-4-基)苯基]-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2- a]吡啉-8-胺	457.6
	2-[6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基] 胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6- 基)-1H-咪唑-3-基]乙-1-醇	455.2

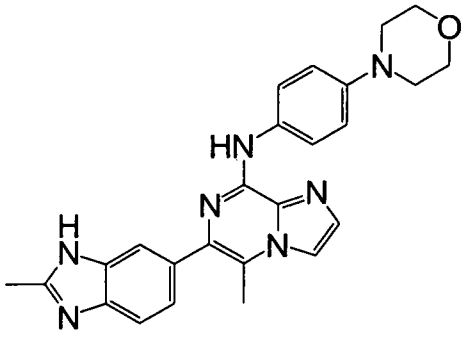
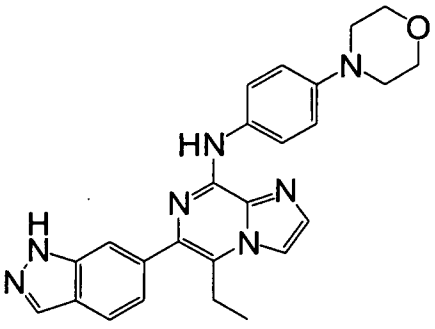
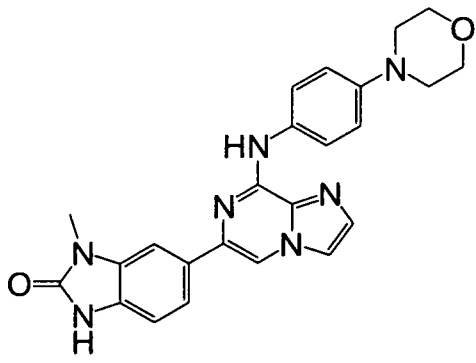
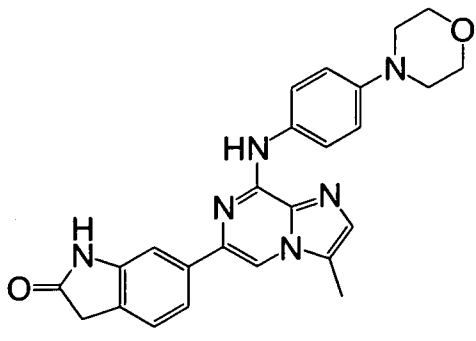
	[1-(4-{{6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基}胺基}苯基)哌啶-4-基]甲醇	440.4
	1-[4-(4-{{6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基}胺基}苯基)哌啶-1-基]乙-1-酮	453
	6-(5-氯-8-{{3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮	491.3
	5-氯-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-{{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	476.4

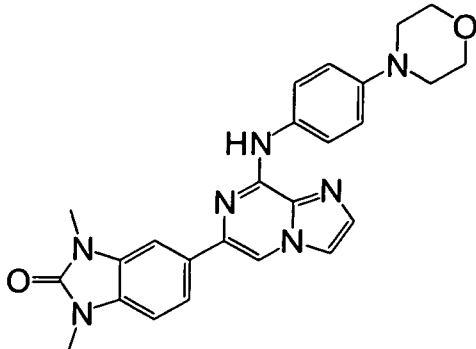
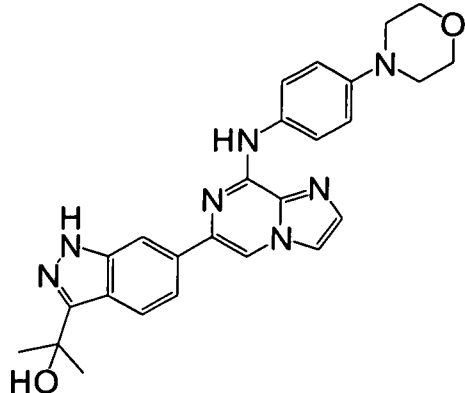
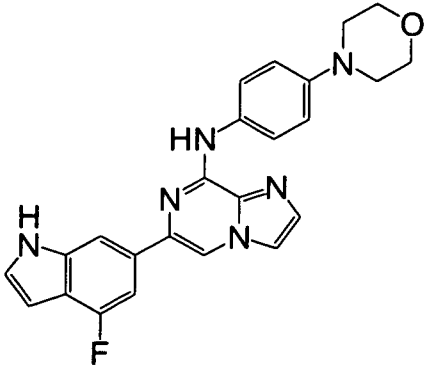
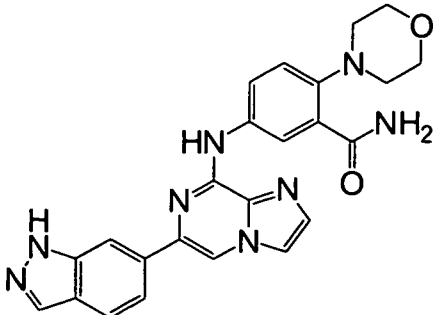
	N-甲基-5-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)吡啶-3-胺	402.3
	6-(1H-咪唑-6-基)-N-(4-{7-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基}苯基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	452.3
	6-(2-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	426.2
	5-(8-{[4-(3-羥基-3-甲基四氫吲哚-1-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1-甲基-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮	442.7

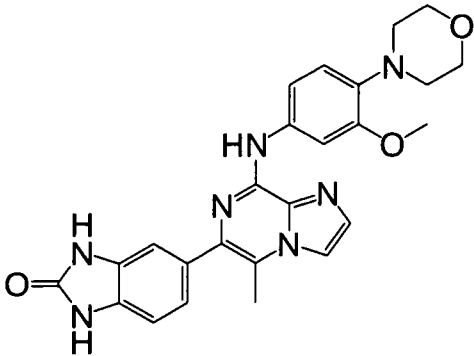
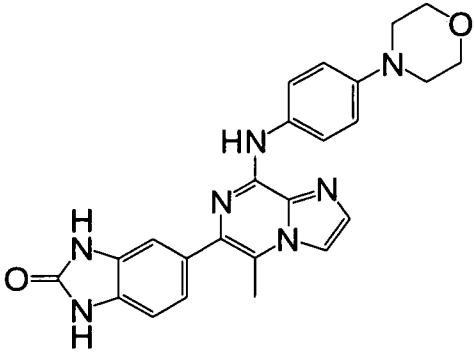
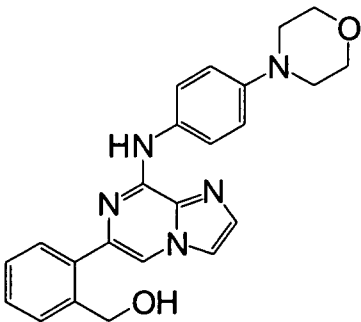
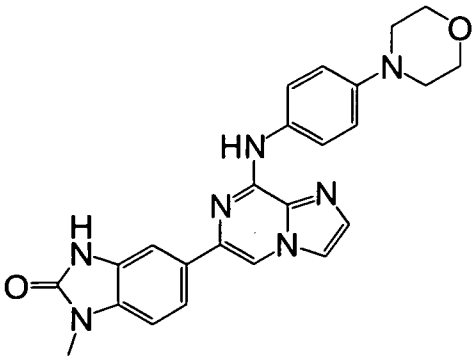
	N-{4-[(2R,6S)-2,6-二甲基嗎 啉-4-基]苯基}-6-(1H-1,2,4- 三唑-6-基)嗎啉並[1,2-a]吡 啶-8-胺	440.3
	N-[6-(1H-1,2,4-三唑-6-基)-5-甲 基嗎啉並[1,2-a]吡啶-8-基]-5-(嗎啉-4-基)吡啶-2-胺	426.2
	[(2R)-6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯 基]胺基}三唑並[1,2-a]吡 啶-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4- 苯並噁啉-2-基]甲醇	459.3
	6-(1H-1,2,4-三唑-6-基)-N-[3-(甲 氧基甲基)-4-(嗎啉-4-基)苯 基]嗎啉並[1,2-a]吡啶-8-胺	456.3

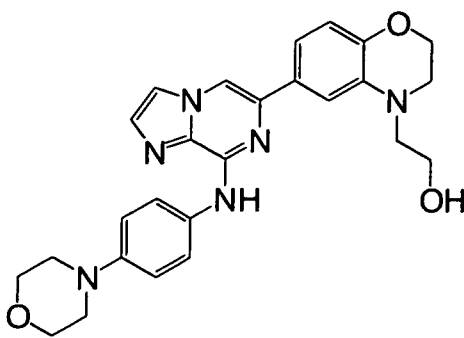
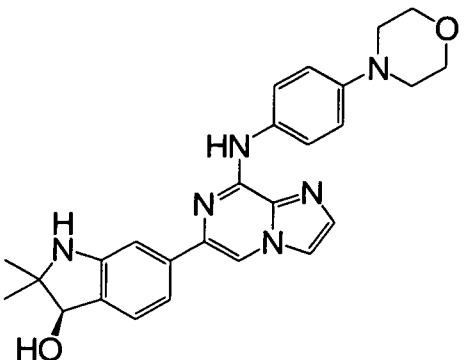
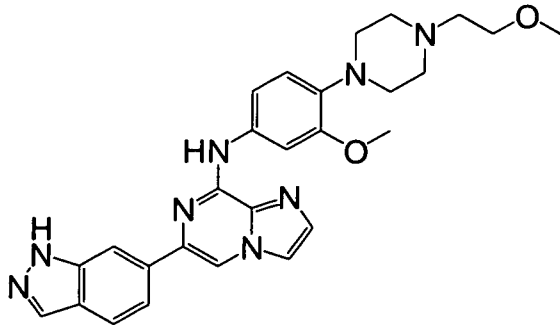
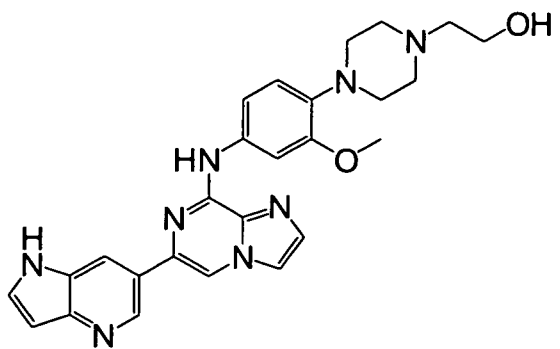
	7-(8-([4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基)咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基)-1,2,3,4-四氫喹啉-2-酮	442.4
	5-氯-6-(1H-咪唑-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡咩-8-胺	476.1
	1-(4-([6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基)苯基)-3-甲基四氫吡啶-3-胺	411.3
	[(2S)-6-(8-([4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基)咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並喹啉-2-基]甲醇	459.3

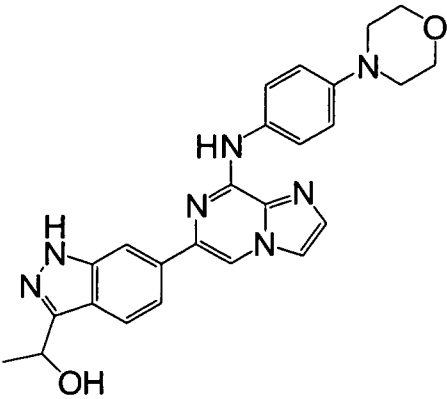
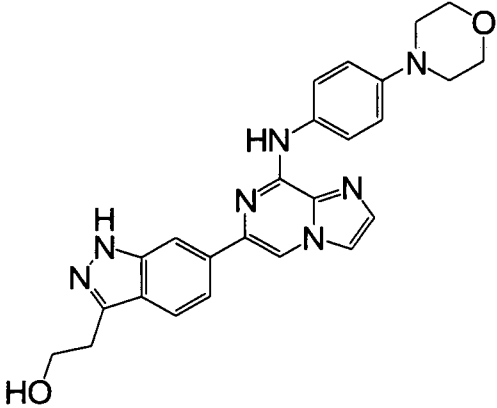
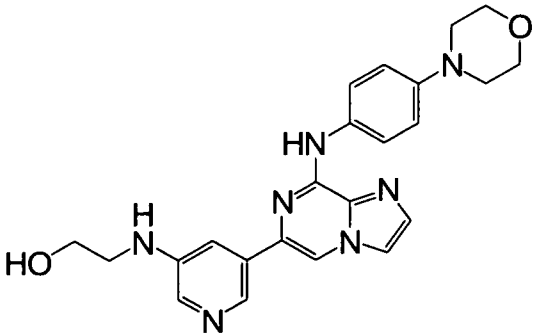
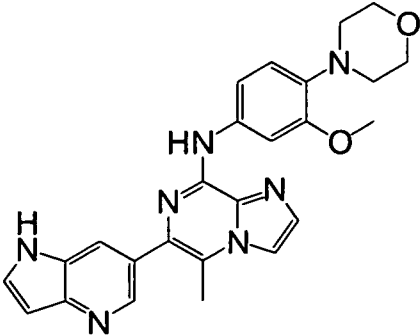
	7-(8-{{4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1,2,3,4-四氫喹啉-2-酮	441.5
	5-{{6-(1H-呟唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基}胺基}-2-(嗎啉-4-基)苄腈	437.1
	6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並呟啉-6-基)-3-甲基-N-{{4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	443.9
	N-{{3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}-3-甲基-6-{{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	456.4

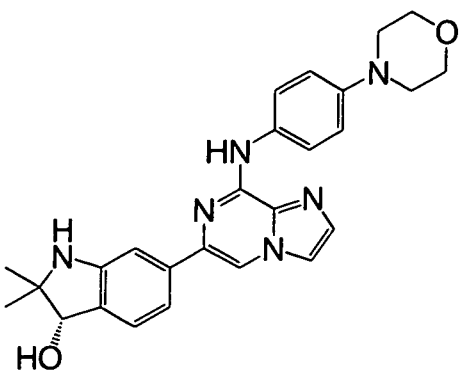
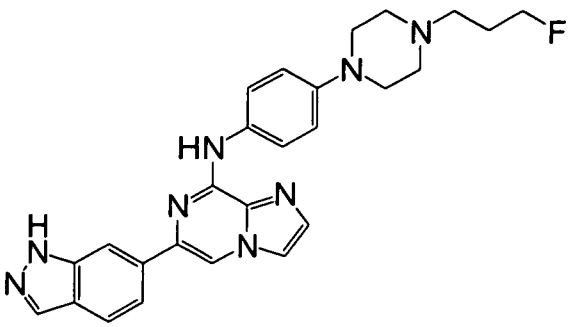
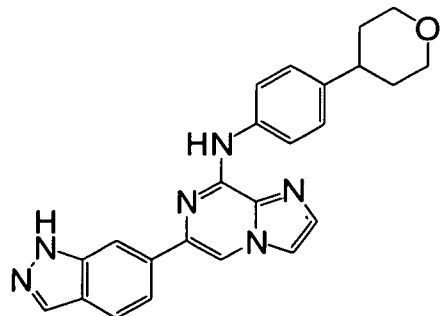
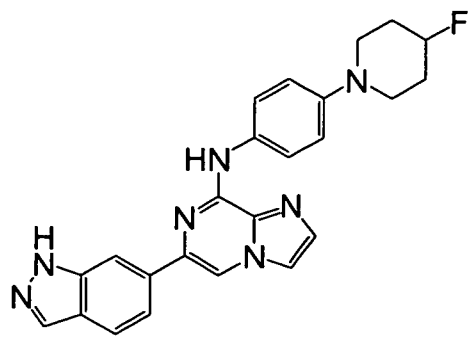
	5-甲基-6-(2-甲基-1H-1,3-苯並二唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	440.2
	5-乙基-6-(1H-咪唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	440.4
	1-甲基-6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮	442.7
	6-(3-甲基-8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-2,3-二氫-1H-咪唑-2-酮	441.3

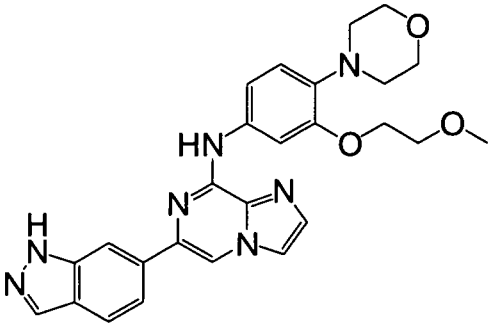
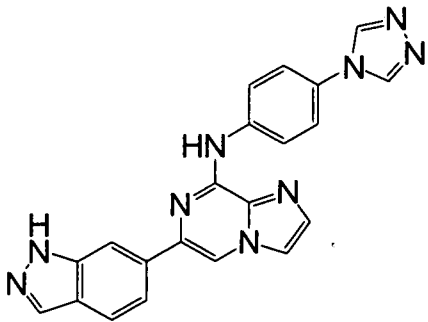
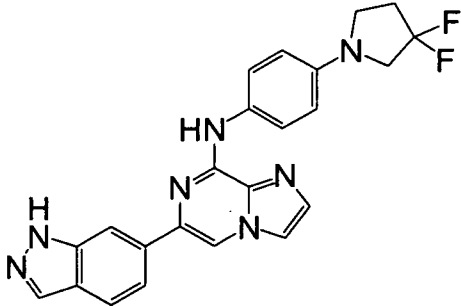
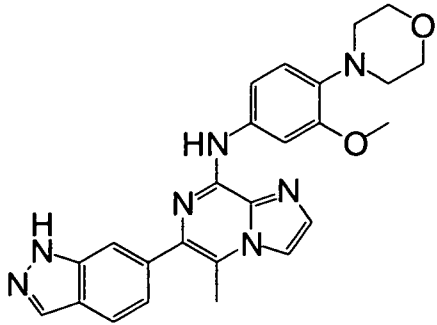
	1,3-二甲基-5-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮	456.2
	2-[6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-咪唑-3-基]丙-2-醇	470.8
	6-(4-氟-1H-咪唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	429.3
	5-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-(嗎啉-4-基)苯醯胺	455.2

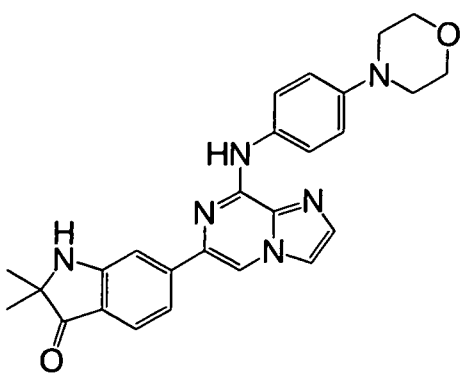
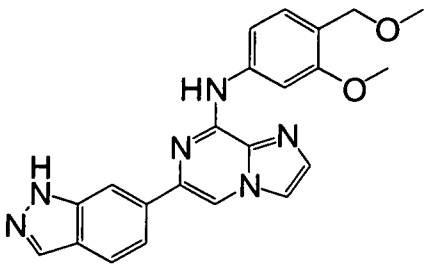
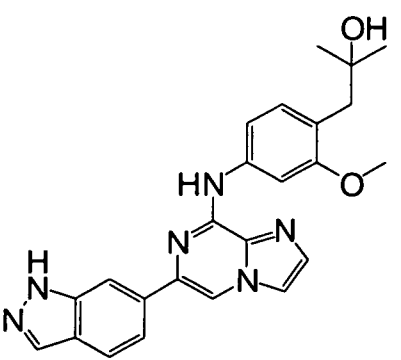
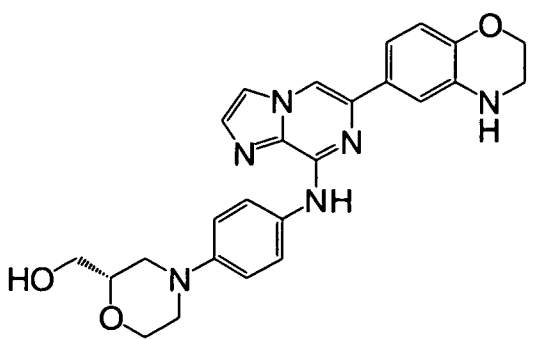
	5-(8-({3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基)-5-甲基咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮	472.4
	5-(5-甲基-8-({4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮	442.4
	[2-(8-({4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)苯基]甲醇	402.2
	1-甲基-5-(8-({4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮	442.7

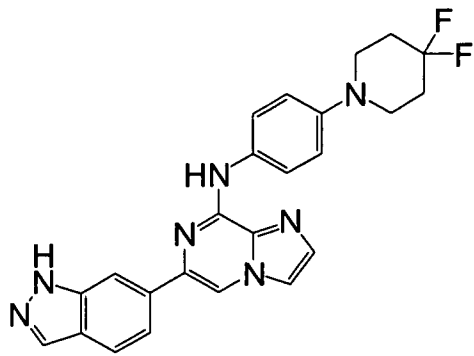
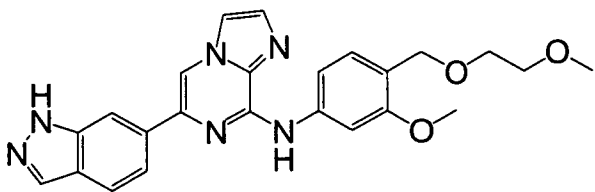
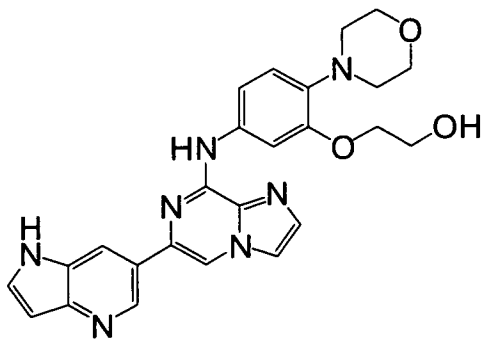
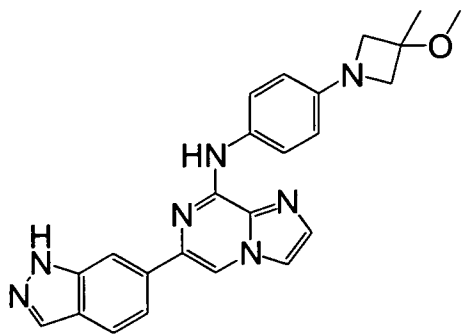
	2-[6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁啉-4-基]乙-1-醇	473.2
	(3R)-2,2-二甲基-6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-吲哚-3-醇	457.6
	6-(1H-吲哚-6-基)-N-{3-甲氧基-4-[4-(2-甲氧基乙基)哌啶-1-基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	499.6
	2-(4-{2-甲氧基-4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基)胺基]苯基}哌啶-1-基)乙-1-醇	485.7

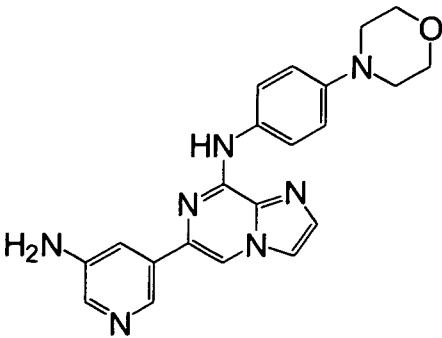
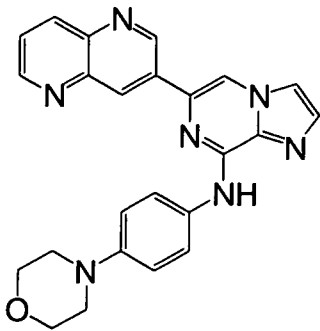
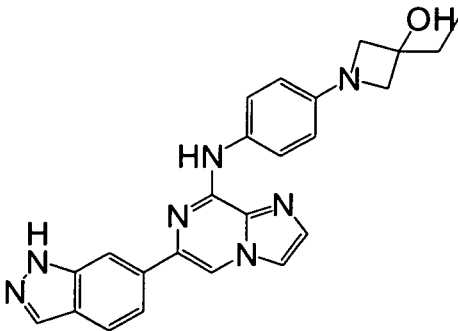
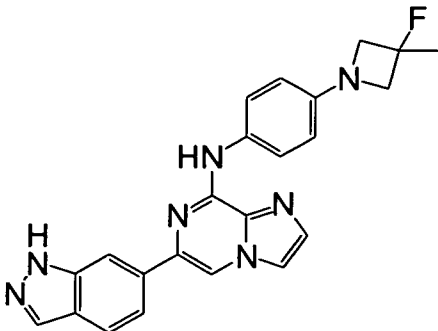
	1-[6-(8-{{4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-𪔐唑-3-基]乙-1-醇	456.5
	2-[6-(8-{{4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-𪔐唑-3-基]乙-1-醇	456.5
	2-{{5-(8-{{4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)吡啶-3-基}胺基}乙-1-醇	432.6
	N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-5-甲基-6-{{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	456.2

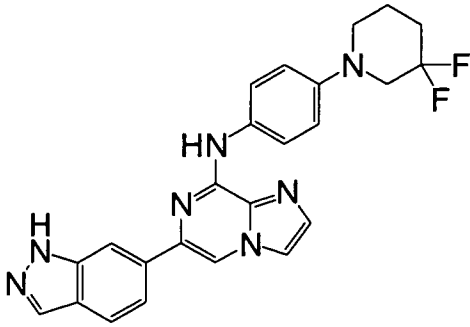
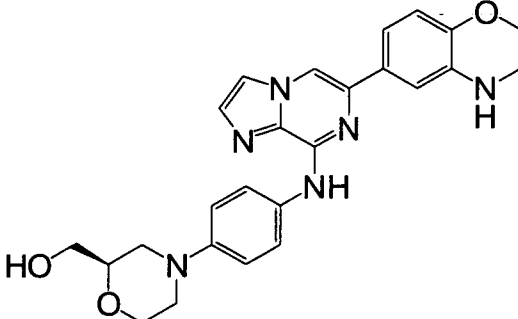
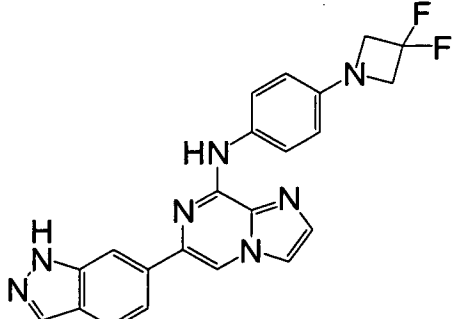
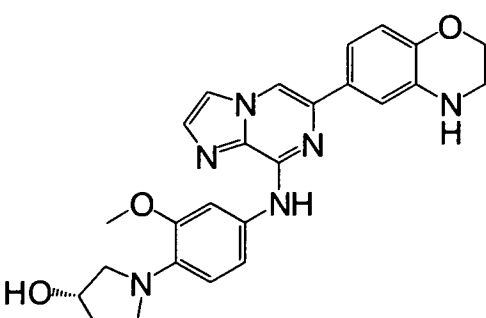
	(3S)-2,2-二甲基-6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-吲哚-3-醇	457.8
	N-{4-[4-(3-氟丙基)哌啶-1-基]苯基}-6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	471.4
	6-(1H-咪唑-6-基)-N-[4-(四氫-2H-吡喃-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	411.3
	N-[4-(4-氟哌啶-1-基)苯基]-6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	428.2

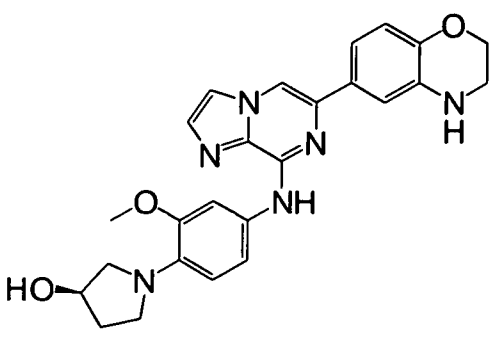
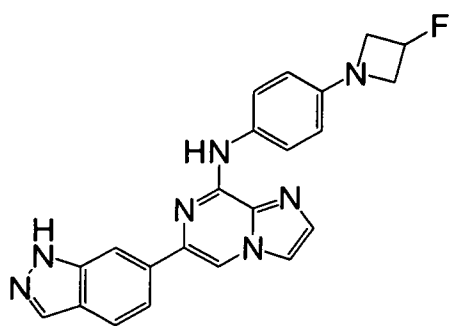
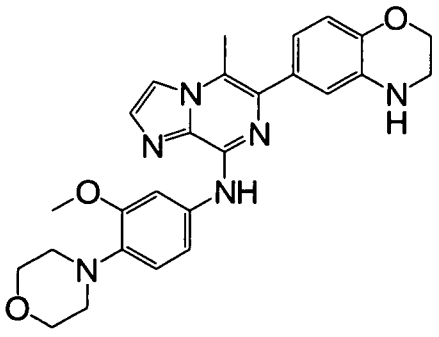
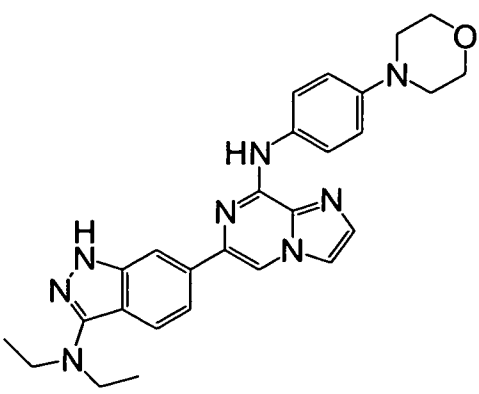
	6-(1H-tryptophan-6-yl)-N-[3-(2-甲氧基乙氧基)-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	486.6
	6-(1H-tryptophan-6-yl)-N-[4-(4H-1,2,4-三唑-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	394.3
	N-[4-(3,3-二氟吡咯啉-1-基)苯基]-6-(1H-tryptophan-6-yl)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	432.3
	6-(1H-tryptophan-6-yl)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-5-甲基咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	456.3

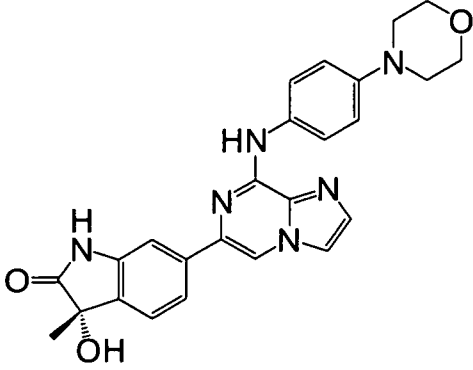
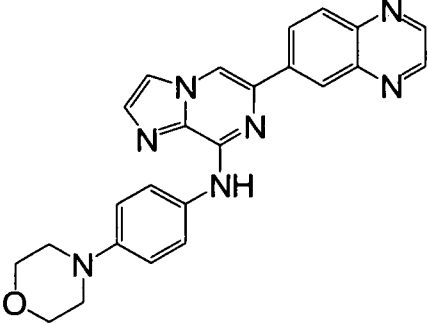
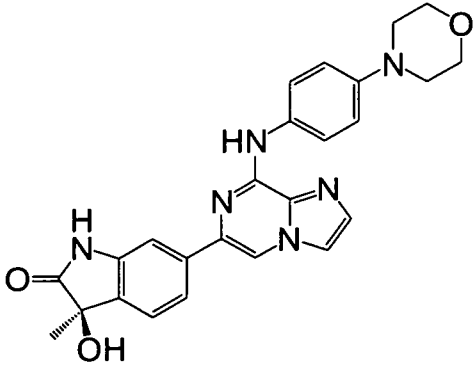
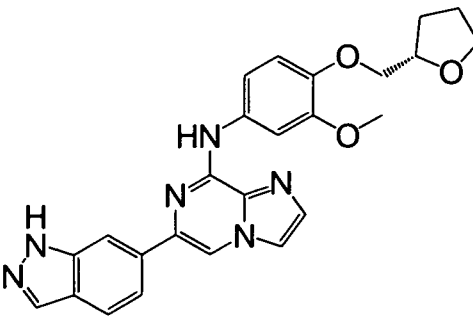
	2,2-二甲基-6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-吡啶-3-酮	455.3
	6-(1H-吡啶-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(甲氧基甲基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	401.2
	1-(4-{[6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)-2-甲基丙-2-醇	429.4
	[(2S)-4-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嗎啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)嗎啉-2-基]甲醇	459.3

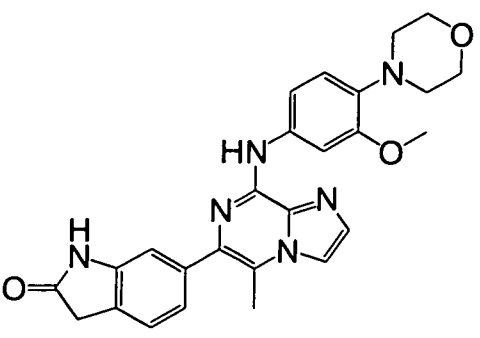
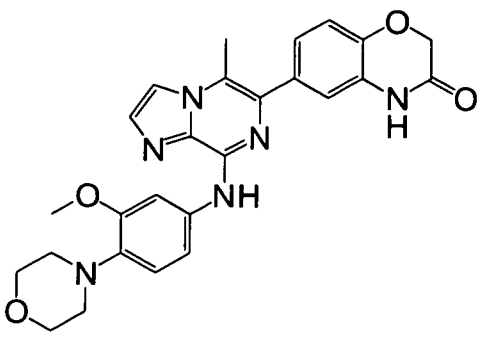
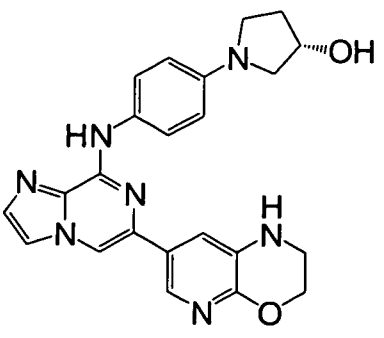
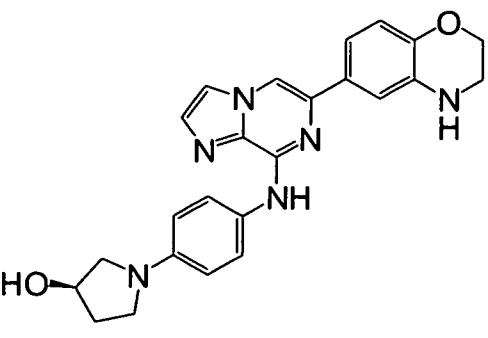
	N-[4-(4,4-二氟哌啶-1-基)苯基]-6-(1H-吲唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	446.3
	6-(1H-吲唑-6-基)-N-{3-甲氧基-4-[(2-甲氧基乙氧基)甲基]苯基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	445.5
	2-[2-(嗎啉-4-基)-5-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基)胺基]苯氧基]乙-1-醇	472.4
	6-(1H-吲唑-6-基)-N-[4-(3-甲氧基-3-甲基四氫呋-1-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	426.2

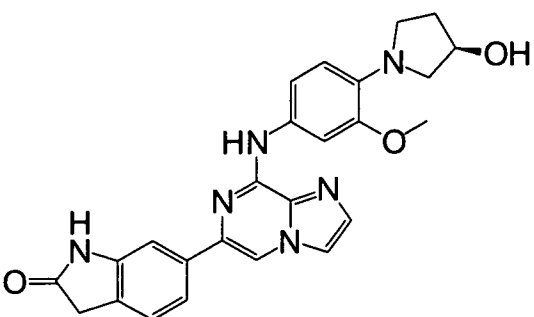
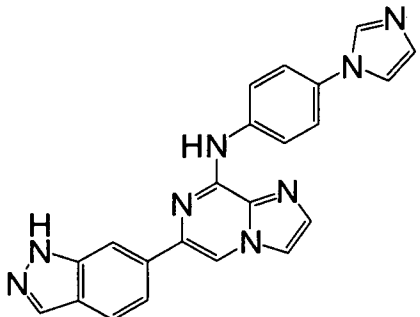
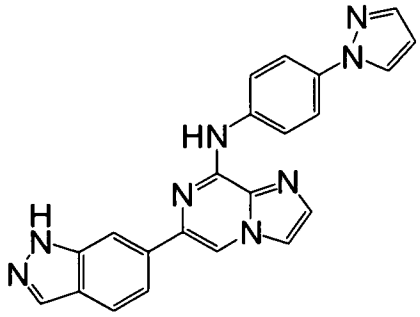
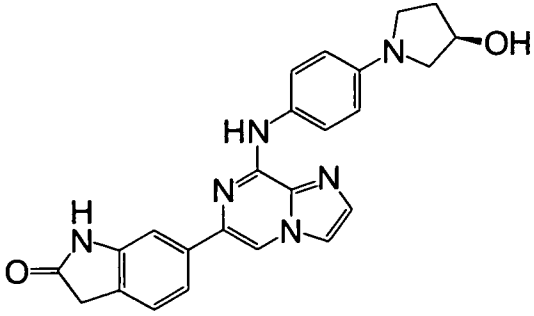
	5-(8-([4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)吡啶-3-胺	388.8
	N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(1,5-萘啶-3-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	424.2
	3-乙基-1-(4-([6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基)苯基)四氫吡啶-3-醇	426
	N-[4-(3-氟-3-甲基四氫吡啶-1-基)苯基]-6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	414.5

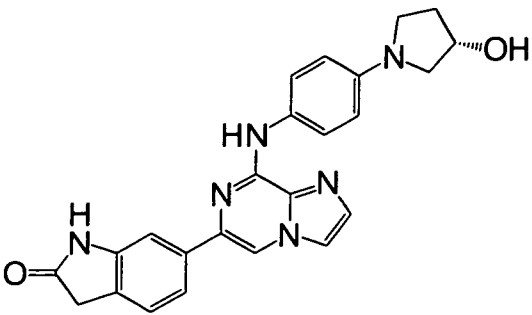
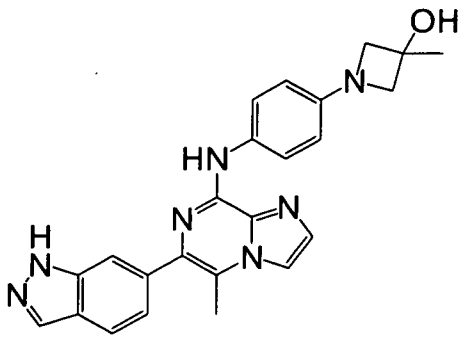
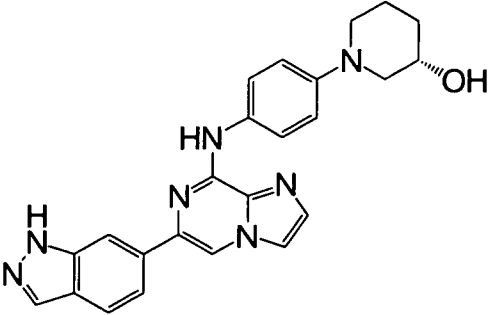
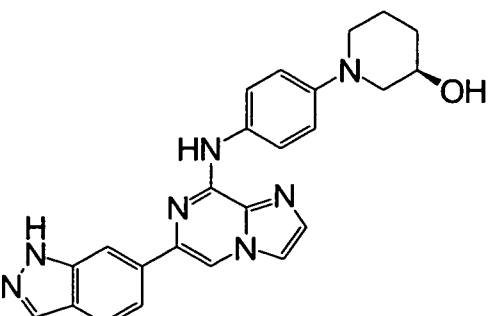
	N-[4-(3,3-二氟哌啶-1-基)苯基]-6-(1H-吡唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	446.2
	[(2R)-4-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嗎啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)嗎啉-2-基]甲醇	459.4
	N-[4-(3,3-二氟四氫吡啶-1-基)苯基]-6-(1H-吡唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	418.6
	(3S)-1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嗎啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)吡咯啶-3-醇	459.5

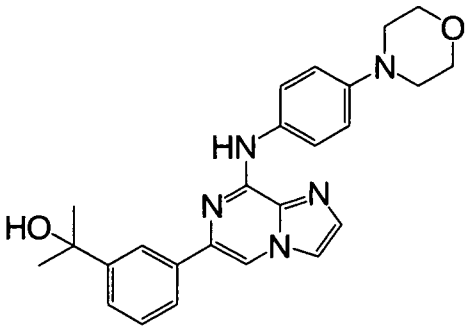
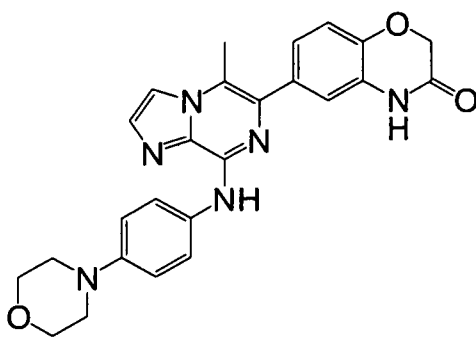
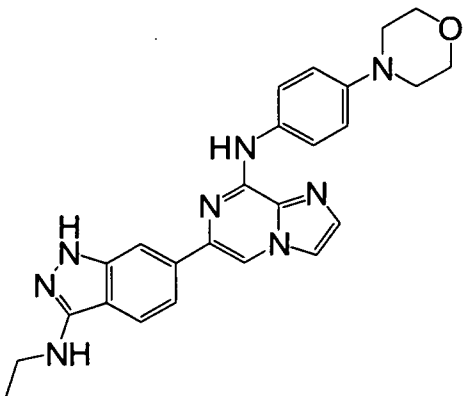
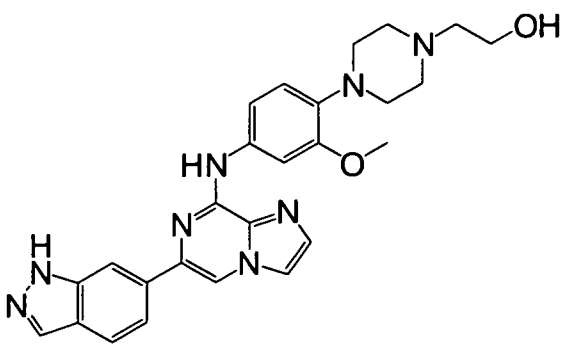
	(3R)-1-(4-{[6-(3,4- 二 氫 -2H-1,4- 苯 並 噁 吡 -6- 基)咪 唑 並 [1,2-a]吡 啶 -8-基]胺 基}-2-甲 氧 基 苯 基)吡 咯 啉 -3-醇	459.5
	N-[4-(3- 氟 四 氫 吡 啶 -1-基)苯 基]-6-(1H- 咪 唑 -6-基)咪 唑 並 [1,2-a]吡 啶 -8-胺	400.2
	6-(3,4- 二 氫 -2H-1,4- 苯 並 噁 吡 -6-基)-N-[3-甲 氧 基 -4-(嗎 啉 -4-基)苯 基]-5-甲 基 咪 唑 並 [1,2-a]吡 啶 -8-胺	473.2
	N,N-二 乙 基 -6-(8-{[4-(嗎 啉 -4-基)苯 基]胺 基}咪 唑 並 [1,2-a]吡 啶 -6-基)-1H- 咪 唑 -3-胺	483.6

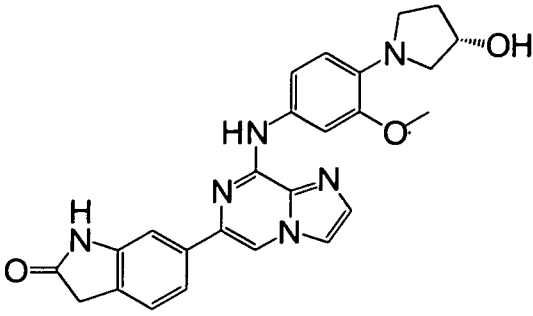
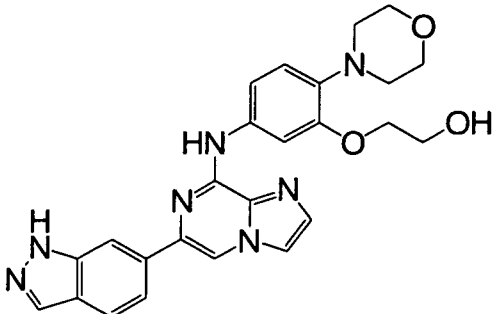
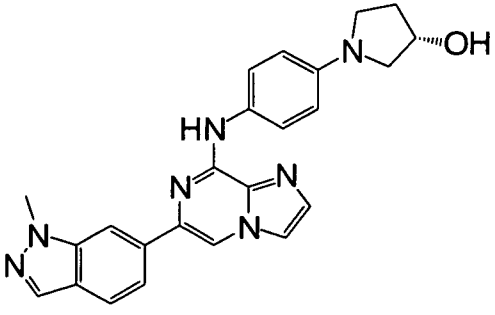
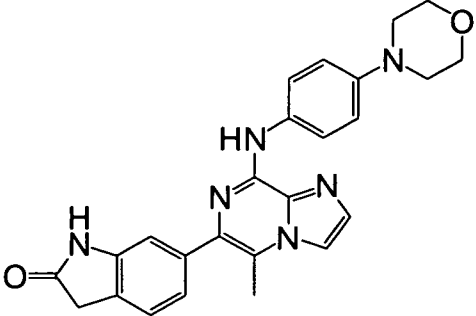
	(3S)-3-羟基-3-甲基-6-(8-{[4-(吗啉-4-基)苯基]胺基}咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氢-1H-吲哚-2-酮	457.6
	N-[4-(吗啉-4-基)苯基]-6-(喹啉-6-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-8-胺	424.3
	(3R)-3-羟基-3-甲基-6-(8-{[4-(吗啉-4-基)苯基]胺基}咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氢-1H-吲哚-2-酮	457.6
	6-(1H-咪唑[4,5-b]吡啶-6-基)-N-{3-甲氧基-4-[(2S)-四氢呋喃-2-基甲氧基]苯基}咪唑并[1,2-a]吡啶-8-胺	457.5

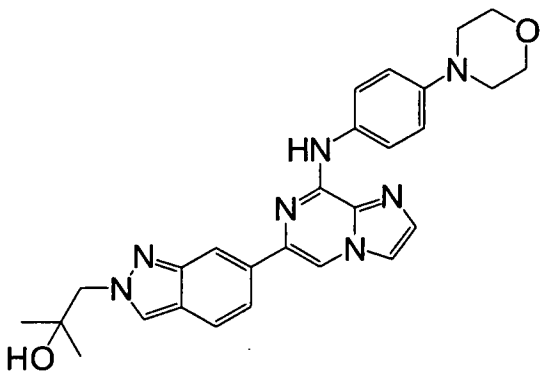
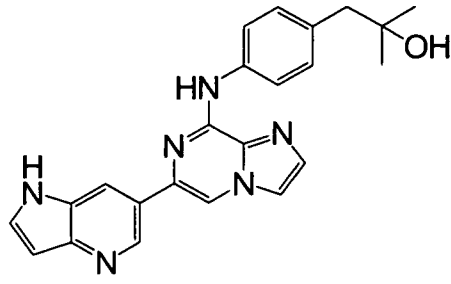
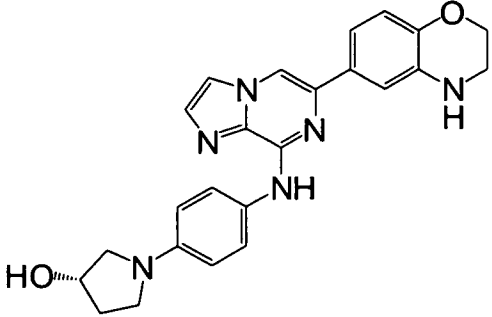
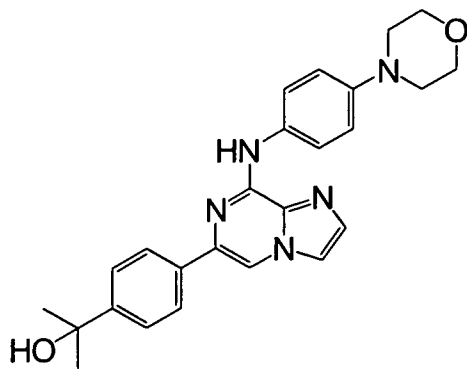
	6-(8-([3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基)-5-甲基咪唑並[1,2-a]吡嗪-6-基)-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮	471.7
	6-(8-([3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基)-5-甲基咪唑並[1,2-a]吡嗪-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-3-酮	487.5
	(3S)-1-(4-((6-((1H,2H,3H-吡啶並[2,3-b][1,4]噁吡-7-基)咪唑並[1,2-a]吡嗪-6-基)胺基)苯基)吡咯啉-3-醇	430.4
	(3R)-1-(4-((6-((3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-6-基)咪唑並[1,2-a]吡嗪-6-基)胺基)苯基)吡咯啉-3-醇	429.4

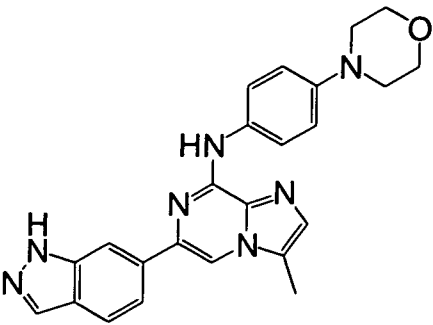
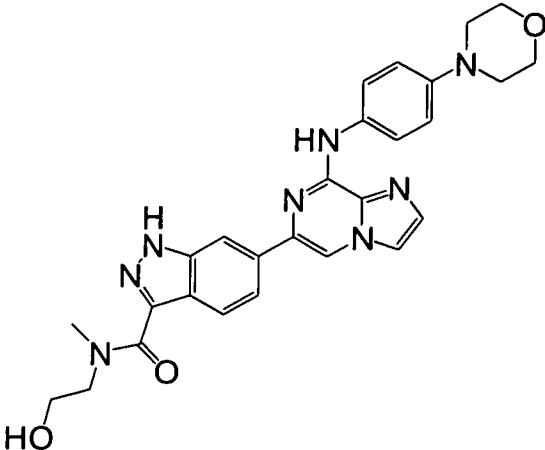
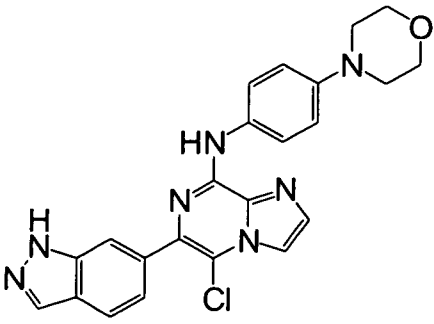
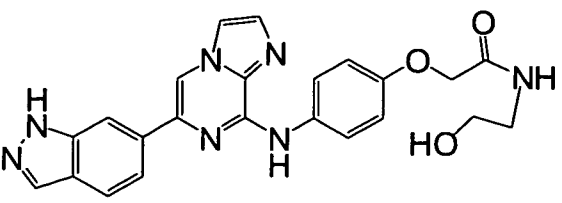
	6-[8-({4-[(3R)-3- 羥基吡咯 啉-1-基]-3-甲氧基苯基}胺 基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基]- 2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮	457.3
	N-[4-(1H-咪唑-1-基)苯基]- 6-(1H- 吲 唑 -6- 基)咪唑 並 [1,2-a]吡啶-8-胺	393.3
	6-(1H-吲 唑 -6- 基)-N-[4-(1H- 吡 唑 -1-基)苯基]咪唑 並 [1,2- a]吡啶-8-胺	393.2
	6-[8-({4-[(3R)-3- 羥基吡咯 啉-1-基]苯基}胺基)咪唑 並 [1,2-a]吡啶-6-基]-2,3- 二氫- 1H-吲哚-2-酮	427.1

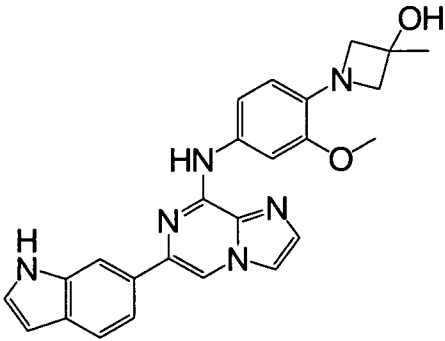
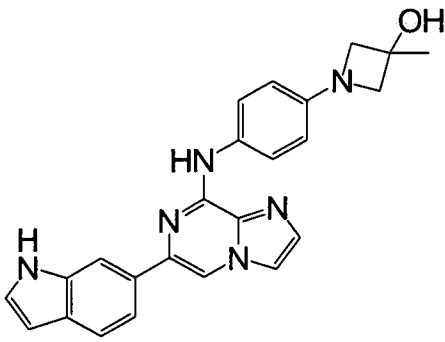
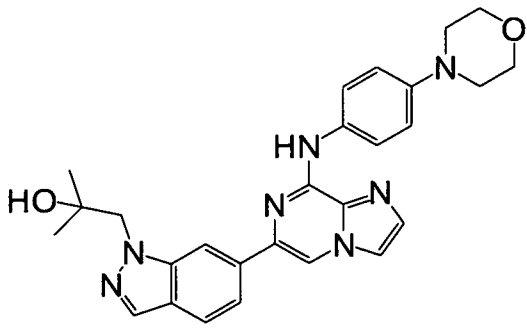
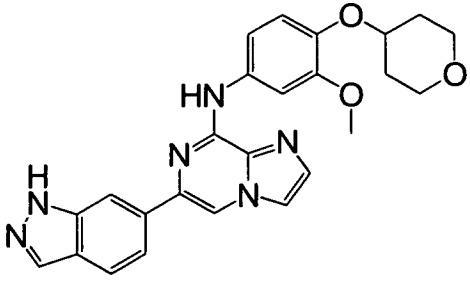
	6-[8-({4-[(3S)-3- 羥 基 吡 咯 啉-1-基] 苯 基} 胺 基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 嘓 -6-基]-2,3- 二 氫 -1H- 唞 噪 -2- 酮	427
	1-(4-{{6-(1H- 唞 噪 -6- 基)-5- 甲 基 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 嘓 -8-基} 胺 基} 苯 基)-3- 甲 基 四 氫 吡 噪 -3- 醇	426.2
	(3S)-1-(4-{{6-(1H- 唞 噪 -6- 基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 嘓 -8- 基} 胺 基} 苯 基) 哌 啶 -3- 醇	426.2
	(3R)-1-(4-{{6-(1H- 唞 噪 -6- 基) 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 嘓 -8- 基} 胺 基} 苯 基) 哌 啶 -3- 醇	426.2

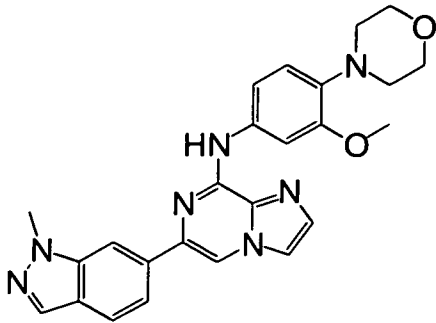
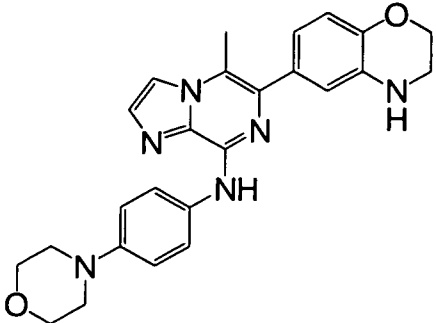
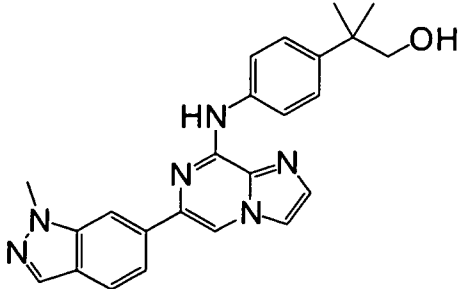
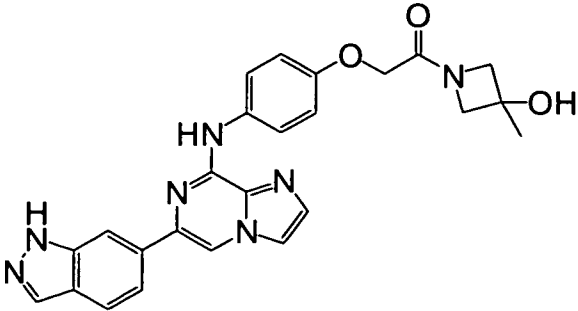
	2-[3-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)苯基]丙-2-醇	430.2
	6-(5-甲基-8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘮啶-3-酮	457.2
	N-乙基-6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-吲唑-3-胺	455.2
	2-[4-(4-{[6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)哌啶-1-基]乙-1-醇	485.6

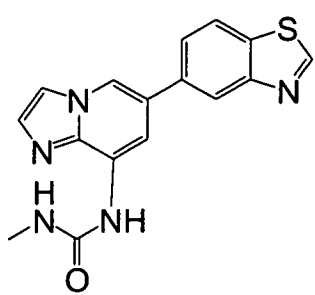
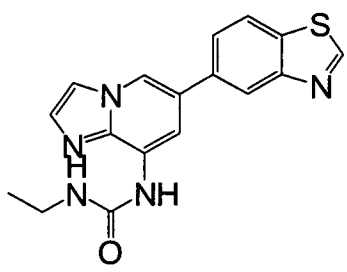
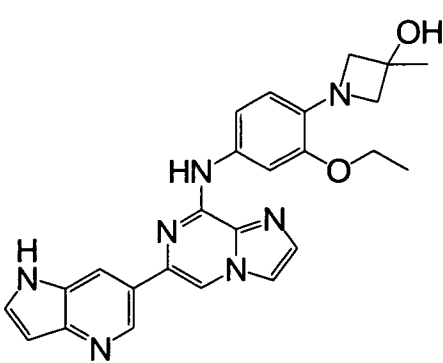
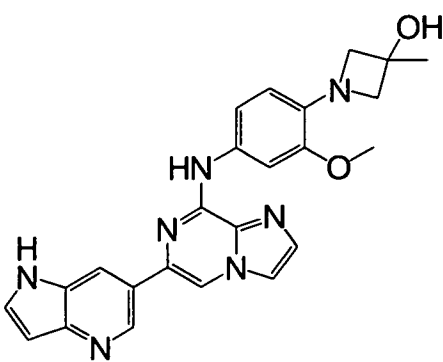
	6-[8-({4-[(3S)-3- 羥 基 吡 咯 啞 -1-基]-3-甲氧基苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基]-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮	457.6
	2-(5-{[6-(1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基}-2-(嗎啉-4-基)苯氧基)乙-1-醇	472.4
	(3S)-1-(4-{[6-(1-甲基-1H-吲哚-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基}苯基)吡咯啞-3-醇	426.2
	6-(5-甲基-8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基)-2,3-二氫-1H-吲哚-2-酮	441.3

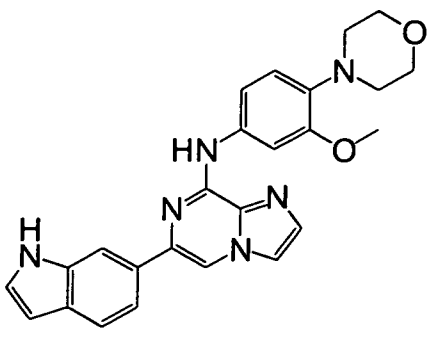
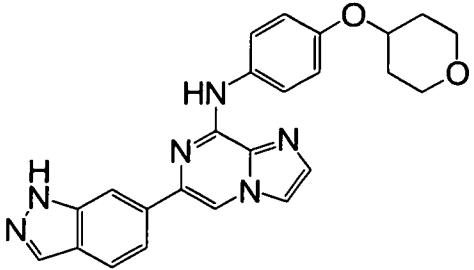
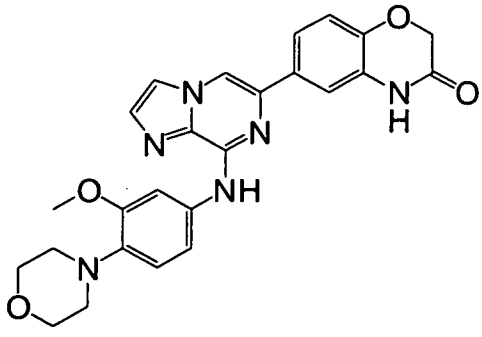
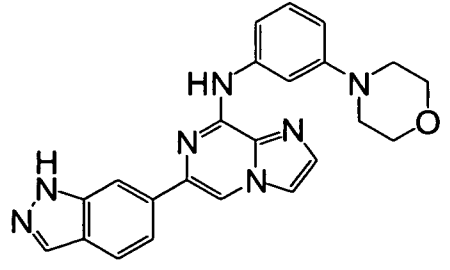
	2-甲基-1-[6-(8-{4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啞-6-基)-2H-吡啞-2-基]丙-2-醇	484.6
	2-甲基-1-{4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啞-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啞-8-基)胺基]苯基}丙-2-醇	399.2
	(3S)-1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡啞-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啞-8-基]胺基}苯基)吡咯啞-3-醇	429.4
	2-[4-(8-{4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啞-6-基)苯基]丙-2-醇	430.2

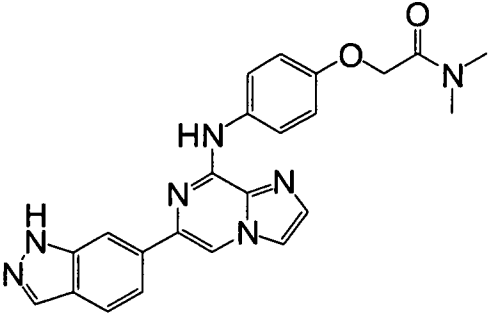
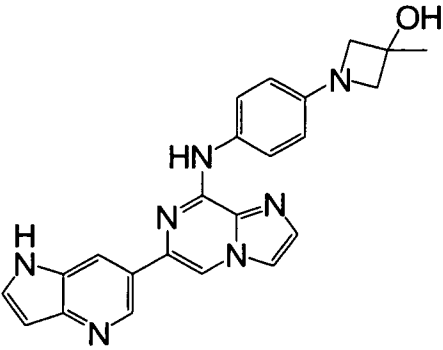
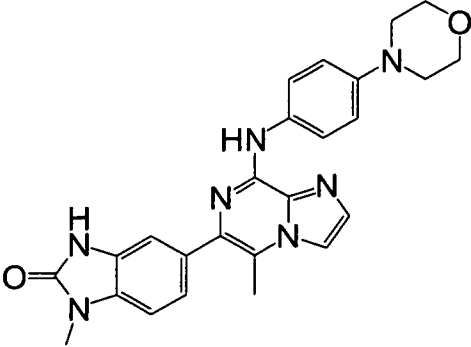
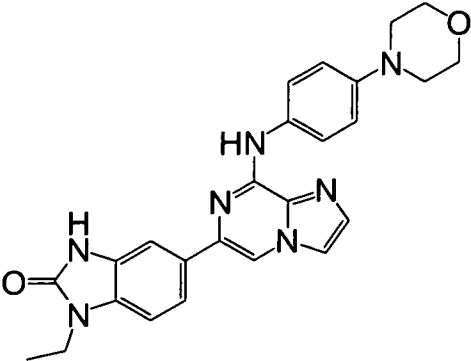
	6-(1H-咪唑-6-基)-3-甲基-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡咩-8-胺	426.2
	N-(2-羥基乙基)-N-甲基-6-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡咩-6-基)-1H-咪唑-3-羧醯胺	513.6
	5-氯-6-(1H-咪唑-6-基)-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡咩-8-胺	446.4
	N-(2-羥基乙基)-2-(4-{[6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡咩-8-基]胺基}苯氧基)乙醯胺	444.8

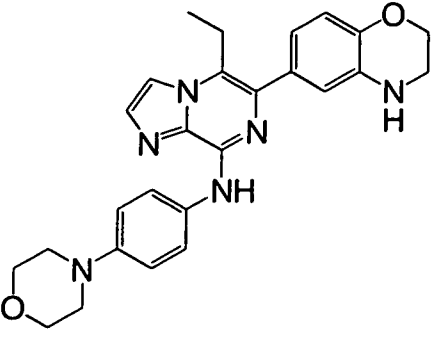
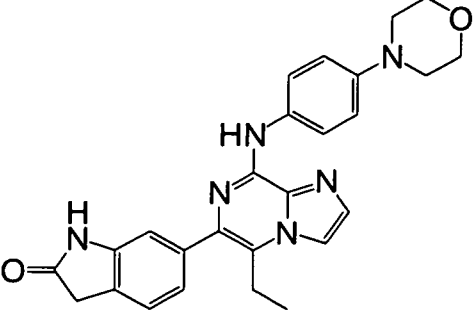
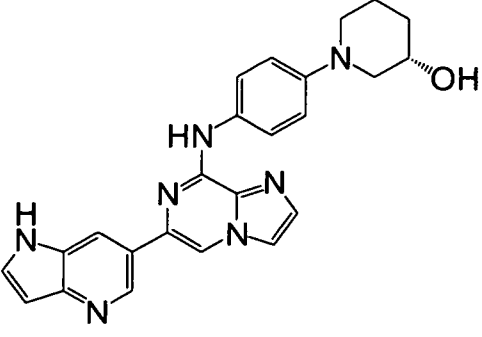
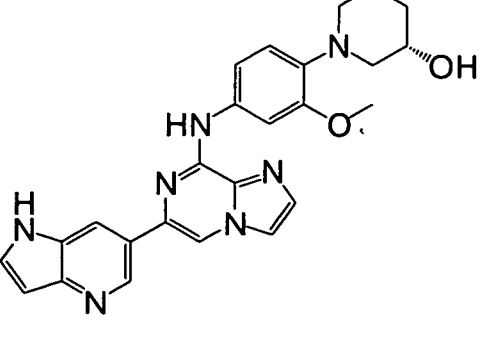
	1-(4-{{6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基}胺基}-2-甲氧基苯基)-3-甲基四氫吡啶-3-醇	441.4
	1-(4-{{6-(1H-吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基}胺基}苯基)-3-甲基四氫吡啶-3-醇	411.4
	2-甲基-1-[6-(8-{{4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-吡啶-1-基]丙-2-醇	484.7
	6-(1H-吡啶-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(四氫吡喃-4-基氧)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	457.6

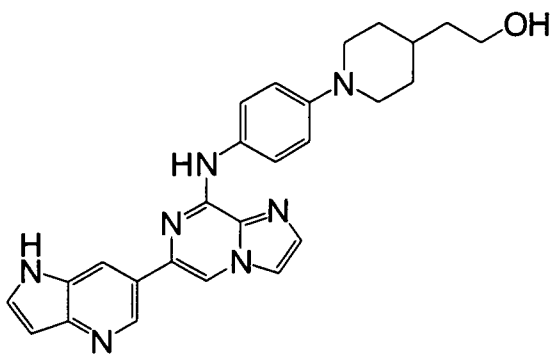
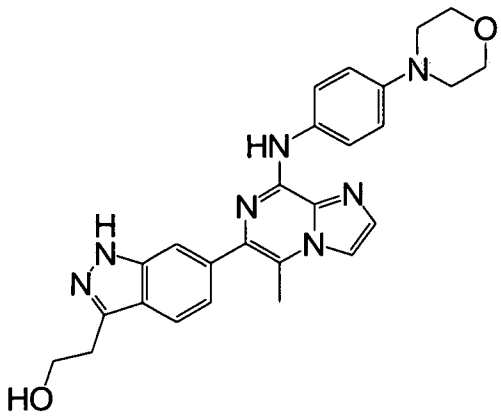
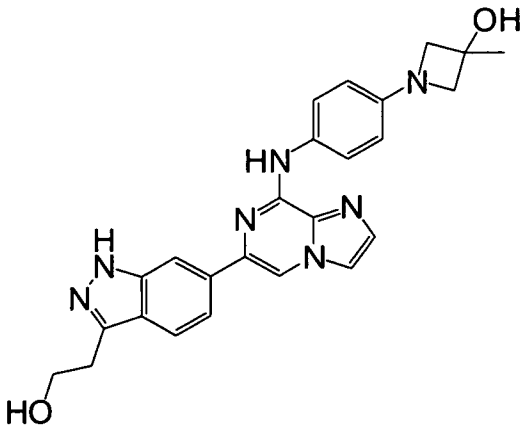
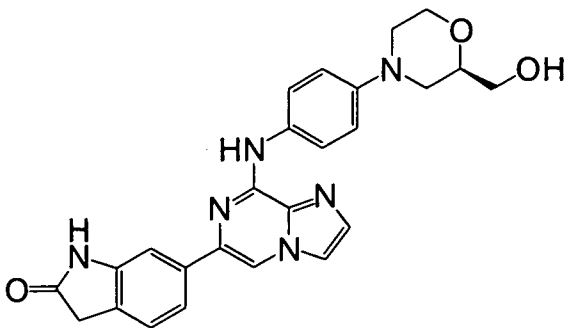
	N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]-6-(1-甲基-1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	456.2
	6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並咪唑-6-基)-5-甲基-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	443.3
	2-甲基-2-(4-{{6-(1-甲基-1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基}胺基}苯基)丙-1-醇	413.5
	1-(3-羥基-3-甲基四氫吡啶-1-基)-2-(4-{{6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基}胺基}苯氧基)乙-1-酮	470.7

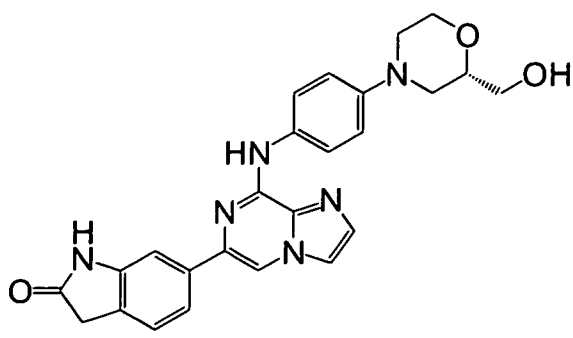
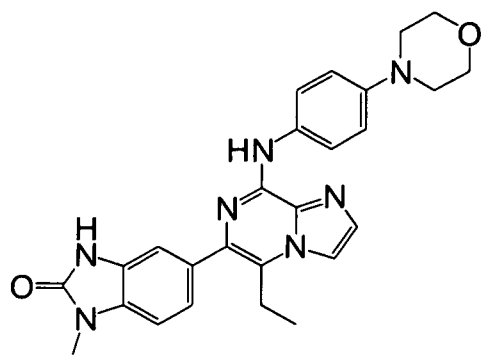
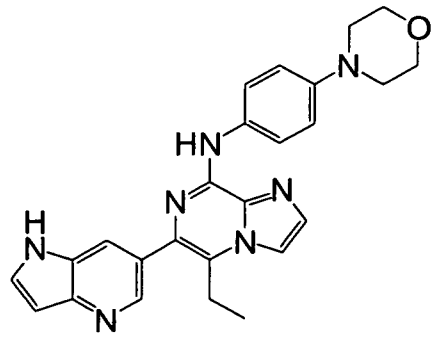
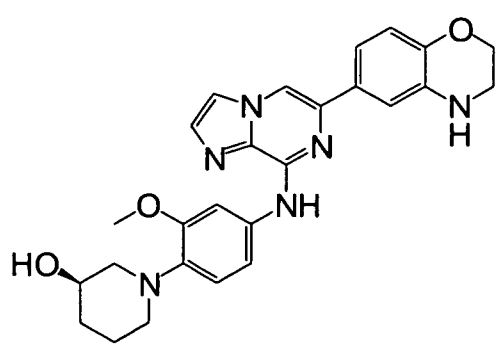
	1-[6-(1,3-苯並噻唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]-3-甲基脲	324.2
	1-[6-(1,3-苯並噻唑-5-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]-3-乙基脲	338.3
	1-{2-乙氧基-4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基)胺基]苯基}-3-甲基四氫吡啶-3-醇	456.4
	1-{2-甲氧基-4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基)胺基]苯基}-3-甲基四氫吡啶-3-醇	442.4

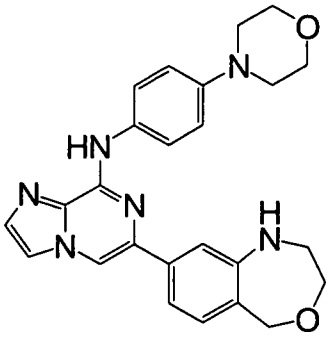
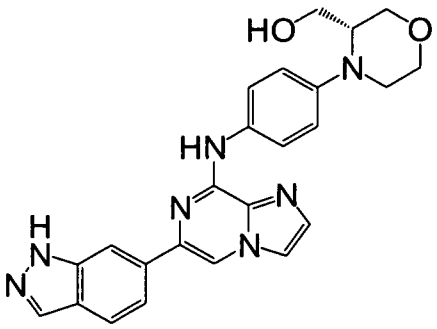
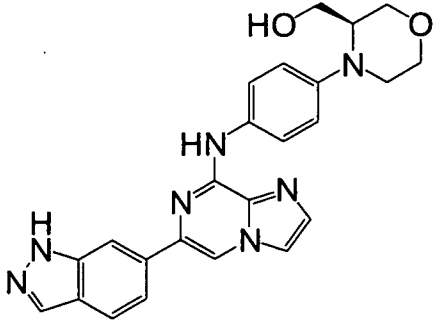
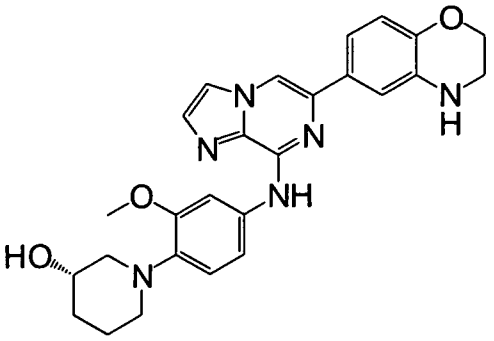
	6-(1H-吲哚-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	441.5
	6-(1H-吲哚-6-基)-N-[4-(四氫吡喃-4-基氧)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	427
	6-(8-({3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁嗪-3-酮	473.2
	6-(1H-吲哚-6-基)-N-[3-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	412.5

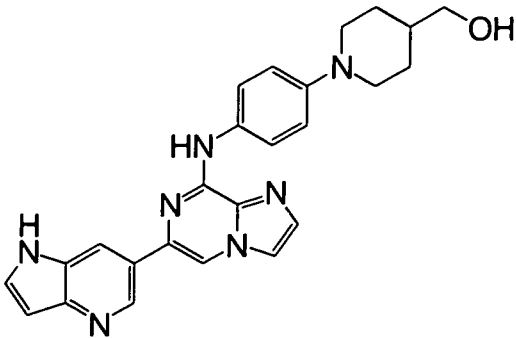
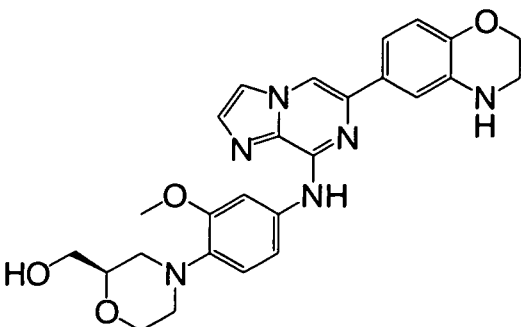
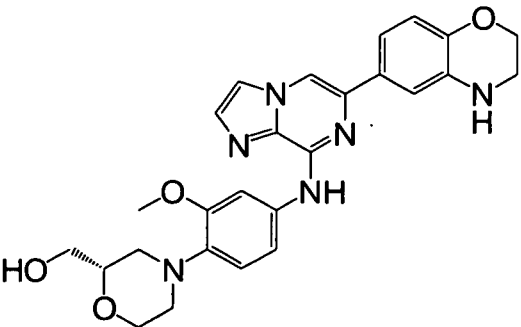
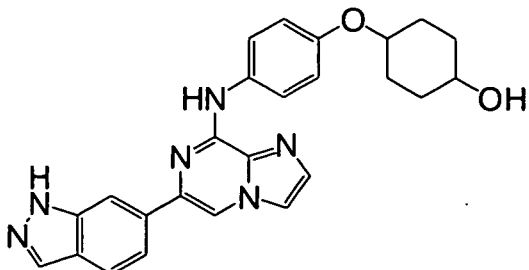
	2-(4-{{6-(1H-咪唑-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基}胺基}苯氧基)-N,N-二甲基乙醯胺	428.3
	3-甲基-1-{4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基)胺基}苯基}四氫吡啶-3-醇	412.3
	1-甲基-5-(5-甲基-8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮	456.5
	1-乙基-5-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮	456.5

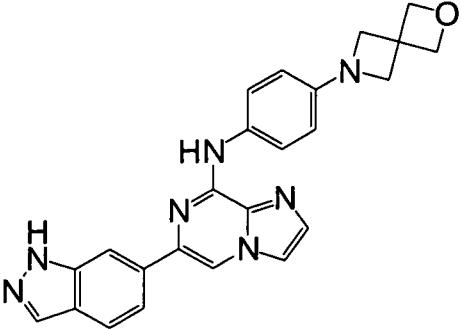
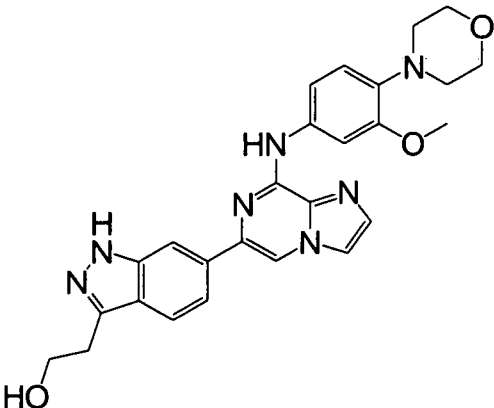
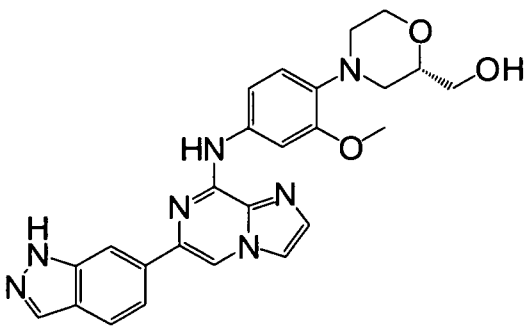
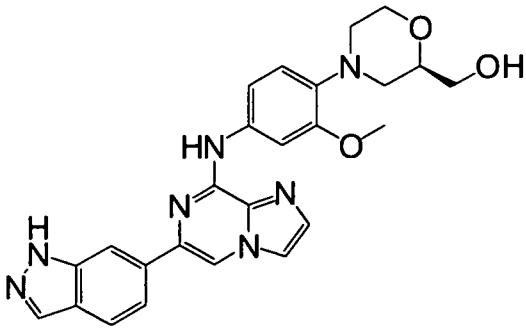
	6-(3,4- 二 氫 -2H-1,4- 苯 並 嘓 咩-6- 基)-5- 乙 基-N-[4-(嗎 啉-4- 基) 苯 基] 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩-8- 胺	457.6
	6-(5- 乙 基-8- {[4-(嗎 啉-4- 基) 苯 基] 胺 基 } 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩-6- 基)-2,3- 二 氫 -1H- 吲 哚 - 2- 酮	455.1
	(3S)-1-{4-[(6-{1H- 吡 咯 並 [3,2-b] 吡 啶 -6- 基 } 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩-8- 基) 胺 基] 苯 基} 哌 啶-3- 醇	426.2
	(3S)-1-{2- 甲 氧 基-4-[(6-{1H- 吡 咯 並 [3,2-b] 吡 啶 -6- 基 } 咪 唑 並 [1,2-a] 吡 咩-8- 基) 胺 基] 苯 基} 哌 啶-3- 醇	456.2

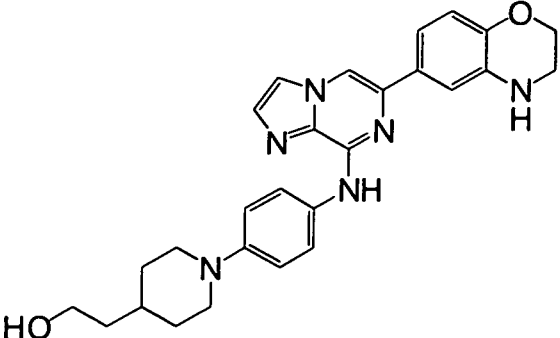
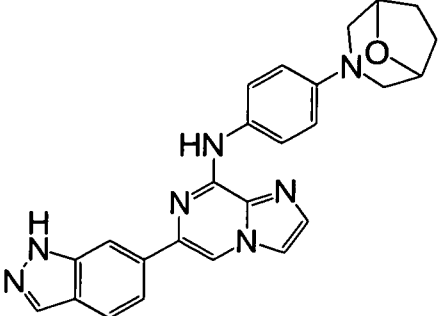
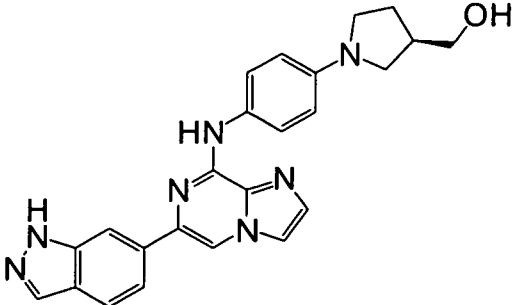
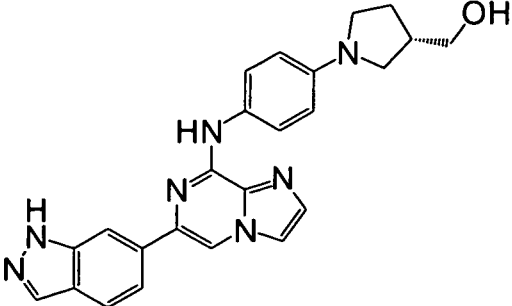
	2-(1-{4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基)胺基]苯基}哌啶-4-基)乙-1-醇	454.2
	2-[6-(5-甲基-8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-呋唑-3-基]乙-1-醇	470.6
	1-[4-((6-[3-(2-羟基乙基)-1H-呋唑-6-基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基)胺基)苯基]-3-甲基四氫吡啶-3-醇	456.4
	6-[8-((4-[(2R)-2-(羟基甲基)嗎啉-4-基]苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-2,3-二氫-1H-呋啶-2-酮	457.5

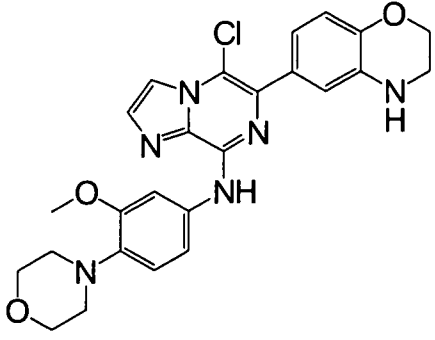
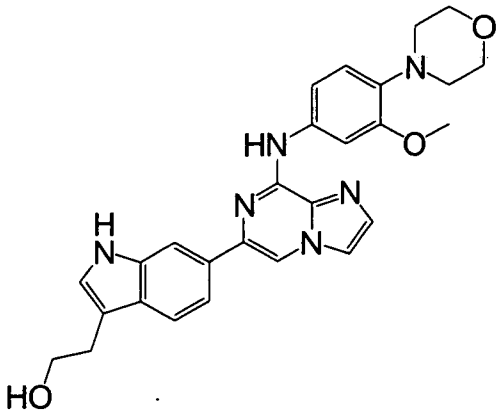
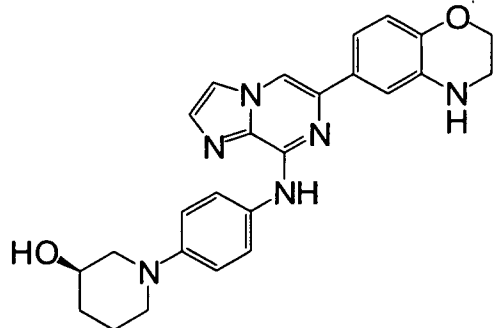
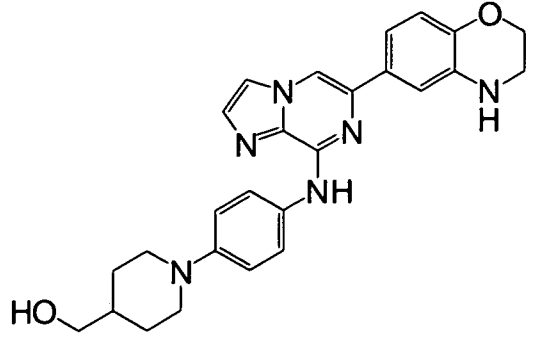
	6-[8-({4-[(2S)-2-(羟基甲基)吗啉-4-基]苯基}胺基)咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基]-2,3-二氢-1H-吲哚-2-酮	457.6
	5-(5-乙基-8-{[4-(咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-1-甲基-2,3-二氢-1H-1,3-苯並二唑-2-酮]胺基}苯基)吗啉	470.7
	5-乙基-N-[4-(咪唑并[1,2-a]吡啶-6-基)-8-胺]吗啉	440.4
	(3R)-1-(4-{[6-(3,4-二氢-2H-1,4-苯並𫓇吡啶-6-基)咪唑并[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)哌啶-3-醇	473.3

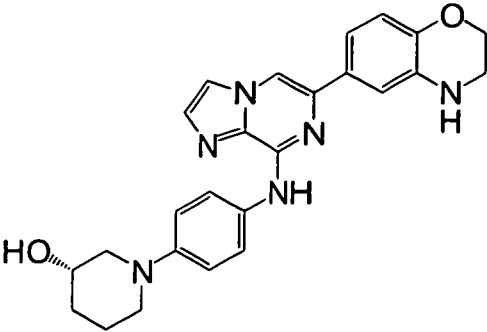
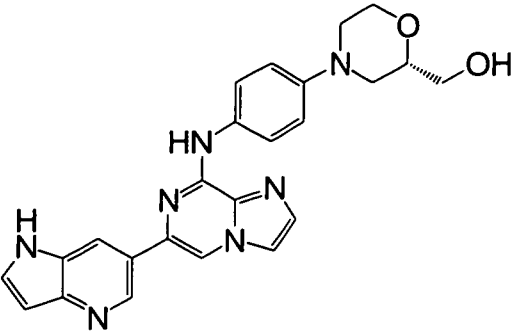
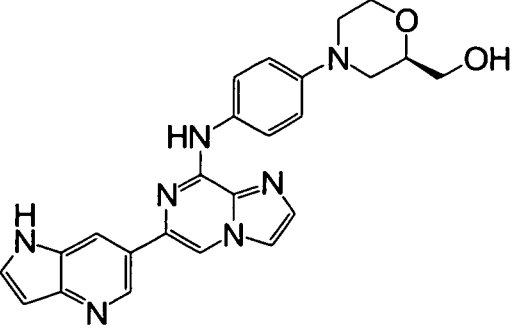
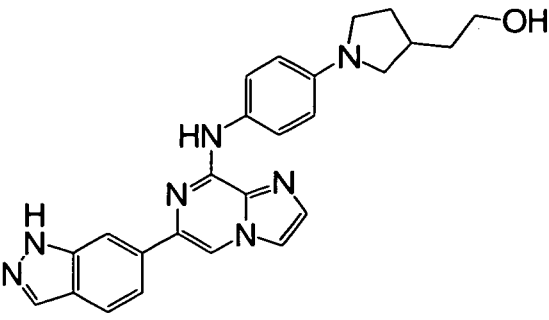
	N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]-6- (1,2,3,5-四氫-4,1-苯並噁氮 呈-8-基)咪唑並[1,2-a]吡啶- 8-胺	443.4
	[(3R)-4-(4-{[6-(1H-吲哚-6- 基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基] 胺基}苯基)嗎啉-3-基]甲醇	442.3
	[(3S)-4-(4-{[6-(1H-吲哚-6-基))咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺 基}苯基)嗎啉-3-基]甲醇	442.2
	(3S)-1-(4-{[6-(3,4-二氫-2H- 1,4-苯並噁吡啶-6-基)咪唑並 [1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-甲 氧基苯基)哌啶-3-醇	473.2

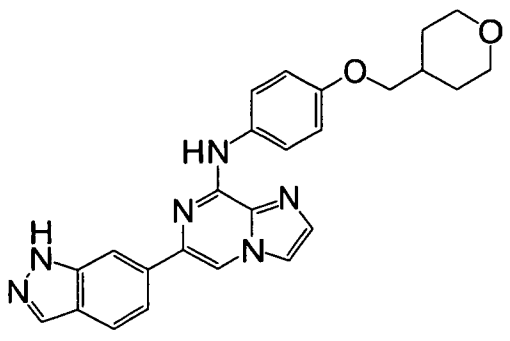
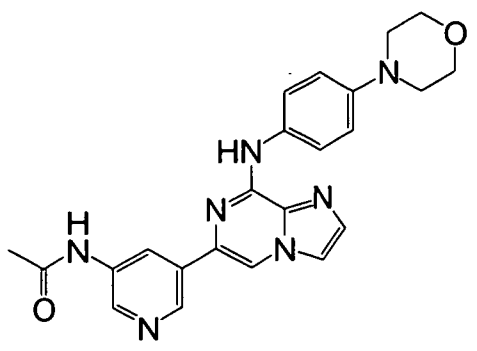
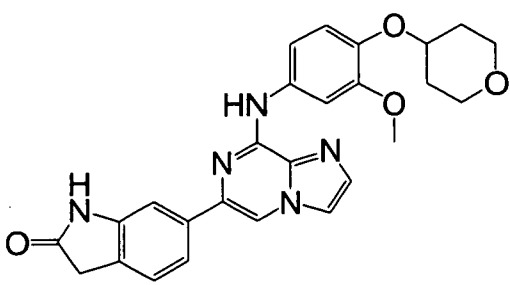
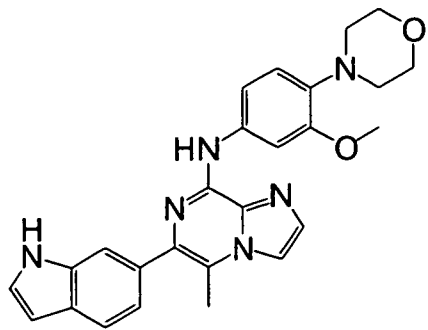
	(1-{4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基)胺基]苯基}哌啶-4-基)甲醇	440.3
	[(2R)-4-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)嗎啉-2-基)甲醇	489.4
	[(2S)-4-(4-{[6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}-2-甲氧基苯基)嗎啉-2-基)甲醇	489.4
	4-(4-{[6-(1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯氧基)環己-1-醇	441.5

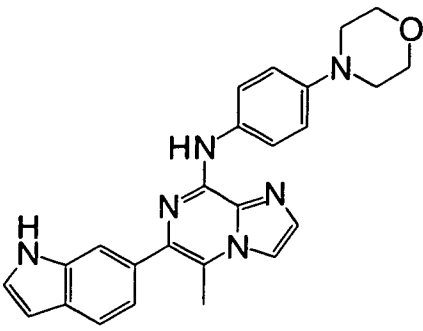
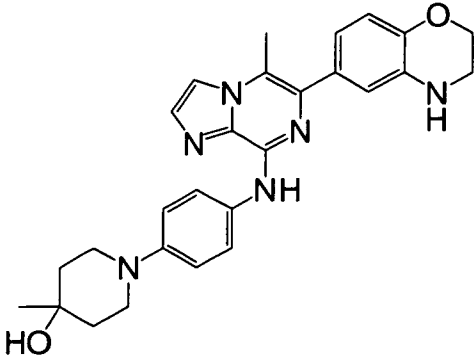
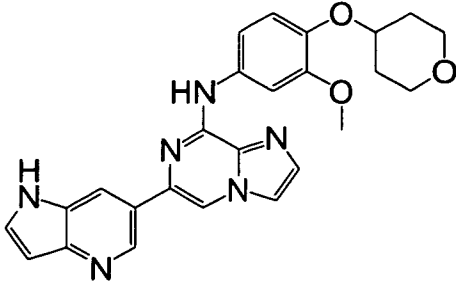
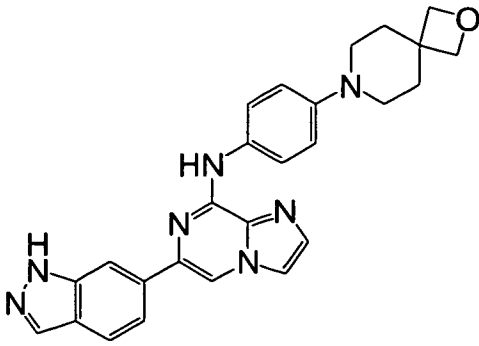
	6-(1H-tryptophan-6-yl)-N-(4-{2-氧 杂-6-氮杂螺[3.3]庚-6-基}苯 基)咪唑并[1,2-a]吡啶-8-胺	424.2
	2-[6-(8-{[3-甲氧基-4-(吗啉- 4-基)苯基]胺基}咪唑并[1,2- a]吡啶-6-基)-1H-tryptophan-3-基] 乙-1-醇	486.6
	[(2S)-4-(4-{[6-(1H-tryptophan-6-基) 咪唑并[1,2-a]吡啶-8-基]胺 基}-2-甲氧基苯基)吗啉-2- 基]甲醇	472.4
	[(2R)-4-(4-{[6-(1H-tryptophan-6-基) 咪唑并[1,2-a]吡啶-8-基] 胺基}-2-甲氧基苯基)吗啉- 2-基]甲醇	472.4

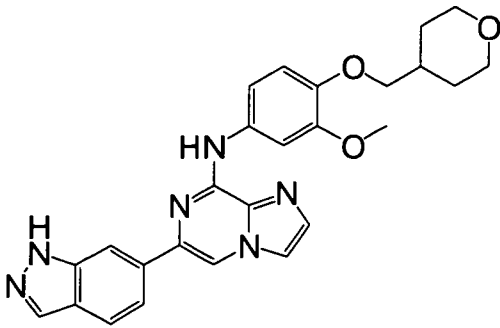
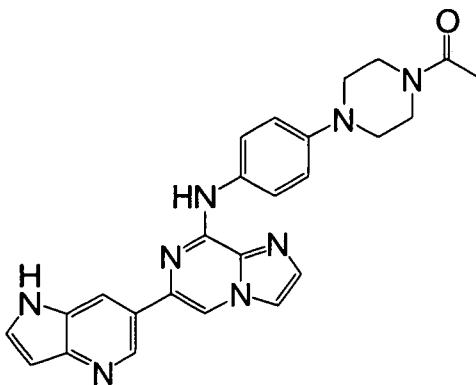
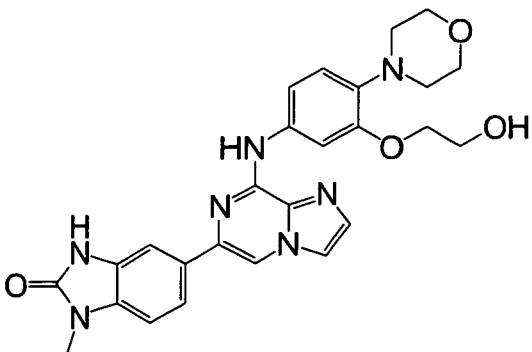
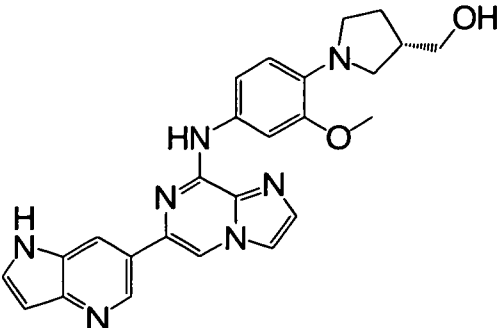
	2-[1-(4-{[6-(3,4- 二 氫 -2H-1,4- 苯並嘔啉-6- 基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)哌啶-4-基]乙-1-醇	471.8
	6-(1H-嘔啉-6-基)-N-(4-{8-氧雜-3-氮雜雙環[3.2.1]辛-3-基}苯基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-胺	438.3
	[(3R)-1-(4-{[6-(1H- 嘔 啉 -6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)吡咯啉-3-基]甲醇	426.2
	[(3S)-1-(4-{[6-(1H-嘔啉-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基]胺基}苯基)吡咯啉-3-基]甲醇	426.2

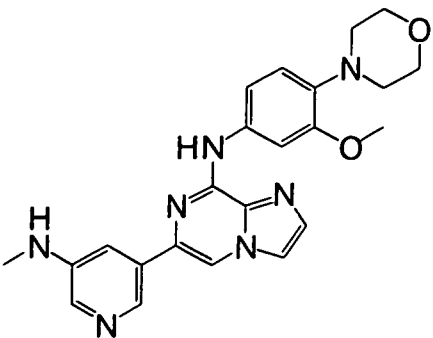
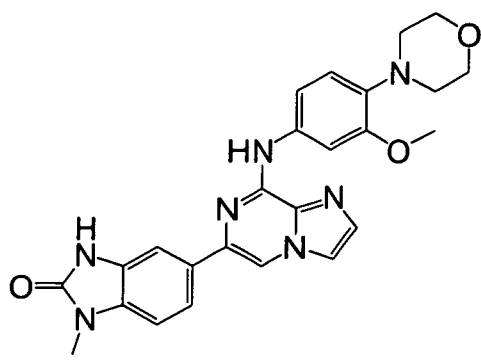
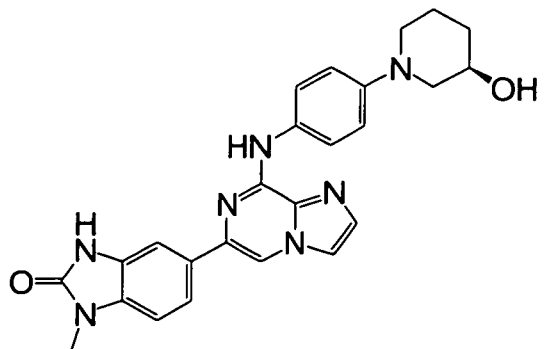
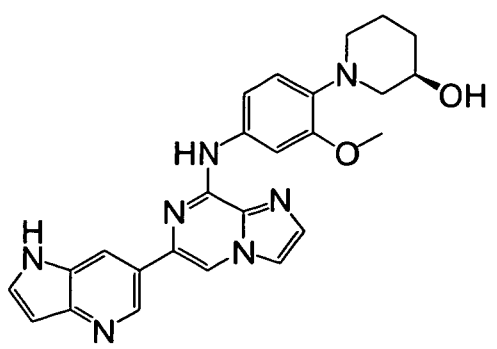
	5-氯-6-(3,4-二氢-2H-1,4-苯並噁吡啶-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	493.5
	2-[6-(8-{[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1H-吲哚-3-基]乙-1-醇	485.6
	(3R)-1-(4-{[6-(3,4-二氢-2H-1,4-苯並噁吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)哌啶-3-醇	443.8
	[1-(4-{[6-(3,4-二氢-2H-1,4-苯並噁吡啶-6-基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基]胺基}苯基)哌啶-4-基]甲醇	457.5

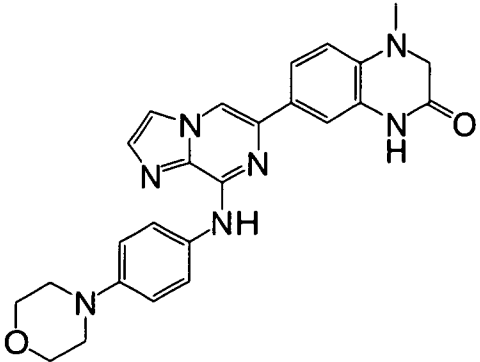
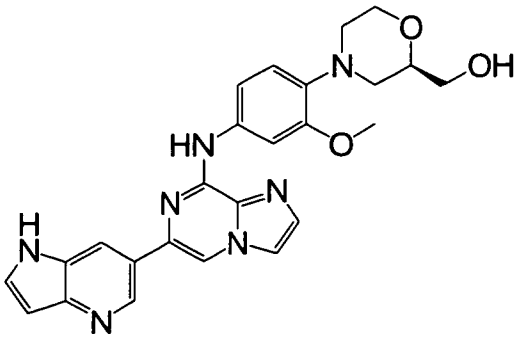
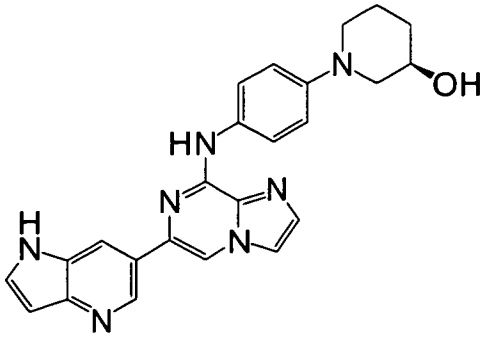
	(3S)-1-(4-{[6-(3,4- 二氢 -2H-1,4- 苯並 噁 吡 -6- 基)咪唑並 [1,2-a]吡 啉 -8-基]胺基} 苯基) 哌 啶 -3-醇	443.3
	[(2S)-4-{4-[(6-{1H- 吡 咯 並 [3,2-b] 吡 啶 -6- 基 } 咪 唑 並 [1,2-a]吡 啉 -8-基)胺基} 苯基) 嗎 啉 -2-基]甲 醇	442.7
	[(2R)-4-{4-[(6-{1H- 吡 咯 並 [3,2-b] 吡 啶 -6- 基 } 咪 唑 並 [1,2-a]吡 啉 -8-基)胺基} 苯基) 嗎 啉 -2-基]甲 醇	442.5
	2-[1-(4-{[6-(1H- 吡 啶 並 [3,2-b] 吡 啶 -6- 基)胺基} 苯基)吡 咯 啶 -3-基]乙 -1-醇	440.3

	6-(1H-咪唑-6-基)-N-[4-(吗啉-4-基甲氧基)苯基]咪唑并[1,2-a]吡啉-8-胺	441.4
	N-[5-(8-{[4-(吗啉-4-基)苯基]胺基}咪唑并[1,2-a]吡啉-6-基)吡啶-3-基]乙酰胺	430.4
	6-(8-{[3-甲氧基-4-(吗啉-4-基氧)苯基]胺基}咪唑并[1,2-a]吡啉-6-基)-2,3-二氢-1H-咪唑-2-酮	472.4
	6-(1H-咪唑-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(吗啉-4-基)苯基]-5-甲基咪唑并[1,2-a]吡啉-8-胺	455.2

	6-(1H-吡啶-6-基)-5-甲基-N-[4-(嗎啉-4-基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	425.2
	1-(4-{{6-(3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘧啶-6-基)-5-甲基咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基}胺基}苯基)-4-甲基哌啶-4-醇	471.8
	N-[3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基氧)苯基]-6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	457.4
	6-(1H-吡啶-6-基)-N-(4-{2-氧雜-7-氮雜螺[3.5]壬-7-基}苯基)咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	452.2

	6-(1H-咪唑-6-基)-N-[3-甲氧基-4-(四氢-4-基甲氧基)苯基]咪唑並[1,2-a]吡啶-8-胺	471.8
	1-(4-{4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基)胺基]苯基}哌啶-1-基)乙-1-酮	453.1
	5-(8-{[3-(2-羥基乙氧基)-4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1-甲基-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮	502.2
	[(3S)-1-{2-甲氧基-4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基)胺基]苯基}吡咯啉-3-基]甲醇	456.5

	5-(8-({3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-N-甲基吡啶-3-胺	432.5
	5-(8-({3-甲氧基-4-(嗎啉-4-基)苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基)-1-甲基-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮	472.3
	5-[8-({4-[(3R)-3-羥基哌啶-1-基]苯基}胺基)咪唑並[1,2-a]吡啉-6-基]-1-甲基-2,3-二氫-1H-1,3-苯並二唑-2-酮	456.2
	(3R)-1-{2-甲氧基-4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啉-8-基)胺基]苯基}哌啶-3-醇	456.4

	4-甲基-7-(8-{[4-(嗎啉-4-基)苯基]胺基}咪唑並[1,2-a]吡啶-6-基)-1,2,3,4-四氫喹啉-2-酮	456.5
	[(2R)-4-{2-甲氧基-4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基)胺基]苯基}嗎啉-2-基]甲醇	472.5
	(3R)-1-{4-[(6-{1H-吡咯並[3,2-b]吡啶-6-基}咪唑並[1,2-a]吡啶-8-基)胺基]苯基}哌啶-3-醇	426

實施例 3

生化 Syk 測定

可用於測試本申請案所揭露之化合物的一種標準生化 Syk 激酶測定之一般方法係如下所述。

製備不含有 Syk 酶之主混合物，其含有 1X 細胞傳訊激酶緩衝劑 (25 mM Tris-HCl, pH 7.5, 5 mM β-甘油磷

酸鹽，2 mM 二硫蘇糖醇，0.1 mM Na_3VO_4 ，10 mM MgCl_2)、0.5 μM Promega PTK 生物素化肽受質 1、0.01% 酪蛋白、0.01% Triton-X100 及 0.25% 甘油。製備含有 Syk 酶之主混合物，其含有 1X 細胞傳訊激酶緩衝劑、0.5 μM Promega PTK 生物素化肽受質 1、0.01% 酪蛋白、0.01% Triton-X100、0.25% 甘油及 0.4 ng/孔槽 Syk 酶。Syk 酶係購自 Cell Signaling Technologies 並係由桿狀病毒表現且係 N 終端 GST 標記之全長人野生型 Syk (取得編號 NM-00377)。該 Syk 蛋白質係經使用谷胱甘肽-瓊脂糖之一步驟純化。藉由 SDS-PAGE 和考馬斯 (Coomassie) 染色以評估最終蛋白質製劑之純度。製備 ATP 水溶液 (200 μM) 並經 1N NaOH 調整至 pH 7.4。將於 5% DMSO 中定量之化合物 (1.25 μl) 轉移至 96 孔槽 $\frac{1}{2}$ 面積之 Costar 聚苯乙烯盤內。化合物經各別測試並經由 11 點劑量-反應曲線 (起始濃度係 10 至 1 μM ; 1:2 之比例稀釋) 測試。將定量之不含有酶之主混合物 (18.75 μl ; 作為陰性對照組) 和含有酶之主混合物 (18.75 μl) 轉移至 96 孔槽 $\frac{1}{2}$ 面積之 Costar 聚苯乙烯盤的適當孔槽內。將 200 μM ATP (5 μl) 加入至該 96 孔槽 $\frac{1}{2}$ 面積之 Costar 聚苯乙烯盤內的混合物中以達最終 ATP 濃度為 40 μM 。室溫下培育該反應物 1 小時。利用 Perkin Elmer 1X 偵測緩衝劑 (其含有 30 mM EDTA, 80 nM SA-APC 及 4 nM PT66 Ab) 中止反應。藉由 Perkin Elmer Envision 儀 (其中激發濾器 330 nm, 發射濾器 665 nm 且第 2 個發射濾器 615 nm) 且使用經時間

解析之螢光讀取該盤。隨後利用線性回歸互除法計算 IC_{50} 值。

實施例 4

Ramos 細胞 pBLNK (Y96) 測定

可用於測試本申請案所揭露之化合物的一種標準細胞 Syk 激酶測定之另一個一般方法係如下所述。

於直立型 T175 Falcon TC 燒瓶中，令 Ramos 細胞 (2×10^6 細胞/ml) 於不含有血清之 RPMI 培養基中經血清饑餓達 1 小時。令細胞經離心 ($1100 \text{ rpm} \times 5$ 分鐘) 並於 37°C 和於測試化合物或 DMSO 對照之存在下以細胞密度 0.5×10^7 細胞/ml 經培育 1 小時。隨後藉由於 37°C 下與 $10 \mu\text{g/ml}$ 抗人 IgM $F(ab)_2$ 培育 5 分鐘以刺激細胞。令細胞沉降，經於 40 ul 細胞溶胞緩衝劑中溶胞且與 Invitrogen SDS-PAGE 負載緩衝劑混合。令每個樣品之細胞溶胞物 (20 ul) 經 SDS-PAGE 和蛋白質印跡 (其使用抗-磷 BLNK (Tyr96) 抗體 (Cell Signaling Technology #3601) 以評估 Syk 活性和使用抗 Syk 抗體 (BD Transduction Labs #611116) 以控制每個溶胞物中之全部蛋白質負荷)。利用螢光二次偵測系統和 LiCor Odyssey 軟體偵測影像。

實施例 5

B 細胞增殖測定

可用於測試本申請案所揭露之化合物的一種標準細胞

B 細胞增殖測定之一般方法係如下所述。

利用 B 細胞分離套組 (Miltenyi Biotech, Cat # 130-090-862) 自 8 至 16 週大之 Balb/c 小鼠的脾臟純化 B 細胞。測試化合物經 0.25% DMSO 稀釋並於加入 10 $\mu\text{g/ml}$ 抗 - 小鼠 IgM 抗體 (Southern Biotechnology Associates Cat # 1022-01; 最終體積 100 μl) 之前與 2.5×10^5 個經純化之小鼠脾臟 B 細胞培育 30 分鐘。經 24 小時培育後，加入 1 μCi ^3H -胸苷並在利用製造商對 SPA[^3H]胸苷攝取測定系統 (Amersham Biosciences # RPNQ 0130) 的方法收取之前再培育 36 小時。利用微 β 計數器 (Wallace Triplex 1450, Perkin Elmer) 計算以 SPA-珠為基礎之螢光。

實施例 6

T 細胞增殖測定

可用於測試本申請案所揭露之化合物的一種標準 T 細胞增殖測定之一般方法係如下所述。

利用 Pan T 細胞分離套組 (Miltenyi Biotech, Cat # 130-090-861) 自 8 至 16 週大之 Balb/c 小鼠的脾臟純化 T 細胞。測試化合物經 0.25% DMSO 稀釋並於透明平底部盤中且於最終體積 100 μl 中與 2.5×10^5 個經純化之小鼠脾臟 T 細胞培育，該透明平底部盤業已於 37°C 下經 10 $\mu\text{g/ml}$ 抗 - CD3 抗體 (BD # 553057) 和 10 $\mu\text{g/ml}$ 抗 - CD28 抗體 (BD # 553294) 預先塗覆 90 分鐘。經 24 小時培育後，加入 1 μCi ^3H -胸苷並在利用製造商對 SPA[^3H]胸苷攝

取測定系統（Amersham Biosciences # RPNQ 0130）的方法收取之前再培育盤 36 小時。利用微 β 計數器（Wallace Triplex 1450, Perkin Elmer）計算以 SPA-珠為基礎之螢光。

實施例 7

CD69 抑制作用測定

可用於測試本申請案所揭露之化合物的一種標準 B 細胞活性抑制作用測定之一般方法係如下所述。

藉由紅血液細胞溶胞作用（BD Pharmingen #555899），自 8 至 16 週大之 Balb/c 小鼠的脾臟純化全部小鼠脾臟細胞。令測試化合物稀釋於 0.5% DMSO 中並於 37°C 下且於透明平底盤（Falcon 353072）內最終體積 200 μ l 中令經稀釋之測試化合物與 1.25×10^6 個脾臟細胞培育 60 分鐘。隨後藉由加入 15 μ g/ml IgM（Jackson Immuno Research 115-006-020）以刺激細胞並於 37°C 和 5% CO₂ 下培育該細胞 16 小時。於該 16 小時培育後，將細胞轉移至透明圓錐形底部之 96 孔槽盤內並藉由離心（1200 $\times$ g）5 分鐘以進行沉降。利用 CD16/CD32（BD Pharmingen #553142）對細胞進行預先阻斷，隨後利用 CD19-FITC（BD Pharmingen #553785）、CD69-PE（BD Pharmingen #553237）及 7AAD（BD Pharmingen #51-68981E）進行三重染色。在 BD FACSCalibur 上揀選細胞並令該細胞限制於 CD19⁺/7AAD⁻種群上。對測試化合物之濃度，測量在該

受限種群之 CD69 表面表現量。

實施例 8

BMMC 去顆粒化作用

可用於測試本申請案所揭露之化合物的一種標準骨髓衍生之小鼠肥大細胞 (BMMC) 去顆粒化作用測定之一般方法係如下所述。

使用 IL-3 (10 ng/ml) 和 SCF (10 ng/ml) 培養骨髓衍生之肥大細胞超過 4 週。在使用時藉由 FACS 分析測定該等細胞係大於 90% cKit⁺/FceRI⁺。於 T150 組織培養燒瓶中，含有 IgE α -DNP (1 ug/ml) 但不存在 IL-3 和 SCF 之條件下，令細胞 (6×10^7 細胞/50 ml) 經血清饑餓達 16 小時。令隔夜致敏之細胞於 Tyrode 氏緩衝劑中經沖洗 2 次並再懸浮為 5×10^6 細胞/ml。將 5×10^5 個細胞 (100ul) 塗覆於 96 孔槽微量量盤 (Falcon 353072) 上且測試化合物經系列稀釋至最終濃度 0.25% DMSO，該盤於 37°C 和 5% CO₂ 下經培育 1 小時。孔槽經 DNP-BSA 抗原攻擊 (50 ng/ml) 處理並於 37°C 下再經培育 30 分鐘。相對於對照組孔槽，測定上清液之胺基己糖苷酶釋出。同時使細胞沉降物溶胞並測定胺基己糖苷酶釋出總量以計算特異性釋出。利用 4 參數計算適值產生劑量反應曲線並計算 IC₅₀ 值。

實施例 9

被動皮膚過敏反應 (PCA)

下述係標準 PCA 模式之方法，該標準 PCA 模式係用於測量活體內 IgE 抗 DNP Ab 致敏化作用及供啟動肥大細胞去顆粒化作用和釋出免疫調節子之 DNP-BSA 抗原，該等免疫調節子引起急性血管可滲透性，該急性血管可滲透性係由小鼠耳內發炎區域內之 Evan 氏藍色染料監測。

試劑：抗 DNP IgE 係呈添加有額外蛋白質 BSA 和供滅菌之疊氮化物的磷酸鹽緩衝液 (1.2 mg/ml)。該溶液於無菌 PBS 中經 1:100 之比例稀釋為 12 ug/ml 之作業儲存液，該作業儲存液可於 PBS 中經進一步稀釋至可供注射之適當濃度。進一步經 1:5 比例之稀釋產生最終 1:500 比例之溶液 (2.4 ng/ul; 10 ul/耳 = 24 ng)。無菌 PBS 單獨將作為陰性對照組。-DNP-BSA 將於無菌二次蒸餾水中被製成為 4 mg/ml 且以溶液儲存於 40°C 下。該溶液於使用前進一步經無菌鹽水以 1:1 之比例稀釋。該溶液或進一步之鹽水稀釋液係經 2% Evan 氏藍色染料之無菌鹽水以 1:1 之比例稀釋，該 Evan 氏藍色染料之無菌鹽水業已經通過 0.02 um 濾器過濾且於注射前再次過濾。對此等實驗，可使用最終濃度為 0.5 mg/ml DNP-BSA 之 1% Evan 氏藍色染料液。維持一定之尾靜脈注射液 (200 ul = 100 ug 之 1% Evan 氏藍色染料液)。-Evan 氏藍色染料：2% 鹽水儲存液將經無菌過濾並經 DNP-BSA 鹽水溶液以 1:1 之比例稀釋為注射用之 1% 最終濃度。

使用皮膚內耳致敏反應之一般 PCA 方法

1) 在第 0 天，利用 29-規胰島素注射器對皮膚內注射 IgE 抗 DNP 使經異氟烷麻醉之動物被動性致敏化。慣常地，右耳接受 10 ul 抗 DNP IgE 之皮膚內注射液，而左耳接受 PBS。2) 致敏化反應後 20 小時，藉由尾靜脈注射 200 ul DNP-BSA 之 1% Evan 氏藍色染料鹽水液以進行抗原攻擊。為增進成功機率，於靜脈內注射前將尾浸沒於溫水中。3) 該抗原攻擊前 30 分鐘至 2 小時，利用 10% EtOH/20% 克美弗 (cremaphor) 載體 / 70% 鹽水經皮下或口服給予藥物。4) 在該抗原攻擊後，藉由使動物吸入 CO₂ 達 30 至 60 分鐘以殺死該等動物，並取下耳以於 65°C 下供 Evan 氏藍色染料之甲醯胺 (500 ul) 液進行隔夜萃取。5) 恰在最後頸脫位之前藉由心臟穿刺得到血液且該血液經處理以得到供 PK 分析之血漿。6) Evan 氏藍色染料係藉由於 620 nm 下讀取微滴量盤內經萃取之溶液 (200 ul) 的吸光度而定量。

實驗之研究設計

每隻動物具有一個抗 DNP IgE 敏化耳 (慣常為右耳) 及一個 PBS 對照組耳 (慣常為左耳)。組 1 至 8：代表媒介物和化合物測試臂；組 9：代表非抗原陰性對照組；組 10：代表非敏化攻擊陰性對照組；組 11：代表非抗原攻擊、非敏化陰性對照組 (組 9 至 11 代表僅為背景值之陰性對照組且每組僅需最少數目之動物)。

本發明所描述之 Syk 生化測定（實施例 3）測試上述實施例所揭露之化合物且某些該等化合物顯現低於或等於 1 微莫耳之 IC_{50} 值。某些該等化合物顯現低於或等於 100 nM 之 IC_{50} 值。某些該等化合物顯現低於或等於 10 nM 之 IC_{50} 值。某些該等化合物顯現低於或等於 1 nM 之 IC_{50} 值。

該 B 細胞增殖測定（如實施例 5 所描述者）測試實施例 2 所揭露之某些化合物且該等化合物顯現低於或等於 10 微莫耳之 IC_{50} 值。某些該等化合物顯現低於或等於 1 微莫耳之 IC_{50} 值。

當藉由於本發明所描述之條件下進行測定時（如實施例 6 所描述者），某些該等化合物並未抑制 T 細胞增殖且顯現大於或等於 5 微莫耳之 IC_{50} 值。

本發明所描述之某些化合物對抑制 T 細胞增殖所顯現之 IC_{50} 值係至少 3 倍且某些情況下為 5 倍大於此等化合物抑制 B 細胞增殖所顯現之 IC_{50} 值。

於抑制 B 細胞活性之測定中（於如實施例 7 所描述之條件下），測試本發明所描述之某些化合物且該等化合物顯現低於或等於 10 微莫耳之 IC_{50} 值。某些該等化合物顯現低於或等於 1 微莫耳之 IC_{50} 值。

本發明所揭露之某些化合物顯現生化和以細胞為基礎之活性。例如，本發明所描述之某些化合物於本發明所描述之 Syk 生化測定（實施例 3）中顯現低於或等於 10 微莫耳之 IC_{50} 值且於本發明（實施例 4、5、7 或 8）所描述

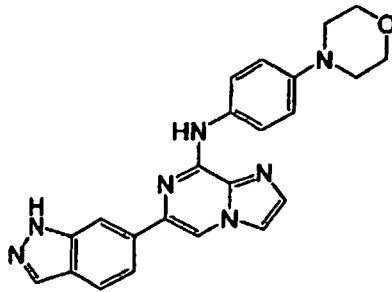
之至少一種以細胞為基礎之測定（非為 T 細胞測定）中顯現低於或等於 10 微莫耳之 IC_{50} 值。於本發明所描述之 Syk 生化測定（實施例 4）中，某些該等化合物顯現低於或等於 1 微莫耳之 IC_{50} 值，且於本發明（實施例 4、5、7 或 8）所描述之至少一種以細胞為基礎之測定（非為 T 細胞測定）中，某些該等化合物顯現低於或等於 10 微莫耳之 IC_{50} 值。於本發明（實施例 4、5、7 或 8）所描述之至少一種以細胞為基礎之測定（非為 T 細胞測定）中，某些該等化合物顯現低於或等於 0.1 微莫耳之 IC_{50} 值及低於或等於 10 微莫耳之 IC_{50} 值。

雖然已顯示並描述某些較佳體系，但是在未偏離本發明之精神和範圍下，對該等較佳體系可作各種不同之修改和替代。例如，對申請專利範圍之建構目的，不欲的是下述之申請專利範圍以任何方式被解釋為較其文字語句為窄，且因此不欲的是說明書所例示之較佳體系被解讀為申請專利範圍。於是，當能瞭解的是本發明已藉由說明加以描述且本發明並非限於申請專利範圍所揭露之範圍。

七、申請專利範圍：

公告本

1. 一種具有以下結構之化合物，



或其藥學上可接受之鹽。

2. 如請求項 1 之化合物，係用於治療罹患對抑制 Syk 活性有反應之疾病的人類。

3. 如請求項 2 之化合物，其中該化合物或其藥學上可接受之鹽係以靜脈內、肌內、非經腸或口服之方式給予。

4. 如請求項 2 之化合物，其中該對抑制 Syk 活性有反應之疾病係癌。

5. 如請求項 2 之化合物，其中該對抑制 Syk 活性有反應之疾病係 B 細胞淋巴瘤或白血病。

6. 如請求項 2 之化合物，其中該對抑制 Syk 活性有反應之疾病係類風濕性關節炎、過敏性鼻炎、慢性阻塞性肺疾病（COPD）、成人呼吸窘迫徵候群（ARDS）、過敏引起之發炎疾病、多發性硬化症、自體免疫疾病、發炎疾病、急性發炎反應、過敏性疾病、多囊性腎疾、B 細胞淋巴瘤、Hodgkin 氏淋巴瘤、非 Hodgkin 氏淋巴瘤、毛樣細胞白血病、多發性骨髓瘤、慢性骨髓性白血病、急性骨髓性白血病、慢性淋巴細胞白血病、或急性淋巴細胞白血

病。

7. 如請求項 2 之化合物，其中該對抑制 Syk 活性有反應之疾病係慢性淋巴細胞白血病。

8. 如請求項 2 之化合物，其中該對抑制 Syk 活性有反應之疾病係急性淋巴細胞白血病。

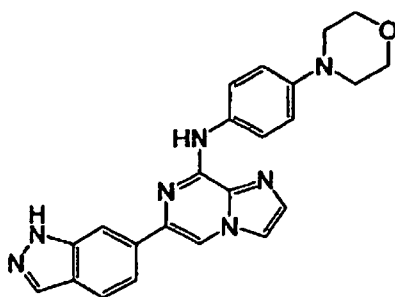
9. 如請求項 2 之化合物，其中該對抑制 Syk 活性有反應之疾病係急性骨髓性白血病。

10. 如請求項 1 之化合物，係用於對有需要之人類抑制 B 細胞活性。

11. 如請求項 1 之化合物，係用於對有需要之人類抑制 ATP 水解。

12. 一種醫藥組成物，其包含如請求項 1 之化合物或其藥學上可接受之鹽及至少一種藥學上可接受之媒介物（vehicle），該媒介物係選自由載體（carriers）、佐劑（adjuvants）及賦形劑（excipients）所組成之群組。

13. 一種具有以下結構之化合物或其藥學上可接受之鹽的用途，



係用於製造用來治療罹患對抑制 Syk 活性有反應之疾病的人類之醫藥。

14. 如請求項 13 之用途，其中該醫藥係以靜脈內、

肌內、非經腸或口服之方式給予。

15. 如請求項 13 或 14 之用途，其中該對抑制 Syk 活性有反應之疾病係癌。

16. 如請求項 13 或 14 之用途，其中該對抑制 Syk 活性有反應之疾病係 B 細胞淋巴瘤或白血病。

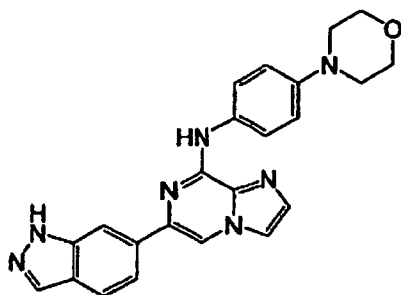
17. 如請求項 13 或 14 之用途，其中該對抑制 Syk 活性有反應之疾病係類風濕性關節炎、過敏性鼻炎、慢性阻塞性肺疾病（COPD）、成人呼吸窘迫徵候群（ARDS）、過敏引起之發炎疾病、多發性硬化症、自體免疫疾病、發炎疾病、急性發炎反應、過敏性疾病、多囊性腎疾、B 細胞淋巴瘤、Hodgkin 氏淋巴瘤、非 Hodgkin 氏淋巴瘤、毛樣細胞白血病、多發性骨髓瘤、慢性骨髓性白血病、急性骨髓性白血病、慢性淋巴細胞白血病、或急性淋巴細胞白血病。

18. 如請求項 13 或 14 之用途，其中該對抑制 Syk 活性有反應之疾病係慢性淋巴細胞白血病。

19. 如請求項 13 或 14 之用途，其中該對抑制 Syk 活性有反應之疾病係急性淋巴細胞白血病。

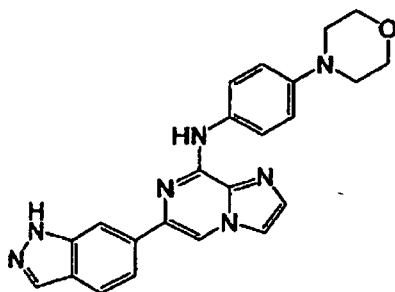
20. 如請求項 13 或 14 之用途，其中該對抑制 Syk 活性有反應之疾病係急性骨髓性白血病。

21. 一種測定樣品中是否存在 Syk 之活體外方法，該方法包含令該樣品於允許偵測 Syk 活性之條件下與具有以下結構之化合物



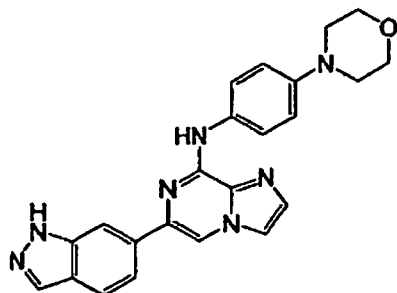
或其藥學上可接受之鹽接觸，偵測該樣品中 Syk 活性程度及依此決定該樣品中存在或不存在 Syk。

22. 一種抑制 B 細胞活性之方法，該方法包含令表現 Syk 之細胞與具有以下結構之化合物



或其藥學上可接受之鹽接觸，該化合物或其藥學上可接受之鹽之量係足以於活體外可偵測性地降低 B 細胞活性。

23. 一種抑制 ATP 水解之方法，該方法包含令表現 Syk 之細胞與具有以下結構之化合物



或其藥學上可接受之鹽接觸，該化合物或其藥學上可接受之鹽之量係足以於活體外可偵測性地降低 ATP 水解之程度。