

發明專利說明書

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號：**97119930**

C07D 498/04 (2006.01)

※ 申請日期：**97.5.29**

※IPC 分類：~~C07D, A61K~~

一、發明名稱：(中文/英文)

γ -分泌酶調節劑

GAMMA SECRETASE MODULATORS

C07D 403/10 (2006.01)

C07D 471/04 (2006.01)

C07D 487/04 (2006.01)

A61K 31/4166 (2006.01)

A61K 31/517 (2006.01)

A61K 31/519 (2006.01)

A61P 25/28 (2006.01)

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

美商美國先靈大藥廠

SCHERING CORPORATION

代表人：(中文/英文)

艾德華 H 梅哲

MAZER, EDWARD H.

住居所或營業所地址：(中文/英文)

美國新澤西州凱利佛市格羅賓希爾路 2000 號

2000 GALLOPING HILL ROAD KENILWORTH, NEW JERSEY

07033-0530, U.S.A.

國 籍：(中文/英文)

美國 U.S.A.

三、發明人：(共 7 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 朱昭寧
ZHU, ZHAONING
2. 威廉 J 格林里
GREENLEE, WILLIAM J.
3. 黃賢海
HUANG, XIANHAI
4. 布萊恩 麥基崔克
MCKITTRICK, BRIAN
5. 約翰 克拉德
CLADER, JOHN
6. 馬克 D 麥布萊爾
MCBRIAR, MARK D.
7. 安納丹 帕拉尼
PALANI, ANANDAN

國 籍：(中文/英文)

1. 美國	U.S.A.
2. 美國	U.S.A.
3. 中華人民共和國	P.R.C.
4-7.均 美國	U.S.A.

四、聲明事項：

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

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1. 美國；2007 年 06 月 01 日；60/941,405

2. 美國；2007 年 11 月 01 日；60/984,484

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1.

2.

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於某些雜環族化合物，其可作為 γ 分泌酶調節劑(包括抑制劑、拮抗劑等)使用，含有此等化合物之醫藥組合物，及使用該化合物與組合物之治療方法，以治療各種疾病，包括中樞神經系統病症，例如神經變性疾病，譬如阿耳滋海默氏病，及關於澱粉狀蛋白質沉積之其他疾病。其係特別可用於降低澱粉狀蛋白 β (於後文稱為 $A\beta$)生產，其係有效治療因 $A\beta$ 所造成之疾病，例如阿耳滋海默氏症與Down氏徵候簇。

本申請案係主張2007年6月1日提出申請之美國臨時申請案號60/941405與2007年11月1日提出申請之美國臨時申請案號60/984484之權益。

【先前技術】

阿耳滋海默氏病為一種特徵為神經元之退化與損失，以及老人斑之形成與神經原纖維變化之疾病。目前，阿耳滋海默氏病之治療係被限制於使用以乙醯膽鹼酯酶抑制劑所代表之病徵改善劑之徵狀療法，而預防該疾病進展之基本治療則尚未發展。一種控制病理學症狀展開原因之方法必須針對建立阿耳滋海默氏病之基本治療而發展。

$A\beta$ 蛋白質，其係為澱粉狀蛋白先質蛋白質(於後文稱為APP)之新陳代謝產物，係被認為是極大地涉及神經元之退化與損失，以及癡呆症狀之展開，例如參閱Klein W L等人，美國國家科學院會刊，2003年9月2日，100(18)，第10417-22

頁，指出關於可逆記憶喪失之分子基礎。

Nitsch R M與16位其他人，抵抗 β 澱粉狀蛋白之抗體會阿耳滋海默氏病中減緩認知力衰退，Neuron, 2003年5月22日，38(4)，第547-554頁)指出A β 蛋白質之主要成份為包含40個胺基酸之A β 40，與具有兩個額外胺基酸在C-末端上之A β 42。A β 40與A β 42傾向於聚集(例如，參閱Jarrell J T等人， β 澱粉狀蛋白質之羧基末端對於澱粉狀蛋白形成之接種作用係為重要的：關於阿耳滋海默氏病之發病原理之關聯性，Biochemistry, 1993年5月11日，32(18)，第4693-4697頁)，且構成老人斑之主要成份(例如，Glenner GG等人，阿耳滋海默氏病：新穎腦血管澱粉狀蛋白質之純化與特徵鑒定之最初報告，生物化學與生物物理研究通信，1984年5月16日，120(3)，第885-90頁。亦參閱Masters C L等人，在阿耳滋海默氏病與Down氏徵候簇中之澱粉狀蛋白斑核心蛋白質，美國國家科學院會刊，1985年6月，82(12)，第4245-4249頁)。

再者，已知APP與初老素基因之突變型，其係被發現於家族性阿耳滋海默氏病中，會增加A β 40與A β 42之生產(例如，參閱Gouras G K等人，於人類腦部中之神經元內A β 42蓄積，美國病理學期刊，2000年1月，156(1)，第15-20頁。亦參閱Scheuner D等人，Nature Medicine, 1996年8月，2(8)，第864-870頁；及Forman M S等人，瑞典突變澱粉狀蛋白先質蛋白質對於神經元與非神經元細胞中之 β 澱粉狀蛋白蓄積與分泌之差別作用，生物化學期刊，1997年12月19日，272(51)，第32247-32253頁)。因此，預期會降低A β 40與A β 42生產之化合

物係作為一種關於控制阿耳滋海默氏病之發展或預防該疾病之藥劑。

當 APP 係被 β 分泌酶分裂，及接著被 γ 分泌酶夾持時，此等 A β 即被產生。在考慮此點時， γ 分泌酶與 β 分泌酶抑制劑之產生已企圖達成降低 A β 生產之目的。已知之許多此等分泌酶抑制劑為肽或擬肽，譬如 L-685,458。L-685,458，一種天門冬胺鹽基蛋白酶轉移腐壞擬似物，係為澱粉狀蛋白 β -蛋白質先質 γ -分泌酶活性之有效抑制劑 (Biochemistry, 2000 年 8 月 1 日, 39(30), 第 8698-8704 頁)。

關於本發明亦令人感興趣的是：US 2007/0117798 (Eisai, 2007 年 5 月 24 日公告)；US 2007/0117839 (Eisai, 2007 年 5 月 24 日公告)；US 2006/0004013 (Eisai, 2006 年 1 月 5 日公告)；WO 2005/110422 (Boehringer Ingelheim, 2005 年 11 月 24 日公告)；WO 2006/045554 (CellZome AG, 2006 年 5 月 4 日公告)；WO 2004/110350 (Neurogenetics, 2004 年 12 月 23 日公告)；WO 2004/071431 (Myriad Genetics, 2004 年 8 月 26 日公告)；US 2005/0042284 (Myriad Genetics, 2005 年 2 月 23 日公告) 及 WO 2006/001877 (Myriad Genetics, 2006 年 1 月 5 日公告)。

有需要新穎化合物、配方、治療藥品及療法以治療與 A β 有關聯之疾病與病症。因此，本發明之一項目的係為提供可用於治療或預防或改善此種疾病與病症之化合物。

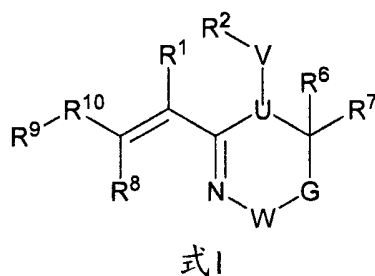
【發明內容】

在本發明之許多具體實施例中，其係提供新穎雜環族化合物種類，作為 γ 分泌酶調節劑 (包括抑制劑、拮抗劑等)，

製備此種化合物之方法，包含一或多種此類化合物之醫藥組合物，製備包含一或多種此類化合物之醫藥配方之方法，及使用此種化合物或醫藥組合物治療、預防、抑制或改善一或多種與 $A\beta$ 有關聯疾病之方法。

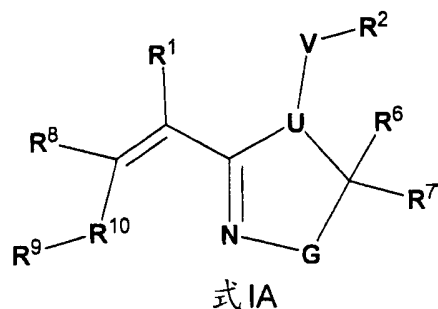
本發明化合物(式I)可作為 γ 分泌酶調節劑使用，且可用於治療與預防疾病，例如阿耳滋海默氏病、溫和認知力減弱(MCI)、Down 氏徵候簇、青光眼(Guo 等人, Proc. Natl. Acad. Sci. USA 104, 13444-13449 (2007))，大腦澱粉狀蛋白血管病、中風或癡呆症(Frangione 等人，澱粉狀蛋白：J. Protein folding Disord. 8, 補充 1, 36-42 (2001))，微神經膠質病與腦部發炎(M P Lamber, Proc. Nati. Acad. Sci. USA 95, 6448-53 (1998))，嗅覺功能喪失(Getchell 等人，老化之神經生物學, 663-673, 24, 2003)。

本發明係提供式I化合物：



其中 R^1 , R^2 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , G, U 及 W 均如下文定義。

於一項具體實施例中，本申請案係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式IA中所示之一般結構：



其中 R^1 , R^2 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , G, U 及 V 均如下文定義。

式 I 化合物可作為 γ 分泌酶調節劑使用，且可用於治療與預防疾病，例如中樞神經系統病症，譬如阿耳滋海默氏病與 Down 氏徵候簇。

本發明亦提供式 I 化合物。

本發明亦提供式 I 化合物之藥學上可接受鹽。

本發明亦提供式 I 化合物之藥學上可接受酯類。

本發明亦提供式 I 化合物之藥學上溶劑合物。

本發明亦提供呈純與單離形式之式 I 化合物。

本發明亦提供呈純形式之式 I 化合物。

本發明亦提供呈單離形式之式 I 化合物。

本發明亦提供化合物 1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1。

本發明亦提供化合物 1 至 20 (意即表 1 中之化合物)。

本發明亦提供化合物 1 至 20 及 23。

本發明亦提供化合物 21、22 及 24。

本發明亦提供醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)式 I 化合物，或其藥學上可接受之鹽、酯或溶劑合物，及藥學上可接受之載劑。

本發明亦提供醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)式I化合物，或其藥學上可接受之鹽、酯或溶劑合物，與有效量之一或多種(例如一種)其他醫藥活性成份(例如藥物)，及藥學上可接受之載劑。

本發明亦提供一種調節(包括抑制、拮抗等) γ -分泌酶之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之一或多種式I化合物。

本發明亦提供一種調節(包括抑制、拮抗等) γ -分泌酶之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式I化合物。

本發明亦提供一種治療一或多種神經變性疾病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之一或多種式I化合物。

本發明亦提供一種治療一或多種神經變性疾病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式I化合物。

本發明亦提供一種抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白質 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之一或多種式I化合物。

本發明亦提供一種抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白質 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式I化合物。

本發明亦提供一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之一或多種式I化合物。

本發明亦提供一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式I化合物。

本發明亦提供一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之一或多種式I化合物，且併用有效(意即治療上有效)量之一或多種膽鹼酯酶抑制劑(例如(±)-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯基甲基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多泉佩吉(donepezil)鹽酸鹽，可以 Aricept® 品牌之多泉佩吉(donepezil)鹽酸鹽取得)。

本發明亦提供一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效(意即治療上有效)量之一或多種式I化合物，且併用有效(意即治療上有效)量之一或多種化合物，選自包括A β 抗體抑制劑、 γ 分泌酶抑制劑及 β 分泌酶抑制劑。

本發明亦提供組合，其包含有效(意即治療上有效)量之一或多種式I化合物，且併用有效(意即治療上有效)量之一或多種化合物，選自包括膽鹼酯酶抑制劑(例如(±)-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯基甲基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多泉佩吉(donepezil)鹽酸鹽，可以 Aricept® 品牌之多泉佩吉(donepezil)鹽酸鹽取得)、A β 抗體抑制劑、 γ 分泌酶抑制劑及 β 分泌酶抑制劑。

本發明亦提供一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式I化合物，且併用有效(意即治療上有效)量之一或多種(例如一種)膽鹼酯酶抑制劑(例如(±)-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯基甲基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多臬佩吉(donepezil)鹽酸鹽，可以 Aricept® 品牌之多臬佩吉(donepezil)鹽酸鹽取得)。

本發明亦提供一種治療 Down 氏徵候簇之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之一或多種式I化合物。

本發明亦提供一種治療 Down 氏徵候簇之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式I化合物。

本發明亦提供一種治療 Down 氏徵候簇之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之一或多種式I化合物，且併用有效(意即治療上有效)量之一或多種膽鹼酯酶抑制劑(例如(±)-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯基甲基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多臬佩吉(donepezil)鹽酸鹽，可以 Aricept® 品牌之多臬佩吉(donepezil)鹽酸鹽取得)。

本發明亦提供一種治療 Down 氏徵候簇之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式I化合物，且併用有效(意即治療上有效)量之一或多種(例如一種)膽鹼酯酶抑制劑(例如(±)-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯

基甲基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多梟佩吉(donepezil)鹽酸鹽，可以 Aricept® 品牌之多梟佩吉(donepezil)鹽酸鹽取得)。

本發明亦提供組合療法，以供(1)調節 γ -分泌酶，或(2)治療一或多種神經變性疾病，或(3)抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近，或(4)治療阿耳滋海默氏病。此組合療法係針對包括投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物及投予有效量之一或多種(例如一種)其他醫藥活性成份(例如藥物)之方法。

本發明亦提供一種治療溫和認知力減弱之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供一種治療青光眼之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供一種治療大腦澱粉狀蛋白血管病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供一種治療中風之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供一種治療癡呆症之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供一種治療微神經膠質病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化

合物。

本發明亦提供一種治療腦部發炎之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供一種治療嗅覺功能喪失之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供醫藥組合物，其包含以下組合，有效量之一或多種(例如一種)式I化合物，且併用有效量之一或多種化合物，選自包括膽鹼酯酶抑制劑、 $A\beta$ 抗體抑制劑、 γ 分泌酶抑制劑及 β 分泌酶抑制劑。此醫藥組合物亦包含藥學上可接受之載劑。

本發明亦提供一種套件，其在個別容器中，於單一包裝中包含醫藥組合物，供使用於組合中，其中一個容器包含有效量之式I化合物在藥學上可接受之載劑中，而另一個容器(意即第二個容器)包含有效量之另一種醫藥活性成份，該式I化合物與另一種醫藥活性成份之合併量係有效：(a)治療阿耳滋海默氏病，或(b)抑制澱粉狀蛋白質沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近，或(c)治療神經變性疾病，或(d)調節 γ -分泌酶之活性。

本發明亦提供一種套件，其在個別容器中，於單一包裝中包含醫藥組合物，供使用於組合中，其中一個容器包含有效量之式I化合物在藥學上可接受之載劑中，而另一個容器(意即第二個容器)包含有效量之另一種醫藥活性成份(如下文所述)，該式I化合物與另一種醫藥活性成份之合併

量係有效：(a)治療阿耳滋海默氏病，或(b)抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白質 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近，或(c)治療神經變性疾病，或(d)調節 γ -分泌酶之活性。

本發明亦提供上文與下文所揭示之任一種方法，其中化合物係選自包括化合物1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明亦提供任一種上文與下文所揭示之方法，其中式I化合物係選自包括化合物1至20及23。

本發明亦提供任一種上文與下文所揭示之方法，其中式I化合物係選自包括化合物21、22及24。

本發明亦提供任一種上文與下文所揭示之方法，其中式I化合物係選自包括化合物1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明亦提供任一種上文與下文所揭示之醫藥組合物，其中化合物係選自包括化合物1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明亦提供任一種上文與下文所揭示之醫藥組合物，其中化合物為化合物1至20及23之任一種。

本發明亦提供任一種上文與下文所揭示之醫藥組合物，其中化合物為化合物21、22及24之任一種。

本發明亦提供任一種上文與下文所揭示之醫藥組合物，其中化合物為化合物1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1之任一種。

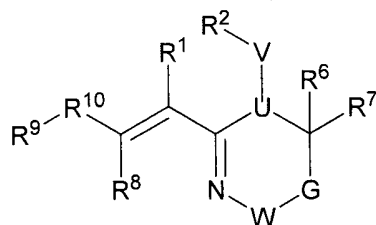
本發明之其他具體實施例係針對上文或下文關於式I或式I用途之任一項具體實施例(例如針對治療方法、醫藥組合物及套件之具體實施例)，其中化合物為式IA化合物，代替式I。熟諳此藝者將明瞭的是，式I與式IA化合物係為彼此之異構物。

本發明亦提供任一種上文所指出之治療方法，其中式I化合物係選自包括表1中之化合物。

詳細說明

於一項具體實施例中，本發明係揭示以結構式I表示之化合物，或其藥學上可接受之鹽、溶劑合物、酯或前體藥物，其中各種部份基團係描述於下文。

於一項具體實施例中，本申請案係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



式 I

其中：

無論是 (i) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、

C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或 (ii) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或 (iii) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；且 R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或 (iv) R^6 與 $-C(R^3)(R^4)-G$ 部份基團之 R^3 或 R^4 之任一個係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或 (v) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成 5-8 員雜環

基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中該雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；且

U 為 $\begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{—C(R}^5\text{)}$ 或 N；

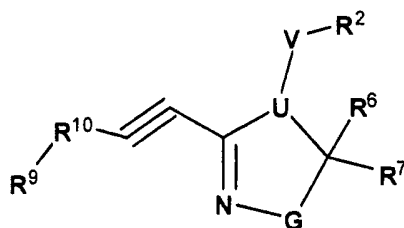
W 係選自包括鍵結；-O-、-C(O)-、-S-、-S(O)-、-S(O₂)-及 -C(R¹¹)(R¹²)-；

G 係選自包括 -C(R³)(R⁴)-、-C(O)-及 -N(R¹³)-，其附帶條件是，當 W 為 -O- 或 -S- 時，G 不為 -N(R¹³)- 或 -C(O)-；

V 係選自包括鍵結、-O-、-C(O)-及 -N(R¹⁴)-；

R¹(當 R¹ 未接合至 R² 時)、R²(當 R² 未接合至 R¹ 或 R⁶ 時)、R⁵、R⁶(當 R⁶ 未接合至 R² 時)及 R⁷ 可為相同或不同，各獨立選自包括 H、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

或者，R¹(當 R¹ 未接合至 R² 時)與 R⁸ 係一起採用以形成鍵結(意即有一個參鍵在 R¹ 所結合之碳原子與 R⁸ 所結合之碳之間，意即，式 I 化合物為式 II 化合物：



式II

且 R^2 , R^5 , R^6 及 R^7 均如上文定義，而 R^3 , R^4 , R^{11} 及 R^{12} 均如下文定義)；

R^3 係選自包括 H、鹵基 (且在一項實例中為 F)、 $-OR^{15}$ (且在一項實例中， R^{15} 為 H)、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或

R^3 與 R^6 一起採用，形成鍵結 (意即 R^3 與 R^6 形成一個鍵結在 G 與 R^6 所結合之碳之間)，其條件是，當 R^3 與 R^6 形成鍵結時：(1) W 不為鍵結，(2) R^2 與 R^6 係未接合在一起，以形成環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團 (如上文 (ii) 與 (iii))

中所述者)，(3) R^6 與 $-C(R^3)(R^4)-G$ 部份基團之 R^3 或 R^4 之任一個係未接合在一起，以形成環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團(如上文(iv)中所述者)，及(4) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係未接合在一起，以形成雜環基或雜環烯基部份基團(如上文(v)中所述者)；

R^4 、 R^{11} 及 R^{12} 可為相同或不同，各獨立選自包括 H、鹵基(且在一項實例中為 F)、 $-OR^{15}$ (且在一項實例中， R^{15} 為 H)、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

其條件是，當 R^3 或 R^4 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、

$N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$
 及 $-N_3$ (意即, 若 R^{11} 或 R^{12} 之一為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、
 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2-$
 $N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、
 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、
 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$, 則另
 一個不為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、
 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、
 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)-$
 OR^{16} 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、
 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$);

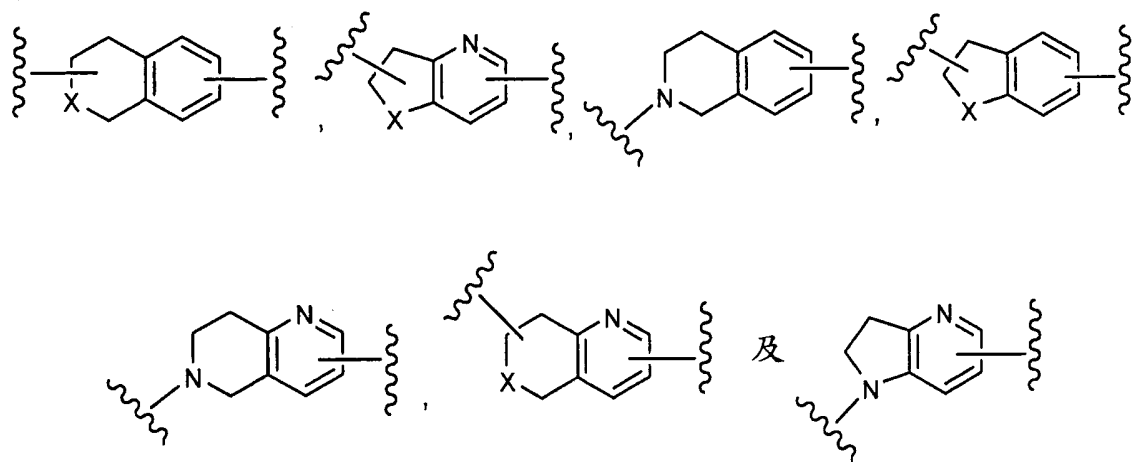
R^{13} 係獨立選自包括 H、烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環
 烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環
 烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、
 環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基-、芳基
 雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基、
 芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基-、芳基雜環烯基-、
 雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、
 雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、
 雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-、雜環烯基芳基-、 $-OR^{15}$ 、
 $-CN$ 、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^9$ 、 $-S(O)R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})(R^{12})$ 、
 $-S(O)N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-S(O)_2N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=C(R^8)_2$ 及 $-N(R^8)_2$;
 且其中該 R^{13} 為烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環烷基烷基-、
 雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環烷基烷基-、

芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基、芳基雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基、芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基-、芳基雜環烯基-、雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-及雜環烯基芳基-係視情況被1至5個基團取代，取代基獨立選自包括：烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、-CN、-OR¹⁵、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-SR¹⁵、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-CH(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-烷基-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-R¹⁵；-CH₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-S(O)R¹⁵、=NOR¹⁵、-N₃、-NO₂及-S(O)₂R¹⁵；

R¹⁴係選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、-CN、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶及-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)；

R^8 係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-係為未經取代，或視情況獨立被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R^{10} 係選自包括鍵結、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-及以下部份基團：



其中X為O、 $N(R^{14})$ 或S；

其中關於 R^{10} 之各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-，以及上文關於 R^{10} 所指之部份基團，可為未經取代，或視情況獨立被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括下文所示之部份基團；且

R^9 係選自包括烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、

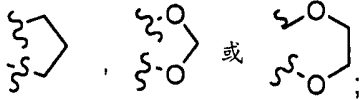
烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

R^{15} 、 R^{16} 及 R^{17} 係獨立選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、芳基環烷基-、芳基雜環基-、 R^{18} -烷基、 R^{18} -環烷基、 R^{18} -環烷基烷基-、 R^{18} -雜環基、 R^{18} -雜環基烷基-、 R^{18} -芳基、 R^{18} -芳烷基-、 R^{18} -雜芳基及 R^{18} -雜芳烷基-；

R^{18} 為1-5個取代基，獨立選自包括烷基、烯基、炔基、芳基、芳烷基-、芳烯基-、芳基炔基-、 $-\text{NO}_2$ 、鹵基、雜芳基、 HO -烷氧基烷基-、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、烷基- CN 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{雜芳基})$ 、 $-\text{SR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{芳基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{雜環基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{O}$ -雜環基、 $-\text{O}$ -環烷基烷基、 $-\text{O}$ -雜環基烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})(\text{雜芳烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、

-NHS(O)₂NH(烷基)、-NHS(O)₂N(烷基)(烷基)、-N(烷基)S(O)₂NH(烷基)及-N(烷基)S(O)₂N(烷基)(烷基)；

或者，在相鄰碳上之兩個R¹⁸部份基團可連結在一起，以形成：



R¹⁹為烷基、環烷基、芳基、芳烷基-或雜芳烷基-；

R²⁰為烷基、環烷基、芳基、鹵基取代之芳基、芳烷基-、雜芳基或雜芳烷基-；

其中在R¹, R², R¹-R², R²-R⁶, R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹²及R¹⁴中之各烷基、環烷基、環烯基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、烷基芳基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或視情況被1至5個R²¹基團取代，取代基獨立選自包括烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、-CN、-OR¹⁵、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-SR¹⁵、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-CH(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-烷基-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-R¹⁵；-CH₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)-N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-S(O)R¹⁵、=NOR¹⁵、-N₃、-NO₂及

$-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$;

其中在 R^{21} 中之各烷基、環烯基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或被1至5個 R^{22} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、環烷基、環烯基、雜環基、芳基、雜芳基、鹵基、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、-烷基 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、-烷基 $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})-\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{N}_3$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 及 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 。

上文陳述："無論是(i) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或(ii) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或(iii) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成C4-C8環烷

基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；且 R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或(iv) R^6 與 $-C(R^3)(R^4)-G$ 部份基團之 R^3 或 R^4 之任一個係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或(v) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；"係意謂(i)、(ii)、(iii)、(iv)及(v)之存在係為相互排外性，且(i)、(ii)、(iii)、(iv)及(v)中只有一個可於任何特定時間下存在。

應明瞭的是，當 R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團時，各該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團獨立地可視情況另外與芳基或雜芳基環稠合，其中由於稠合

所形成之環部份基團可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括上文所示之部份基團(意即各取代基係獨立選自包括 R^{21} 取代基)。

亦應明瞭的是，當 R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團時，各該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團獨立地可視情況另外與芳基或雜芳基環稠合，其中由於稠合所形成之環部份基團可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括上文所示之部份基團(意即各取代基係獨立選自包括 R^{21} 取代基)。

應明瞭的是，當 R^6 與 $-C(R^3)(R^4)-G$ 部份基團之 R^3 或 R^4 之任一個係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團時，各該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團獨立地可視情況另外與芳基或雜芳基環稠合，其中由於稠合所形成之環部份基團可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括上文所示之部份基團(意即各取代基係獨立選自包括 R^{21} 取代基)。

應明瞭的是，當 R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團時，各該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團獨立地可視情況另外與芳基或雜芳基環

稠合，其中由於稠合所形成之環部份基團可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括上文所示之部份基團(意即各取代基係獨立選自包括 R^{21} 取代基)。

於一項具體實施例中，無論是：

(i) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括上文所示之部份基團(意即各取代基係獨立選自包括 R^{21} 取代基)；或

(ii) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括上文所示之部份基團(意即各取代基係獨立選自包括 R^{21} 取代基)；或

(iii) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；且 R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經

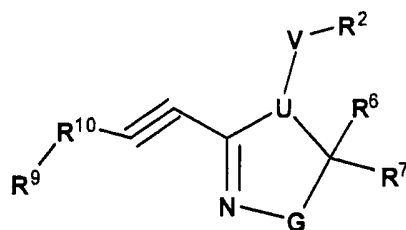
取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括上文所示之部份基團(意即各取代基係獨立選自包括 R^{21} 取代基)。

於一項具體實施例中， R^1 (當 R^1 未接合至 R^2 時)、 R^2 (當 R^2 未接合至 R^1 或 R^6 時)、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 (當 R^6 未接合至 R^2 時)、 R^7 、 R^{11} 及 R^{12} 可為相同或不同，各獨立選自包括H、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括上文所示之部份基團(意即各取代基係獨立選自包括 R^{21} 取代基)。

於一項具體實施例中，在 R^1 、 R^2 、 R^1-R^2 、 R^2-R^6 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 及 R^{14} 中之各烷基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、雜環基烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、烯基及炔基係獨立為未經取代，或視情況被1至5個 R^{21} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、環烯基、雜環基、雜環基烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-CH(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-烷基-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、

$-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{R}^{15}$ ；
 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 、 $-\text{N}_3$ 、 $-\text{NO}_2$
 及 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ ；且在 R^{21} 中之各烷基、環烯基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、雜環基烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、烯基及炔基係獨立為未經取代，或被 1 至 5 個 R^{22} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、環烷基、環烯基、雜環基、芳基、雜芳基、鹵基、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、-烷基 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、-烷基 $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})-\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{N}_3$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 及 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 。

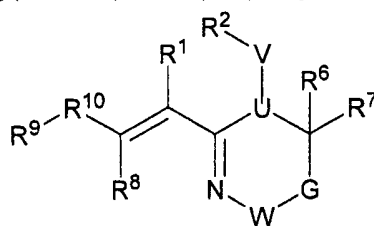
於另一項具體實施例中， R^1 (當 R^1 未接合至 R^2 時) 與 R^8 係一起採用以形成鍵結 (意即有一個參鍵在 R^1 所結合之碳原子與 R^8 所結合之碳之間，意即，式 I 化合物為式 II 化合物：



式II

且 R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R¹¹ 及 R¹² 均如上文定義)。

因此，一項具體實施例係針對式I化合物：



式I

或其藥學上可接受之鹽、溶劑合物、酯或前體藥物，其中：

無論是

(i) R¹ 與 R² 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中：(a) 該環烷基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R²¹ 取代基取代，(b) 該雜環基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R²¹ 取代基取代，及 (c) 該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R²¹ 取代基取代；或

(ii) R² 與 R⁶ 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中：(a) 該環烷基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R²¹ 取代基取代，(b) 該雜環基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇

之 R^{21} 取代基取代，及(c)該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(iii)

(a) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(1)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與(2)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及

(b) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(1)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與(2)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；及

(c) 該 R^2 與 R^6 環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(iv) R^6 與 $-C(R^3)(R^4)-G$ 部份基團之 R^3 或 R^4 之任一個係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(a)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，(b)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取

代，及(c)該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(v) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(a)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，(b)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及(c)該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；

U為 $\begin{cases} -C(R^5) \text{ 或 } N; \end{cases}$

W係選自包括鍵結； $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O_2)-$ 及 $-C(R^{11})(R^{12})-$ ；

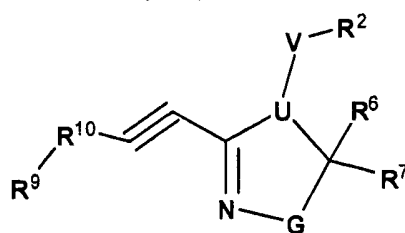
G係選自包括 $-C(R^3)(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 及 $-N(R^{13})-$ ，其附帶條件是，當W為 $-O-$ 或 $-S-$ 時，G不為 $-N(R^{13})-$ 或 $-C(O)-$ ；

V係選自包括鍵結、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 及 $-N(R^{14})-$ ；

R^1 (當 R^1 未接合至 R^2 時)、 R^2 (當 R^2 未接合至 R^1 或 R^6 時)、 R^5 、 R^6 (當 R^6 未接合至 R^2 時)及 R^7 可為相同或不同，各獨立選自包括H、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜

芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

或者， R^1 (當 R^1 未接合至 R^2 時)與 R^8 係一起採用以形成鍵結 (意即有一個參鍵在 R^1 所結合之碳原子與 R^8 所結合之碳之間，意即，式I化合物為式II化合物：



式II

且 R^2 , R^5 , R^6 及 R^7 均如上文定義，而 R^3 , R^4 , R^{11} 及 R^{12} 均如下文定義)；

R^3 係選自包括H、鹵基 (且在一項實例中為F)、 $-OR^{15}$ (且在一項實例中， R^{15} 為H)、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或

不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或

R^3 與 R^6 一起採用，形成鍵結（意即 R^3 與 R^6 形成一個鍵結在 G 與 R^6 所結合之碳之間），其條件是，當 R^3 與 R^6 形成鍵結時：
 (1) W 不為鍵結，(2) R^2 與 R^6 係未接合在一起，以形成環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團（如上文(ii)與(iii)中所述者），(3) R^6 與 $-C(R^3)(R^4)-G$ 部份基團之 R^3 或 R^4 之任一個係未接合在一起，以形成環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團（如上文(iv)中所述者），及(4) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係未接合在一起，以形成雜環基或雜環烯基部份基團（如上文(v)中所述者）；

R^4 、 R^{11} 及 R^{12} 可為相同或不同，各獨立選自包括 H、鹵基（且在一項實例中為 F）、 $-OR^{15}$ （且在一項實例中， R^{15} 為 H）、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取

代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，且

其條件是，當 R^3 或 R^4 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ 時，則另一個不選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 及 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ (意即，若 R^3 或 R^4 之一為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$ ，則另一個不為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 及 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$)；

其條件是，當 R^{11} 或 R^{12} 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、

$-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、
 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、
 $=\text{NOR}^{15}$ 及 $-\text{N}_3$ 時，則另一個不選自包括： $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、
 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}$ -
 $(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$
 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 及 $-\text{N}_3$ (意
 即，若 R^{11} 或 R^{12} 之一為 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2$ -
 $\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、
 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 或 $-\text{N}_3$ ，則另
 一個不為 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})$ -
 OR^{16} 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、
 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 或 $-\text{N}_3$)；

R^{13} 係獨立選自包括 H、烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環
 烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環
 烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、
 環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基-、芳基
 雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基、
 芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基-、芳基雜環烯基-、
 雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、

雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、
 雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-、雜環烯基芳基-、 $-OR^{15}$ 、
 $-CN$ 、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^9$ 、 $-S(O)R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})(R^{12})$ 、
 $-S(O)N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-S(O)_2N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=C(R^8)_2$ 及
 $-N(R^8)_2$ ；且其中該 R^{13} 烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環烷基
 烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環烷基
 烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、環烷
 基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基、芳基雜環
 烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基、芳基
 環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基-、芳基雜環烯基-、
 雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、
 雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、
 雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-及雜環烯基芳基-係視情況
 被1至5個基團取代，取代基獨立選自包括：烷基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷
 基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、 $-CN$ 、
 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、
 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-CH(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、
 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、-烷基
 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})-$
 $C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-R^{15}$ ； $-CH_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、
 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$
 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})-$
 $C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、

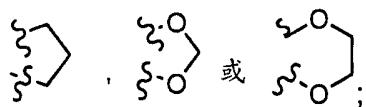
烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 及 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ ，其中各該烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基及雜芳烷基-係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；

R^{15} 、 R^{16} 及 R^{17} 係獨立選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、芳基環烷基-、芳基雜環基-、 $(\text{R}^{18})_r$ -烷基、 $(\text{R}^{18})_r$ -環烷基、 $(\text{R}^{18})_r$ -環烷基烷基-、 $(\text{R}^{18})_r$ -雜環基、 $(\text{R}^{18})_r$ -雜環基烷基-、 $(\text{R}^{18})_r$ -芳基、 $(\text{R}^{18})_r$ -芳烷基-、 $(\text{R}^{18})_r$ -雜芳基及 $(\text{R}^{18})_r$ -雜芳烷基-；其中r為1-5；

各 R^{18} 係獨立選自包括烷基、烯基、炔基、芳基、芳烷基-、芳烯基-、芳基炔基-、 $-\text{NO}_2$ 、鹵基、雜芳基、HO-烷氧基烷基-、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、烷基-CN、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{雜芳基})$ 、 $-\text{SR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{芳基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{雜環基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{O}$ -雜環基、 $-\text{O}$ -環烷基烷基、 $-\text{O}$ -雜環基烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})(\text{雜芳烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{烷$

基)、-N(烷基)C(O)N(烷基)(烷基)、-NHS(O)₂R²⁰、-NHS(O)₂NH(烷基)、-NHS(O)₂N(烷基)(烷基)、-N(烷基)S(O)₂NH(烷基)及-N(烷基)S(O)₂N(烷基)(烷基)；

或者，在相鄰碳上之兩個R¹⁸部份基團可連結在一起，以形成：



R¹⁹係選自包括：烷基、環烷基、芳基、芳烷基-及雜芳烷基-；

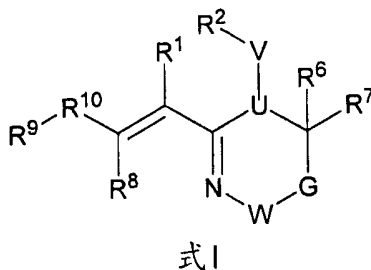
R²⁰係選自包括：烷基、環烷基、芳基、鹵基取代之芳基、芳烷基-、雜芳基及雜芳烷基-；

各R²¹基團係獨立選自包括烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、-CN、-OR¹⁵、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-SR¹⁵、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-CH(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-烷基-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-R¹⁵；-CH₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)-S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)-C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-S(O)R¹⁵、=NOR¹⁵、-N₃、-NO₂及-S(O)₂R¹⁵；且其中各R²¹烷基、環烯基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、

雜芳烷基-、烯基及炔基係視情況被1至5個獨立經選擇之 R^{22} 基團取代；且

各 R^{22} 係獨立選自包括：烷基、環烷基、環烯基、雜環基、芳基、雜芳基、鹵基、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-$ 烷基 $-C(O)OR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-$ 烷基 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})-C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)-N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-N_3$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-NO_2$ 、 $-S(O)R^{15}$ 及 $-S(O)_2R^{15}$ 。

於另一項具體實施例中，本申請案係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中：

R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選

自包括下文所示之部份基團；

U 為 $\begin{matrix} \diagup \\ \diagdown \end{matrix} -C(R^5)$ 或 N；

W 係選自包括鍵結、-O-、-C(O)-、-S-、-S(O)-、-S(O₂)-及 -C(R¹¹)(R¹²)-；

G 係選自包括 -C(R³)(R⁴)-、-C(O)-及 -N(R¹³)-；其附帶條件是，當 W 為 -O- 或 -S- 時；G 不為 -N(R¹³)- 或 -C(O)-；

V 係選自包括鍵結、-O-、-C(O)-及 -N(R¹⁴)-；

R⁵、R⁶及 R⁷可為相同或不同，各獨立選自包括 H、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R³係選自包括 H、鹵基(且在一項實例中為 F)、-OR¹⁵(且在一項實例中，R¹⁵為 H)、-CN、-SR¹⁵、-NR¹⁵R¹⁶、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)-OR¹⁶、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、=NOR¹⁵、-N₃、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷

基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或

R^3 與 R^6 一起採用，形成鍵結(意即 R^3 與 R^6 形成一個鍵結在G與 R^6 所結合之碳之間)，其條件是當 R^3 與 R^6 形成鍵結時，W不為鍵結；

R^4 、 R^{11} 及 R^{12} 可為相同或不同，各獨立選自包括H、鹵基(且在一項實例中為F)、 $-OR^{15}$ (且在一項實例中， R^{15} 為H)、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

其條件是，當 R^3 或 R^4 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、

$-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ 時，則另一個不選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 及 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ (意即，若 R^3 或 R^4 之一為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$ ，則另一個不為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 及 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$)；

其條件是，當 R^{11} 或 R^{12} 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ 時，則另一個不選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、

$-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 及 $-\text{N}_3$ (意
 即，若 R^{11} 或 R^{12} 之一為 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、
 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 或 $-\text{N}_3$ ，則另
 一個不為 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、
 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、
 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 或 $-\text{N}_3$)；

R^{13} 係獨立選自包括H、烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環
 烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環
 烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、
 環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基-、芳基
 雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基芳
 基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基-、芳基雜環烯基-、
 雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、
 雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基環烷基雜芳基-、
 雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-、雜環烯基芳基-、 $-\text{OR}^{15}$ 、
 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^9$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})(\text{R}^{12})$ 、

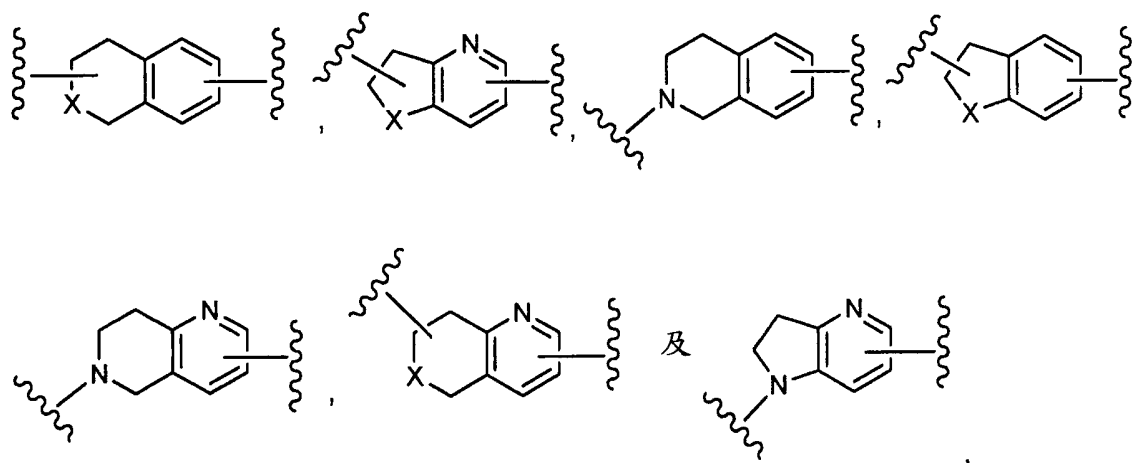
$-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})(\text{R}^{12})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{11})(\text{R}^{12})$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}=\text{C}(\text{R}^8)_2$ 及
 $-\text{N}(\text{R}^8)_2$ ；且其中該 R^{13} 烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環烷基
 烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環烷基
 烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、環烷
 基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基-、芳基雜環
 烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基、芳基
 環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基-、芳基雜環烯基-、
 雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、
 雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、
 雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-及雜環烯基芳基-係視情況
 被 1 至 5 個基團取代，取代基獨立選自包括：烷基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷
 基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、 $-\text{CN}$ 、
 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-$
 $\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{CH}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$
 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、-烷基- $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$
 、 $-\text{CH}_2-\text{R}^{15}$ ； $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}-$
 $(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$
 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 、
 $-\text{N}_3$ 、 $-\text{NO}_2$ 及 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ ；

R^{14} 係選自包括 H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基
 烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、

雜芳基、雜芳烷基-、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 及 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ ；

R^8 係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-係為未經取代，或視情況獨立被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R^{10} 係選自包括鍵結、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-及以下部份基團：



其中X為O、 $\text{N}(\text{R}^{14})$ 或S；

其中關於 R^{10} 之各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-，以及上文關於 R^{10} 所指之部份基團，可為未經取代，或視情況獨立被1-3個取代基取代，取

代基可為相同或不同，各獨立選自包括下文所示之部份基團；且

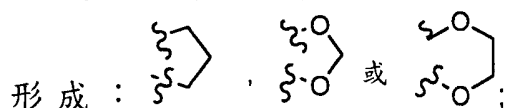
R^9 係選自包括烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

R^{15} 、 R^{16} 及 R^{17} 係獨立選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、芳基環烷基-、芳基雜環基、 R^{18} -烷基、 R^{18} -環烷基、 R^{18} -環烷基烷基-、 R^{18} -雜環基、 R^{18} -雜環基烷基-、 R^{18} -芳基、 R^{18} -芳烷基-、 R^{18} -雜芳基及 R^{18} -雜芳烷基-；

R^{18} 為1-5個取代基，獨立選自包括烷基、烯基、炔基、芳基、芳烷基-、芳烯基-、芳基炔基-、 $-\text{NO}_2$ 、鹵基、雜芳基、HO-烷氧基烷基-、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、烷基-CN、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{雜芳基})$ 、 $-\text{SR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{芳基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{雜環基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{O}$ -雜環基、 $-\text{O}$ -環烷基烷基-、 $-\text{O}$ -雜環基烷基-、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳$

烷基)₂、-N(芳烷基)-(雜芳烷基)、-NHC(O)R²⁰、-NHC(O)NH₂、
-NHC(O)NH(烷基)、-NHC(O)N(烷基)(烷基)、-N(烷基)C(O)NH(烷基)、
-N(烷基)C(O)N(烷基)(烷基)、-NHS(O)₂R²⁰、-NHS(O)₂NH(烷基)、
-NHS(O)₂N(烷基)(烷基)、-N(烷基)S(O)₂NH(烷基)及-N(烷基)S(O)₂N(烷基)(烷基)；

或者，在相鄰碳上之兩個R¹⁸部份基團可連結在一起，以



R¹⁹為烷基、環烷基、芳基、芳烷基-或雜芳烷基-；

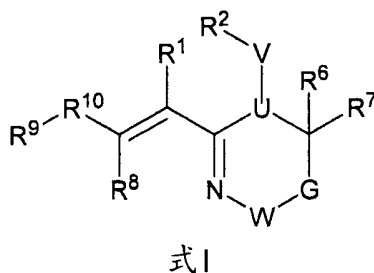
R²⁰為烷基、環烷基、芳基、鹵基取代之芳基、芳烷基-、雜芳基或雜芳烷基-；

其中在R¹-R²，R³，R⁴，R⁵，R⁶，R⁷，R⁸，R⁹，R¹⁰，R¹¹，R¹²及R¹⁴中之各烷基、環烷基、環烯基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、烷基芳基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或視情況被1至5個R²¹基團取代，取代基獨立選自包括烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、環烯基、雜環基、雜環基烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、鹵基、-CN、-OR¹⁵、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-SR¹⁵、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-CH(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-烷基-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-R¹⁵；-CH₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)-S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、

$-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ 及 $-S(O)_2R^{15}$ ；

其中在 R^{21} 中之各烷基、環烯基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或被1至5個 R^{22} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、環烷基、環烯基、雜環基、芳基、雜芳基、鹵基、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、-烷基- $-C(O)OR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、-烷基- $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-N_3$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-NO_2$ 、 $-S(O)R^{15}$ 及 $-S(O)_2R^{15}$ 。

於另一項具體實施例中，本申請案係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中：

R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

U 為 $\begin{cases} -C(R^5) \\ \text{或 } N \end{cases}$ ；

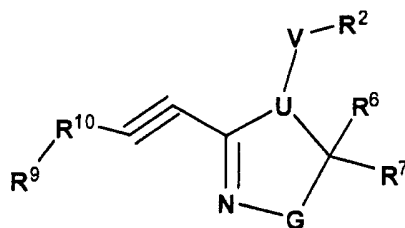
W 係選自包括鍵結、-O-、-C(O)-、-S-、-S(O)-、-S(O₂)- 及 -C(R¹¹)(R¹²)-；

G 為 -C(R³)(R⁴)-、-C(O)- 及 -N(R¹³)-；其附帶條件是，當 W 為 -O- 或 -S- 時，G 不為 -N(R¹³)- 或 -C(O)-；

V 係選自包括鍵結、-O-、-C(O)- 及 -N(R¹⁴)-；

R^1 (當 R^1 未接合至 R^2 時)、 R^5 、 R^6 (當 R^6 未接合至 R^2 時) 及 R^7 可為相同或不同，各獨立選自包括 H、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

或者， R^1 (當 R^1 未接合至 R^2 時) 與 R^8 係一起採用以形成鍵結 (意即有一個參鍵在 R^1 所結合之碳原子與 R^8 所結合之碳之間，意即，式 I 化合物為式 II 化合物：



式II

且 R^2 , R^5 , R^6 及 R^7 均如上文定義，而 R^3 , R^4 , R^{11} 及 R^{12} 均如下文定義)；

R^3 係選自包括 H、鹵基(且在一項實例中為 F)、 $-OR^{15}$ (且在一項實例中， R^{15} 為 H)、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或

R^4 、 R^{11} 及 R^{12} 可為相同或不同，各獨立選自包括 H、鹵基(且在一項實例中為 F)、 $-OR^{15}$ (且在一項實例中， R^{15} 為 H)、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$

、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 、 $-\text{N}_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

其條件是，當 R^3 或 R^4 之一係選自包括： $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 及 $-\text{N}_3$ 時，則另一個不選自包括： $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 及 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 及 $-\text{N}_3$ (意即，若 R^3 或 R^4 之一為 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、

1

1

C(O)OR^{16} 、 $-\text{S(O)N(R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{N(R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S(O)R}^{15}$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P(O)(OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 或 $-\text{N}_3$) ;

R^{13} 係獨立選自包括 H、烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、環烷基-、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基-、芳基雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基-、芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基-、芳基雜環烯基-、雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-、雜環烯基芳基-、 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C(O)R}^8$ 、 $-\text{C(O)OR}^9$ 、 $-\text{S(O)R}^{10}$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{R}^{10}$ 、 $-\text{C(O)N(R}^{11})(\text{R}^{12})$ 、 $-\text{S(O)N(R}^{11})(\text{R}^{12})$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{N(R}^{11})(\text{R}^{12})$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}=\text{C(R}^8)_2$ 及 $-\text{N(R}^8)_2$; 且其中該 R^{13} 烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基、芳基雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基、環烯基、芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基、芳基雜環烯基-、雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基、雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-及雜環烯基芳基-係視情況被 1 至 5 個基團取代，取代基獨立選自包括：烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、

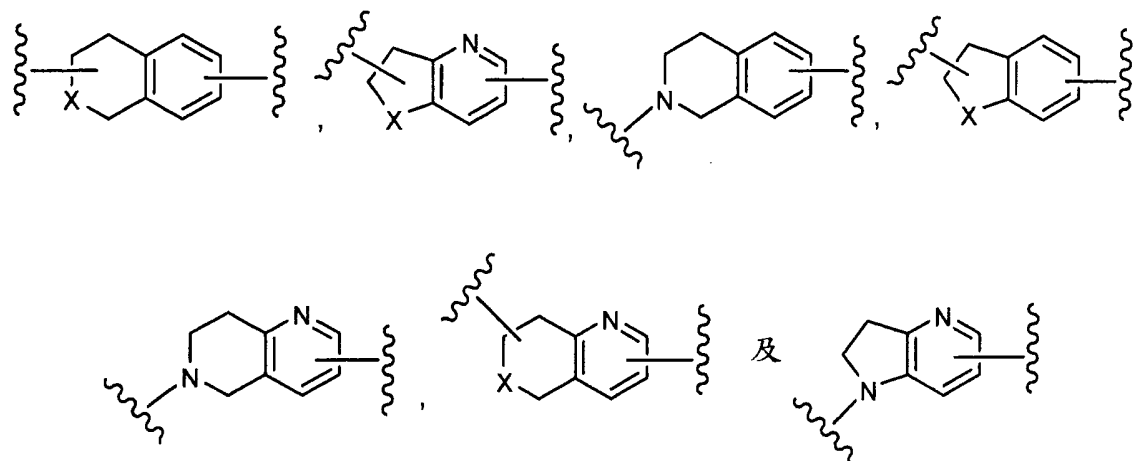
芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{CH}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、-烷基- $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{R}^{15}$ ； $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 、 $-\text{N}_3$ 、 $-\text{NO}_2$ 及 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ ；

R^{14} 係選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 及 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ ；

R^8 係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-係為未經取代，或視情況獨立被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R^{10} 係選自包括鍵結、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜

芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-及以下部份基團：



其中 X 為 O、N(R¹⁴) 或 S；

其中關於 R¹⁰ 之各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-，以及上文關於 R¹⁰ 所指之部份基團，可為未經取代，或視情況獨立被 1-3 個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括下文所示之部份基團；

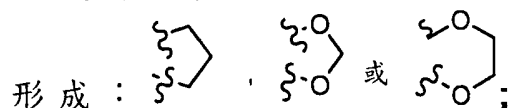
R⁹ 係選自包括烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-3 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

R¹⁵、R¹⁶ 及 R¹⁷ 係獨立選自包括 H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、芳基環烷基-芳基雜環基-

R^{18} -烷基、 R^{18} -環烷基、 R^{18} -環烷基烷基-、 R^{18} -雜環基、 R^{18} -雜環基烷基-、 R^{18} -芳基、 R^{18} -芳烷基-、 R^{18} -雜芳基及 R^{18} -雜芳烷基-；

R^{18} 為 1-5 個取代基，獨立選自包括烷基、烯基、炔基、芳基、芳烷基-、芳烯基-、芳基炔基-、 $-\text{NO}_2$ 、鹵基、雜芳基、HO-烷氧基烷基、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、烷基-CN、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{雜芳基})$ 、 $-\text{SR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{芳基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{雜環基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{O}$ -雜環基、 $-\text{O}$ -環烷基烷基、 $-\text{O}$ -雜環基烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})(\text{雜芳烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 及 $-\text{N}(\text{烷基})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ ；

或者，在相鄰碳上之兩個 R^{18} 部份基團可連結在一起，以



R^{19} 為烷基、環烷基、芳基、芳烷基-或雜芳烷基-；

R^{20} 為烷基、環烷基、芳基、鹵基取代之芳基、芳烷基-、雜芳基或雜芳烷基-；

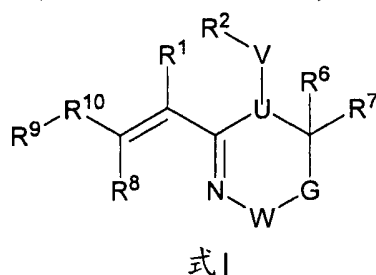
其中在 R^1 ， R^2 - R^6 ， R^3 ， R^4 ， R^5 ， R^7 ， R^8 ， R^9 ， R^{10} ， R^{11} ， R^{12} 及 R^{14}

中之各烷基、環烷基、環烯基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、烷基芳基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或視情況被1至5個 R^{21} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-CH(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、-烷基 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-R^{15}$ ； $-CH_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})-S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})-C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ 及 $-S(O)_2R^{15}$ ；

其中在 R^{21} 中之各烷基、環烯基-、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或被1至5個 R^{22} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、環烷基、環烯基-、雜環基、芳基、雜芳基、鹵基、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、-烷基 $-C(O)OR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、-烷基 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、

-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N-(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-N₃、=NOR¹⁵、-NO₂、-S(O)R¹⁵及-S(O)₂R¹⁵。

於另一項具體實施例中，本申請案係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中：

R¹與R²係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；且R²與R⁶係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

U為 $\begin{cases} -C(R^5) \\ N \end{cases}$ ；

W係選自包括鍵結、-O-、-C(O)-、-S-、-S(O)-、-S(O₂)-及

$-\text{C}(\text{R}^{11})(\text{R}^{12})-$;

G 為 $-\text{C}(\text{R}^3)(\text{R}^4)-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-$ 及 $-\text{N}(\text{R}^{13})-$ ；其附帶條件是，當 W 為 $-\text{O}-$ 或 $-\text{S}-$ 時，G 不為 $-\text{N}(\text{R}^{13})-$ 或 $-\text{C}(\text{O})-$ ；

V 係選自包括鍵結、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-$ 及 $-\text{N}(\text{R}^{14})-$ ；

R^5 、 R^6 及 R^7 可為相同或不同，各獨立選自包括 H、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R^3 係選自包括 H、鹵基(且在一項實例中為 F)、 $-\text{OR}^{15}$ (且在一項實例中， R^{15} 為 H)、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 、 $-\text{N}_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或

不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或

R^4 、 R^{11} 及 R^{12} 可為相同或不同，各獨立選自包括H、鹵基（且在一項實例中為F）、 $-OR^{15}$ （且在一項實例中， R^{15} 為H）、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

其條件是，當 R^3 或 R^4 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ 時，則另一個不選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 及 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、

$-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、
 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ (意即，
 若 R^3 或 R^4 之一為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$
 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、
 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)-$
 OR^{16} 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、
 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$ ，則另一個不為
 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 及 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、
 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$
 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、
 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、
 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$)；

其條件是，當 R^{11} 或 R^{12} 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、
 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})-$
 $S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、
 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、
 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、
 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ 時，則另一個不選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、
 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、
 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)-$
 $N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N-$
 $(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$
 及 $-N_3$ (意即，若 R^{11} 或 R^{12} 之一為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、
 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2-$

$N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、
 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、
 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$ ，則另
 一個不為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、
 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、
 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)-$
 OR^{16} 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、
 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$ ；

R^{13} 係獨立選自包括 H、烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環
 烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環
 烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、
 環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基-、芳基
 雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基、
 芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基、芳基雜環烯基-、
 雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、
 雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、
 雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-、雜環烯基芳基-、 $-OR^{15}$ 、
 $-CN$ 、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^9$ 、 $-S(O)R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})(R^{12})$ 、
 $-S(O)N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-S(O)_2N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=C(R^8)_2$ 及 $-N(R^8)_2$ ；
 且其中該 R^{13} 烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環烷基烷基-、
 雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環烷基烷基-、
 芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、環烷基、芳
 基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基-、芳基雜環烷基-、
 雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基、芳基環烯基、

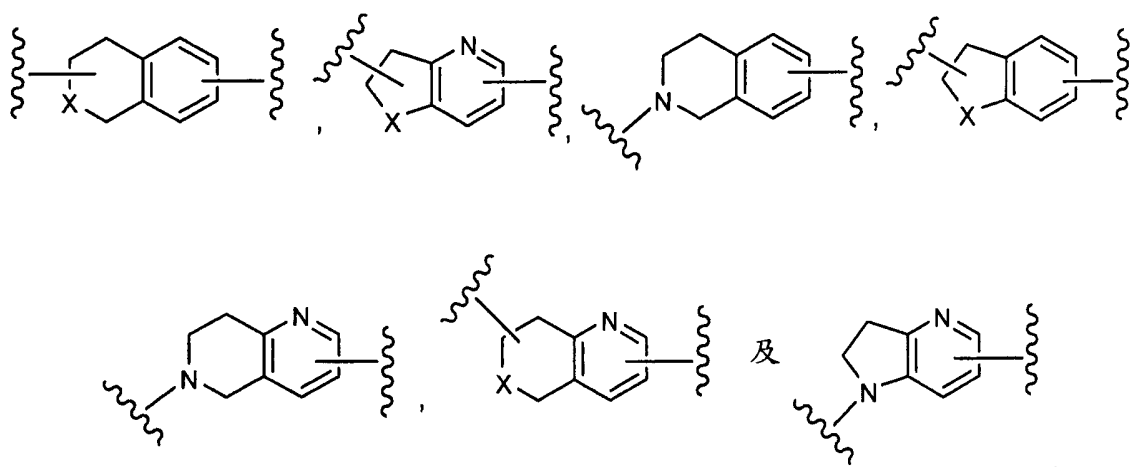
雜芳基環烯基-、雜環烯基-、芳基雜環烯基-、雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-及雜環烯基芳基-係視情況被1至5個基團取代，取代基獨立選自包括：烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、-CN、-OR¹⁵、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-SR¹⁵、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-CH(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-烷基-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)-C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-R¹⁵；-CH₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)-N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-S(O)R¹⁵、=NOR¹⁵、-N₃、-NO₂及-S(O)₂R¹⁵；

R¹⁴係選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、-CN、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶及-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)；

R⁸係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及

炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-係為未經取代，或視情況獨立被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R^{10} 係選自包括鍵結、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-及以下部份基團：



其中X為O、 $N(R^{14})$ 或S；

其中關於 R^{10} 之各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-，以及上文關於 R^{10} 所指之部份基團，可為未經取代，或視情況獨立被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括下文所示之部份基團；且

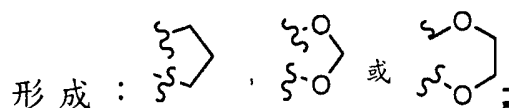
R^9 係選自包括烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜

芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

R^{15} 、 R^{16} 及 R^{17} 係獨立選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、芳基環烷基-、芳基雜環基-、 R^{18} -烷基、 R^{18} -環烷基、 R^{18} -環烷基烷基-、 R^{18} -雜環基、 R^{18} -雜環基烷基-、 R^{18} -芳基、 R^{18} -芳烷基-、 R^{18} -雜芳基及 R^{18} -雜芳烷基-；

R^{18} 為1-5個取代基，獨立選自包括烷基、烯基、炔基、芳基、芳烷基-、芳烯基-、芳基炔基-、 $-\text{NO}_2$ 、鹵基、雜芳基、HO-烷基、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、烷基-CN、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{雜芳基})$ 、 $-\text{SR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{芳基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{雜環基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{O}$ -雜環基、 $-\text{O}$ -環烷基、 $-\text{O}$ -雜環基烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})(\text{雜芳烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 及 $-\text{N}(\text{烷基})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ ；

或者，在相鄰碳上之兩個 R^{18} 部份基團可連結在一起，以



R^{19} 為烷基、環烷基、芳基、芳烷基-或雜芳烷基-；

R^{20} 為烷基、環烷基、芳基、鹵基取代之芳基、芳烷基-、雜芳基或雜芳烷基-；

其中在 R^1 - R^2 , R^2 - R^6 , R^3 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} 及 R^{14} 中之各烷基、環烷基、環烯基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、烷基芳基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或視情況被 1 至 5 個 R^{21} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、-CN、-OR¹⁵、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-SR¹⁵、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-CH(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-烷基-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)-C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-R¹⁵；-CH₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)-N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-S(O)R¹⁵、=NOR¹⁵、-N₃、-NO₂ 及 -S(O)₂R¹⁵；

其中在 R^{21} 中之各烷基、環烯基環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或被 1 至 5 個 R^{22} 基團

取代，取代基獨立選自包括烷基、環烷基、環烯基、雜環基、芳基、雜芳基、鹵基、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{烷基}-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{烷基}-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})-\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{N}_3$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 及 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 。

於另一項具體實施例中，U 為 $\text{C}(\text{R}^5)$ 。

於另一項具體實施例中，U 為 N。

於另一項具體實施例中， R^2 為 H。

於另一項具體實施例中， R^2 為烷基。

於另一項具體實施例中， R^2 為甲基。

於另一項具體實施例中， R^2 為烷氧烷基-。

於另一項具體實施例中， R^2 為 3-甲氧基丙基-。

於另一項具體實施例中，U 為 N，且 R^2 為 3-甲氧基丙基-。

於另一項具體實施例中，W 為鍵結。

於另一項具體實施例中，W 為 $-\text{O}-$ 。

於另一項具體實施例中，W 為 $-\text{C}(\text{O})-$ 。

於另一項具體實施例中，W 為 $-\text{S}-$ 。

於另一項具體實施例中，W 為 $-\text{S}(\text{O})-$ 。

於另一項具體實施例中，W 為 $-\text{S}(\text{O}_2)-$ 。

於另一項具體實施例中，W 為 $-\text{C}(\text{R}^{11})(\text{R}^{12})-$ 。

於另一項具體實施例中， $=\text{N}-\text{W}-\text{G}-$ 為 $=\text{N}-\text{C}(\text{R}^{11}\text{R}^{12})-\text{C}(\text{O})-$ 。

於另一項具體實施例中，G 為 $-\text{C}(\text{R}^3)(\text{R}^4)-$ 。

於另一項具體實施例中，G 為 $-\text{C}(\text{O})-$ 。

於另一項具體實施例中，G 為 $-\text{N}(\text{R}^{13})-$ 。

於另一項具體實施例中，V 為鍵結。

於另一項具體實施例中，V 為 $-\text{O}-$ 。

於另一項具體實施例中，V 為 $-\text{C}(\text{O})-$ 。

於另一項具體實施例中，V 為 $-\text{N}(\text{R}^{14})-$ 。

於另一項具體實施例中， R^2 為芳烷基-。

於另一項具體實施例中， R^2 為苯基甲基-。

於另一項具體實施例中， R^2 為(4-烷氧基)苯基甲基-。

於另一項具體實施例中， R^2 為(4-甲氧基)苯基甲基-。

於另一項具體實施例中， R^1 為 H。

於另一項具體實施例中， R^1 為烷基。

於另一項具體實施例中， R^1 為甲基。

於另一項具體實施例中， R^1 與 R^2 係接合在一起以形成環戊基環，其係為未經取代。

於另一項具體實施例中， R^1 與 R^2 係接合在一起以形成環戊基環，其係被 1-3 個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中， R^1 與 R^2 係接合在一起以形成環己基環，其係為未經取代。

於另一項具體實施例中， R^1 與 R^2 係接合在一起以形成環己基環，其係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起以形成六氫吡啶基環，包含U之N作為該未經取代之六氫吡啶基環之氮。

於另一項具體實施例中，U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起以形成六氫吡啶基環，包含U之N作為該六氫吡啶基環之氮，其中該六氫吡啶基環係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起以形成四氫吡咯基環，包含U之N作為該未經取代之四氫吡咯基環之氮。

於另一項具體實施例中，U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起以形成四氫吡咯基環，包含U之N作為該四氫吡咯基環之氮，其中該四氫吡咯基環係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起以形成六氫吡啶基環，包含U之N作為該未經取代之六氫吡啶基環之氮。

於另一項具體實施例中，U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起

以形成六氫吡咩基環，包含U之N作為該六氫吡咩基環之氮，其中該六氫吡咩基環係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，R¹與R²係接合在一起，以形成視情況被1至5個獨立經選擇之R²¹取代基取代之環，且該環係與芳基或雜芳基環稠合，及該所形成之稠合環係視情況被1至5個獨立經選擇之R²¹取代基取代。

於另一項具體實施例中，R¹與R²係接合在一起，以形成被1至5個獨立經選擇之R²¹取代基取代之環，且該環係與芳基或雜芳基環稠合，及該所形成之稠合環係視情況被1至5個獨立經選擇之R²¹取代基取代。

於另一項具體實施例中，R¹與R²係接合在一起，以形成視情況被1至5個獨立經選擇之R²¹取代基取代之環。

於另一項具體實施例中，R¹與R²係接合在一起以形成環。

於另一項具體實施例中，R¹與R²係接合在一起，以形成視情況被1至5個獨立經選擇之R²¹取代基取代之雜環基環。

於另一項具體實施例中，R¹與R²係接合在一起，以形成被1至5個獨立經選擇之R²¹取代基取代之雜環基環。

於另一項具體實施例中，U為N，且R¹與R²係接合在一起，以形成視情況被1至5個獨立經選擇之R²¹取代基取代之雜環基環。

於另一項具體實施例中，U為N，且R¹與R²係接合在一起，以形成被1至5個獨立經選擇之R²¹取代基取代之雜環基

環。

於另一項具體實施例中， R^1 與 R^2 係接合在一起以形成環，且該環係與芳基或雜芳基環稠合，及該所形成之稠合環係視情況被1至5個獨立經選擇之 $R^{2'}$ 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^1 與 R^2 係接合在一起以形成雜環基環。

於另一項具體實施例中，U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起以形成雜環基環。

於另一項具體實施例中， R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成視情況被1至5個獨立經選擇之 $R^{2'}$ 取代基取代之六氫吡啶基環。

於另一項具體實施例中， R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成被1至5個獨立經選擇之 $R^{2'}$ 取代基取代之六氫吡啶基環。

於另一項具體實施例中，U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成視情況被1至5個獨立經選擇之 $R^{2'}$ 取代基取代之六氫吡啶基環。

於另一項具體實施例中，U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成被1至5個獨立經選擇之 $R^{2'}$ 取代基取代之六氫吡啶基環。

於另一項具體實施例中， R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成視情況被=O部份基團取代之六氫吡啶基環。

於另一項具體實施例中，U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成視情況被=O部份基團取代之六氫吡啶基環。

於另一項具體實施例中， R^1 與 R^2 係接合在一起以形成六

氮吡啶基。

於另一項具體實施例中，U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起以形成六氮吡啶基環。

於另一項具體實施例中， R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成被=O部份基團取代之六氮吡啶基環。

於另一項具體實施例中，U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成被=O部份基團取代之六氮吡啶基環。

於另一項具體實施例中， R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(a)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，(b)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及(c)該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中：

(a) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(1)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與(2)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及

(b) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(1)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代

基取代，與(2)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；及

(c) 該 R^2 與 R^6 環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-C(R^3)(R^4)-G$ 部份基團之 R^3 或 R^4 之任一個係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(a) 該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，(b) 該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及(c) 該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(a) 該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與(b) 該雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之

R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中該雜環基部份基團係被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(a)該雜環基部份基團係視情況被 $=O$ 取代，與(b)該雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中該雜環基部份基團係視情況被 $=O$ 取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中該雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基

團。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(a)該雜環基部份基團係被 $=O$ 取代，與(b)該雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中該雜環基部份基團係被 $=O$ 取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團，其中：(a)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與(b)該雜環基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團，其中該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團，其中：(a)該雜環基部份基團係視情況被 $=O$ 取代，與(b)該雜環基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團，其中該雜環基部份基團係視情況被 $=O$ 取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團，其中該雜環基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團，其中：(a)該雜環基部份基團係被 $=O$ 取代，與(b)該雜環基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團，其中該雜環基部份基團係被 $=O$ 取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中：(a)該四氫吡咯基環係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與(b)該四氫吡咯基環係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中該四氫吡咯基環係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中：(a)該四氫吡咯基環係視情況被 $=O$ 取代，與(b)該四氫吡咯基環係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中該四氫吡咯基環係視情況被 $=O$ 取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中該四氫吡咯基環係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中：(a)該四氫吡咯基環係被 $=O$ 取代，與(b)該四氫吡咯基環係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中該四氫吡咯基環

係被=O取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團，其中：(a)該雜環基部份基團係被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與(b)該雜環基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團，其中該雜環基部份基團係被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中：(a)該四氫吡咯基環係被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與(b)該四氫吡咯基環係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5四氫吡咯基環，其中該四氫吡咯基環係被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

於另一項具體實施例中， R^6 為H。

於另一項具體實施例中， R^6 為烷基。

於另一項具體實施例中， R^6 為甲基。

於另一項具體實施例中， R^7 為芳基。

於另一項具體實施例中， R^7 為未經取代之苯基。

於另一項具體實施例中， R^7 為苯基，其係被1-4個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、羥基、烷氧基、芳基及雜芳基。

於另一項具體實施例中， R^7 為未經取代之萘基。

於另一項具體實施例中， R^7 為萘基，其係被1-4個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、羥基、烷氧基、芳基及雜芳基。

於另一項具體實施例中， R^7 為未經取代之聯苯基。

於另一項具體實施例中， R^7 為聯苯基，其係被1-4個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中， R^7 為3-(1,1'-聯苯基)-基。

於另一項具體實施例中， R^7 為4-(1,1'-聯苯基)-基。

於另一項具體實施例中， R^6 為H，且 R^7 為聯苯基，其可為未經取代，或視情況獨立被1-4個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中， R^6 為甲基，且 R^7 為聯苯基，其可為未經取代，或視情況獨立被1-4個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中， R^6 為H，且 R^7 為苯基，其可為

未經取代，或視情況獨立被1-4個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，R⁶為甲基，且R⁷為聯苯基，其可為未經取代，或視情況獨立被1-4個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，R²與R⁶係接合在一起以形成環戊基環。

於另一項具體實施例中，R²與R⁶係接合在一起以形成環戊基環，其係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，R²與R⁶係接合在一起以形成環己基環。

於另一項具體實施例中，R²與R⁶係接合在一起以形成環己基環，其係被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，U為N，且R²與R⁶係接合在一起以形成六氫吡啶基環，包含U之N作為該未經取代之六氫吡啶基環之氮。

於另一項具體實施例中，U為N，且R²與R⁶係接合在一起以形成六氫吡啶基環，包含U之N作為該六氫吡啶基環之

氮，其中該六氫吡啶基環係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，U為N，且R²與R⁶係接合在一起以形成四氫吡咯基環，包含U之N作為該未經取代之四氫吡咯基環之氮。

於另一項具體實施例中，U為N，且R²與R⁶係接合在一起以形成四氫吡咯基環，包含U之N作為該四氫吡咯基環之氮，其中該四氫吡咯基環係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，U為N，且R²與R⁶係接合在一起以形成六氫吡啶基環，包含U之N作為該未經取代之六氫吡啶基環之氮。

於另一項具體實施例中，U為N，且R²與R⁶係接合在一起以形成六氫吡啶基環，包含U之N作為該六氫吡啶基環之氮，其中該六氫吡啶基環係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，R²與R⁶係接合在一起，以形成未經取代之嗎福啉基環。

於另一項具體實施例中，R²與R⁶係接合在一起以形成嗎福啉基環，其係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、

-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，R²與R⁶係接合在一起，以形成未經取代之哌喃基環。

於另一項具體實施例中，R²與R⁶係接合在一起以形成哌喃基環，其係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，R²與R⁶係接合在一起，以形成未經取代之四氫吡咯基環。

於另一項具體實施例中，R²與R⁶係接合在一起以形成四氫吡咯基環，其係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，(R¹與R²)與(R²與R⁶)兩者係接合在一起，以形成獨立之環烷基環。

於另一項具體實施例中，(R¹與R²)與(R²與R⁶)兩者係接合在一起，以形成獨立之環烷基環，其每一個係獨立視情況被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，(R¹與R²)與(R²與R⁶)兩者係接合在一起，以形成獨立之雜環基環。

於另一項具體實施例中，(R¹與R²)與(R²與R⁶)兩者係接合在一起，以形成獨立之雜環基環，其每一個係獨立視情況

被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，(R¹與R²)與(R²與R⁶)兩者係接合在一起，以形成獨立之環烷基環。

於另一項具體實施例中，R¹與R²兩者係接合在一起以形成環烷基環，且R²與R⁶係接合在一起以形成雜環基環，其每一個係獨立視情況被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，R¹與R²兩者係接合在一起以形成雜環基環，且R²與R⁶係接合在一起以形成環烷基環，其每一個係獨立視情況被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中，R⁷為芳基。

於另一項具體實施例中，R⁷為未經取代之苯基。

於另一項具體實施例中，R⁷為苯基，其係被1-4個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基、烷氧基、芳基及雜芳基。

於另一項具體實施例中，R⁷為4-氟苯基。

於另一項具體實施例中，R⁷為未經取代之萘基。

於另一項具體實施例中，R⁷為萘基，其係被1-4個可為相

同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、羥基、烷氧基、芳基及雜芳基。

於另一項具體實施例中， R^7 為未經取代之聯苯基。

於另一項具體實施例中， R^7 為聯苯基，其係被1-4個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中， R^7 為3-(1,1'-聯苯基)-基。

於另一項具體實施例中， R^7 為4-(1,1'-聯苯基)-基。

於另一項具體實施例中， R^8 為H。

於另一項具體實施例中， R^8 為烷基。

於另一項具體實施例中， R^8 為甲基。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為芳基。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為苯基。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為被1個鹵基取代之芳基。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為被1個鹵基取代之芳基，且該鹵基為F。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為被1至3個獨立經選擇之 R^{21} 部份基團取代之芳基。

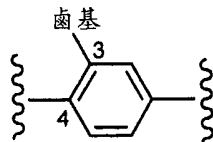
於另一項具體實施例中， R^{10} 為被1至3個 R^{21} 部份基團取代之芳基，其中各 R^{21} 部份基團為相同或不同之 $-\text{OR}^{15}$ 基團。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為被1個 R^{21} 部份基團取代之芳基。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為被1個鹵基取代之苯基。

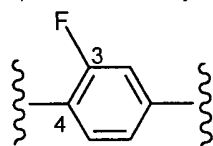
於另一項具體實施例中， R^{10} 為被1個鹵基取代之苯基，且該鹵基為F。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為3-鹵基苯基：



(其中得自經標識為4之碳之鍵結係對 R^9 基團)。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為3-F-苯基：



(其中得自經標識為4之碳之鍵結係對 R^9 基團)。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為被一個 $-OR^{15}$ 基團取代之芳基。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為被一個 $-OR^{15}$ 基團取代之芳基，且該 R^{15} 為烷基(例如甲基)。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為被1至3個獨立經選擇之 R^{21} 部份基團取代之苯基。

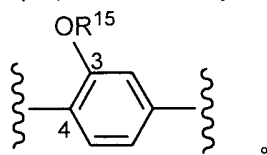
於另一項具體實施例中， R^{10} 為被1至3個 R^{21} 部份基團取代之苯基，其中各 R^{21} 部份基團為相同或不同之 $-OR^{15}$ 基團。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為被1個 R^{21} 部份基團取代之苯基。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為被一個 $-OR^{15}$ 基團取代之苯基。

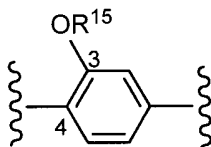
於另一項具體實施例中， R^{10} 為被一個 $-OR^{15}$ 基團取代之苯基，且該 R^{15} 為烷基(例如甲基)。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為 3- OR^{15} -苯基：



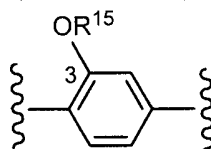
(其中得自經標識為 4 之碳之鍵結係對 R^9 基團)。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為 3- OR^{15} -苯基：



其中 R^{15} 為烷基 (其中得自經標識為 4 之碳之鍵結係對 R^9 基團)。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為 3- OR^{15} -苯基：



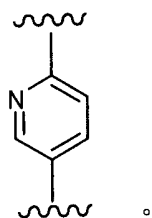
其中 R^{15} 為甲基 (意即 R^{10} 為 3-甲氧基-苯基)。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為雜芳基。

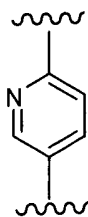
於另一項具體實施例中， R^{10} 為未經取代之雜芳基。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為未經取代之雜芳基，其中該雜芳基為吡啶基。

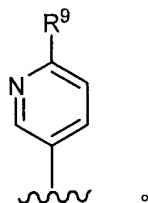
於另一項具體實施例中， R^{10} 為：



於另一項具體實施例中， R^{10} 為：



其中 $-R^{10}-R^9$ 部份基團為：



於另一項具體實施例中， R^{10} 為被 1 至 3 個 R^{21} 部份基團取代之芳基，其中各 R^{21} 部份基團為相同或不同之鹵基。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為被 1 至 3 個 R^{21} 部份基團取代之芳基，其中各 R^{21} 部份基團為 F。

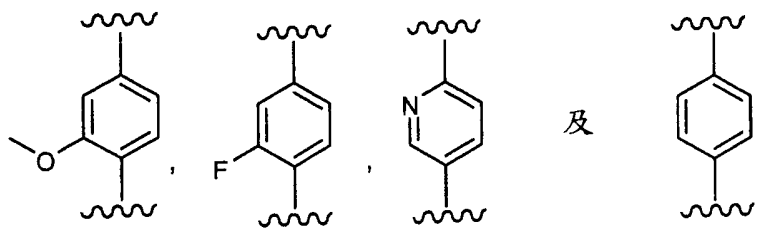
於另一項具體實施例中， R^{10} 為被一個 R^{21} 部份基團取代之芳基，且該 R^{21} 部份基團為鹵基。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為被一個 R^{21} 部份基團取代之芳基，該 R^{21} 部份基團為 -鹵基，且該鹵基為 F。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為被 1 至 3 個 R^{21} 部份基團取代之苯基，其中各 R^{21} 部份基團為相同或不同之鹵基。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為被 1 至 3 個 R^{21} 部份基團取代之苯基，其中各 R^{21} 部份基團為 F。

於另一項具體實施例中， R^{10} 係選自包括：



於本發明之另一項具體實施例中， R^9 係選自包括雜芳基

與被 1-3 個 R^{21} 基團取代之雜芳基，且其中各 R^{21} 係獨立經選擇。

於另一項具體實施例中， R^9 為未經取代之雜芳基。

於另一項具體實施例中， R^9 為雜芳基，其係被 1-3 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、CN、 NH_2 、 NH (烷基)、 N (烷基) $_2$ 、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中， R^9 為被 1 至 3 個獨立經選擇之烷基取代之雜芳基。

於另一項具體實施例中， R^9 為被一個烷基(例如甲基)取代之雜芳基。

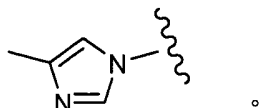
於本發明之另一項具體實施例中， R^9 係選自包括咪唑基與被 1-3 個 R^{21} 基團取代之咪唑基，且其中各 R^{21} 係獨立經選擇。

於本發明之另一項具體實施例中， R^9 為被 1-3 個 R^{21} 基團取代之咪唑基，且其中各 R^{21} 係獨立經選擇。

於另一項具體實施例中， R^9 為咪唑基，被 1-3 個取代基取代，取代基獨立選自包括鹵基、烷基、CN、 NH_2 、 NH (烷基)、 N (烷基) $_2$ 、羥基及烷氧基。

於另一項具體實施例中， R^9 為咪唑-1-基。

於另一項具體實施例中， R^9 為 4-甲基-咪唑-1-基：



於另一項具體實施例中， R^9 為 5-氯基-4-甲基-咪唑-1-基。

於另一項具體實施例中， R^{10} 係選自包括芳基與被一或多

個 R^{21} 基團取代之芳基，且 R^9 係選自包括雜芳基與被一或多個 R^{21} 基團取代之雜芳基，且其中各 R^{21} 係獨立經選擇。

於另一項具體實施例中， R^{10} 係選自包括苯基與被1-3個獨立經選擇之 R^{21} 基團取代之苯基，且 R^9 係選自包括咪唑基與被1-3個獨立經選擇之 R^{21} 基團取代之咪唑基。

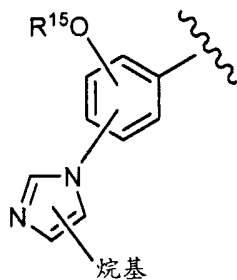
於另一項具體實施例中， R^{10} 為被1-3個獨立經選擇之 R^{21} 基團取代之苯基，且 R^9 係選自包括咪唑基與被1-3個獨立經選擇之 R^{21} 基團取代之咪唑基。

於另一項具體實施例中， R^{10} 係選自包括雜芳基與被1-3個 R^{21} 基團取代之雜芳基，且 R^9 係選自包括雜芳基與被1-3個 R^{21} 基團取代之雜芳基，且其中各 R^{21} 係獨立經選擇。

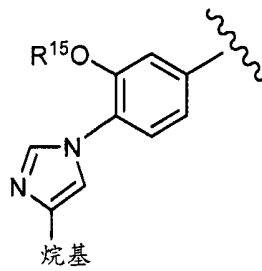
於另一項具體實施例中， R^{10} 係選自包括吡啶基與被1-3個 R^{21} 基團取代之吡啶基，且 R^9 係選自包括咪唑基與被1-3個 R^{21} 基團取代之咪唑基，且其中各 R^{21} 係獨立經選擇。

於另一項具體實施例中， R^{10} 為吡啶基，且 R^9 為被1-3個 R^{21} 基團取代之咪唑基，且其中各 R^{21} 係獨立經選擇。

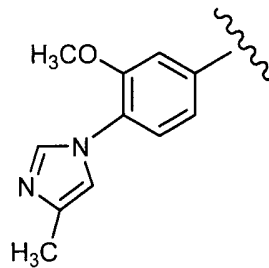
於另一項具體實施例中， R^9 - R^{10} -部份基團為：



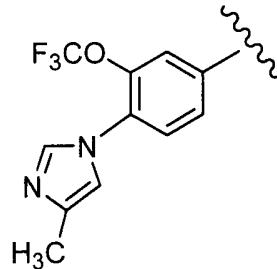
於另一項具體實施例中， R^9 - R^{10} -部份基團為：



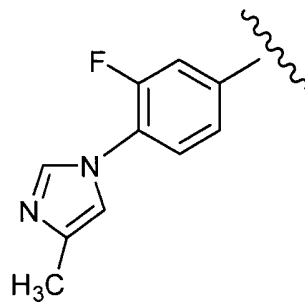
於另一項具體實施例中， R^9-R^{10} -部份基團為：



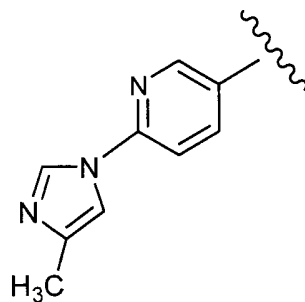
於另一項具體實施例中， R^9-R^{10} -部份基團為：



於另一項具體實施例中， R^9-R^{10} -部份基團為：



於另一項具體實施例中， R^9-R^{10} -部份基團為：



於另一項具體實施例中， R^9-R^{10} -部份基團為：

經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；且 R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

且

W係選自包括鍵結；-O-、-C(O)-、-S-、-S(O)-、-S(O₂)-及-C(R¹¹)(R¹²)-；

G係選自包括-C(R³)(R⁴)-、-C(O)-、-S-、-S(O)-、-S(O₂)-、-C(O)-O-及-N(R¹³)-；

V係選自包括鍵結、-O-及-N(R¹⁴)-；

R^1 (當 R^1 未接合至 R^2 時)、 R^2 (當 R^2 未接合至 R^1 或 R^6 時)、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 (當 R^6 未接合至 R^2 時)、 R^7 、 R^{11} 及 R^{12} 可為相同或不同，各獨立選自包括H、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R^{13} 係獨立選自包括H、烷基-、芳烷基-、雜芳烷基-、環

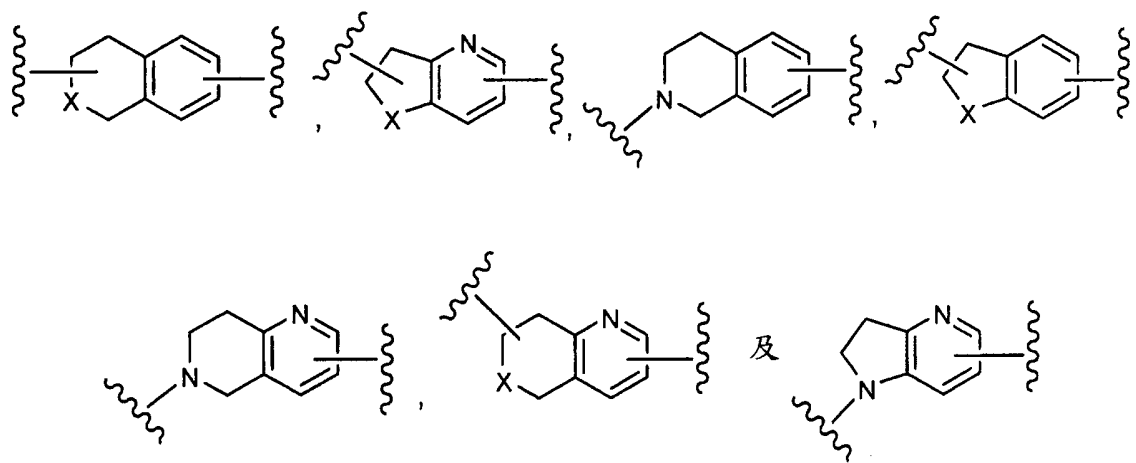
烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環
 烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、
 環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基-、芳基
 雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基、
 芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基-、芳基雜環烯基-、
 雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、
 雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、
 雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-、雜環烯基芳基-、 $-OR^{15}$ 、
 $-CN$ 、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^9$ 、 $-S(O)R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})(R^{12})$ 、
 $-S(O)N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-S(O)_2N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=C(R^8)_2$ 及
 $-N(R^8)_2$ ；且其中該 R^{13} 烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環烷基
 烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環烷基
 烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、環烷
 基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基、芳基雜環
 烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基、芳基
 環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基-、芳基雜環烯基-、
 雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、
 雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、
 雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-及雜環烯基芳基-係視情況
 被 1 至 5 個基團取代，取代基獨立選自包括：烷基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷
 基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、 $-CN$ 、
 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、
 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-CH(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、

-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-烷基
 -N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)-
 C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-R¹⁵；-CH₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、
 -N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)
 、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)-
 C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、
 -S(O)R¹⁵、=NOR¹⁵、-N₃、-NO₂及-S(O)₂R¹⁵；

R¹⁴係選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基
 烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、
 雜芳基、雜芳烷基-、-CN、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)
 (R¹⁶)、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶及
 -P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)；

R⁸係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷
 基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳
 烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及
 炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷
 基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-係為未
 經取代，或視情況獨立被1-3個可為相同或不同之取代基取
 代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R¹⁰係選自包括鍵結、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳
 烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜
 芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-及以下部份基團：



其中 X 為 O、N(R¹⁴) 或 S；

其中關於 R¹⁰ 之各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-，以及上文關於 R¹⁰ 所指之部份基團，可為未經取代，或視情況獨立被 1-3 個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括下文所示之部份基團；且

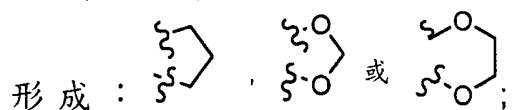
R⁹ 係選自包括烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-3 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

R¹⁵、R¹⁶ 及 R¹⁷ 係獨立選自包括 H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基-、芳基環烷基-、芳基雜環基-、R¹⁸-烷基、R¹⁸-環烷基、R¹⁸-環烷基烷基-、R¹⁸-雜環基、R¹⁸-

雜環基烷基-、 R^{18} -芳基、 R^{18} -芳烷基、 R^{18} -雜芳基及 R^{18} -雜芳烷基-；

R^{18} 為1-5個取代基，獨立選自包括烷基、烯基、炔基、芳基、芳烷基-、芳烯基-、芳基炔基-、 $-\text{NO}_2$ 、鹵基、雜芳基、HO-烷氧基烷基、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、烷基-CN、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{雜芳基})$ 、 $-\text{SR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{芳基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{雜環基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{O}$ -雜環基、 $-\text{O}$ -環烷基烷基、 $-\text{O}$ -雜環基烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})-(\text{雜芳烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 及 $-\text{N}(\text{烷基})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ ；

或者，在相鄰碳上之兩個 R^{18} 部份基團可連結在一起，以



R^{19} 為烷基、環烷基、芳基、芳烷基或雜芳烷基；

R^{20} 為烷基、環烷基、芳基、鹵基取代之芳基、芳烷基、雜芳基或雜芳烷基；

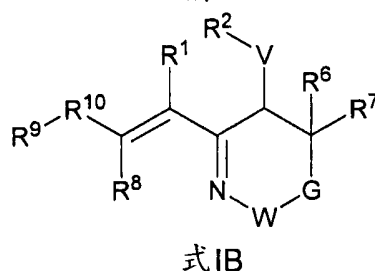
其中在 R^1 ， R^2 ， R^1-R^2 ， R^2-R^6 ， R^3 ， R^4 ， R^5 ， R^6 ， R^7 ， R^8 ， R^9 ， R^{10} ， R^{11} ， R^{12} 及 R^{14} 中之各烷基、環烷基、環烯基、環烷基烷基、

雜環基、雜環基烷基、芳基、芳烷基、烷基芳基、雜芳基、雜芳烷基、烯基及炔基係獨立為未經取代，或視情況被1至5個 R^{21} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-CH(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、-烷基- $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})-C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-R^{15}$ ； $-CH_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)-N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ 及 $-S(O)_2R^{15}$ ；

其中在 R^{21} 中之各烷基、環烯基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或被1至5個 R^{22} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、環烷基、環烯基、雜環基、芳基、雜芳基、鹵基、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、-烷基- $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、-烷基- $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})-C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)-$

$N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-N_3$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-NO_2$ 、 $-S(O)R^{15}$ 及 $-S(O)_2R^{15}$ 。

於另一項具體實施例中，本申請案係揭示式 I 化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 IB 之一般結構：



其中：

無論是

(i) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中：(a) 該環烷基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，(b) 該雜環基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及 (c) 該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(ii) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中：(a) 該環烷基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，(b) 該雜環基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇

之 R^{21} 取代基取代，及 (c) 該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(iii)

(a) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中：(1) 該環烷基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與 (2) 該雜環基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及

(b) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中：(1) 該環烷基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與 (2) 該雜環基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；及

(c) 該 R^2 與 R^6 環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(iv) R^6 與 $-C(R^3)(R^4)-G$ 部份基團之 R^3 或 R^4 之任一個係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中：(a) 該環烷基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，(b) 該雜環基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取

代，及(c)該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(v) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(a)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，(b)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及(c)該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；且

W係選自包括鍵結、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O_2)-$ 及 $-C(R^{11})(R^{12})-$ ；

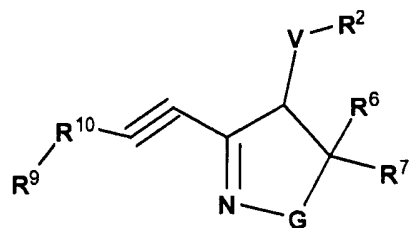
G係選自包括 $-C(R^3)(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O_2)-$ 、 $-C(O)-O-$ 及 $-N(R^{13})-$ ；

V係選自包括鍵結、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 及 $-N(R^{14})-$ ；

R^1 (當 R^1 未接合至 R^2 時)、 R^2 (當 R^2 未接合至 R^1 或 R^6 時)、 R^5 、 R^6 (當 R^6 未接合至 R^2 時)及 R^7 可為相同或不同，各獨立選自包括H、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，

或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

或者， R^1 (當 R^1 未接合至 R^2 時)與 R^8 係一起採用以形成鍵結 (意即有一個參鍵在 R^1 所結合之碳原子與 R^8 所結合之碳之間，意即，式I化合物為式IIA化合物：



式IIA

且 R^2 , R^5 , R^6 及 R^7 均如上文定義，而 R^3 , R^4 , R^{11} 及 R^{12} 均如下文定義)；

R^3 係選自包括H、鹵基 (且在一項實例中為F)、 $-OR^{15}$ (且在一項實例中， R^{15} 為H)、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之

部份基團；或

R^3 與 R^6 一起採用，形成鍵結(意即 R^3 與 R^6 形成一個鍵結在G與 R^6 所結合之碳之間)，其條件是，當 R^3 與 R^6 形成鍵結時：(1) W不為鍵結，(2) R^2 與 R^6 係未接合在一起，以形成環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團(如上文(ii)與(iii)中所述者)，(3) R^6 與 $-C(R^3)(R^4)-G$ 部份基團之 R^3 或 R^4 之任一個係未接合在一起，以形成環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團(如上文(iv)中所述者)，及(4) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係未接合在一起，以形成雜環基或雜環烯基部份基團(如上文(v)中所述者)；

R^4 、 R^{11} 及 R^{12} 可為相同或不同，各獨立選自包括H、鹵基(且在一項實例中為F)、 $-OR^{15}$ (且在一項實例中， R^{15} 為H)、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

其條件是，當 R^3 或 R^4 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ 時，則另一個不選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 及 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ (意即，若 R^3 或 R^4 之一為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$ ，則另一個不為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 及 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$)；

其條件是，當 R^{11} 或 R^{12} 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、

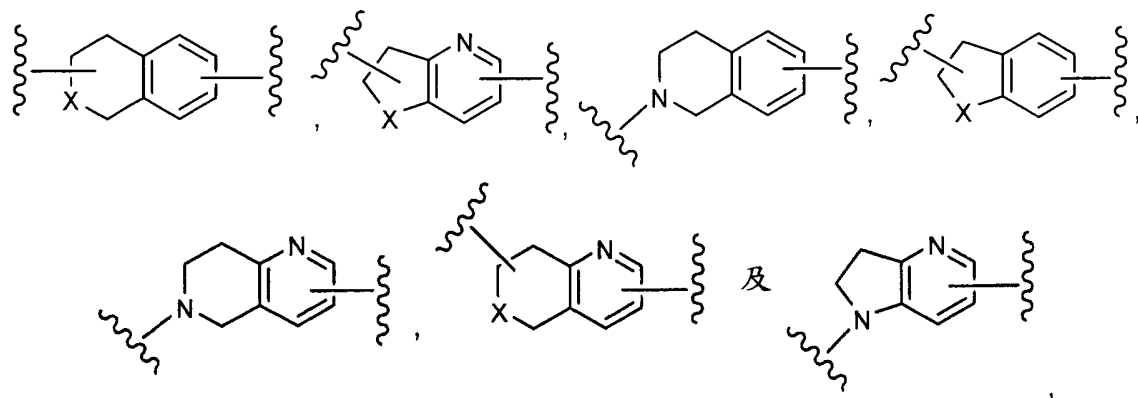
$-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、
 $=\text{NOR}^{15}$ 及 $-\text{N}_3$ 時，則另一個不選自包括： $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、
 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})-$
 $\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})$
 (R^{16}) 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 及
 $-\text{N}_3$ (意即，若 R^{11} 或 R^{12} 之一為 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2-$
 $\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$
 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 或 $-\text{N}_3$ ，則另一個不
 為 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、
 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、
 $=\text{NOR}^{15}$ 或 $-\text{N}_3$)；

R^8 係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-係視情況被1-3個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；

R^9 係選自包括烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、

雜環基-及雜環基烷基-，其中各 R^9 係視情況被1-3個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；

R^{10} 係選自包括鍵結、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-及以下部份基團：



其中X為O、 $N(R^{14})$ 或S；

其中各 R^{10} 基團(惟鍵結除外)係視情況被1-3個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；

R^{13} 係獨立選自包括H、烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基-、芳基雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基、芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基-、芳基雜環烯基-、雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-、雜環烯基芳基-、 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^9$ 、 $-S(O)R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-S(O)N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-S(O)_2N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=C(R^8)_2$ 及

-N(R⁸)₂；且其中該R¹³烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環烷基
 烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環烷基
 烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、環烷
 基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基、芳基雜環
 烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基、芳基
 環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基-、芳基雜環烯基-、
 雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、
 雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、
 雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-及雜環烯基芳基-係視情況
 被1至5個基團取代，取代基獨立選自包括：烷基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷
 基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、-CN、
 -OR¹⁵、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-SR¹⁵、
 -S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-CH(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、
 -C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-烷基
 -N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)-
 C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-R¹⁵；-CH₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、
 -N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)
 、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)-
 C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、
 -S(O)R¹⁵、=NOR¹⁵、-N₃、-NO₂及-S(O)₂R¹⁵；

R¹⁴係選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基
 烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、
 雜芳基、雜芳烷基-、-CN、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、

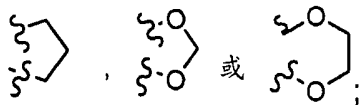
$-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 及 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ ，其中各該烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基及雜芳烷基-係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；

R^{15} 、 R^{16} 及 R^{17} 係獨立選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基-、芳基環烷基-、芳基雜環基-、 R^{18}_r -烷基、 R^{18}_r -環烷基、 R^{18}_r -環烷基烷基-、 R^{18}_r -雜環基、 R^{18}_r -雜環基烷基-、 R^{18}_r -芳基、 R^{18}_r -芳烷基、 R^{18}_r -雜芳基及 R^{18}_r -雜芳烷基-，其中r為1-5；

各 R^{18} 係獨立選自包括烷基、烯基、炔基、芳基、芳烷基-、芳烯基-、芳基炔基-、 $-\text{NO}_2$ 、鹵基、雜芳基、HO-烷氧基烷基、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、烷基-CN、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{雜芳基})$ 、 $-\text{SR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{芳基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{雜環基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{O}$ -雜環基、 $-\text{O}$ -環烷基烷基、 $-\text{O}$ -雜環基烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})(\text{雜芳烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 及 $-\text{N}(\text{烷基})$

基) $S(O)_2N$ (烷基)(烷基)；

或者，在相鄰碳上之兩個 R^{18} 部份基團可連結在一起，以形成：



R^{19} 係選自包括烷基、環烷基、芳基、芳烷基-及雜芳烷基-；

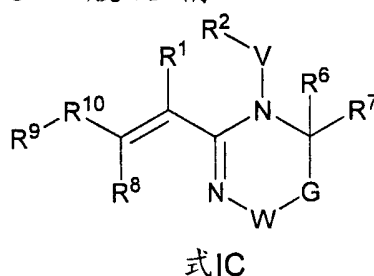
R^{20} 係選自包括烷基、環烷基、芳基、經鹵基取代之芳基、芳烷基-、雜芳基或雜芳烷基-；

各 R^{21} 係獨立選自包括烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-CH(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、-烷基- $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-R^{15}$ 、 $-CH_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ 及 $-S(O)_2R^{15}$ ；且其中各 R^{21} 烷基、環烯基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係視情況被1至5個獨立經選擇之 R^{22} 基團取代；且

各 R^{22} 係獨立選自包括烷基、環烷基、環烯基、雜環基、

芳基、雜芳基、鹵基、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、
 $-\text{烷基}-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、
 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(\text{=NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{烷基}-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})-$
 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})-$
 $\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{N}_3$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 及
 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示式 II 化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 IC 之一般結構：



其中：

無論是 (i) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或 (ii) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜

環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或(iii) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；且 R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

且

W係選自包括鍵結、-O-、-C(O)-、-S-、-S(O)-、-S(O₂)-及-C(R¹¹)(R¹²)-；

G係選自包括-C(R³)(R⁴)-、-C(O)-、-S-、-S(O)-、-S(O₂)-、-C(O)-O-及-N(R¹³)-；

V係選自包括鍵結、-O-及-N(R¹⁴)-；

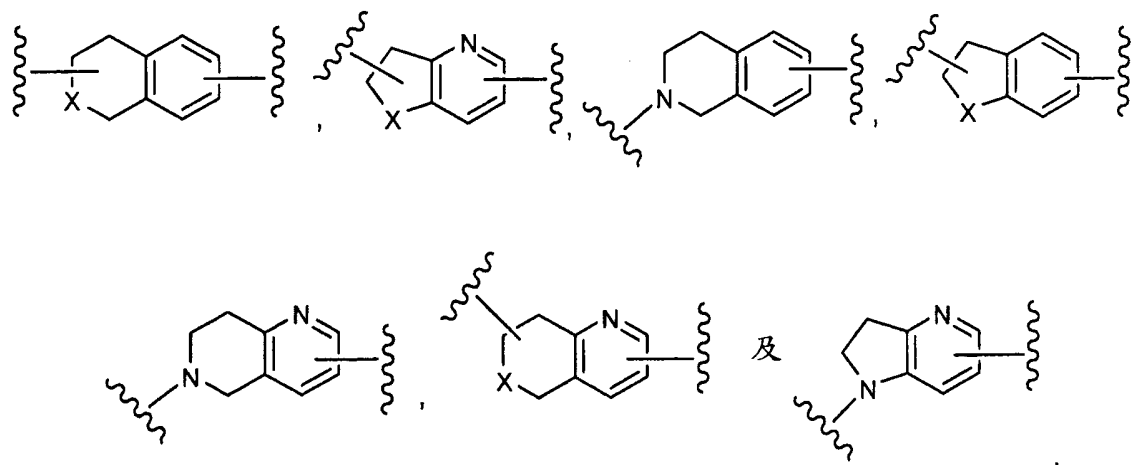
R^1 (當 R^1 未接合至 R^2 時)、 R^2 (當 R^2 未接合至 R^1 或 R^6 時)、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 (當 R^6 未接合至 R^2 時)、 R^7 、 R^{11} 及 R^{12} 可為相同或不同，各獨立選自包括H、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-

環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R^{14} 係選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、環烯基、雜環基、雜環基烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、-CN、-C(O) R^{15} 、-C(O)OR ^{15} 、-C(O)N(R^{15})(R^{16})、-S(O)N(R^{15})(R^{16})、-S(O) $_2$ N(R^{15})(R^{16})、-C(=NOR ^{15}) R^{16} 及-P(O)(OR ^{15})(OR ^{16})；

R^8 係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-係為未經取代，或視情況獨立被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R^{10} 係選自包括鍵結、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-及以下部份基團：



其中 X 為 O、N(R¹⁴) 或 S；

其中關於 R¹⁰ 之各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-，以及上文關於 R¹⁰ 所指之部份基團，可為未經取代，或視情況獨立被 1-3 個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括下文所示之部份基團；且

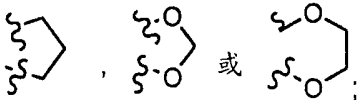
R⁹ 係選自包括烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-3 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

R¹⁵、R¹⁶ 及 R¹⁷ 係獨立選自包括 H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、芳基環烷基-、芳基雜環基-、R¹⁸-烷基、R¹⁸-環烷基、R¹⁸-環烷基烷基、R¹⁸-雜環基、R¹⁸-

雜環基烷基、 R^{18} -芳基、 R^{18} -芳烷基、 R^{18} -雜芳基及 R^{18} -雜芳烷基；

R^{18} 為1-5個取代基，獨立選自包括烷基、烯基、炔基、芳基、芳烷基-、芳烯基-、芳基炔基-、 $-\text{NO}_2$ 、鹵基、雜芳基、 HO -烷氧基烷基、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、烷基- CN 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{雜芳基})$ 、 $-\text{SR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{芳基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{雜環基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{O}$ -雜環基、 $-\text{O}$ -環烷基烷基、 $-\text{O}$ -雜環基烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})-(\text{雜芳烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 及 $-\text{N}(\text{烷基})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ ；

或者，在相鄰碳上之兩個 R^{18} 部份基團可連結在一起，以形成：



R^{19} 為烷基、環烷基、芳基、芳烷基或雜芳烷基；

R^{20} 為烷基、環烷基、芳基、鹵基取代之芳基、芳烷基、雜芳基或雜芳烷基；

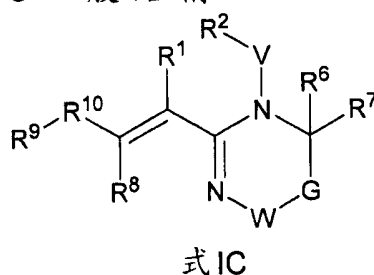
其中在 R^1 ， R^2 ， R^1-R^2 ， R^2-R^6 ， R^3 ， R^4 ， R^5 ， R^6 ， R^7 ， R^8 ， R^9 ， R^{10} ， R^{11} ， R^{12} 及 R^{14} 中之各烷基、環烷基、環烯基、環烷基烷基、

雜環基、雜環基烷基、芳基、芳烷基、烷基芳基-、雜芳基、雜芳烷基、烯基及炔基係獨立為未經取代，或視情況被1至5個 R^{21} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-CH(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、-烷基、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-R^{15}$ 、 $-CH_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ 及 $-S(O)_2R^{15}$ ；

其中在 R^{21} 中之各烷基、環烯基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或被1至5個 R^{22} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、環烷基、環烯基、雜環基、芳基、雜芳基、鹵基、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、-烷基、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、-烷基、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、

-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、
 -N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)-
 C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-N₃、
 =NOR¹⁵、-NO₂、-S(O)R¹⁵及-S(O)₂R¹⁵。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示式I化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式IC之一般結構：



其中：

無論是

(i) R¹與R²係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(a)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之R²¹取代基取代，(b)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之R²¹取代基取代，及(c)該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之R²¹取代基取代；或

(ii) R²與R⁶係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(a)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之R²¹取代

基取代，(b)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及(c)該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(iii)

(a) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(1)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與(2)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及

(b) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(1)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與(2)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；及

(c)該 R^2 與 R^6 環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(iv) R^6 與 $-C(R^3)(R^4)-G$ 部份基團之 R^3 或 R^4 之任一個係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(a)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，(b)該雜環

基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及 (c) 該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(v) R^6 與 $-N(R^{13})-$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中：(a) 該環烷基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，(b) 該雜環基部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及 (c) 該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；且

W 係選自包括鍵結、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O_2)-$ 及 $-C(R^{11})(R^{12})-$ ；

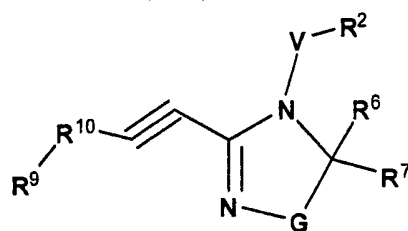
G 係選自包括 $-C(R^3)(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O_2)-$ 、 $-C(O)-O-$ 及 $-N(R^{13})-$ ；

V 係選自包括鍵結、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 及 $-N(R^{14})-$ ；

R^1 (當 R^1 未接合至 R^2 時)、 R^2 (當 R^2 未接合至 R^1 或 R^6 時)、 R^5 、 R^6 (當 R^6 未接合至 R^2 時) 及 R^7 可為相同或不同，各獨立選自包括 H、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜

芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

或者， R^1 (當 R^1 未接合至 R^2 時)與 R^8 係一起採用以形成鍵結 (意即有一個參鍵在 R^1 所結合之碳原子與 R^8 所結合之碳之間，意即，式I化合物為式II化合物：



式II B

且 R^2 , R^5 , R^6 及 R^7 均如上文定義，而 R^3 , R^4 , R^{11} 及 R^{12} 均如下文定義)；

R^3 係選自包括H、鹵基 (且在一項實例中為F)、 $-OR^{15}$ (且在一項實例中， R^{15} 為H)、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)-OR^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或

不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或

R^3 與 R^6 一起採用，形成鍵結(意即 R^3 與 R^6 形成一個鍵結在G與 R^6 所結合之碳之間)，其條件是，當 R^3 與 R^6 形成鍵結時：

(1) W不為鍵結，(2) R^2 與 R^6 係未接合在一起，以形成環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團(如上文(ii)與(iii)中所述者)，(3) R^6 與 $-C(R^3)(R^4)-G$ 部份基團之 R^3 或 R^4 之任一個係未接合在一起，以形成環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團(如上文(iv)中所述者)，及(4) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係未接合在一起，以形成雜環基或雜環烯基部份基團(如上文(v)中所述者)；

R^4 、 R^{11} 及 R^{12} 可為相同或不同，各獨立選自包括H、鹵基(且在一項實例中為F)、 $-OR^{15}$ (且在一項實例中， R^{15} 為H)、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取

代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

其條件是，當 R^3 或 R^4 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ 時，則另一個不選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 及 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ (意即，若 R^3 或 R^4 之一為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$ ，則另一個不為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 及 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$)；

其條件是，當 R^{11} 或 R^{12} 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、

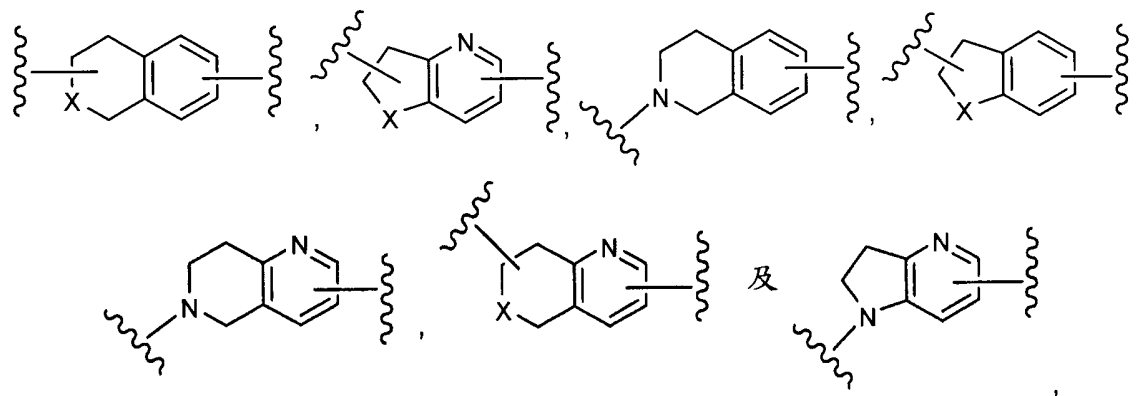
$-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、
 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、
 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ 時，則另一個不選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、
 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、
 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)-$
 $N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})$
 (R^{16}) 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ (意
 即，若 R^{11} 或 R^{12} 之一為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、
 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2-$
 $N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、
 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$
 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$ ，則另一個不
 為 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$
 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$
 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、
 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、
 $=NOR^{15}$ 或 $-N_3$)；

R^8 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、
 烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳
 烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-、
 炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷
 基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-係視情
 況被 1-3 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；

R^9 係選自包括烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、

烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-係視情況被1-3個獨立經選擇之可為相同或不同之 R^{21} 取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

R^{10} 係選自包括鍵結、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-及以下部份基團：



其中X為O、 $N(R^{14})$ 或S；

其中各該 R^{10} 部份基團(惟鍵結除外)係視情況被1-3個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括下文所示之部份基團；且

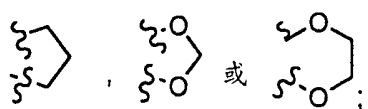
R^{14} 係選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、環烯基、雜環基、雜環基烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、-CN、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 及 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ ，其中各該烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、環烯基、雜環基、雜環基烷基、芳基、芳烷

基、雜芳基、雜芳烷基係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；

R^{15} 、 R^{16} 及 R^{17} 係獨立選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、芳基環烷基-、芳基雜環基-、 $(R^{18})_r$ -烷基、 $(R^{18})_r$ -環烷基、 $(R^{18})_r$ -環烷基烷基、 $(R^{18})_r$ -雜環基、 $(R^{18})_r$ -雜環基烷基、 $(R^{18})_r$ -芳基、 $(R^{18})_r$ -芳烷基、 $(R^{18})_r$ -雜芳基及 $(R^{18})_r$ -雜芳烷基，其中r為1-5；

各 R^{18} 係獨立選自包括烷基、烯基、炔基、芳基、芳烷基-、芳烯基-、芳基炔基-、 $-NO_2$ 、鹵基、雜芳基、HO-烷氧基烷基、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、烷基-CN、 $-C(O)R^{19}$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OR^{19}$ 、 $-C(O)NHR^{20}$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(O)NH_2-C(O)N(烷基)_2$ 、 $-C(O)N(烷基)(芳基)$ 、 $-C(O)N(烷基)(雜芳基)$ 、 $-SR^{19}$ 、 $-S(O)_2R^{20}$ 、 $-S(O)NH_2$ 、 $-S(O)NH(烷基)$ 、 $-S(O)N(烷基)(烷基)$ 、 $-S(O)NH(芳基)$ 、 $-S(O)_2NH_2$ 、 $-S(O)_2NHR^{19}$ 、 $-S(O)_2NH(雜環基)$ 、 $-S(O)_2N(烷基)_2$ 、 $-S(O)_2N(烷基)(芳基)$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{20}$ 、 $-O$ -雜環基、 $-O$ -環烷基烷基、 $-O$ -雜環基烷基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{20}$ 、 $-N(烷基)_2$ 、 $-N(芳烷基)_2$ 、 $-N(芳烷基)-(雜芳烷基)$ 、 $-NHC(O)R^{20}$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NHC(O)NH(烷基)$ 、 $-NHC(O)N(烷基)(烷基)$ 、 $-N(烷基)C(O)NH(烷基)$ 、 $-N(烷基)C(O)N(烷基)(烷基)$ 、 $-NHS(O)_2R^{20}$ 、 $-NHS(O)_2NH(烷基)$ 、 $-NHS(O)_2N(烷基)(烷基)$ 、 $-N(烷基)S(O)_2NH(烷基)$ 及 $-N(烷基)S(O)_2N(烷基)(烷基)$ ；

或者，在相鄰碳上之兩個 R^{18} 部份基團可連結在一起，以

形成：;

R^{19} 係選自包括烷基、環烷基、芳基、芳烷基-及雜芳烷基-；

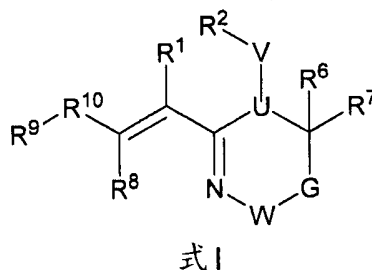
R^{20} 係選自包括烷基、環烷基、芳基、鹵基取代之芳基、芳烷基-、雜芳基及雜芳烷基-；

各 R^{21} 係獨立選自包括烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{CH}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{烷基}-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})-\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{R}^{15}$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 、 $-\text{N}_3$ 、 $-\text{NO}_2$ 及 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ ；且其中各 R^{21} 烷基、環烯基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係視情況被1至5個獨立經選擇之 R^{22} 基團取代；且

各 R^{22} 係獨立選自包括烷基、環烷基、環烯基、雜環基、芳基、雜芳基、鹵基、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{烷基}-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、

-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、
 -N(R¹⁵)(R¹⁶)、-烷基-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)-
 C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶
 、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)-
 N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、
 -CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-N₃、=NOR¹⁵、-NO₂、-S(O)R¹⁵及
 -S(O)₂R¹⁵。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中U為C(R⁵)；

R¹為H；

R²與R⁶係連接以形成4-7員環烷基環；

R⁷為3-(1,1'-聯苯基)-基；

R⁸為H；

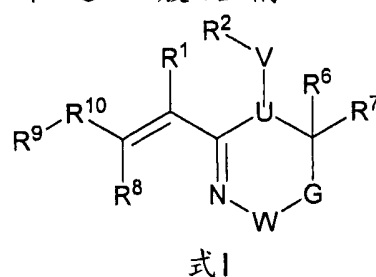
R⁵係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未

經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 為苯基；且

R^9 為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中U為 $C(R^5)$ ；

R^6 為H；

R^1 與 R^2 係連接以形成4-7員環烷基環；

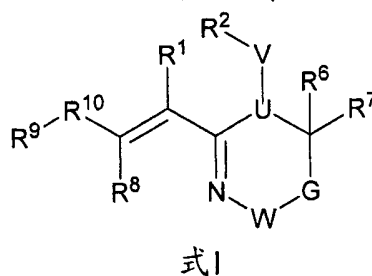
R^7 為3-(1,1'-聯苯基)-基；

R^8 為H；

R^5 係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 為苯基；且

化合物具有式I中所示之一般結構：



其中U為C(R⁵)；

R⁶為H；

R¹與R²係連接以形成5-8員雜環基環；

R⁷為3-(1,1'-聯苯基)-基；

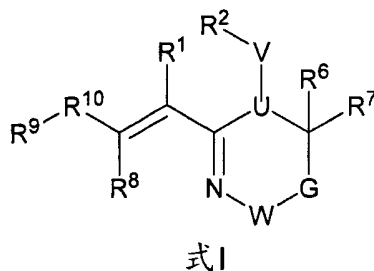
R⁸為H；

R⁵係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰為苯基；且

R⁹為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中 U 為 C(R⁵) 或 N；

R¹ 與 R² 係連接以形成 5-8 員雜環基環；

R² 與 R⁶ 係連接以形成 5-8 員雜環基環；

R⁷ 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

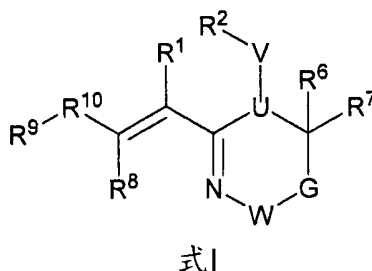
R⁸ 為 H；

R⁵ 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰ 為苯基；且

R⁹ 為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中 U 為 $C(R^5)$ ；

R^2 與 R^6 係連接以形成 4-7 員環烷基環；

R^1 與 R^2 係連接以形成 4-7 員環烷基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

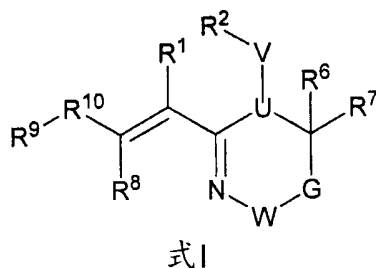
R^8 為 H；

R^5 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 為苯基；且

R^9 為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中 U 為 $C(R^5)$ 或 N；

R^1 與 R^2 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^2 與 R^6 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

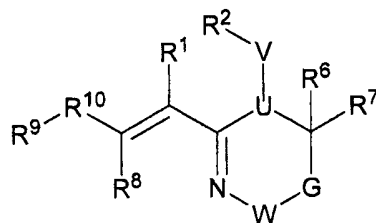
R^8 為 H；

R^5 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 為苯基；且

R^9 為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



式 I

其中 U 為 N；

R^1 與 R^2 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^2 與 R^6 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

R^8 為 H；

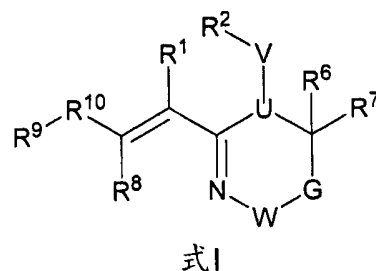
R^5 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-

基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 為苯基；且

R^9 為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中U為C(R^5)或N；

R^1 與 R^2 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^2 與 R^6 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^7 為3-(1,1'-聯苯基)-基；

R^8 為H；

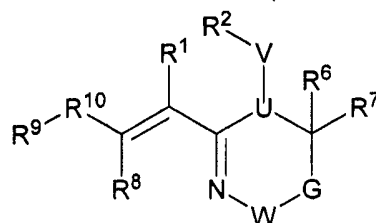
R^5 係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-

基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 為苯基；且

R^9 為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



式I

其中U為C(R^5)或N；

R^1 與 R^2 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^2 與 R^6 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^7 為3-(1,1'-聯苯基)-基；

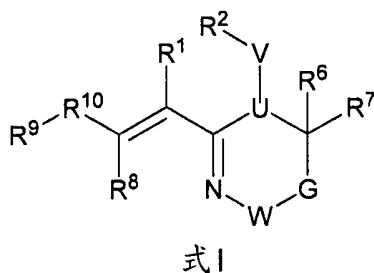
R^8 為H；

R^5 係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 為苯基；且

R^9 為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中 U 為 $C(R^5)$ ；

R^1 與 R^2 係連接以形成環己基環；

R^2 與 R^6 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

R^8 為 H；

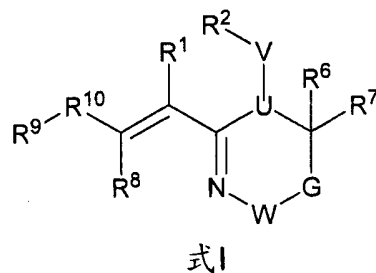
R^5 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 為苯基；且

R^9 為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化

化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中U為C(R⁵)；

R¹與R²係連接以形成環己基環；

R²與R⁶係連接以形成六氫吡啶基環；

R⁷為3-(1,1'-聯苯基)-基；

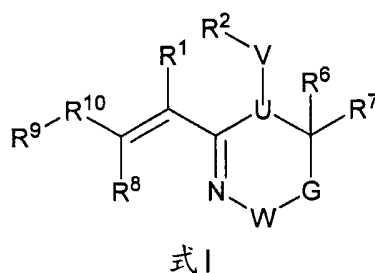
R⁸為H；

R⁵係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰為苯基；且

R⁹為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中 U 為 C(R⁵)；

R¹與 R²係連接以形成六氫吡啶基環；

R²與 R⁶係連接以形成環己基環；

R⁷為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

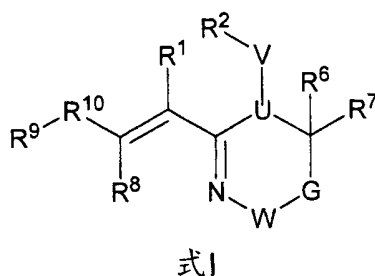
R⁸為 H；

R⁵係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰為苯基；且

R⁹為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中 U 為 $C(R^5)$ ；

R^1 與 R^2 係連接以形成六氫吡咩基環；

R^2 與 R^6 係連接以形成環己基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

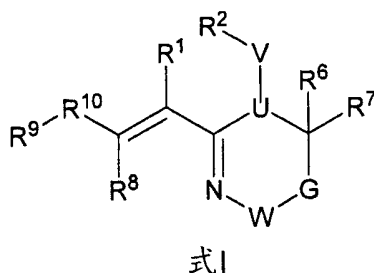
R^8 為 H；

R^5 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 為苯基；且

R^9 為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中 U 為 $C(R^5)$ 或 N；

R^6 為 H；

R^1 與 R^2 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

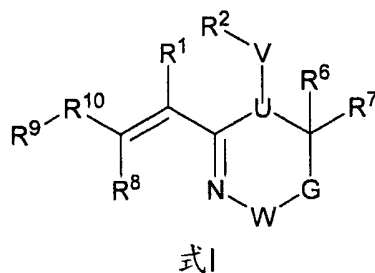
R^8 為 H；

R^5 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 為苯基；且

R^9 為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中 U 為 C(R^5)或 N；

R^6 為 H；

R^1 與 R^2 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

R^8 為 H；

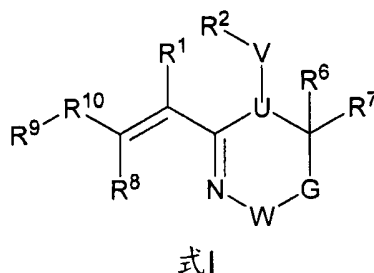
R^5 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-

基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 為苯基；且

R^9 為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中U為C(R^5)或N；

R^1 為H；

R^6 與 R^2 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^7 為3-(1,1'-聯苯基)-基；

R^8 為H；

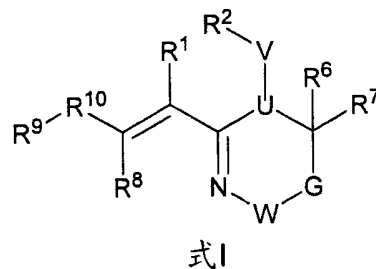
R^5 係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-

基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 為苯基；且

R^9 為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中U為C(R^5)或N；

R^1 為H；

R^6 與 R^2 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^7 為3-(1,1'-聯苯基)-基；

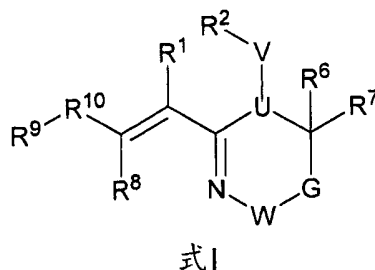
R^8 為H；

R^5 係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 為苯基；且

R^9 為咪唑-1-基，且其他部份基團均如前文定義。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中 U 為 $C(R^5)$ ；

R^1 為 H；

R^2 與 R^6 係連接以形成 4-7 員環烷基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

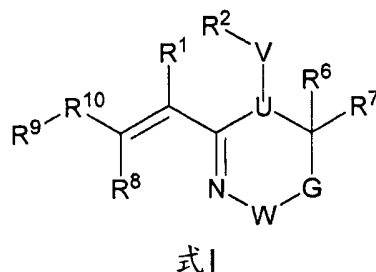
R^8 為 H；

R^5 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基(且在一項實例中， R^{10} 為 3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中， R^{10} 為 3-F-苯基)；

R^9 為 4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中 U 為 $C(R^5)$ ；

R^6 為 H；

R^1 與 R^2 係連接以形成 4-7 員環烷基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

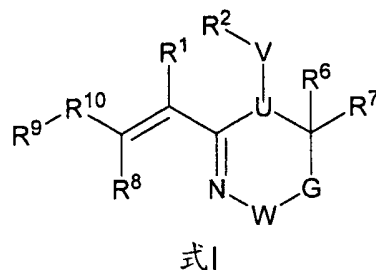
R^8 為 H；

R^5 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基（且在一項實例中， R^{10} 為 3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中， R^{10} 為 3-F-苯基）；

R^9 為 4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中U為C(R⁵)或N；

R¹為H；

R²與R⁶係連接以形成5-8員雜環基環；

R⁷為3-(1,1'-聯苯基)-基；

R⁸為H；

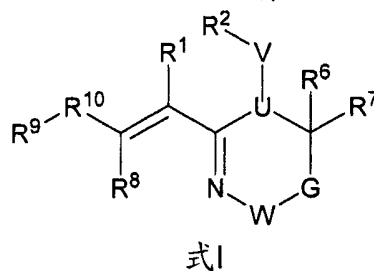
R⁵係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰係選自包括：3-甲氧基-苯基與3-F-苯基(且在一項實例中，R¹⁰為3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰為3-F-苯基)；

R⁹為4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化

合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中U為C(R⁵)；

R⁶為H；

R¹與R²係連接以形成5-8員雜環基環；

R⁷為3-(1,1'-聯苯基)-基；

R⁸為H；

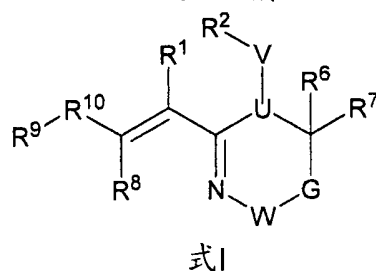
R⁵係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰係選自包括：3-甲氧基-苯基與3-F-苯基(且在一項實例中，R¹⁰為3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰為3-F-苯基)；

R⁹為4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該

化合物具有式I中所示之一般結構：



其中 U 為 $C(\mathbb{R}^5)$ 或 N ;

R^1 與 R^2 係連接以形成 5-8 員雜環基環；

R^2 與 R^6 係連接以形成 5-8 員雜環基環；

R⁷ 為 3-(1,1'-聯 苯 基)-基 ；

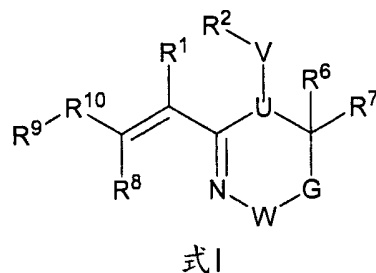
 R^8 為 H ;

R⁵係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰係選自包括：3-甲氧基-苯基與3-F-苯基(且在一項實例中，R¹⁰為3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰為3-F-苯基)；

R⁹ 為 4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中 U 為 C(R⁵)；

R²與 R⁶係連接以形成 4-7 員環烷基環；

R¹與 R²係連接以形成 4-7 員環烷基環；

R⁷為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

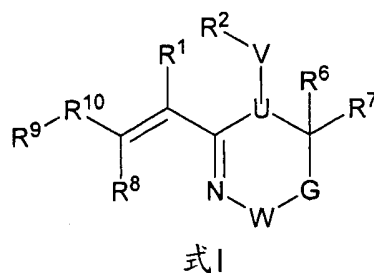
R⁸為 H；

R⁵係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基(且在一項實例中，R¹⁰為 3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰為 3-F-苯基)；

R⁹為 4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中 U 為 C(R⁵) 或 N；

R¹ 與 R² 係連接以形成六氫吡啶基環；

R² 與 R⁶ 係連接以形成六氫吡啶基環；

R⁷ 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

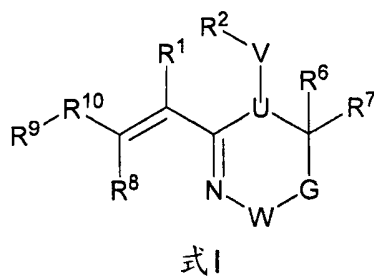
R⁸ 為 H；

R⁵ 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰ 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基(且在一項實例中，R¹⁰ 為 3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰ 為 3-F-苯基)；

R⁹ 為 4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中 U 為 N；

R^1 與 R^2 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^2 與 R^6 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

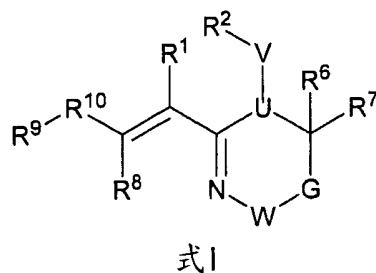
R^8 為 H；

R^5 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R^{10} 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基(且在一項實例中， R^{10} 為 3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中， R^{10} 為 3-F-苯基)；

R^9 為 4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中 U 為 C(R⁵) 或 N；

R¹ 與 R² 係連接以形成六氫吡啶基環；

R² 與 R⁶ 係連接以形成六氫吡啶基環；

R⁷ 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

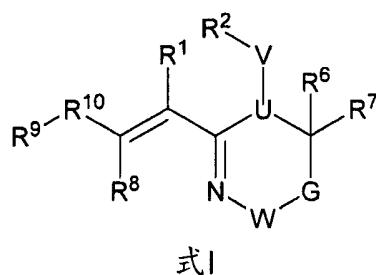
R⁸ 為 H；

R⁵ 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰ 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基（且在一項實例中，R¹⁰ 為 3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰ 為 3-F-苯基）；

R⁹ 為 4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中 U 為 $C(R^5)$ 或 N ;

R^1 與 R^2 係連接以形成六氫吡咭基環；

R²與R⁶係連接以形成六氫吡啶基環；

R⁷ 為 3-(1,1'-聯 苯 基)-基 ；

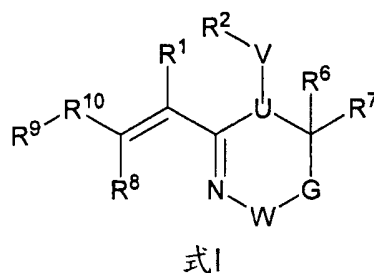
 R^8 為 H ;

R⁵係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰係選自包括：3-甲氧基-苯基與3-F-苯基(且在一項實例中，R¹⁰為3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰為3-F-苯基)；

R⁹ 為 4-甲 基 -咪 唑 基 -1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中 U 為 C(R⁵)；

R¹與 R²係連接以形成環己基環；

R²與 R⁶係連接以形成六氫吡啶基環；

R⁷為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

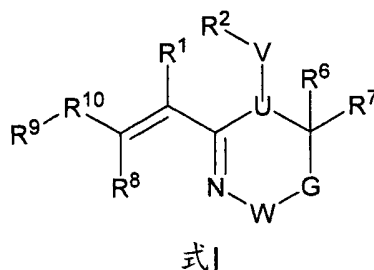
R⁸為 H；

R⁵係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基(且在一項實例中，R¹⁰為 3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰為 3-F-苯基)；

R⁹為 4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中U為C(R⁵)；

R¹與R²係連接以形成環己基環；

R²與R⁶係連接以形成六氫吡咩基環；

R⁷為3-(1,1'-聯苯基)-基；

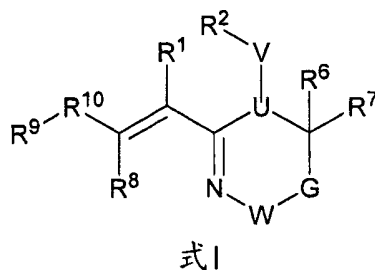
R⁸為H；

R⁵係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰係選自包括：3-甲氧基-苯基與3-F-苯基(且在一項實例中，R¹⁰為3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰為3-F-苯基)；

R⁹為4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中 U 為 C(R⁵)；

R¹ 與 R² 係連接以形成六氫吡啶基環；

R² 與 R⁶ 係連接以形成環己基環；

R⁷ 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

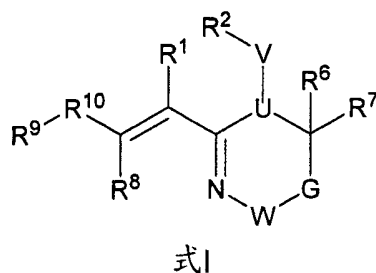
R⁸ 為 H；

R⁵ 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰ 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基(且在一項實例中，R¹⁰ 為 3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰ 為 3-F-苯基)；

R⁹ 為 4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中 U 為 C(R⁵)；

R¹ 與 R² 係連接以形成六氫吡啶基環；

R² 與 R⁶ 係連接以形成環己基環；

R⁷ 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

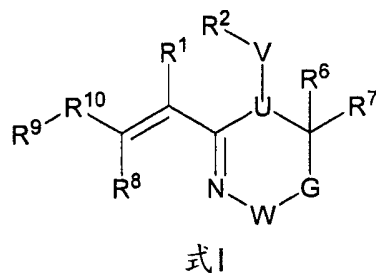
R⁸ 為 H；

R⁵ 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰ 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基(且在一項實例中，R¹⁰ 為 3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰ 為 3-F-苯基)；

R⁹ 為 4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中 U 為 C(R⁵) 或 N；

R⁶ 為 H；

R¹ 與 R² 係連接以形成六氫吡啶基環；

R⁷ 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

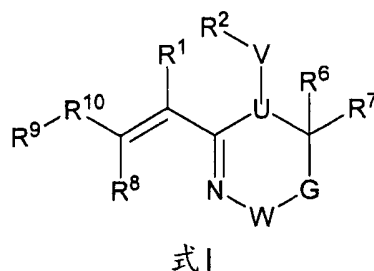
R⁸ 為 H；

R⁵ 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰ 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基(且在一項實例中，R¹⁰ 為 3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰ 為 3-F-苯基)；

R⁹ 為 4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中 U 為 C(R⁵) 或 N；

R⁶ 為 H；

R¹ 與 R² 係連接以形成六氫吡咭基環；

R⁷ 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

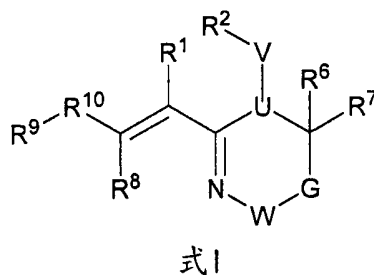
R⁸ 為 H；

R⁵ 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰ 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基(且在一項實例中，R¹⁰ 為 3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰ 為 3-F-苯基)；

R⁹ 為 4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式 I 中所示之一般結構：



其中 U 為 $C(R^5)$ 或 N ;

R^1 為 H ;

R⁶與R²係連接以形成六氫吡啶基環；

R⁷ 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

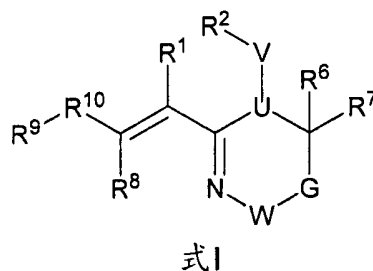
 R^8 為 H ;

R⁵係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

R¹⁰係選自包括：3-甲氧基-苯基與3-F-苯基(且在一項實例中，R¹⁰為3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰為3-F-苯基)；

R⁹ 為 4-甲基-咪唑基-1-基。

於另一項具體實施例中，本發明係揭示化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有式I中所示之一般結構：



其中 U 為 C(R⁵) 或 N；

R¹ 為 H；

R⁶ 與 R² 係連接以形成六氫吡啶基環；

R⁷ 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

R⁸ 為 H；

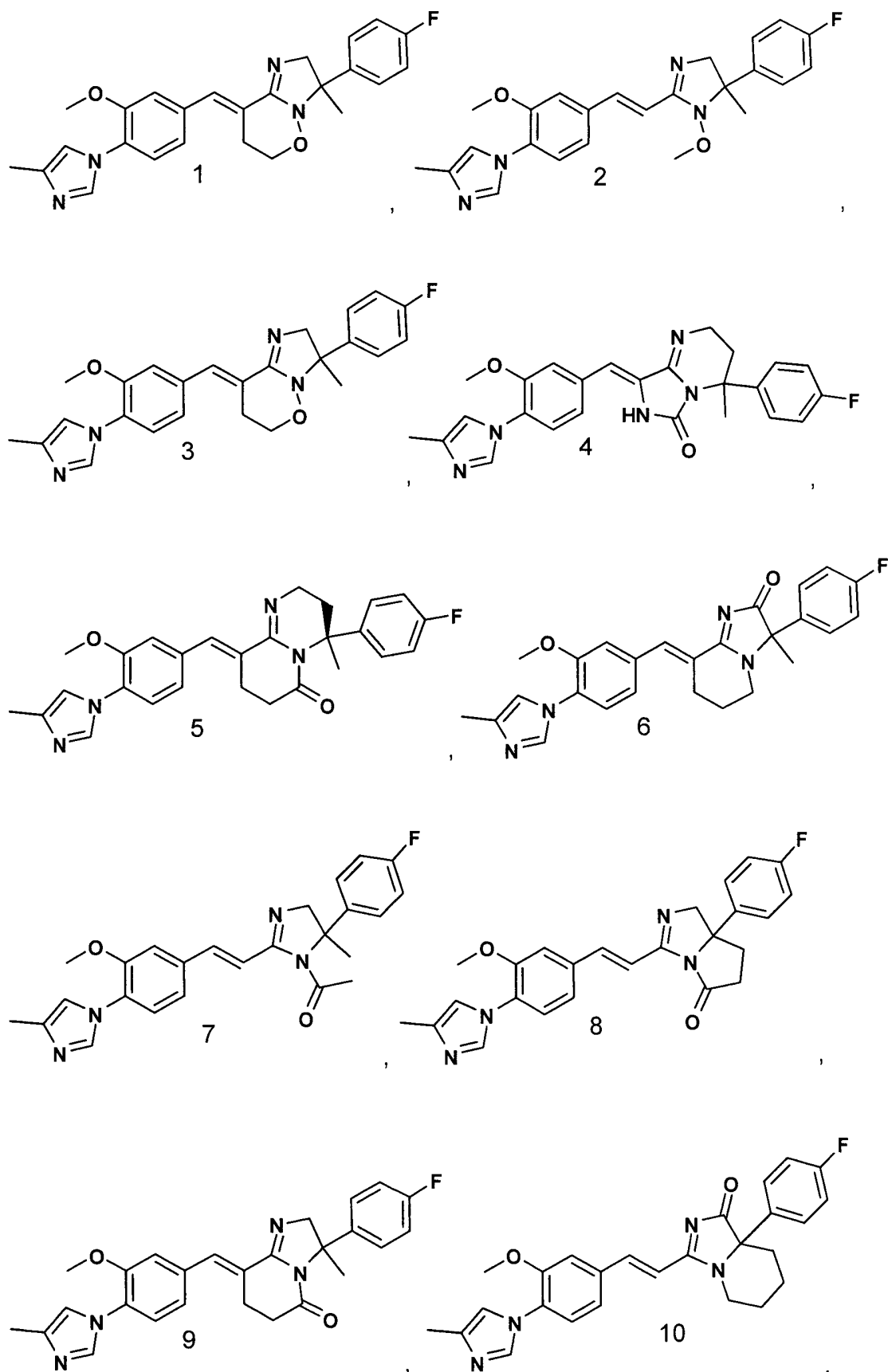
R⁵ 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括前文所述之部份基團；

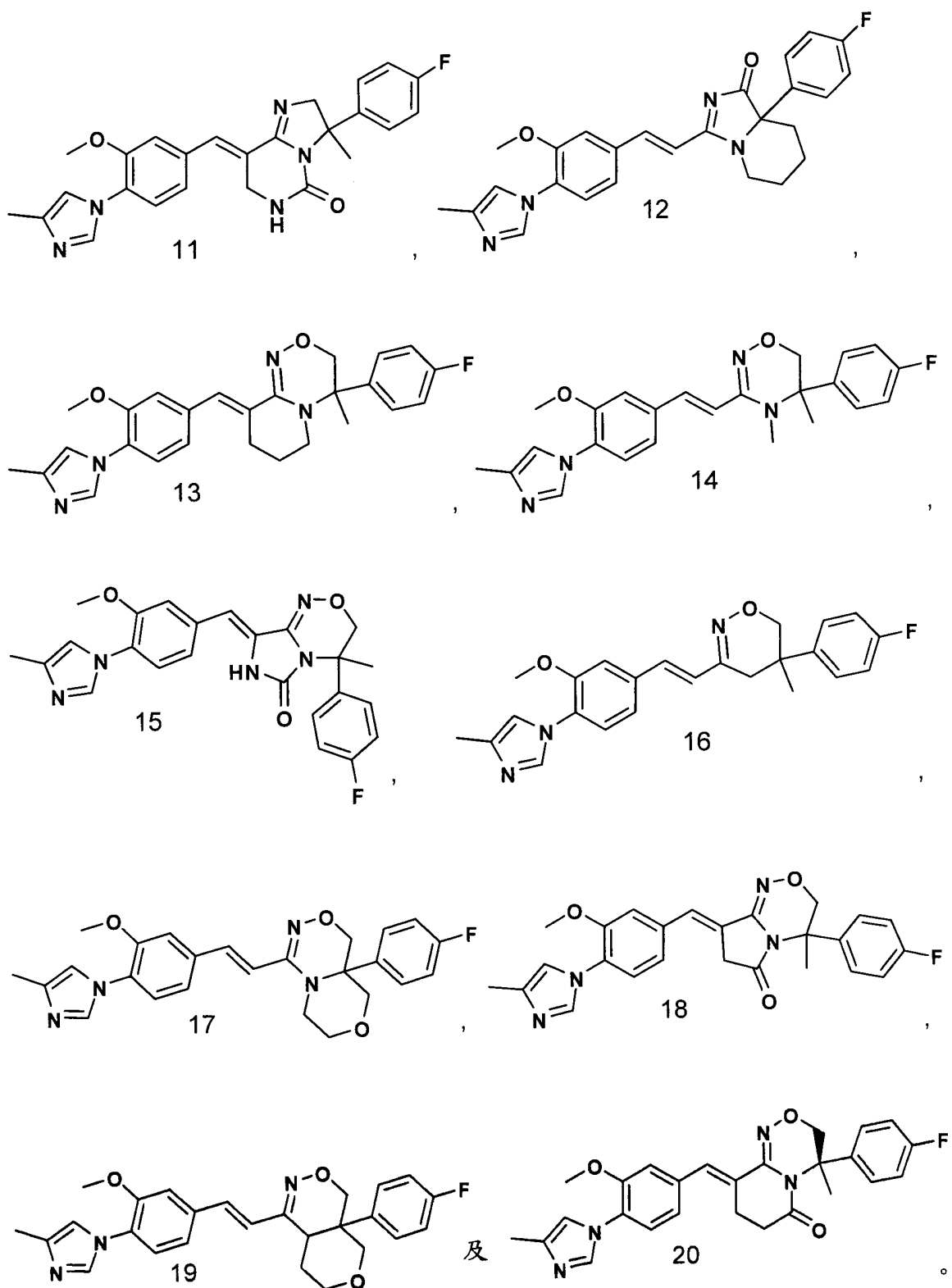
R¹⁰ 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基(且在一項實例中，R¹⁰ 為 3-甲氧基-苯基，而在另一項實例中，R¹⁰ 為 3-F-苯基)；

R⁹ 為 4-甲基-咪唑基-1-基。

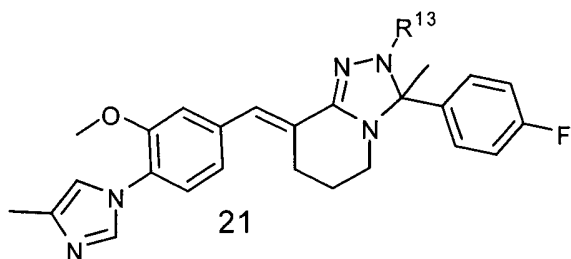
本發明化合物之說明例基團係示於表 1 中。

表 1

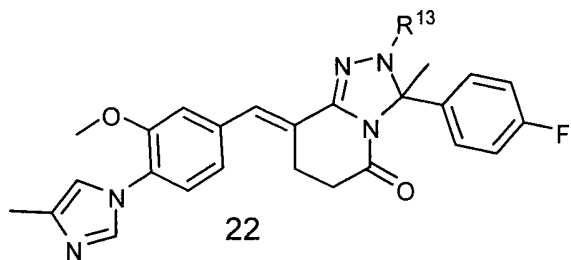




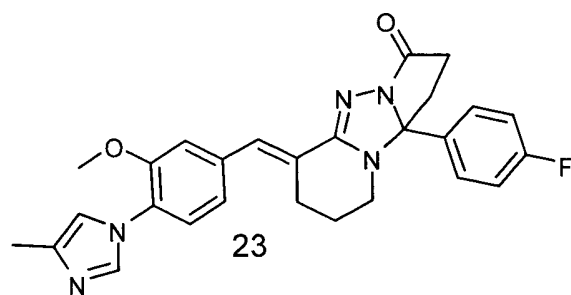
本發明之代表性化合物亦包括：



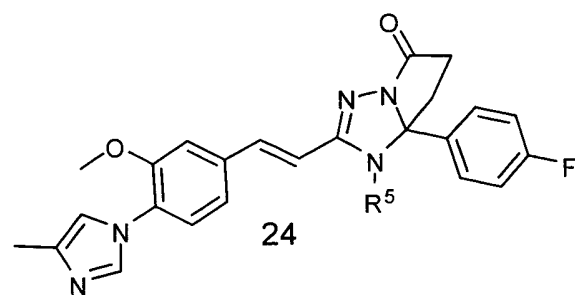
其中在化合物 21 中之 R^{13} 係如關於式 I 之定義 (且在一項實例中, R^{13} 為 H),



其中在化合物 22 中之 R^{13} 係如關於式 I 之定義 (且在一項實例中, R^{13} 為 H),

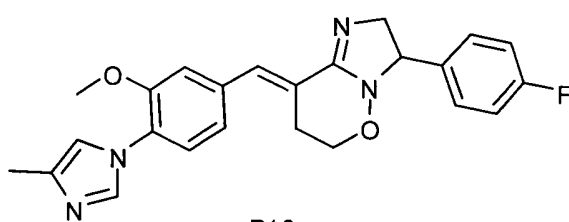


與

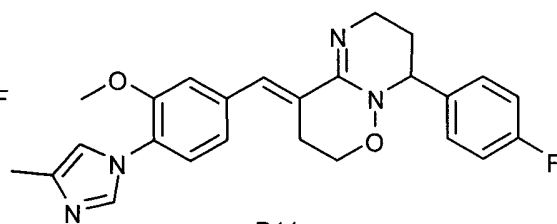


其中在化合物 22 中之 R^5 係如關於式 I 之定義 (且在一項實例中, R^5 為 H)。

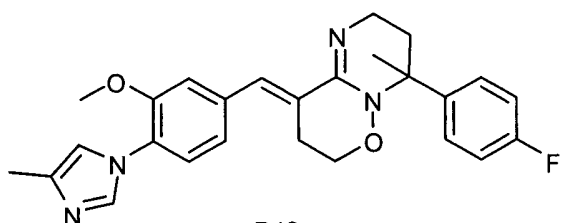
本發明之代表性化合物亦包括：



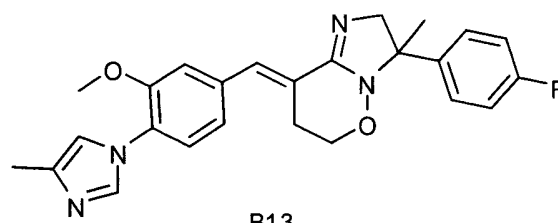
B10



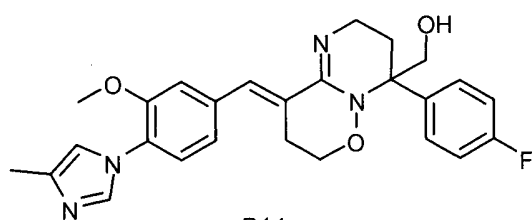
B11



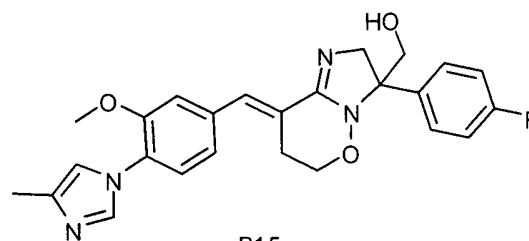
B12



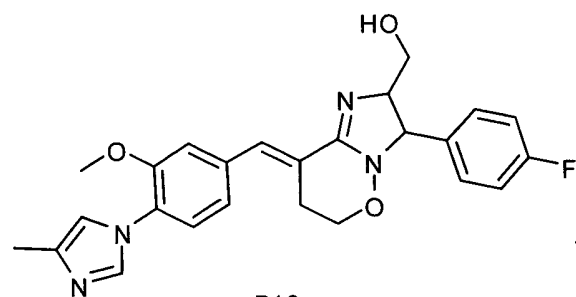
B13



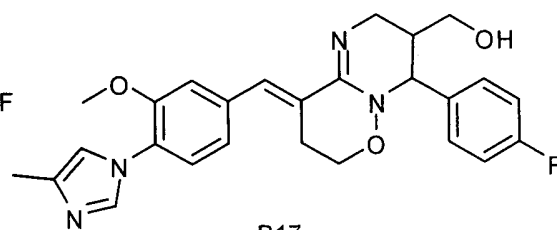
B14



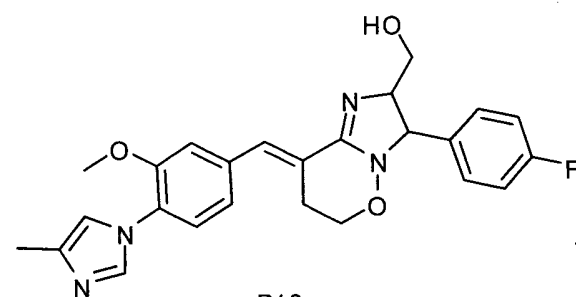
B15



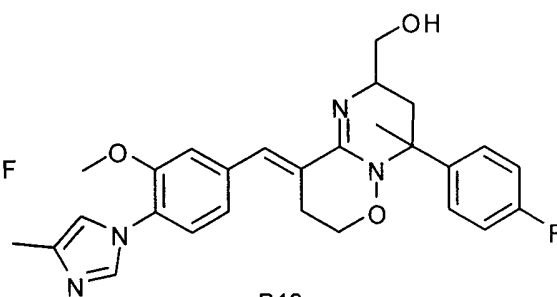
B16



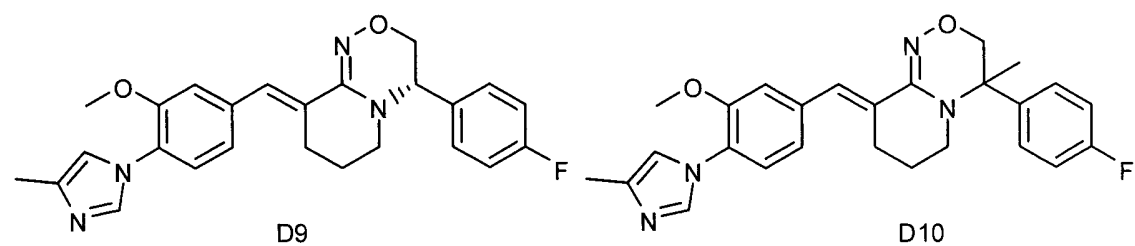
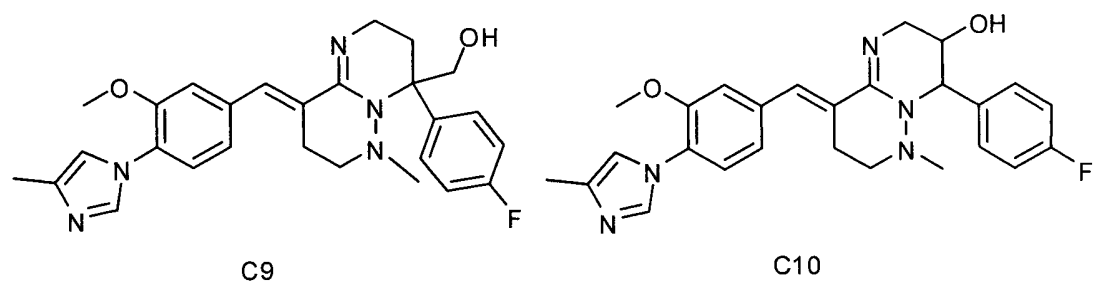
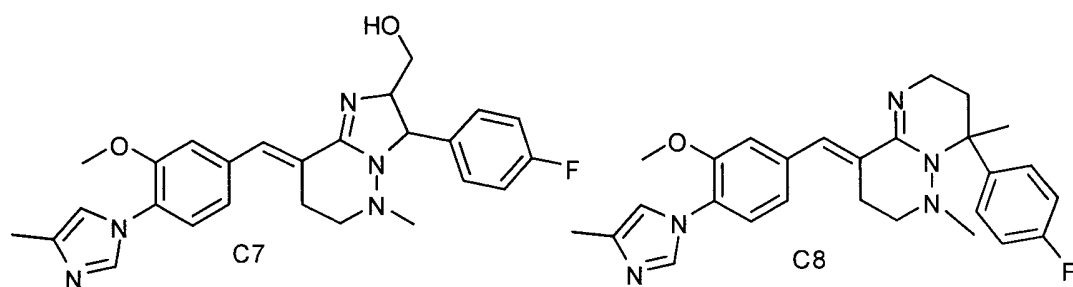
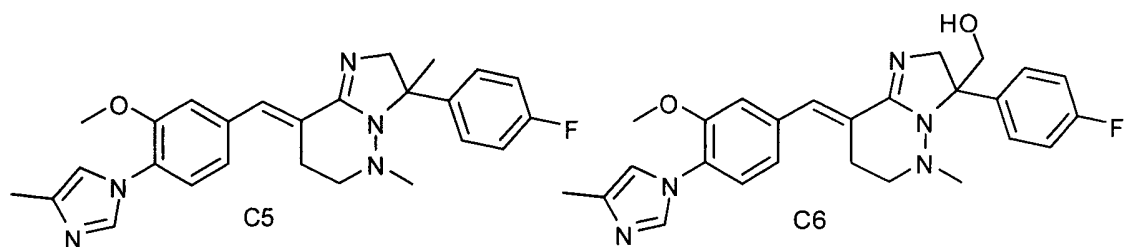
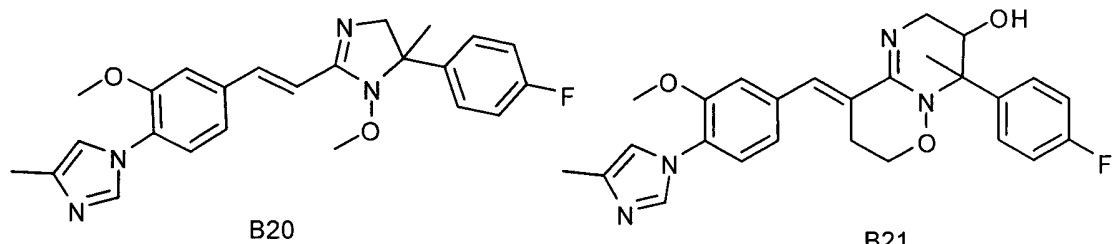
B17

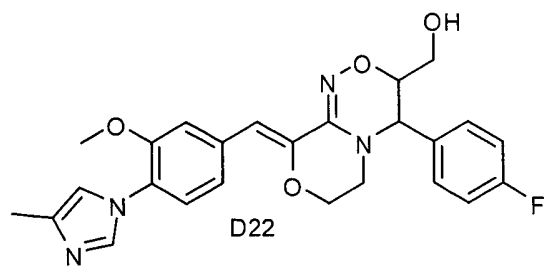
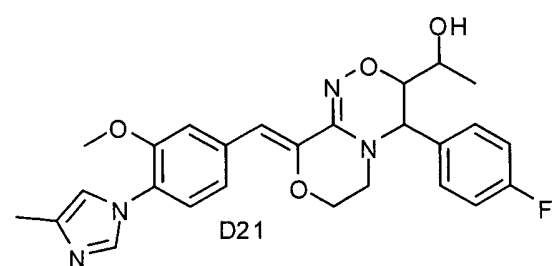
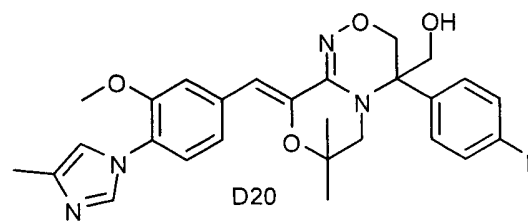
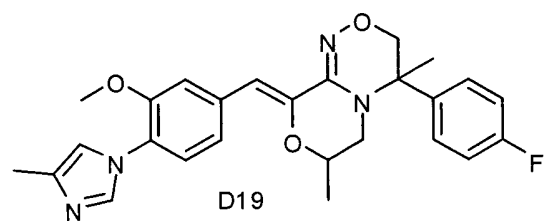
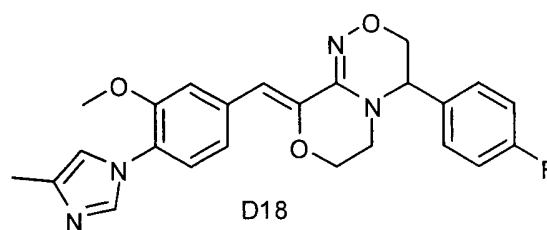
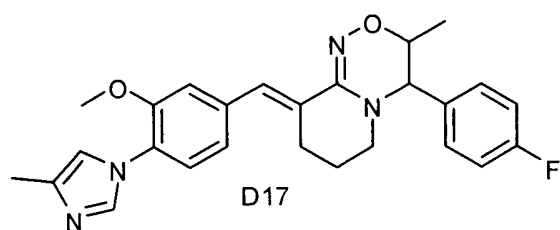
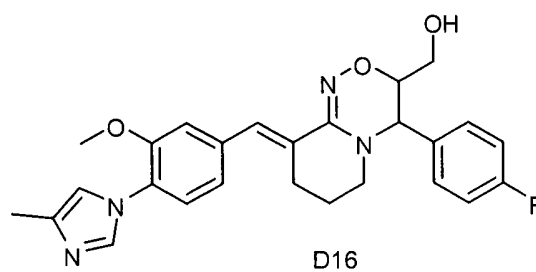
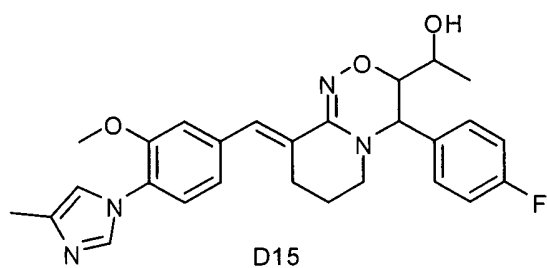
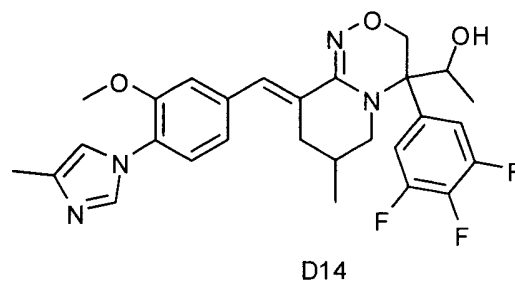
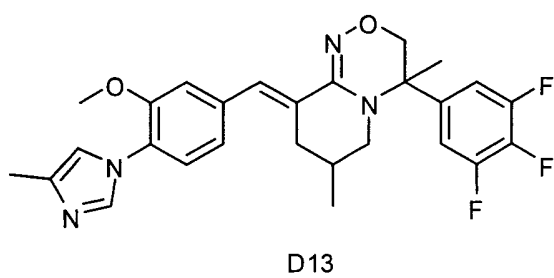
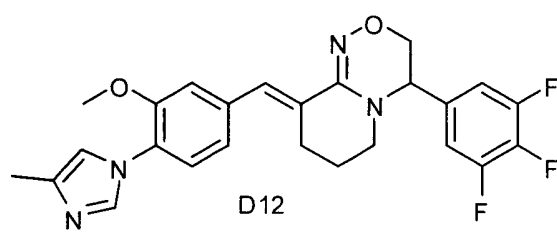
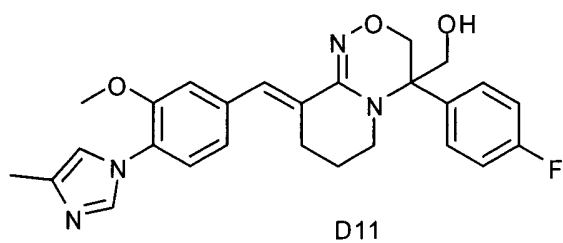


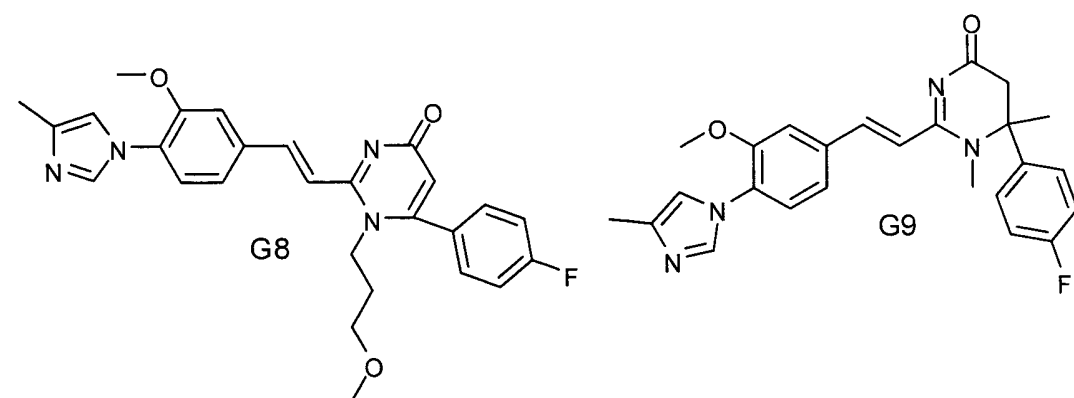
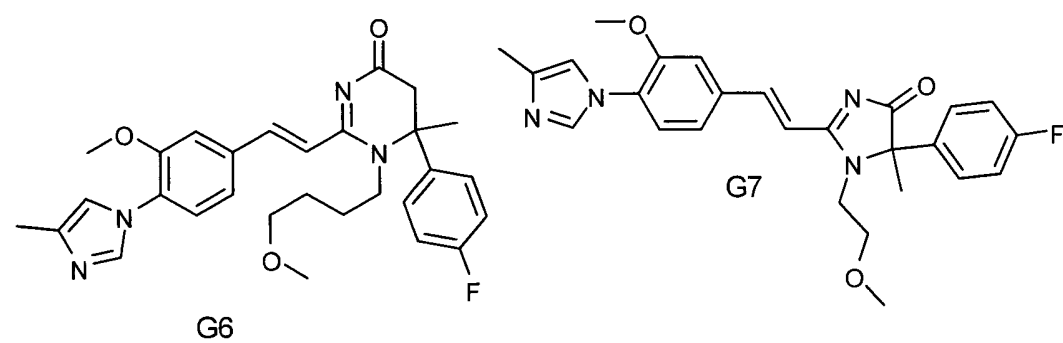
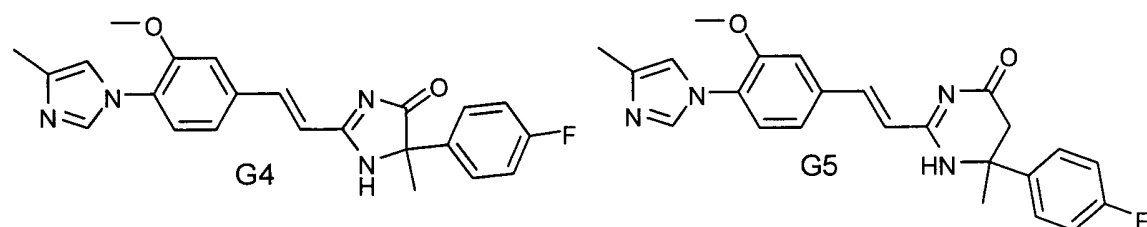
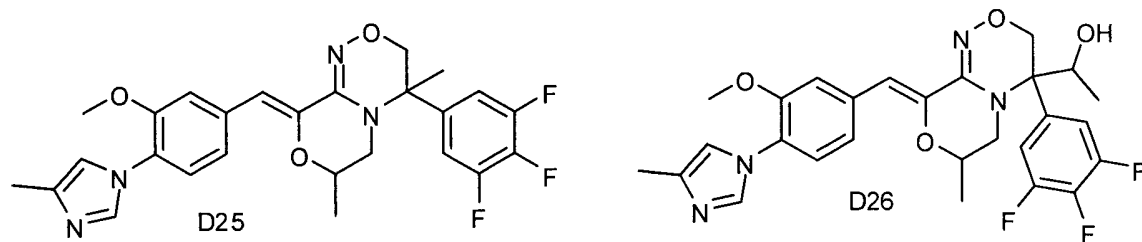
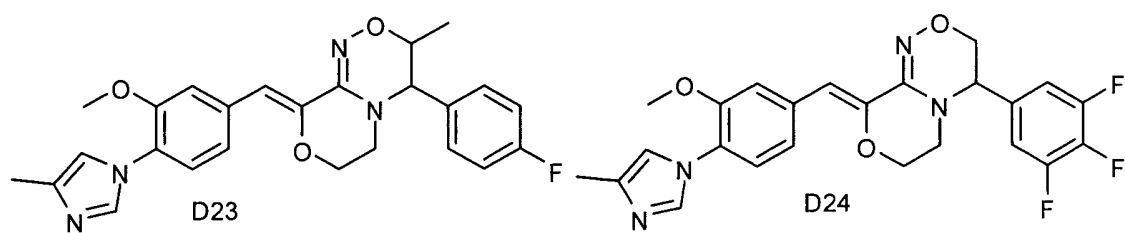
B18

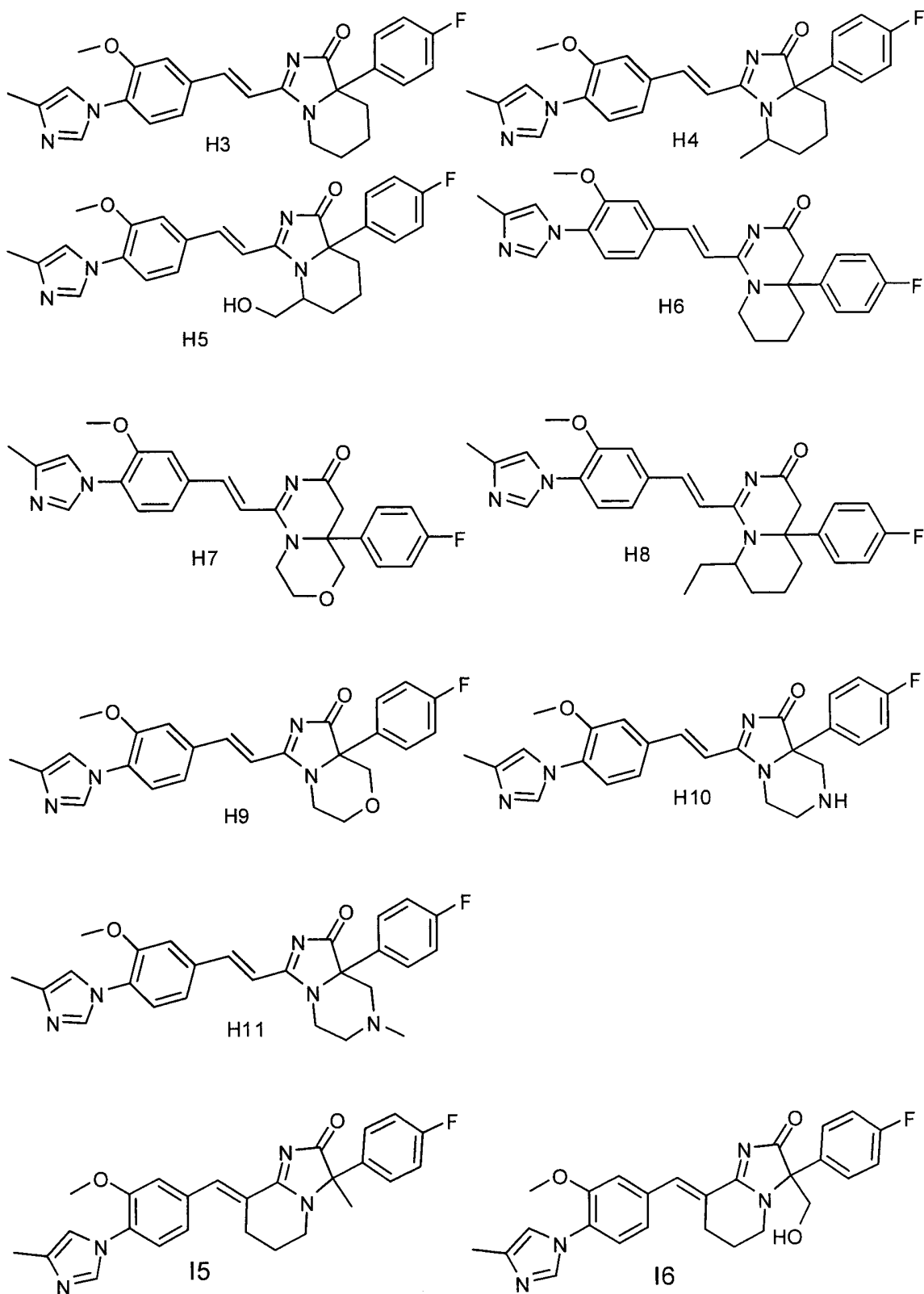


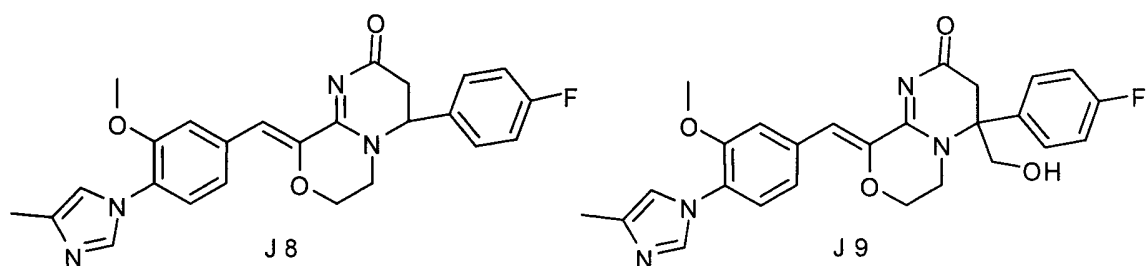
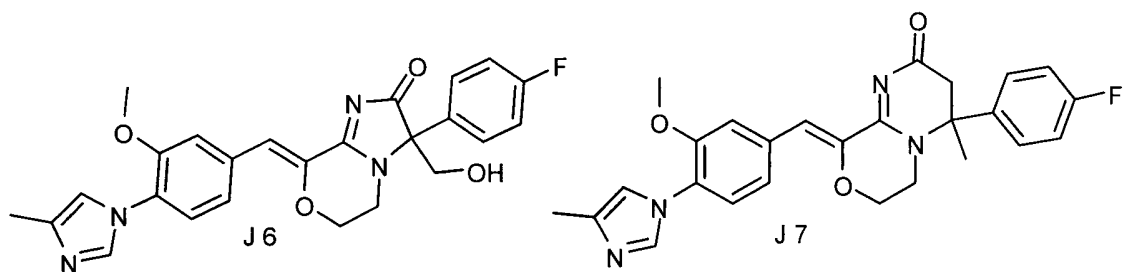
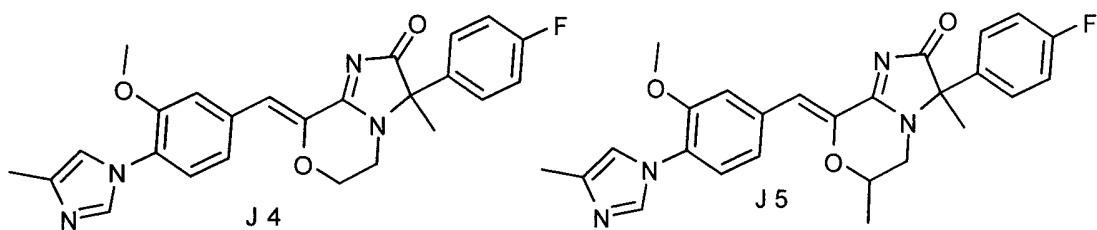
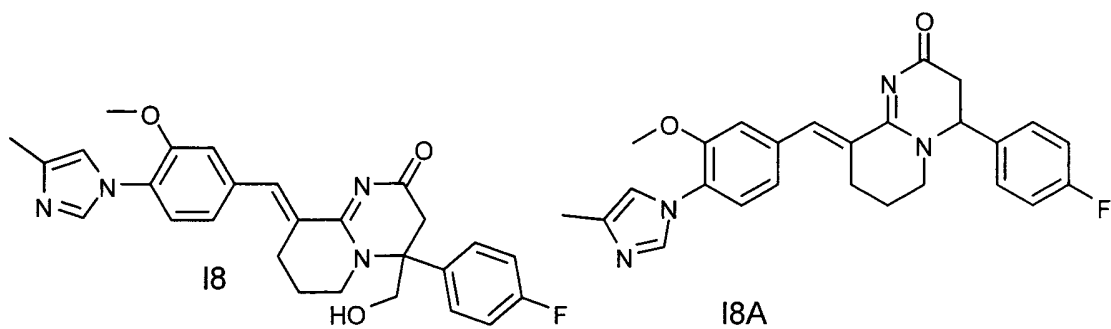
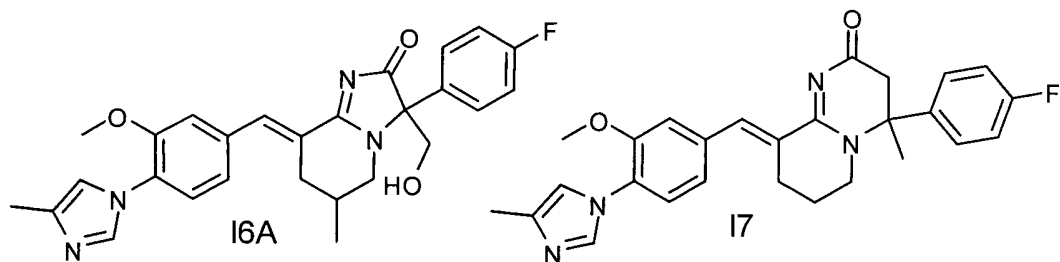
B19

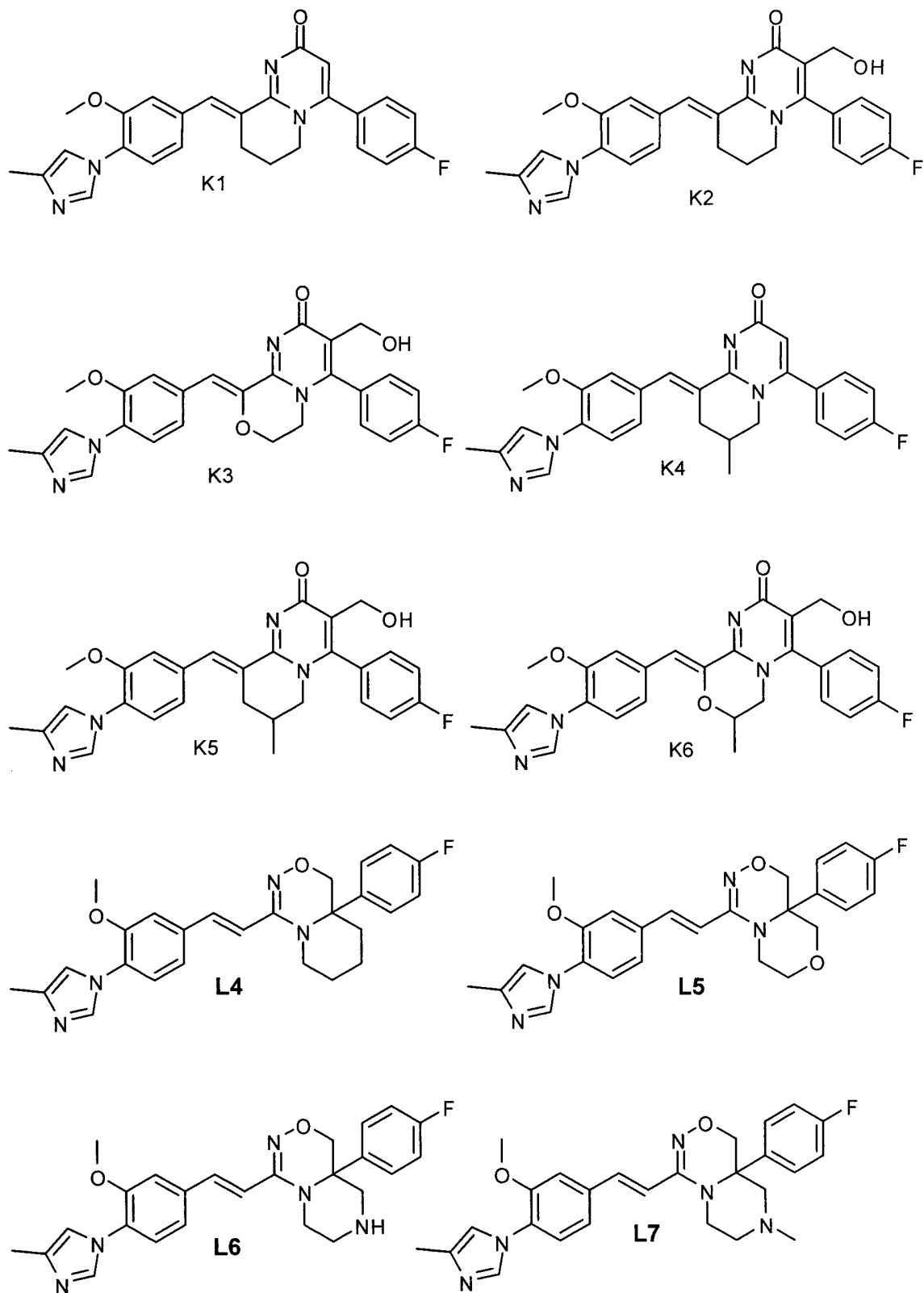


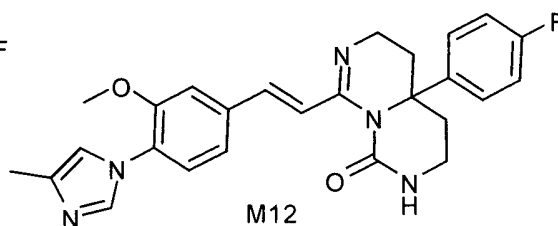
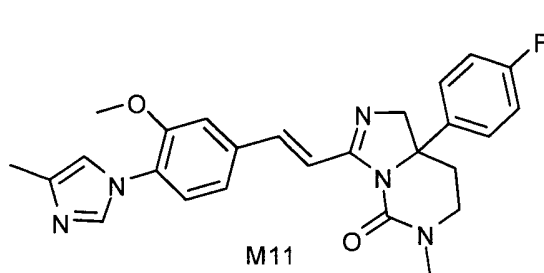
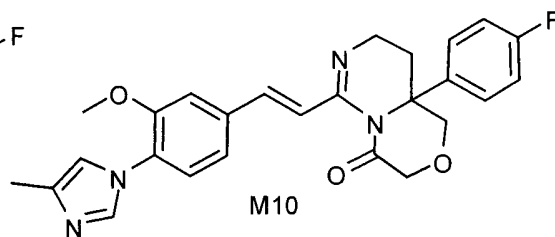
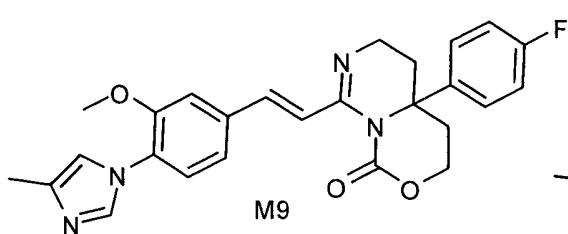
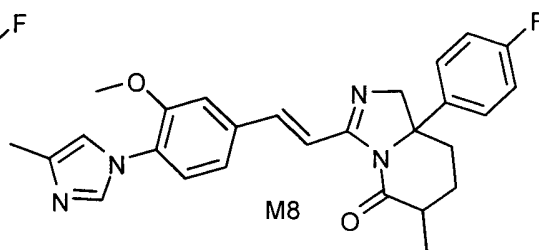
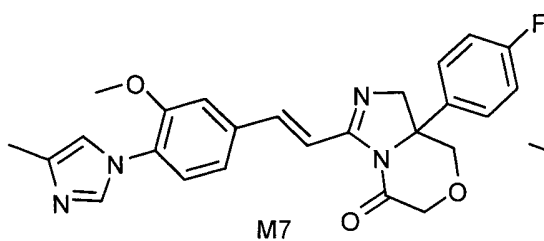
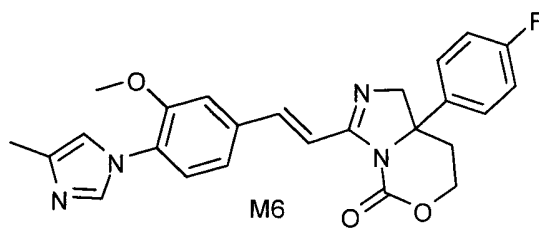
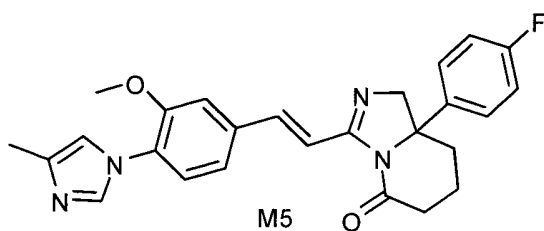
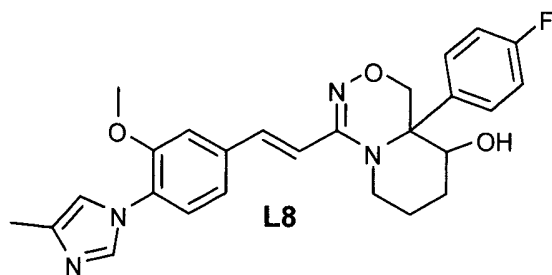


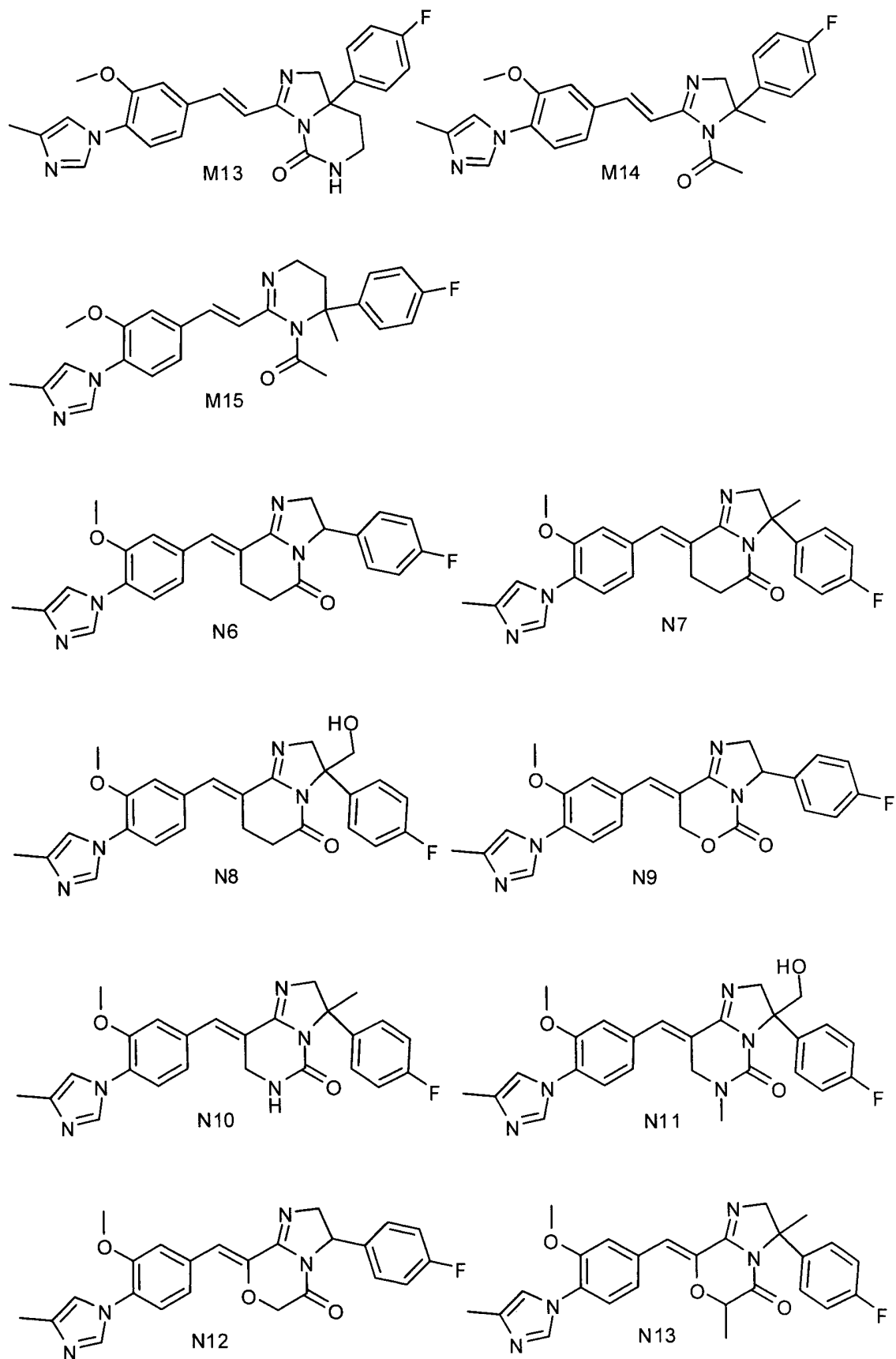


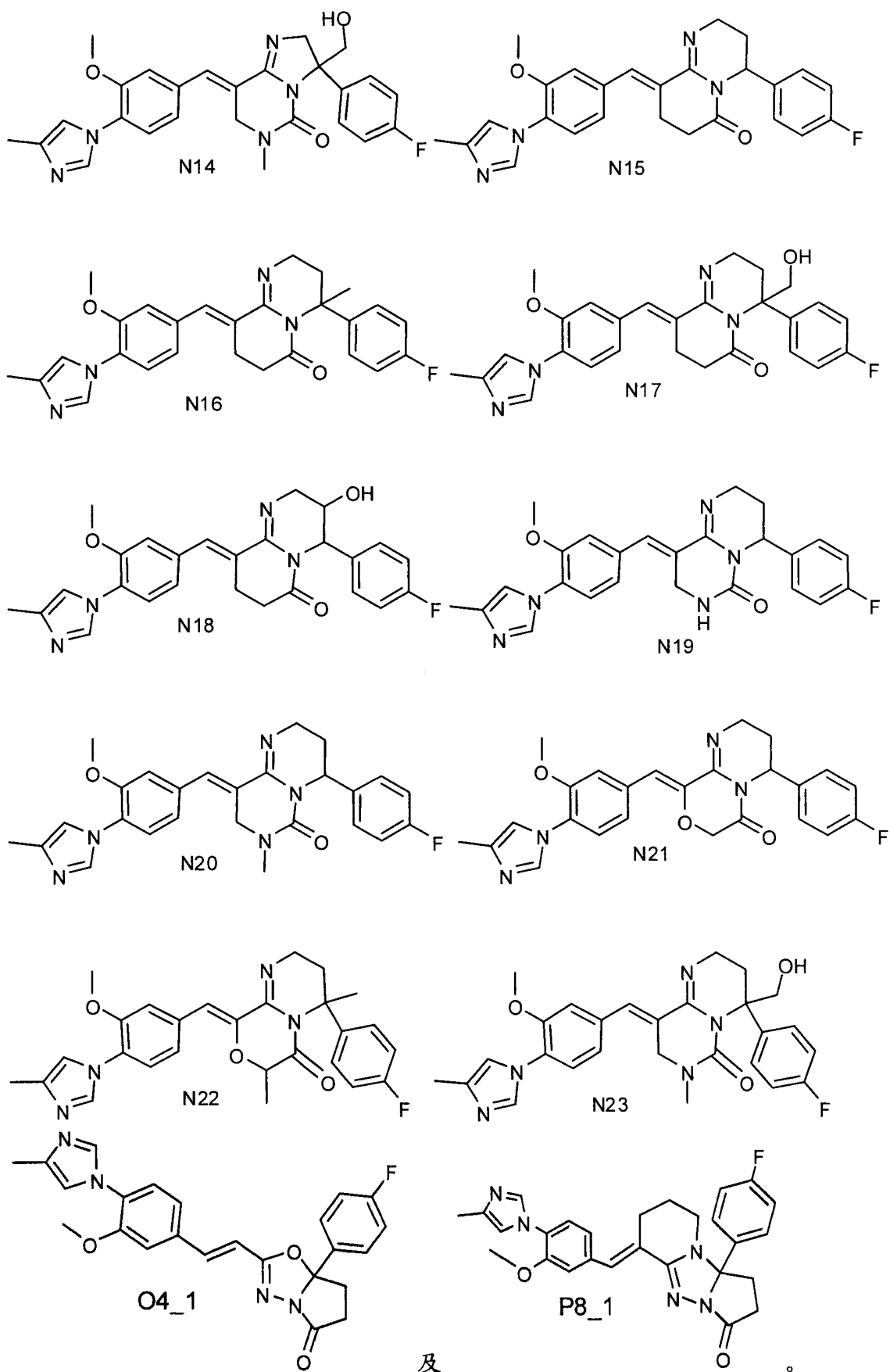












本發明之一項具體實施例係針對化合物1。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 2。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 3。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 4。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 5。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 6。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 7。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 8。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 9。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 10。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 11。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 12。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 13。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 14。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 15。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 16。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 17。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 18。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 19。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 20。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 21。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 22。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 23。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 24。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 B10。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 B11。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 B12。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 B13。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 B14。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 B15。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 B16。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 B17。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 B18。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 B19。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 B20。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 B21。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 C5。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 C6。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 C7。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 C8。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 C9。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 C10。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D9。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D10。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D11。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D12。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D13。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D14。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D15。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D16。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D17。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D18。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D19。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D20。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D21。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D22。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D23。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D24。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D25。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 D26。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 G4。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 G5。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 G6。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 G7。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 G8。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 G9。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 H3。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 H4。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 H5。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 H6。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 H7。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 H8。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 H9。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 H10。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 H11。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 I5。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 I6。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 I6A。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 I7。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 I8。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 I8A。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 J4。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 J5。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 J6。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 J7。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 J8。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 J9。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 K1。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 K2。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 K3。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 K4。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 K5。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 K6。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 L4。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 L5。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 L6。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 L7。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 L8。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 M5。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 M6。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 M7。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 M8。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 M9。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 M10。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 M11。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 M12。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 M13。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 M14。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 M15。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N6。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N7。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N8。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N9。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N10。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N11。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N12。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N13。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N14。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N15。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N16。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N17。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N18。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N19。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N20。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N21。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N22。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 N23。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 O4_1。

本發明之另一項具體實施例係針對化合物 P8_1。

當於上文及在整個本揭示內容中使用時，下列術語，除非另有指出，否則應明瞭係具有下述意義：

"ADDP" 係意謂 1,1'-(偶氮二羰基)雙六氫吡啶。

"AIBN" 係意謂 2,2'-偶氮雙(2-甲基丙腈)。

"CAN" 係意謂硝酸銨銻(IV)。

"DCC" 係意謂 N,N'-二環己基碳化二亞胺。

"DCM" 係意謂二氯甲烷。

"DMF" 係意謂二甲基甲醯胺。

"HOBT" 係意謂 1-羥基苯并三唑。

"LDA" 係意謂鋰二異丙基胺。

"TBAF" 係意謂氟化四-正-丁基銨。

"TBSO" 係意謂第三-丁基二甲基矽烷基氧基。

"TfO" 係意謂三氟甲基磺醯氧基。

"至少一種" 係意謂一種或一種以上，例如 1、2 或 3 種，或在另一項實例中為 1 或 2 種，或在另一項實例中為 1 種。

關於使用本發明化合物之"一或多種"係意謂使用一種或

一種以上化合物，例如1、2或3種，或在另一項實例中為1或2種，或在另一項實例中為1種。

"病患"包括人類與動物兩者。

"哺乳動物"係意謂人類及其他哺乳動物。

應注意的是，本文式I及其他化學式之碳可被1至3個矽原子置換，只要滿足所有價鍵要求條件即可。

"烷基"係意謂脂族烴基，其可為直鏈或分枝狀，且包含約1至約20個碳原子在此鏈中。較佳烷基含有約1至約12個碳原子在此鏈中。更佳烷基含有約1至約6個碳原子在此鏈中。分枝狀係意謂一或多個低碳烷基，譬如甲基、乙基或丙基，被連接至線性烷基鏈。"低碳烷基"係意謂一種基團，具有約1至約6個碳原子在此鏈中，其可為直鏈或分枝狀。"烷基"可為未經取代或視情況被一或多個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、芳基、環烷基、氰基、羥基、烷氧基、烷硫基、胺基、肟(例如=N-OH)、-NH(烷基)、-NH(環烷基)、-N(烷基)₂、-O-C(O)-烷基、-O-C(O)-芳基、-O-C(O)-環烷基、羧基及-C(O)O-烷基。適當烷基之非限制性實例包括甲基、乙基、正-丙基、異丙基及第三-丁基。

"烯基"係意謂含有至少一個碳-碳雙鍵之脂族烴基，且其可為直鏈或分枝狀，並包含約2至約15個碳原子在此鏈中。較佳烯基具有約2至約12個碳原子在此鏈中；且更佳為約2至約6個碳原子在此鏈中。分枝狀係意謂一或多個低碳烷基，譬如甲基、乙基或丙基，被連接至線性烯基鏈。"低碳

烯基"係意謂約2至約6個碳原子在此鏈中，其可為直鏈或分枝狀。"烯基"可為未經取代或視情況被一或多個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、芳基、環烷基、氰基、烷氧基及-S(烷基)。適當烯基之非限制性實例包括乙烯基、丙烯基、正-丁烯基、3-甲基丁-2-烯基、正-戊烯基、辛烯基及癸烯基。

"次烷基"係意謂藉由從上文所定義之烷基移除一個氫原子所獲得之雙官能性基團。次烷基之非限制性實例包括亞甲基、次乙基及次丙基。

"炔基"係意謂含有至少一個碳-碳參鍵之脂族烴基，且其可為直鏈或分枝狀，並包含約2至約15個碳原子在此鏈中。較佳炔基具有約2至約12個碳原子在此鏈中；且更佳為約2至約4個碳原子在此鏈中。分枝狀係意謂一或多個低碳烷基，譬如甲基、乙基或丙基，被連接至線性炔基鏈。"低碳炔基"係意謂約2至約6個碳原子在此鏈中，其可為直鏈或分枝狀。適當炔基之非限制性實例包括乙炔基、丙炔基、2-丁炔基及3-甲基丁炔基。"炔基"可為未經取代或視情況被一或多個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括烷基、芳基及環烷基。

"芳基"係意謂芳族單環狀或多環狀環系統，包含約6至約14個碳原子，較佳為約6至約10個碳原子。芳基可視情況被一或多個"環系統取代基"取代，其可為相同或不同，且均如本文定義。適當芳基之非限制性實例，包括苯基與萘基。

"烷基芳基"係意謂烷基-芳基-，其中烷基與芳基均如前文所述。較佳烷基芳基係包含低碳烷基。適當烷基芳基之非限制性實例為甲苯基。對母體部份基團之鍵結係經過芳基。

"環烷基"係意謂非芳族單-或多環狀環系統，包含約3至約10個碳原子，較佳為約5至約10個碳原子。較佳環烷基環含有約5至約7個環原子。環烷基可視情況被一或多個"環系統取代基"取代，其可為相同或不同，且均如上文定義。適當單環狀環烷基之非限制性實例包括環丙基、環戊基、環己基、環庚基等。適當多環狀環烷基之非限制性實例包括1-十氫萘基、正萘基、金剛烷基等。

"環烷基烷基"係意謂經由烷基部份基團(上文所定義)連結至母體核心之如上文定義之環烷基部份基團。適當環烷基烷基之非限制性實例包括環己基甲基、金剛烷基甲基等。

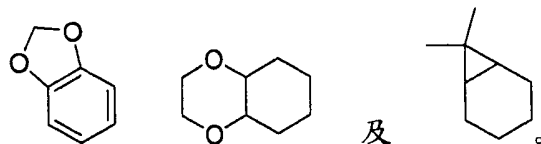
"環烯基"係意謂非芳族單或多環狀環系統，包含約3至約10個碳原子，較佳為約5至約10個碳原子，其含有至少一個碳-碳雙鍵。較佳環烯基環含有約5至約7個環原子。環烯基可視情況被一或多個"環系統取代基"取代，其可為相同或不同，且均如上文定義。適當單環狀環烯基之非限制性實例包括環戊烯基、環己烯基、環庚-1,3-二烯基等。適當多環狀環烯基之非限制性實例為正萘烯基。

"環烯基烷基"係意謂經由烷基部份基團(上文所定義)連結至母體核心之如上文定義之環烯基部份基團。適當環烯基烷基之非限制性實例包括環戊烯基甲基、環己烯基甲基

等。

"鹵素"係意謂氟、氯、溴或碘。較佳為氟、氯及溴。
"鹵基"係指氟基、氯基、溴基或碘基。

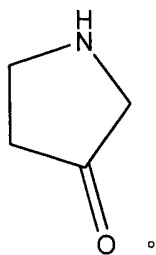
"環系統取代基"係意謂連接至芳族或非芳族環系統之取代基，其例如係置換環系統上之可取用氫。環系統取代基可為相同或不同，各獨立選自包括烷基、烯基、炔基、芳基、雜芳基、芳烷基、烷基芳基、雜芳烷基、雜芳基烯基、雜芳基炔基、烷基雜芳基、羥基、羥烷基、烷氧基、芳氧基、芳烷氧基、鹽基、芳鹽基、鹵基、硝基、氰基、羧基、烷氧羰基、芳氧基羰基、芳烷氧基羰基、烷基磺鹽基、芳基磺鹽基、雜芳基磺鹽基、烷硫基、芳基硫基、雜芳基硫基、芳烷硫基、雜芳烷基硫基、環烷基、雜環基、-O-C(O)-烷基、-O-C(O)-芳基、-O-C(O)-環烷基、-C(=N-CN)-NH₂、-C(=NH)-NH₂、-C(=NH)-NH(烷基)、肟(例如=N-OH)、Y₁Y₂N-、Y₁Y₂N-烷基-、Y₁Y₂NC(O)-、Y₁Y₂NSO₂-及-SO₂NY₁Y₂，其中Y₁與Y₂可為相同或不同，且獨立選自包括氫、烷基、芳基、環烷基及芳烷基。"環系統取代基"亦可意謂單一部份基團，其同時置換環系統之兩個相鄰碳原子上之兩個可取用氫(一個H在各碳上)。此種部份基團之實例為亞甲二氧基、次乙二氧基、-C(CH₃)₂-等，其係形成部份基團，例如：



"雜芳烷基"係意謂經由烷基部份基團(上文所定義)連結至母體核心之如上文定義之雜芳基部份基團。適當雜芳基

之非限制性實例，包括2-吡啶基甲基、喹啉基甲基等。

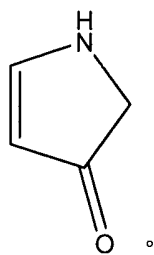
"雜環基"係意謂非芳族飽和單環狀或多環狀環系統，包含約3至約10個環原子，較佳為約5至約10個環原子，其中在此環系統中之一或多個原子係為碳以外之元素，例如氮、氧或硫，單獨或併用。沒有相鄰氧及/或硫原子存在於此環系統中。較佳雜環基含有約5至約6個環原子。在雜環基字根名稱前之字首氮、氧或硫，係意謂至少一個氮、氧或硫原子個別存在作為環原子。雜環基環中之任何-NH可經保護存在，例如成為-N(Boc)、-N(CBz)、-N(Tos)基團等；此種保護亦被視為本發明之一部份。雜環基可視情況被一或多個"環系統取代基"取代，其可為相同或不同，且均如本文定義。雜環基之氮或硫原子可視情況被氧化成其相應之N-氧化物、S-氧化物或S,S-二氧化物。適當單環狀雜環基環之非限制性實例包括六氫吡啶基、四氫吡咯基、六氫吡嗪基、嗎福啉基、硫代嗎福啉基、噻唑啶基、1,4-二氧陸園基、四氫呋喃基、四氫硫苯基、內醯胺、內酯等。"雜環基"亦可意謂單一部份基團(例如羰基)，其係同時置換環系統上之相同碳原子上之兩個可取用氫。此種部份基團之實例為四氫吡咯酮：



"雜環基烷基"係意謂經由烷基部份基團(上文所定義)連

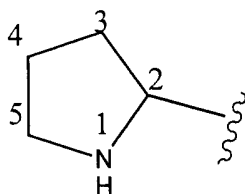
結至母體核心之如上文定義之雜環基部份基團。適當雜環基烷基之非限制性實例包括六氫吡啶基甲基、六氫吡啶基甲基等。

"雜環烯基"係意謂非芳族單環狀或多環狀環系統，包含約3至約10個環原子，較佳為約5至約10個環原子，其中在此環系統中之一或多個原子係為碳以外之元素，例如氮、氧或硫原子，單獨或併用，且其含有至少一個碳-碳雙鍵或碳-氮雙鍵。沒有相鄰氧及/或硫原子存在於此環系統中。較佳雜環烯基環含有約5至約6個環原子。在雜環烯基字根名稱前之字首氮、氧或硫，係意謂至少一個氮、氧或硫原子個別存在作為環原子。雜環烯基可視情況被一或多個環系統取代基取代，其中"環系統取代基"係如上文定義。雜環烯基之氮或硫原子可視情況被氧化成其相應之N-氧化物、S-氧化物或S,S-二氧化物。適當雜環烯基之非限制性實例包括1,2,3,4-四氫吡啶基、1,2-二氫吡啶基、1,4-二氫吡啶基、1,2,3,6-四氫吡啶基、1,4,5,6-四氫嘧啶基、2-二氫吡咯基、3-二氫吡咯基、2-二氫咪唑基、2-二氫吡唑基、二氫咪唑基、二氫呋唑基、二氫呋二唑基、二氫噻唑基、3,4-二氫-2H-哌喃基、二氫呋喃基、氟基二氫呋喃基、7-氧雙環并[2.2.1]庚烯基、二氫硫苯基、二氫硫代哌喃基等。"雜環烯基"亦可意謂單一部份基團(例如羰基)，其係同時置換環系統上之相同碳原子上之兩個可取用氫。此種部份基團之實例為四氫吡咯酮：



"雜環烯基烷基"係意謂經由烷基部份基團(上文所定義)連結至母體核心之如上文定義之雜環烯基部份基團。

應注意的是，於本發明含有雜原子之環系統中，沒有羥基在鄰近N、O或S之碳原子上，以及沒有N或S基團在鄰近另一個雜原子之碳上。因此，例如，在以下環中：



沒有-OH直接連接至標示為2與5之碳。

亦應注意的是，互變異構形式，例如以下部份基團：



在本發明之某些具體實施例中，係被視為等效。

"炔基烷基"係意謂炔基-烷基-，其中炔基與烷基均如前文所述。較佳炔基烷基含有低碳炔基與低碳烷基。對母體部份基團之鍵結係經過烷基。適當炔基烷基之非限制性實例包括炔丙基甲基。

"雜芳烷基"係意謂雜芳基-烷基-，其中雜芳基與烷基均如前文所述。較佳雜芳烷基係含有低碳烷基。適當芳烷基之非限制性實例包括吡啶基甲基與喹啉-3-基甲基。對母體部份基團之鍵結係經過烷基。

"羥烷基"係意謂HO-烷基-，其中烷基係如前文定義。較佳羥烷基含有低碳烷基。適當羥烷基之非限制性實例包括羥甲基與2-羥乙基。

"醯基"係意謂H-C(O)-、烷基-C(O)-或環烷基-C(O)-基團，其中各種基團均如前文所述。對母體部份基團之鍵結係經過羰基。較佳醯基係含有低碳烷基。適當醯基之非限制性實例包括甲醯基、乙醯基及丙醯基。

"芳醯基"係意謂芳基-C(O)-基團，其中芳基係如前文所述。對母體部份基團之鍵結係經過羰基。適當基團之非限制性實例包括苯甲醯基與1-萘甲醯基。

"烷氧基"係意謂烷基-O-基團，其中烷基係如前文所述。適當烷氧基之非限制性實例包括甲氧基、乙氧基、正-丙氧基、異丙氧基及正-丁氧基。對母體部份基團之鍵結係經過醚氧。

"芳氧基"係意謂芳基-O-基團，其中芳基係如前文所述。適當芳氧基之非限制性實例包括苯氧基與萘氧基。對母體部份基團之鍵結係經過醚氧。

"芳烷氧基"係意謂芳烷基-O-基團，其中芳烷基係如前文所述。適當芳烷氧基之非限制性實例包括苄氧基與1-或2-萘甲氧基。對母體部份基團之鍵結係經過醚氧。

"烷硫基"係意謂烷基-S-基團，其中烷基係如前文所述。適當烷硫基之非限制性實例包括甲硫基與乙硫基。對母體部份基團之鍵結係經過硫。

"芳基硫基"係意謂芳基-S-基團，其中芳基係如前文所

述。適當芳基硫基之非限制性實例包括苯硫基與萘基硫基。對母體部份基團之鍵結係經過硫。

"芳烷硫基"係意謂芳烷基-S-基團，其中芳烷基係如前文所述。適當芳烷硫基之非限制性實例為苄硫基。對母體部份基團之鍵結係經過硫。

"烷氧羰基"係意謂烷基-O-CO-基團。適當烷氧羰基之非限制性實例包括甲氧羰基與乙氧羰基。對母體部份基團之鍵結係經過羰基。

"芳氧基羰基"係意謂芳基-O-C(O)-基團。適當芳氧基羰基之非限制性實例包括苯氧基羰基與萘氧基羰基。對母體部份基團之鍵結係經過羰基。

"芳烷氧基羰基"係意謂芳烷基-O-C(O)-基團。適當芳烷氧基羰基之非限制性實例為苄氧羰基。對母體部份基團之鍵結係經過羰基。

"烷基磺醯基"係意謂烷基-S(O₂)-基團。較佳基團係為其中烷基為低碳烷基者。對母體部份基團之鍵結係經過磺醯基。

"芳基磺醯基"係意謂芳基-S(O₂)-基團。對母體部份基團之鍵結係經過磺醯基。

"經取代"一詞係意謂在所指定原子上之一或多個氫係被選自所指示之基團置換，其條件是在現有情況下不超過所指定原子之正常價鍵，且此取代會造成安定化合物。取代基及/或變數之組合，只有在此種組合會造成安定化合物下才可允許。所謂"安定化合物"或"安定結構"係意謂一種化

合物，其足夠強健而自反應混合物中留存著，單離至有用純度，及調配成有效治療劑。

"視情況經取代"一詞係意謂以特定基團、原子團或部份基團之選用取代。

關於化合物之"經純化"、"呈純化形式"或"呈單離與純化形式"術語，係指該化合物自合成方法(例如自反應混合物)或天然來源或其組合單離後之物理狀態。因此，關於化合物之"經純化"、"呈純化形式"或"呈單離與純化形式"術語，係指該化合物在得自本文中所述或熟練技師所習知之一或多種純化方法(例如層析、再結晶作用等)後之物理狀態，呈可藉由本文中所述或熟練技師所習知之標準分析技術特徵鑒定之足夠純度。

亦應注意的是，在本文之內文、圖式、實例及表中具有未滿足價鍵之任何碳以及雜原子，係被假定具有足夠數目之氫原子以滿足該價鍵。

當化合物中之官能基被稱為"經保護"時，這意謂該基團係呈經改質形式，以在使化合物接受反應時，阻止不期望之副反應在經保護位置處。適當保護基將由一般熟諳此藝者以及參考標準教科書而明瞭，例如 T.W. Greene 等人，有機合成之保護基 (1991), Wiley, New York。

當任何變數(例如芳基、雜環、 R^2 等)在任何成份中或在式 I 中出現超過一次時，其在各存在處之定義係與其在每一個其他存在處之定義無關。

於本文中使用的"組合物"一詞，係意欲涵蓋一種以特定

量包含特定成份之產物，以及直接或間接由特定成份以特定量組合所形成之任何產物。

本發明化合物之前體藥物與溶劑合物，亦意欲被涵蓋於此處。前體藥物之討論係被提供於 T. Higuchi 與 V. Stella, 前體藥物作為新穎傳輸系統, (1987) A.C.S. 論集系列之 14, 及在藥物設計中之生物可逆載劑, (1987) Edward B. Roche 編著, 美國醫藥協會與 Pergamon 出版社中。"前體藥物"一詞係意謂一種化合物(例如藥物先質), 其係於活體內被轉變而產生式(I)化合物, 或此化合物之藥學上可接受鹽、水合物或溶劑合物。該轉變可藉由各種機制(例如藉由代謝或化學過程)發生, 例如在血液中經過水解作用。前體藥物用途之討論係由 T. Higuchi 與 W. Stella, "前體藥物作為新穎傳輸系統", A.C.S. 論集系列之第 14 卷, 及在藥物設計中之生物可逆載劑, Edward B. Roche 編著, 美國醫藥協會與 Pergamon 出版社, 1987 中提供。

例如, 若式(I)化合物或此化合物之藥學上可接受鹽、水合物或溶劑合物含有羧酸官能基, 則前體藥物可包含經由以一種基團置換酸基之氫原子所形成之酯, 該基團例如 (C₁-C₈)烷基、(C₂-C₁₂)烷醯基-氧基甲基、具有 4 至 9 個碳原子之 1-(烷醯氧基)乙基、具有 5 至 10 個碳原子之 1-甲基-1-(烷醯氧基)-乙基、具有 3 至 6 個碳原子之烷氧羰基氧基甲基、具有 4 至 7 個碳原子之 1-(烷氧羰基氧基)乙基、具有 5 至 8 個碳原子之 1-甲基-1-(烷氧羰基氧基)乙基、具有 3 至 9 個碳原子之 N-(烷氧羰基)胺基甲基、具有 4 至 10 個碳原子之 1-(N-(烷氧基-

羧基)胺基)乙基、3-酞基、4-巴豆內酯基、 γ -丁內酯-4-基、二-N,N-(C₁-C₂)烷胺基(C₂-C₃)烷基(譬如 β -二甲胺基乙基)、胺甲鹽基-(C₁-C₂)烷基、N,N-二(C₁-C₂)烷基胺甲鹽基-(C₁-C₂)烷基，及六氫吡啶并-、四氫吡咯并-或嗎福啉并(C₂-C₃)烷基等。

同樣地，若式(I)化合物含有醇官能基，則前體藥物可經由以一種基團置換醇基之氫原子而形成，該基團例如(C₁-C₆)烷鹽氧基甲基、1-((C₁-C₆)烷鹽氧基)乙基、1-甲基-1-((C₁-C₆)烷鹽氧基)乙基、(C₁-C₆)烷氧基-羰基氧基甲基、N-(C₁-C₆)烷氧羰基胺基甲基、琥珀鹽基、(C₁-C₆)烷鹽基、 α -胺基(C₁-C₄)烷基、芳基鹽基及 α -胺鹽基或 α -胺鹽基- α -胺鹽基，其中各 α -胺鹽基係獨立選自天然生成之L-胺基酸類，P(O)(OH)₂、-P(O)(O(C₁-C₆)烷基)₂或糖基(由於移除碳水化合物半縮醛形式之羥基所形成之基團)等。

若式(I)化合物併入胺官能基，則前體藥物可經由以一種基團置換胺基中之氫原子而形成，該基團例如R-羰基、RO-羰基、NRR'-羰基，其中R與R'各獨立為(C₁-C₁₀)烷基、(C₃-C₇)環烷基、苄基，或R-羰基為天然 α -胺鹽基或天然 α -胺鹽基，-C(OH)C(O)OY¹，其中Y¹為H、(C₁-C₆)烷基或苄基，-C(OY²)Y³，其中Y²為(C₁-C₄)烷基，且Y³為(C₁-C₆)烷基、羧基(C₁-C₆)烷基、胺基(C₁-C₄)烷基或單-N-或二-N,N-(C₁-C₆)烷胺基烷基，-C(Y⁴)Y⁵，其中Y⁴為H或甲基，且Y⁵為單-N-或二-N,N-(C₁-C₆)烷胺基嗎福啉基、六氫吡啶-1-基或四氫吡咯-1-基等。

一或多種本發明化合物可以未溶劑化合以及溶劑化合形

式存在，具有藥學上可接受之溶劑，譬如水、乙醇等，且本發明係意欲包含溶劑化合與未溶劑化合形式兩者。"溶劑合物"係意謂本發明化合物與一或多種溶劑分子之物理締合。此物理締合係涉及不同程度之離子與共價鍵結，包括氫鍵。在某些情況中，溶劑合物係能夠隔離，例如當一或多個溶劑分子被併入結晶性固體之晶格中時。"溶劑合物"係涵蓋溶液相與可隔離之溶劑合物兩者。適當溶劑合物之非限制性實例包括乙醇化物、甲醇化物等。"水合物"為溶劑合物，其中溶劑分子為 H_2O 。

一或多種本發明化合物可視情況被轉化成溶劑合物。溶劑合物之製備係為一般已知。因此，例如 M. Caira 等人, *J. Pharmaceutical Sci.*, **93(3)**, 601-611 (2004) 係描述抗真菌劑氟康唑 (fluconazole) 在醋酸乙酯中以及自水之溶劑合物之製備。溶劑合物、半溶劑合物、水合物等之類似製備係由 E. C. van Tonder 等人, *AAPS PharmSciTech.*, **5(1)**, 論文 12 (2004)；與 A. L. Bingham 等人, *Chem. Commun.*, 603-604 (2001) 描述。一種典型非限制方法係涉及使本發明化合物在高於環境溫度下，溶解於所需要量之所要溶劑(有機或水或其混合物)中，並使該溶液在足以形成結晶之速率下冷卻，然後藉標準方法單離之。分析技術，例如 I.R. 光譜學，顯示溶劑(或水)存在於結晶中，作為溶劑合物(或水合物)。

"有效量"或"治療上有效量"係意欲描述本發明化合物或組合物有效抑制上文所指出疾病，且因此產生所要治療、改善、抑制或預防作用之量。

式I化合物可形成鹽，其亦在本發明之範圍內。應明瞭，對於本文式I化合物之指稱，係包括指稱其鹽，除非另有指出。當於本文中採用時，"鹽"一詞係表示以無機及/或有機酸類形成之酸性鹽，以及以無機及/或有機鹼類形成之鹼性鹽。此外，當式I化合物含有鹼性部份基團譬如但不限於吡啶或咪唑，與酸性部份基團譬如但不限於羧酸兩者時，兩性離子("內鹽")可以形成且係被包含在如本文中使用之"鹽"一詞內。藥學上可接受(意即無毒性、生理學上可接受)之鹽為較佳，惟其他鹽亦可使用。式I化合物之鹽可例如經由使式I化合物與一數量之酸或鹼，譬如等量，在媒質中反應，譬如鹽會沉澱於其中者，或在水性媒質中，接著為冷凍乾燥而形成。

舉例之酸加成鹽包括醋酸鹽、抗壞血酸鹽、苯甲酸鹽、苯磺酸鹽、酸性硫酸鹽、硼酸鹽、丁酸鹽、檸檬酸鹽、樟腦酸鹽、樟腦磺酸鹽、反丁烯二酸鹽、鹽酸鹽、氫溴酸鹽、氫碘酸鹽、乳酸鹽、順丁烯二酸鹽、甲烷磺酸鹽、萘磺酸鹽、硝酸鹽、草酸鹽、磷酸鹽、丙酸鹽、柳酸鹽、琥珀酸鹽、硫酸鹽、酒石酸鹽、硫氰酸鹽、甲苯磺酸鹽(toluenesulfonate)(亦稱為甲苯磺酸鹽(tosylate))等。此外，一般被認為適合由鹼性醫藥化合物形成藥學上可使用鹽之酸類，係例如由P. Stahl等人, Camille G (編著) 醫藥鹽手冊. 性質、選擇及用途. (2002) Zurich: Wiley-VCH; S. Berge等人, 醫藥科學期刊 (1977) 66(1) 1-19; P. Gould, 國際製藥學期刊 (1986) 33 201-217; Anderson等人, 醫藥化學實務 (1996), 大學出版社, New York; 及在橘

皮書(食品藥物管理局, Washington, D.C., 在其網站上)討論。此等揭示內容係併於本文供參考。

舉例之鹼性鹽包括銨鹽，鹼金屬鹽，譬如鈉、鋰及鉀鹽，鹼土金屬鹽，譬如鈣與鎂鹽，與有機鹼(例如有機胺類)譬如二環己基胺類、第三-丁基胺類之鹽，及與胺基酸之鹽，該胺基酸譬如精胺酸、離胺酸等。鹼性含氮基團可以作用劑四級化，譬如低碳烷基鹵化物(例如甲基、乙基及丁基氯化物、溴化物及碘化物)、二烷基硫酸鹽(例如二甲基、二乙基及二丁基硫酸鹽)、長鏈鹵化物(例如癸基、月桂基及硬脂基氯化物、溴化物及碘化物)、芳烷基鹵化物(例如苄基與苄乙基溴化物)及其他。

所有此種酸鹽與鹼鹽係意欲成為本發明範圍內之藥學上可接受鹽，且對本發明之目的而言，所有酸與鹼鹽係被認為相當於相應化合物之自由態形式。

本發明化合物之藥學上可接受酯類包括下列組群：(1)藉由羥基之酯化作用所獲得之羧酸酯類，其中酯基團群之羧酸部份之非羰基部份基團係選自直鏈或分枝鏈烷基(例如乙醯基、正-丙基、第三-丁基或正-丁基)、烷氧烷基(例如甲氧基甲基)、芳烷基(例如苄基)、芳氧基烷基(例如苯氧基甲基)、芳基(例如苯基，視情況被例如鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基或胺基取代)；(2)磺酸酯類，譬如烷基-或芳烷基磺醯基(例如甲烷磺醯基)；(3)胺基酸酯類(例如L-異纈草胺醯基或L-異白胺醯基)；(4)膦酸酯類，及(5)單-、二-或三磷酸酯類。磷酸酯類可進一步被例如 C_{1-20} 醇或其反應性衍

生物，或被2,3-二-(C₆₋₂₄)醯基甘油酯化。

式(I)化合物，以及其鹽、溶劑合物、酯及前體藥物可以其互變異構形式存在(例如作為醯胺、烯醇、酮基或亞胺基醚)。所有此種互變異構形式係意欲被涵蓋在本文中，作為本發明之一部份。

式(I)化合物可含有不對稱或對掌中心，因此以不同立體異構形式存在。所意欲的是，式(I)化合物之所有立體異構形式，以及其混合物，包括外消旋混合物，係構成本發明之一部份。此外，本發明係包含所有幾何與位置異構物。例如，若式(I)化合物併入雙鍵或稠合環，則順式-與反式-形式兩者，以及混合物，係被包含在本發明之範圍內。

非對映異構混合物可以其物理化學差異為基礎，藉由熟諳此藝者所習知之方法，例如藉層析及/或分級結晶，被分離成其個別非對映異構物。對掌異構物可經由使對掌異構混合物轉化成非對映異構混合物而被分離，其方式是與適當光學活性化合物(例如對掌性輔助劑，譬如對掌性醇或Mosher氏氯化醯)反應，分離非對映異構物，及使個別非對映異構物轉化(例如水解)成為其相應之純對掌異構物。一些式(I)化合物亦可為非向性異構物(例如經取代之聯芳基類)，且係被認為是本發明之一部份。對掌異構物亦可利用對掌性HPLC管柱分離。

式(I)化合物亦可以不同互變異構形式存在，且所有此種形式係被包含在本發明之範圍內。例如，此等化合物之所有酮基-烯醇與亞胺-烯胺形式，亦被包含在本發明中。

本發明化合物(包括此等化合物之鹽、溶劑合物、酯類及前體藥物，以及前體藥物之鹽、溶劑合物及酯類)之所有立體異構物(例如幾何異構物、光學異構物等)，譬如可由於不同取代基上之不對稱碳所致而存在者，包括對掌異構形式(其甚至可於不對稱碳不存在下存在)、旋轉異構形式、非向性異構物及非對映異構形式，係意欲被涵蓋在本發明之範圍內，位置異構物(例如4-吡啶基與3-吡啶基)。(例如，若式(I)化合物併入雙鍵或稠合環，則順式-與反式-形式兩者，以及混合物，係被包含在本發明之範圍內。例如，此等化合物之所有酮基-烯醇與亞胺-烯胺形式亦被包含在本發明中)。本發明化合物之個別立體異構物，可例如實質上不含其他異構物，或可經混合，例如作成外消旋物，或與所有其他或其他經選擇之立體異構物混合。本發明之對掌中心可具有如由 *IUPAC* 1974 建議所定義之 S 或 R 組態。術語"鹽"、"溶劑合物"、"酯"、"前體藥物"等之使用，係意欲同樣地適用於本發明化合物之對掌異構物、立體異構物、旋轉異構物、互變異構物、位置異構物、外消旋物或前體藥物之鹽、溶劑合物、酯及前體藥物。

本發明亦包含以同位素方式標識之本發明化合物，其係與本文所述者相同，惟以下事實除外，一或多個原子係被一個具有原子質量或質量數不同於通常在天然上所發現之原子質量或質量數之原子所置換。可被併入本發明化合物中之同位素，其實例包括氫、碳、氮、氧、磷、氟及氯之同位素，譬如個別為 ^2H 、 ^3H 、 ^{13}C 、 ^{14}C 、 ^{15}N 、 ^{18}O 、 ^{17}O 、

^{31}P 、 ^{32}P 、 ^{35}S 、 ^{18}F 及 ^{36}Cl 。

某些以同位素方式標識之式(I)化合物(例如以 ^3H 與 ^{14}C 標識者)可用於化合物及/或受質組織分佈檢測中。經氚化(意即 ^3H)與碳-14(意即 ^{14}C)同位素係為特佳，因其易於製備與可偵測性。再者，以較重質同位素譬如氘(意即 ^2H)取代，可提供由於較大代謝安定性所造成之某些治療利益(例如，增加之活體內半生期或降低之劑量需要量)，且因此在一些情況中可能較佳。以同位素方式標識之式(I)化合物一般可按照類似下文圖式及/或實例中所揭示之程序製成，其方式是以適當經同位素方式標識之試劑取代未以同位素方式標識之試劑。

式I化合物之多晶形式，及式I化合物之鹽、溶劑合物、酯及前體藥物之多晶形式，係欲被包含於本發明中。

根據本發明之化合物可具有藥理學性質；特定言之，式I化合物可為 γ 分泌酶之調節劑(包括抑制劑、拮抗劑等)。

更明確言之，式I化合物可用於治療多種中樞神經系統病症，例如包括但不限於阿耳滋海默氏病、AIDS相關之癡呆症、巴金森氏病、肌萎縮性側索硬化、色素性視網膜炎、脊柱肌肉萎縮及小腦退化等。

本發明之另一方面為一種治療具有中樞神經系統之疾病或症狀之哺乳動物(例如人類)之方法，其方式是對該哺乳動物投予治療上有效量之至少一種式I化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯或前體藥物。

較佳劑量為約0.001至500毫克/公斤體重/天之式I化合

物。尤佳劑量為約 0.01 至 25 毫克/公斤體重/天之式 I 化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽或溶劑合物。

本發明化合物亦可與一或多種上文列示之其他藥劑合併使用（一起或相繼地投予）。

本發明化合物亦可與一或多種選自包括 $A\beta$ 抗體抑制劑、 γ 分泌酶抑制劑及 β 分泌酶抑制劑之化合物合併使用（一起或相繼地投予）。

若被調配成固定劑量，則此種組合產物係採用本發明化合物在本文中所述之劑量範圍內，而其他醫藥活性劑或治療法在其劑量範圍內。

因此，在一方面，本發明包括一些組合，其包含一數量之至少一種式 I 化合物，或其藥學上可接受之鹽、溶劑合物、酯或前體藥物，及一數量之上文列示之一或多種其他藥劑，其中化合物/治療藥品之量會造成所要之治療作用。

本發明化合物之藥理學性質可藉由許多藥理學檢測確認。某些檢測係稍後在此文件中舉例。

本發明亦針對醫藥組合物，其包含至少一種式 I 化合物，或該化合物之藥學上可接受之鹽、溶劑合物、酯或前體藥物，及至少一種藥學上可接受之載劑。

本發明之其他具體實施例係針對上文關於任一種化合物 1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1 之任一項具體實施例之藥學上可接受鹽。

本發明之其他具體實施例係針對上文關於任一種化合物

1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1 之任一項具體實施例之藥學上可接受酯類。

本發明之其他具體實施例係針對上文關於任一種化合物 1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1 之任一項具體實施例之溶劑合物。

本發明之一項具體實施例係針對式 I 化合物。

本發明之另一項具體實施例係針對式 I 化合物之藥學上可接受鹽。

本發明之另一項具體實施例係針對式 I 化合物之藥學上可接受酯。

本發明之另一項具體實施例係針對式 I 化合物之溶劑合物。

本發明之另一項具體實施例係針對呈單離形式之式 I 化合物。

本發明之另一項具體實施例係針對呈純形式之式 I 化合物。

本發明之另一項具體實施例係針對呈純與單離形式之式 I 化合物。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)式 I 化合物，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其

包含有效量之一或多種(例如一種)式I化合物之藥學上可接受鹽，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)式I化合物之藥學上可接受酯，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)式I化合物之溶劑合物，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)式I化合物，與有效量之一或多種(例如一種)其他醫藥活性成份(例如藥物)，及藥學上可接受之載劑。其他醫藥活性成份之實例包括但不限於一些藥物，選自包括：(a)可用於治療阿耳滋海默氏病之藥物，(b)可用於抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近之藥物，(c)可用於治療神經變性疾病之藥物，及(d)可用於抑制 γ -分泌酶之藥物。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)式I化合物，與有效量之一或多種BACE抑制劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)式I化合物，與有效量之一或多種膽鹼酯酶抑制劑(例如乙醯基-及/或丁醯基膽鹼酯酶抑制劑)，及藥學上可接受之載劑。

式I化合物可作為 γ 分泌酶調節劑使用，且可用於治療與預防疾病，例如中樞神經系統病症，譬如阿耳滋海默氏疾病與Down氏徵候簇。

因此，本發明之另一項具體實施例係針對一種調節(包括抑制、拮抗等) γ -分泌酶之方法，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明之另一項具體實施例係針對一種調節(包括抑制、拮抗等) γ -分泌酶之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之式I化合物。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療一或多種神經變性疾病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療一或多種神經變性疾病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之式I化合物。

本發明之另一項具體實施例係針對一種抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明之另一項具體實施例係針對一種抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之式I化合物。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默

氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之式I化合物。

本發明亦提供組合療法，以供(1)調節 γ -分泌酶，或(2)治療一或多種神經變性疾病，或(3)抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近，或(4)治療阿耳滋海默氏病。此組合療法係針對包括投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物及投予有效量之一或多種(例如一種)其他醫藥活性成份(例如藥物)之方法。式I化合物及其他藥物可個別地(意即每一個係以其自有之個別劑型)投予，或式I化合物可與其他藥物合併在相同劑型中。

因此，本發明之其他具體實施例係針對本文中所述之任一種治療方法或抑制方法，其中有效量之式I化合物係併用有效量之一或多種其他醫藥活性成份，選自包括：BACE抑制劑(β 分泌酶抑制劑)、蠅蕈鹼拮抗劑(例如 m_1 催動劑或 m_2 拮抗劑)、膽鹼酯酶抑制劑(例如乙醯基-及/或丁醯基膽鹼酯酶抑制劑)； γ 分泌酶抑制劑； γ 分泌酶調節劑；HMG-CoA還原酶抑制劑；非類固醇消炎劑；N-甲基-D-天冬胺酸鹽受體拮抗劑；抗-澱粉狀蛋白抗體；維生素E；菸鹼酸乙醯膽鹼受體催動劑；CB1受體逆催動劑或CB1受體拮抗劑；抗生素；生長激素促分泌素；組織胺H3拮抗劑；AMPA催動劑；

PDE4 抑制劑；GABA_A 逆催動劑；澱粉狀蛋白聚集之抑制劑；糖原合成酶激酶 β 抑制劑； α 分泌酶活性之促進劑；PDE-10 抑制劑及膽固醇吸收抑制劑（例如也吉提麥伯 (ezetimibe)）。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種（例如一種）式 I 化合物，且併用有效（意即治療上有效）量之一或多種膽鹼酯酶抑制劑（例如（ $\pm$ ）-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯基甲基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多臬佩吉 (donepezil) 鹽酸鹽，可以 Aricept[®] 品牌之多臬佩吉 (donepezil) 鹽酸鹽取得）。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之式 I 化合物，且併用有效量之一或多種（例如一種）膽鹼酯酶抑制劑（例如（ $\pm$ ）-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯基甲基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多臬佩吉 (donepezil) 鹽酸鹽，可以 Aricept[®] 品牌之多臬佩吉 (donepezil) 鹽酸鹽取得）。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種（例如一種）式 I 化合物，且併用有效量之一或多種化合物，選自包括 A β 抗體抑制劑、 γ 分泌酶抑制劑及 β 分泌酶抑制劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種（例如一種）式 I 化合物，且併用有效量之一或多種 BACE 抑制劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默

氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之也西隆(Exelon)(利發史替明(rivastigmine))。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之康葛尼斯(Cognex)(塔克林(tacrine))。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之 τ 激酶抑制劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之一或多種 τ 激酶抑制劑(例如GSK3 β 抑制劑、cdk5抑制劑、ERK抑制劑)。

本發明亦提供一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之一種抗-A β 接種疫苗(主動免疫作用)。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之一或多種APP配位體。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之一或多種會向上調節胰島素降解酵素及/或臬普溶素(neprilysin)之藥劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且

併用有效量之一或多種膽固醇降低劑(例如制菌素, 譬如阿托瓦制菌素(Atorvastatin)、弗伐制菌素(Fluvastatin)、洛伐制菌素(Lovastatin)、美伐制菌素(Mevastatin)、皮塔伐制菌素(Pitavastatin)、普拉伐制菌素(Pravastatin)、洛蘇伐制菌素(Rosuvastatin)、辛伐制菌素(Simvastatin), 及膽固醇吸收抑制劑, 譬如也吉提麥伯(Ezetimibe))。

本發明亦提供一種治療阿耳滋海默氏病之方法, 其包括投予有效量之一或多種式I化合物, 且併用有效量之一或多種纖維酸酯(例如氯苯丁酯(clofibrate)、氯纖維酸化物(Clofibrider)、約托纖維酸酯(Etofibrate)、鋁氯苯丁酯(Clofibrate))。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法, 其包括投予有效量之一或多種式I化合物, 且併用有效量之一或多種LXR催動劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法, 其包括投予有效量之一或多種式I化合物, 且併用有效量之一或多種LRP擬似物。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法, 其包括投予有效量之一或多種式I化合物, 且併用有效量之一或多種5-HT₆受體拮抗劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法, 其包括投予有效量之一或多種式I化合物, 且併用有效量之一或多種菸鹼酸受體催動劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法, 其包括投予有效量之一或多種式I化合物, 且

併用有效量之一或多種H3受體拮抗劑。

本發明亦提供一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之一或多種組織蛋白脫乙酰酶抑制劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之一或多種hsp90抑制劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之一或多種m1蠅蕈鹼受體催動劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之一或多種5-HT₆受體拮抗劑、mGluR1或mGluR5正異位調節劑或催動劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之一或多種mGluR2/3拮抗劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之一或多種可降低神經發炎之消炎劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之一或多種前列腺素EP2受體拮抗劑。

本發明亦提供一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括

投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之一或多種PAI-1抑制劑。

本發明亦提供一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之一或多種可誘發A β 射流之藥劑，譬如膠索素(gelsolin)。

本發明亦提供一種治療Down氏徵候簇之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供一種治療Down氏徵候簇之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之式I化合物。

本發明亦提供一種治療Down氏徵候簇之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物，且併用有效量之一或多種膽鹼酯酶抑制劑(例如(±)-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯基甲基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多梟佩吉(donepezil)鹽酸鹽，可以Aricept®品牌之多梟佩吉(donepezil)鹽酸鹽取得)。

本發明亦提供一種治療Down氏徵候簇之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之式I化合物，且併用有效量之一或多種(例如一種)膽鹼酯酶抑制劑(例如(±)-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯基甲基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多梟佩吉(donepezil)鹽酸鹽，可以Aricept®品牌之多梟佩吉(donepezil)鹽酸鹽取得)。

本發明亦提供一種治療溫和認知力減弱之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I

化合物。

本發明亦提供一種治療青光眼之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供一種治療大腦澱粉狀蛋白血管病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供一種治療中風之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供一種治療癡呆症之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供一種治療微神經膠質病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供一種治療腦部發炎之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供一種治療嗅覺功能喪失之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種(例如一種)式I化合物。

本發明亦提供組合(意即醫藥組合物)，其包含有效量之一或多種(例如一種)式I化合物，且併用有效量之一或多種化合物，選自包括膽鹼酯酶抑制劑(例如(±)-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯基甲基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多梟佩吉(donepezil)鹽酸鹽，可以 Aricept® 品牌之多梟佩吉(donepezil)鹽酸鹽取得)、 $A\beta$ 抗體抑制劑、 γ 分泌酶

抑制劑及 β 分泌酶抑制劑。此醫藥組合物亦包含藥學上可接受之載劑。

本發明亦提供一種套件，其在個別容器中，於單一包裝中包含醫藥組合物，供使用於組合中，其中一個容器包含有效量之式I化合物在藥學上可接受之載劑中，而另一個容器(意即第二個容器)包含有效量之另一種醫藥活性成份(如上文所述)，該式I化合物與另一種醫藥活性成份之合併量係有效：(a)治療阿耳滋海默氏病，或(b)抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近，或(c)治療神經變性疾病，或(d)調節 γ -分泌酶之活性。

本發明之另一項具體實施例係針對式(I)化合物之藥學上可接受鹽，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對式(I)化合物之藥學上可接受酯，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對式(I)化合物之溶劑合物，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對呈單離形式之式(I)化

合物，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對呈純形式之式(I)化合物，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對呈純與單離形式之式(I)化合物，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)式(I)化合物，及藥學上可接受之載劑，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)式(I)化合物之藥學上可接受鹽，及藥學上可接受之載劑，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)式(I)化合物之藥學上可接受酯，

及藥學上可接受之載劑，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)式(I)化合物之溶劑合物，及藥學上可接受之載劑，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)式(I)化合物，與有效量之一或多種(例如一種)其他醫藥活性成份(例如藥物)，及藥學上可接受之載劑。其他醫藥活性成份之實例包括但不限於一些藥物，選自包括：(a)可用於治療阿耳滋海默氏病之藥物，(b)可用於抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近之藥物，(c)可用於治療神經變性疾病之藥物，及(d)可用於抑制 γ -分泌酶之藥物，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)式(I)化合物，與有效量之一或多種BACE抑制劑，及藥學上可接受之載劑，該式(I)

化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種膽鹼酯酶抑制劑(例如乙醯基-及/或丁醯基膽鹼酯酶抑制劑)，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種蠅蕈鹼拮抗劑(例如 m_1 催動劑或 m_2 拮抗劑)，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之也西隆(Exelon)(利發史替明(rivastigmine))，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1

至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1，與有效量之康葛尼斯 (Cognex) (塔克林 (tacrine))，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1，與有效量之 τ 激酶抑制劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1，與有效量之一或多種 τ 激酶抑制劑(例如 GSK3 β 抑制劑、cdk5 抑制劑、ERK 抑制劑)，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1，與有效量之一種抗-A β 疫苗(主動免疫作用)，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其

包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種APP配位體，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種會向上調節胰島素降解酵素及/或臬普溶素(neprilysin)之藥劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種膽固醇降低劑(例如制菌素，譬如阿托瓦制菌素(Atorvastatin)、弗伐制菌素(Fluvastatin)、洛伐制菌素(Lovastatin)、美伐制菌素(Mevastatin)、皮塔伐制菌素(Pitavastatin)、普拉伐制菌素(Pravastatin)、洛蘇伐制菌素(Rosuvastatin)、辛伐制菌素(Simvastatin)，及膽固醇吸收抑制劑，譬如也吉提麥伯(Ezetimibe))，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1

至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1，與有效量之一或多種纖維酸酯(例如氯苯丁酯(clofibrate)、氯纖酸化物(Clofibrider)、約托纖酸酯(Etofibrate)、鋁氯苯丁酯(Clofibrate))，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1，與有效量之一或多種 LXR 催動劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1，與有效量之一或多種 LRP 擬似物，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1，與有效量之一或多種 5-HT₆ 受體拮抗劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其

包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種菸鹼酸受體催動劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種H3受體拮抗劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種組織蛋白脫乙酰酶抑制劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種hsp90抑制劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其

包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種m1蠅蕈鹼受體催動劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種5-HT6受體拮抗劑、mGluR1或mGluR5正異位調節劑或催動劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種mGluR2/3拮抗劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種可降低神經發炎之消炎劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種前列腺素EP2受體拮抗劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種PAI-1抑制劑，及藥學上可接受之載劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種醫藥組合物，其包含有效量之一或多種(例如一種)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，與有效量之一或多種可誘發A β 射流之藥劑，譬如膠索素(gelsolin)，及藥學上可接受之載劑。

選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1之式I化合物可作為 γ 分泌酶調節劑使用，且可用於治療與預防疾病，例如中樞神經系統病症(譬如阿耳滋海默氏疾病與Down氏徵候簇)，及治療溫和認知力減弱、青光眼、大腦澱粉狀蛋白血管病、中風、

癡呆症、微神經膠質病、腦部發炎及嗅覺功能喪失。

因此，本發明之另一項具體實施例係針對一種調節(包括抑制、拮抗等) γ -分泌酶之方法，其包括對需要此種治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之一或多種(例如一種)式(I)化合物，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對一種調節(包括抑制、拮抗等) γ -分泌酶之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式(I)化合物，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療一或多種神經變性疾病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之一或多種(例如一種)式(I)化合物，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療一或多種神經變性疾病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式(I)化合物，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、

O4_1 及 P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對一種抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之一或多種(例如一種)式(I)化合物，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對一種抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式(I)化合物，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之一或多種(例如一種)式(I)化合物，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式(I)化合物，該式(I)化合物係選自包括：1至

24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療溫和認知力減弱、青光眼、大腦澱粉狀蛋白血管病、中風、癡呆症、微神經膠質病、腦部發炎或嗅覺功能喪失之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之一或多種(例如一種)式(I)化合物，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療溫和認知力減弱、青光眼、大腦澱粉狀蛋白血管病、中風、癡呆症、微神經膠質病、腦部發炎或嗅覺功能喪失之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式(I)化合物，該式(I)化合物係選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明亦提供組合療法，以供(1)調節 γ -分泌酶，或(2)治療一或多種神經變性疾病，或(3)抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近，或(4)治療阿耳滋海默氏病。此組合療法係針對包括投予一或多種(例如一種)式(I)化合物及投予一或多種(例如一種)其他醫藥活性成份(例如藥物)之方法。式(I)化合物

及其他藥物可個別地(意即每一個係以其自有之個別劑型)投予，或式(I)化合物可與其他藥物合併在相同劑型中。

因此，本發明之其他具體實施例係針對本文中所述之任一種治療方法或抑制方法，其中式(I)化合物係併用有效量之一或多種其他醫藥活性成份，選自包括：BACE抑制劑(β 分泌酶抑制劑)；蠅蕈鹼拮抗劑(例如 m_1 催動劑或 m_2 拮抗劑)；膽鹼酯酶抑制劑(例如乙醯基-及/或丁醯基膽鹼酯酶抑制劑)； γ 分泌酶抑制劑； γ 分泌酶調節劑；HMG-CoA還原酶抑制劑；非類固醇消炎劑；N-甲基-D-天冬胺酸鹽受體拮抗劑；抗-澱粉狀蛋白抗體；維生素E；菸鹼酸乙醯膽鹼受體催動劑；CB1受體逆催動劑或CB1受體拮抗劑；抗生素；生長激素促分泌素；組織胺H3拮抗劑；AMPA催動劑；PDE4抑制劑；GABA_A逆催動劑；澱粉狀蛋白聚集之抑制劑；糖原合成酶激酶 β 抑制劑； α 分泌酶活性之促進劑；PDE-10抑制劑；也西隆(Exelon)(利發史替明(rivastigmine))；康葛尼斯(Cognex)(塔克林(tacrine))； τ 激酶抑制劑(例如GSK3 β 抑制劑、cdk5抑制劑或ERK抑制劑)；抗-A β 疫苗；APP配位體；會向上調節胰島素之藥劑，膽固醇降低劑(例如制菌素，譬如阿托瓦制菌素(Atorvastatin)、弗伐制菌素(Fluvastatin)、洛伐制菌素(Lovastatin)、美伐制菌素(Mevastatin)、皮塔伐制菌素(Pitavastatin)、普拉伐制菌素(Pravastatin)、洛蘇伐制菌素(Rosuvastatin)、辛伐制菌素(Simvastatin))；膽固醇吸收抑制劑(譬如也吉提麥伯(Ezetimibe))；纖維酸酯(例如氯苯丁酯(clofibrate)、氯纖酸化物(Clofibrider)、約托纖酸酯(Etofibrate)及

鋁氯苯丁酯 (Clofibrate)); LXR 催動劑; LRP 擬似物; 菸鹼酸受體催動劑; H3 受體拮抗劑; 組織蛋白脫乙酰酶抑制劑; hsp90 抑制劑; m1 蠅蕈鹼受體催動劑; 5-HT6 受體拮抗劑; mGluR1; mGluR5; 正異位調節劑或催動劑; mGluR2/3 拮抗劑; 可降低神經發炎之消炎劑; 前列腺素 EP2 受體拮抗劑; PAI-1 抑制劑; 及可誘發 A β 射流之藥劑, 譬如膠索素 (gelsolin)。

本發明亦提供組合療法, 以供 (1) 調節 γ -分泌酶, 或 (2) 治療一或多種神經變性疾病, 或 (3) 抑制澱粉狀蛋白質 (例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質) 沉積於神經組織 (例如腦部) 中、其上或附近, 或 (4) 治療阿耳滋海默氏病。此組合療法係針對包括投予一或多種 (例如一種) 式 (I) 化合物, 選自包括: 1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1, 及投予一或多種 (例如一種) 其他醫藥活性成份 (例如藥物) 之方法。式 1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1 化合物及其他藥物可個別地 (意即每一個係以其自有之個別劑型) 投予, 或式 1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1 化合物可與其他藥物合併在相同劑型中。

因此, 本發明之其他具體實施例係針對本文中所述之任一種治療方法或抑制方法, 其中選自包括: 1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、

I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1之式(I)化合物係併用有效量之一或多種其他醫藥活性成份，選自包括：BACE抑制劑(β 分泌酶抑制劑)、蠅蕈鹼拮抗劑(例如 m_1 催動劑或 m_2 拮抗劑)、膽鹼酯酶抑制劑(例如乙醯基-及/或丁醯基膽鹼酯酶抑制劑)； γ 分泌酶抑制劑； γ 分泌酶調節劑；HMG-CoA還原酶抑制劑；非類固醇消炎劑；N-甲基-D-天冬胺酸鹽受體拮抗劑；抗-澱粉狀蛋白抗體；維生素E；菸鹼酸乙醯膽鹼受體催動劑；CB1受體逆催動劑或CB1受體拮抗劑；抗生素；生長激素促分泌素；組織胺H3拮抗劑；AMPA催動劑；PDE4抑制劑；GABA_A逆催動劑；澱粉狀蛋白聚集之抑制劑；糖原合成酶激酶 β 抑制劑； α 分泌酶活性之促進劑；PDE-10抑制劑；也西隆(Exelon)(利發史替明(rivastigmine))；康葛尼斯(Cognex)(塔克林(tacrine))； τ 激酶抑制劑(例如GSK3 β 抑制劑、cdk5抑制劑或ERK抑制劑)；抗-A β 疫苗；APP配位體；會向上調節胰島素之藥劑，膽固醇降低劑(例如制菌素，譬如阿托瓦制菌素(Atorvastatin)、弗伐制菌素(Fluvastatin)、洛伐制菌素(Lovastatin)、美伐制菌素(Mevastatin)、皮塔伐制菌素(Pitavastatin)、普拉伐制菌素(Pravastatin)、洛蘇伐制菌素(Rosuvastatin)、辛伐制菌素(Simvastatin))；膽固醇吸收抑制劑(譬如也吉提麥伯(Ezetimibe))；纖維酸酯(例如氯苯丁酯(clofibrate)、氯纖維酸化物(Clofibrider)、約托纖維酸酯(Etofibrate)及鋁氯苯丁酯(Clofibrate))；LXR催動劑；LRP擬似物；菸鹼酸受體催動劑；H3受體拮抗劑；組織蛋白脫乙醯酶抑制劑；hsp90抑制劑； m_1 蠅蕈鹼

受體催動劑；5-HT₆受體拮抗劑；mGluR1；mGluR5；正異位調節劑或催動劑；mGluR2/3拮抗劑；可降低神經發炎之消炎劑；前列腺素EP2受體拮抗劑；PAI-1抑制劑；及可誘發A β 射流之藥劑，譬如膠索素(gelsolin)。

本發明之其他具體實施例係針對本文中所述之任一種治療方法或抑制方法，其中選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1之式(I)化合物係併用有效量之一或多種其他醫藥活性成份，選自包括：BACE抑制劑(β 分泌酶抑制劑)、蠅蕈鹼拮抗劑(例如m₁催動劑或m₂拮抗劑)、膽鹼酯酶抑制劑(例如乙醯基-及/或丁醯基膽鹼酯酶抑制劑)； γ 分泌酶抑制劑； γ 分泌酶調節劑；HMG-CoA還原酶抑制劑；非類固醇消炎劑；N-甲基-D-天冬胺酸鹽受體拮抗劑；抗-澱粉狀蛋白抗體；維生素E；菸鹼酸乙醯膽鹼受體催動劑；CB1受體逆催動劑或CB1受體拮抗劑；抗生素；生長激素促分泌素；組織胺H3拮抗劑；AMPA催動劑；PDE4抑制劑；GABA_A逆催動劑；澱粉狀蛋白聚集之抑制劑；糖原合成酶激酶 β 抑制劑； α 分泌酶活性之促進劑；PDE-10抑制劑；及膽固醇吸收抑制劑(例如也吉提麥伯(ezetimibe))。

本發明之其他具體實施例係針對本文中所述之任一種治療方法或抑制方法，其中選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1之式(I)

化合物係併用有效量之一或多種其他醫藥活性成份，選自包括：也西隆 (Exelon) (利發史替明 (rivastigmine))；康葛尼斯 (Cognex) (塔克林 (tacrine))； τ 激酶抑制劑 (例如 GSK3 β 抑制劑、cdk5 抑制劑或 ERK 抑制劑)；抗-A β 疫苗；APP 配位體；會向上調節胰島素之藥劑，膽固醇降低劑 (例如制菌素，譬如阿托瓦制菌素 (Atorvastatin)、弗伐制菌素 (Fluvastatin)、洛伐制菌素 (Lovastatin)、美伐制菌素 (Mevastatin)、皮塔伐制菌素 (Pitavastatin)、普拉伐制菌素 (Pravastatin)、洛蘇伐制菌素 (Rosuvastatin)、辛伐制菌素 (Simvastatin))；膽固醇吸收抑制劑 (譬如也吉提麥伯 (Ezetimibe))；纖維酸酯 (例如氯苯丁酯 (clofibrate)、氯纖維酸化物 (Clofibrider)、約托纖維酸酯 (Etofibrate) 及鋁氯苯丁酯 (Clofibrate))；LXR 催動劑；LRP 擬似物；菸鹼酸受體催動劑；H3 受體拮抗劑；組織蛋白脫乙酰酶抑制劑；hsp90 抑制劑；m1 蠅蕈鹼受體催動劑；5-HT₆ 受體拮抗劑；mGluR1；mGluR5；正異位調節劑或催動劑；mGluR2/3 拮抗劑；可降低神經發炎之消炎劑；前列腺素 EP2 受體拮抗劑；PAI-1 抑制劑；及可誘發 A β 射流之藥劑，譬如膠索素 (gelsolin)。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效 (意即治療上有效) 量之一或多種 (例如一種) 式 (I) 化合物，選自包括：1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1，且併用有效 (意即治療上有效) 量之一或多種膽鹼酯酶抑制劑 (例如 (±)-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯基甲

基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多臬佩吉 (donepezil) 鹽酸鹽，可以 Aricept® 品牌之多臬佩吉 (donepezil) 鹽酸鹽取得)。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式(I)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，且併用有效(意即治療上有效)量之一或多種(例如一種)膽鹼酯酶抑制劑(例如(±)-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯基甲基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多臬佩吉 (donepezil) 鹽酸鹽，可以 Aricept® 品牌之多臬佩吉 (donepezil) 鹽酸鹽取得)。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效(意即治療上有效)量之一或多種(例如一種)式(I)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，且併用有效(意即治療上有效)量之一或多種化合物，選自包括Aβ抗體抑制劑、γ分泌酶抑制劑及β分泌酶抑制劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效(意即治療上有效)量之一或多種(例如一種)式(I)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、

J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，且併用有效(意即治療上有效)量之一或多種BACE抑制劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括投予有效(意即治療上有效)量之式(I)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1，且併用有效(意即治療上有效)量之一或多種BACE抑制劑。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療Down氏徵候簇之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之一或多種(例如一種)式(I)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療Down氏徵候簇之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式(I)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療Down氏徵候簇之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之一或多種(例如一種)式(I)化合物，選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、

O4_1 及 P8_1，且併用有效(意即治療上有效)量之一或多種膽鹼酯酶抑制劑(例如(±)-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯基甲基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多臬佩吉(donepezil)鹽酸鹽，可以 Aricept® 品牌之多臬佩吉(donepezil)鹽酸鹽取得)。

本發明之另一項具體實施例係針對一種治療 Down 氏徵候簇之方法，其包括對需要治療之病患投予有效(意即治療上有效)量之式(I)化合物，選自包括：1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1，且併用有效(意即治療上有效)量之一或多種(例如一種)膽鹼酯酶抑制劑(例如(±)-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯基甲基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多臬佩吉(donepezil)鹽酸鹽，可以 Aricept® 品牌之多臬佩吉(donepezil)鹽酸鹽取得)。

本發明之另一項具體實施例係針對組合(意即醫藥組合物)，其包含有效(意即治療上有效)量之一或多種(例如一種)式(I)化合物，選自包括：1 至 24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1 及 P8_1，且併用有效(意即治療上有效)量之一或多種化合物，選自包括膽鹼酯酶抑制劑(例如(±)-2,3-二氫-5,6-二甲氧基-2-[[1-(苯基甲基)-4-六氫吡啶基]甲基]-1H-茛-1-酮鹽酸鹽，意即多臬佩吉(donepezil)鹽酸鹽，可以 Aricept® 品牌之多臬佩吉(donepezil)鹽

酸鹽取得)、 $A\beta$ 抗體抑制劑、 γ 分泌酶抑制劑及 β 分泌酶抑制劑。此醫藥組合物亦包含藥學上可接受之載劑。

本發明亦提供一種套件，其在個別容器中，於單一包裝中包含醫藥組合物，供使用於組合中，其中一個容器包含有效量之一或多種(例如一種)式(I)化合物(例如選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1之化合物)在藥學上可接受之載劑中，而另一個容器(意即第二個容器)包含有效量之另一種醫藥活性成份(如上文所述)，該式(I)化合物與另一種醫藥活性成份之合併量係有效：(a)治療阿耳滋海默氏病，或(b)抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)中、其上或附近，或(c)治療神經變性疾病，或(d)調節 γ -分泌酶之活性。

本發明亦提供一種套件，其在個別容器中，於單一包裝中包含醫藥組合物，供使用於組合中，其中一個容器包含有效量之化合物，選自包括式(I)化合物(例如選自包括：1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1之化合物)在藥學上可接受之載劑中，而另一個容器(意即第二個容器)包含有效量之另一種醫藥活性成份(如上文所述)，式(I)化合物與另一種醫藥活性成份之合併量係有效：(a)治療阿耳滋海默氏病，或(b)抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織(例如腦部)

中、其上或附近，或(c)治療神經變性疾病，或(d)調節 γ -分泌酶之活性。

本發明之其他具體實施例係針對上述治療方法、醫藥組合物或套件之任一個，其中式I化合物為化合物1至24、B10-B21、C5-C10、D9-D26、G4-G9、H3-H11、I5、I6、I6A、I7、I8、I8A、J4-J9、K1-K6、L4-L8、M5-M15、N6-N23、O4_1及P8_1之任一種。

膽鹼酯酶抑制劑之實例為塔克林(tacrine)、多梟佩吉(donepezil)、利發史替明(rivastigmine)、雪花蓮胺、吡啶斯的明及新斯的明，其中塔克林(tacrine)、多梟佩吉(donepezil)、利發史替明(rivastigmine)及雪花蓮胺為較佳。

m_1 催動劑之實例係為此項技藝中已知。 m_2 拮抗劑之實例亦為此項技藝中已知；特定言之， m_2 拮抗劑係揭示於美國專利5,883,096；6,037,352；5,889,006；6,043,255；5,952,349；5,935,958；6,066,636；5,977,138；6,294,554；6,043,255；及6,458,812中；及於WO03/031412中，其全部均併於本文供參考。

BACE抑制劑之實例包括以下中所述者：06/02/2005公告之US2005/0119227（亦參閱02/24/2005公告之WO2005/016876）、02/24/2005公告之US2005/0043290（亦參閱02/17/2005公告之WO2005/014540）、06/30/2005公告之WO2005/058311（亦參閱03/29/2007公告之US2007/0072852）、05/25/2006公告之US2006/0111370（亦參閱06/22/2006公告之WO2006/065277）、02/23/2007提出申請之美國專利申請案序號11/710582、02/23/2006公告之US2006/0040994（亦參閱02/09/2006公告之WO2006/014762）、

02/09/2006 公告之 WO2006/014944 (亦參閱 02/23/2006 公告之 US2006/0040948)、12/28/2006 公告之 WO2006/138266 (亦參閱 01/11/2007 公告之 US2007/0010667)、12/28/2006 公告之 WO2006/138265、12/28/2006 公告之 WO2006/138230、12/28/2006 公告之 WO2006/138195 (亦參閱 12/14/2006 公告之 US2006/0281729)、12/28/2006 公告之 WO2006/138264 (亦參閱 03/15/2007 公告之 US2007/0060575)、12/28/2006 公告之 WO2006/138192 (亦參閱 12/14/2006 公告之 US2006/0281730)、12/28/2006 公告之 WO2006/138217 (亦參閱 12/21/2006 公告之 US2006/0287294)、05/03/2007 公告之 US2007/0099898 (亦參閱 05/03/2007 公告之 WO2007/050721)、05/10/2007 公告之 WO2007/053506 (亦參閱 05/03/2007 公告之 US2007/099875)、06/07/2007 提出申請之美國專利申請案序號 11/759336、12/12/2006 提出申請之美國專利申請案序號 60/874362 及 12/12/2006 提出申請之美國專利申請案序號 60/874419，各揭示內容係併於本文供參考。

對於從本發明所述之化合物製備醫藥組合物而言，惰性藥學上可接受之載劑可為無論是固體或液體。固體形式製劑包括粉末、片劑、可分散顆粒、膠囊、扁囊劑及栓劑。粉末與片劑可包含約 5 至約 95 百分比之活性成份。適當固體載劑為此項技藝中已知，例如碳酸鎂、硬脂酸鎂、滑石、糖或乳糖。片劑、粉末、扁囊劑及膠囊可作為適於口服投藥之固體劑型使用。藥學上可接受載劑之實例及各種組合物之製法，可參閱 A. Gennaro (編著)，*Remington 氏醫藥科學*，第 18 版 (1990)，Mack 出版公司，Easton, Pennsylvania。

液體形式製劑包括溶液、懸浮液及乳化液。以下述作為實例，可指出水或水-丙二醇溶液用於非經腸注射，或添加增甜劑與遮光劑，用於口服溶液、懸浮液及乳化液。液體形式製劑亦可包括供鼻內投藥之溶液。

適用於吸入之氣溶膠製劑可包括溶液及呈粉末形式之固體，其可併用藥學上可接受之載劑，譬如惰性壓縮氣體，例如氮。

亦包括固體形式製劑，其係意欲在使用之前不久，被轉化成液體形式製劑，無論是供口服或非經腸投藥。此種液體形式包括溶液、懸浮液及乳化液。

本發明化合物亦可以經皮方式傳輸。經皮組合物可採取乳膏、洗劑、氣溶膠及/或乳化液之形式，並可被包含在基質或儲器型之經皮貼藥中，如同此項技藝中習用於此項目的之方式。

本發明化合物亦可以皮下方式傳輸。

化合物較佳係以經口方式投藥。

此醫藥製劑較佳係呈單位劑型。在此種形式中，製劑係被再分成適當大小之單位劑量，含有適當量之活性成份，例如達成所要目的之有效量。

活性化合物在單位劑量製劑中之量，可以改變或調整，從約1毫克至約100毫克，較佳為約1毫克至約50毫克，更佳為約1毫克至約25毫克，根據特定應用而定。

所採用之實際劑量可依病患之需要量及被治療症狀之嚴重性而改變。測定對於特定狀況之適當劑量服法，係在此

項技藝之技術範圍內。為方便起見，可將總日服劑量區分，並在一天期間內分次投予，按需要而定。

本發明化合物及/或其藥學上可接受鹽之投藥量與頻率係根據負責臨床師之判斷作調整，考慮到一些因素，譬如病患之年齡、症狀及大小以及被治療病徵之嚴重性。對口服投藥之典型建議每日劑量服法，可涵蓋從約1毫克/天至約500毫克/天之範圍，較佳為1毫克/天至200毫克/天，在二至四份分離劑量中。

本發明之另一方面為一種套件，其包含治療上有效量之至少一種式I化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯或前體藥物，及藥學上可接受之載劑、媒劑或稀釋劑。

本發明之又另一方面為一種套件，其包含量至少一種式I化合物，或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯或前體藥物，及一數量之上文列示之至少一種其他藥劑，其中該兩種或多種成份之量會造成所要之治療效果。

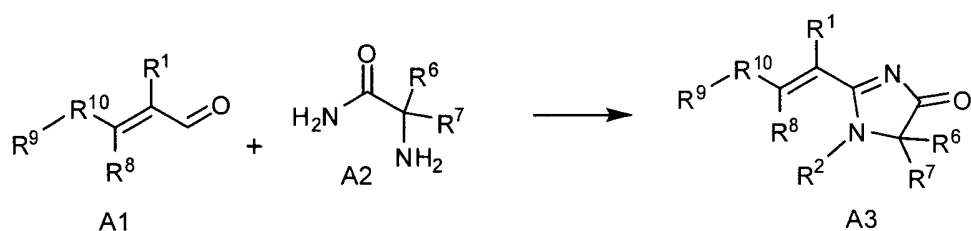
【實施方式】

於本文中所揭示之本發明，係以下述說明性實例舉例，其不應被解釋為限制揭示內容之範圍。替代之機制途徑與類似結構，將為熟諳此藝者所顯而易見。

在提出NMR數據之情況下， ^1H 光譜係於無論是Varian VXR-200 (200 MHz, ^1H)、Varian Gemini-300 (300 MHz) 或 XL-400 (400 MHz) 上獲得，且以距 Me_4Si 低磁場之ppm作報告，其中質子數、多重性及偶合常數(以赫茲表示)係以括弧方式指示。

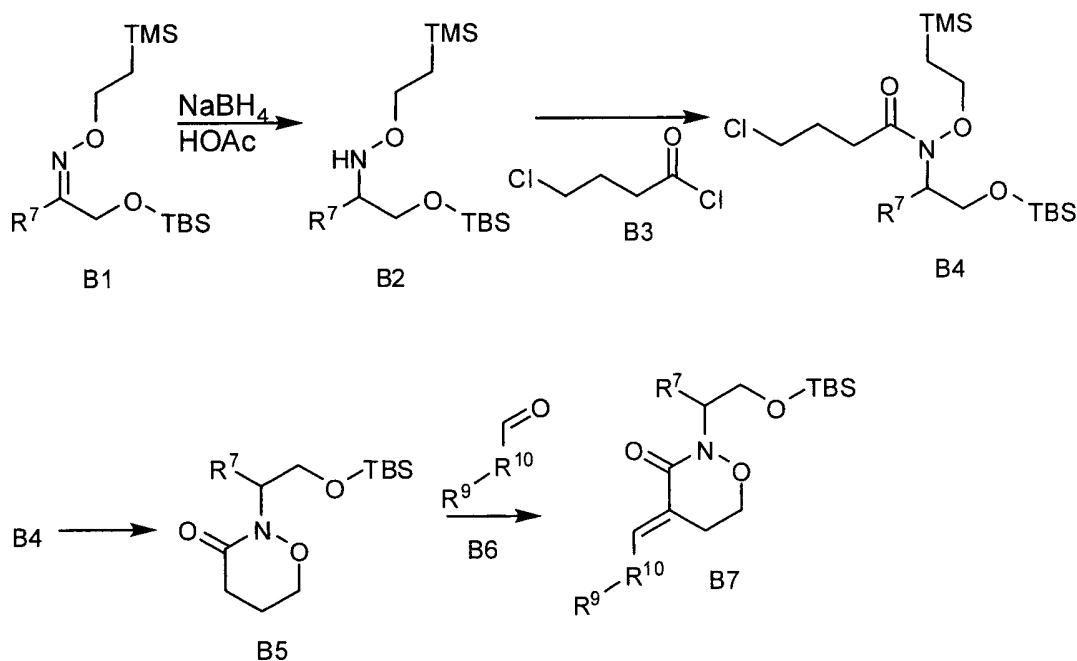
在提出 LC/MS 數據之情況下，分析係使用 Applied Biosystems API-100 質譜儀與 Shimadzu SCL-10A LC 管柱進行：Altech 鉑 C18, 3 微米, 33 毫米 x 7 毫米 內徑；梯度液流量：0 分鐘 - 10% CH₃ CN, 5 分鐘 - 95% CH₃ CN, 7 分鐘 - 95% CH₃ CN, 7.5 分鐘 - 10% CH₃ CN, 9 分鐘 - 終止。給予所發現之母離子。

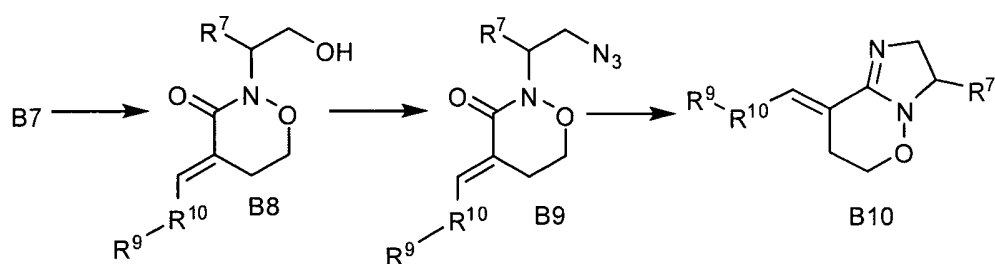
方法 A



於 A1 ($R^1 = H$, $R^8 = H$, $R^{10} = 3$ -(甲氧基)苯基, $R^9 = 4$ -(4-Me-咪唑基)) 與 A2 ($R^6 = Me$, $R^7 = 4$ -氟苯基) 之二氯甲烷溶液中，添加 N-氯基琥珀醯亞胺，並將反應混合物攪拌過夜，接著處理，獲得化合物 A3 ($R^2 = H$, $R^8 = H$, $R^{10} = 3$ -(甲氧基)苯基, $R^9 = 4$ -(4-Me-咪唑基), $R^6 = Me$, $R^7 = 4$ -氟苯基)。

方法 B





方法 B 步驟 1；

使得自相應之酮與肼之化合物 **B1** ($R^7 = p\text{-F-Ph}$) 還原成羥胺，使用 NaBH_4 與 HOAc 作為溶劑，獲得化合物 **B2** ($R^7 = p\text{-F-Ph}$)。

方法 B 步驟 2；

使用標準醯胺形成條件，使化合物 **B2** ($R^7 = p\text{-F-Ph}$) 轉化成 **B4** ($R^7 = p\text{-F-Ph}$)。

方法 B 步驟 3；

將化合物 **B4** ($R^7 = p\text{-F-Ph}$) 以 1.5 當量 TBAF 處理，經過三甲基矽烷基乙基之選擇性去除保護，接著為環化作用，產生化合物 **B5** ($R^7 = p\text{-F-Ph}$)。

方法 B 步驟 4

將化合物 **B5** ($R^7 = p\text{-F-Ph}$) 以 LDA，接著以化合物 **B6** ($R^9 = 4\text{-(4'-甲基咪唑-1-基)}$) 與 $R^{10} = 3\text{-MeO 苯基}$) 處理，獲得化合物 **B7** ($R^7 = p\text{-F-Ph}$ ， $R^9 = 4\text{-(4'-甲基咪唑-1-基)}$ 及 $R^{10} = 3\text{-MeO 苯基}$)。

方法 B 步驟 5

將化合物 **B7** ($R^7 = p\text{-F-Ph}$ ， $R^9 = 4\text{-(4'-甲基咪唑-1-基)}$ 及 $R^{10} = 3\text{-MeO 苯基}$) 以 TFA 處理，獲得化合物 **B8** ($R^7 = p\text{-F-Ph}$ ， $R^9 = 4\text{-(4'-甲基咪唑-1-基)}$ 及 $R^{10} = 3\text{-MeO 苯基}$)。

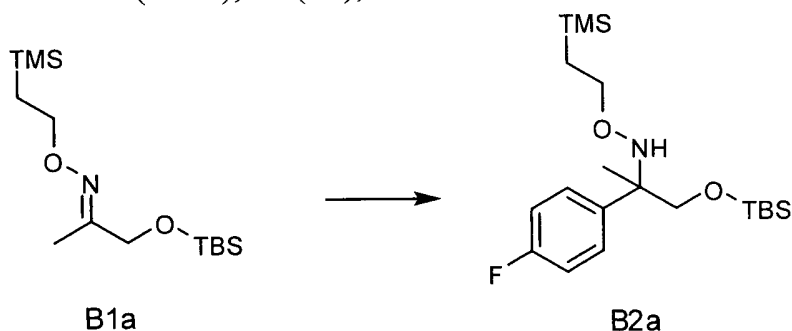
方法 B 步驟 6

將化合物 **B8** ($R^7 = p\text{-F-Ph}$, 4-(4-甲基咪唑-1-基) 及 $R^{10} = 3\text{-MeO}$ 苯基) 以 DPPA 處理, 獲得化合物 **B9** ($R^7 = p\text{-F-Ph}$, $R^9 = 4\text{-(4'-甲基咪唑-1-基)}$ 及 $R^{10} = 3\text{-MeO}$ 苯基)。

方法 B 步驟 7

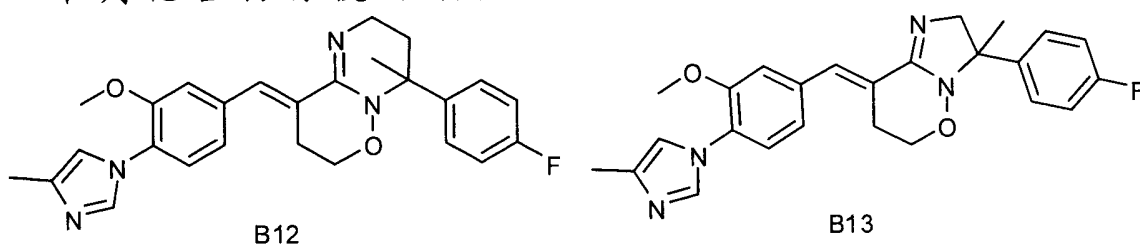
將化合物 **B9** ($R^7 = p\text{-F-Ph}$, $R^9 = 4\text{-(4'-甲基咪唑-1-基)}$ 及 $R^{10} = 3\text{-MeO}$ 苯基), 以三丁基磷在回流甲苯中處理, 獲得化合物 **B10A** ($R^7 = p\text{-F-Ph}$, $R^9 = 4\text{-(4'-甲基咪唑-1-基)}$ 及 $R^{10} = 3\text{-MeO}$ 苯基)。

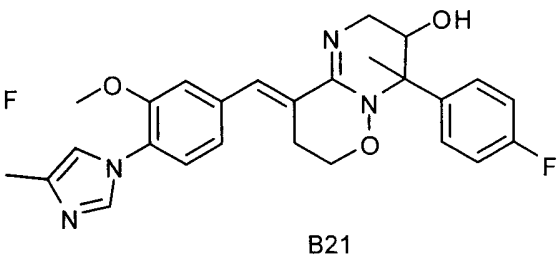
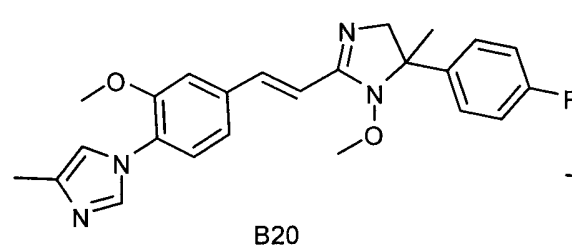
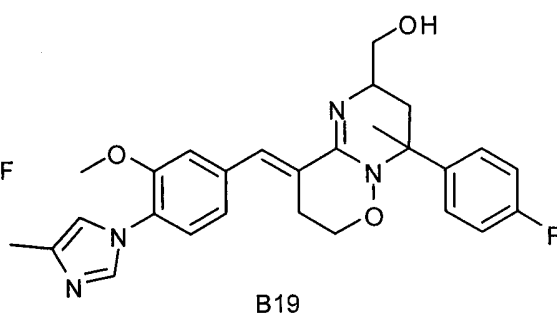
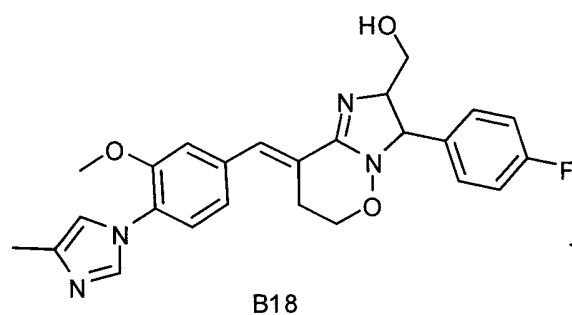
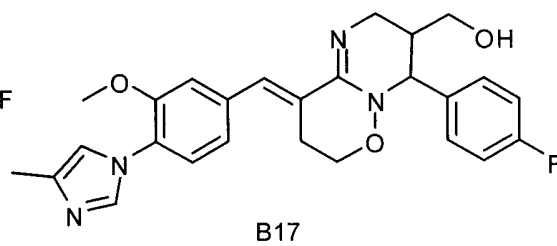
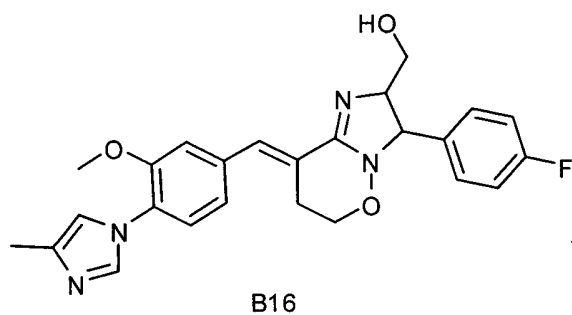
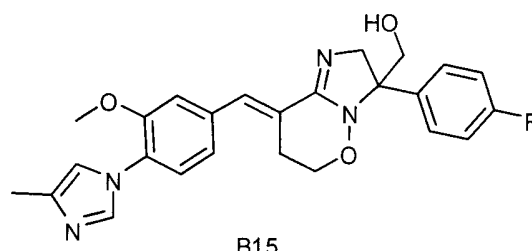
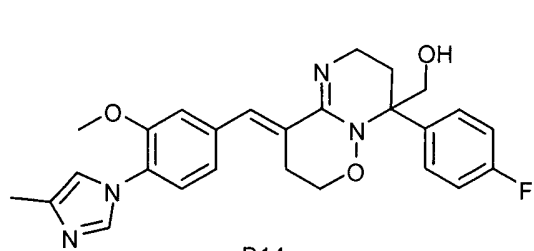
或者, **B2** 之類似物可使用類似下述方法產生: 有機鋰試劑之非對映異構選擇性添加至經保護赤蘚酮糖脞醚類之 $C=N$ 鍵結. 對掌純 α, α -二取代- α -胺基酸之合成 Marco, J. Alberto; Carda, Miguel; Murga, Juan; Gonzalez, Florenci; Falomir, Eva. *Tetrahedron Letters* (1997), **38**(10), 1841-1844。



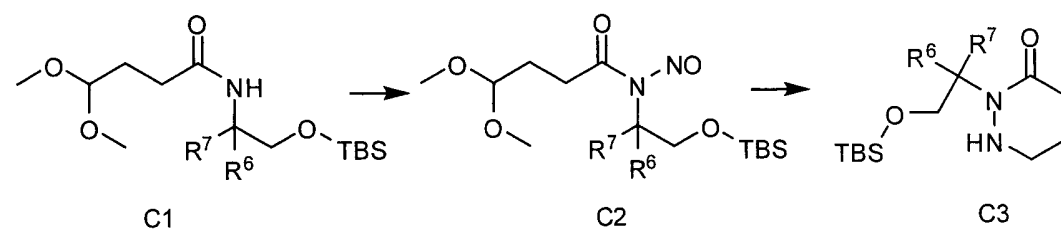
於 **B1a** 之醚溶液中, 添加苯基鋰, 獲得化合物 **B2a**, 將其應用至方法 B 中之合成途徑之其餘部份。

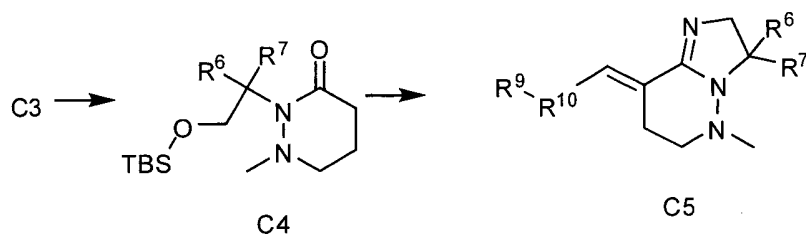
下列化合物係使用類似方法 B 之方法合成。





方法 C





方法 C 步驟 1

化合物 C1 ($R^6 = \text{Me}$, $R^7 = \text{對-F-苯基}$), 其係經過醯胺偶合化學, 使用相應之酸與胺獲得, 使其轉化成 N-亞硝基產物 C2 ($R^6 = \text{Me}$, $R^7 = \text{對-F-苯基}$), 利用類似下述文獻之條件: 碳環族三唑核苷及其類似物之對掌選擇性合成: 線性對會聚途徑. Kuang, R.; Ganguly, A. K.; Chan, T.-M.; Pramanik, B. N.; Blythin, D. J.; McPhail, A. T.; Saksena, A. K. *Tetrahedron Letters* (2000), **41**(49), 9575-9579。

方法 C 步驟 2

將 C2 ($R^6 = \text{Me}$, $R^7 = \text{對-F-苯基}$) 以 $\text{Zn}/\text{HOAc}/\text{H}_2\text{O}$ 處理, 獲得化合物 C3 ($R^6 = \text{Me}$, $R^7 = \text{對-F-苯基}$)。

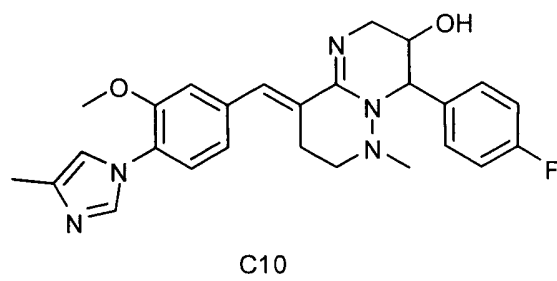
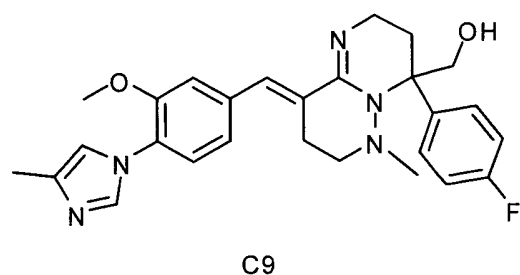
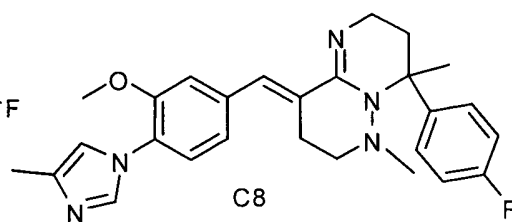
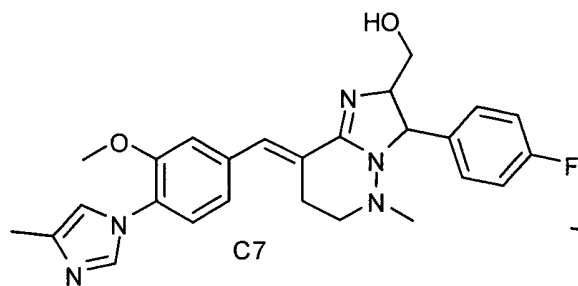
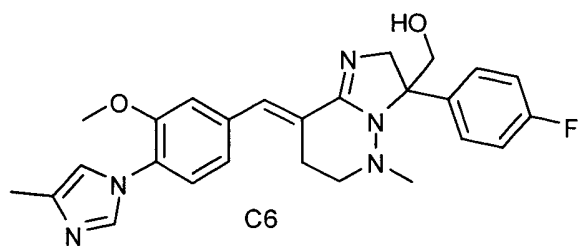
方法 C 步驟 3

將化合物 C3 ($R^6 = \text{Me}$, $R^7 = \text{對-F-苯基}$) 以 NaH , 接著以 MeI 處理, 獲得化合物 C4 ($R^6 = \text{Me}$, $R^7 = \text{對-F-苯基}$)。

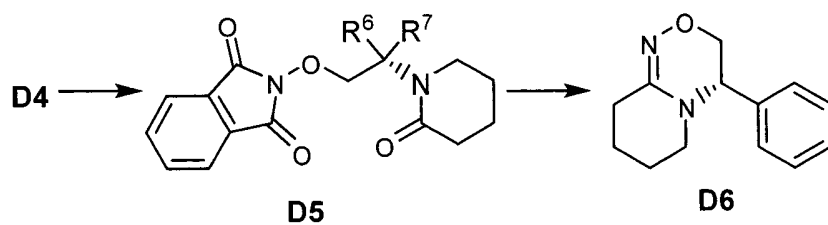
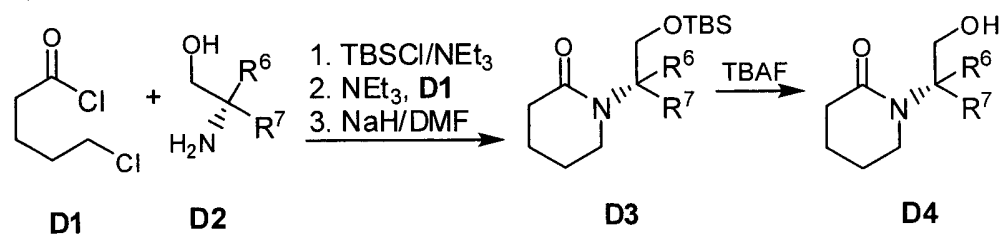
方法 C 步驟 4

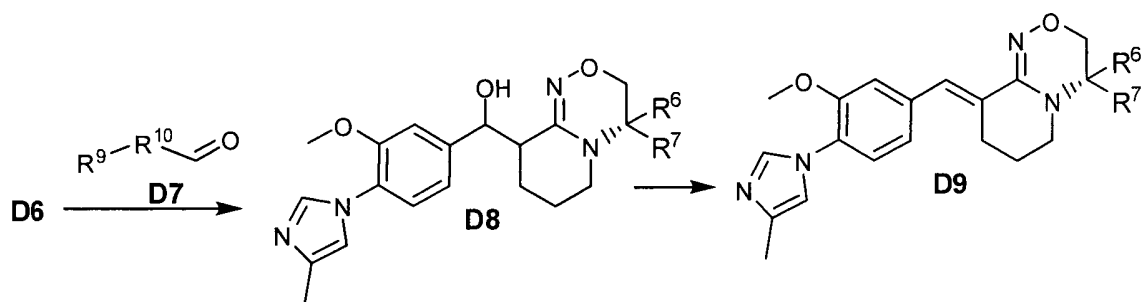
使用類似方法 B 步驟 4、5、6 及 7 之程序, 使化合物 C4 ($R^6 = \text{Me}$, $R^7 = \text{對-F-苯基}$) 轉化成化合物 C5 ($R^6 = \text{Me}$, $R^7 = \text{對-F-苯基}$, $R^9 = 4\text{-(4-甲基咪唑-1-基)}$, $R^{10} = 3\text{-MeO 苯基}$)。

下列化合物係使用類似方法 C 之方法獲得:



方法 D





方法 D 步驟 1：

於室溫下，將 CH_2Cl_2 (10 毫升) 中之 TBSCl (5.6 克，37.2 毫莫耳) 逐滴添加至 **D2** ((S), $\text{R}^6 = \text{H}$, $\text{R}^7 = \text{Ph}$) (5.1 克，37.2 毫莫耳)、 NEt_3 (10.4 毫升，74.4 毫莫耳) 及 DMAP (20 毫克) 在 CH_2Cl_2 (20) 中之溶液內。然後，將混合物攪拌過夜。以 CH_2Cl_2 (200 毫升) 與 NH_4Cl 溶液 (30 毫升) 稀釋混合物。將有機層以水、鹽水洗滌，以 MgSO_4 脫水乾燥，及濃縮，獲得粗產物 (6.0 克)，使其溶於 CH_2Cl_2 (50 毫升) 中，並以 NEt_3 (3.8 毫升，27.45 毫莫耳) 處理。在 0°C 下，將化合物 **D1** 逐滴添加至混合物中。將所形成之反應混合物於室溫下攪拌過夜。以 EtOAc (200 毫升) 與 NaHCO_3 溶液 (40 毫升) 稀釋混合物。將有機層以水、鹽水洗滌，以 MgSO_4 脫水乾燥，及濃縮，獲得粗產物。在室溫下，使粗製殘留物溶於 DMF (50 毫升) 中，並以 NaH (1.25 克，28.6 毫莫耳，60%，在石蠟中) 處理。接著，將所形成之混合物於 60°C 下加熱過夜。以 EtOAc (200 毫升) 與 NH_4Cl 水溶液 (40 毫升) 稀釋混合物。將有機層以水 (3x)、鹽水洗滌，以 MgSO_4 脫水乾燥，及濃縮，獲得粗產物，使其藉管柱層析純化，以 EtOAc /己烷溶離，產生化合物 **D3** ((S), $\text{R}^6 = \text{H}$, $\text{R}^7 = \text{Ph}$; 5.0 克)。

方法 D 步驟 2：

將 TBAF (3.15 毫升, 3.15 毫莫耳, 1.0M, 在 THF 中) 逐滴添加至化合物 **D3** ((S), $R^6 = H$, $R^7 = Ph$; 0.7 克, 2.1 毫莫耳) 在 THF (10 毫升) 中之溶液內。將混合物攪拌 2 小時, 然後, 將其以 EtOAc (100 毫升) 與 HCl 溶液 (20 毫升, 0.5M) 稀釋。將有機層以水、鹽水洗滌, 以 $MgSO_4$ 脫水乾燥, 及濃縮, 獲得粗產物, 使其藉管柱層析純化, 以 EtOAc/己烷溶離, 產生羥基化合物 **D4** ((S), $R^6 = H$, $R^7 = Ph$; 0.44 克)。

方法 D 步驟 3:

於室溫下, 將 PBu_3 (0.2 毫升, 0.82 毫莫耳) 添加至化合物 **D4** ((S), $R^6 = H$, $R^7 = Ph$; 0.1 克, 0.457 毫莫耳)、ADDP (0.2 克, 0.82 毫莫耳) 及鄰苯二甲醯亞胺 (0.12 克, 0.685 毫莫耳) 在 THF (5 毫升) 中之溶液內。然後, 將所形成之混合物在 $80^\circ C$ 下加熱 2 小時。以 EtOAc (100 毫升) 與 $NaHCO_3$ 溶液 (20 毫升) 稀釋混合物。將有機層以 $NaHCO_3$ 溶液、鹽水洗滌, 以 $MgSO_4$ 脫水乾燥, 及濃縮, 獲得粗產物, 使其藉管柱層析純化, 以 EtOAc/己烷溶離, 產生化合物 **D5** ((S), $R^6 = H$, $R^7 = Ph$; 0.1 克, 0.457 毫莫耳, 0.14 克)。

方法 D 步驟 4:

於室溫下, 將 $NH_2NH_2 \cdot xH_2O$ (54.4 微升, 1.12 毫莫耳) 添加至化合物 **D5** ((S), $R^6 = H$, $R^7 = Ph$; 0.14 克, 0.373 毫莫耳) 在 MeOH (2.0 毫升) 與 CH_2Cl_2 (2.0 毫升) 中之溶液內。將所形成之混合物攪拌 2 小時, 然後, 將其以 EtOAc (50 毫升) 與 $NaHCO_3$ 溶液 (10 毫升) 稀釋。將有機層以水、鹽水洗滌, 以 $MgSO_4$ 脫水乾燥, 及濃縮, 獲得粗產物, 使其溶於 EtOH (3.0 毫升) 中,

並以 P_2O_5 (0.53 克, 3.72 毫莫耳) 處理。將所形成之混合物在 80°C 下加熱過夜。使混合物冷卻, 且以 EtOAc (50 毫升) 與 NaHCO_3 溶液 (20 毫升) 稀釋。將有機層以 NaHCO_3 溶液、鹽水洗滌, 以 MgSO_4 脫水乾燥, 及濃縮, 獲得粗產物, 使其藉管柱層析純化, 以 EtOAc/己烷溶離, 產生化合物 **D6** ((S), $R^6 = \text{H}$, $R^7 = \text{Ph}$; 46 毫克)。

^1H NMR (CDCl_3) δ : 7.43-7.32 (m, 5H); 4.30 (dd, $J = 5.0, 4.0$ Hz, 1H); 4.16 (AB, 四重峰, $J = 11.5, 4.0$ Hz, 1H); 3.96 (AB, 四重峰, $J = 11.5, 5.0$ Hz, 1H); 3.07 (m, 1H); 2.89 (m, 1H); 2.50 (m, 2H); 1.84 (m, 2H); 1.76 (m, 2H). 電噴霧 LCMS: 發現質量: 217.2.

方法 D 步驟 5:

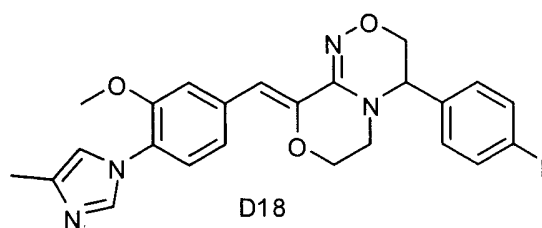
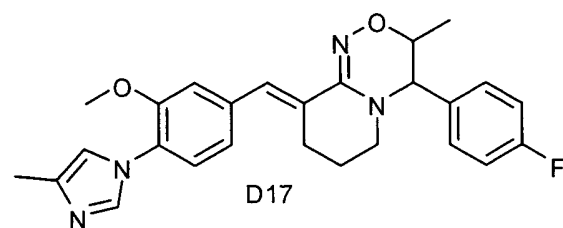
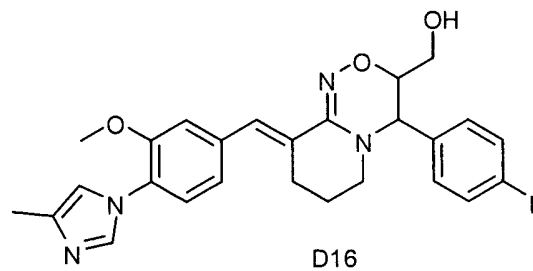
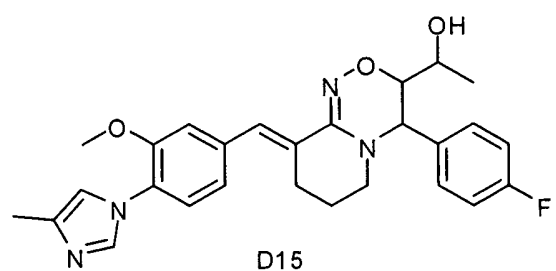
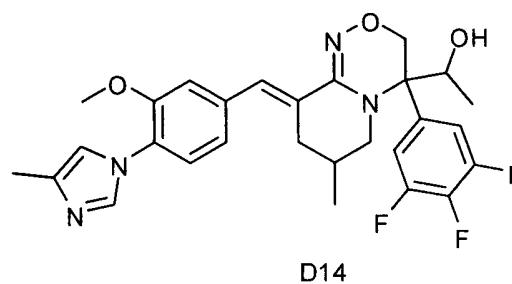
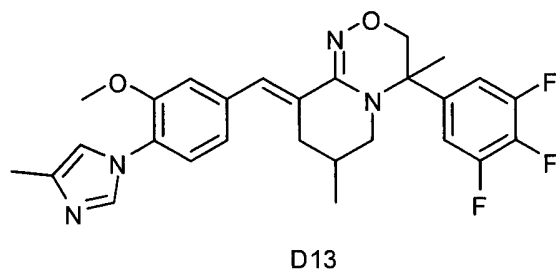
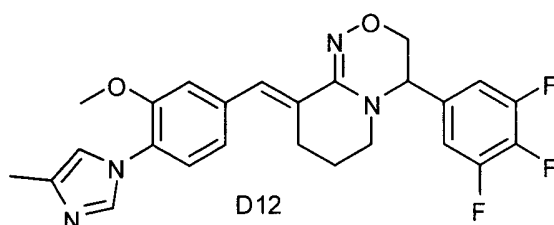
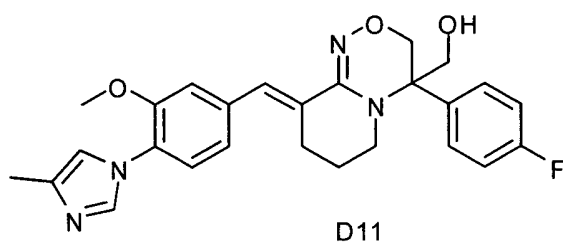
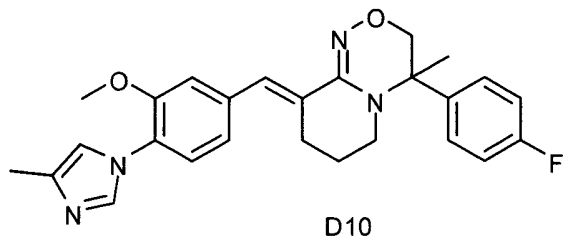
於 -78°C 下, 將 t-BuLi (0.188 毫升, 0.32 毫莫耳, 1.7M) 逐滴添加至化合物 **D6** ((S), $R^6 = \text{H}$, $R^7 = \text{Ph}$; 46 毫克, 0.21 毫莫耳) 在 THF (1.5 毫升) 中之溶液內。將混合物攪拌 45 分鐘, 然後, 將化合物 **D7** ($R^{10} = 3\text{-MeO-苯基}$, $R^9 = 4\text{-(4-甲基咪唑-1-基)}$) 以快速滴液添加至 THF (1.0 毫升) 中。將所形成之混合物攪拌 2 小時, 接著, 將其以 EtOAc (50 毫升) 與 NH_4Cl 溶液 (10 毫升) 稀釋。將有機層以鹽水洗滌, 以 MgSO_4 脫水乾燥, 及濃縮, 獲得粗產物, 使其藉管柱層析純化, 以 EtOAc/己烷溶離, 產生化合物 **D8** ((S), $R^6 = \text{H}$, $R^7 = \text{Ph}$; $R^{10} = 3\text{-MeO-苯基}$, $R^9 = 4\text{-(4-甲基咪唑-1-基)}$)。

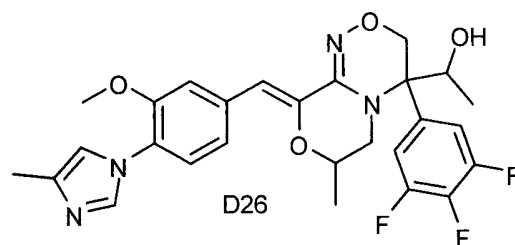
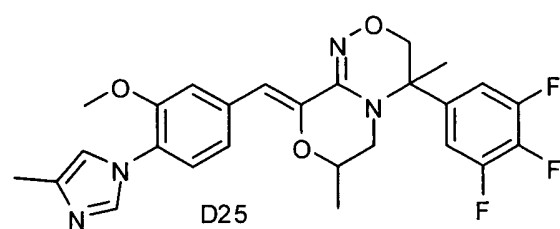
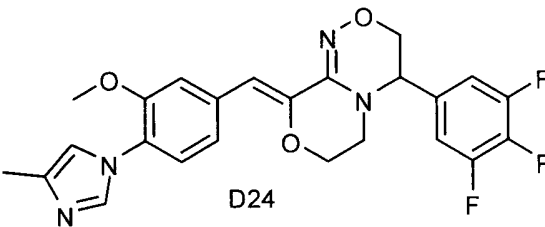
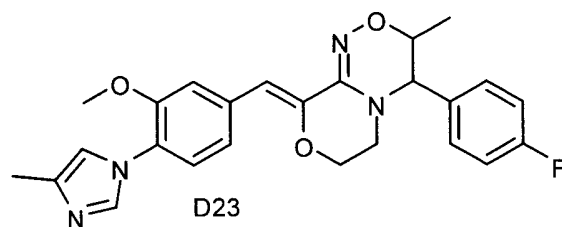
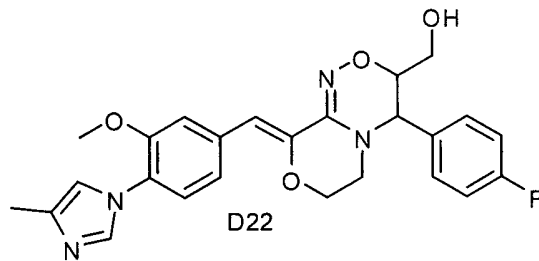
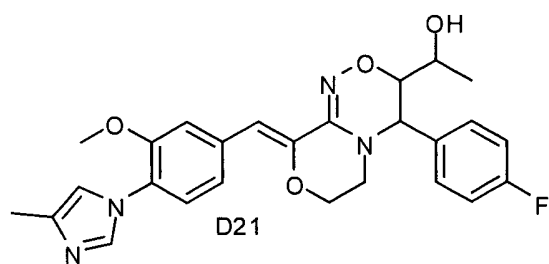
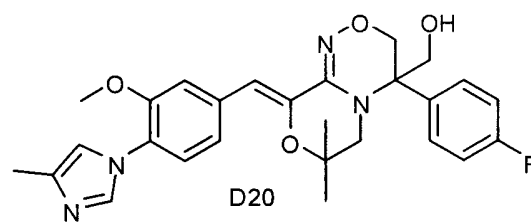
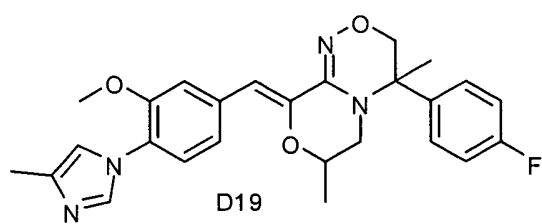
方法 D 步驟 6:

使化合物 **D8** ((S), $R^6 = \text{H}$, $R^7 = \text{Ph}$; $R^{10} = 3\text{-MeO-苯基}$, $R^9 = 4\text{-(4-甲基咪唑-1-基)}$) 溶於甲苯中, 並以 p-TSA (10 莫耳%) 處理。將

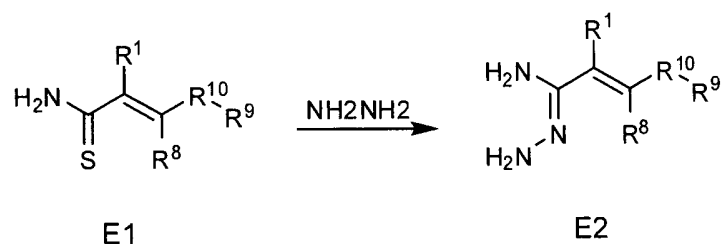
混合物在回流條件下，以 Dean-Stark 裝置加熱過夜。移除溶劑，並使粗製殘留物以管柱層析純化，獲得化合物 **D9** ((S)， $R^6 = H$ ， $R^7 = Ph$ ； $R^{10} = 3\text{-MeO-苯基}$ ， $R^9 = 4\text{-(4-甲基咪唑-1-基)}$)。

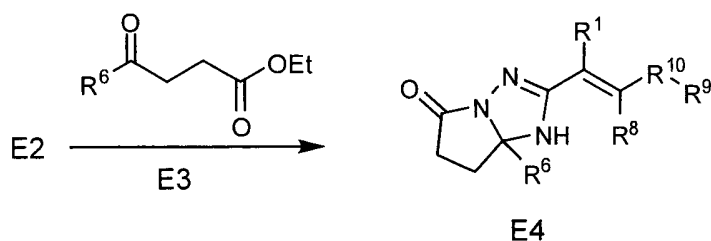
下列化合物係使用類似方法 D 之方法合成：





方法 E





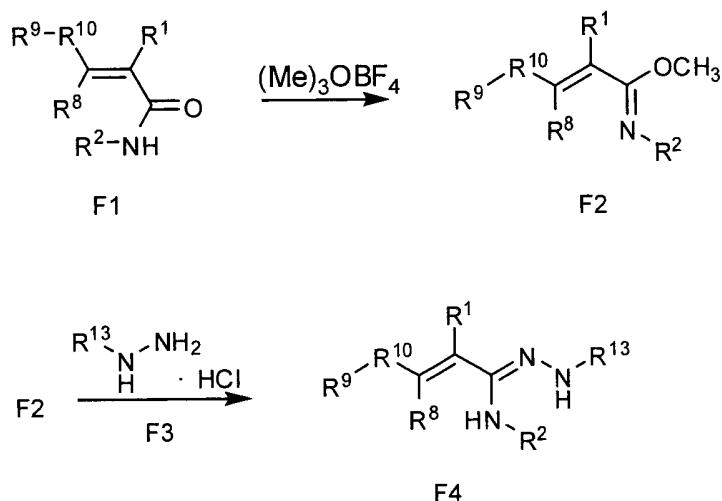
方法 E 步驟 1.

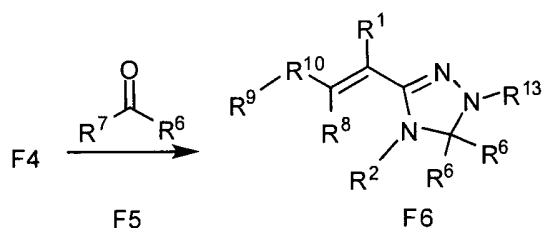
E1 化合物 ($R^1 = R^8 = H$, $R^{10} = 3\text{-MeO 苯基}$, $R^9 = 4\text{-(4-Me-咪唑-1-基)}$) 係經由以胼，使用催化量之酸，在溶劑譬如乙醇中處理，並加熱，製自其相應之硫鹽胺或腓類。

方法 E 步驟 2.

使 E1 ($R^1 = R^8 = H$, $R^{10} = 3\text{-MeO 苯基}$, $R^9 = 4\text{-(4-Me-咪唑-1-基)}$) 與 E3 之酮酯類 ($R^6 = \text{對-F-苯基}$) 於脫水條件下反應，譬如以催化量之酸 (例如 TsOH 或 AcOH)，在溶劑譬如甲苯或 DCM 中之處理。於一些情況中，在甲苯中加熱，以經過共沸蒸餾作用移除水係有助於反應，以產生化合物 E4 ($R^1 = R^8 = H$, $R^{10} = 3\text{-MeO 苯基}$, $R^9 = 4\text{-(4-Me-咪唑-1-基)}$, $R^6 = \text{對-F-苯基}$)。

方法 F.





方法 F 步驟 1：

於 **F1** ($R^1 = \text{H}$, $R^2 = \text{H}$, $R^8 = \text{H}$, $R^{10} = 3\text{-(甲氧基)苯基}$, $R^9 = 4\text{-(4-Me-咪唑-1-基)}$) 之二氯甲烷溶液中，添加四氟硼酸三甲基鎢，並將反應混合物在室溫下攪拌過夜。蒸發溶劑，產生粗製亞胺基醚 **B2**，為其四氟硼酸鹽。視情況，將粗製四氟硼酸鹽以醚研製，且將所形成之已沉澱 **F2** 之四氟硼酸鹽 ($R^1 = \text{H}$, $R^2 = \text{H}$, $R^8 = \text{H}$, $R^{10} = 3\text{-(甲氧基)苯基}$, $R^9 = 4\text{-(4-Me-咪唑-1-基)}$) 過濾，及乾燥。藉由於二氯甲烷與過量 1M NaOH 之間作分液處理，使其轉化成自由態鹼。使二氯甲烷層以 K_2CO_3 脫水乾燥，及蒸發，獲得 **F2** 之自由態鹼 ($R^1 = \text{H}$, $R^2 = \text{H}$, $R^8 = \text{H}$, $R^{10} = 3\text{-(甲氧基)苯基}$, $R^9 = 4\text{-(4-Me-咪唑-1-基)}$)，立即使用之。

方法 F 步驟 2：

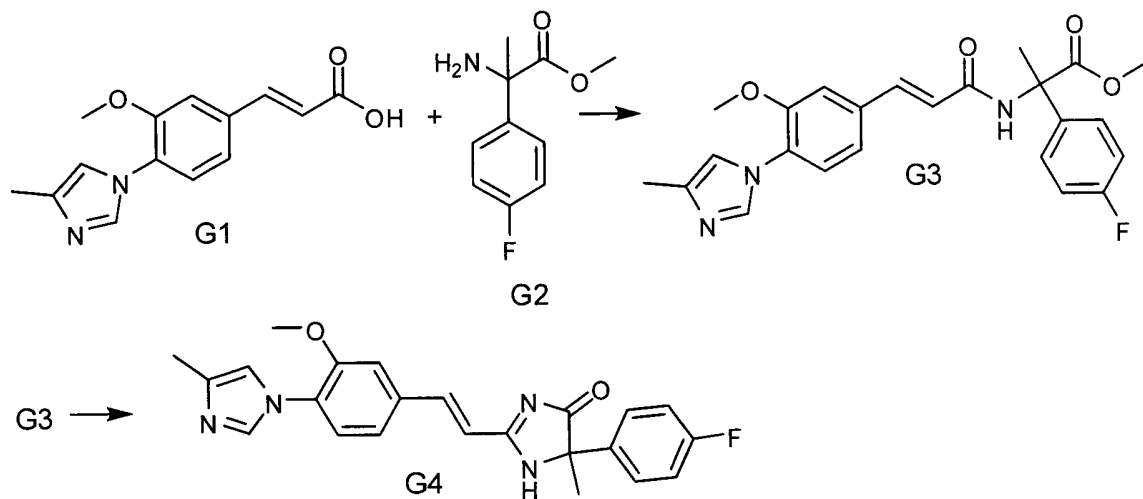
將 **F2** ($R^1 = \text{H}$, $R^2 = \text{H}$, $R^8 = \text{H}$, $R^{10} = 3\text{-(甲氧基)苯基}$, $R^9 = 4\text{-(4-Me-咪唑-1-基)}$) 以視情況作為其鹽酸鹽或水合物之肼 **F3** ($R^{13} = \text{H}$)，在回流甲醇中處理過夜。使反應混合物以碳酸氫鈉中和，過濾，及蒸發，獲得粗製醯胺基醯肼 **F4** ($R^1 = \text{H}$, $R^2 = \text{H}$, $R^{13} = \text{H}$, $R^8 = \text{H}$, $R^{10} = 3\text{-(甲氧基)苯基}$, $R^9 = 4\text{-(4-Me-咪唑-1-基)}$)。

方法 F 步驟 3：

將 **F4** ($R^1 = \text{H}$, $R^2 = \text{H}$, $R^{13} = \text{H}$, $R^8 = \text{H}$, $R^{10} = 3\text{-(甲氧基)苯基}$)

基， $R^9 = 4-(4\text{-Me-咪唑-1-基})$) 以酮 **F5** ($R^6 = \text{Me}$ ， $R^7 = 4\text{-氟苯基}$) 與對-甲苯磺酸，在回流乙醇下處理過夜，於中和及蒸發後，獲得化合物 **F6** ($R^1 = \text{H}$ ， $R^2 = \text{H}$ ， $R^{13} = \text{H}$ ， $R^8 = \text{H}$ ， $R^{10} = 3\text{-(甲氧基)苯基}$ ， $R^9 = 4-(4\text{-Me-咪唑-1-基})$ ， $R^6 = \text{Me}$ ， $R^7 = 4\text{-氟苯基}$)。

方法 G



方法 G 步驟 1

化合物 **G1** (200 毫克)，係自其相應之醛與二乙基膦酸甲氧羰基甲酯，接著為 LiOH 水解作用產生，使其與化合物 **G2** (230 毫克)，以 HOBt (135 毫克) 及 EDCI (197 毫克)，在 10 毫升 DMF 中反應，在例行處理及純化後，以 66% 產率獲得化合物 **G3**。

G3 之 $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , ppm) ; δ 7.35 s, 1H ; 7.55 d, 1H ; 7.45 m, 2H ; 7.25, d, 1H ; 7.15, m, 3H ; 7.10, m, 1H ; 6.95, s, 1H ; 6.5, s, 1H ; 3.9 s, 3H ; 3.75 s, 3H ; 2.3 s, 3H ; 2.15 s, 3H.

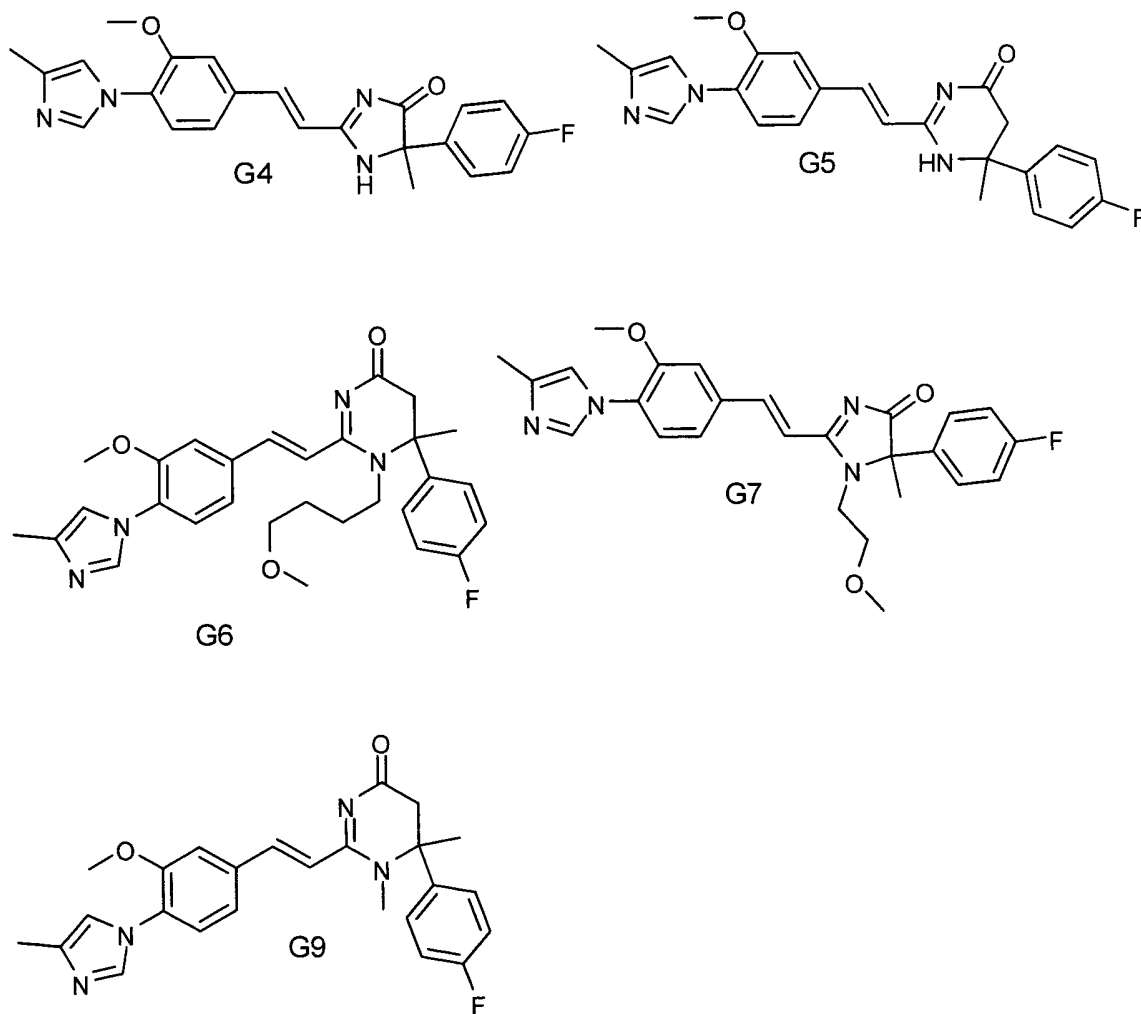
方法 G 步驟 2

將氨在 THF 中之溶液以 Me_3Al 在己烷中處理，然後慢慢添加化合物 **G3**。使最後混合物回流過夜，接著以飽和氯化銨水溶液使其淬滅，並以 EtOAc 萃取。將有機層以鹽水洗滌，

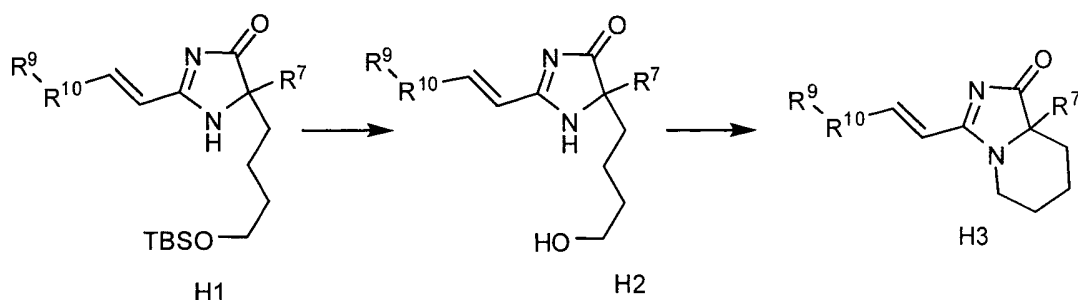
脫水乾燥，及蒸發溶劑。使殘留物層析，獲得其相應之醯胺。使產物醯胺溶於1毫升EtOH與2毫升1N NaOH中。在起始物質消失後，使反應混合物於DCM/飽和氯化銨水溶液中進行分液處理。使有機層脫水乾燥，及蒸發溶劑。使殘留物層析，獲得化合物 **G4**。

G4 之 ^1H NMR (CDCl_3 , ppm) ; δ 10.5 寬廣, 1H ; 7.9, s, 1H, 7.6 m, 2H, 7.4, m, 1H ; 7.3, m, 2H ; 7.2, m, 1H ; 7.05, m, 2H ; 7.0 s, 1H ; 6.9 m, 1H ; 3.9 s, 3H ; 2.3 s, 3H.

下列化合物使用類似方法 G 之方法獲得：



方法 H



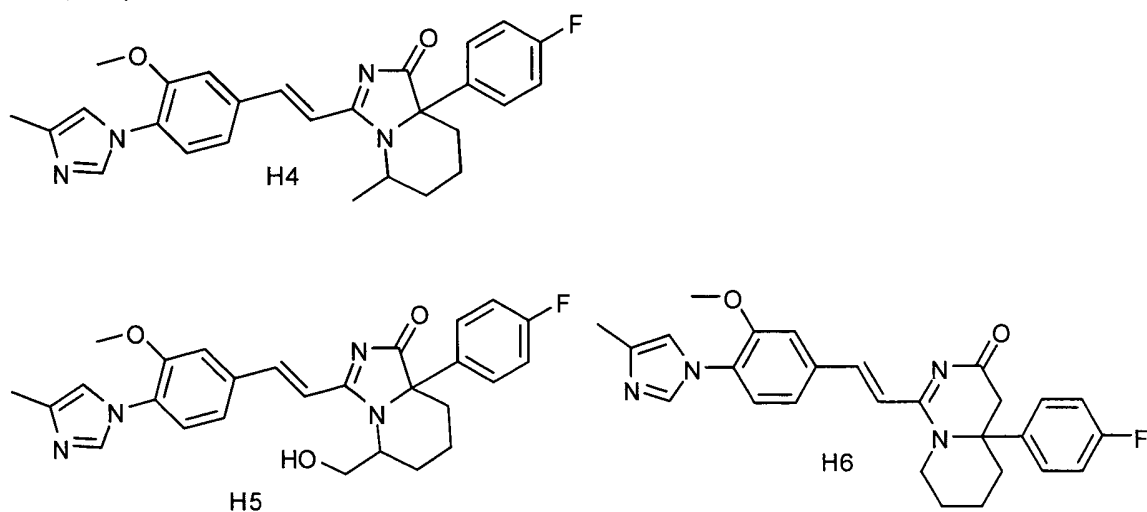
方法 H 步驟 1

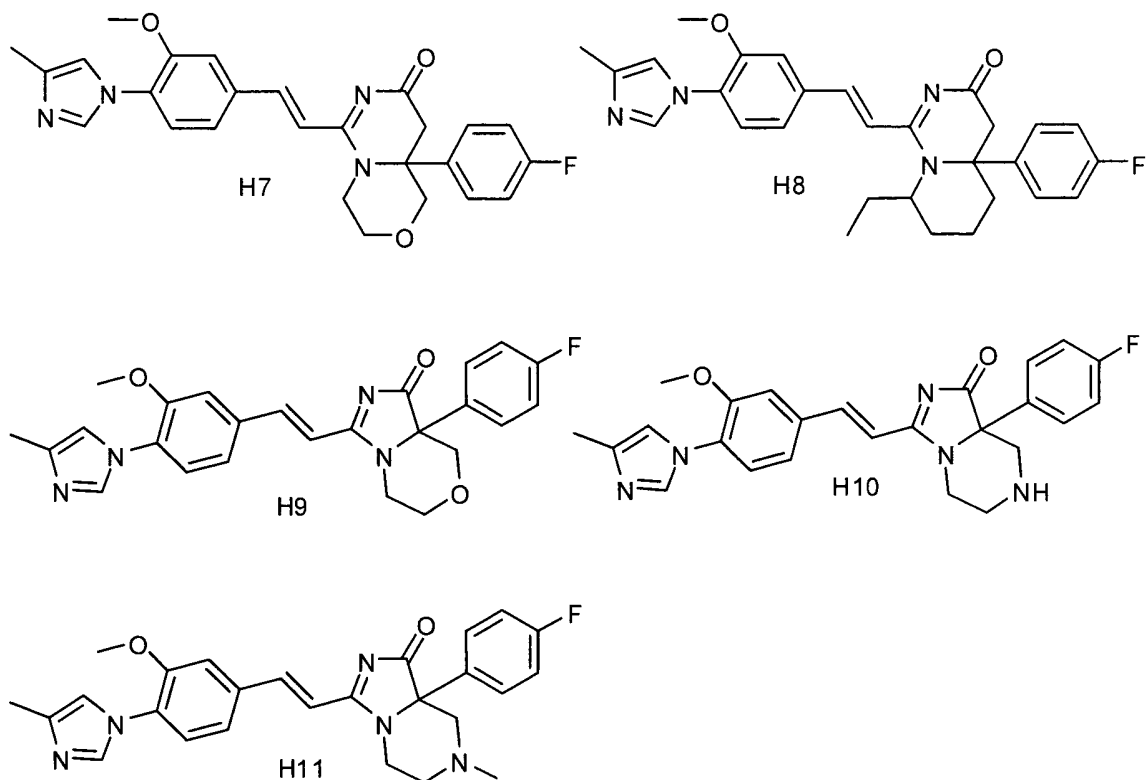
將使用類似方法 G 之方法製成之化合物 **H1** (R^7 = 對-F-苯基, R^{10} = 3-MeO-苯基, R^9 = 4-(4-甲基-咪唑-1-基)) 以 TBAF 處理, 於純化後, 獲得化合物 **H2** (R^7 = 對-F-苯基, R^{10} = 3-MeO-苯基, R^9 = 4-(4-甲基-咪唑-1-基))。

方法 H 步驟 2

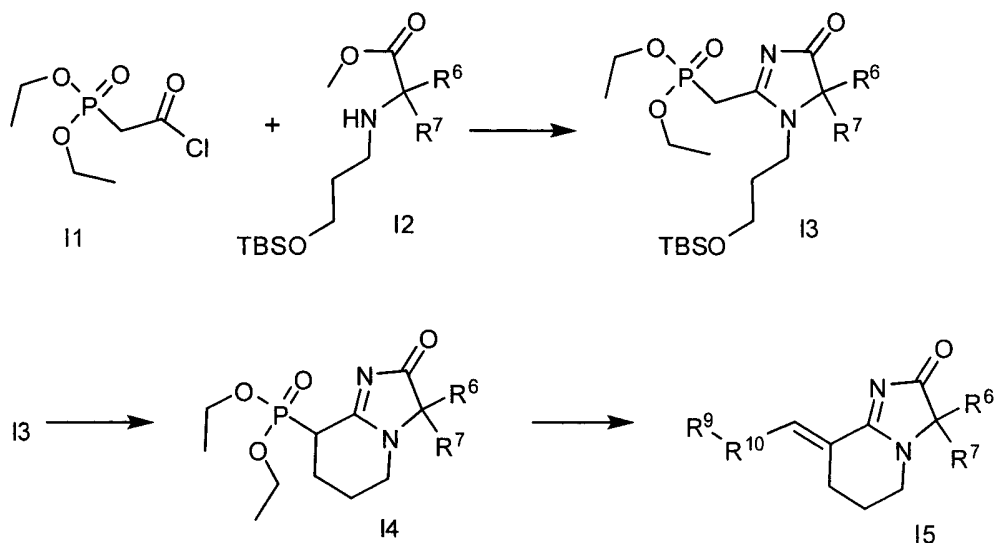
使化合物 **H2** (R^7 = 對-F-苯基, R^{10} = 3-MeO-苯基, R^9 = 4-(4-甲基-咪唑-1-基)) 轉化成三氟甲烷磺酸酯。將產物三氟甲烷磺酸酯以 NaH 在 DMF 中處理, 於例行處理及純化後, 獲得化合物 **H3** (R^7 = 對-F-苯基, R^{10} = 3-MeO-苯基, R^9 = 4-(4-甲基-咪唑-1-基))。

下列化合物係使用類似方法 H 之方法獲得：





方法 I



方法 I 步驟 1

化合物 **I3** (R^6 =對-F-苯基, R^7 =Me) 係使用類似方法 G 之方法, 利用起始物質 **I1** 與 **I2** (R^6 =對-F-苯基, R^7 =Me) 獲得。

方法 I 步驟 2

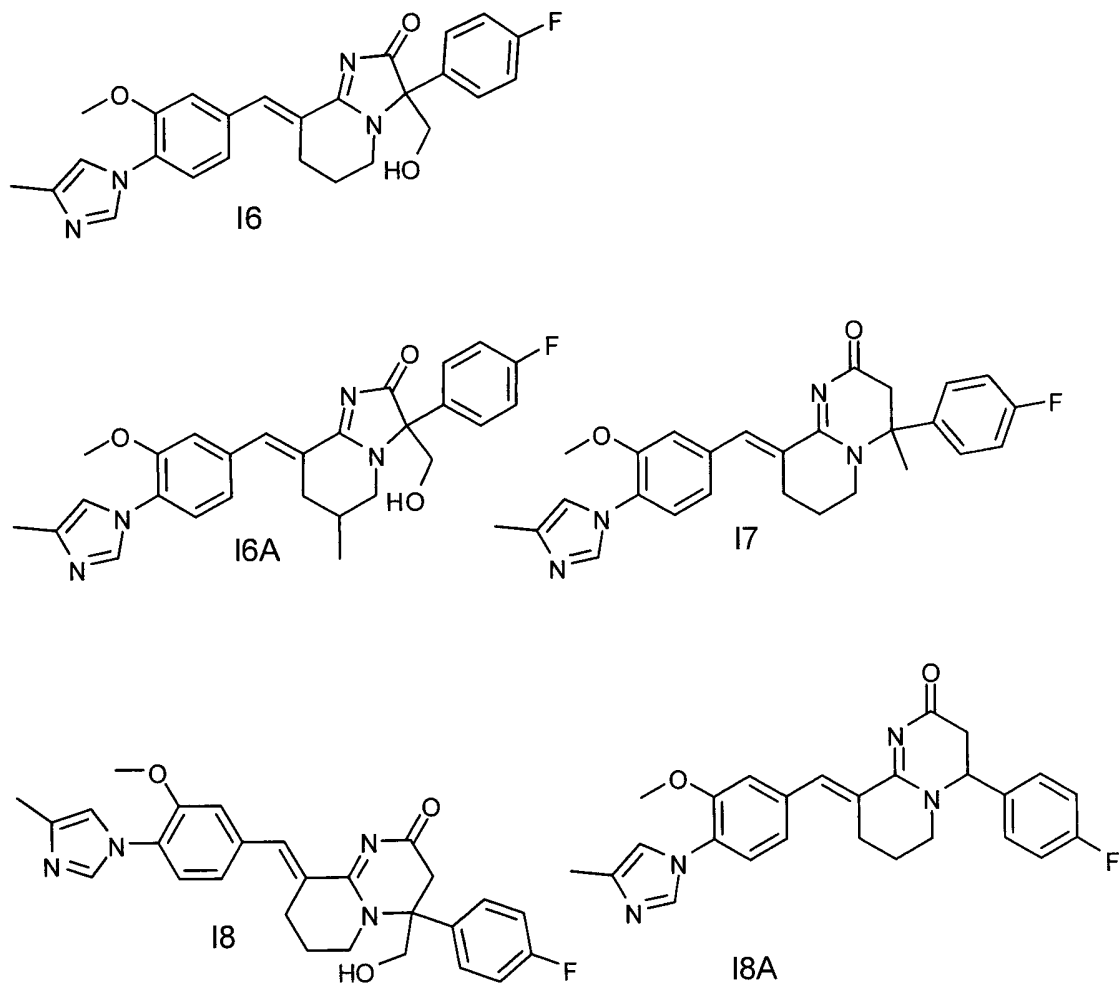
將化合物 **I3** (R^6 =對-F-苯基, R^7 =Me) 以 TBAF 處理, 接著, 使其純化, 獲得其相應之醇, 使其轉化成三氟甲烷磺酸酯。

將三氟甲烷磺酸酯以 NaH 在 DMF 中處理，獲得化合物 **I4** (R^6 = 對-F-苯基， R^7 = Me)。

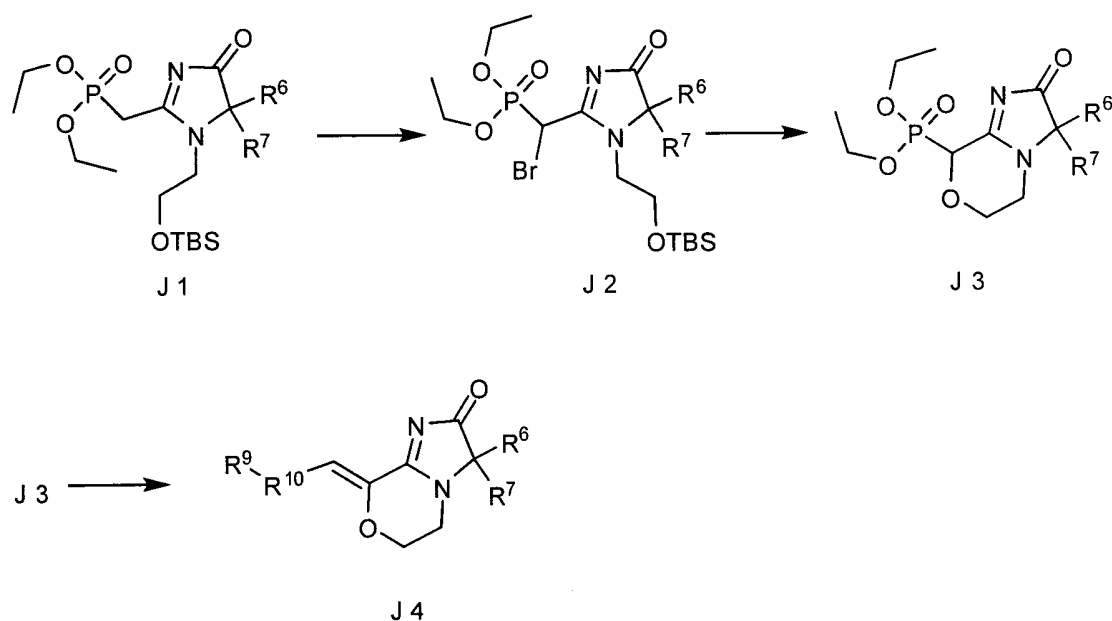
方法 I 步驟 3

化合物 **I5** (R^6 = 對-F-苯基， R^7 = Me， R^{10} = 3-MeO 苯基， R^9 = 4-(4-甲基咪唑-1-基)) 係使用化合物 **I4** (R^6 = 對-F-苯基， R^7 = Me)，與 **D7** (R^{10} = 3-MeO 苯基， R^9 = 4-(4-甲基咪唑-1-基)) 及鹼反應，在純化後獲得。

下列化合物係使用類似方法 I 之方法獲得。



方法 J



方法 J 步驟 1

於回流下，將使用類似方法 I 步驟 1 之方法獲得之化合物 **J1** ($R^6 = p\text{-F-Ph}$ 與 $R^7 = \text{甲基}$) 以 NBS 在苯中，使用自由基引發劑 (譬如 AIBN) 處理，獲得化合物 **J2** ($R^6 = \text{對-F-Ph}$ 與 $R^7 = \text{甲基}$)。

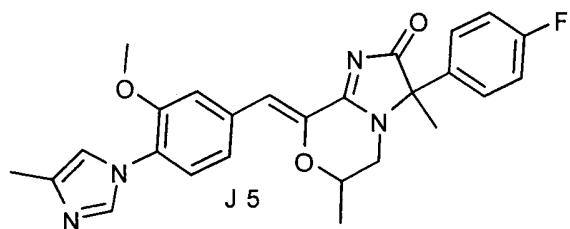
方法 J 步驟 2

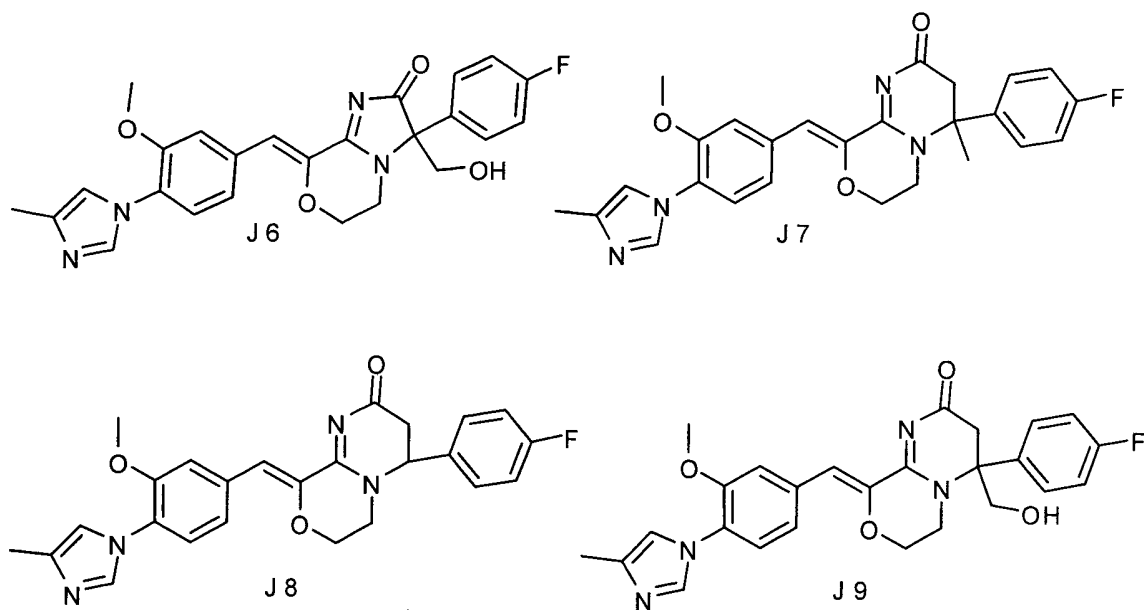
將化合物 **J2** ($R^6 = \text{對-F-Ph}$ 與 $R^7 = \text{甲基}$) 以 TBAF 在 DMF 中處理，於純化後，獲得化合物 **J3** ($R^6 = \text{對-F-Ph}$ 與 $R^7 = \text{甲基}$)。

方法 J 步驟 3

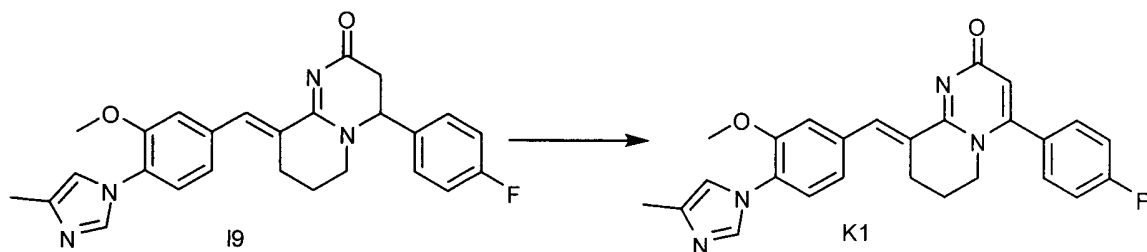
化合物 **J4** ($R^6 = \text{對-F-Ph}$ 與 $R^7 = \text{甲基}$ ， $R^{10} = 3\text{-MeO 苯基}$ ， $R^9 = 4\text{-(4-甲基咪唑-1-基)}$) 係使用類似方法 I 步驟 3 之方法獲得。

下列化合物係使用類似方法 J 之方法獲得：



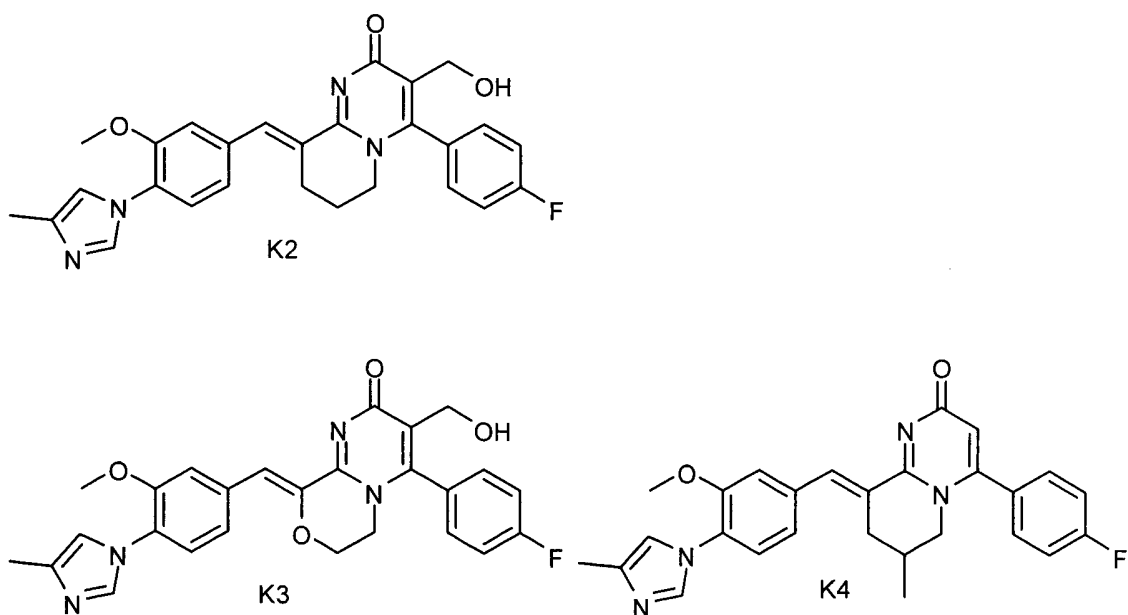


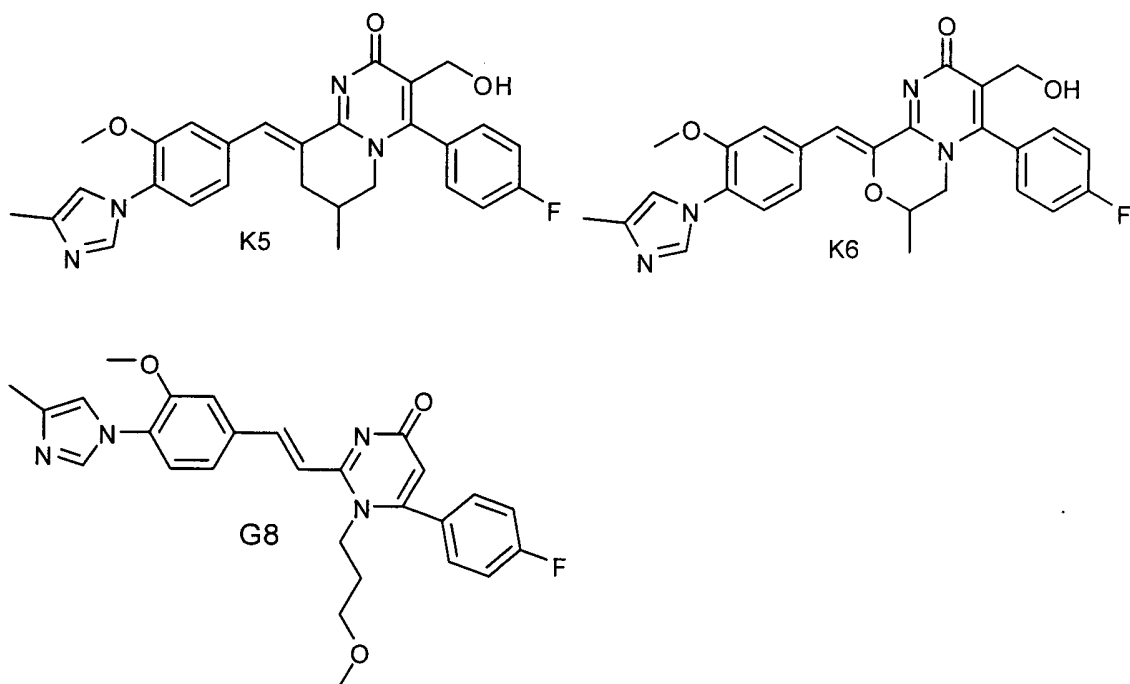
方法 K



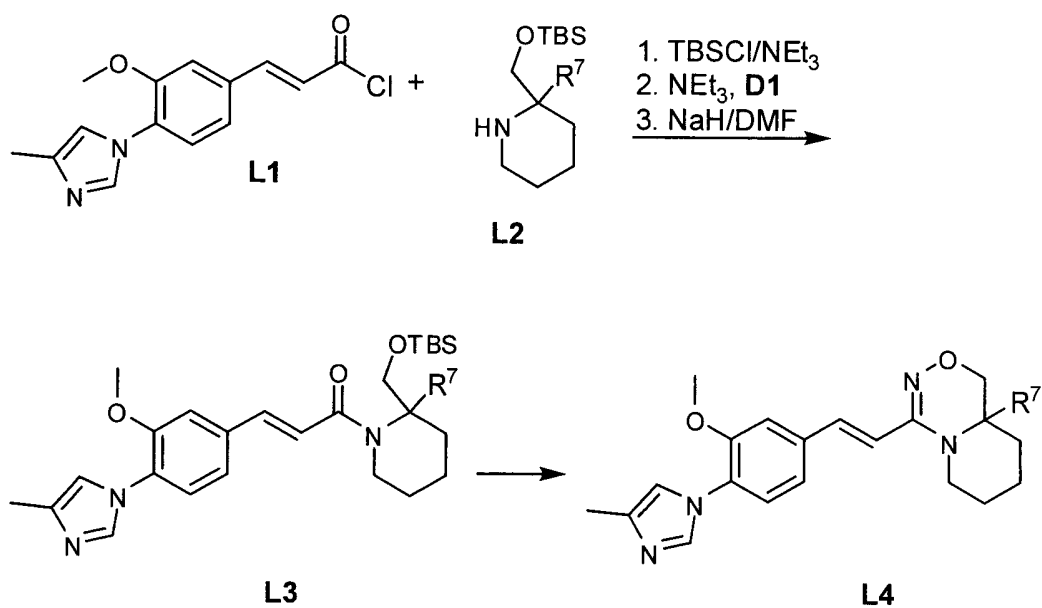
於 -78°C 下，將化合物 **I9** 以 1.2 當量 LDA 處理，然後，使其與溴化苯基碲反應。使反應物溫熱至室溫後，將其以 H_2O_2 處理，及純化，獲得化合物 **K1**。

下列化合物係使用類似方法 K 之方法獲得：





方法 L



方法 L 步驟 1

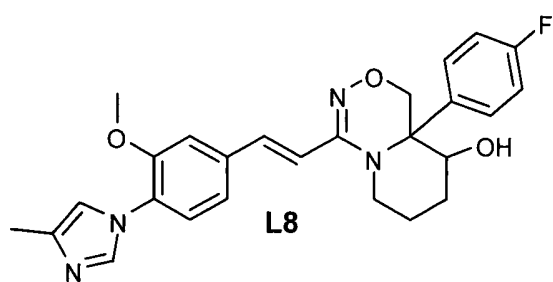
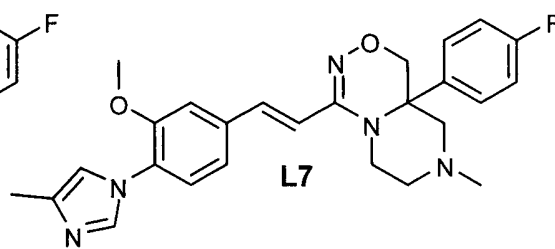
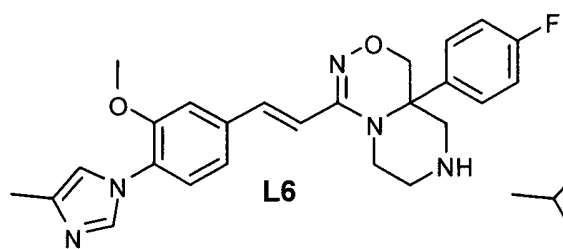
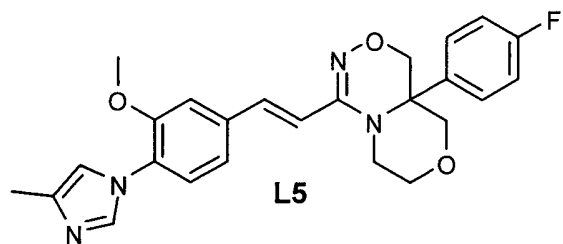
化合物 L3 (R⁷=對-F-苯基) 係使用醯胺偶合化學，得自 L1 與 L2。

方法 L 步驟 2

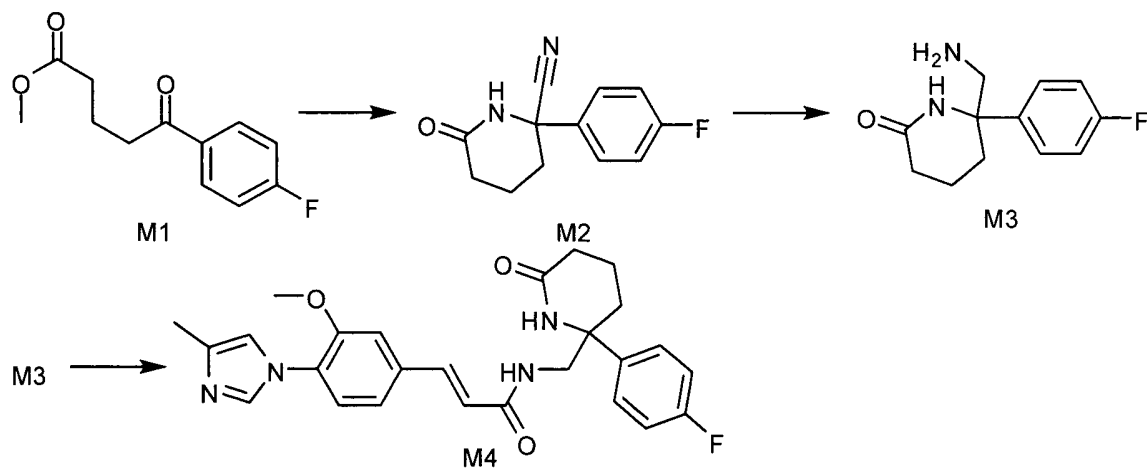
化合物 L4 (R⁷=對-F-苯基) 係使用類似方法 D 步驟 2 至 5 之

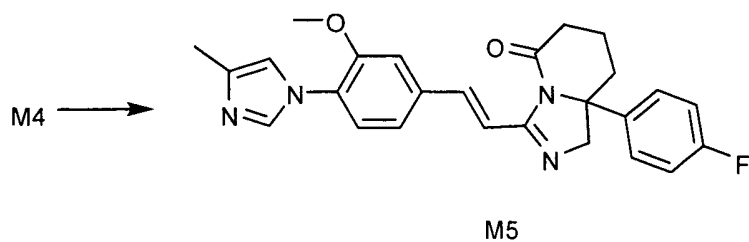
方法獲得。

下列化合物係使用類似方法L之方法獲得：



方法 M





方法 M 步驟 1

經過 Strecker 胺合成，藉由使 **M1** 與氰化銨在醇中反應，使化合物 **M1** 轉化成 **M2**。

方法 M 步驟 2

化合物 **M3** 係使用 **M2** 之 Ni 所媒介氫化作用獲得。

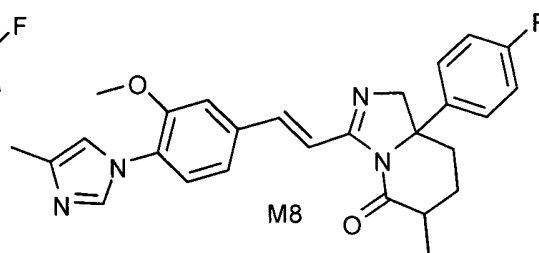
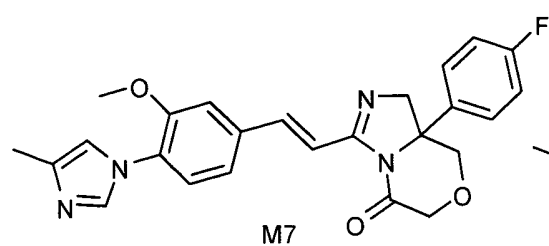
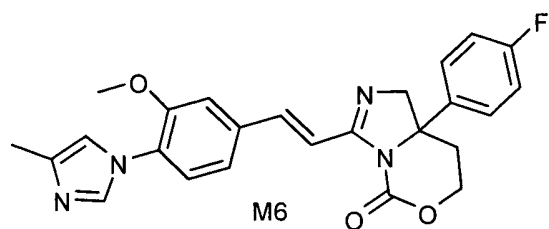
方法 M 步驟 3

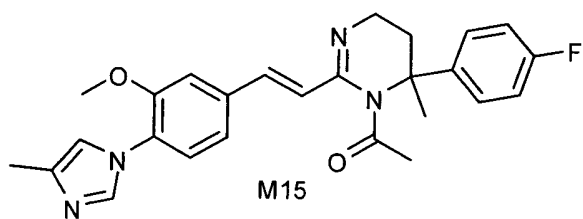
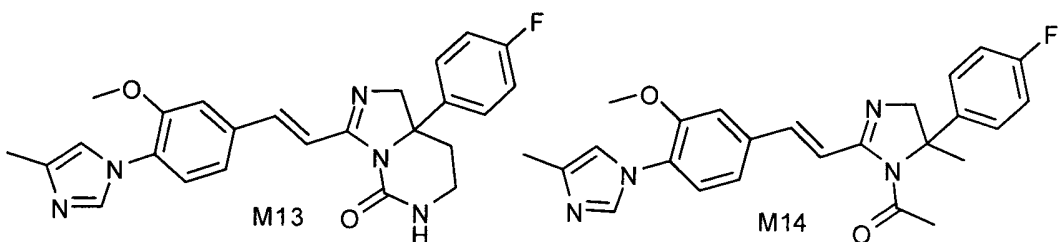
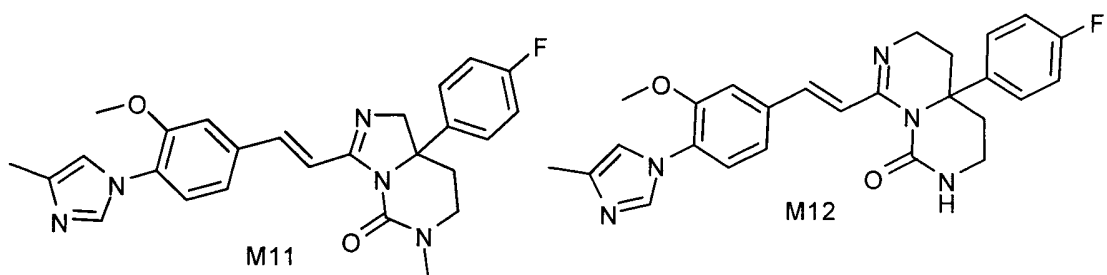
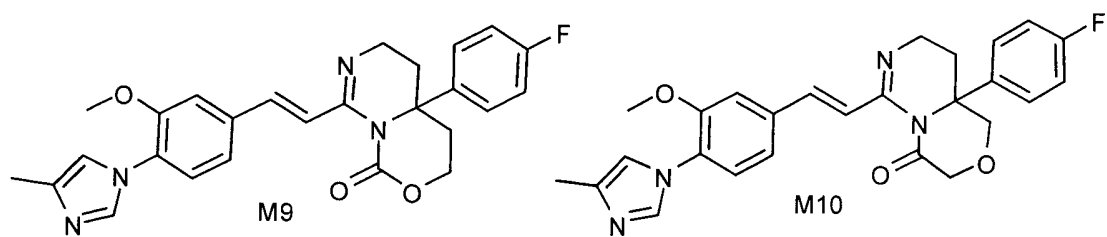
化合物 **M4** 係使用正常醯胺偶合條件獲得。

方法 M 步驟 4

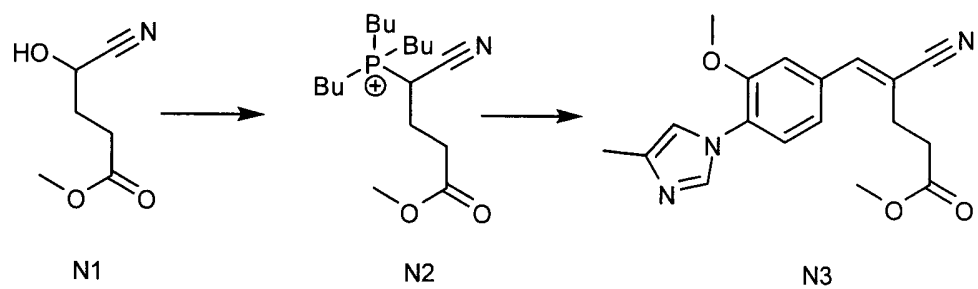
化合物 **M5** 係經過 **M4** 以 POCl_3 在回流甲苯中之處理而得。

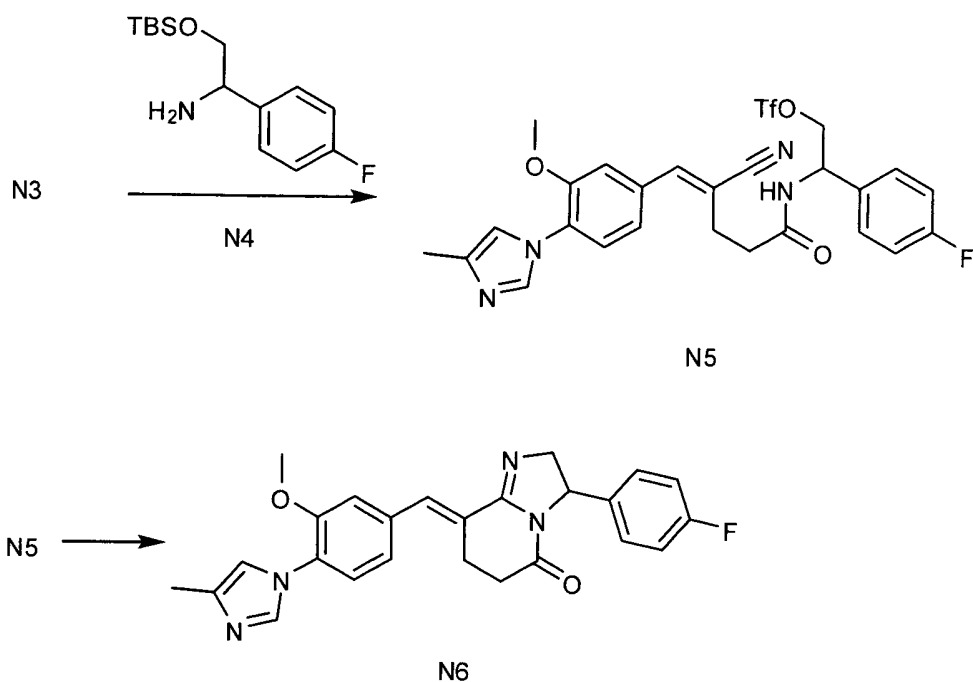
下列化合物可使用類似方法 M 之方法獲得。





方法 N





方法 N 步驟 1

N2 係於三氟甲烷磺酸酯產生，接著為三丁基膦處理後，得自 N1。

方法 N 步驟 2

化合物 N3 係經過使用 N2，與適當醛之 Wittig 反應獲得。

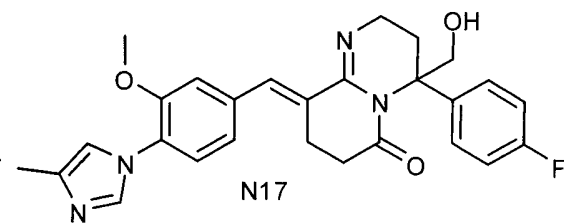
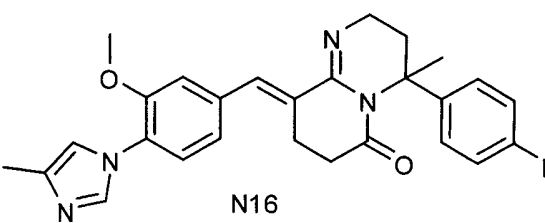
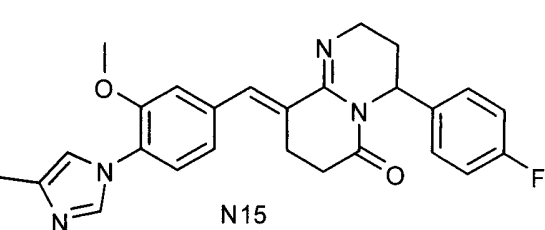
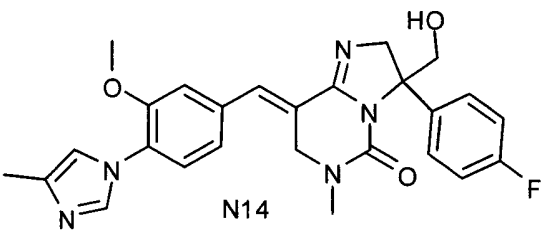
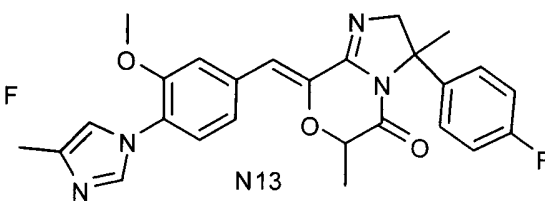
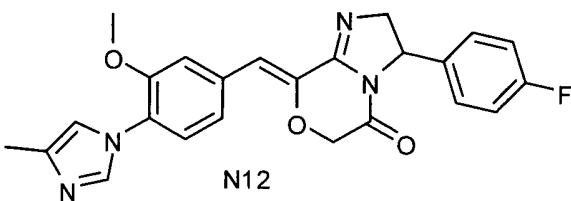
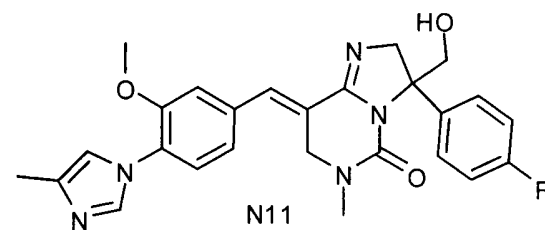
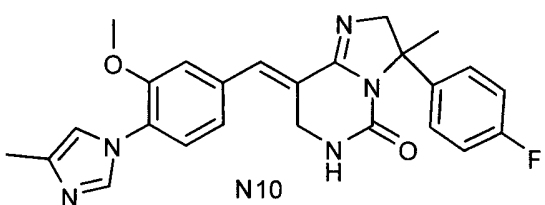
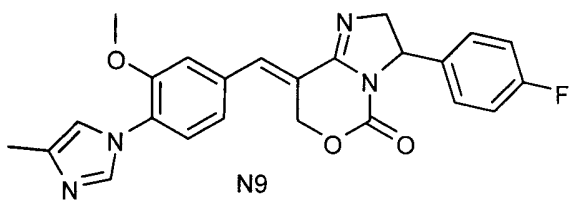
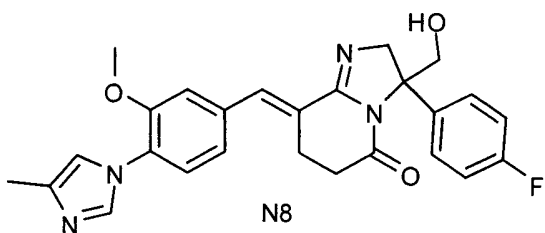
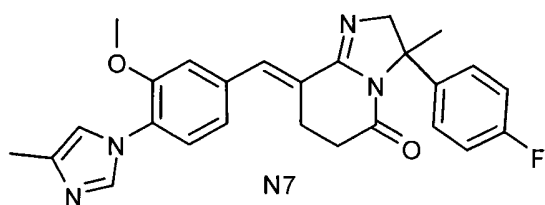
方法 N 步驟 3

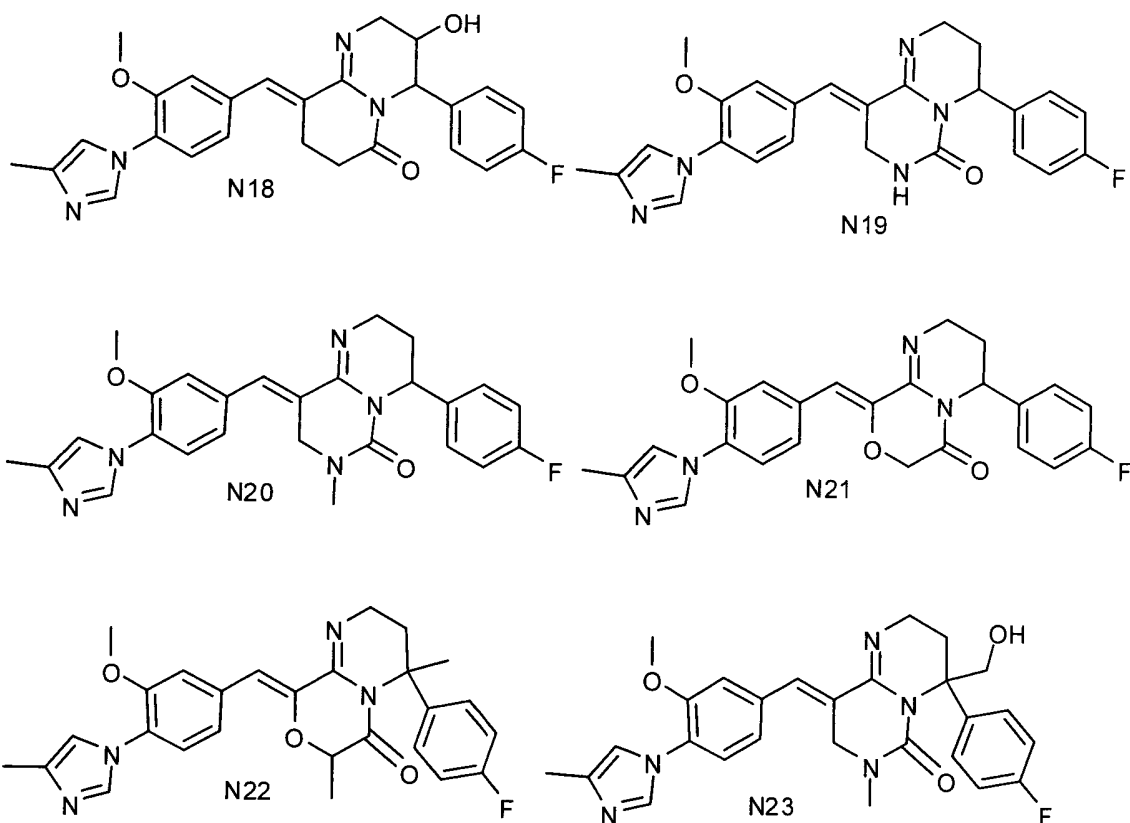
化合物 N5 係經過 N3 之水解成其相應之酸，接著為與化合物 N4 之標準醯胺偶合，然後為 TBS 去除保護及三氟甲烷磺酸酯產生而得。

方法 N 步驟 4

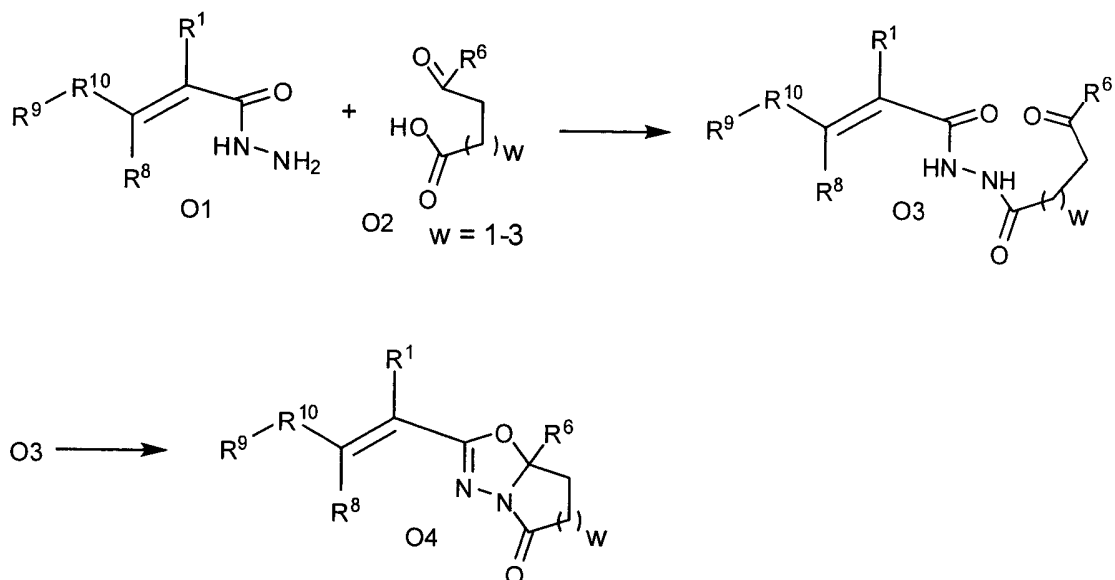
化合物 N6 係於 NaH 在 DMF 中之處理後，使用化合物 N5 獲得。

下列化合物係使用類似方法 N 之方法獲得：





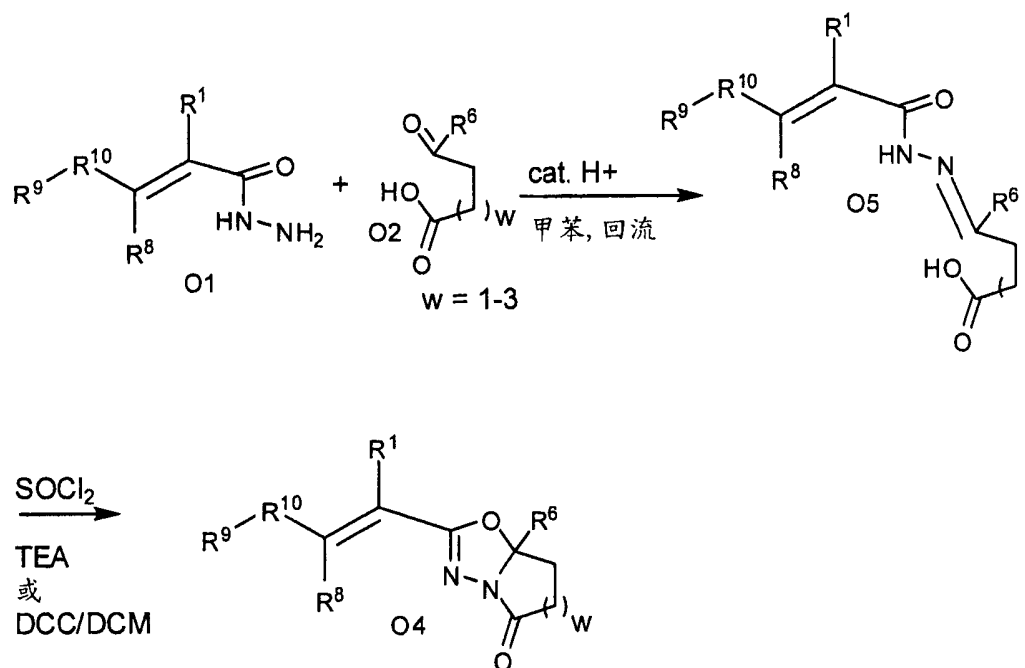
方法 O



醯基肼 **O1** (其係經由使其相應之酸與肼在肽偶合條件下偶合，或經由肼與適當甲酯之反應而製成) 與酮基酸類 (**O2**) 之反應係使用標準碳化二亞胺條件或其他廣泛使用之偶合程序進行，在肽化學中，以製造醯胺鍵結。化合物 **O3** 之後續脫水作用係經由以催化量之酸譬如 TsOH 或 AcOH，在溶劑

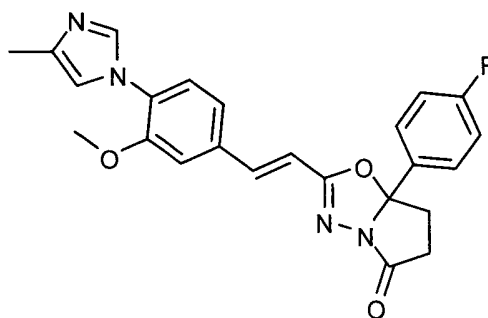
譬如甲苯或 DCM 中處理而達成。於一些情況中，在甲苯中加熱，以共沸出 H_2O 係有助於反應，以產生式 **O4** 之化合物。

或者，可使用經修改之圖式，其中，使酮 **O2** 首先與胺 **O1** 縮合，獲得亞胺 **O5**。**O5** 以脫水劑譬如 $SOCl_2$ 、 Ac_2O 或碳化二亞胺之後續處理係提供式 **O4** 化合物。



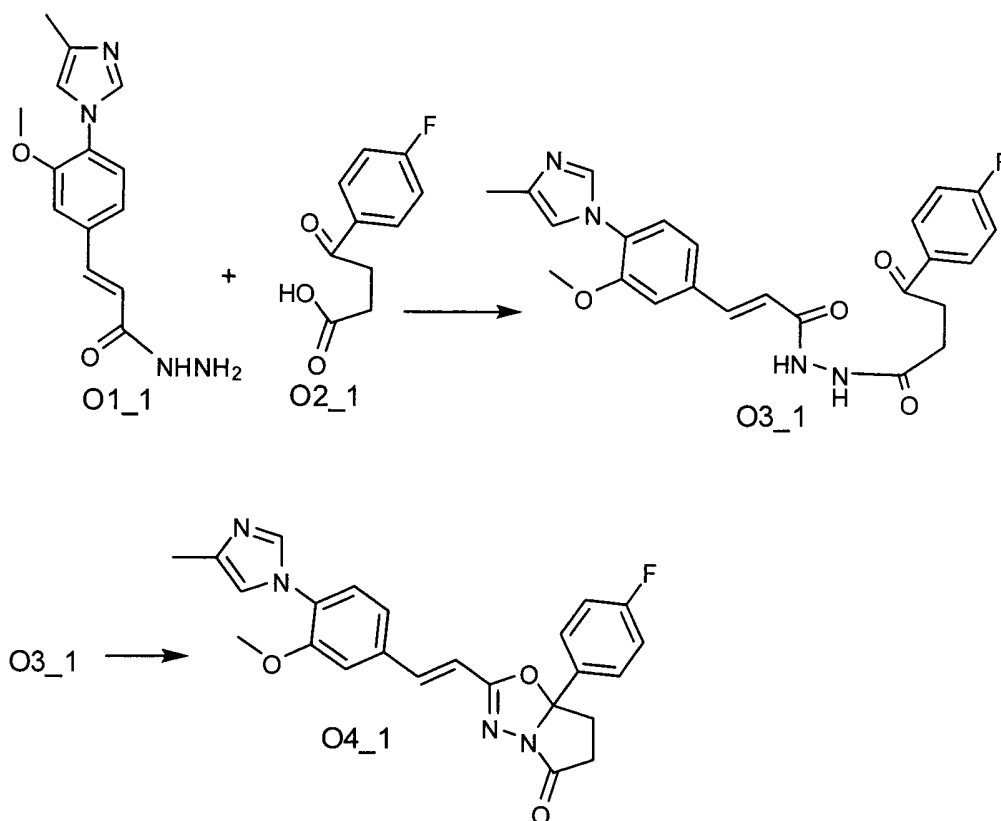
實例方法 O

(E)-7a-(4-氟苯基)-2-(3-甲氧基-4-(4-甲基-1H-咪唑-1-基)苯基)-5(6H)-吡咯并[2,1-b][1,3,4]噻二唑-5(6H)-酮



O4_1

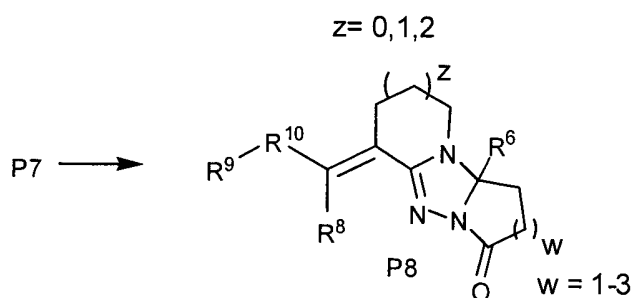
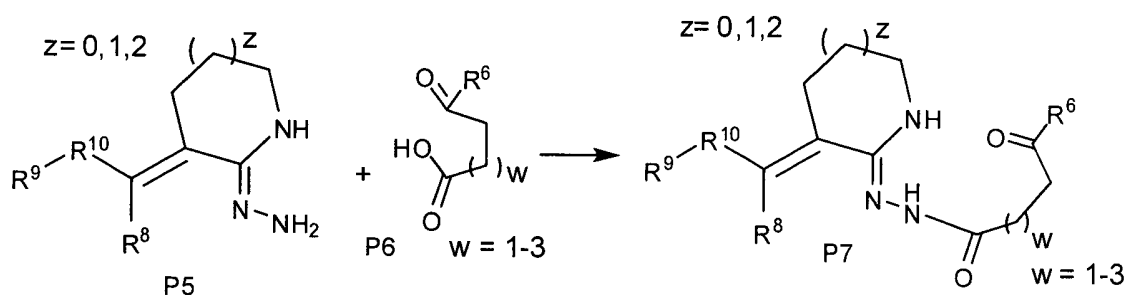
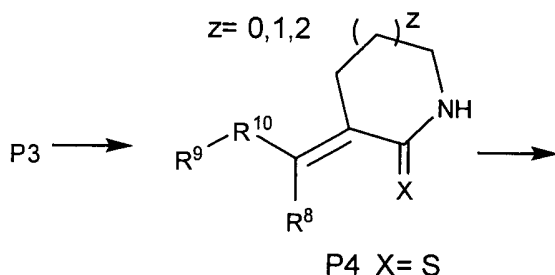
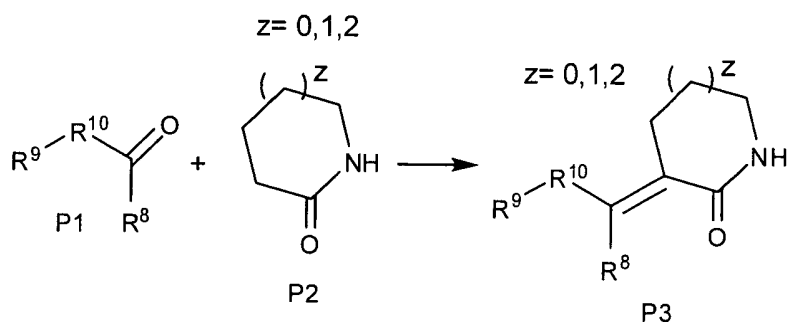
步驟 1：反應圖式



步驟 1

化合物 **O3_1** 係經由將 1 克化合物 **O1_1** 在 DCM (100 毫升) 中之溶液與 1 當量 DCC，以 1 當量已知化合物 **O2_1** 處理而製成。於攪拌 12 小時後，添加鹽水 (100 毫升)，並分離有機層。使其蒸發至乾涸，且將殘留物藉急驟式層析純化，獲得 **O3_1**。將化合物 **O3_1** 在甲苯中以 TsOH (0.1 當量) 處理，及在 Dean Stark 集氣瓶下加熱至回流過夜。於冷卻至室溫後，添加稀 NaHCO_3 溶液與鹽水，並分離有機層。使其蒸發至乾涸，且將殘留物藉急驟式層析純化，獲得化合物 **O4_1**。

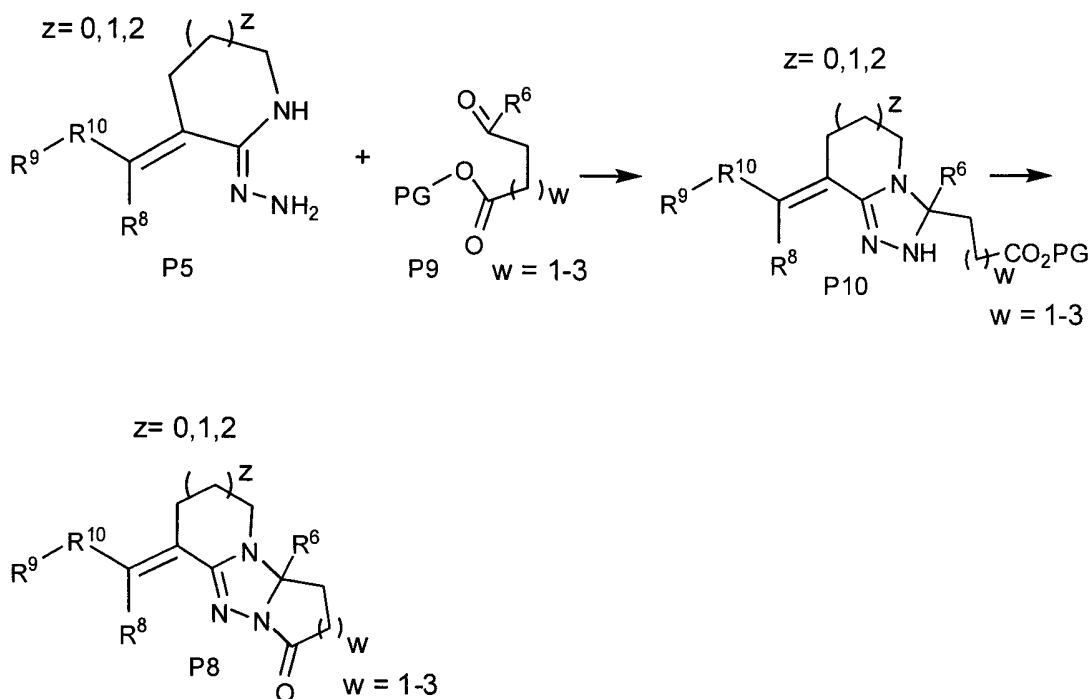
方法 P



含有化合物譬如 **P1** 之羰基，與內醯胺 **P2**，於鹼性條件(使用例如 NaH 與 LDA，以形成 **P2** 之二價陰離子，接著以 **P1** 處理)下之縮合，係提供化合物 **P3**。**P3** 與 Lawesson 氏試劑之反應係提供硫醯胺 **P4**。此等可藉由以肼，在溶劑譬如異丙醇或甲苯中之直接處理，而被轉化成類型 **P5** 化合物。或者，

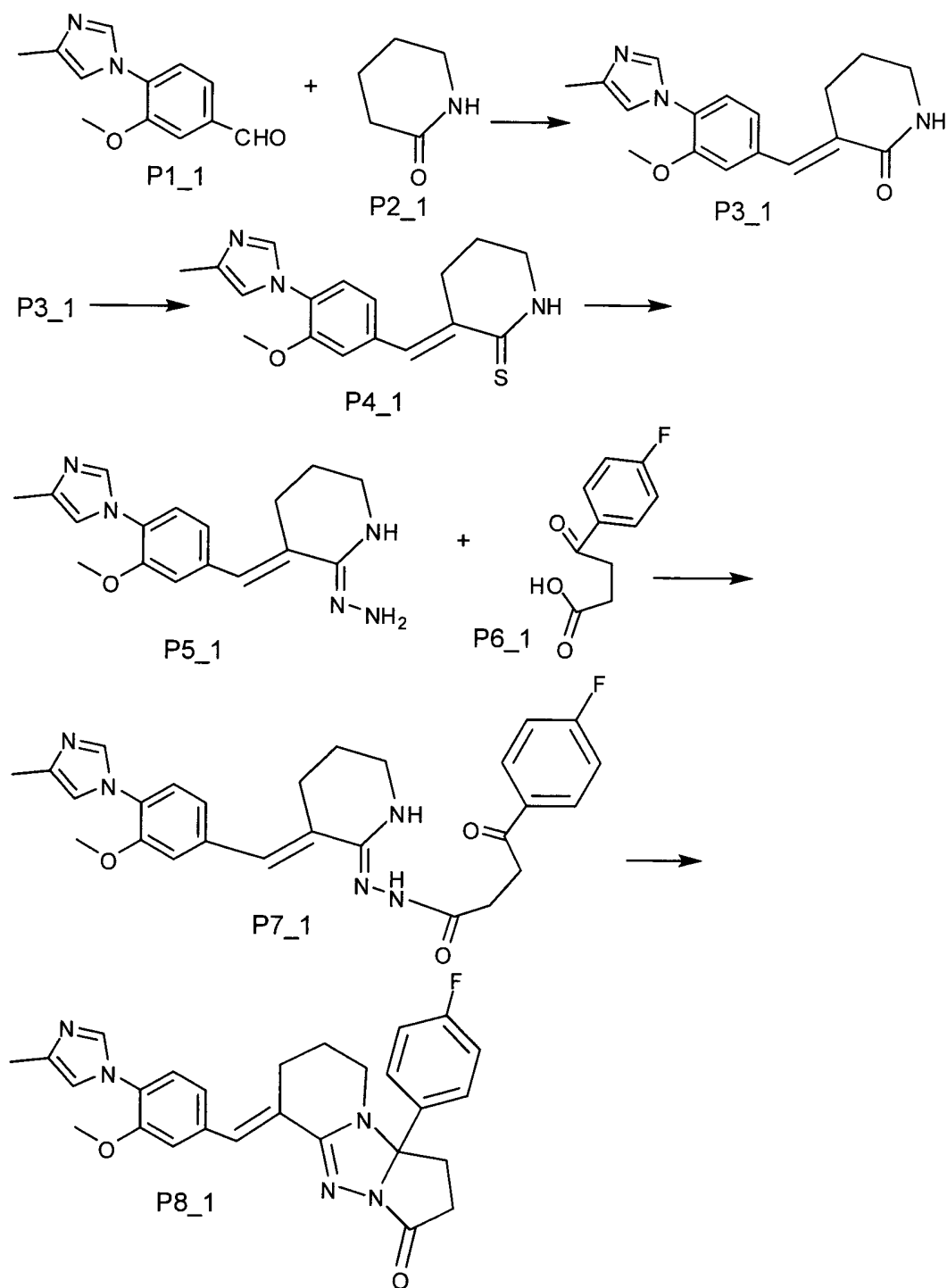
在一些情況中，反應物可藉助於首先使 **P4** 與 MeI 反應，以製備硫基甲基醚，為中間物，然後，將其以胼處理，以提供類型 **P5** 化合物。**P5** 與酮酸 **P6** 及脫水劑譬如 DCC，於 DCM 中之反應，係提供中間物 **P7**，其可在進一步加熱，或使用酸觸媒譬如 TsOH，於回流甲苯中時，被轉化成式 **P8** 化合物。

或者，經修改之反應圖式係提供式 **P8** 化合物。例如，可使胺 **P5** 與酮 **P9** (其中 PG 為保護基，譬如 tBu、Et、TMSCH₂CH₂)，在脫水條件下反應，以提供三吡 **P10**。在移除 PG 後，該酸係藉由以 DCC，在 DCM 中處理，或其他脫水反應條件，而被轉化成式 **P8** 化合物。



於一些情況中，以保護基，譬如對-甲氧苯基或三苯甲基保護起始內醯胺 **P2** 之 NH，係為有利的。在此等情況中，可將對-甲氧苯基或三苯甲基保護基自中間物 **P5**、**P3** 或 **P4** 及按上述所完成之順序移除(藉由以 CAN 或酸個別處理)。

方法 P 實例



步驟 1

於室溫及惰性大氣下，將內醯胺 **P2_1** (1 克) 在 THF (100 毫升) 中之溶液添加至 NaH (1.5 當量) 在 THF 中之懸浮液內。於攪拌 15 分鐘後，使反應混合物冷卻至 -78°C ，然後，於其中經由注射器添加 THF 中之 1 當量 LDA。使其溫熱至 0°C ，歷經

1 小時，接著再冷卻至 -78°C ，並經由注射器添加醛 **P1_1** 之 THF 溶液。使反應混合物溫熱至室溫，然後添加飽和 NH_4Cl 溶液。將混合物以 EtOAc 分配，分離有機層，蒸發至乾涸，及藉急驟式層析純化，提供化合物 **P3_1**。

步驟 2

將 1 克化合物 **P3_1** 以 1 當量 Lawesson 氏試劑，於甲苯 (100 毫升) 中，在介於 50 與 100°C 下處理過夜。於冷卻至室溫後，以鹽水分配，並分離有機層。使其蒸發至乾涸，且將殘留物藉急驟式層析純化，獲得中間物 **P4_1**。

步驟 3：

將 1 克化合物 **P4_1** 於 DCM (100 毫升) 中，以 1 當量 MeI 與 1 當量三乙胺處理。於室溫下 3 小時後，濃縮至乾涸，並使殘留物再溶於二氧陸園中，且添加過量胼。在 50°C 下加熱 6 小時後，冷卻至室溫，蒸發至乾涸，並使殘留物於 DCM 與鹽水之間分配。分離有機層，使其蒸發至乾涸，且將殘留物藉急驟式層析純化，獲得中間物 **P5_1**。

步驟 4

化合物 **P8_1** 可經由將 1 克化合物 **P5_1** 在 DCM (100 毫升) 中之溶液與 1 當量 DCC，以 1 當量已知酸 **P6_1** 處理而製成。於攪拌 12 小時後，添加鹽水 (100 毫升)，並分離有機層。使其蒸發至乾涸，且將殘留物藉急驟式層析純化，獲得中間物 **P7_1**。將化合物 **P7_1** 於甲苯 (100 毫升) 中以 TsOH (0.1 當量) 處理，及在 Dean Stark 集氣瓶中加熱至回流過夜。於冷卻至室溫後，添加稀 NaHCO_3 溶液與鹽水，並分離有機層。使其蒸

發至乾涸，且使殘留物藉急驟式層析，獲得所要之化合物 P8_1。

檢測：

在全細胞中之分泌酶反應與 $A\beta$ 分析：將會過度表現 APP 而具有 Swedish 與 London 突變型之 HEK293 細胞，以所指定之化合物，在含有 10% 牛胎兒血清之 100 毫升 DMEM 培養基中，於 37°C 下處理 5 小時。在培養結束時，總 $A\beta$ 、 $A\beta_{40}$ 及 $A\beta_{42}$ 係使用電致化學發光 (ECL) 為基礎之夾層免疫檢測度量。總 $A\beta$ 係使用一對抗體 TAG-W02 與生物素 -4G8 測定， $A\beta_{40}$ 係以抗體對 TAG-G2-10 與生物素 -4G8 確認，而 $A\beta_{42}$ 係以 TAG-G2-11 與生物素 -4G8 確認。ECL 信號係使用 Sector 成像器 2400 (Meso Scale Discovery) 度量。

$A\beta$ 分佈形態之 MS 分析：在經調理培養基中之 $A\beta$ 分佈形態係使用表面增強雷射解吸附作用 / 離子化作用 (SELDI) 質量光譜法測定。使經調理之培養基與抗體 W02 塗覆之 PS20 ProteinChip 陣列一起培養。於陣列上所捕獲 $A\beta$ 之質譜係根據製造者說明書，在 SELDI ProteinChip 讀取器 (Bio-Rad) 上讀取。

CSF $A\beta$ 分析：在大白鼠 CSF 中之 $A\beta$ 係使用如上述之 MSD 技術測定。 $A\beta_{40}$ 係使用抗體對 TAG-G2-10 與生物素 -4G8 度量，而 $A\beta_{42}$ 係使用 Tag-抗 $A\beta_{42}$ (Meso Scale Discovery) 與生物素 -4G8 度量。ECL 信號係使用 Sector 成像器 2400 (Meso Scale Discovery) 度量。

$A\beta$ 之基質輔助雷射解吸附作用 / 離子化作用質量光譜測定 (MALDI MS) 分析係於 Voyager-DE STR 質譜儀 (ABI, Framingham,

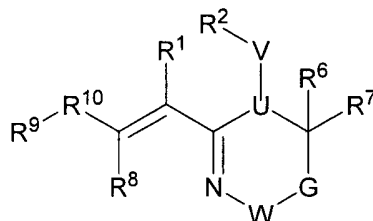
MA)上進行。此儀器係裝有脈衝式氮雷射(337毫微米)。質譜係以線性模式，使用20 kV之加速電壓獲取。在此研究工作中所呈現之各光譜係表示平均256次雷射發射。為製備試樣-基質溶液，將1微升免疫沉澱之 $A\beta$ 試樣與3微升飽和 α -氰基-4-羥基桂皮酸溶液在0.1% TFA/乙腈中混合。接著在質譜分析之前，將試樣-基質溶液施加至試樣板，並於環境溫度下乾燥。所有光譜係以牛胰島素與ACTH之混合物(18-39夾持)作外部校準。

化合物G4具有Ab42 IC₅₀為1114 nM，其中Abtotal/Ab42選擇性為11倍。

雖然本發明已搭配上文提出之特殊具體實施例加以描述，但許多其替代方式、修正及其他變異將為一般熟諳此項技藝者所明瞭。所有此種替代方式、修正及變異均意欲落在本發明之精神與範圍內。

五、中文發明摘要：

在本發明之許多具體實施例中，其係提供新穎下式雜環族化合物種類：

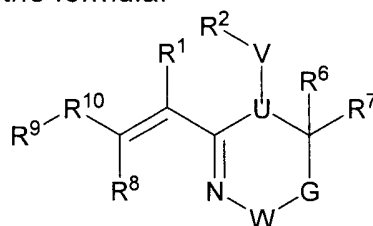


式 I

作為 γ 分泌酶之調節劑，製備此種化合物之方法，含有一或多種此類化合物之醫藥組合物，製備包含一或多種此類化合物之醫藥配方之方法，及使用此種化合物或醫藥組合物治療、預防、抑制或改善一或多種與中樞神經系統有關聯疾病之方法。

六、英文發明摘要：

In its many embodiments, the present invention provides a novel class of heterocyclic compounds of the formula:

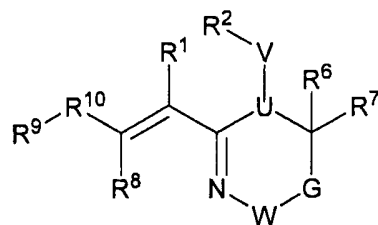


Formula I

as modulators of gamma secretase, methods of preparing such compounds, pharmaceutical compositions containing one or more such compounds, methods of preparing pharmaceutical formulations comprising one or more such compounds, and methods of treatment, prevention, inhibition, or amelioration of one or more diseases associated with the central nervous system using such compounds or pharmaceutical compositions.

十、申請專利範圍：

1. 一種化合物或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有下式中所示之一般結構：



式I

其中：

無論是 (i) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或 (ii) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或 (iii) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；且 R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜

環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或(iv) R^6 與 $-C(R^3)(R^4)-G$ 部份基團之 R^3 或 R^4 之任一個係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或(v) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中該雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；且

U為 $\begin{cases} -C(R^5) \\ N \end{cases}$ ；

W係選自包括鍵結、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O_2)-$ 及 $-C(R^{11})(R^{12})-$ ；

G係選自包括 $-C(R^3)(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 及 $-N(R^{13})-$ ，其附帶條件是，當W為 $-O-$ 或 $-S-$ 時，G不為 $-N(R^{13})-$ 或 $-C(O)-$ ；

V係選自包括鍵結、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 及 $-N(R^{14})-$ ；

R^1 (當 R^1 未接合至 R^2 時)、 R^2 (當 R^2 未接合至 R^1 或 R^6 時)、 R^5 、 R^6 (當 R^6 未接合至 R^2 時)及 R^7 可為相同或不同，各獨立選自包括H、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、

雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

或者， R^1 （當 R^1 未接合至 R^2 時）與 R^8 係一起採用以形成鍵結；

R^3 係選自包括H、鹵基、 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；或

R^3 與 R^6 一起採用，形成鍵結，其條件是，當 R^3 與 R^6 形成鍵結時：(1) W不為鍵結，(2) R^2 與 R^6 係未接合在一起以形成環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團（如上文(ii)與(iii)中所述者），(3) R^6 與 $-C(R^3)(R^4)-G$ 部份基團之 R^3 或 R^4

之任一個係未接合在一起以形成環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團(如上文(iv)中所述者)，及(4) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係未接合在一起以形成雜環基或雜環烯基部份基團(如上文(v)中所述者)；

R^4 、 R^{11} 及 R^{12} 可為相同或不同，各獨立選自包括H、鹵基、 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

其條件是，當 R^3 或 R^4 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ 時，則另一個不選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$

及 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 及 $-\text{N}_3$ ；

其條件是，當 R^{11} 或 R^{12} 之一係選自包括： $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 及 $-\text{N}_3$ 時，則另一個不選自包括： $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 及 $-\text{N}_3$ ；

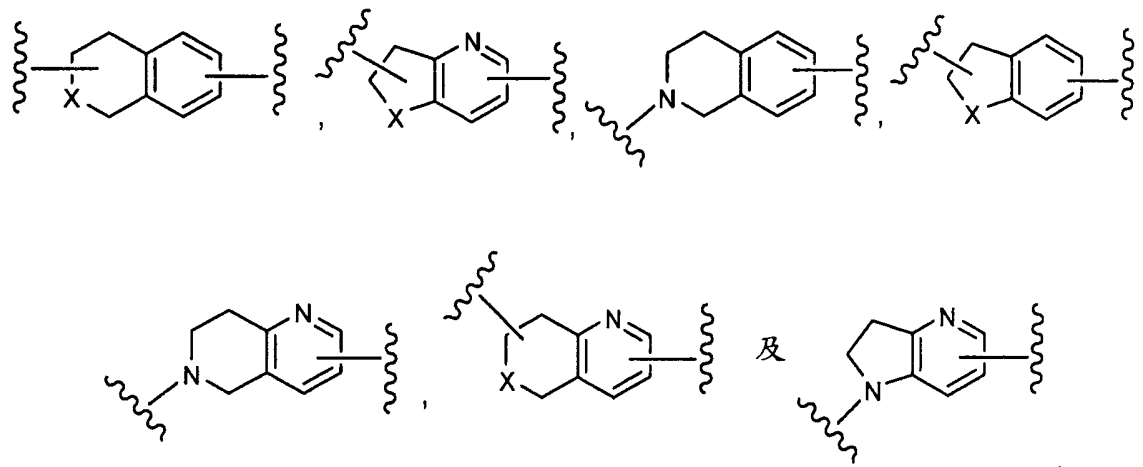
R^{13} 係獨立選自包括 H、烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基-、芳基雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基、芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基-、芳基雜環烯基-、雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-、雜環

烯基芳基-、 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^9$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、
 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})(\text{R}^{12})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})(\text{R}^{12})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{11})$
 (R^{12}) 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{N}=\text{C}(\text{R}^8)_2$ 及 $-\text{N}(\text{R}^8)_2$ ；且其中該 R^{13} 烷基、芳烷
 基-、雜芳烷基-、環烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環
 烷基烷基-、雜芳基環烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、
 雜芳基雜環烷基烷基-、環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環
 烷基-、雜環烷基、芳基雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、
 烯基、芳烯基-、環烯基、芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、
 雜環烯基-、芳基雜環烯基-、雜芳基雜環烯基-、炔基、
 芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、雜環烷基芳基-、雜環
 烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、雜環烷基雜芳基-、
 環烯基芳基-及雜環烯基芳基-係視情況被1至5個基團取
 代，取代基獨立選自包括：烷基、烯基、炔基、環烷基、
 環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳
 烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、
 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、
 $-\text{CH}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})$
 (OR^{16}) 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、-烷基- $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、
 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{R}^{15}$ ；
 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})-$
 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、
 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 、
 $-\text{N}_3$ 、 $-\text{NO}_2$ 及 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ ；

R^{14} 係選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 及 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ ；

R^8 係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-係為未經取代，或視情況獨立被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R^{10} 係選自包括鍵結、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-及以下部份基團：



其中X為O、 $\text{N}(\text{R}^{14})$ 或S；

其中關於 R^{10} 之各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-

基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-，以及上文關於 R^{10} 所指之部份基團，可為未經取代，或視情況獨立被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括下文所示之部份基團；且

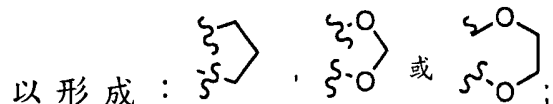
R^9 係選自包括烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

R^{15} 、 R^{16} 及 R^{17} 係獨立選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、芳基環烷基-、芳基雜環基-、 R^{18} -烷基、 R^{18} -環烷基、 R^{18} -環烷基烷基-、 R^{18} -雜環基、 R^{18} -雜環基烷基-、 R^{18} -芳基、 R^{18} -芳烷基-、 R^{18} -雜芳基及 R^{18} -雜芳烷基-；

R^{18} 為1-5個取代基，獨立選自包括烷基、烯基、炔基、芳基、芳烷基-、芳烯基-、芳基炔基-、 $-\text{NO}_2$ 、鹵基、雜芳基、HO-烷氧基烷基-、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、烷基-CN、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{雜芳基})$ 、 $-\text{SR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、

-S(O)NH(芳基)、-S(O)₂NH₂、-S(O)₂NHR¹⁹、-S(O)₂NH(雜環基)、
 -S(O)₂N(烷基)₂、-S(O)₂N(烷基)(芳基)、-OCF₃、-OH、-OR²⁰、
 -O-雜環基、-O-環烷基烷基、-O-雜環基烷基、-NH₂、-NHR²⁰、
 -N(烷基)₂、-N(芳烷基)₂、-N(芳烷基)-(雜芳烷基)、
 -NHC(O)R²⁰、-NHC(O)NH₂、-NHC(O)NH(烷基)、-NHC(O)N(烷
 基)(烷基)、-N(烷基)C(O)NH(烷基)、-N(烷基)C(O)N(烷基)(烷
 基)、-NHS(O)₂R²⁰、-NHS(O)₂NH(烷基)、-NHS(O)₂N(烷基)(烷
 基)、-N(烷基)S(O)₂NH(烷基)及-N(烷基)S(O)₂N(烷基)(烷基)；

或者，在相鄰碳上之兩個R¹⁸部份基團可連結在一起，



R¹⁹為烷基、環烷基、芳基、芳烷基-或雜芳烷基-；

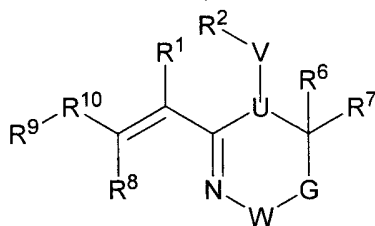
R²⁰為烷基、環烷基、芳基、鹵基取代之芳基、芳烷基-、
 雜芳基或雜芳烷基-；

其中在R¹, R², R¹-R², R²-R⁶, R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰,
 R¹¹, R¹²及R¹⁴中之各烷基、環烷基、環烯基、環烷基烷基-、
 雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、烷基芳基-、雜
 芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或視
 情況被1至5個R²¹基團取代，取代基獨立選自包括烷基、
 烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、
 雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵
 基、-CN、-OR¹⁵、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、
 -SR¹⁵、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-CH(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、
 -C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-烷基

-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)-C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-R¹⁵；-CH₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)-C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-S(O)R¹⁵、=NOR¹⁵、-N₃、-NO₂及-S(O)₂R¹⁵；

其中在R²¹中之各烷基、環烯基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或被1至5個R²²基團取代，取代基獨立選自包括烷基、環烷基、環烯基、雜環基、芳基、雜芳基、鹵基、-CF₃、-CN、-OR¹⁵、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-烷基-C(O)OR¹⁵、C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-SR¹⁵、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-烷基-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)-C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)-N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-N₃、=NOR¹⁵、-NO₂、-S(O)R¹⁵及-S(O)₂R¹⁵。

2. 一種化合物或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有下式中所示之一般結構：



其中：

R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

U為 $\begin{matrix} \diagup \\ \diagdown \end{matrix} -C(R^5)$ 或N；

W係選自包括鍵結、-O-、-C(O)-、-S-；-S(O)-、-S(O₂)-及-C(R¹¹)(R¹²)-；

G為-C(R³)(R⁴)-；-C(O)-及-N(R¹³)-；其附帶條件是，當W為-O-或-S-時，G不為-N(R¹³)-或-C(O)-；

V係選自包括鍵結、-O-、-C(O)-及-N(R¹⁴)-；

R^5 、 R^6 及 R^7 可為相同或不同，各獨立選自包括H、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R^3 係選自包括H、鹵基、-OR¹⁵、-CN、-SR¹⁵、-NR¹⁵R¹⁶、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂-N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、

-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、
 -S(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、=NOR¹⁵、-N₃、烷基-、
 烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、
 環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷
 基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、
 烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、
 雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被
 1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選
 自包括下文所示之部份基團；或

R³與R⁶一起採用，形成鍵結，其條件是，當R³與R⁶形成
 鍵結時，W不為鍵結；

R⁴、R¹¹及R¹²可為相同或不同，各獨立選自包括H、鹵
 基、-OR¹⁵、-CN、-SR¹⁵、-NR¹⁵R¹⁶、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)-
 S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)-
 N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、
 -C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、
 -S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、
 -P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、=NOR¹⁵、-N₃、烷基-、烯基-、炔基-、
 芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、
 雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該
 烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環
 烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及
 雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相
 同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所

示之部份基團，

其條件是，當 R^3 或 R^4 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ 時，則另一個不選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 及 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ ；

其條件是，當 R^{11} 或 R^{12} 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ 時，則另一個不選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ ；

R^{13} 係獨立選自包括 H、烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳

基環烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基、芳基雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基、環烯基、芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基、芳基雜環烯基-、雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-、雜環烯基芳基-、 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^9$ 、 $-S(O)R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-S(O)N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-S(O)_2N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=C(R^8)_2$ 及 $-N(R^8)_2$ ；且其中該 R^{13} 烷基、芳烷基-、雜芳烷基-、環烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基、芳基雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基、芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基、芳基雜環烯基-、雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-及雜環烯基芳基-係視情況被1至5個基團取代，取代基獨立選自包括：烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-CH(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、

-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-烷基-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)-C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-R¹⁵；-CH₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)-N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-S(O)R¹⁵、=NOR¹⁵、-N₃、-NO₂及-S(O)₂R¹⁵；

R¹⁴係選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、-CN、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶及-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)；

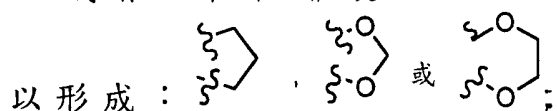
R⁸係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-係為未經取代，或視情況獨立被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R¹⁰係選自包括鍵結、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-及以下部份基團：

雜環基烷基-、 R^{18} -芳基 R^{18} -芳烷基、 R^{18} -雜芳基及 R^{18} -雜芳烷基-；

R^{18} 為 1-5 個取代基，獨立選自包括烷基、烯基、炔基、芳基、芳烷基-、芳烯基-、芳基炔基-、 $-\text{NO}_2$ 、鹵基、雜芳基、HO-烷氧基烷基-、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、烷基-CN、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{雜芳基})$ 、 $-\text{SR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{芳基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{雜環基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{O}$ -雜環基、 $-\text{O}$ -環烷基烷基、 $-\text{O}$ -雜環基烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})(\text{雜芳烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 及 $-\text{N}(\text{烷基})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ ；

或者，在相鄰碳上之兩個 R^{18} 部份基團可連結在一起，



R^{19} 為烷基、環烷基、芳基、芳烷基或雜芳烷基；

R^{20} 為烷基、環烷基、芳基、鹵基取代之芳基、芳烷基、雜芳基或雜芳烷基；

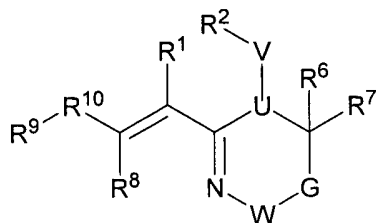
其中在 R^1 - R^2 ， R^3 ， R^4 ， R^5 ， R^6 ， R^7 ， R^8 ， R^9 ， R^{10} ， R^{11} ， R^{12} 及 R^{14} 中之各烷基、環烷基、環烯基、環烷基烷基-、雜環基、

雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、烷基芳基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或視情況被1至5個 R^{21} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、-CN、-OR¹⁵、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-SR¹⁵、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-CH(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-烷基-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)-C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-R¹⁵；-CH₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-CH₂-N(R¹⁵)-C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-S(O)R¹⁵、=NOR¹⁵、-N₃、-NO₂及-S(O)₂R¹⁵；

其中在 R^{21} 中之各烷基、環烯基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或被1至5個 R^{22} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、環烷基、環烯基、雜環基、芳基、雜芳基、鹵基、-CF₃、-CN、-OR¹⁵、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-烷基-C(O)OR¹⁵、C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-SR¹⁵、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-烷基-N(R¹⁵)(R¹⁶)、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-CH₂-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)

、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})-C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-N_3$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-NO_2$ 、 $-S(O)R^{15}$ 及 $-S(O)_2R^{15}$ 。

3. 一種化合物或該化合物之藥學上可接受鹽、溶劑合物、酯類或前體藥物，該化合物具有下式中所示之一般結構：



其中：

R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

U 為 $\begin{matrix} \diagup \\ \diagdown \end{matrix} -C(R^5)$ 或 N；

W 係選自包括鍵結、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O_2)-$ 及 $-C(R^{11})(R^{12})-$ ；

G 為 $-C(R^3)(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 及 $-N(R^{13})-$ ；其附帶條件是，當 W 為 $-O-$ 或 $-S-$ 時，G 不為 $-N(R^{13})-$ 或 $-C(O)-$ ；

V 係選自包括鍵結、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 及 $-N(R^{14})-$ ；

R^1 (當 R^1 未接合至 R^2 時)、 R^5 、 R^6 (當 R^6 未接合至 R^2 時) 及 R^7 可為相同或不同，各獨立選自包括 H、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，

其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

或者， R^1 （當 R^1 未接合至 R^2 時）與 R^8 係一起採用以形成鍵結；

R^3 係選自包括H、鹵基、 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R^4 、 R^{11} 及 R^{12} 可為相同或不同，各獨立選自包括H、鹵基、 $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)-$

OR¹⁶、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、
 -S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、
 -P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、=NOR¹⁵、-N₃、烷基-、烯基-、炔基-、
 芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、
 雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該
 烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環
 烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及
 雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相
 同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所
 示之部份基團，

其條件是，當R³或R⁴之一係選自包括：-OR¹⁵、-CN、
 -SR¹⁵、-NR¹⁵R¹⁶、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)-
 S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、
 -N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、
 -S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、
 =NOR¹⁵及-N₃時，則另一個不選自包括：-OR¹⁵、-CN、-SR¹⁵
 及 -NR¹⁵R¹⁶、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)-
 S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、
 -N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、
 -S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、
 =NOR¹⁵及-N₃；

其條件是，當R¹¹或R¹²之一係選自包括：-OR¹⁵、-CN、
 -SR¹⁵、-NR¹⁵R¹⁶、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)-
 S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、

-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、
 -S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、
 =NOR¹⁵及-N₃時，則另一個不選自包括：-OR¹⁵、-CN、-SR¹⁵、
 -NR¹⁵R¹⁶、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、
 -N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)-
 N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)
 (R¹⁶)、-S(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、=NOR¹⁵及-N₃；

R¹³係獨立選自包括H、烷基、芳烷基、雜芳烷基-、環
 烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基
 環烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-
 、環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基、芳
 基雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯
 基、芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基、芳基雜環
 烯基-、雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環
 烷基芳基-、雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、
 環烷基雜芳基-、雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基、雜環烯
 基芳基-、-OR¹⁵、-CN、-C(O)R⁸、-C(O)OR⁹、-S(O)R¹⁰、-S(O)₂R¹⁰、
 -C(O)N(R¹¹)(R¹²)、-S(O)N(R¹¹)(R¹²)、-S(O)₂N(R¹¹)(R¹²)、-NO₂、
 -N=C(R⁸)₂及-N(R⁸)₂；且其中該R¹³烷基、芳烷基-、雜芳烷
 基-、環烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、
 雜芳基環烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷
 基烷基-、環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環
 烷基、芳基雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、
 環烯基、芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基、芳基

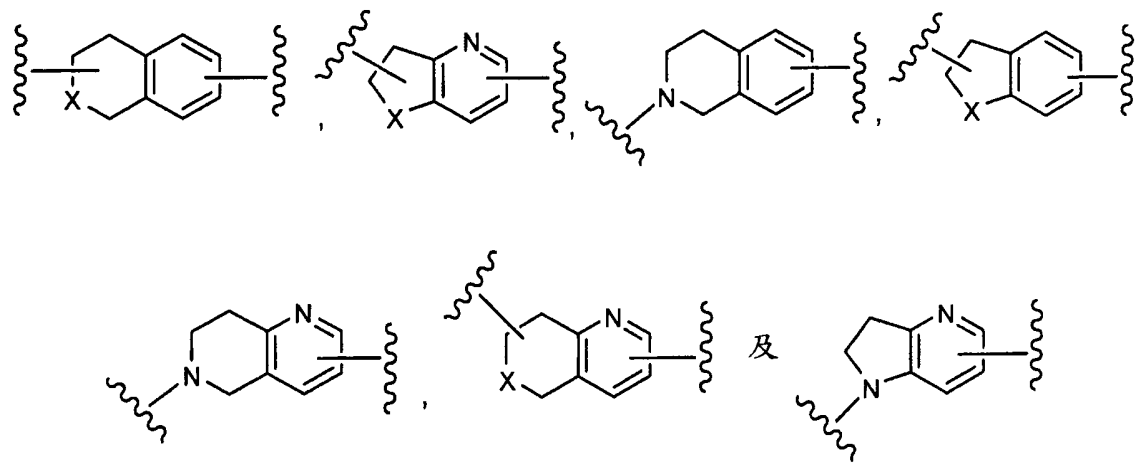
雜環烯基-、雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基、芳基、環烷基芳基-、雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-、及雜環烯基芳基-係視情況被1至5個基團取代，取代基獨立選自包括：烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{CH}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、-烷基- $\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})-\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{R}^{15}$ ； $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 、 $-\text{N}_3$ 、 $-\text{NO}_2$ 及 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ ；

R^{14} 係選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 及 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ ；

R^8 係選自包括H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-

-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-係為未經取代，或視情況獨立被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R^{10} 係選自包括鍵結、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-及以下部份基團：



其中X為O、 $N(R^{14})$ 或S；

其中關於 R^{10} 之各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-，以及上文關於 R^{10} 所指之部份基團，可為未經取代，或視情況獨立被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括下文所示之部份基團；且

R^9 係選自包括烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、

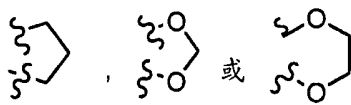
雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

R^{15} 、 R^{16} 及 R^{17} 係獨立選自包括H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、芳基環烷基、芳基雜環基-、 R^{18} -烷基-、 R^{18} -環烷基-、 R^{18} -環烷基烷基-、 R^{18} -雜環基-、 R^{18} -雜環基烷基-、 R^{18} -芳基-、 R^{18} -芳烷基-、 R^{18} -雜芳基-及 R^{18} -雜芳烷基-；

R^{18} 為1-5個取代基，獨立選自包括烷基、烯基、炔基、芳基、芳烷基、芳烯基、芳基炔基、 $-\text{NO}_2$ 、鹵基、雜芳基、HO-烷氧基烷基、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、烷基-CN、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{雜芳基})$ 、 $-\text{SR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{芳基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{雜環基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{O}$ -雜環基、 $-\text{O}$ -環烷基烷基、 $-\text{O}$ -雜環基烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})(\text{雜芳烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})$

基) $\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 及 $-\text{N}(\text{烷基})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$;

或者，在相鄰碳上之兩個 R^{18} 部份基團可連結在一起，

以形成：

R^{19} 為烷基、環烷基、芳基、芳烷基或雜芳烷基；

R^{20} 為烷基、環烷基、芳基、鹵基取代之芳基、芳烷基、雜芳基或雜芳烷基；

其中在 $\text{R}^1, \text{R}^2\text{-R}^6, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{11}, \text{R}^{12}$ 及 R^{14} 中之各烷基、環烷基、環烯基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、烷基芳基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或視情況被1至5個 R^{21} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{CH}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^{15})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{15})(\text{OR}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、-烷基 $-\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{R}^{15}$ ； $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{16}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{16})(\text{R}^{17})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^{15})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{16}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $=\text{NOR}^{15}$ 、 $-\text{N}_3$ 、 $-\text{NO}_2$ 及 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ ；

一起，以形成 C4-C8 環烷基、C4-C8 環烯基、5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中各該環烷基或雜環基部份基團係為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

U 為 $\begin{array}{c} \diagup \\ \diagdown \end{array} \text{—C(R}^5\text{) 或 N}；$

W 係選自包括鍵結、-O-、-C(O)-、-S-、-S(O)-、-S(O₂)-及 -C(R¹¹)(R¹²)-；

G 為 -C(R³)(R⁴)-；-C(O)- 及 -N(R¹³)-；其附帶條件是，當 W 為 -O- 或 -S- 時，G 不為 -N(R¹³)- 或 -C(O)-；

V 係選自包括鍵結、-O-、-C(O)- 及 -N(R¹⁴)-；

R⁵、R⁶ 及 R⁷ 可為相同或不同，各獨立選自包括 H、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被 1-5 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R³ 係選自包括 H、鹵基、-OR¹⁵、-CN、-SR¹⁵、-NR¹⁵R¹⁶、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂-N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、

-S(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、=NOR¹⁵、-N₃、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R⁴、R¹¹及R¹²可為相同或不同，各獨立選自包括H、鹵基、-OR¹⁵、-CN、-SR¹⁵、-NR¹⁵R¹⁶、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)S(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)N(R¹⁶)(R¹⁷)、-N(R¹⁵)C(O)OR¹⁶、-C(O)R¹⁵、-C(O)OR¹⁵、-C(=NOR¹⁵)R¹⁶、-C(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)₂N(R¹⁵)(R¹⁶)、-S(O)R¹⁵、-S(O)₂R¹⁵、-P(O)(OR¹⁵)(OR¹⁶)、=NOR¹⁵、-N₃、烷基-、烯基-、炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-可為未經取代，或視情況獨立被1-5個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團，

其條件是，當R³或R⁴之一係選自包括：-OR¹⁵、-CN、-SR¹⁵、-NR¹⁵R¹⁶、-N(R¹⁵)C(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)R¹⁶、-N(R¹⁵)S(O)₂-

R^{16} 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ 時，則另一個不選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 及 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ ；

其條件是，當 R^{11} 或 R^{12} 之一係選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ 時，則另一個不選自包括： $-OR^{15}$ 、 $-CN$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-NR^{15}R^{16}$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{15}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $=NOR^{15}$ 及 $-N_3$ ；

R^{13} 係獨立選自包括H、烷基、芳烷基、雜芳烷基-、環烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、雜芳基環烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷基烷基-、環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環烷基、芳基雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、環烯基、芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基、芳基雜環烯基-、

雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳基、環烷基芳基-、
 雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜芳基、環烷基雜芳基-、
 雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-、雜環烯基芳基-、 $-OR^{15}$ 、
 $-CN$ 、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^9$ 、 $-S(O)R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、
 $-C(O)N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-S(O)N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-S(O)_2N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-NO_2$ 、
 $-N=C(R^8)_2$ 及 $-N(R^8)_2$ ；且其中該 R^{13} 烷基、芳烷基-、雜芳烷
 基-、環烷基烷基-、雜環烷基烷基-、芳基環烷基烷基-、
 雜芳基環烷基烷基-、芳基雜環烷基烷基-、雜芳基雜環烷
 基烷基-、環烷基、芳基環烷基-、雜芳基環烷基-、雜環
 烷基、芳基雜環烷基-、雜芳基雜環烷基-、烯基、芳烯基-、
 環烯基、芳基環烯基-、雜芳基環烯基-、雜環烯基-、芳
 基雜環烯基-、雜芳基雜環烯基-、炔基、芳基炔基-、芳
 基、環烷基芳基-、雜環烷基芳基-、雜環烯基芳基-、雜
 芳基、環烷基雜芳基-、雜環烷基雜芳基-、環烯基芳基-
 及雜環烯基芳基-係視情況被1至5個基團取代，取代基獨
 立選自包括：烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、
 環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、
 雜芳烷基-、鹵基、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、
 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-CH(R^{15})(R^{16})$ 、
 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、
 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-烷基-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})-$
 $C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-R^{15}$ ； $-CH_2N(R^{15})$
 (R^{16}) 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、
 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)-$

$N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ 及 $-S(O)_2R^{15}$ ；

R^{14} 係選自包括 H、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、 $-CN$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 及 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ ；

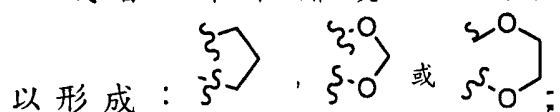
R^8 係選自包括 H、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-，其中各該烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-及雜環基烷基-係為未經取代，或視情況獨立被 1-3 個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括下文所示之部份基團；

R^{10} 係選自包括鍵結、烷基-、烯基-及炔基-、芳基-、芳烷基-、烷基芳基-、環烷基-、環烷基烷基-、雜芳基-、雜芳烷基-、雜環基-、雜環基烷基-及以下部份基團：

R^{18} -雜環基烷基-、 R^{18} -芳基-、 R^{18} -芳烷基-、 R^{18} -雜芳基-及 R^{18} -雜芳烷基

R^{18} 為1-5個取代基，獨立選自包括烷基、烯基、炔基、芳基、芳烷基-、芳烯基-、芳基炔基-、 $-\text{NO}_2$ 、鹵基、雜芳基、HO-烷氧基烷基-、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、烷基-CN、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{19}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{雜芳基})$ 、 $-\text{SR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NH}(\text{芳基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHR}^{19}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{雜環基})$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{芳基})$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{O}$ -雜環基、 $-\text{O}$ -環烷基烷基、 $-\text{O}$ -雜環基烷基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{20}$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{芳烷基})(\text{雜芳烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{烷基})\text{S}(\text{O})_2\text{NH}(\text{烷基})$ 及 $-\text{N}(\text{烷基})\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{烷基})(\text{烷基})$ ；

或者，在相鄰碳上之兩個 R^{18} 部份基團可連結在一起，



R^{19} 為烷基、環烷基、芳基、芳烷基-或雜芳烷基-；

R^{20} 為烷基、環烷基、芳基、鹵基取代之芳基、芳烷基-、雜芳基或雜芳烷基-；

其中在 R^1 - R^2 ， R^2 - R^6 ， R^3 ， R^4 ， R^5 ， R^7 ， R^8 ， R^9 ， R^{10} ， R^{11} ， R^{12} 及 R^{14} 中之各烷基、環烷基、環烯基、環烷基烷基、雜環基、

雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、烷芳基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或視情況被1至5個 R^{21} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基-、環烯基、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、鹵基、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-CH(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-烷基-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})-C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-R^{15}$ ； $-CH_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})S(O)-N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)-N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ 及 $-S(O)_2R^{15}$ ；

其中在 R^{21} 中之各烷基、環烯基、環烷基、環烷基烷基-、雜環基、雜環基烷基-、芳基、芳烷基-、雜芳基、雜芳烷基-、烯基及炔基係獨立為未經取代，或被1至5個 R^{22} 基團取代，取代基獨立選自包括烷基、環烷基、環烯基、雜環基、芳基、雜芳基、鹵基、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{15}$ 、 $-C(O)R^{15}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-烷基-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-S(O)_2N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-C(=NOR^{15})R^{16}$ 、 $-P(O)(OR^{15})(OR^{16})$ 、 $-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-烷基-N(R^{15})(R^{16})$ 、 $-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})S(O)_2R^{16}$ 、 $-N(R^{15})S(O)_2N(R^{16})(R^{17})$

、 $-N(R^{15})S(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-CH_2-N(R^{15})-C(O)N(R^{16})(R^{17})$ 、 $-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-CH_2-N(R^{15})C(O)OR^{16}$ 、 $-N_3$ 、 $=NOR^{15}$ 、 $-NO_2$ 、 $-S(O)R^{15}$ 及 $-S(O)_2R^{15}$ 。

5. 如請求項 1 之化合物，其中 R^1 為 H。
6. 如請求項 1 之化合物，其中 R^1 為烷基。
7. 如請求項 1 之化合物，其中 R^1 為甲基。
8. 如請求項 1 之化合物，其中 U 為 $C(R^5)$ 。
9. 如請求項 1 之化合物，其中 U 為 N。
10. 如請求項 1 之化合物，其中 W 為鍵結。
11. 如請求項 1 之化合物，其中 W 為 $-O-$ 。
12. 如請求項 1 之化合物，其中 R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成環己基環。
13. 如請求項 1 之化合物，其中 W 為 $-C(O)-$ 。
14. 如請求項 1 之化合物，其中 $=N-W-G-$ 為 $=N-C(R^{11}R^{12})-C(O)-$ 。
15. 如請求項 1 之化合物，其中 W 為 $-C(R^{11})(R^{12})-$ 。
16. 如請求項 1 之化合物，其中：

(a) U 為 N，且 R^2 與 R^6 係接合在一起以形成四氫吡咯基環，包含 U 之 N 作為該未經取代之四氫吡咯基環之氮；或

(b) U 為 N，且 R^2 與 R^6 係接合在一起以形成四氫吡咯基環，包含 U 之 N 作為該四氫吡咯基環之氮，其中該四氫吡咯基環係被 1-3 個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(\text{烷基})$ 、 $-N(\text{烷基})_2$ 、羥基及烷氧基；或

(c) U 為 N，且 R^2 與 R^6 係接合在一起以形成六氫吡啶基

環，包含U之N作為該未經取代之六氫吡啶基環之氮；或

(d) U為N，且 R^2 與 R^6 係接合在一起以形成六氫吡啶基環，包含U之N作為該六氫吡啶基環之氮，其中該六氫吡啶基環係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基；或

(e) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成未經取代之嗎福啉基環；或

(f) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成嗎福啉基環，其係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基；或

(g) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成未經取代之哌喃基環；或

(h) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成哌喃基環，其係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基；或

(i) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成未經取代之四氫吡咯基環；或

(j) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其係被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

17. 如請求項 1 之化合物，其中：

(a) U 為 N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起以形成四氫吡咯基環，其係被 1-3 個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基；或

(b) U 為 N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起以形成六氫吡啶基環，其係被 1-3 個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基；或

(c) U 為 N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起以形成六氫吡啶基環，其係被 1-3 個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

18. 如請求項 1 之化合物，其中 R^7 為 4-氟苯基。

19. 如請求項 1 之化合物，其中：

(a) U 為 N， R^1 與 R^2 係接合在一起以形成四氫吡咯基環，該環係為未經取代，或視情況被 1-3 個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基，且 R^2 與 R^6 係接合在一起以形成四氫吡咯基環，該環係為未經取代，或視情況被 1-3 個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基；或

(b) U 為 N， R^1 與 R^2 係接合在一起以形成六氫吡啶基環，

該環係為未經取代，或視情況被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基，且R²與R⁶係接合在一起以形成六氫吡啶基環，該環係為未經取代，或視情況被1-3個取代基取代，取代基可為相同或不同，各獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

20. 如請求項1之化合物，其中：

(a) R⁷為未經取代之聯苯基；或

(b) R⁷為聯苯基，其係被1-4個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、-CN、-NH₂、-NH(烷基)、-N(烷基)₂、羥基及烷氧基；

(c) R⁷為3-(1,1'-聯苯基)-基；或

(d) R⁷為4-(1,1'-聯苯基)-基。

21. 如請求項1之化合物，其中R⁸為H。

22. 如請求項1之化合物，其中R⁸為烷基。

23. 如請求項1之化合物，其中R⁸為甲基。

24. 如請求項1之化合物，其中R¹⁰為芳基。

25. 如請求項1之化合物，其中R¹⁰為苯基。

26. 如請求項1之化合物，其中R¹⁰為雜芳基。

27. 如請求項1之化合物，其中R⁹為未經取代之雜芳基。

28. 如請求項1之化合物，其中R⁹為雜芳基，其係被1-3個可為相同或不同之取代基取代，各取代基係獨立選自包括鹵基、烷基、CN、NH₂、NH(烷基)、N(烷基)₂、羥基及烷氧基。

基。

29. 如請求項1之化合物，其中 R^9 為咪唑-1-基。

30. 如請求項1之化合物，其中 R^9 為4-甲基-咪唑-1-基。

31. 如請求項1之化合物，其中 R^9 為5-氯基-4-甲基-咪唑-1-基。

32. 如請求項1之化合物，其中：

(a)

U 為 $C(R^5)$ ；

R^1 為 H；

R^2 與 R^6 係連接以形成4-7員環烷基環；

R^7 為3-(1,1'-聯苯基)-基；

R^8 為 H；

R^{10} 係選自包括：3-甲氧基-苯基與3-F-苯基；且

R^9 為4-甲基-咪唑基-1-基；或

(b)

U 為 $C(R^5)$ 或 N；

R^1 為 H；

R^2 與 R^6 係連接以形成5-8員雜環基環；

R^7 為3-(1,1'-聯苯基)-基；

R^8 為 H；

R^{10} 係選自包括：3-甲氧基-苯基與3-F-苯基；且

R^9 為4-甲基-咪唑基-1-基；或

(c)

U 為 $C(R^5)$ 或 N；

R^1 與 R^2 係連接以形成5-8員雜環基環；

R^2 與 R^6 係連接以形成 5-8 員雜環基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

R^8 為 H；

R^{10} 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基；且

R^9 為 4-甲基-咪唑基-1-基；或

(d)

U 為 $C(R^5)$ ；

R^2 與 R^6 係連接以形成 4-7 員環烷基環；

R^1 與 R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

R^8 為 H；

R^{10} 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基；且

R^9 為 4-甲基-咪唑基-1-基；或

(e)

U 為 $C(R^5)$ 或 N；

R^1 與 R^2 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^2 與 R^6 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

R^8 為 H；

R^{10} 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基；且

R^9 為 4-甲基-咪唑基-1-基；或

(f)

U 為 $C(R^5)$ 或 N；

R^1 與 R^2 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^2 與 R^6 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

R^8 為 H；

R^{10} 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基；且

R^9 為 4-甲基-咪唑基-1-基；或

(g)

U 為 C(R^5)或 N；

R^1 與 R^2 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^2 與 R^6 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

R^8 為 H；

R^{10} 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基；且

R^9 為 4-甲基-咪唑基-1-基；或

(h)

U 為 N；

R^1 與 R^2 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^2 與 R^6 係連接以形成六氫吡啶基環；

R^7 為 3-(1,1'-聯苯基)-基；

R^8 為 H；

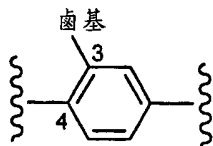
R^{10} 係選自包括：3-甲氧基-苯基與 3-F-苯基；且

R^9 為 4-甲基-咪唑基-1-基。

33. 如請求項 1 之化合物，其中 R^{10} 為被 1 個鹵基取代之苯基。

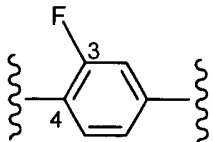
34. 如請求項 1 之化合物，其中 R^{10} 為被 1 個鹵基取代之苯基，
且該鹵基為 F。

35. 如請求項 1 之化合物，其中 R^{10} 為：



(其中得自經標識為4之碳之鍵結係對 R^9 基團)。

36. 如請求項1之化合物，其中 R^{10} 為：

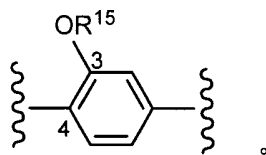


(其中得自經標識為4之碳之鍵結係對 R^9 基團)。

37. 如請求項1之化合物，其中 R^{10} 為被一個 $-OR^{15}$ 基團取代之苯基。

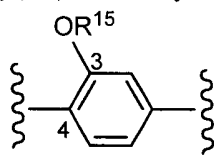
38. 如請求項1之化合物，其中 R^{10} 為被一個 $-OR^{15}$ 基團取代之苯基，且該 R^{15} 為烷基。

39. 於另一項具體實施例中， R^{10} 為：



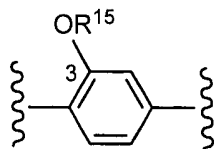
(其中得自經標識為4之碳之鍵結係對 R^9 基團)。

40. 如請求項1之化合物，其中 R^{10} 為：



其中 R^{15} 為烷基(其中得自經標識為4之碳之鍵結係對 R^9 基團)。

41. 如請求項1之化合物，其中 R^{10} 為：



其中 R^{15} 為甲基(意即 R^{10} 為3-甲氧基-苯基)。

42. 如請求項1之化合物，其中 R^9 為被1至3個獨立經選擇之烷基取代之雜芳基。

43. 如請求項1之化合物，其中 R^9 為被一個烷基取代之雜芳基。

44. 如請求項1之化合物，其中：

(a) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成視情況被1至5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代之環，且該環係與芳基或雜芳基環稠合，及該所形成之稠合環係視情況被1至5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(b) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成被1至5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代之環，且該環係與芳基或雜芳基環稠合，及該所形成之稠合環係視情況被1至5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(c) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成視情況被1至5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代之環；或

(d) R^1 與 R^2 係接合在一起以形成環；或

(e) R^1 與 R^2 係接合在一起以形成環，且該環係與芳基或雜芳基環稠合，且該所形成之稠合環係視情況被1至5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

45. 如請求項1之化合物，其中：

(a) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成視情況被1至5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代之雜環基環；或

(b) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成被1至5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代之雜環基環；或

(c) U 為 N ，且 R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成視情況被1

至5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代之雜環基環；或

(d) U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成被1至5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代之雜環基環；或

(e) R^1 與 R^2 係接合在一起以形成雜環基環；或

(f) U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起以形成雜環基環。

46. 如請求項1之化合物，其中：

(a) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成視情況被1至5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代之六氫吡啶基環；或

(b) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成被1至5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代之六氫吡啶基環；或

(c) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成視情況被1至5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代之六氫吡啶基環；或

(d) U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成被1至5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代之六氫吡啶基環；或

(e) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成視情況被=O部份基團取代之六氫吡啶基環；或

(f) U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成視情況被=O部份基團取代之六氫吡啶基環；或

(g) R^1 與 R^2 係接合在一起以形成六氫吡啶基；或

(h) U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起以形成六氫吡啶基環；或

(i) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成被=O部份基團取代之六氫吡啶基環；或

(j) U為N，且 R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成被=O部份基

團取代之六氫吡啶基環。

47. 如請求項1之化合物，其中 R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(a)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，(b)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及(c)該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

48. 如請求項1之化合物，其中：

(a) R^1 與 R^2 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(1)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與(2)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及

(b) R^2 與 R^6 係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(1)該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與(2)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；及

(c) 該 R^2 與 R^6 環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

49. 如請求項1之化合物，其中 R^6 與 $-C(R^3)(R^4)-G$ 部份基團之 R^3 或 R^4 之任一個係接合在一起，以形成C4-C8環烷基、C4-C8環烯基、5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：

(a) 該環烷基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，(b) 該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，及(c) 該環烷基、環烯基、雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

50. 如請求項1之化合物，其中：

(a) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中：(1) 該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與(2) 該雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(b) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(c) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團，其中該雜環基部份基團係被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(d) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5-8員雜環基或5-8員雜環烯基部份基團；或

(e) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成 5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中：(1) 該雜環基部份基團係視情況被 $=O$ 取代，與 (2) 該雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(f) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成 5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中該雜環基部份基團係視情況被 $=O$ 取代；或

(g) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成 5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中該雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(h) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成 5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團；

(i) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成 5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中：(1) 該雜環基部份基團係被 $=O$ 取代，與 (2) 該雜環基或雜環烯基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；

(j) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成 5-8 員雜環基或 5-8 員雜環烯基部份基團，其中該雜環基部

份基團係被=O取代。

51. 如請求項1之化合物，其中：

(a) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團，其中：(1)該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與(2)該雜環基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(b) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團，其中該雜環基部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(c) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團，其中：(1)該雜環基部份基團係視情況被=O取代，與(2)該雜環基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(d) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團，其中該雜環基部份基團係視情況被=O取代；或

(e) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5員雜環基部份基團，其中該雜環基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被1-5個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(f) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成5

員雜環基部份基團；或

(g) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成 5 員雜環基部份基團，其中：(1) 該雜環基部份基團係被 $=O$ 取代，與 (2) 該雜環基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(h) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成 5 員雜環基部份基團，其中該雜環基部份基團係被 $=O$ 取代；或

(i) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成 5 員雜環基部份基團，其中：(1) 該雜環基部份基團係被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與 (2) 該雜環基部份基團係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(j) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成 5 員雜環基部份基團，其中該雜環基部份基團係被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

52. 如請求項 1 之化合物，其中：

(a) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中：(1) 該四氫吡咯基環係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與 (2) 該四氫吡咯基環係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(b) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中該四氫吡咯基環係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(c) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中：(1) 該四氫吡咯基環係視情況被 $=O$ 取代，與 (2) 該四氫吡咯基環係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(d) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中該四氫吡咯基環係視情況被 $=O$ 取代；或

(e) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中該四氫吡咯基環係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(f) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環；或

(g) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中：(1) 該四氫吡咯基環係被 $=O$ 取代，與 (2) 該四氫吡咯基環係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(h) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中該四氫吡咯基環係被 $=O$ 取代；或

(i) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成四氫吡咯基環，其中：(1) 該四氫吡咯基環係被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代，與 (2) 該四氫吡咯基環係視情況與芳基或雜芳基環稠合，且由於稠合所形成之環部份基團係視情況被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代；或

(j) R^6 與 $-N(R^{13})-G$ 部份基團之 R^{13} 係接合在一起，以形成 5 四氫吡咯基環，其中該四氫吡咯基環係被 1-5 個獨立經選擇之 R^{21} 取代基取代。

53. 如請求項 1 之化合物，其中：

(a) R^{10} 係選自包括芳基與被一或多個 R^{21} 基團取代之芳基，且 R^9 係選自包括雜芳基與被一或多個 R^{21} 基團取代之雜芳基，且其中各 R^{21} 係獨立經選擇；或

(b) R^{10} 係選自包括苯基與被 1-3 個獨立經選擇之 R^{21} 基團取代之苯基，且 R^9 係選自包括咪唑基與被 1-3 個獨立經選擇之 R^{21} 基團取代之咪唑基；或

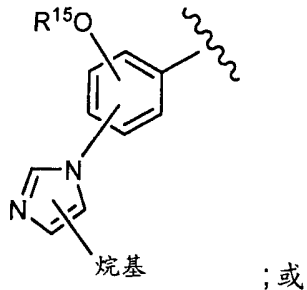
(c) R^{10} 為被 1-3 個獨立經選擇之 R^{21} 基團取代之苯基，且 R^9 係選自包括咪唑基與被 1-3 個獨立經選擇之 R^{21} 基團取代之咪唑基；或

(d) R^{10} 係選自包括雜芳基與被 1-3 個 R^{21} 基團取代之雜芳基，且 R^9 基團係選自包括雜芳基與被 1-3 個 R^{21} 基團取代之雜芳基，且其中各 R^{21} 係獨立經選擇；或

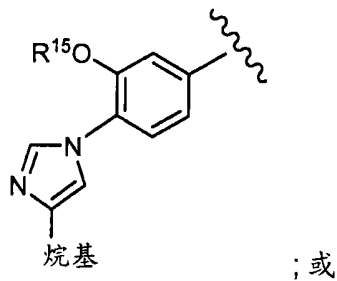
(e) R^{10} 係選自包括吡啶基與被 1-3 個 R^{21} 基團取代之吡啶基，且 R^9 基團係選自包括咪唑基與被 1-3 個 R^{21} 基團取代之咪唑基，且其中各 R^{21} 係獨立經選擇；或

(f) R^{10} 為吡啶基，且 R^9 基團為被 1-3 個 R^{21} 基團取代之咪唑基，且其中各 R^{21} 係獨立經選擇；或

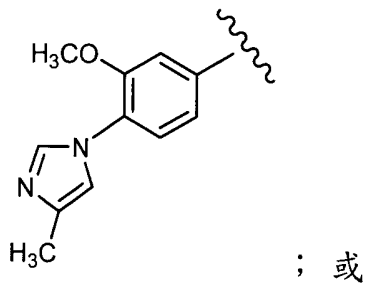
(g) R^9 - R^{10} -部份基團為：



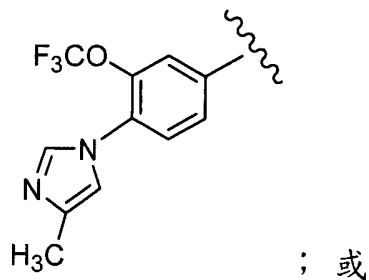
(h) R^9 - R^{10} -部份基團為：



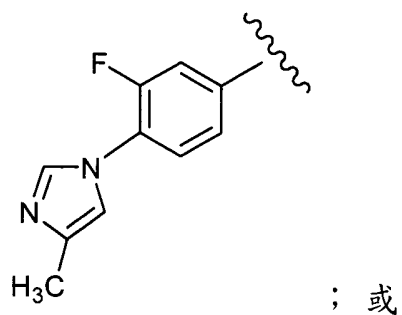
(i) R^9 - R^{10} -部份基團為：



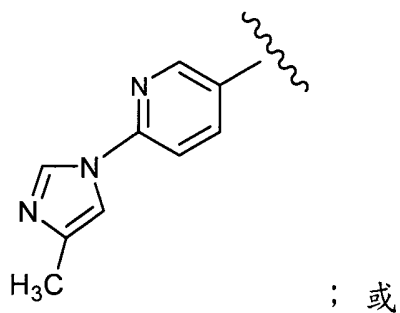
(j) R^9 - R^{10} -部份基團為：



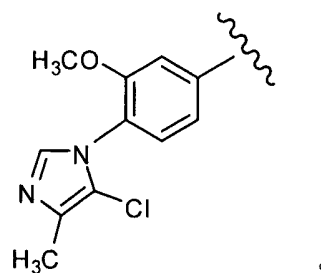
(k) R^9 - R^{10} -部份基團為：



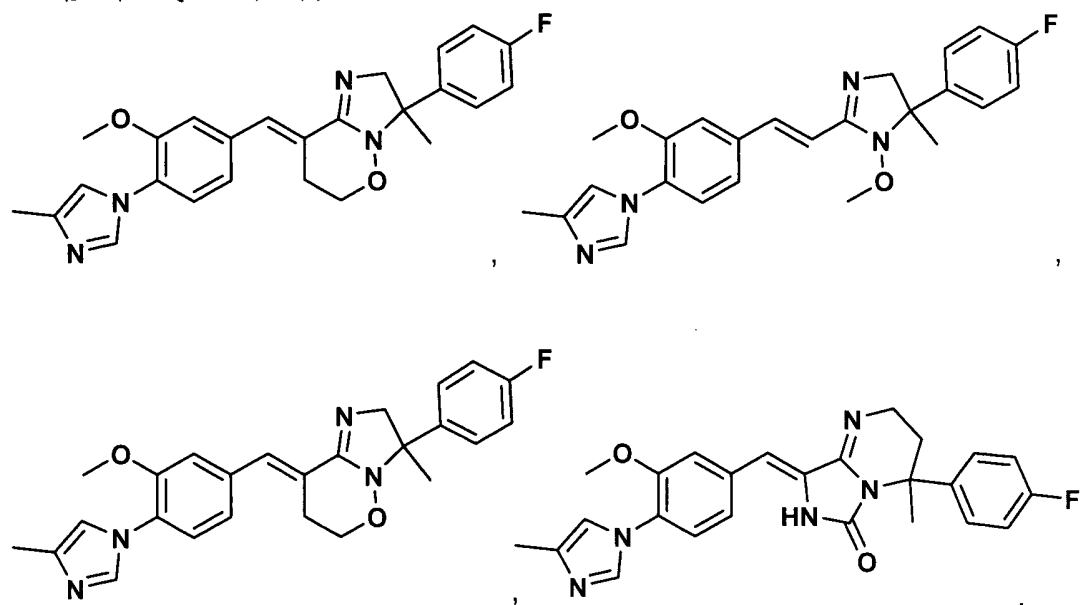
(l) R^9 - R^{10} -部份基團為：

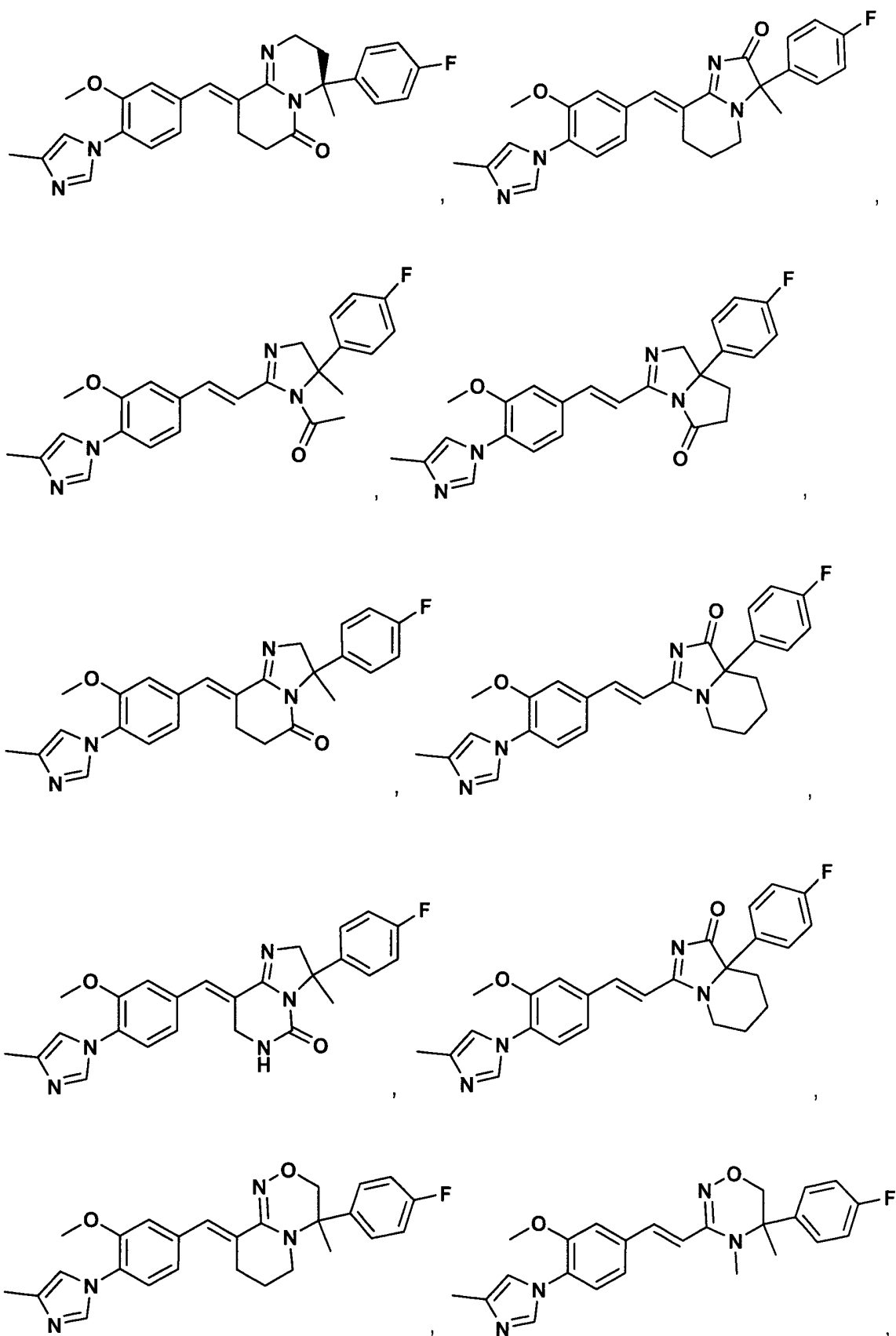


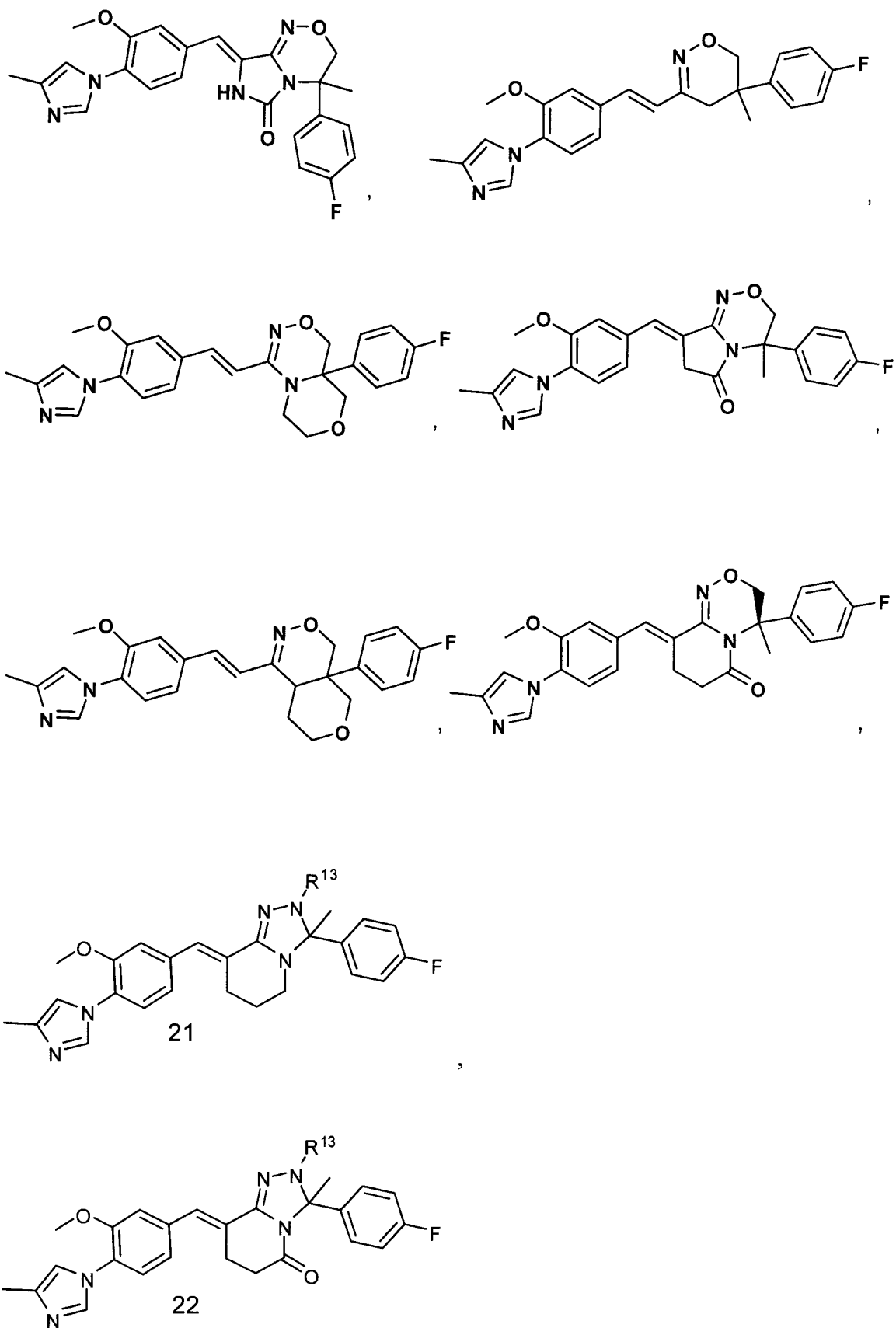
(m) R^9 - R^{10} -部份基團為：

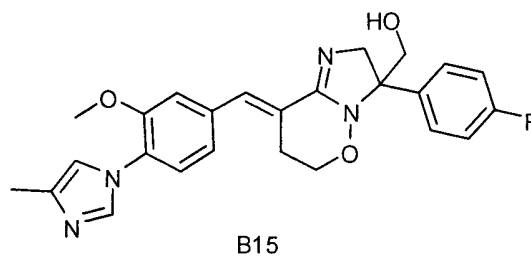
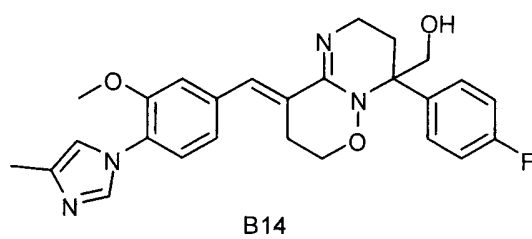
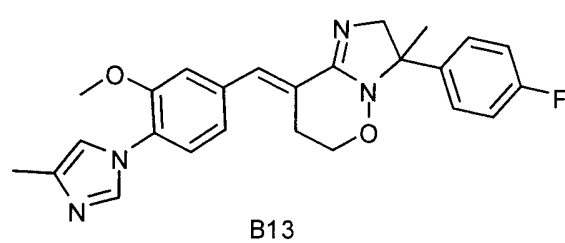
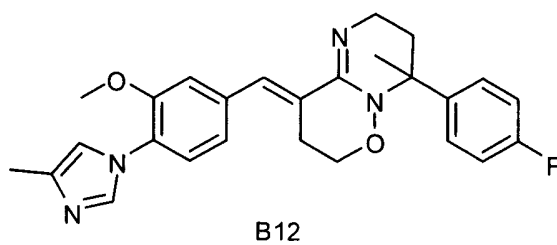
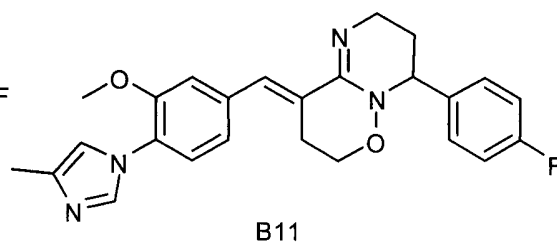
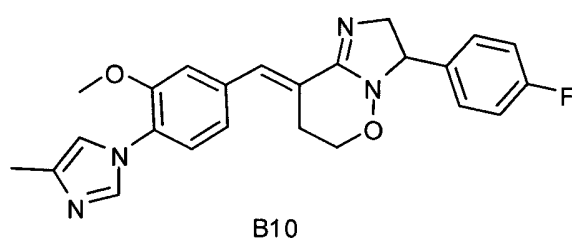
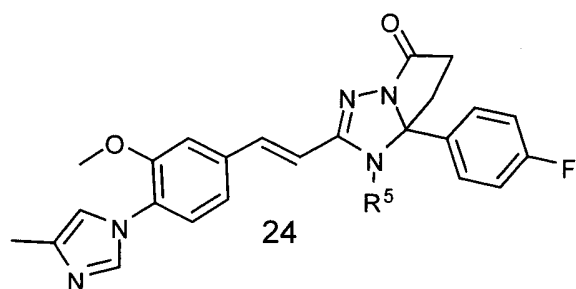
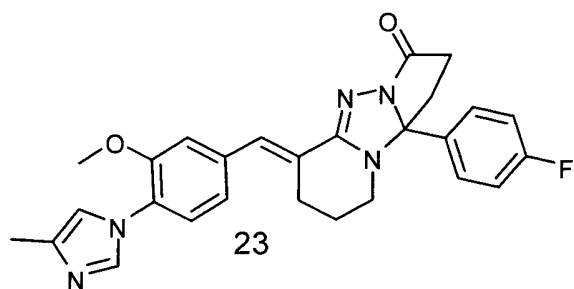


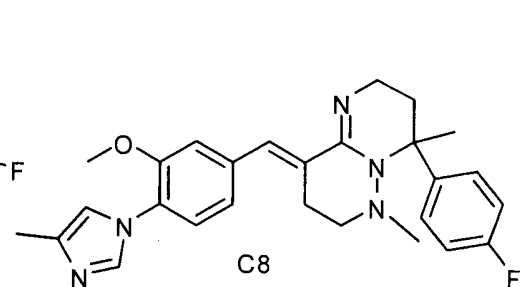
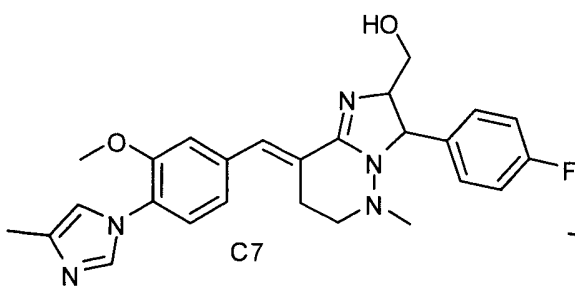
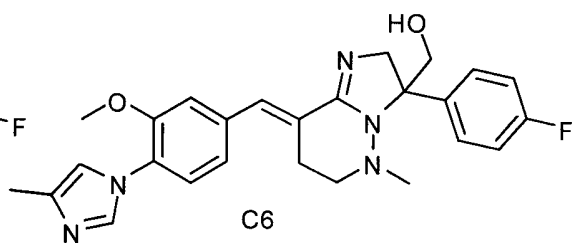
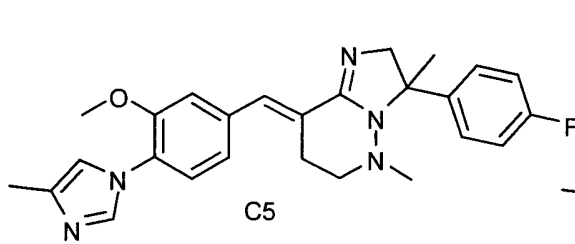
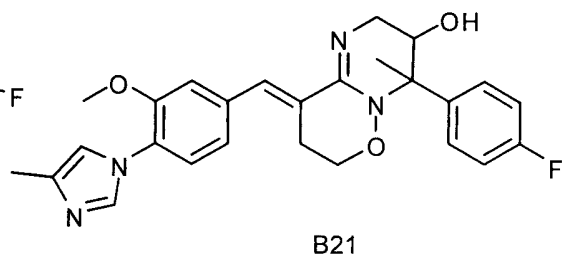
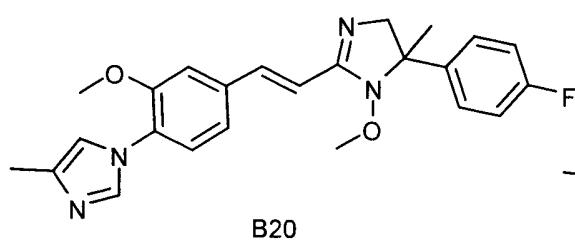
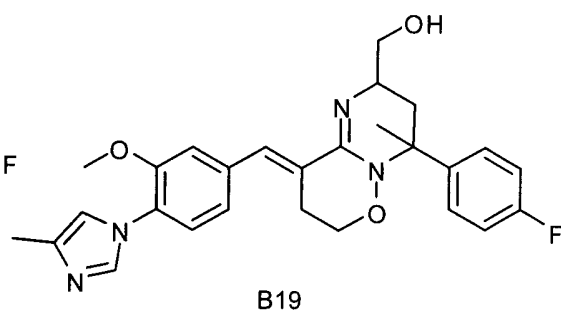
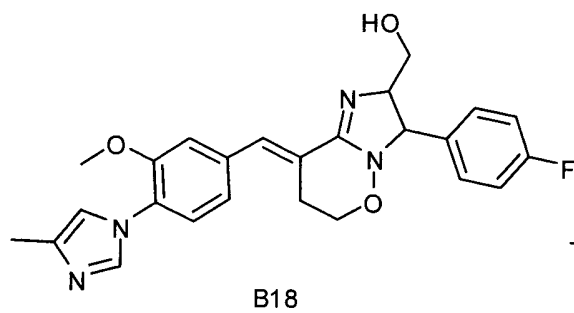
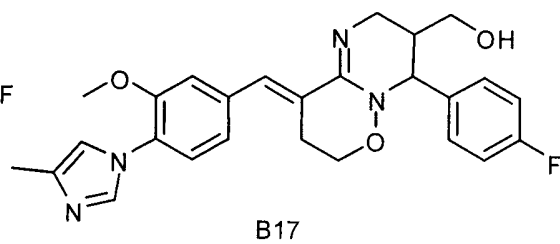
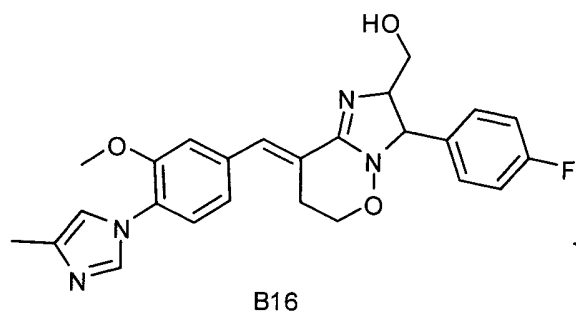
54. 一種下式化合物：

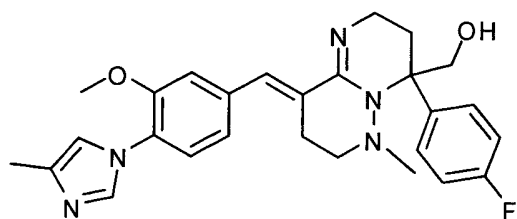




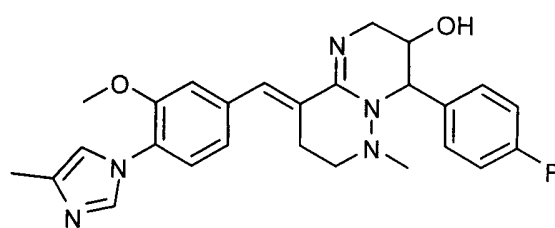




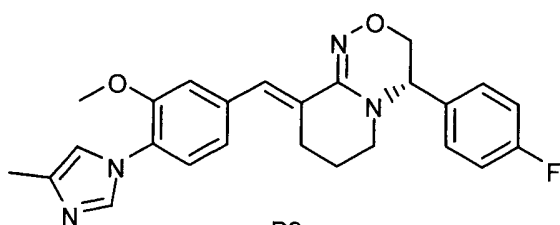




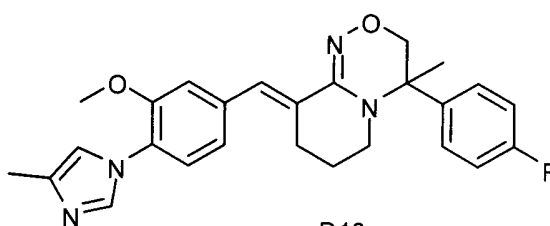
C9



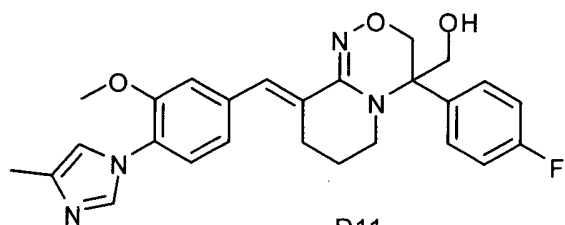
C10



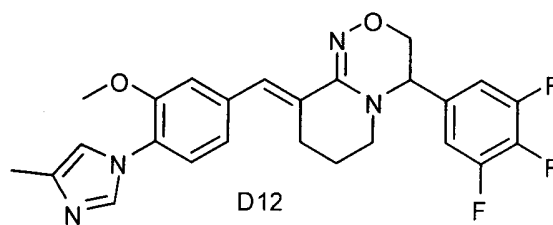
D9



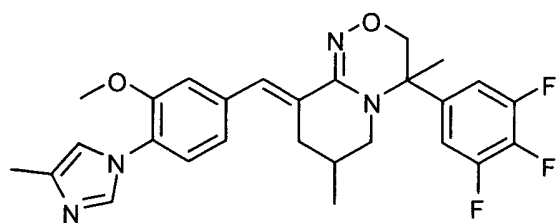
D10



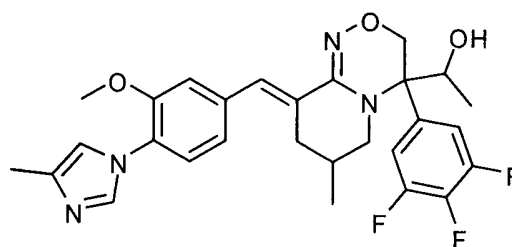
D11



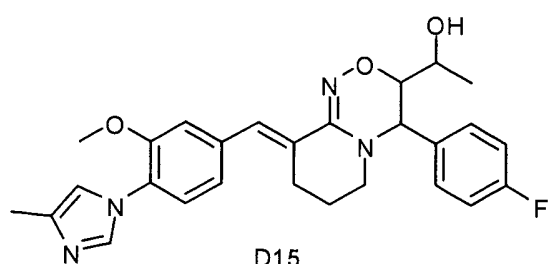
D12



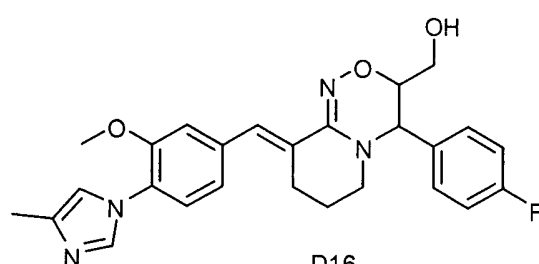
D13



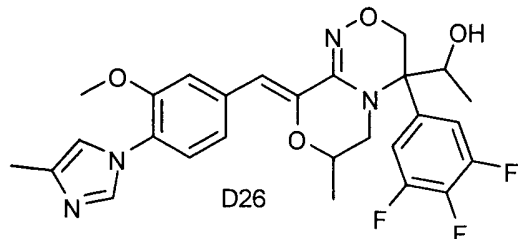
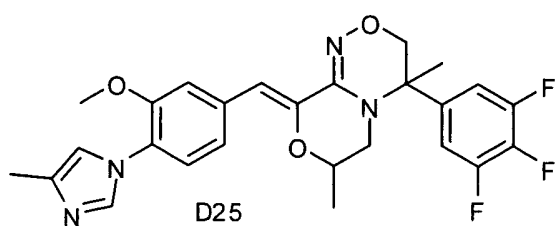
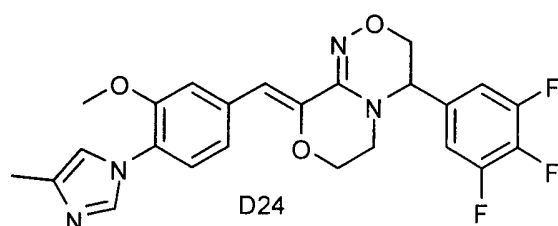
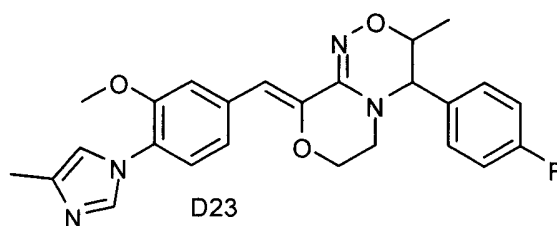
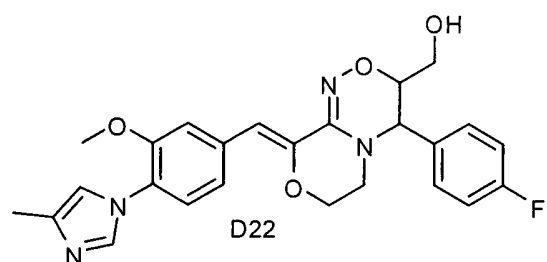
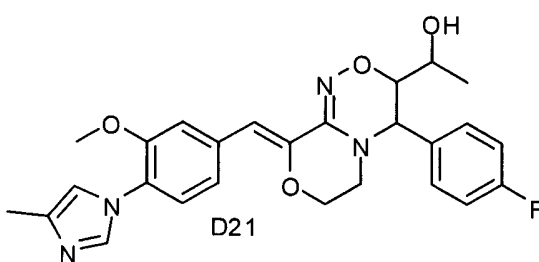
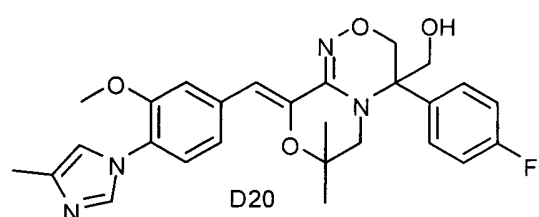
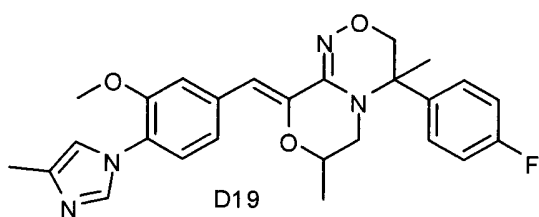
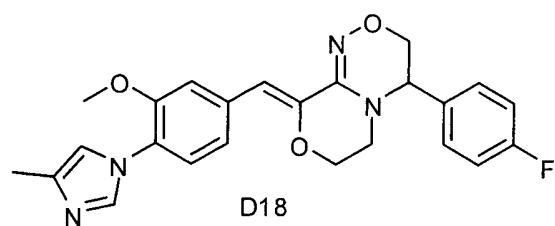
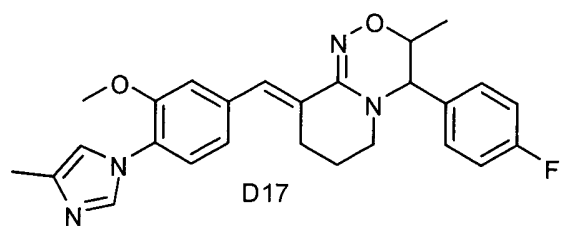
D14

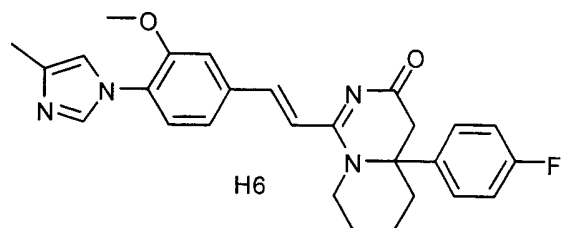
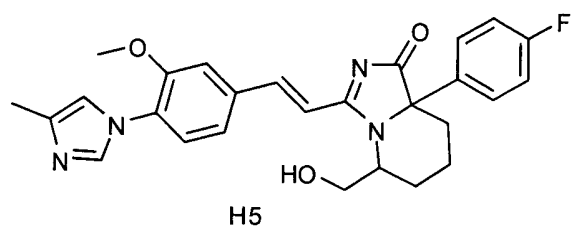
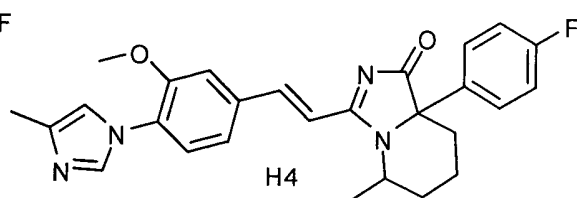
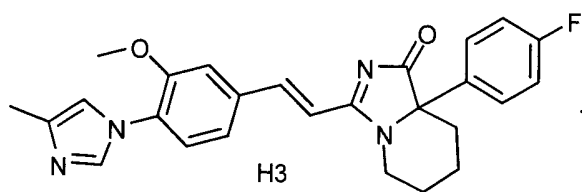
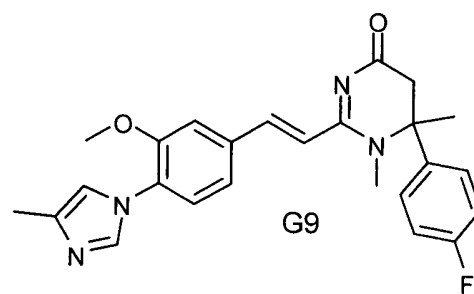
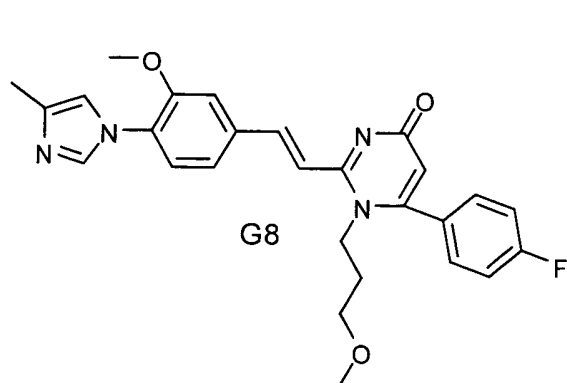
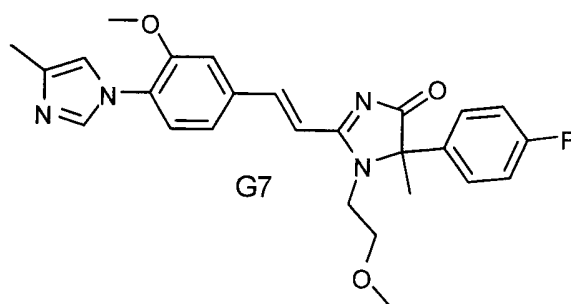
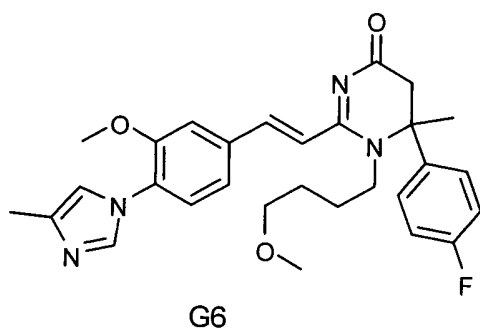
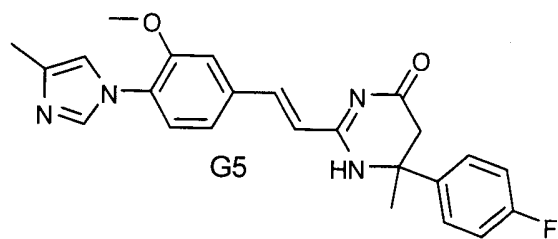
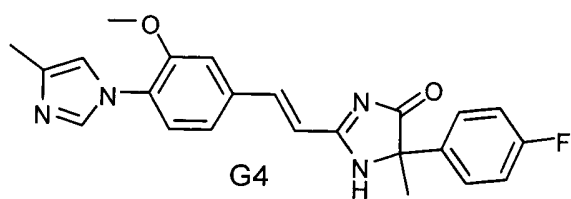


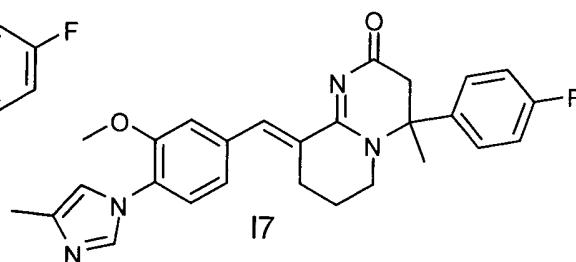
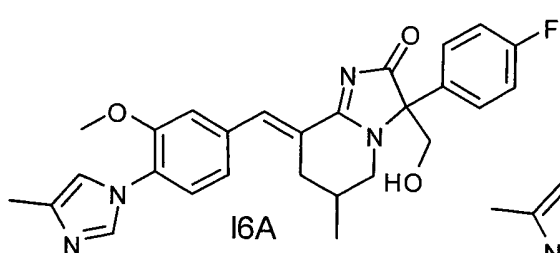
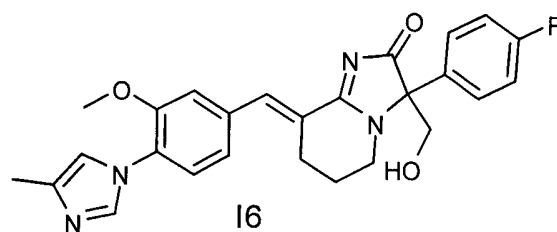
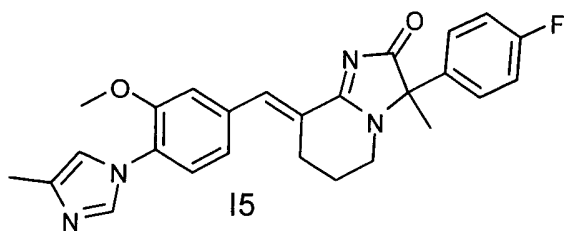
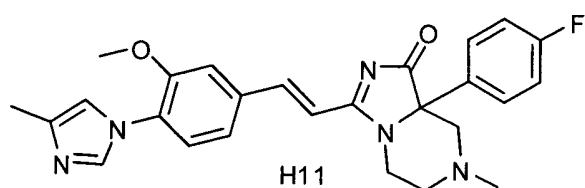
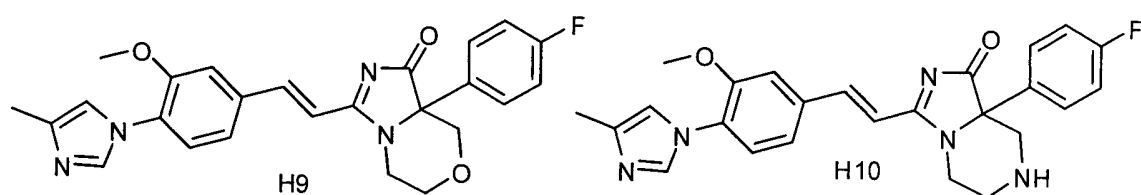
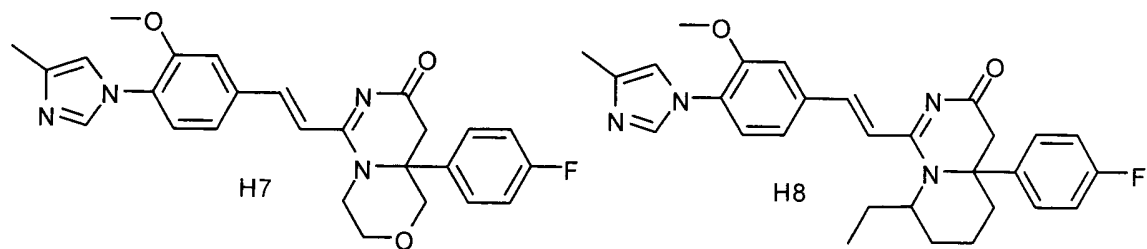
D15

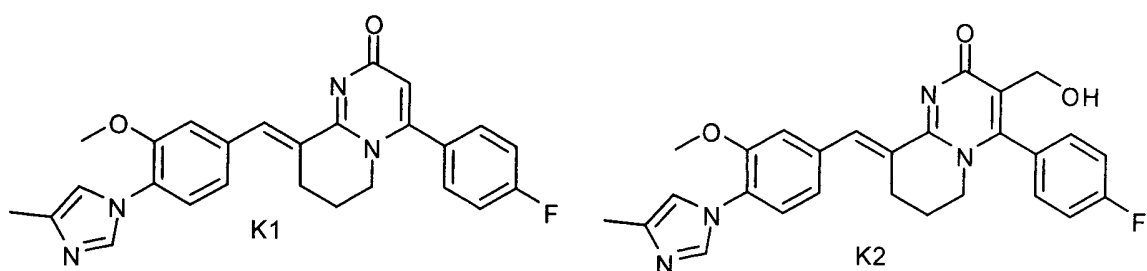
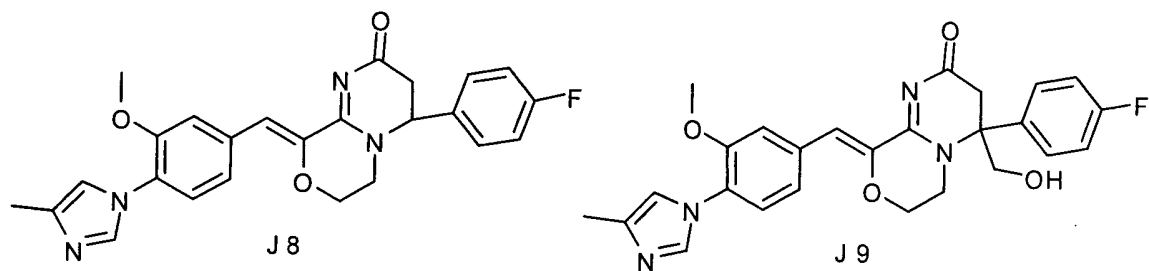
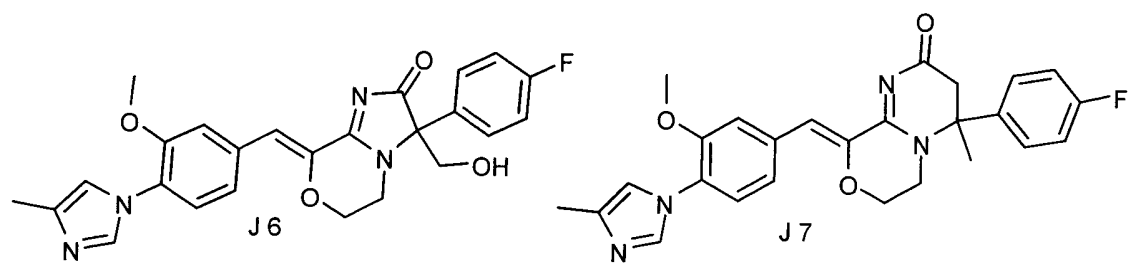
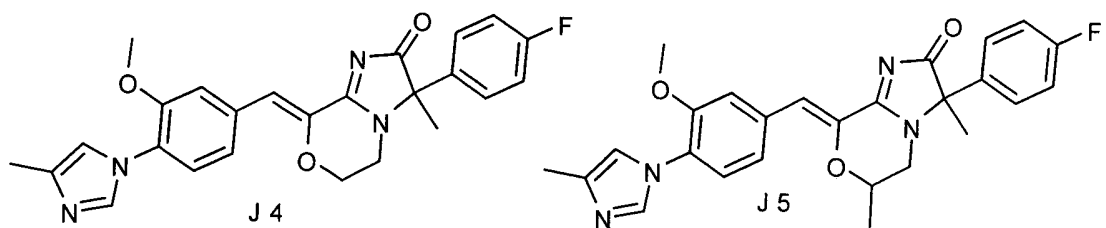
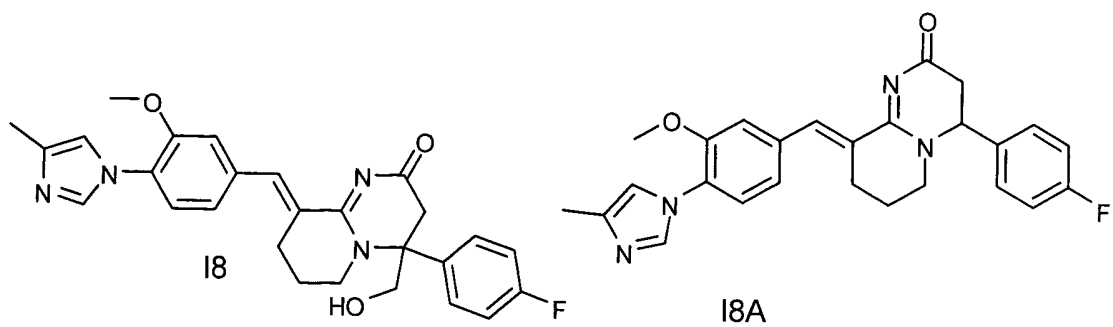


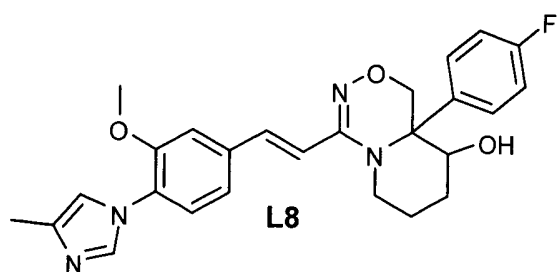
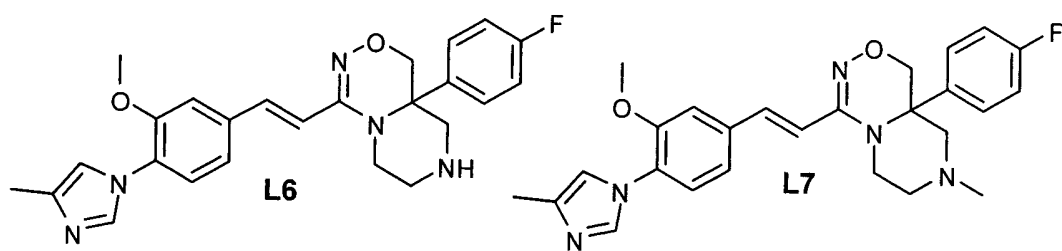
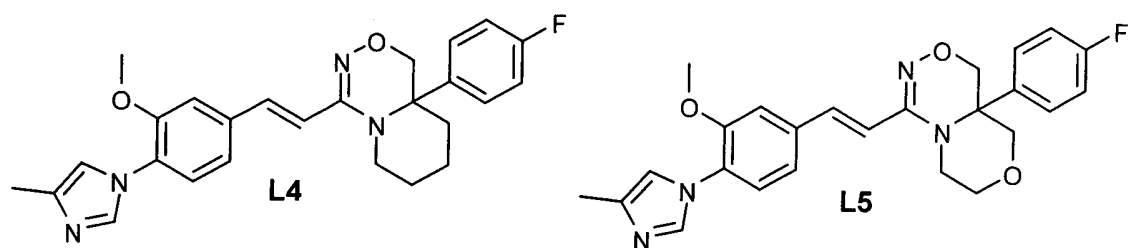
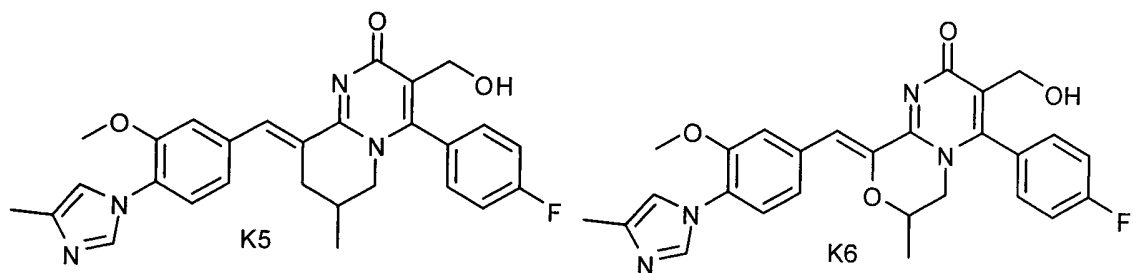
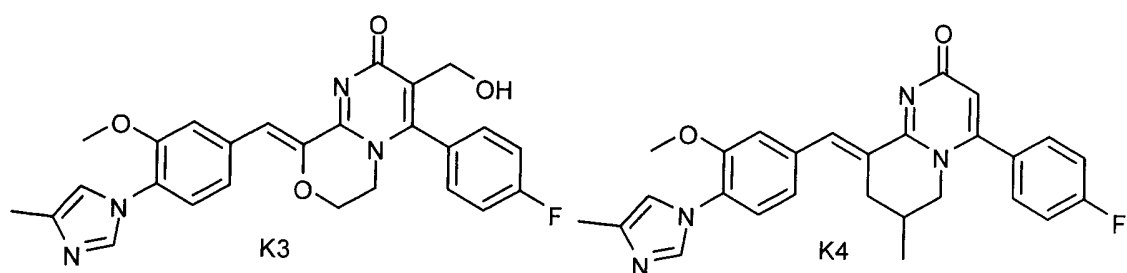
D16

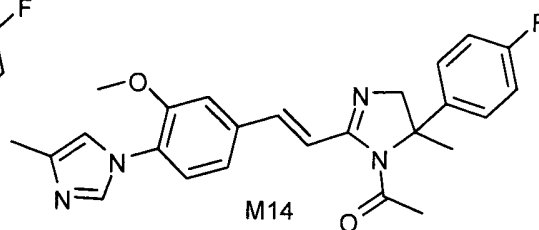
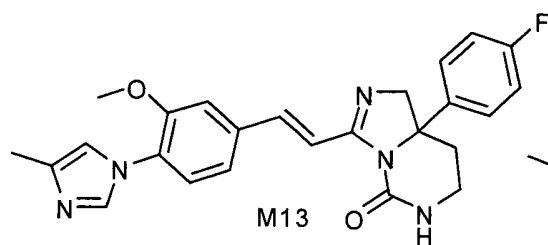
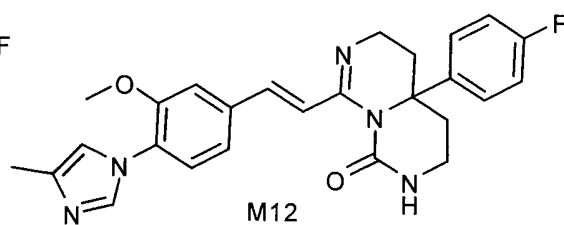
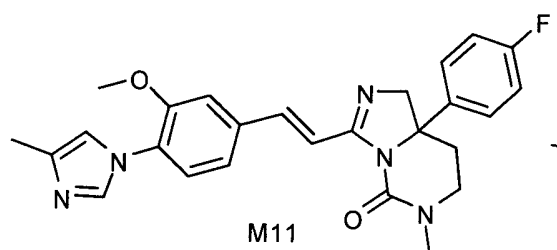
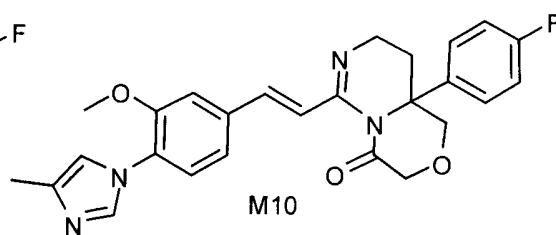
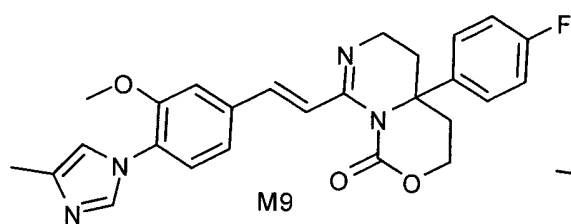
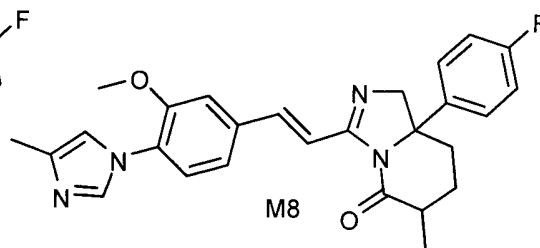
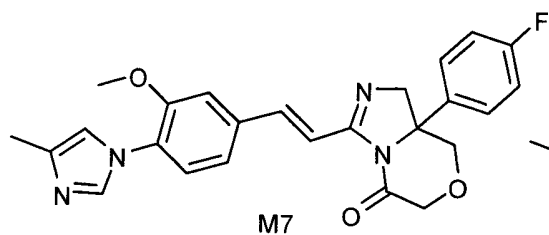
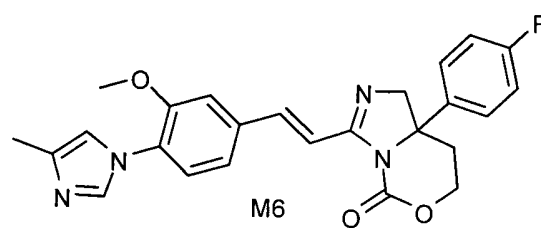
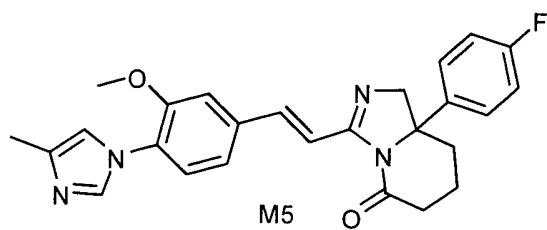


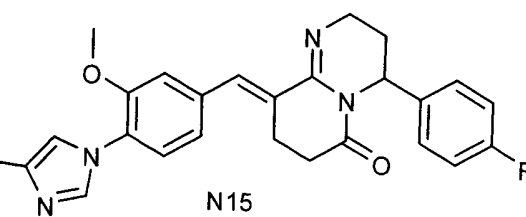
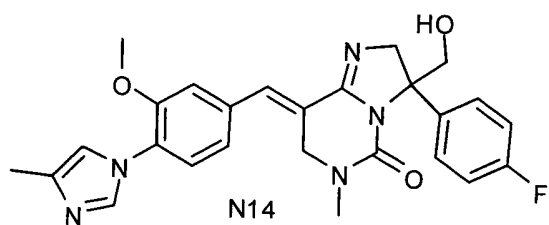
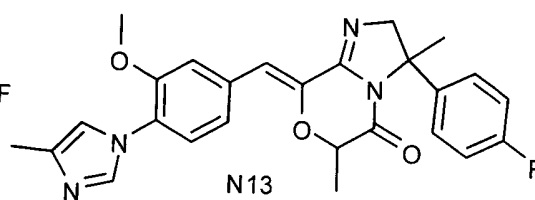
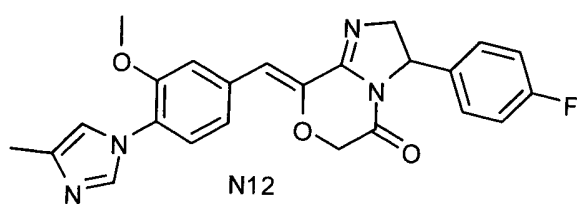
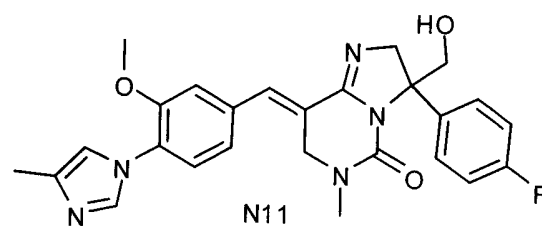
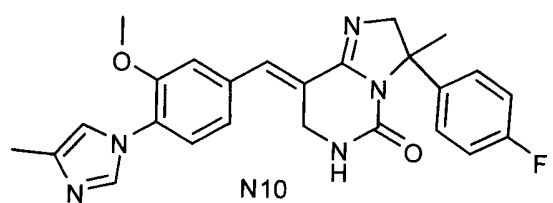
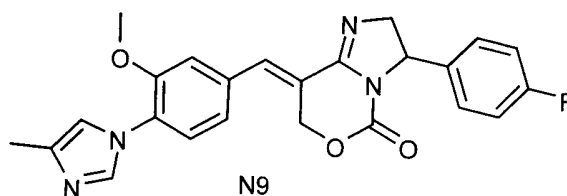
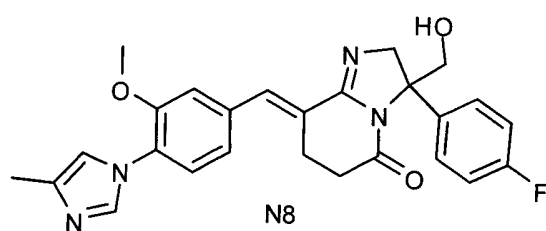
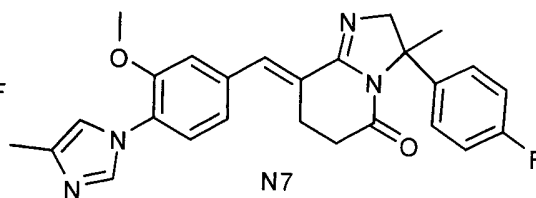
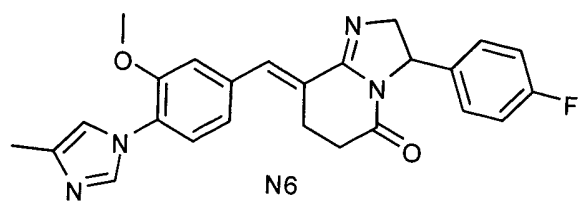
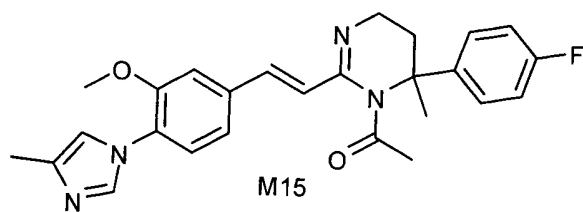


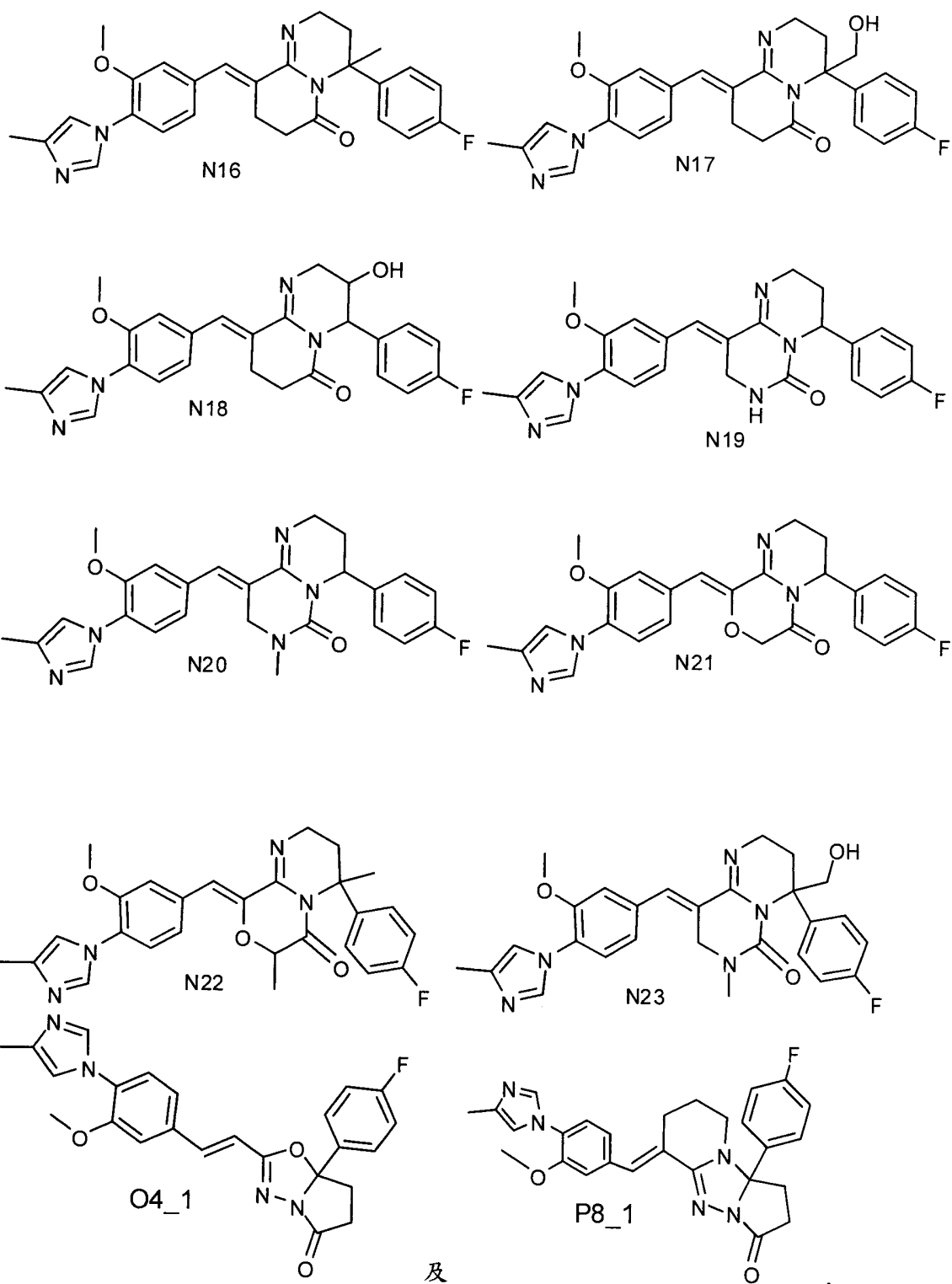












及

,

或其藥學上可接受之鹽、溶劑合物、酯或前體藥物。

55. 如請求項 54 之化合物，其中該化合物為如請求項 54 之化合物之藥學上可接受鹽。

56. 如請求項 54 之化合物，其中該化合物為如請求項 54 之化合

物之溶劑合物。

57. 如請求項 54 之化合物，其中該化合物為如請求項 54 之化合物之酯。

58. 一種醫藥組合物，其包含治療上有效量之如請求項 1 之化合物，及藥學上可接受之載劑。

59. 一種醫藥組合物，其包含治療上有效量之如請求項 54 之化合物，及藥學上可接受之載劑。

60. 一種醫藥組合物，其包含治療上有效量之如請求項 1 之化合物，與藥學上可接受之載劑，及有效量之一或多種其他醫藥活性藥物，選自包括：(a) 可用於治療阿耳滋海默氏病之藥物，(b) 可用於抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織中、其上或附近之藥物，(c) 可用於治療神經變性疾病之藥物，及(d) 可用於抑制 γ -分泌酶之藥物。

61. 一種醫藥組合物，其包含治療上有效量之如請求項 54 之化合物，與藥學上可接受之載劑，及有效量之一或多種其他醫藥活性藥物，選自包括：(a) 可用於治療阿耳滋海默氏病之藥物，(b) 可用於抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織中、其上或附近之藥物，(c) 可用於治療神經變性疾病之藥物，及(d) 可用於抑制 γ -分泌酶之藥物。

62. 一種醫藥組合物，其包含治療上有效量之如請求項 1 之化合物，與藥學上可接受之載劑，及有效量之一或多種 BACE 抑制劑。

63. 一種醫藥組合物，其包含治療上有效量之如請求項 54 之化合物，與藥學上可接受之載劑，及有效量之一或多種 BACE 抑制劑。

64. 一種醫藥組合物：

(1) 包含治療上有效量之至少一種如請求項 1 之化合物，或其藥學上可接受之鹽、溶劑合物或酯，及至少一種藥學上可接受之載劑，或

(2) 包含治療上有效量之至少一種如請求項 1 之化合物，或其藥學上可接受之鹽、溶劑合物或酯，與至少一種藥學上可接受之載劑，及有效量之一或多種其他醫藥活性藥物，選自包括：(a) 可用於治療阿耳滋海默氏病之藥物，(b) 可用於抑制澱粉狀蛋白質(例如澱粉狀蛋白 β 蛋白質)沉積於神經組織中、其上或附近之藥物，(c) 可用於治療神經變性疾病之藥物，及(d) 可用於抑制 γ -分泌酶之藥物，或

(3) 包含治療上有效量之至少一種如請求項 1 之化合物，或其藥學上可接受之鹽、溶劑合物或酯，與至少一種藥學上可接受之載劑，及有效量之一或多種 BACE 抑制劑，

(4) 包含治療上有效量之至少一種如請求項 1 之化合物，或其藥學上可接受之鹽、溶劑合物或酯，與至少一種藥學上可接受之載劑，及有效量之一或多種膽鹼酯酶抑制劑，或

(5) 包含治療上有效量之至少一種如請求項 1 之化合物，與至少一種藥學上可接受之載劑，及有效量之一或多種膽鹼酯酶抑制劑，或

(6) 包含治療上有效量之至少一種如請求項1之化合物，或其藥學上可接受之鹽、溶劑合物或酯，與至少一種藥學上可接受之載劑，及有效量之一或多種BACE抑制劑、蠅蕈鹼拮抗劑、膽鹼酯酶抑制劑； γ 分泌酶抑制劑； γ 分泌酶調節劑；HMG-CoA還原酶抑制劑；非類固醇消炎劑；N-甲基-D-天冬胺酸鹽受體拮抗劑；抗-澱粉狀蛋白抗體；維生素E；菸鹼酸乙醯膽鹼受體催動劑；CB1受體逆催動劑或CB1受體拮抗劑；抗生素；生長激素促分泌素；組織胺H3拮抗劑；AMPA催動劑；PDE4抑制劑；GABA_A逆催動劑；澱粉狀蛋白聚集之抑制劑；糖原合成酶激酶 β 抑制劑； α 分泌酶活性之促進劑；PDE-10抑制劑及膽固醇吸收抑制劑，或

(7) 包含治療上有效量之至少一種如請求項1之化合物，與至少一種藥學上可接受之載劑，及有效量之一或多種BACE抑制劑、蠅蕈鹼拮抗劑、膽鹼酯酶抑制劑； γ 分泌酶抑制劑； γ 分泌酶調節劑；HMG-CoA還原酶抑制劑；非類固醇消炎劑；N-甲基-D-天冬胺酸鹽受體拮抗劑；抗-澱粉狀蛋白抗體；維生素E；菸鹼酸乙醯膽鹼受體催動劑；CB1受體逆催動劑或CB1受體拮抗劑；抗生素；生長激素促分泌素；組織胺H3拮抗劑；AMPA催動劑；PDE4抑制劑；GABA_A逆催動劑；澱粉狀蛋白聚集之抑制劑；糖原合成酶激酶 β 抑制劑； α 分泌酶活性之促進劑；PDE-10抑制劑及膽固醇吸收抑制劑，或

(8) 包含治療上有效量之至少一種如請求項1之化合

物，或其藥學上可接受之鹽、溶劑合物或酯，與至少一種藥學上可接受之載劑，及有效量之多梟佩吉 (donepezil) 鹽酸鹽，或

(9) 包含治療上有效量之至少一種如請求項 1 之化合物，與至少一種藥學上可接受之載劑，及有效量之多梟佩吉 (donepezil) 鹽酸鹽。

65. 一種調節 γ -分泌酶之方法，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項 1 之化合物。
66. 一種治療一或多種神經變性疾病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項 1 之化合物。
67. 一種抑制澱粉狀蛋白質沉積於神經組織中、其上或附近之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項 1 之化合物。
68. 一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項 1 之化合物。
69. 一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項 54 之化合物。
70. 一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之如請求項 1 之化合物。
71. 一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之如請求項 54 之化合物。
72. 一種 (a) 調節 γ -分泌酶、(b) 治療一或多種神經變性疾病、(c) 抑制澱粉狀蛋白質沉積於神經組織中、其上或附近或 (d) 治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要此種治療之病

患投予：

(1)有效量之如請求項1之化合物，與

(2)有效量之一或多種其他醫藥活性成份，選自包括：BACE抑制劑、蠅蕈鹼拮抗劑、膽鹼酯酶抑制劑； γ 分泌酶抑制劑； γ 分泌酶調節劑；HMG-CoA還原酶抑制劑；非類固醇消炎劑；N-甲基-D-天冬胺酸鹽受體拮抗劑；抗-澱粉狀蛋白抗體；維生素E；菸鹼酸乙醯膽鹼受體催動劑；CB1受體逆催動劑或CB1受體拮抗劑；抗生素；生長激素促分泌素；組織胺H3拮抗劑；AMPA催動劑；PDE4抑制劑；GABA_A逆催動劑；澱粉狀蛋白聚集之抑制劑；糖原合成酶激酶 β 抑制劑； α 分泌酶活性之促進劑；PDE-10抑制劑及膽固醇吸收抑制劑。

73.一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之如請求項1之化合物，及有效量之一或多種化合物，選自包括A β 抗體抑制劑、 γ 分泌酶抑制劑及 β 分泌酶抑制劑。

74.一種治療阿耳滋海默氏病之方法，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之如請求項1之化合物，及有效量之一或多種BACE抑制劑。

75.一種方法，其係：

(1)治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種膽鹼酯酶，或

(2)治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要治療之病患投

予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之多梟佩吉 (donepezil) 鹽酸鹽，或

(3) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要治療之病患投予有效量之如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種膽鹼酯酶，或

(4) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要治療之病患投予有效量之如請求項1之化合物，且併用有效量之多梟佩吉 (donepezil) 鹽酸鹽，或

(5) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之利發史替明 (rivastigmine)，或

(6) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之塔克林 (tacrine)，或

(7) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之 τ 激酶抑制劑，或

(8) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種 τ 激酶抑制劑，選自包括：GSK3 β 抑制劑、cdk5抑制劑、ERK抑制劑，或

(9) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一種抗-A β 接種疫苗，或

(10) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種APP配位體，或

(11) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種會向上調節胰島素降解酵素及/或臬普溶素(neprilysin)之藥劑，或

(12) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種膽固醇降低劑，或

(13) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種膽固醇降低劑，選自包括：阿托瓦制菌素(Atorvastatin)、弗伐制菌素(Fluvastatin)、洛伐制菌素(Lovastatin)、美伐制菌素(Mevastatin)、皮塔伐制菌素(Pitavastatin)、普拉伐制菌素(Pravastatin)、洛蘇伐制菌素(Rosuvastatin)、辛伐制菌素(Simvastatin)及也吉提麥伯(Ezetimibe)，或

(14) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種纖維酸酯，或

(15) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種纖維酸酯，選自包括氯苯丁酯(clofibrate)、

氯纖酸化物 (Clofibrider)、約托纖酸酯 (Etofibrate)、鋁氯苯丁酯 (Clofibrate)，或

(16) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種LXR催動劑，或

(17) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種LRP擬似物，或

(18) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種5-HT₆受體拮抗劑，或

(19) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種菸鹼酸受體催動劑，或

(20) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種H3受體拮抗劑，或

(21) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種組織蛋白脫乙酰酶抑制劑，或

(22) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種hsp90抑制劑，或

(23) 治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病

患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種m1蠅蕈鹼受體催動劑，或

(24)治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種5-HT₆受體拮抗劑mGluR1或mGluR5正異位調節劑或催動劑，或

(25)治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種mGluR2/3拮抗劑，或

(26)治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種式I化合物，且併用有效量之一或多種可降低神經發炎之消炎劑，或

(27)治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種前列腺素EP2受體拮抗劑，或

(28)治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種PAI-1抑制劑，或

(29)治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之一或多種可誘發A β 射流之藥劑，或

(30)治療阿耳滋海默氏病，其包括對需要此種治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，且併用有效量之膠索素(gelsolin)，或

(31) 治療 Down 氏徵候簇，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項 1 之化合物，或

(32) 治療 Down 氏徵候簇，其包括對需要治療之病患投予有效量之如請求項 1 之化合物，或

(33) 治療 Down 氏徵候簇，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項 1 之化合物，且併用有效量之一或多種膽鹼酯酶抑制劑，

(34) 治療 Down 氏徵候簇，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項 1 之化合物，且併用有效量之多梟佩吉 (donepezil) 鹽酸鹽，或

(35) 治療 Down 氏徵候簇，其包括對需要治療之病患投予有效量之如請求項 1 之化合物，且併用有效量之一或多種膽鹼酯酶抑制劑，

(37) 治療 Down 氏徵候簇，其包括對需要治療之病患投予有效量之如請求項 1 之化合物，且併用有效量之多梟佩吉 (donepezil) 鹽酸鹽，或

(38) 治療溫和認知力減弱，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項 1 之化合物，或

(39) 治療青光眼，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項 1 之化合物，或

(40) 治療大腦澱粉狀蛋白血管病，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項 1 之化合物，或

(41) 治療中風，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項 1 之化合物，或

(42) 本發明亦提供一種治療癡呆症之方法，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，或

(43) 治療微神經膠質病，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，或

(44) 治療腦部發炎，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物，或

(45) 治療嗅覺功能喪失，其包括對需要治療之病患投予有效量之一或多種如請求項1之化合物。

76. 一種套件，其在個別容器中，於單一包裝中包含醫藥組合物，供使用於組合中，其中一個容器包含有效量之如請求項1之化合物在藥學上可接受之載劑中，而另一個容器包含有效量之另一種醫藥活性成份，該如請求項1之化合物與另一種醫藥活性成份之合併量係有效：(a) 治療阿耳滋海默氏病，或(b) 抑制澱粉狀蛋白質沉積於神經組織中、其上或附近，或(c) 治療神經變性疾病，或(d) 調節 γ -分泌酶之活性。

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：(無)

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

