

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：**97127045**

※ 申請日期：**97. 2. 16**

※IPC 分類：~~C07D~~;**A61K**;**A61P**

一、發明名稱：(中文/英文)

吡啶酮 GPR119 G 蛋白偶合受體激動劑

PYRIDONE GPR119 G PROTEIN-COUPLED RECEPTOR AGONISTS

A61K^{31/506} (2006.01), G07D^{401/12} (2006.01),
A61K^{31/501} (2006.01), G07D^{401/14} (2006.01),
A61K^{31/435} (2006.01),

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

美商必治妥美雅史谷比公司

BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY

代表人：(中文/英文)

蘇珊 E. 芭芭可

BABAJKO, SUZANNE E.

住居所或營業所地址：(中文/英文)

美國紐澤西州普林斯頓市第 206 號州線路第 4000 號郵政信箱

P.O. BOX 4000, ROUTE 206 AND PROVINCE LINE ROAD,

PRINCETON, NEW JERSEY 08543-4000, U.S.A.

國 籍：(中文/英文)

美國 U.S.A.

三、發明人：(共 3 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 迪恩 A 瓦克
WACKER, DEAN A.

2. 凱倫 A 羅希
ROSSI, KAREN A.

3. 王瑩
WANG, YING

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.

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07月17日；60/950,162

2.

無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1.

2.

主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

主張專利法第三十條生物材料：

須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

相關申請案

本申請案係主張於2007年7月17日提出申請之美國臨時申請案號60/950,162之權益，以其全文併於本文供參考。

【先前技術】

糖尿病為一種折磨全世界超過一億人之重大疾病。在美國有超過1千2百萬位糖尿病患者，伴隨著每年診斷出600,000件新病例。糖尿病為一組病症之診斷術語，其特徵為造成高血糖之異常葡萄糖等穩性。有多種糖尿病類型，但兩種最常見者為第1型(亦被稱為胰島素依賴性糖尿病或IDDM)與第2型(亦被稱為非胰島素依賴性糖尿病或NIDDM)。

不同類型糖尿病之病因學係不相同；但是，每個患有糖尿病者具有兩個共同點：葡萄糖藉由肝臟之過度產生，與極少或無能力自血液中移動葡萄糖進入細胞中，其係於該處變成身體之主要燃料。

未具有糖尿病之人們係倚賴胰島素，一種在胰臟中製造之激素，以移動來自血液之葡萄糖，進入身體之細胞內。但是，具有糖尿病之人們無論是不會產生胰島素或不能夠有效地利用其產生之胰島素；因此，其不能夠移動葡萄糖進入其細胞中。葡萄糖會累積在血液中，造成被稱為高血糖之症狀，且隨著時間可造成嚴重健康問題。

糖尿病為一種具有互相關聯代謝性、血管性及神經病原性成份之徵候簇。一般特徵為高血糖之代謝徵候簇，係包括因不存在或顯著地減少胰島素分泌及/或無效胰島素作

用所造成，於碳水化合物、脂肪及蛋白質代謝作用上之改變。血管徵候簇包括血管異常，導致心血管、視網膜及腎併發症。於末梢與自主神經系統中之異常，亦為糖尿病徵候簇之一部份。

糖尿病亦與腎臟病、眼睛疾病及神經系統問題之發展有關聯。腎臟病亦稱為腎病，發生於腎臟"過濾機制"受到傷害，且蛋白質以過量滲漏至尿液中，而最後腎臟衰弱時。糖尿病亦為對眼睛背後之視網膜傷害之主要原因，且增加白內障與青光眼之危險。最後，糖尿病係伴隨著神經傷害，尤其是在腿部與腳部，其會干擾感覺疼痛之能力，及助長嚴重感染。合併在一起，糖尿病併發症係為國家主要死亡原因之一。

許多患有NIDDM者具有久坐生活型態，且係為肥胖；其體重超過關於其高度與體格所建議體重之約20%。再者，肥胖之特徵為胰島素過多與胰島素抗藥性，此為與NIDDM共有之特徵，高血壓與動脈粥瘤硬化。

肥胖係為卡路里攝取與能量消耗之間平衡缺失之結果，其在實驗動物與人類中，係高度地與胰島素抗藥性及糖尿病有關聯。但是，涉及肥胖-糖尿病徵候簇之分子機制並不明顯。在肥胖之早期發展期間，增加胰島素分泌會使胰島素抗藥性達到平衡，且保護病患免於高血糖(Le Stunff等人, 糖尿病 43: 696-702 (1989))。但是，隨著時間， β 細胞功能惡化，且非胰島素依賴性糖尿病在約20%肥胖人口中發展(Pederson, P., *Diab. Metab. Rev.*, 5: 505-509 (1989))與(Brancati, F. L.

等人, *Arch. Intern. Med.*, 159 : 957-963 (1999))。在現代社會中，於其高盛行下，肥胖已因此變成NIDDM之主要危險因子(Hill, J. O. 等人, *Science*, 280 : 1371-1374 (1998))。但是，使一部份病患傾向於胰島素分泌之改變以回應脂肪蓄積之因素，仍然未知。關於肥胖之最常見疾病為心血管疾病(特別是高血壓)、糖尿病(肥胖使糖尿病之發展惡化)、膽囊疾病(特別是癌症)及生殖疾病。研究已証實即使適度降低體重亦可相應於顯著降低發展冠狀心臟疾病之危險。

肥胖亦相當大地增加發展心血管疾病之危險。冠狀機能不全、粥瘤疾病及心臟機能不全，係為因肥胖所引致之心血管併發症之前兆。據估計，若全體人口均具有理想體重，則冠狀機能不全之風險將減少達25%，且心臟機能不全與腦血管意外之風險減少達35%。冠狀疾病之發生率在低於50歲而其為30%過重之病患中係為兩倍。糖尿病患者係面對30%減少之生命期限。於45歲後，患有糖尿病之人們相較於未患有糖尿病之人們，約三倍較可能具有顯著心臟疾病，而高達五倍較可能具有中風。此等發現係強調NIDDM之危險因子、肥胖及冠狀心臟疾病間之相互關係，以及涉及治療肥胖與糖尿病兩者之整合途徑之潛在價值(Perry, I.J. 等人, *BMJ*, 310 : 560-564 (1995))。

第2型糖尿病係由於胰 β -細胞功能於胰島素抗藥性存在下之漸進損失所造成，導致胰島素產量上之整體降低(Prentki, M. 等人, "在第2型糖尿病中之胰島破壞", *J. Clin. Invest.*, 116 : 1802-1812 (2006))。 β -細胞為會儲存及釋出胰島素

之細胞類型，以在攝食食物之後，回應血漿葡萄糖上之升高，或回應來自腸之激素訊息。證據指出在第2型糖尿病患者中， β -細胞之細胞死亡(細胞凋零)速率係超過新穎 β -細胞發展之速率，在 β -細胞數目上產生整體損失(Butler, A.E. 等人, "在具有第2型糖尿病之人類中 β -細胞不足與經增加之 β -細胞凋零", *糖尿病*, 52: 102-110 (2003))。 β -細胞凋零可由於血漿葡萄糖含量(葡萄糖毒性)及/或血漿脂質含量(脂質毒性)上之持續升高而發生。

已知被表現在 β -細胞上之G-蛋白偶合受體(GPCR)會調制胰島素之釋出，以回應血漿葡萄糖含量上之變化(Ahren, B., "胰島素分泌之自主調節-對健康與疾病之關聯性", *Diabetologia*, 43: 393-410 (2003))。專一性地經由G-蛋白質之 $G_s \alpha$ 亞單位聯結至cAMP之升高之GPCR，已被證實會提昇自 β -細胞之葡萄糖刺激之胰島素釋出。在 β -細胞上之環AMP刺激之GPCR包括GLP-1、GIP、 β_2 -腎上腺素能受體及GPR119。已知在 β -細胞中之漸增cAMP濃度會導致PKA之活化作用，其係被認為會防止鉀通道於 β -細胞表面上打開。在 K^+ 射流上之降低會使 β -細胞去極化，導致會促進胰島素釋出之 Ca^{++} 流入。

GPR119 (例如人類GPR119，GenBank®收受號碼AAP72125及其對偶基因；例如老鼠GPR119，GenBank®收受號碼AY288423及其對偶基因)為位於染色體位置Xp26.1上之GPCR (Fredricksson, R. 等人, "七種缺乏密切關聯之演變地保守人類視紫質G蛋白偶合受體", *FEBS Lett.*, 554: 381-388 (2003))。此受體係經偶

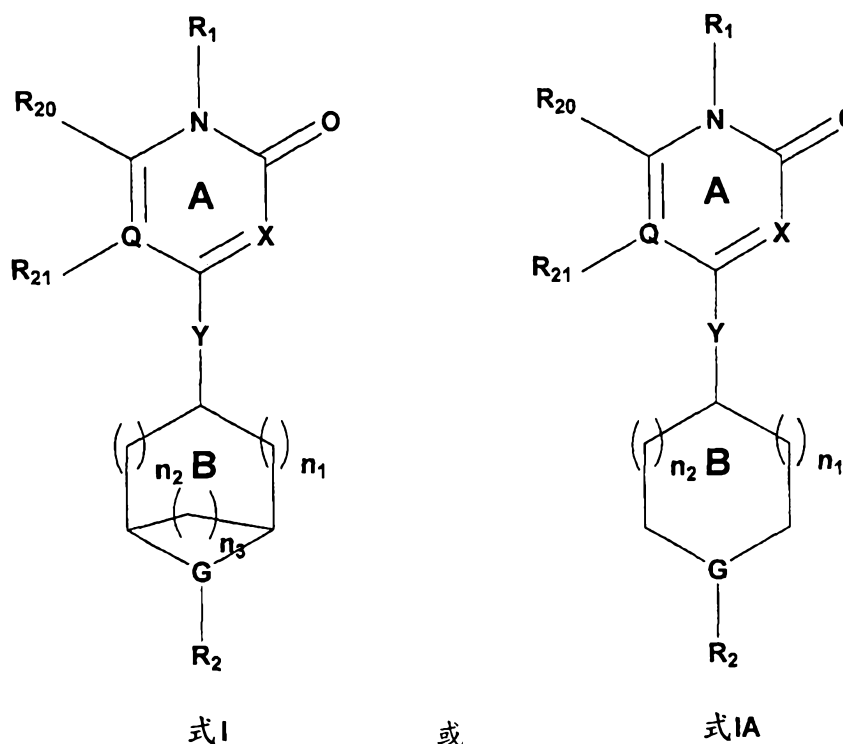
合至Gs，且當被刺激時，係於多種細胞類型中，包括 β -細胞-衍生之胰島腺瘤，在cAMP上產生升高(Soga, T.等人, "溶血磷脂醯膽鹼係經由孤兒G-蛋白-偶合受體提昇葡萄糖依賴性胰島素分泌", *Biochem. Biophys. Res. Comm.*, 326: 744-751 (2005)，國際專利申請案 WO 04/065380, WO 04/076413, WO 05/007647, WO 05/007658, WO 05/121121, WO 06/083491 及 EP 1338651)。
該受體已被証實係在許多物種中，以及在胃腸道之特定細胞類型中，被定位至胰臟之 β -細胞。GPR119以激動劑配位體譬如溶血磷脂醯膽鹼之活化作用，係在得自原始老鼠胰島與各種胰島腺瘤細胞系譬如NIT-1與HIT-T15之胰島素分泌上，產生葡萄糖依賴性增加(Soga, T.等人, "溶血磷脂醯膽鹼係經由孤兒G-蛋白-偶合受體提昇葡萄糖依賴性胰島素分泌", *Biochem. Biophys. Res. Comm.*, 326: 744-751 (2005); Chu, Z.L.等人, "關於 β -細胞-表現GPR119經由提昇葡萄糖依賴性胰島素釋出而在血糖控制上之角色", *內分泌學*, doi: 10.1210/en.2006-1608 (2007))。

當GPR119之活化劑係被投予無論是正常老鼠或由於基因突變所致而易患糖尿病之老鼠時，在口服葡萄糖容許度試驗之前，係發現葡萄糖容許度上之改善。在似血漿胰高血糖素肽-1上之短暫留存增加與血漿胰島素含量，亦在此等經治療之動物中發現(Chu, Z.L.等人, "關於 β -細胞-表現GPR119經由提昇葡萄糖依賴性胰島素釋出而在血糖控制上之角色", *內分泌學*, doi: 10.1210/en.2006-1608 (2007))。除了對血漿葡萄糖含量之作用以外，GPR119活化劑亦已被証實會

在急性食物攝取上產生降低，且於慢性投藥之後，在大白鼠中降低體重 (Overton, H.A. 等人, "關於油醯基乙醇醯胺之G蛋白耦合受體之去孤兒化作用，及其在發現小分子攝食不足劑上之用途", 細胞新陳代謝作用, 3: 167-175 (2006), WO 05/007647, WO 05/007658)。

【發明內容】

根據本發明，係提供化合物，其具有式I或式IA之一般結構：



其中 n_1 , n_2 , n_3 , G, Q, X, R_1 , R_2 , R_{20} 及 R_{21} 係定義於下文。

本發明化合物會調制G蛋白耦合受體之活性。本發明化合物較佳係調制GPR119 G蛋白耦合受體("GPR119")之活性。因此，本發明化合物可用於治療與GPR119有關聯之多種疾病或病症，譬如糖尿病及相關症狀、與糖尿病有關聯之微血管併發症、與糖尿病有關聯之巨血管併發症、心血管疾

病、代謝徵候簇及其成份症狀、肥胖，以及其他病恙。可根據本發明預防、調制或治療而與 GPR119 G 蛋白偶合受體之調制有關聯疾病或病症之實例，包括但不限於糖尿病、高血糖、減弱之葡萄糖容許度、胰島素抗藥性、胰島素過多、視網膜病、神經病、腎病、延遲之傷口癒合、動脈粥瘤硬化及其後遺症、異常心臟功能、心肌絕血、中風、代謝徵候簇、高血壓、肥胖、脂血症障礙、脂血症異常、血脂肪過多、血三酸甘油酯過多、高膽固醇血症、低 HDL、高 LDL、非心臟絕血、感染、癌症、血管再狹窄、胰腺炎、神經變性疾病、脂質病症、認知力減弱與癡呆症、骨質疾病、與 HIV 蛋白酶有關聯之脂肪代謝障礙及青光眼。

此外，本發明係關於經調配之產物，其中經選擇之配方係以下述方式製成，使用式 I 及 / 或 IA 化合物作為唯一活性成份，或藉由將 (a) 式 I 及 / 或 IA 化合物 (使用本文列示之任何化合物具體實施例) 與 (b) 另一種活性成份合併，例如二肽基肽酶 -IV (DPP4) 抑制劑 (例如選自沙克沙葛菌素 (saxagliptin)、西塔葛菌素 (sitagliptin)、威達葛菌素 (vildagliptin) 及阿洛葛菌素 (alogliptin) 之成員)。

本發明係提供式 I 與 IA 化合物，採用此種化合物之醫藥組合物，及使用此種化合物之方法。特定言之，本發明係提供一種醫藥組合物，其包含治療上有效量之式 I 及 / 或 IA 化合物，單獨或併用藥學上可接受之載劑。

再者，根據本發明，係提供一種預防、調制或治療與 GPR119 G 蛋白偶合受體之活性有關聯疾病或病症之進展或

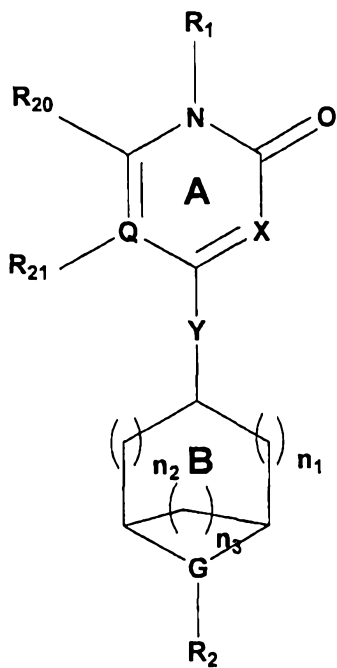
展開之方法，該疾病譬如上文與後文所定義者，其中係將治療上有效量之式I及/或IA化合物投予需要治療之哺乳動物，意即人類病患。

本發明化合物可單獨使用，併用本發明之其他化合物，或併用一或多種其他藥劑。

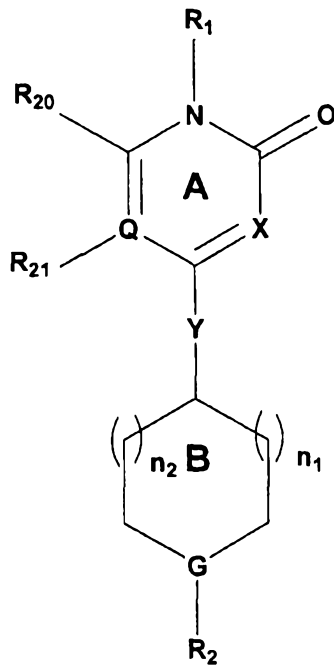
再者，本發明係提供一種預防、調制或治療如上文與後文所定義疾病之方法，其中係將治療上有效量之式I或IA化合物與另一種式I或IA化合物及/或至少一種其他類型治療劑之組合投予需要治療之哺乳動物，意即人類病患。

發明說明

根據本發明，係提供式I與式IA化合物：



式I



式IA

包括其對掌異構物、非對映異構物、溶劑合物及鹽(特別是其對掌異構物、非對映異構物及藥學上可接受之鹽)，具有環A與環B，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C 或 N；

X 為 CH 或 N，其條件是，Q 與 X 不皆為 N；

Y 為 CH_2 、 $N(R_3)$ 、 $C(=O)$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $S(=O)$ 或 $S(O)_2$ ；

n_1 為 0-2；

n_2 為 0-2；

n_3 為 1-2；

R_1 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{11}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{11}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_{12}R_{12}$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{11}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{11}$ 、 $-S(O)_2R_{11}$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O)_2R_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-S(O)_2R_5$ 、 $-C(=O)NR_3R_5$ 、 $-C(=O)R_5$ 或 $-C(=O)OR_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基

可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O)_2R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$

及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

$\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、
 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、
 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、
 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、
 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、
 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、

-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₁₄S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-
 NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、
 -NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-
 NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈
 及芳烷基；

R₁₂在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R₁₄在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R₂₀與R₂₁各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-C(=O)NR₉R₉、-C(=O)R₁₀及-OC(=O)R₁₀。

"式I"與"式IA"術語及其所有具體實施例係包括其對掌異構物、非對映異構物、溶劑合物及鹽(特別是其對掌異構物、非對映異構物及藥學上可接受之鹽)。

在第二項具體實施例中，係提供式I與式IA化合物，其中：環A係視情況被一或多個以R₂₀與R₂₁顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C或N；

X為CH或N，其條件是，Q與X不皆為N；

Y為CH₂、N(R₃)、C(=O)、O、OCR₉R₉、S、S(=O)或S(O)₂；

n_1 為 0-2；

n_2 為 0-2；

n_3 為 1-2；

R_1 為 6-員單環狀芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、

炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、

雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，

其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$

及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且 R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 及 $-OC(=O)R_{10}$ 。

在第三項具體實施例中，係提供式I與式IA化合物，其中：環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C或N；

X為CH或N，其條件是，Q與X不皆為N；

Y為 CH_2 、 $N(R_3)$ 、 $C(=O)$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $S(=O)$ 或 $S(O)_2$ ；

n_1 為0-2；

n_2 為0-2；

n_3 為1-2；

R_1 為苯基、吡啶基、吡啶基或嘧啶基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{11}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{11}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_{12}R_{12}$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、

-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₁、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、
 -C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₁、-S(O)₂R₁₁、
 -NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、
 芳基及雜環基可各視情況被一或多個R₆取代；與(b) 烷基可
 視情況被一或多個R₇取代；

R₂為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、-S(O)₂R₅、
 -C(=O)NR₃R₅、-C(=O)R₅或-C(=O)OR₅，其中環烷基、芳基、雜
 芳基及雜環基可各視情況被一或多個R₆取代；

R₃為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳
 基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R₅為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其
 每一個可視情況被一或多個R₆取代；

R₆在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
 雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、
 -OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、
 -C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、
 -OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、
 -S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯
 基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $=O$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 及 $-NR_{14}S(O_2)R_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、

芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ 、 $=O$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、

$-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第四項具體實施例中，係提供式 I 與式 IA 化合物，其中：
環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C 或 N；

X 為 CH 或 N，其條件是，Q 與 X 不皆為 N；

Y 為 CH_2 、 $N(R_3)$ 、 $C(=O)$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $S(=O)$ 或 $S(O)_2$ ；

n_1 為 0-2；

n_2 為 0-2；

n_3 為 1-2；

R_1 為苯基或吡啶基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{11}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{11}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_{12}R_{12}$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{11}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{11}$ 、 $-S(O)_2R_{11}$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O)_2R_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-S(O)_2R_5$ 、 $-C(=O)NR_3R_5$ 、 $-C(=O)R_5$ 或 $-C(=O)OR_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基

可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$

及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

$\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、
 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})-$
 $\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、
 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})-$
 $\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、
 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})-$
 $\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$
 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、

-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₁₄S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-
 NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、
 -NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-
 NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O)₂R₈
 及芳烷基；

R₁₂在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R₁₄在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；
 且

R₂₀與R₂₁各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、
 -C(=O)NR₉R₉、-C(=O)R₁₀及-OC(=O)R₁₀。

在第五項具體實施例中，係提供式I與式IA化合物，其中：
 環A係視情況被一或多個以R₂₀與R₂₁顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C或N；

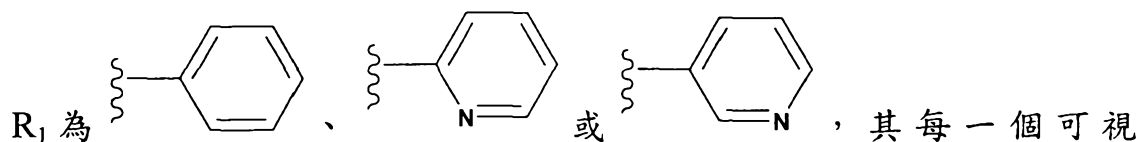
X為CH或N，其條件是，Q與X不皆為N；

Y為CH₂、N(R₃)、C(=O)、O、OCR₉R₉、S、S(=O)或S(O)₂；

n₁為0-2；

n₂為0-2；

n_3 為 1-2 ;



情況被一或多個選自包括 R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代 ;

R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、

炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、

雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，

其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$

及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；
且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第六項具體實施例中，係提供式I與式IA化合物，其中：
環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C或N；

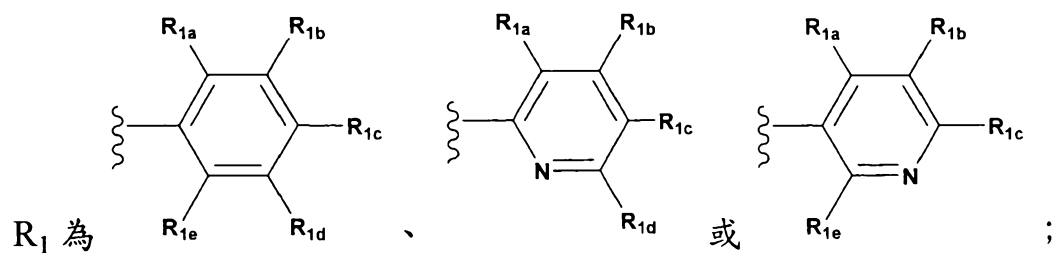
X為CH或N，其條件是，Q與X不皆為N；

Y為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、O、 OCR_9 、 R_9 、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為0-2；

n_2 為0-2；

n_3 為1-2；



R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、

-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₁、-OH、-SH、-SR₁₁、
 -S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₁₂R₁₂、-S(O)₂NR₉R₉、
 -NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₁、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、
 -C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₁、-S(O)₂R₁₁、
 -NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O)₂R₈，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、
 芳基及雜環基可各視情況被一或多個R₆取代；與(b) 烷基可
 視情況被一或多個R₇取代；

R₂為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、-S(O)₂R₅、-C(=O)NR₃R₅、
 -C(=O)R₅或-C(=O)OR₅，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基
 可各視情況被一或多個R₆取代；

R₃為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳
 基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R₅為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其
 每一個可視情況被一或多個R₆取代；

R₆在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
 雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、
 -OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、
 -C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、
 -OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、

$-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(\text{=NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(\text{=NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(\text{=O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(\text{=NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(\text{=NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{14}$ 及

$-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$;

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、

-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈及芳烷基；

R₁₁在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{11a}取代；

R_{11a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈及芳烷基；

R₁₂在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R₁₄在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R₂₀與R₂₁各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、

鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第七項具體實施例中，係提供式 I 與式 IA 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C 或 N；

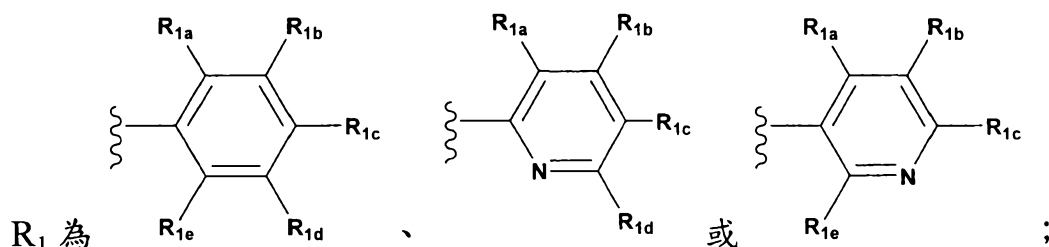
X 為 CH 或 N，其條件是，Q 與 X 不皆為 N；

Y 為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為 0-2；

n_2 為 0-2；

n_3 為 1-2；



R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、

$-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與(b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、

-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、
 -SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、
 -NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、
 -NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈
 及 -NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、
 環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R₈ 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
 雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
 雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
 -OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-
 NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、
 -NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-
 NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄ 及
 -NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉ 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、
 芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
 其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、
 雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ 、 $=O$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；
且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 及 $-OC(=O)R_{10}$ 。

在第八項具體實施例中，係提供式I與式IA化合物，其中：
環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C 或 N；

X 為 CH 或 N，其條件是，Q 與 X 不皆為 N；

Y 為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為 0-2；

n_2 為 0-2；

n_3 為 1-2；

R_1 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、

環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $=O$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 及 $-NR_{14}S(O)_2R_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、

$-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、

$-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、
 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)-$
 $NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、
 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})-$
 $NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$
 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環
 烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、
 芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a}
 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、
 鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、
 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 及 $-OC(=O)R_{10}$ 。

在第九項具體實施例中，係提供式I與式IA化合物，其中：
 環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C或N；

X為CH或N，其條件是，Q與X不皆為N；

Y為 CH_2 、 $N(R_3)$ 、 $C(=O)$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $S(=O)$ 或 $S(O)_2$ ；

n_1 為0-2；

n_2 為0-2；

n_3 為1-2；

R_1 為6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或6-員單環狀雜

芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為芳基、雜芳基或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中芳基與雜芳基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、

-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、
 -C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、
 -OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、
 -S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯
 基、炔基、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各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、
 烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-NH₂、
 -CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、
 -SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、
 -NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、
 -NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈
 及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、
 環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
 雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
 雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
 -OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-

$\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、
 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})-$
 $\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及
 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜

環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a}

取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第十項具體實施例中，係提供式 I 與式 IA 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C 或 N；

X 為 CH 或 N，其條件是，Q 與 X 不皆為 N；

Y 為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為 0-2；

n_2 為 0-2；

n_3 為 1-2；

R_1 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、

-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、
-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₁、-S(O)₂R₁₁、
-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中：(a)烯基、炔基、環烷基、
芳基及雜環基可各視情況被一或多個R₆取代；與(b)烷基可
視情況被一或多個R₇取代；R₂為雜芳基或-C(=O)OR₅，其中
雜芳基可視情況被一或多個R₆取代；

R₃為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳
基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R₅為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其
每一個可視情況被一或多個R₆取代；

R₆在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、
-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、
-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、
-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、
-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯
基、炔基、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各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、
烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-NH₂、
-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、

-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、
 -NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、
 -NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈
 及 -NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、
 環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R₈ 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
 雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
 雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
 -OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-
 NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、
 -NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-
 NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄ 及
 -NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉ 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、
 芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
 其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、
 雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、

炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、

芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 及 $-OC(=O)R_{10}$ 。

在第十一項具體實施例中，係提供式 I 與式 IA 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C 或 N；

X 為 CH 或 N，其條件是，Q 與 X 不皆為 N；

Y 為 CH₂、N(R₃)、C(=O)、O、OCR₉R₉、S、S(=O) 或 S(O)₂；

n₁ 為 0-2；

n₂ 為 0-2；

n₃ 為 1-2；

R₁ 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}、R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}、R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₁、-OH、-SH、-SR₁₁、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₁₂R₁₂、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₁、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₁、-S(O)₂R₁₁、-NR₉C(=O)OR₈ 及 -NR₉S(O)₂R₈，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R₆ 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R₇ 取代；

R₂ 為雜芳基，其可視情況被一或多個 R₆ 取代；

R₃ 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R₆ 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、

炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、

雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，

其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$

及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 及 $-OC(=O)R_{10}$ 。

在第十二項具體實施例中，係提供式I與式IA化合物，其中：

環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C或N；

X為CH或N，其條件是，Q與X不皆為N；

Y為 CH_2 、 $N(R_3)$ 、 $C(=O)$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $S(=O)$ 或 $S(O)_2$ ；

n_1 為0-2；

n_2 為0-2；

n_3 為1-2；

R_1 為6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、

-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₁、-OH、-SH、-SR₁₁、
 -S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₁₂R₁₂、-S(O)₂NR₉R₉、
 -NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₁、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、
 -C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₁、-S(O)₂R₁₁、
 -NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、
 芳基及雜環基可各視情況被一或多個R₆取代；與(b) 烷基可
 視情況被一或多個R₇取代；

R₂為喹二唑基、苯并喹唑基、吡啶基或嘧啶基，其每一
 個可視情況被一或多個R₆取代；

R₃為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳
 基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R₆在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
 雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、
 -OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、
 -C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、
 -OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、
 -S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯
 基、炔基、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各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，

其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ 、 $=O$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、

$\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第十三項具體實施例中，係提供式I與式IA化合物，其

中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C 或 N；

X 為 CH 或 N，其條件是，Q 與 X 不皆為 N；

Y 為 CH_2 、 $N(R_3)$ 、 $C(=O)$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $S(=O)$ 或 $S(O)_2$ ；

n_1 為 0-2；

n_2 為 0-2；

n_3 為 1-2；

R_1 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{11}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{11}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_{12}R_{12}$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{11}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{11}$ 、 $-S(O)_2R_{11}$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O)_2R_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為嘓啶基，其可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、

雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $=O$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 及 $-NR_{14}S(O_2)R_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ 、

=O 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

$\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、
 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})-$
 $\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$
 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環
 烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、
 芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a}
 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、
 鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第十四項具體實施例中，係提供式I與式IA化合物，其
 中：

環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C或N；

X為CH或N，其條件是，Q與X不皆為N；

Y為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為0-2；

n_2 為0-2；

n_3 為1-2；

R_1 為6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或6-員單環狀雜
 芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d}

及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、

-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、
-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯
基、炔基、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各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、
烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-NH₂、
-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、
-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、
-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、
-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、
-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈
及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、
環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、
-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-
NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、
-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-

$\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、

-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₁₄S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-
 NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、
 -NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-
 NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈
 及芳烷基；

R₁₁在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、
 芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、
 芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{11a}取代；

R_{11a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
 基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜
 環基、雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、
 -C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₁₄S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-
 NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、
 -NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-
 NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈
 及芳烷基；

R₁₂在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環
 烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、
 芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{10a}
 取代；

R₁₄在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第十五項具體實施例中，係提供式 I 與式 IA 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C 或 N；

X 為 CH 或 N，其條件是，Q 與 X 不皆為 N；

Y 為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為 0-2；

n_2 為 0-2；

n_3 為 1-2；

R_1 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、

$-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$

及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

$\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、
 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})-$
 $\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、
 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})-$
 $\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、
 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})-$
 $\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$
 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、

$-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、
 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、
 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)-$
 $NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、
 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})-$
 $NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$
 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環
 烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、
 芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a}
 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、
 鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、
 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 及 $-OC(=O)R_{10}$ 。

在第十六項具體實施例中，係提供式I與式IA化合物，其
 中：

環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C或N；

X為CH或N，其條件是，Q與X不皆為N；

Y為 CH_2 、 $N(R_3)$ 、 $C(=O)$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $S(=O)$ 或 $S(O)_2$ ；

n_1 為0-2；

n_2 為0-2；

n_3 為 1-2；

R_1 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、

雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、

-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-
 NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、
 -NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-
 NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
 -NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、
 芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
 其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、
 雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
 雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
 -OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₀、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₀、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-
 NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、
 -NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-
 NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈、
 =O及芳烷基；

R₁₀在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、
 芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
 其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基

及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-C(=O)NR₉R₉、-C(=O)R₁₀及-OC(=O)R₁₀。

在第十七項具體實施例中，係提供式I與式IA化合物，其中：

環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C或N；

X為CH；

Y為CH₂、N(R₃)、C(=O)、O、OCR₉R₉、S、S(=O)或S(O)₂；

n_1 為0-2；

n_2 為0-2；

n_3 為1-2；

R_1 為6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、

-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₁、-OH、-SH、-SR₁₁、
 -S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₁₂R₁₂、-S(O)₂NR₉R₉、
 -NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₁、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、
 -C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₁、-S(O)₂R₁₁、
 -NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、
 芳基及雜環基可各視情況被一或多個R₆取代；與(b) 烷基可
 視情況被一或多個R₇取代；

R₂為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、-S(O)₂R₅、-C(=O)NR₃R₅、
 -C(=O)R₅或-C(=O)OR₅，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基
 可各視情況被一或多個R₆取代；

R₃為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳
 基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R₅為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其
 每一個可視情況被一或多個R₆取代；

R₆在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
 雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、
 -OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、
 -C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、
 -OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、

$-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{O})\text{OR}_{14}$ 及

$-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$;

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、

-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈及芳烷基；

R₁₁在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{11a}取代；

R_{11a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈及芳烷基；

R₁₂在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R₁₄在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R₂₀為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第十八項具體實施例中，係提供式 I 與式 IA 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為 0-2；

n_2 為 0-2；

n_3 為 1-2；

R_1 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、

$-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、

-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、
 -NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、
 -NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈
 及 -NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、
 環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R₈ 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
 雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
 雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
 -OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-
 NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、
 -NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-
 NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄ 及
 -NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉ 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、
 芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
 其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、
 雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、

炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、

芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 及 $-OC(=O)R_{10}$ 。

在第十九項具體實施例中，係提供式 IA 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(\text{=O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(\text{=O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為 0-2；

n_2 為 0-2；

R_1 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(\text{=NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(\text{=NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、

雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $=O$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 及 $-NR_{14}S(O_2)R_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ 、

=O 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

$\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、
 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})-$
 $\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$
 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環
 烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、
 芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a}
 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第二十項具體實施例中，係提供式I化合物，其中：
 環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G 為CH或N；

Q 為C；

X 為CH；

Y 為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為0-2；

n_2 為0-2；

n_3 為2；

R_1 為6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或6-員單環狀雜
 芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d}

及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、

-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、
 -C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、
 -OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、
 -S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯
 基、炔基、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各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、
 烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-NH₂、
 -CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、
 -SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、
 -NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、
 -NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈
 及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、
 環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
 雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
 雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
 -OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-

$\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、
 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})-$
 $\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及
 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜

環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a}

取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-C(=O)NR₉R₉、-C(=O)R₁₀ 及 -OC(=O)R₁₀。

在第二十一項具體實施例中，係提供式 IA 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 CH₂、N(R₃)、C(=O)、O、OCR₉R₉、S、S(=O) 或 S(O)₂；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

R_1 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₁、-OH、-SH、-SR₁₁、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₁₂R₁₂、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₁、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、

$-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、

-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、
 -SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、
 -NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、
 -NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈
 及 -NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、
 環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R₈ 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
 雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
 雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
 -OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-
 NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、
 -NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-
 NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄ 及
 -NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉ 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、
 芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
 其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、
 雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ 、 $=O$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 及 $-OC(=O)R_{10}$ 。

在第二十二項具體實施例中，係提供式I化合物，其中：

環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(\text{=O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(\text{=O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

n_3 為 2；

R_1 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(\text{=NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(\text{=NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、

環烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $=O$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 及 $-NR_{14}S(O)_2R_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、

$-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、

-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₁₄S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)-
 NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、
 -NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)-
 NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈
 及芳烷基；

R₁₂在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環
 烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、
 芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{10a}
 取代；

R₁₄在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R₂₀為氫；且

R₂₁係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、-CN、
 -C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-C(=O)NR₉R₉、
 -C(=O)R₁₀及-OC(=O)R₁₀。

在第二十三項具體實施例中，係提供式IA化合物，其中：
 環A係視情況被一或多個以R₂₀與R₂₁顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C；

X為CH；

Y為CH₂、N(R₃)、C(=O)、O、OCR₉R₉、S、S(=O)或S(O)₂；

n₁為1；

n₂為1；

R₁為6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或6-員單環狀雜

芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、

-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、
 -C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、
 -OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、
 -S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯
 基、炔基、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各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、
 烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-NH₂、
 -CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、
 -SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、
 -NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、
 -NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈
 及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、
 環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
 雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
 -OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
 -NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
 -OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及

$-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$;

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯

基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第二十四項具體實施例中，係提供式I化合物，其中：環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C；

X為CH；

Y為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為1；

n_2 為1；

n_3 為2；

R_1 為6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d}

及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、

-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、
 -C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、
 -OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、
 -S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯
 基、炔基、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各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、
 烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-NH₂、
 -CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、
 -SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、
 -NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、
 -NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈
 及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、
 環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
 雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
 -OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
 -NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
 -OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
 -NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、

-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈及-NR₁₄S(O₂)R₈;

R₁₂在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R₁₄在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R₂₀為氫；且

R₂₁係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、-CN、
-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-C(=O)NR₉R₉、
-C(=O)R₁₀及-OC(=O)R₁₀。

在第二十五項具體實施例中，係提供式IA化合物，其中：
環A係視情況被一或多個以R₂₀與R₂₁顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C；

X為CH；

Y為O、OCR₉R₉或S；

n₁為1；

n₂為1；

R₁為6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}、R_{1d}及R_{1e}之成員取代；

R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}、R_{1d}及R_{1e}各獨立選自包括氫、烷基、烯基、

炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與(b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、

-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、
-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯
基、炔基、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各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、
烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-NH₂、
-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、
-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、
-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、
-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、
-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈
及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、
環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
-NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、
芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，

其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、

$-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$;

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第二十六項具體實施例中，係提供式 I 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 O、 OCR_9R_9 或 S；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

n_3 為 2；

R_1 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、

-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₁、-OH、-SH、-SR₁₁、
 -S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₁₂R₁₂、-S(O)₂NR₉R₉、
 -NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₁、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、
 -C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₁、-S(O)₂R₁₁、
 -NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O)₂R₈，其中：(a)烯基、炔基、環烷基、
 芳基及雜環基可各視情況被一或多個R₆取代；與(b)烷基可
 視情況被一或多個R₇取代；

R₂為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、-S(O)₂R₅、-C(=O)NR₃R₅、
 -C(=O)R₅或-C(=O)OR₅，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基
 可各視情況被一或多個R₆取代；

R₃為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳
 基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R₅為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其
 每一個可視情況被一或多個R₆取代；

R₆在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
 雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、
 -OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、
 -C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、
 -OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、

$-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(\text{=NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(\text{=NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、

雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及

$-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$;

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第二十七項具體實施例中，係提供式 IA 化合物，其中：環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 O、 OCR_9R_9 或 S；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

R_1 為苯基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、

-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₁、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、
 -C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₁、-S(O)₂R₁₁、
 -NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、
 芳基及雜環基可各視情況被一或多個R₆取代；與(b) 烷基可
 視情況被一或多個R₇取代；

R₂為雜芳基或-C(=O)OR₅，其中雜芳基可視情況被一或多
 個R₆取代；

R₅為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其
 每一個可視情況被一或多個R₆取代；

R₆在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
 雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、
 -OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、
 -C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、
 -OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、
 -S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯
 基、炔基、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各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、
 烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-NH₂、

-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、
 -SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、
 -NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、
 -NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、
 -NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈
 及 -NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、
 環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R₈ 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
 雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
 -OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
 -NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
 -OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄ 及
 -NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉ 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、
 芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
 其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、
 雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
 -OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
 -NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、

$-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、
 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-C(=O)NR₉R₉、-C(=O)R₁₀及-OC(=O)R₁₀。

在第二十八項具體實施例中，係提供式I化合物，其中：
環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 O、OCR₉R₉或S；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

n_3 為 2；

R_1 為苯基或6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₁、-OH、-SH、-SR₁₁、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₁₂R₁₂、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₁、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₁、-S(O)₂R₁₁、

$-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、

$-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及 $=\text{O}$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，

其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 及 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 及 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、

$-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第二十九項具體實施例中，係提供式 IA 化合物，其中：
環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 O、 OCR_9R_9 或 S；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

R_1 為苯基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-C(=O)OR_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、

-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
-NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、
芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、
雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈
及=O；

R₁₀在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、
芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基
及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R_{10a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、
-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃
、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、
-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈及-NR₁₄S(O₂)R₈；

R₁₁在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、

芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 及 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 及 $-OC(=O)R_{10}$ 。

在第三十項具體實施例中，係提供式 I 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 O、 OCR_9R_9 或 S；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

n_3 為 2；

R_1 為苯基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} , R_{1b} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、

-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、
-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯
基、炔基、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各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、
烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-CN、
-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、
-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、
-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、
-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、
環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
-NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、
芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、
雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及 $=\text{O}$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環

烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-C(=O)NR₉R₉、-C(=O)R₁₀ 及 -OC(=O)R₁₀。

在第三十一項具體實施例中，係提供式 IA 化合物，其中：環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 O、OCR₉R₉ 或 S；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

R_1 為苯基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、-CN、-OCF₃、-OR₁₁、-OH、-C(=O)NR₉R₉、-NR₁₂R₁₂、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₁、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、-S(=O)R₁₁、-S(O)₂R₁₁、-NR₉C(=O)OR₈ 及 -NR₉S(O)₂R₈，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視

情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、

$-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及 $=\text{O}$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$

、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第三十二項具體實施例中，係提供式 I 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 O、 OCR_9R_9 或 S；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

n_3 為 2；

R_1 為苯基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} , R_{1b} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、

-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、
-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯
基、炔基、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各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、
烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-CN、
-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、
-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、
-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、
-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、
環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一
個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
-NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，
其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、

-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈
及=O；

R₁₀在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可
各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R_{10a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、
-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃
、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、
-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈及-NR₁₄S(O₂)R₈；

R₁₁在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可
各視情況被0-3個R_{11a}取代；

R_{11a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈及-NR₁₄S(O₂)R₈；

R₁₂在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，
其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R₁₄在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R₂₀為氫；且

R₂₁係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、-CN、
-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-C(=O)NR₉R₉、

$-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第三十三項具體實施例中，係提供式 IA 化合物，其中：
環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 O、 OCR_9R_9 或 S；

n_1 為 1；

n_2 為 1

R_1 為苯基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-C(=O)OR_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、

-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
-NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，
其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈
及=O；

R₁₀在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可
各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R_{10a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、
-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃
、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、
-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈及-NR₁₄S(O₂)R₈；

R₁₁在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可
各視情況被0-3個R_{11a}取代；

R_{11a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、

$-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、
 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$;

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第三十四項具體實施例中，係提供式 I 化合物，其中：環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 O、 OCR_9R_9 或 S；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

n_3 為 2；

R_1 為苯基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、

$-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、

-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、
-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、
-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、
-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、
環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
-NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，
其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈
及=O；

R₁₀在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可
各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R_{10a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯

基、炔基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第三十五項具體實施例中，係提供式IA化合物，其中：環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為N；

Q為C；

X為CH；

Y為O；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

R_1 為苯基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} , R_{1b} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、

雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、

炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及 $=\text{O}$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、

$-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第三十六項具體實施例中，係提供式I化合物，其中：
環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為N；

Q為C；

X為CH；

Y為O；

n_1 為1；

n_2 為1；

n_3 為2；

R_1 為苯基或6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a)烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與(b)烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、

$-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及 $=\text{O}$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯

基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

在第三十七項具體實施例中，係提供式IA化合物，其中：環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為N；

Q為C；

X為CH；

Y為O；

n_1 為1；

n_2 為1；

R_1 為苯基或6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、

$-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與(b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與(b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、

烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及 $=\text{O}$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 及 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 及 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、鹵基及 $-CN$ 。

在第三十八項具體實施例中，係提供式 I 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 O；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

n_3 為 2；

R_1 為苯基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} , R_{1b} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、

雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、

炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及 $=\text{O}$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、鹵基及 $-\text{CN}$ 。

在第三十九項具體實施例中，係提供式IA化合物，其中：
環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為N；

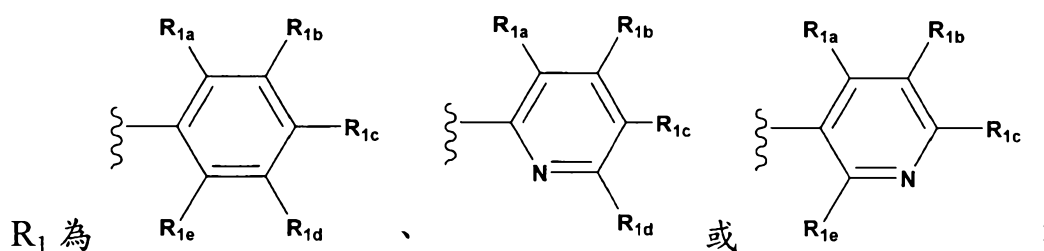
Q為C；

X為CH；

Y為O；

n_1 為1；

n_2 為1；



R_{1a} , R_{1b} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{11}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_{12}R_{12}$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{11}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)NR_9R_9$ 、 $-S(=O)R_{11}$ 、 $-S(O)_2R_{11}$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與(b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-CN$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{11}$ 、 $-OH$ 、 $-SR_{11}$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_{12}R_{12}$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{11}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)NR_9R_9$ 、 $-S(=O)R_{11}$ 、 $-S(O)_2R_{11}$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與(b) 烷

基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-C(=O)OR_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、

-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
-NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，
其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈
及=O；

R₁₀在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可
各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R_{10a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、
-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃
、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、
-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈及-NR₁₄S(O₂)R₈；

R₁₁在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可
各視情況被0-3個R_{11a}取代；

R_{11a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、

$-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、
 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$;

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，
 其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、鹵基及 $-\text{CN}$ 。

在第四十項具體實施例中，係提供式 I 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 N；

Q 為 C；

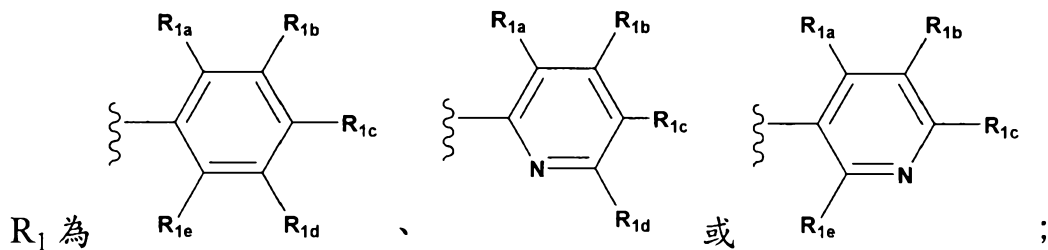
X 為 CH；

Y 為 O；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

n_3 為 2；



R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、
 環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、
 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、
 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、
 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔

基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、

$-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、
 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、
 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、
 環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、
 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、
 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、
 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及
 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，
 其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
 炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、
 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、
 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、
 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及
 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可
 各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
 基、炔基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、

-OH、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、鹵基及 $-\text{CN}$ 。

在第四十一項具體實施例中，係提供式IA化合物，其中：環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為N；

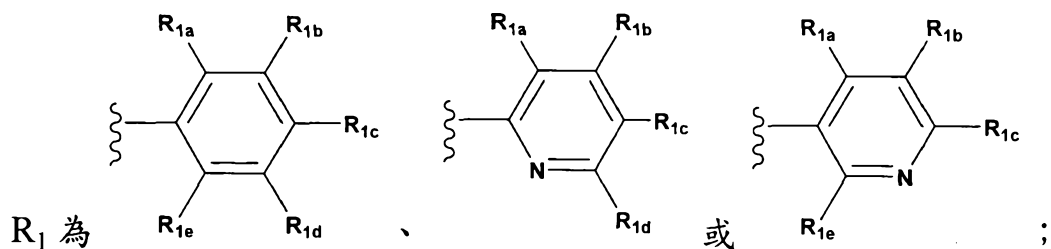
Q為C；

X為CH；

Y為O；

n_1 為1；

n_2 為1；



R_{1a} , R_{1b} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為吡啶基、嘧啶基或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中吡啶基與嘧啶基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、芳基或環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、

-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、
-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯
基、炔基、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各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、
烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-CN、
-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、
-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、
-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、
-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、
環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一
個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
-NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，
其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、

-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈
及=O；

R₁₀在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可
各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R_{10a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、
-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃
、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、
-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈及-NR₁₄S(O₂)R₈；

R₁₁在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可
各視情況被0-3個R_{11a}取代；

R_{11a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈及-NR₁₄S(O₂)R₈；

R₁₂在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，
其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R₁₄在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R₂₀為氫；且

R₂₁係選自包括氫、烷基、鹵烷基、鹵基及-CN。

在第四十二項具體實施例中，係提供式I化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 N；

Q 為 C；

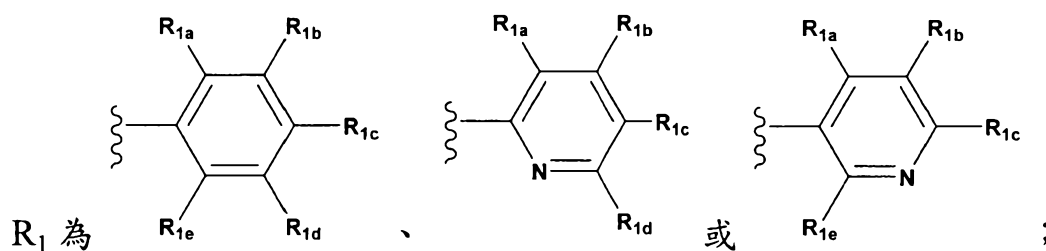
X 為 CH；

Y 為 O；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

n_3 為 2；



R_{1a} , R_{1b} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷

基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為吡啶基、嘧啶基或 $-C(=O)OR_5$ ，其中吡啶基與嘧啶基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、芳基或環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、

-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
-NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，
其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈
及=O；

R₁₀在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可
各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R_{10a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、
-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃
、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、
-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈及-NR₁₄S(O₂)R₈；

R₁₁在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可
各視情況被0-3個R_{11a}取代；

R_{11a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、

$-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、
 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$;

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、鹵基及 $-\text{CN}$ 。

化合物之一個特定組群為式 I 具體實施例之組群。

化合物之另一個特定組群為式 IA 具體實施例之組群(注意式 IA，沒有 n_3 在式中)。

關於本申請案中所述之各具體實施例，使用於各具體實施例中之術語之進一步且更特定意義可選自下述定義；此等意義可個別地使用於任何具體實施例中或在任何組合中。應注意的是，關於 " $=\text{O}$ " 之任何存在處，此等可伴隨著適當調整，使用於鍵結結構中，在正如熟諳此藝者所明瞭之位置處。

使用於各存在處之雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各含有 1-4 個選自 N、O 及 S 之雜原子。

R_1 可選自苯基，與 6 員單環狀雜芳基，具有 1 或 2 個 N，其中：

a) 苯基與雜芳基可各被 1-3 個 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 取代；與

b) R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自氫、 C_{1-3} 烷基、 C_{3-6} 環烷基、苯基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、

$-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、
 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$
 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：

i) R_8 係選自包括 C_{1-6} 直鏈與分枝鏈烷基及 C_{3-6} 環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代，其中 R_{8a} 係選自鹵基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{3-6} 環烷基、 OH 、 C_{1-3} 烷氧基及 CN ；

ii) R_9 係選自包括 C_{1-6} 直鏈與分枝鏈烷基及 C_{3-6} 環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{9a} 取代，其中 R_{9a} 係選自鹵基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{3-6} 環烷基、 OH 、 C_{1-3} 烷氧基及 CN ；

iii) R_{10} 係選自包括 C_{1-6} 直鏈與分枝鏈烷基及 C_{3-6} 環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{10a} 取代，其中 R_{10a} 係選自鹵基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{3-6} 環烷基、 OH 、 C_{1-3} 烷氧基及 CN ；

iv) R_{11} 係選自包括 C_{1-6} 直鏈與分枝鏈烷基及 C_{3-6} 環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{11a} 取代，其中 R_{11a} 係選自鹵基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{3-6} 環烷基、 OH 、 C_{1-3} 烷氧基及 CN ；且

v) R_{12} 係選自包括 C_{1-6} 直鏈與分枝鏈烷基及 C_{3-6} 環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{10a} 取代，其中 R_{10a} 係選自鹵基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{3-6} 環烷基、 OH 、 C_{1-3} 烷氧基及 CN ；

R_2 可選自 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，5-6 員單環狀雜芳基，具有 1-3 個選自

O與N之雜原子；及8-10雙環狀雜芳基，具有1-3個選自O與N之雜原子，其中：

i) 雜芳基可各被1或2個 R_6 取代，其中 R_6 係選自 C_{1-6} 烷基、 C_{1-3} 鹵烷基、苯基、 C_{3-6} 環烷基、鹵基、-CN、-OCF₃及-OC₁₋₅烷基，其中關於 R_6 之烷基、苯基及環烷基意義可各視情況被0-2個 R_{9a} 取代，其中 R_{9a} 係選自鹵基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{3-6} 環烷基、OH、 C_{1-3} 烷氧基及CN；與

ii) R_5 係選自包括 C_{1-6} 直鏈與分枝鏈烷基、 C_{3-6} 環烷基及苯基，其中烷基、苯基及環烷基可各視情況被0-2個 R_6 取代，其中 R_6 係如i)中之定義。

R_5 可選自包括 C_{1-6} 直鏈與分枝鏈烷基、 C_{3-6} 環烷基及苯基，其中：

i) 烷基、苯基及環烷基可各視情況被0-2個 R_6 取代；

ii) R_6 係選自 C_{1-6} 直鏈與分枝鏈烷基； C_{3-6} 環烷基； C_{2-6} 烯基； C_{2-6} 炔基；OH；苯基；鹵基； C_{1-6} 鹵烷基；5-6員雜芳基，具有碳原子與1-2個選自O、S及N之雜原子；5-6員雜環，具有碳原子與1-2個選自O與N之雜原子；OCF₃；OR₁₀，其中 R_{10} 為 C_{1-3} 烷基或 C_{3-6} 環烷基；及SR₁₀，其中 R_{10} 為 C_{1-3} 烷基或 C_{3-6} 環烷基；及

iii) R_6 之烷基、烯基、炔基、苯基、環烷基、雜芳基及雜環基意義可各視情況被0-3個 R_{9a} 取代，其中 R_{9a} 係選自包括鹵基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{3-6} 環烷基、OH、 C_{1-3} 烷氧基、CN及=O。

R_6 可選自 C_{1-6} 直鏈與分枝鏈烷基； C_{3-6} 環烷基； C_{2-6} 烯基；

C_{2-6} 炔基；OH；苯基；鹵基； C_{1-6} 鹵烷基；5-6員雜芳基，具有碳原子與1-2個選自O、S及N之雜原子；5-6員雜環，具有碳原子與1-2個選自O與N之雜原子； OCF_3 ； OR_{10} ，其中 R_{10} 為 C_{1-3} 烷基或 C_{3-6} 環烷基；及 SR_{10} ，其中 R_{10} 為 C_{1-3} 烷基或 C_{3-6} 環烷基；而再者，其中 R_6 之烷基、烯基、炔基、苯基、環烷基、雜芳基及雜環基意義可各視情況被0-3個 R_{9a} 取代，其中 R_{9a} 係選自包括鹵基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{3-6} 環烷基、OH、 C_{1-3} 烷氧基、CN及=O。

R_7 可選自包括 C_{1-6} 直鏈與分枝鏈烷基； C_{3-6} 環烷基； C_{2-6} 烯基； C_{2-6} 炔基；OH；苯基；鹵基； C_{1-6} 鹵烷基；5-6員雜環，具有碳原子與1-2個選自O與N之雜原子； OCF_3 ； OR_{10} ，其中 R_{10} 為 C_{1-3} 烷基或 C_{3-6} 環烷基；及 SR_{10} ，其中 R_{10} 為 C_{1-3} 烷基或 C_{3-6} 環烷基；而再者，其中 R_7 之烷基、烯基、炔基、苯基、環烷基及雜環基意義可各視情況被0-3個 R_{9a} 取代，其中 R_{9a} 係選自包括鹵基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{3-6} 環烷基、OH、 C_{1-3} 烷氧基、CN及=O。

R_8 係選自包括 C_{1-6} 直鏈與分枝鏈烷基及 C_{3-6} 環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代，其中 R_{8a} 係選自鹵基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{3-6} 環烷基、OH、 C_{1-3} 烷氧基、CN及=O。

R_{8a} 係選自鹵基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{3-6} 環烷基、OH、 C_{1-3} 烷氧基、CN及=O。

R_9 係選自H、 C_{1-3} 直鏈與分枝鏈烷基及 C_{3-6} 環烷基。

R_{9a} 係選自鹵基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{3-6} 環烷基、OH、 C_{1-3} 烷氧基、CN及=O。

R_{10} 係選自 C_{1-3} 直鏈與分枝鏈烷基及 C_{3-6} 環烷基。

R_{10a} 係選自 鹵基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{3-6} 環烷基、OH、 C_{1-3} 烷氧基、CN 及 =O。

R_{11} 係選自 C_{1-3} 直鏈與分枝鏈烷基及 C_{3-6} 環烷基。

R_{11a} 係選自 鹵基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{3-6} 環烷基、OH、 C_{1-3} 烷氧基、CN 及 =O。

R_{12} 係選自 包括 C_{1-3} 直鏈與分枝鏈烷基及 C_{3-6} 環烷基。

R_{14} 為 H。

R_{20} 為 H。

R_{21} 係選自 H、 C_{1-3} 烷基、 C_{3-6} 環烷基、鹵基及 CN。

在第四十三項具體實施例中，本發明之化合物係選自實例中所舉例之化合物組群。

在第四十四項具體實施例中，本發明係關於醫藥組合物，其包含治療上有效量之本發明化合物，單獨或視情況併用藥學上可接受之載劑及/或一或多種其他藥劑，例如似胰高血糖素肽-1 受體激動劑或其片段。

在第四十五項具體實施例中，本發明係關於調制 GPR119 G 蛋白偶合受體之活性之方法，其包括對有需要之哺乳動物病患例如人類病患投予治療上有效量之本發明化合物，單獨或視情況併用本發明之另一種化合物及/或至少一種其他類型之治療劑。

在第四十六項具體實施例中，本發明係關於一種預防、調制或治療與 GPR119 G 蛋白偶合受體活性有關聯疾病或病症之進展或展開之方法，其包括對需要預防、調制或治療

之哺乳動物病患例如人類病患投予治療上有效量之本發明化合物，單獨或視情況併用本發明之另一種化合物及/或至少一種其他類型之治療劑。

可根據本發明預防、調制或治療而與GPR119 G蛋白偶合受體活性有關聯疾病或病症之實例，包括但不限於糖尿病、高血糖、減弱之葡萄糖容許度、胰島素抗藥性、胰島素過多、視網膜病、神經病、腎病、延遲傷口癒合、動脈粥瘤硬化及其後遺症、異常心臟功能、心肌絕血、中風、代謝徵候簇、高血壓、肥胖、脂血症障礙、脂血症異常、血脂肪過多、血三酸甘油酯過多、高膽固醇血症、低HDL、高LDL、非心臟絕血感染、癌症、血管再狹窄、胰腺炎、神經變性疾病、脂質病症、認知力減弱與癡呆症、骨質疾病、HIV蛋白酶有關聯之脂肪代謝障礙及青光眼。

在第四十七項具體實施例中，本發明係關於一種預防、調制或治療糖尿病、高血糖、肥胖、脂血症障礙、高血壓及認知力減弱之進展或展開之方法，其包括對需要預防、調制或治療之哺乳動物病患例如人類病患投予治療上有效量之本發明化合物，單獨或視情況併用本發明之另一種化合物及/或至少一種其他類型之治療劑。

在第四十八項具體實施例中，本發明係關於一種預防、調制或治療糖尿病之進展或展開之方法，其包括對需要預防、調制或治療之哺乳動物病患例如人類病患投予治療上有效量之本發明化合物，單獨或視情況併用本發明之另一種化合物，及/或至少一種其他類型之治療劑。

在第四十九項具體實施例中，本發明係關於一種預防、調制或治療高血糖之進展或展開之方法，其包括對需要預防、調制或治療之哺乳動物病患例如人類病患投予治療上有效量之本發明化合物，單獨或視情況併用本發明之另一種化合物及/或至少一種其他類型之治療劑。

在第五十項具體實施例中，本發明係關於一種預防、調制或治療肥胖之進展或展開之方法，其包括對需要預防、調制或治療之哺乳動物病患例如人類病患投予治療上有效量之本發明化合物，單獨或視情況併用本發明之另一種化合物及/或至少一種其他類型之治療劑。

在第五十一項具體實施例中，本發明係關於一種預防、調制或治療脂血症障礙之進展或展開之方法，其包括對需要預防、調制或治療之哺乳動物病患例如人類病患投予治療上有效量之本發明化合物，單獨或視情況併用本發明之另一種化合物及/或至少一種其他類型之治療劑。

在第五十二項具體實施例中，本發明係關於一種預防、調制或治療高血壓之進展或展開之方法，其包括對需要預防、調制或治療之哺乳動物病患例如人類病患投予治療上有效量之本發明化合物，單獨或視情況併用本發明之另一種化合物及/或至少一種其他類型之治療劑。

在第五十三項具體實施例中，本發明係關於經調配之產物，其中經選擇之配方係藉由將(a)式I或IA化合物(使用上文列示之任何化合物具體實施例)與(b)二肽基肽酶-IV(DPP4)抑制劑(例如選自沙克沙葛菌素(saxagliptin)、西塔葛菌

素 (sitagliptin)、威達葛菌素 (vildagliptin) 及阿洛葛菌素 (alogliptin) 之成員) 合併而製成。

本發明可在未偏離其精神或基本特質下，以其他特定形式具體表現。本發明亦涵蓋本文所指出本發明替代方面之所有組合。應明瞭的是，本發明之任何與所有具體實施例均可搭配任何其他具體實施例一起採用，以描述本發明之其他具體實施例。再者，一項具體實施例之任何要件，可與得自任何具體實施例之任何及所有其他要件合併，以描述另外之具體實施例。

定義

本文所述之化合物可具有不對稱中心。含有不對稱取代原子之本發明化合物，可以光學活性或外消旋形式被單離。此項技藝中習知如何製備光學活性形式，譬如藉由外消旋形式之解析，或藉由從光學活性起始物質合成。烯烴、C=N 雙鍵等之許多幾何異構物亦可存在於本文所述之化合物中，且所有此種安定異構物均意欲被涵蓋在本發明中。本發明化合物之順式與反式幾何異構物係經描述，且可被單離成異構物之混合物或經分離之異構形式。一種結構之所有對掌性、非對映異構性、外消旋形式及所有幾何異構形式，均為所意欲的，除非明確指示特定立體化學或異構形式。

式 I 或式 IA 化合物之一種對掌異構物，與另一種比較，可顯示優越活性。因此，所有立體化學係被認為是本發明之一部份。當需要時，外消旋物質之分離可藉由高性能液相

層析法(HPLC)，使用對掌性管柱，或藉由解析，使用解析劑，譬如氯化樟腦磺醯達成，如在 Young, S.D. 等人，抗微生物劑與化學療法，2602-2605 (1995) 中。

就式 I 與 IA 化合物及其鹽可以其互變異構形式存在之範圍而論，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。

於本文中使用之"經取代"一詞，係意謂在所指定原子或環上之任一個或多個氫係被選自所指示之基團取代，其條件是不得超過所指定原子或環原子之正常價鍵，且此取代會造成安定化合物。當取代基為酮基(意即=O)時，則在原子上之2個氫係被置換。

當任何變數(例如 R_4) 在化合物之任何組成或化學式上發生超過一次時，其在每一存在處之定義，係與其在每一個其他存在處之定義無關。因此，例如，若一種基團被說明為被 $(R_4)_m$ 取代，且 m 為 0-3，則該基團可視情況被至高三個 R_4 基團取代，且 R_4 在每一存在處係獨立選自 R_4 之定義。而且，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。

當一個對取代基之鍵結，被顯示為越過一個連接環中之兩個原子之鍵結時，則此種取代基可被結合至環上之任何原子。當取代基經列示，而未顯示此種取代基被結合至所予化學式化合物之其餘部份所經由之原子時，則此種取代基可經由此種取代基中之任何原子結合。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。

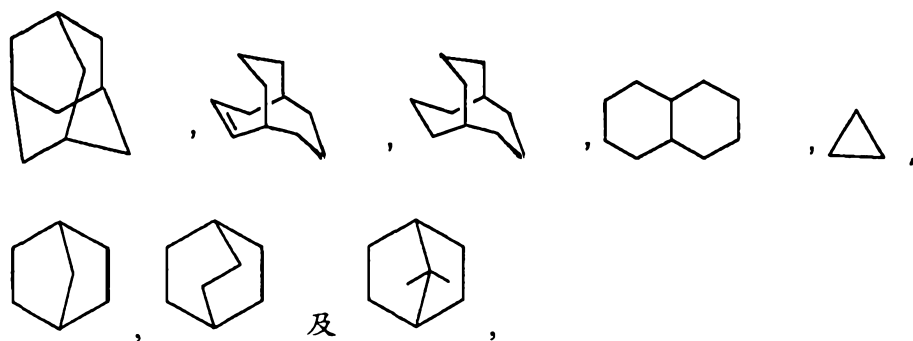
於本文中使用的"烷基"係意欲包括分枝狀與直鏈飽和脂族烴基兩者，含有1至20個碳，較佳為1至10個碳，更佳為1至8個碳，在正鏈中，譬如甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、第三-丁基、異丁基、戊基、己基、異己基、庚基、4,4-二甲基戊基、辛基、2,2,4-三甲基-戊基、壬基、癸基、十一基、十二基，其各種分枝鏈異構物等，而且此種基團可視情況包含1至4個取代基，譬如鹵基，例如F、Br、Cl或I，或CF₃、烷基、烷氧基、芳基、芳氧基、芳基(芳基)或二芳基、芳烷基、芳烷基氧基、烯基、環烷基、環烷基烷基、環烷基烷氧基、胺基、羥基、羥烷基、醯基、雜芳基、雜芳基氧基、雜芳烷基、雜芳基烷氧基、芳氧基烷基、烷硫基、芳烷基硫基、芳氧基芳基、烷基醯胺基、烷醯胺基、芳基羰基胺基、硝基、氰基、硫醇、鹵烷基、三鹵烷基及/或烷硫基。

除非另有指出，否則於本文中使用的"烯基"一詞，獨自或作為另一種基團之一部份，係指直鏈或分枝鏈基團，2至20個碳，較佳為2至12個碳，而更佳為2至8個碳在正鏈中，其包含一至六個雙鍵在正鏈中，譬如乙烯基、2-丙烯基、3-丁烯基、2-丁烯基、4-戊烯基、3-戊烯基、2-己烯基、3-己烯基、2-庚烯基、3-庚烯基、4-庚烯基、3-辛烯基、3-壬烯基、4-癸烯基、3-十一烯基、4-十二烯基、4,8,12-十四烷三烯基等，且其可視情況被1至4個取代基取代，意即鹵素、鹵烷基、烷基、烷氧基、烯基、炔基、芳基、芳烷基、環烷基、胺基、羥基、雜芳基、環雜烷基、烷醯胺基、烷基醯胺基、

芳基羰基-胺基、硝基、氰基、硫醇、烷硫基，及/或本文所提出之任何烷基取代基。

除非另有指出，否則於本文中使用的"炔基"一詞，獨自或作為另一種基團之一部份，係指直鏈或分枝鏈基團，2至20個碳，較佳為2至12個碳，而更佳為2至8個碳在正鏈中，其包含一個參鏈在正鏈中，譬如2-丙炔基、3-丁炔基、2-丁炔基、4-戊炔基、3-戊炔基、2-己炔基、3-己炔基、2-庚炔基、3-庚炔基、4-庚炔基、3-辛炔基、3-壬炔基、4-癸炔基、3-十一炔基、4-十二炔基等，且其可視情況被1至4個取代基取代，意即鹵素、鹵烷基、烷基、烷氧基、烯基、炔基、芳基、芳烷基、環烷基、胺基、雜芳基、環雜烷基、羥基、烷醯胺基、烷基醯胺基、芳基羰基胺基、硝基、氰基、硫醇及/或烷硫基，及/或本文所提出之任何烷基取代基。

除非另有指出，否則"環烷基"一詞當於本文中採用時，單獨或作為另一種基團之一部份，係包括飽和或部份不飽和(含有1或2個雙鍵)環狀烴基團，含有1至10個環，較佳為1至3個環，包括單環狀烷基、雙環狀烷基(或雙環烷基)及三環狀烷基，含有總計3至20個碳形成該環，較佳為3至15個碳，更佳為3至10個碳形成該環，且其可被稠合至1或2個如關於芳基所述之芳族環，環烷基包括環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、環辛基、環癸基、環十二基、環己烯基，



其中任一個基團可視情況被1至4個取代基取代，取代基譬如鹵素、烷基、烷氧基、羥基、芳基、芳氧基、芳烷基、環烷基、烷基醯胺基、烷醯胺基、酮基、醯基、芳基羰基、胺基、硝基、氰基、硫醇及/或烷硫基，及/或關於烷基之任何取代基。

在如上文定義之烷基具有供連接至其他基團之單鍵在兩個不同碳原子上之情況下，其係被稱為"次烷基"，且可視情況如上文關於"烷基"之定義經取代。

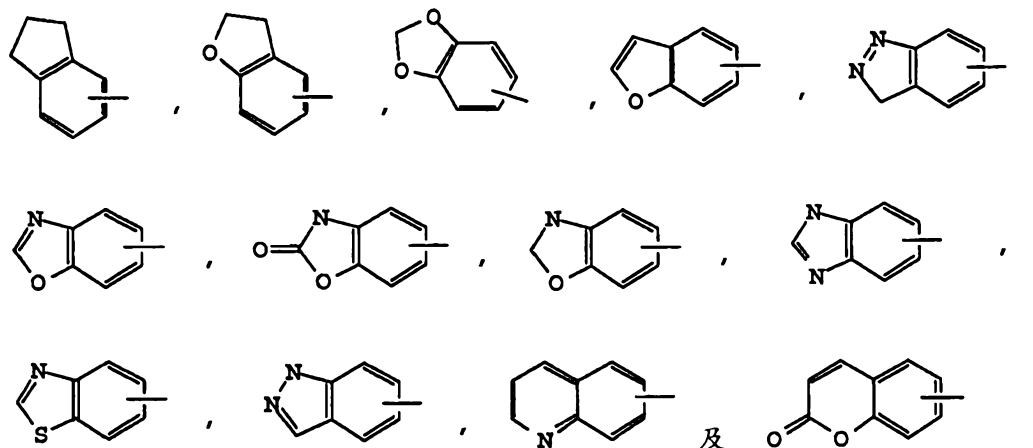
在如上文定義之烯基與如上文定義之炔基，個別具有供連接之單鍵在兩個不同碳原子上之情況下，其係個別被稱為"次烯基"與"次炔基"，且可視情況如上文關於"烯基"與"炔基"之定義經取代。

於本文中使用之"鹵基"或"鹵素"，係指氟基、氯基、溴基及碘基；且"鹵烷基"係意欲包括分枝狀與直鏈飽和脂族烴基兩者，例如 CF_3 ，具有所指定之碳原子數，被1或多個鹵素取代(例如 $-\text{C}_v\text{F}_w$ ，其中 $v = 1$ 至 3 ，且 $w = 1$ 至 $(2v+1)$)。

除非另有指出，否則"芳基"一詞當於本文中採用時，單獨或作為另一種基團之一部份，係指單環狀與雙環狀芳族基團，含有6至10個碳在環部份中(譬如苯基或萘基，包括

1-萘基與2-萘基)，且可視情況包含1至3個其他環，經稠合至碳環或雜環(譬如芳基、環烷基、雜芳基或環雜烷基環，

例如



且可視情況經過可採用之碳原子，被1, 2或3個取代基取代，例如氫、鹵基、鹵烷基、烷基、鹵烷基、烷氧基、鹵烷氧基、烯基、三氟甲基三氟甲氧基、炔基、環烷基-烷基、環雜烷基、環雜烷基烷基、芳基、雜芳基、芳烷基、芳氧基、芳氧基烷基、芳基烷氧基、芳基硫芳基偶氮基雜芳烷基、雜芳基烯基、雜芳基雜芳基、雜芳基氧基、羥基、硝基、氰基、胺基，經取代之胺基，其中胺基包含1或2個取代基(其係為烷基、芳基，或定義中所提及之任何其他芳基化合物)，硫醇、烷硫基、芳基硫基、雜芳基硫基、芳基硫基烷基、烷氧基芳基硫基、烷羰基、芳基羰基、烷胺基羰基、芳胺基羰基、烷氧羰基、胺基羰基、烷羰基氧基、芳基羰基氧基、烷羰基胺基、芳基羰基胺基、芳基亞磺醯基、芳基亞磺醯基烷基、芳基磺醯基胺基或芳基磺基胺基羰基，及/或本文所提出之任何烷基取代基。

除非另有指出，否則"低碳烷氧基"、"烷氧基"、"芳氧

基"或"芳烷氧基"術語，當於本文中採用時，單獨或作為另一種基團之一部份，係包括經連結至氧原子之任何上述烷基、芳烷基或芳基。

除非另有指出，否則"胺基"一詞當於本文中採用時，單獨或作為另一種基團之一部份，係指可被一或兩個取代基取代之胺基，該取代基可為相同或不同，譬如烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、環雜烷基、環雜烷基烷基、環烷基、環烷基烷基、鹵烷基、羥烷基、烷氧烷基或硫基烷基。此外，胺基取代基可與彼等所連接之氮原子一起採用，以形成1-四氫吡咯基、1-六氫吡啶基、1-一氮七園烯基、4-嗎福啉基、4-硫基嗎福啉基、1-六氫吡啶基、4-烷基-1-六氫吡啶基、4-芳烷基-1-六氫吡啶基、4-二芳基烷基-1-六氫吡啶基、1-四氫吡咯基、1-六氫吡啶基或1-一氮七園烯基，視情況被烷基、烷氧基、烷硫基、鹵基、三氟甲基或羥基取代。

除非另有指出，否則"低碳烷硫基"、"烷硫基"、"芳基硫基"或"芳烷硫基"術語，當於本文中採用時，單獨或作為另一種基團之一部份，係包括經連結至硫原子之任何上述烷基、芳烷基或芳基。

除非另有指出，否則"低碳烷胺基"、"烷胺基"、"芳胺基"或"芳烷基胺基"術語，當於本文中採用時，單獨或作為另一種基團之一部份，係包括經連結至氮原子之任何上述烷基、芳基或芳烷基。

於本文中使用之"雜環基"或"雜環系統"術語，係意謂安定4-至14-員單環狀、雙環狀或三環狀雜環，其係為飽和或

部份不飽和，且其包含碳原子與1, 2, 3或4個雜原子，獨立選自包括N、NH、O及S，及包括任何雙環狀基團，其中任何上文定義之雜環係稠合至苯環。氮與硫雜原子可視情況被氧化。雜環可在會造成安定結構之任何雜原子或碳原子處，連接至其懸垂基團。本文中所述之雜環可在碳上或在氮原子上經取代，若所形成之化合物係為安定時。若明確指出，則在雜環中之氮可視情況被四級化。較佳的是，當S與O原子在雜環中之總數超過1時，則此等雜原子係彼此不相鄰。

雜環之實例包括但不限於四氫吡咯酮基、4-六氫吡啶酮基、吡嗪基、十氫喹啉基、二氫呋喃并[2,3-b]四氫呋喃、二氫吲哚基、異吡嗪基、異吲哚啉基八氫異喹啉基、六氫吡啶基、六氫吡啶酮基、4-六氫吡啶酮基、四氫呋喃基、四氫異喹啉基、四氫喹啉基、嗎福啉基、二氫呋喃基、四氫硫苯基、哌喃基、二氫哌喃基、1,4-二氧陸園基及1,3-二氧陸園基。亦被包含者為稠合環與螺狀化合物，含有例如上述雜環。

於本文中使用之"芳族雜環狀系統"或"雜芳基"術語，係意謂安定5-至7-員單環狀或雙環狀或7-至10-員雙環雜環族芳族環，其包含碳原子與1至4個獨立選自包括N、O及S之雜原子，且在本性上為芳族。

雜芳基之實例為1H-吲唑、2H,6H-1,5,2-二噻吡基、吲哚基、4aH-呋唑、4H-噻吡基、6H-1,2,5-噻二吡基、吡啶基、一氮八園烯基、苯并咪唑基、苯并呋喃基、苯并硫代呋喃基、苯

并硫苯基、苯并呋唑基、苯并噻唑基、苯并三唑基、苯并四唑基、苯并異呋唑基、苯并異噻唑基、苯并咪唑酮基、呋唑基、4aH-呋唑基、 β -呋啉基、吡基、吡烯基、吡啉基、十氫喹啉基、2H,6H-1,5,2-二噻吡基、二氫呋喃并[2,3-b]四氫呋喃、呋喃基、呋啉基、四氫咪唑基、二氫咪唑基、咪唑基、吡唑基、吡啉烯基、二氫吡啉基、吡吡基、吡啉基、異苯并呋喃基、異吡基、異吡唑基、異吡啉基、異吡啉基、異喹啉基(苯并咪唑基)、異噻唑基、異呋唑基、嗎福啉基、哌啶基、八氫異喹啉基、呋二唑基、1,2,3-呋二唑基、1,2,4-呋二唑基、1,2,5-呋二唑基、1,3,4-呋二唑基、四氫呋唑基、呋唑基、四氫呋唑基哌啶基、啡啶基、啡啉基、啡吡基、啡吡基、啡噻吡基、苯氧硫陸圓烯基、啡呋吡基、呋吡基、六氫吡吡基、六氫吡啶基、喋啶基、喋啶基、嘌呤基、哌喃基、吡吡基、四氫吡唑基、二氫吡唑基、吡唑基、吡唑并三吡基、嗒吡基、吡啶呋唑、吡啶并咪唑、吡啶噻唑、吡啶基、吡啶基、嘧啶基、四氫吡咯基、喹啉基、喹啉基、4H-喹吡基、喹啉基、吡啶基、呋啉基、6H-1,2,5-噻二吡基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、噻噁基、噻唑基、噻吩基、噻吩噻唑基、噻吩呋唑基、噻吩咪唑基、硫苯基、三吡基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、1,2,5-三唑基、1,3,4-三唑基、四唑基及吡基。於本發明之另一方面，雜芳基之實例為吡啉基、苯并咪唑基、苯并呋喃基、苯并硫代呋喃基、苯并呋唑基、苯并噻唑基、苯并三唑基、苯并四唑基、苯并異呋唑基、苯并異噻唑基、

苯并咪唑酮基、噁啉基、呋喃基、咪唑基、吡啶基、吡嗪基、異噁啉基、異噻唑基、異噁唑基、噁唑基、吡嗪基、吡啶并三吡嗪基、噁吡嗪基、吡啶基、吡啶基、嘧啶基、吡咯基、噻唑啉基、噻啉基、噻唑基、噻吩基及四唑基。

於本文中使用的"雜環基烷基"一詞，單獨或作為另一種基團之一部份，係指如上文定義之雜環基，經過C原子或雜原子連結至烷基鏈。

於本文中使用的"雜芳烷基"或"雜芳基烯基"術語，單獨或作為另一種基團之一部份，係指如上文定義之雜芳基，經過C原子或雜原子連結至如上文定義之烷基鏈、次烷基或次烯基。

於本文中使用的"氰基"一詞，係指-CN基團。

於本文中使用的"硝基"一詞，係指-NO₂基團。

於本文中使用的"羥基"一詞，係指-OH基團。

於本文中係採用措辭"藥學上可接受"，以指此等化合物、物質、組合物及/或劑型，其係為在安全可靠醫學判斷之範圍內適用於與人類及動物之組織接觸，而無過度毒性、刺激性、過敏性回應或其他問題或併發症，伴隨著合理利益/風險比。

於本文中使用的"藥學上可接受之鹽"係指所揭示化合物之衍生物，其中母體化合物係經由製造其酸或鹼鹽而被改質。藥學上可接受鹽之實例，包括但不限於鹼性殘基譬如胺類之礦酸或有機酸鹽；酸性殘基譬如羧酸類之鹼或有機

鹽等。藥學上可接受之鹽，包括例如自無毒性無機或有機酸類所形成之母體化合物之習用無毒性鹽或四級銨鹽。例如，此種習用無毒性鹽係包括衍生自無機酸者，該無機酸譬如鹽酸、氫溴酸、硫酸、胺基磺酸、磷酸、硝酸等；及製自有機酸類之鹽，該有機酸譬如醋酸、丙酸、琥珀酸、乙醇酸、硬脂酸、乳酸、蘋果酸、酒石酸、檸檬酸、抗壞血酸、雙羥萘酸、順丁烯二酸、羥基順丁烯二酸、苯基醋酸、麩胺酸、苯甲酸、柳酸、磺胺酸、2-乙醯氧基苯甲酸、反丁烯二酸、甲苯磺酸、甲烷磺酸、乙烷二磺酸、草酸、羥乙磺酸等。

本發明之藥學上可接受鹽可自含有鹼性或酸性部份之母體化合物，藉習用化學方法合成而得。一般而言，此種鹽可經由使此等化合物之自由態酸或鹼形式與化學計量之適當鹼或酸，在水中或在有機溶劑中或在此兩者之混合物中反應而製成；一般而言，非水性媒質，例如醚、醋酸乙酯、乙醇、異丙醇或乙腈係為較佳。適當鹽之清單可參閱 **Remington 氏醫藥科學**，第 17 版，Mack 出版公司，Easton, PA，第 1418 頁 (1985)，其揭示內容係據此併於本文供參考。

可於活體內被轉化以提供生物活性劑(意即式 I 或 IA 化合物)之任何化合物，係為在本發明範圍與精神內之前體藥物。

"前體藥物"一詞，當於本文中採用時，係包括酯類與碳酸酯類，其係經由使式 I 或 IA 化合物之一或多個羥基與烷基、烷氧基或芳基取代之醯化劑反應，採用熟諳此藝者已

知之程序而形成，以產生醋酸酯、三甲基醋酸酯、甲基碳酸酯、苯甲酸酯等。

各種形式之前體藥物係為此項技藝中所習知，且係被描述於：

- a) 醫藥化學實務，Camille G. Wermuth 等人，第 31 章(大學出版社, 1996)；
- b) 前體藥物之設計，由 H. Bundgaard 編著 (Elsevier, 1985)；
- c) 藥物設計與發展之教科書，P. Krogsgaard-Larson 與 H. Bundgaard 編著，第 5 章，第 113-191 頁 (Harwood 大學出版社，1991)；及
- d) 藥物之水解作用與前體藥物新陳代謝作用，Bernard Testa 與 Joachim M. Mayer, (Wiley-VCH, 2003)。

該參考資料均併於本文供參考，特別是關於前體藥物之描述。

此外，式 I 與 IA 化合物，於其製備之後，較佳係經單離與純化，以獲得一種組成物，其含有一數量，以重量計，等於或大於 99% 之式 I 或 IA 化合物("實質上純"化合物)，然後按本文中所述使用或調配。此種"實質上純"之式 I 與 IA 化合物亦意欲被涵蓋於本文中作為本發明之一部份。

本發明化合物之所有立體異構物均意欲涵蓋在內，無論是呈互混物或呈純或實質純式。本發明化合物可具有不對稱中心，在任何碳原子處，包括任一個 R 取代基，及/或顯示多晶型現象。因此，式 I 與 IA 化合物可以對掌異構或非對映異構形式，或以其混合物存在。製備方法可利用外消旋

物、對掌異構物或非對映異構物作為起始物質。當製備非對映異構或對掌異構產物時，可將其藉習用方法分離，例如層析或分級結晶。

"安定化合物"與"安定結構"係意欲表示一種化合物，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。本發明係意欲具體化表現安定化合物。

"治療上有效量"係意欲包括單獨本發明化合物之量，或所請求化合物之組合之量，或本發明化合物併用其他活性成份之量，有效調制 GPR119 或有效治療或預防各種病症。

於本文中使用的"進行治療"或"治療作業"係涵蓋在哺乳動物中，特別是在人類中之疾病狀態之治療，且包括：
(a) 預防疾病狀態發生於哺乳動物中，特別是當此種哺乳動物易罹患該疾病狀態，但尚未被診斷為具有該疾病時；
(b) 調制該疾病狀態，意即遏制其發展；及/或
(c) 減輕該疾病狀態，意即造成該疾病狀態之退化。

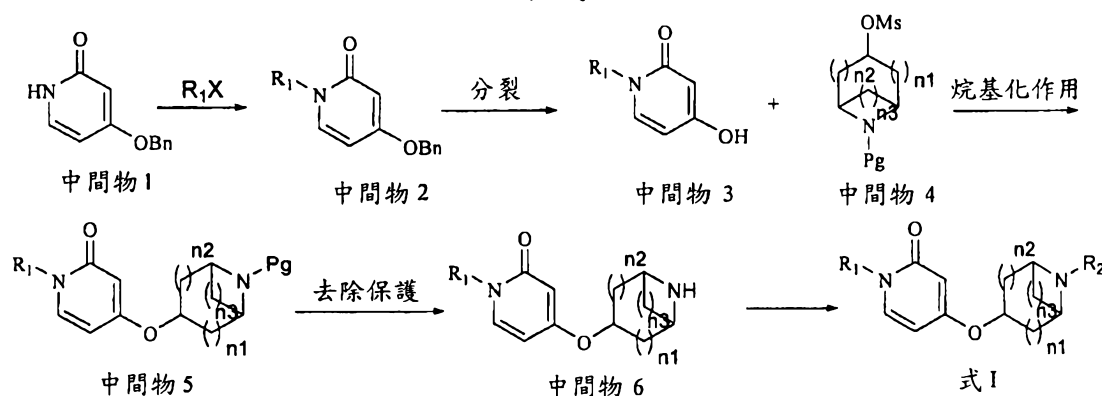
合成

本發明之化合物可以熟諳有機合成技藝者所習知之多種方式製備。本發明之化合物可使用下文所述之方法，以及合成有機化學技藝中已知之合成方法，或如熟諳此藝者所明瞭之其變型合成。較佳方法包括但不限於下文所述者。本文中所引用之所有參考資料均據此以其全文併於本文供參考。

新穎式 I 與 IA 化合物可使用此段落中所述之反應與技術製備。反應係在適合所採用試劑與物質之溶劑中進行，且

適用於欲被達成之轉變。而且，在下文所述合成方法之說明中，應明瞭的是，所有提出之反應條件，包括溶劑、反應大氣、反應溫度、實驗期間及處理程序，均經選擇為對該反應標準之條件，其應易被熟諳此藝者所明瞭。熟諳有機合成技藝者明瞭存在於所詔告分子不同部份上之官能基，必須可與所提出之試劑及反應相容。並非所有落在特定種類中之式I與IA化合物均可與一些所述方法中所需要之一些反應條件相容。此種對於可與反應條件相容取代基之限制，係為熟諳此藝者可容易地明瞭的，且必須使用替代方法。

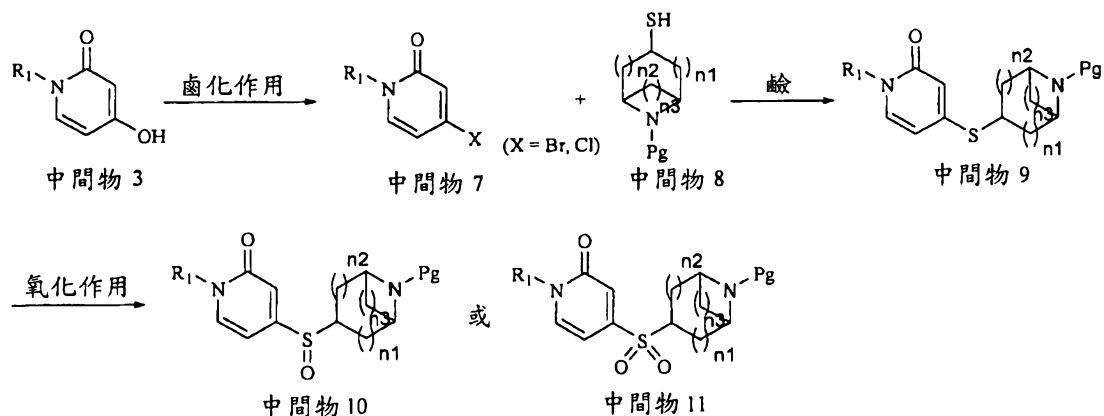
圖式 1



式 I 與 IA 化合物可藉由圖式 1 中所描繪之程序製備。可使自商業來源之中間物 1，與 R_1X (其中不為 H 之 R_1 係如關於式 I 與 IA 所定義，且 X 為鹵化物)，於配位體譬如 8-羥基喹啉、CuI (I) 及鹼譬如 K_2CO_3 存在下，在適當溶劑中，譬如 DMF、DMSO 等，於高溫下反應，而產生中間物 2。中間物 2 之苄基之分裂可使用此項技藝中已知之方法進行，譬如藉由鈀所催化之氫解作用。然後，可使中間物 3 以中間物 4 烷基化，該中間物 4 可經由相應醇類，與氯化甲烷磺醯，於鹼

譬如 K_2CO_3 存在下，在高溫下反應而製成。上述醇類係為市購可得，或可藉由熟諳此藝者所習知之許多方法製成(典型實例可參閱 Sandler, S. 等人，有機官能基製備，第 I 卷，大學出版公司發行(1983))。中間物 5 之保護基之移除可使用熟諳此藝者所習知之適當試劑進行(關於特定細節，參閱 Greene 等人，有機合成上之保護基，John Wiley & Sons 公司發行(1991))。接著，可將經去除保護之產物以 R_2X (其中 R_2 係如式 I 與 IA 中之定義，且 X 為脫離基，譬如鹵化物、甲烷磺酸鹽、三氟甲烷磺酸鹽等)處理，其係為市購可得，或可藉由此項技藝中已知之許多方法，在對熟諳有機合成技藝者為例行之許多條件下製成，而得式 I 與 IA 化合物。或者，亦可使中間物 6 與異氰酸酯或異硫氰酸酯，於鹼譬如 Et_3N 存在下反應，以提供式 I 與 IA 化合物。

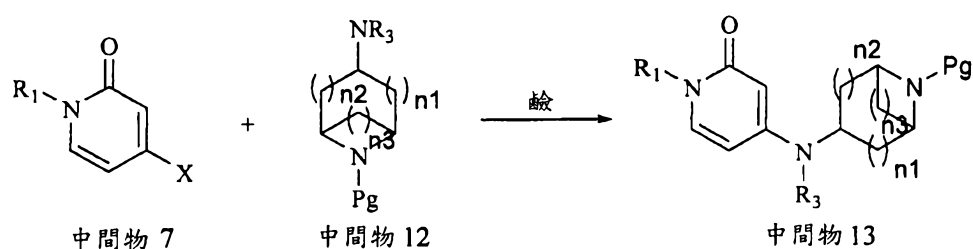
圖式 2



式 I 與 IA 化合物，其中 Y 係被定義為 S、 $S(=O)$ 或 $S(O)_2$ ，可藉由圖式 2 中所概述之程序製備。按圖式 I 中所述產生之中間物 3 之鹵化作用可以 $POBr_3$ 、 PBr_3 或 $POCl_3$ ，使用熟諳此藝者所已知之條件達成。然後，可使鹵化吡啶酮與中間物 8 反應，該中間物 8 可根據美國專利 6,556,384 B1 (Owen, D. 等人)

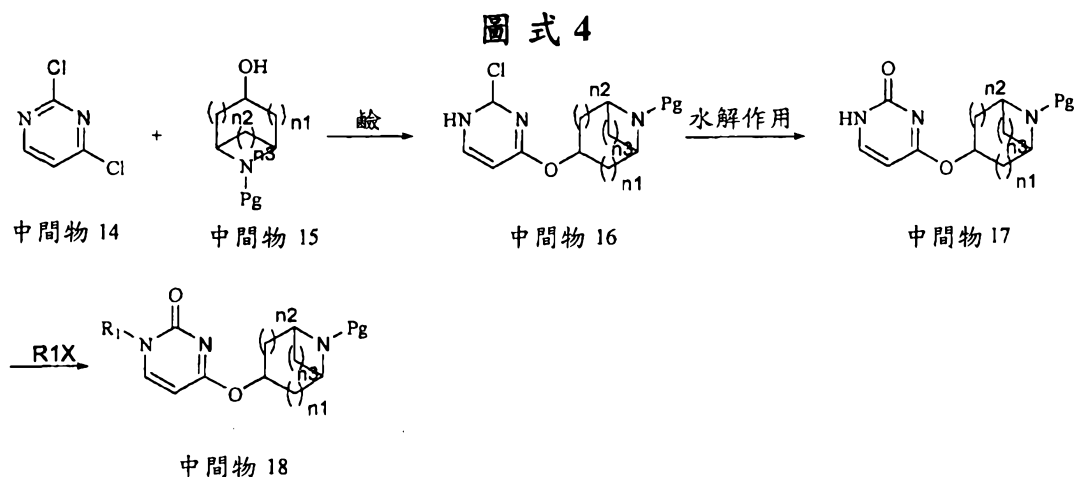
中所述之程序製成，關於此等製備均併於本文供參考，於鹼譬如 NaH 存在下，產生中間物 9。中間物 9，以氧化劑，譬如 mCPBA，在適當溶劑譬如 CH_2Cl_2 中之氧化作用，係獲得中間物 10 與中間物 11。中間物 9、中間物 10 或中間物 11 可被推進至式 I 與 IA 化合物，按照上文圖式 1 中所述之程序，以中間物 9、10 或 11 取代中間物 5。

圖式 3

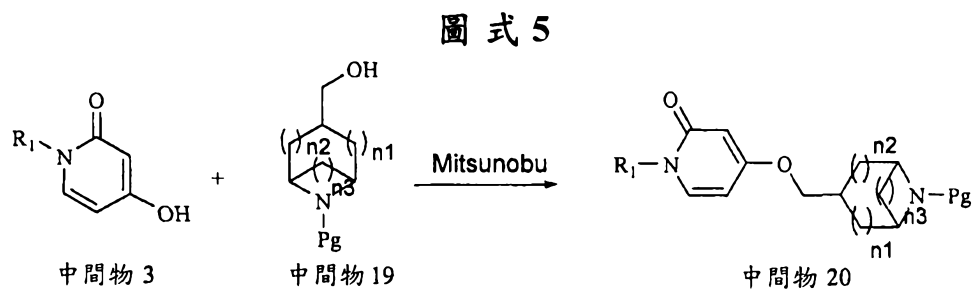


式 I 與 IA 化合物，其中 Y 係被定義為 NR_3 ，可藉由圖式 3 中所示之程序製備。可使如圖式 II 中所述製成之中間物 7 與中間物 12 反應，該中間物 12 係為市購可得，或可藉由熟諳此藝者已知之方法，於觸媒譬如 $\text{Pd}(\text{P}(\text{tBu})_3)_2$ ，與鹼譬如 NaOtBu 存在下，在適當溶劑譬如甲苯中製成，而產生中間物 13。然後，可將產物進一步精巧地製成式 I 與 IA 化合物，使用上文圖式 1 中所述之程序，以中間物 13 取代中間物 5。

或者，式 I 與 IA 化合物，其中 Y 係被定義為 NR_3 ，亦可藉由類似圖式 3 中所提供之程序製成。此等本發明化合物可替代地藉由式 I 與 IA 化合物，其中 $\text{R}_3 = \text{H}$ ，以適當親電子劑 R_3X (其中 X 為鹵化物、甲烷磺酸鹽、三氟甲烷磺酸鹽等)，於鹼譬如 K_2CO_3 、 CsCO_3 、NaOtBu 等存在下處理而獲得。

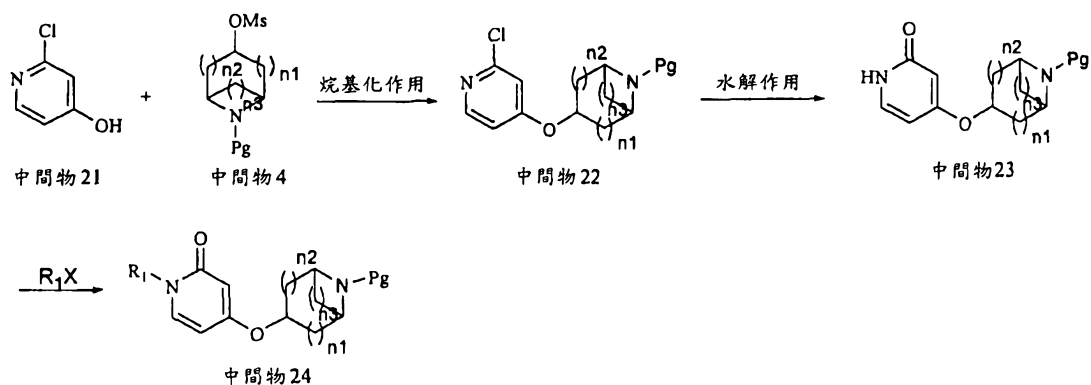


或者，式 I 與 IA 化合物可藉由圖式 4 中所概述之程序合成。可使得自商業來源之中間物 14，與中間物 15，其係為市購可得，或可藉由熟諳此藝者所易於明瞭之許多方法產生(典型實例可參閱 Sandler, S. 等人，有機官能基製備，第 I 卷，大學出版公司發行(1983))，於鹼譬如 NaH 存在下反應，而產生中間物 16。中間物 16 之水解作用可經由以 DABCO，於鹼譬如 K_2CO_3 存在下，在二氧陸園/水中，於高溫下處理而達成。然後，可使中間物 17 與 R_1X (其中 R_1 係關於式 I 或 IA 所定義，且 X 為鹵化物)，於配位體譬如 8-羥基喹啉、CuI (I) 及鹼譬如 K_2CO_3 存在下，在適當溶劑中，譬如 DMF、DMSO 等，於高溫下反應，而產生中間物 18。中間物 18 可被推進至式 I 與 IA 化合物，按照上文圖式 1 中所述之程序，以中間物 18 取代中間物 5。



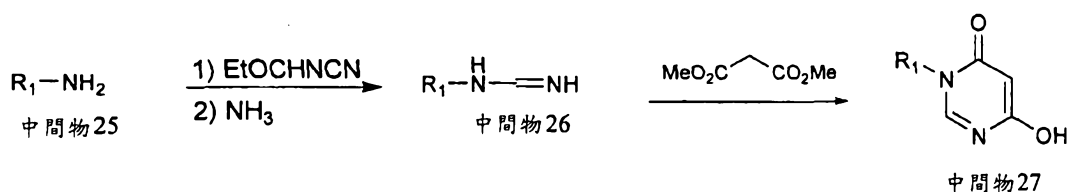
式I與IA化合物可藉由圖式5中所示之程序製備。可使如圖式I中所述產生之中間物3，與中間物19，其係為市購可得，或可藉由熟諳此藝者所易於明瞭之許多方法製成(典型實例可參閱Sandler, S.等人，有機官能基製備，第I卷，大學出版公司發行(1983))，經由Mitsunobo反應法進行反應，而產生中間物20，其可被轉化成式I或IA，使用上文在圖式1中所述之程序，以中間物20取代中間物5。

圖式6



或者，式I與IA化合物可如圖式6中所提供之方式合成。可使得自商業來源之中間物21與按圖式I中所述製成之中間物4反應，而得中間物22。中間物22之水解作用可經由以DABCO，於鹼譬如 K_2CO_3 存在下，在二氧陸園/水中，於高溫下處理而達成。可將中間物23，以 R_1X (其中 R_1 係關於式I或IA所定義，且X為鹵化物)，於配位體譬如8-羥基喹啉、CuI (I)及鹼譬如 K_2CO_3 存在下，在適當溶劑中，譬如DMF、DMSO等，於高溫下處理，而產生中間物24。中間物24可被推進至式I與IA化合物，按照上文圖式1中所述之程序，以中間物24取代中間物5。

圖式 7



式 I 與 IA 化合物亦可藉由圖式 7 中所示之程序製成。中間物 25 ($\text{R}_1\text{-NH}_2$ ，其中 R_1 係如式 I 與 IA 中之定義)，其係為市購可得，或可藉由熟諳此藝者所明瞭之方法製成，可在由 Donetti, A 等人 (*J. Med. Chem.*, 27: 380 (1984)) 所述之兩步驟程序中，被轉化成甲脒中間物 26。可使中間物 26 與丙二酸二甲酯反應，而產生中間物 27，使用文獻程序 (*J. Med. Chem.*, 45: 3639 (2002))。然後，中間物 27 可被推進至式 I 與 IA 化合物，按照上文圖式 1 中所述之程序，以中間物 28 取代中間物 3。

縮寫

下列縮寫係被採用於實例及本文別處：

EtOAc = 醋酸乙酯

DMF = 二甲基甲醯胺

THF = 四氫呋喃

K_2CO_3 = 碳酸鉀

Na_2CO_3 = 碳酸鈉

MgSO_4 = 硫酸鎂

SiO_2 = 二氧化矽

CH_2Cl_2 = 二氯甲烷

MeOH = 甲醇

HCl = 鹽酸

Cs_2CO_3 = 碳酸鈉

KOH = 氫氧化鉀

DME = 1,2-二甲氧基乙烷

$\text{Pd}(\text{dppf})\text{Cl}_2$ = [1,1'-雙(二苯基膦基)二環戊二烯鐵]二氯化鈀(II)

t-BuONa = 第三-丁醇鈉

$\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ = 參(二苯亞甲基丙酮)二鈀(0)

TFA = 三氟醋酸

BINAP = 外消旋-2,2'-雙(二苯基膦基)-1,1'-聯萘

DABCO = 1,4-二氮雙環并[2.2.0]辛烷

mCPBA = 間-氯基過氧苯甲酸

min = 分鐘

h 或 hr = 小時

mL 或 ml = 毫升

g = 克

mg = 毫克

mmol = 毫莫耳

LRMS = 低解析質量光譜法

NMR = 核磁共振

【實施方式】

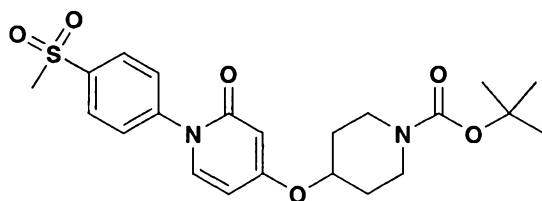
實例

下述實例係以說明例提出，作為本發明之部份範圍與特定具體實施例，而非意欲為本發明範圍之限制。縮寫與化學符號具有其一般與習用意義，除非另有指出。除非另有指出，否則本文中所述之化合物已使用本文中所揭示之圖

式及其他方法製成、單離及特徵鑒定，或可使用相同者製成。

實例 1

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備



步驟 A. 4-(苄氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備

將 4-苄氧基-2(1H)-吡啶酮 (6.87 克，34.1 毫莫耳，Aldrich)、4-溴苯基甲基磺 (8.01 克，34.1 毫莫耳，Combi-Blocks 公司)、碘化銅 (I) (1.30 克，6.82 毫莫耳，Aldrich)、8-羥基喹啉 (0.99 克，6.82 毫莫耳，Alfa Aesar) 及碳酸鉀 (6.12 克，44.3 毫莫耳，EMD) 在 DMSO (100 毫升) 中之混合物於 145°C 下加熱 6 小時，冷卻至室溫，然後以 10% NH₄OH 水溶液 (50 毫升) 與 EtOAc (100 毫升) 稀釋。過濾所形成之混合物，並以 H₂O 與 EtOAc 洗滌固體，獲得 8.0 克粗產物，為綠色固體。MS (ESI) 356 (M+H).

步驟 B. 4-羥基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備

將 4-(苄氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮 (3.0 克，8.44 毫莫耳) 與鈰/活性碳 (1.63 克，10 重量%，潮濕，Aldrich) 在 THF (150 毫升) 與甲醇 (250 毫升) 中之正在攪拌懸浮液，於氫 (氣瓶) 下放置 1 小時。將所形成之混合物以氫滌氣，然後以 THF (150 毫升) 與甲醇 (50 毫升) 稀釋。在氫氣下攪拌 30 分鐘後，使混合物經過 Celite® 545 助濾劑之墊片過濾，並於減壓下蒸

發濾液，獲得 2.28 克粗產物，為暗綠色固體。MS (ESI) 266 (M+H).

步驟 C. 4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備

於 4-羥基-1-六氫吡啶羧酸第三-丁酯 (10.28 克，51.08 毫莫耳，Aldrich) 與 Et_3N (14.25 毫升，102.16 毫莫耳，EMD) 在 CH_2Cl_2 (300 毫升) 中之正在攪拌溶液內，在室溫下，逐滴添加氯化甲烷磺醯 (4.35 毫升，56.19 毫莫耳，Aldrich)。將反應混合物於室溫下攪拌 4 小時，並以 0.1N HCl 水溶液、 H_2O 及鹽水洗滌。使有機層以 Na_2SO_4 脫水乾燥，及在真空中濃縮，產生 14.3 克粗產物，為淡橘色固體。

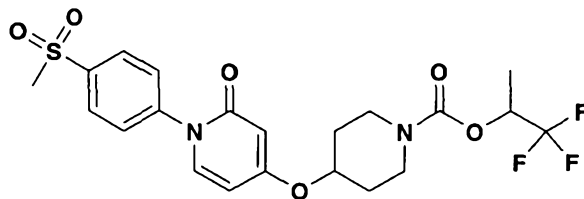
步驟 D. 實例 1

將 4-羥基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮 (2.27 克，8.55 毫莫耳)、4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯 (3.6 克，12.83 毫莫耳) 及碳酸鉀 (2.36 克，17.1 毫莫耳，EMD) 在 DMF (50 毫升) 中之正在攪拌混合物於 90°C 下加熱過夜，然後冷卻至室溫。將所形成之混合物以 EtOAc 與 H_2O 稀釋，並以 EtOAc 進一步萃取 (2x) 水層。將合併之萃液以 H_2O /鹽水 (1:1, 3x) 洗滌，脫水乾燥 (Na_2SO_4)，及蒸發。使殘留物藉急驟式層析純化 (0 至 10% MeOH/ CH_2Cl_2)，產生 2.57 克 (67%) 實例 1，為黃色固體。 ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 8.07 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.62 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.23 (d, $J=7.70$ Hz, 1H), 6.06 (dd, $J=7.42, 2.47$ Hz, 1H), 5.97 (d, $J=2.75$ Hz, 1H), 4.38-4.57 (m, 1H), 3.63-3.78 (m, 2H), 3.22-3.45 (m, 2H), 3.09 (s, 3H), 1.93-2.03 (m, 2H), 1.69-1.85 (m, 2H), 1.48 (s, 9H). MS (ESI) 449 (M+H).

實例 2

4-(1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)

六氫吡啶-1-羧酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯之製備



步驟 A. 1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽之製備

將 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯 (2.515 克, 5.61 毫莫耳) 與氯化氫 (4.0M, 在二氧陸園中, 35.0 毫升, Aldrich) 在甲醇 (45 毫升) 中之混合物攪拌 1 小時, 然後在真空中濃縮。使所獲得之固體溶於甲醇中, 及蒸發, 而得 2.28 克粗產物, 為暗黃色固體。MS (ESI) 349 (M+H).

步驟 B. 氟甲酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯之製備

於 1,1,1-三氟-2-丙醇 (114.1 毫克, 1.0 毫莫耳, Matrix Scientific) 與三光氣 (98 毫克, 0.33 毫莫耳, Aldrich) 在乙醚 (10 毫升) 中之混合物內, 在 -40°C 下, 逐滴添加乙醚 (1.0 毫升) 中之吡啶 (80 毫升, 1.0 毫莫耳, EMD)。使反應混合物溫熱至 0°C , 並攪拌 6 小時。將含有上述反應混合物之燒瓶放入冷藏室中過夜, 接著過濾。於冰浴中, 使濾液在真空中濃縮成無色油, 將其直接使用於下一步驟中。

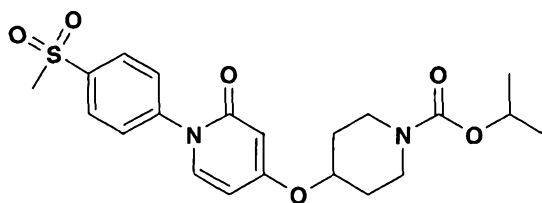
步驟 C. 實例 2

於 1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-

酮鹽酸鹽(30.8毫克, 0.08毫莫耳)在 CH_2Cl_2 中之懸浮液內, 添加二異丙基乙胺(70毫升, 0.40毫莫耳, Aldrich), 接著添加 CH_2Cl_2 (0.5毫升)中之氯甲酸1,1,1-三氟丙-2-基酯(1/3得自步驟B之物質, 0.33毫莫耳)。將反應混合物攪拌30分鐘, 然後在減壓下蒸發, 產生粗產物, 使其藉預備之HPLC純化(C_{18} 管柱; 10-100%乙腈在含有0.05%三氟醋酸之水中), 於凍乾時, 獲得實例2(16.8毫克, 灰白色固體, 43%)。 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ 8.07 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.59 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.25 (d, $J=7.70$, 1H), 6.03-6.22 (m, 2H), 5.17-5.36 (m, 1H), 4.57 (m, 1H), 3.64-3.85 (m, 2H), 3.37-3.56 (m, 2H), 3.10 (s, 3H), 1.95-2.08 (m, 2H), 1.76-1.93 (m, 2H), 1.42 (d, $J=6.60$ Hz, 3H). MS (ESI) 489 (M+H).

實例3

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備



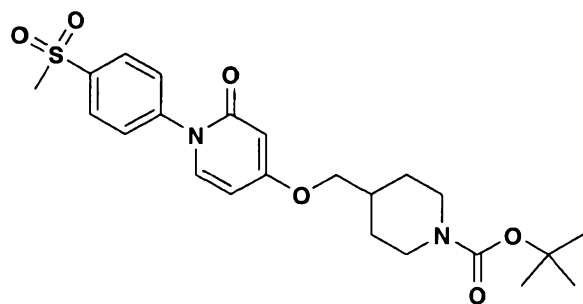
於4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯(53毫克, 0.118毫莫耳)在 CH_2Cl_2 (1.0毫升)中之溶液內, 逐滴添加TFA(0.5毫升)。將反應混合物攪拌1小時, 及在減壓下蒸發。然後, 使殘留物溶於 CH_2Cl_2 (1.5毫升)中, 接著添加 Et_3N (82毫升, 0.59毫莫耳)與氯甲酸異丙酯(0.295毫升, 0.295毫莫耳, Aldrich)。將所形成之混合物於室溫下攪拌30分鐘, 以 H_2O (0.2毫升)使反應淬滅, 然

後蒸發至乾涸。使粗產物藉預備之 HPLC 純化 (C_{18} 管柱；10-100% 甲醇在含有 0.05% 三氟醋酸之水中)，於凍乾時，獲得實例 3 (44.5 毫克，白色固體，87%)。 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ 8.09 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.61 (d, $J=8.25$ Hz, 2H), 7.30 (d, $J=7.70$ Hz, 1H), 6.28 (d, $J=2.20$ Hz, 1H), 6.19 (dd, $J=7.70, 2.20$ Hz, 1H), 4.86-5.00 (m, 1H), 4.51-4.63 (m, 1H), 3.77 (表觀寬廣 s, 2H), 3.33-3.44 (m, 2H), 3.11 (s, 3H), 1.96-2.11 (m, 2H), 1.73-1.86 (m, $J=7.15$ Hz, 2H), 1.26 (d, $J=6.05$ Hz, 6H). MS (ESI) 435 (M+H).

實例 4

4-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備

六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備



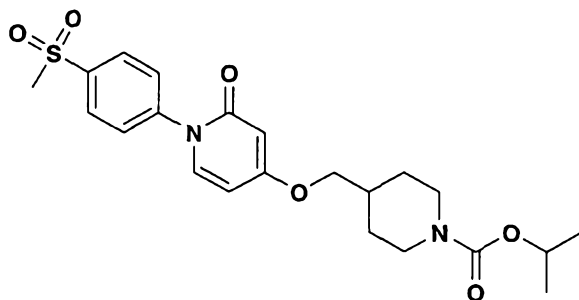
於三苯膦 (86.6 毫克，0.33 毫莫耳，Aldrich) 在 THF (1.5 毫升) 中之正在攪拌溶液內，添加 4-羥基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮 (39.8 毫克，0.15 毫莫耳)、N-Boc-4-六氫吡啶甲醇 (71.0 毫克，0.33 毫莫耳，Aldrich) 及偶氮二羧酸二異丙酯 (63.9 毫升，0.33 毫莫耳，Aldrich)。將反應混合物攪拌 1.5 小時，以甲醇 (1.5 毫升) 使反應淬滅，然後在減壓下蒸發。使殘留物藉急驟式層析純化 (0-100% EtOAc/己烷)，獲得 33 毫克 (48%) 實例 4，為白色固體。 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ 8.06 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.61 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.22 (d, $J=7.70$ Hz, 1H), 6.06 (dd, $J=7.70, 2.75$ Hz,

1H), 5.94 (d, J=2.20 Hz, 1H), 4.18 (表觀寬廣 s, 2H), 3.83 (d, J=6.05 Hz, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.75 (表觀寬廣 s, 2H), 1.91-2.09 (m, 1H), 1.71-1.85 (m, 2H), 1.47 (s, 9H), 1.19-1.38 (m, 2H). MS (ESI) 464 (M+H).

實例 5

4-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備

六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備

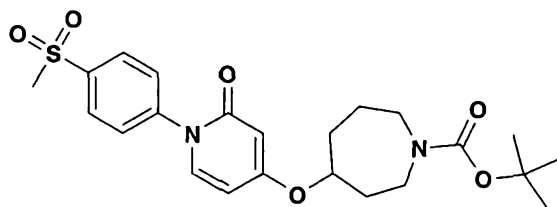


實例 5 係根據實例 3 中所述之程序，以 4-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.07 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.23 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.09 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 6.01 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.87-4.98 (m, 1H), 4.23 (表觀寬廣 s, 2H), 3.85 (d, J=6.05 Hz, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.79 (t, J=12.65 Hz, 2H), 1.87-2.06 (m, 1H), 1.76-1.87 (d, J=12.10 Hz, 2H), 1.18-1.37 (m, 6H), 1.25 (d, J=6.05 Hz, 6H). MS (ESI) 449 (M+H).

實例 6

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)一氮七

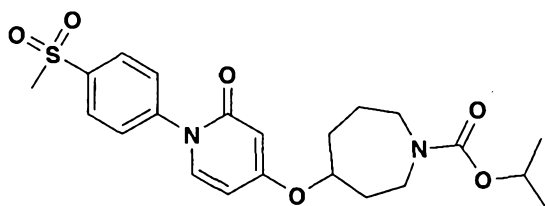
圓烷-1-羧酸第三-丁酯之製備



實例 6 係根據實例 1 中所述之程序，在步驟 C 中，以 4-羥基-1-氮七元環烷-1-羧酸第三-丁酯 (SynChem 公司) 取代 4-羥基-1,2-二氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.07 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.22 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.03 (d, J=7.70 Hz, 1H), 5.91 (s, 1H), 4.40-4.51 (m, 1H), 3.32-3.60 (m, 4H), 3.09 (s, 3H), 2.06-2.17 (m, 1H), 1.87-2.03 (m, 4H), 1.63-1.73 (m, 1H), 1.48 (s, 9H). MS (ESI) 463 (M+H).

實例 7

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-1-氮七元環烷-1-羧酸異丙酯之製備

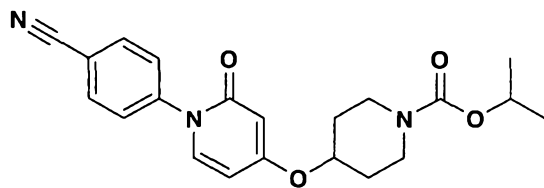


實例 7 係根據實例 3 中所述之程序，以 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-1-氮七元環烷-1-羧酸第三-丁酯取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.29 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.22 (s, 1H), 6.17 (d, J=7.70 Hz, 1H), 4.90-5.02 (m, 1H), 4.48-4.56 (m, 1H), 3.36-3.63 (m, 4H), 3.11 (s, 3H), 1.91-2.17 (m, 5H), 1.64-1.77 (m, 1H), 1.27 (d, J=6.05 Hz, 6H). MS (ESI) 449 (M+H).

實例 8

4-(1-(4-氰基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-

羧酸異丙酯之製備



步驟 A. 4-羥基吡啶-2(1H)-酮之製備

將 4-苄氧基-2(1H)-吡啶 (5.0 克, 24.85 毫莫耳, Aldrich) 與鈹 / 活性碳 (2.6 克, 10 重量%, 潮濕, Aldrich) 在甲醇 (200 毫升) 中之正在攪拌混合物於氫 (氣瓶) 下放置 2 小時。將所形成之混合物以氮滌氣, 然後以甲醇 (50 毫升) 與 CH_2Cl_2 (10 毫升) 稀釋。在氮氣下攪拌 30 分鐘後, 使混合物經過 Celite[®] 545 助濾劑之墊片過濾, 並在減壓下蒸發濾液, 獲得 2.73 克粗產物, 為淡橘色固體。

步驟 B. 4-(2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備

將 4-羥基吡啶-2(1H)-酮 (1.5 克, 13.5 毫莫耳)、4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯 (5.0 克, 18.9 毫莫耳, 根據實例 1 步驟 C 中所述之程序製成) 及碳酸鉀 (3.7 克, 27.0 毫莫耳, EMD) 在 DMF (80 毫升) 中之正在攪拌混合物於 140°C 下加熱 2 小時, 然後冷卻至室溫。將所形成之混合物以 EtOAc 與 H_2O 稀釋, 並以 EtOAc 進一步萃取 (7x) 水層。將合併之萃液以飽和 NH_4Cl 水溶液洗滌 (2x), 脫水乾燥 (Na_2SO_4), 及蒸發。使殘留物藉急驟式層析純化 (0 至 100% EtOAc/ 己烷, 接著為 5%

MeOH/CH₂Cl₂)，產生 1.67 克 (44%) 產物，為灰白色固體。MS (ESI) 281 (M+H).

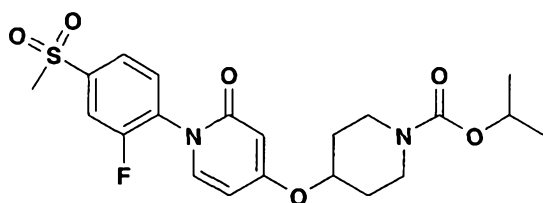
步驟 C. 實例 8

將 4-(2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯 (42 毫克，0.15 毫莫耳)、4-溴基苯甲腈 (27.3 毫克，0.15 毫莫耳，Aldrich)、碘化銅 (I) (5.7 毫克，0.03 毫莫耳，Aldrich)、8-羥基喹啉 (4.4 毫克，0.03 毫莫耳，Alfa Aesar) 及碳酸鉀 (26.9 毫克，0.195 毫莫耳，EMD) 在 DMSO (0.6 毫升) 中之混合物於微波條件 (160°C，30 分鐘) 下加熱，接著冷卻至室溫，最後藉預備之 HPLC 純化 (C₁₈ 管柱；0-100% 甲醇在含有 0.05% 三氟醋酸之水中)，於凍乾時，獲得實例 8 (23.1 毫克，灰白色固體，40%)。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 7.79 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.53 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.21 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.04 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 5.96 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.89-4.99 (m, 1H), 4.44-4.55 (m, 1H), 3.70-3.80 (m, 2H), 3.33-3.43 (m, 2H), 1.93-2.05 (m, 2H), 1.72-1.85 (m, 2H), 1.26 (d, J=6.05 Hz, 6H). MS (ESI) 382 (M+H).

實例 9

4-(1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)

六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備



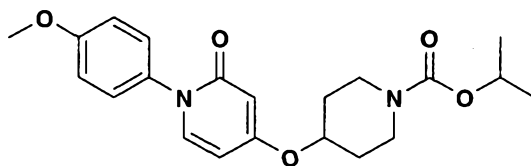
實例 9 係根據實例 8 中所述之程序，在步驟 C 中，以 1-溴基-2-氟基-4-(甲磺醯基)苯 (根據國際專利申請案編號 WO2004/

089885 中所述之程序製成) 取代 4-溴基苯甲腈而製成，惟將反應物於 180°C 下在微波中加熱 1 小時。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 7.84-7.89 (m, 2H), 7.62 (t, J=7.70 Hz, 1H), 7.17 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.11-6.20 (m, 2H), 4.88-5.01 (m, 1H), 4.47-4.61 (m, 1H), 3.70-3.83 (m, 2H), 3.35-3.48 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 1.96-2.06 (m, 2H), 1.73-1.86 (m, 2H), 1.26 (d, J=6.60 Hz, 6H). MS (ESI) 453 (M+H).

實例 10

4-(1-(4-甲氧基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-

羧酸異丙酯之製備

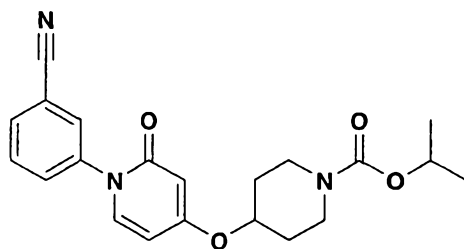


實例 10 係根據實例 8 中所述之程序，在步驟 C 中，以 1-溴基-4-甲氧基苯取代 4-溴基苯甲腈而製成。¹H NMR (500 MHz, CD₃OD) 7.50 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.26 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.04 (d, J=8.80 Hz, 2H), 6.21 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 6.04 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.82-4.92 (m, 1H), 4.64-4.74 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.69-3.80 (m, 2H), 3.36-3.45 (m, 2H), 1.96-2.07 (m, 2H), 1.68-1.79 (m, 2H), 1.26 (d, J=6.05 Hz, 6H). MS (ESI) 387 (M+H).

實例 11

4-(1-(3-氟基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-

羧酸異丙酯之製備

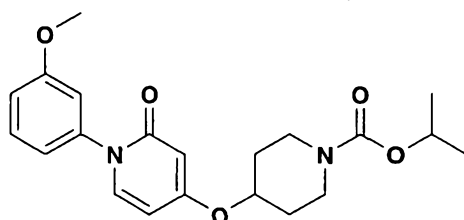


實例 11 係根據實例 8 中所述之程序，在步驟 C 中，以 3-溴基苯甲腈取代 4-溴基苯甲腈而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 7.56-7.81 (m, 4H), 7.26 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.26 (d, J=2.75 Hz, 1H), 6.16 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 4.89-5.05 (m, 1H), 4.50-4.62 (m, 1H), 3.77 (表觀寬廣 s, 2H), 3.33-3.47 (m, 2H), 1.93-2.09 (m, 2H), 1.74-1.85 (m, 2H), 1.26 (d, J=6.05 Hz, 6H). MS (ESI) 382 (M+H).

實例 12

4-(1-(3-甲氧基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-

羧酸異丙酯之製備

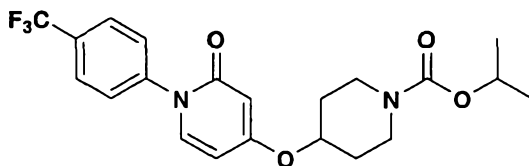


實例 12 係根據實例 8 中所述之程序，在步驟 C 中，以 1-溴基-3-甲氧基苯取代 4-溴基苯甲腈而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 7.39 (t, J=7.97 Hz, 1H), 7.33 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.98 (dd, J=8.25, 2.20 Hz, 1H), 6.91 (d, J=8.25 Hz, 1H), 6.89 (t, J=2.20 Hz, 1H), 6.41 (d, J=2.20 Hz, 1H), 6.16 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 4.89-4.98 (m, 1H), 4.51-4.60 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.77 (表觀寬廣 s, 2H), 3.33-3.44 (m, 2H), 1.96-2.06 (m, 2H), 1.79 (表觀寬廣 s, 2H), 1.26 (d, J=6.05 Hz, 6H). MS (ESI) 387 (M+H).

實例 13

4-(2-酮基-1-(4-(三氟甲基)苯基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡

啶-1-羧酸異丙酯之製備

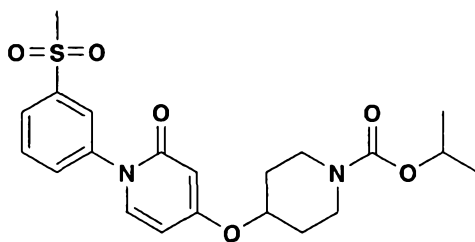


實例 13 係根據實例 8 中所述之程序，在步驟 C 中，以 1-溴基-4-(三氟甲基)苯取代 4-溴基苯甲腈而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 7.76 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.52 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.25 (d, J=7.1 Hz, 1H), 6.01-6.17 (m, 2H), 4.83-5.03 (m, 1H), 4.44-4.59 (m, 1H), 3.76 (表觀寬廣 s, 2H), 3.29-3.47 (m, 2H), 1.90-2.11 (m, 2H), 1.80 (表觀寬廣 s, 2H), 1.26 (d, J=6.05 Hz, 6H). MS (ESI) 425 (M+H).

實例 14

4-(1-(3-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡

啶-1-羧酸異丙酯之製備

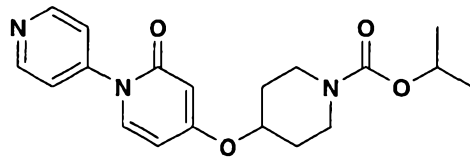


實例 14 係根據實例 8 中所述之程序，在步驟 C 中，以 1-溴基-3-(甲磺醯基)苯(可得自 Oakwood 產物公司)取代 4-溴基苯甲腈而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.01 (m, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.72 (m, 2H), 7.30 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.11-6.23 (m, 2H), 4.88-5.02 (m, 1H), 4.47-4.62 (m, 1H), 3.72-3.82 (m, 2H), 3.31-3.47 (m, 2H), 3.11 (s, 3H), 1.95-2.08 (m, 2H), 1.81 (表觀寬廣 s, 2H), 1.26 (d, J=6.60 Hz, 6H). MS (ESI) 435 (M+H).

實例 15

4-(2-酮基-1-(吡啶-4-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧

酸異丙酯, TFA 鹽之製備

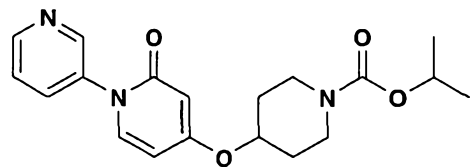


實例 15 係根據實例 8 中所述之程序，在步驟 C 中，以 4-溴基吡啶鹽酸鹽取代 4-溴基苯甲腈而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) 14.50 (寬廣 s, 2H), 8.34 (寬廣 s, 2H), δ 7.32 (d, J=7.15 Hz, 1H), 6.18 (d, J=7.15 Hz, 1H), 6.06 (s, 1H), 4.88-4.99 (m, 1H), 4.53 (表觀寬廣 s, 1H), 3.76 (表觀寬廣 s, 2H), 3.34-3.44 (m, 2H), 2.00 (表觀寬廣 s, 2H), 1.80 (表觀寬廣 s, 2H), 1.26 (d, J=6.05 Hz, 6H). MS (ESI) 358 (M+H).

實例 16

4-(2-酮基-1-(吡啶-3-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧

酸異丙酯之製備

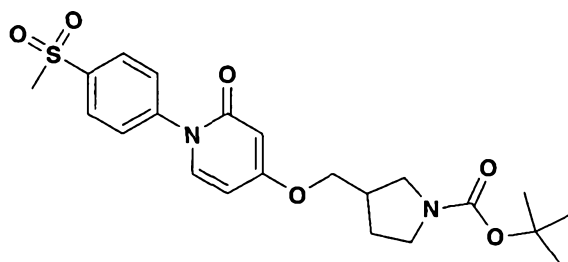


實例 16 係根據實例 8 中所述之程序，在步驟 C 中，以 3-溴基吡啶取代 4-溴基苯甲腈而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.74 (寬廣 s, 2H), 8.08 (d, J=8.25 Hz, 1H), 7.69 (寬廣 s, 1H), 7.29 (d, J=8.25 Hz, 1H), 6.13-6.18 (m, 2H), 4.88-5.01 (m, 1H), 4.46-4.62 (m, 1H), 3.70-3.83 (m, 2H), 3.31-3.46 (m, 2H), 1.93-2.07 (m, 2H), 1.74-1.86 (m, 2H), 1.26 (d, J=6.60 Hz, 6H). MS (ESI) 358 (M+H).

實例 17

3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)

四氫吡咯-1-羧酸第三-丁酯之製備

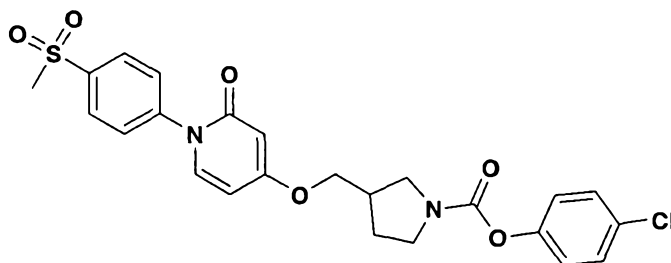


實例 17 係根據實例 1 中所述之程序，在步驟 C 中，以 3-(羥甲基)四氫吡咯-1-羧酸第三-丁酯取代 4-羥基-1-六氫吡啶羧酸第三-丁酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.07 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.22 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.02-6.11 (m, 1H), 5.95 (d, J=2.75 Hz, 1H), 3.86-4.02 (m, 2H), 3.32-3.67 (m, 3H), 3.12-3.30 (m, 1H), 3.09 (s, 3H), 2.65-2.75 (m, 1H), 2.03-2.15 (m, 1H), 1.72-1.83 (m, 1H), 1.48 (s, 9H). MS (ESI) 449 (M+H).

實例 18

3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)

四氫吡咯-1-羧酸 4-氯苯酯之製備



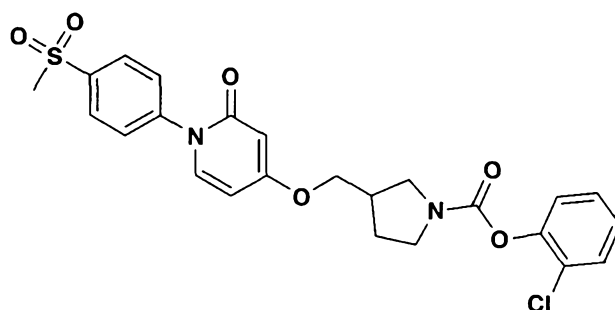
實例 18 係根據實例 2 步驟 A 與步驟 C 中所述之程序，於步驟 A 中，以 3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)四氫吡咯-1-羧酸第三-丁酯取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-

丁酯，且在步驟C中，以氯甲酸4-氯苯酯取代氯甲酸1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.07 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.32 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.25 (dd, J=7.70, 3.30 Hz, 1H), 7.09 (d, J=8.80 Hz, 2H), 6.06-6.12 (m, 1H), 5.98-6.03 (m, 1H), 3.92-4.09 (m, 2H), 3.49-3.92 (m, 3H), 3.34-3.48 (m, 1H), 3.09 (s, 3H), 2.73-2.89 (m, 1H), 2.12-2.29 (m, 1H), 1.79-1.97 (m, 1H). MS (ESI) 503 (M+H).

實例 19

3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)

四氫吡咯-1-羧酸2-氯苯酯之製備

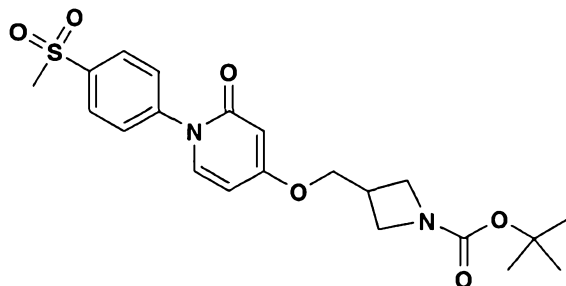


實例 19 係根據實例 2 步驟 A 與步驟 C 中所述之程序，於步驟 A 中，以 3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)四氫吡咯-1-羧酸第三-丁酯取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯，且在步驟 C 中，以氯甲酸 2-氯苯酯取代氯甲酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.43 (d, J=8.25 Hz, 1H), 7.23-7.31 (m, 3H), 7.14-7.19 (m, 1H), 6.10-6.21 (m, 2H), 3.38-4.14 (m, 6H), 3.10 (s, 3H), 2.77-2.93 (m, 1H), 2.15-2.32 (m, 1H), 1.83-2.00 (m, 1H). MS (ESI) 503 (M+H).

實例 20

3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)

一氮四環-1-羧酸第三-丁酯之製備

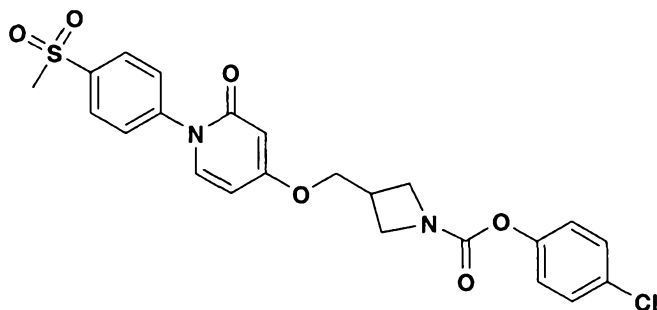


實例 20 係根據實例 1 中所述之程序，在步驟 C 中，以 3-(羥甲基)一氮四環-1-羧酸第三-丁酯取代 4-羥基-1-六氫吡啶羧酸第三-丁酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.07 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.23 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.07 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 5.97 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.06-4.14 (m, 4H), 3.79 (dd, J=8.80, 4.95 Hz, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.94-3.05 (m, 1H), 1.46 (s, 9H). MS (ESI) 435 (M+H).

實例 21

3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)

一氮四環-1-羧酸 4-氯苯酯之製備



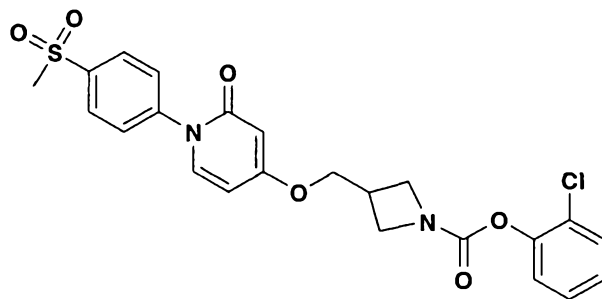
實例 21 係根據實例 2 步驟 A 與步驟 C 中所述之程序，於步驟 A 中，以 3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)一氮四環-1-羧酸第三-丁酯取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)

苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯，且在步驟C中，以氯甲酸4-氯苯酯取代氯甲酸1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.09 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.29-7.36 (m, 3H), 7.05-7.12 (m, 2H), 6.16-6.25 (m, 2H), 4.38 (表觀寬廣 s, 1H), 4.28 (表觀寬廣 s, 1H), 4.21 (d, J=6.05 Hz, 2H), 4.09 (表觀寬廣 s, 1H), 4.00 (表觀寬廣 s, 1H), 3.14-3.23 (m, 1H), 3.11 (s, 3H). MS (ESI) 489 (M+H).

實例 22

3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)

一氮四環-1-羧酸2-氯苯酯之製備

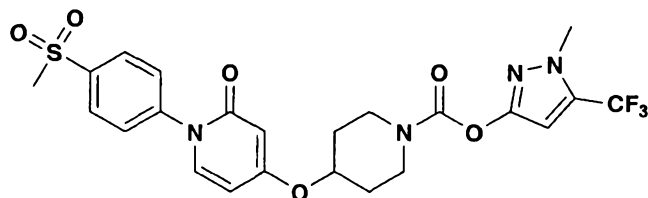


實例 22 係根據實例 2 步驟 A 與步驟 C 中所述之程序，於步驟 A 中，以 3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)一氮四環-1-羧酸第三-丁酯取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯，且在步驟 C 中，以氯甲酸 2-氯苯酯取代氯甲酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.09 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.43 (dd, J=7.97, 1.37 Hz, 1H), 7.32 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.16-7.31 (m, 3H), 6.28 (d, J=2.20 Hz, 1H), 6.25 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 4.41 (表觀寬廣 s, 1H), 4.31 (表觀寬廣 s, 1H), 4.23 (d, J=6.05 Hz, 2H), 4.20 (表觀寬廣 s, 1H), 4.04 (表觀寬廣

s, 1H), 3.15-3.26 (m, 1H), 3.11 (s, 3H). MS (ESI) 489 (M+H).

實例 23

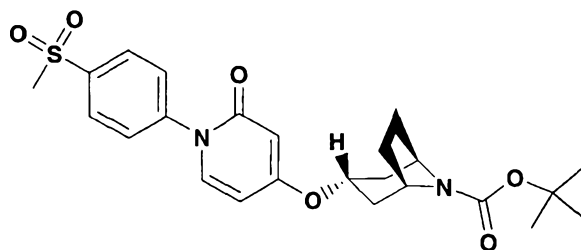
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-吡唑-3-基酯之製備



實例 23 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B 中，以 1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-吡唑-3-醇取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。
 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ 8.08 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.62 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.26 (d, $J=7.70$ Hz, 1H), 6.50 (s, 1H), 6.09 (dd, $J=7.70, 2.75$ Hz, 1H), 6.02 (d, $J=2.75$ Hz, 1H), 4.55-4.63 (m, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.82-3.92 (m, 1H), 3.73-3.83 (m, 1H), 3.63-3.73 (m, 1H), 3.54-3.63 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.01-2.12 (m, 2H), 1.86-1.98 (m, 2H). MS (ESI) 489 (M+H).

實例 24

3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并 [3.2.1] 辛烷-8-羧酸 (3-外向)-第三-丁酯之製備

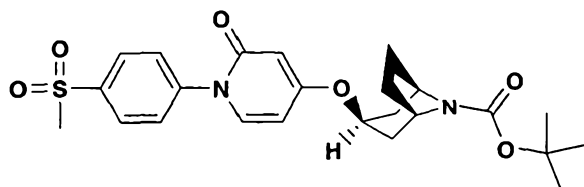


實例 24 係根據實例 1 中所述之程序，在步驟 C 中，以 3-羥基-8-氮雙環并 [3.2.1] 辛烷-8-羧酸 (3-內向)-第三-丁酯取代 4-羥基-1-六氫吡啶羧酸第三-丁酯而製成。
 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ 8.07 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.61 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.20 (d,

J=7.70 Hz, 1H), 5.97-6.02 (m, 2H), 4.66-4.81 (m, 1H), 4.37 (表觀寬廣 s, 1H), 4.28 (表觀寬廣 s, 1H), 3.09 (s, 3H), 1.99-2.19 (m, 4H), 1.65-1.90 (m, 4H), 1.49 (s, 9H). MS (ESI) 475 (M+H).

實例 25

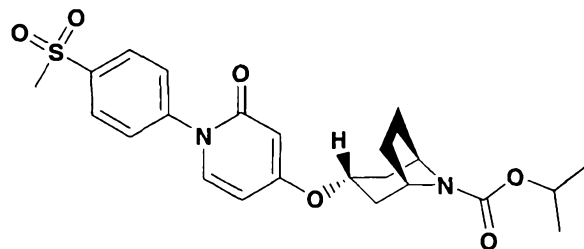
3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并 [3.2.1]辛烷-8-羧酸(3-內向)-第三-丁酯之製備



實例 25 係根據實例 1 中所述之程序，在步驟 C 中，以 3-羥基-8-氮雙環并 [3.2.1]辛烷-8-羧酸(3-外向)-第三-丁酯取代 4-羥基-1-六氫吡啶羧酸第三-丁酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.07 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.24 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.03 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 5.85 (d, J=2.20 Hz, 1H), 4.62 (t, J=4.40 Hz, 1H), 4.29 (表觀寬廣 s, 1H), 4.21 (表觀寬廣 s, 1H), 3.09 (s, 3H), 1.92-2.29 (m, 8H), 1.48 (s, 9H). MS (ESI) 475 (M+H).

實例 26

3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并 [3.2.1]辛烷-8-羧酸(3-外向)-異丙酯之製備

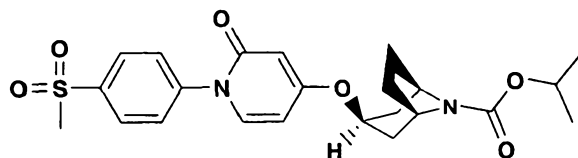


實例 26 係根據實例 3 中所述之程序，以 3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并 [3.2.1]辛烷-8-

羧酸(3-外向)-第三-丁酯取代4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯而製成。
 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ 8.07 (d, $J=8.25$ Hz, 2H), 7.61 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.22 (d, $J=7.70$ Hz, 1H), 6.06 (d, $J=2.75$ Hz, 1H), 6.03 (dd, $J=7.70, 2.75$ Hz, 1H), 4.91-5.03 (m, 1H), 4.70-4.81 (m, 1H), 4.41 (表觀寬廣 s, 1H), 4.36 (表觀寬廣 s, 1H), 3.10 (s, 3H), 1.99-2.23 (m, 4H), 1.66-1.92 (m, 4H), 1.27 (d, $J=6.05$ Hz, 6H). MS (ESI) 461 (M+H).

實例 27

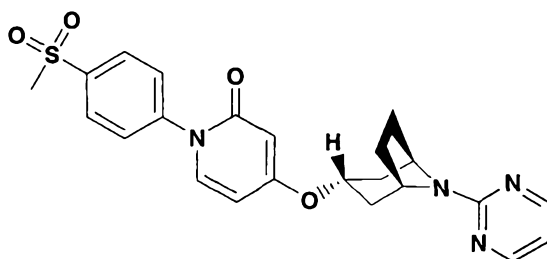
3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸(3-內向)-異丙酯之製備



實例 27 係根據實例 3 中所述之程序，以 3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸(3-內向)-第三-丁酯取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯而製成。
 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ 8.08 (d, $J=8.25$ Hz, 2H), 7.61 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.26 (d, $J=7.70$ Hz, 1H), 6.09 (dd, $J=7.70, 2.75$ Hz, 1H), 5.97 (d, $J=2.75$ Hz, 1H), 4.92-5.00 (m, 1H), 4.63 (t, $J=4.67$ Hz, 1H), 4.30 (表觀寬廣 s, 2H), 3.10 (s, 3H), 1.96-2.35 (m, 8H), 11.27 (d, $J=6.60$ Hz, 6H). MS (ESI) 461 (M+H).

實例 28

(3-外向)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(8-(嘓啶-2-基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛-3-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



步驟 A. (3-外向)-4-(8-氮雙環并[3.2.1]辛-3-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽之製備

(3-外向)-4-(8-氮雙環并[3.2.1]辛-3-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽係根據實例2步驟A中所述之程序，以3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸(3-外向)-第三-丁酯取代4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯而製成。MS (ESI) 375 (M+H).

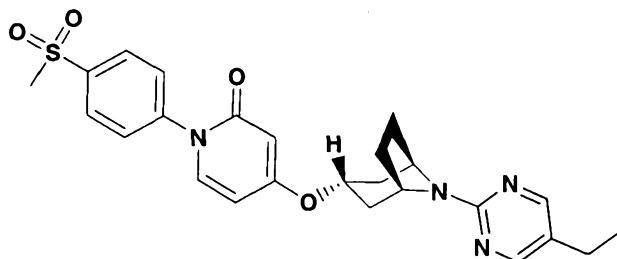
步驟 B. 實例 28

將(3-外向)-4-(8-氮雙環并[3.2.1]辛-3-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽(41毫克，0.10毫莫耳)、2-溴基嘧啶(31.8毫克，0.20毫莫耳，Alfa Aesar)及碳酸鉀(55.2毫克，0.40毫莫耳，EMD)在DMF(0.8毫升)中之混合物於微波條件(160°C，30分鐘)下加熱，然後冷卻至室溫。使反應混合物藉預備之HPLC純化(C₁₈管柱；0-100%甲醇在含有0.05%三氟醋酸之水中)，於凍乾時，獲得實例28(17.0毫克，黃色固體，TFA鹽，30%)。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.53 (d, J=4.95 Hz, 2H), 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.60 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.23 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.70 (t, J=5.22 Hz, 1H), 6.25 (d, J=2.20 Hz, 1H), 6.03 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 4.98 (m, 2H), 4.86-4.97 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.26-2.40 (m, 2H), 2.14-2.27

(m, 2H), 1.92-2.03 (m, 2H), 1.79-1.92 (m, 2H). MS (ESI) 461 (M+H).

實例 29

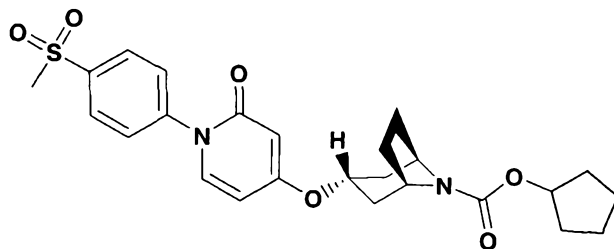
(3-外向)-4-(8-(5-乙基嘧啶-2-基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛-3-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮. TFA 鹽之製備



實例 29 係根據實例 28 中所述之程序，於步驟 B 中，以 2-氯基-5-乙基嘧啶取代 2-溴基嘧啶而製成，惟將反應物在微波中於 160°C 下加熱 1 小時。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.35 (s, 2H), 8.07 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.19 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.07 (d, J=2.20 Hz, 1H), 5.96 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 4.81-4.97 (m, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.54 (q, J=7.33 Hz, 2H), 2.14-2.30 (m, 4H), 1.78-1.98 (m, 4H), 1.24 (t, J=7.70 Hz, 3H). MS (ESI) 481 (M+H).

實例 30

3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氮吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸(3-外向)-環戊酯之製備

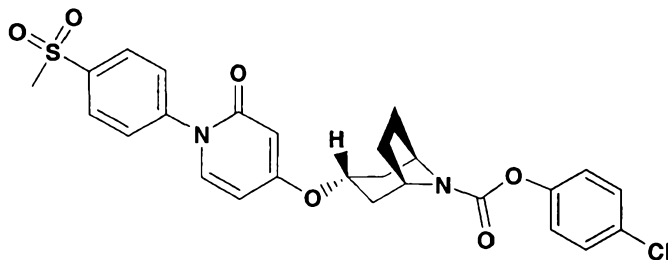


實例 30 係根據實例 2 步驟 C 中所述之程序，以 (3-外向)-4-(8-氮雙環并[3.2.1]辛-3-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽取代 1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氮吡啶-4-基氧基)吡

啖-2(1H)-酮鹽酸鹽，且以氯甲酸環戊酯取代氯甲酸1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.26 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.25 (d, J=2.75 Hz, 1H), 6.10 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 5.15-5.19 (m, 1H), 4.71-4.83 (m, 1H), 4.42 (表觀寬廣 s, 1H), 4.32 (表觀寬廣 s, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.03-2.21 (m, 4H), 1.51-1.94 (m, 12H). MS (ESI) 487 (M+H).

實例 31

3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸(3-外向)-4-氯苯酯之製備

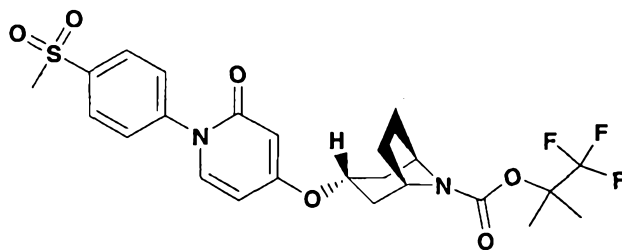


實例 31 係根據實例 2 步驟 C 中所述之程序，以(3-外向)-4-(8-氮雙環并[3.2.1]辛-3-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽取代 1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽，且以氯甲酸 4-氯苯酯取代氯甲酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.34 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.22 (d, J=7.15 Hz, 1H), 7.10 (d, J=8.80 Hz, 2H), 5.98-6.06 (m, 2H), 4.75-4.85 (m, 1H), 4.58 (表觀寬廣 s, 1H), 4.51 (表觀寬廣 s, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.08-2.36 (m, 4H), 1.77-2.00 (m, 4H). MS (ESI) 529 (M+H).

實例 32

3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙

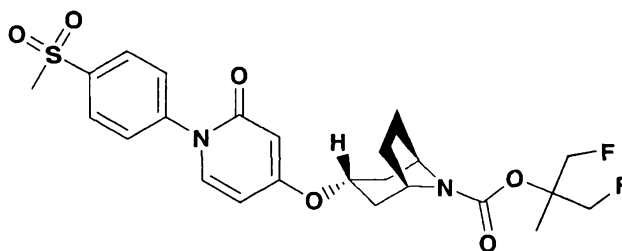
環并 [3.2.1]辛烷 -8-羧酸 (3-外向)-1,1,1-三氟-2-甲基丙-2-基酯之
製備



實例 32 係根據實例 2 步驟 B-C 中所述之程序，於步驟 B 中，以 2-(三氟甲基)丙-2-醇取代 1,1,1-三氟-2-丙醇，且在步驟 C 中，以 (3-外向)-4-(8-氮雙環并 [3.2.1]辛-3-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽取代 1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.07 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.21 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.01 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 5.97 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.69-4.79 (m, 1H), 4.38 (表觀寬廣 s, 1H), 4.30 (表觀寬廣 s, 1H), 3.09 (s, 3H), 2.00-2.26 (m, 4H), 1.67-1.90 (m, 4H), 1.73 (d, J=16.50 Hz, 6H). MS (ESI) 529 (M+H).

實例 33

3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并 [3.2.1]辛烷-8-羧酸 (3-外向)-1,3-二氟-2-甲基丙-2-基酯之製備

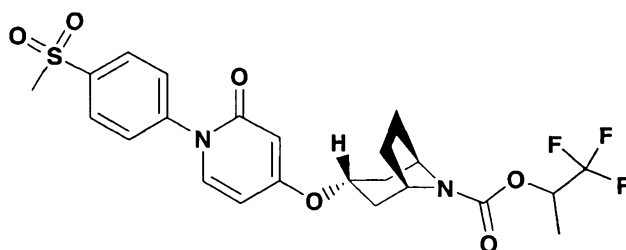


實例 33 係根據實例 2 步驟 B-C 中所述之程序，於步驟 B 中，以 1,3-二氟-2-甲基丙-2-醇取代 1,1,1-三氟-2-丙醇，且在步驟 C

中，以(3-外向)-4-(8-氮雙環并[3.2.1]辛-3-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽取代1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.07 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.21 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.01 (dd, J=7.42, 2.47 Hz, 1H), 5.97 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.69-4.78 (m, 2H), 4.63 (dd, J=9.35, 2.20 Hz, 1H), 4.54 (dd, J=9.35, 2.20 Hz, 1H), 4.37 (表觀寬廣 s, 1H), 4.32 (表觀寬廣 s, 1H), 3.09 (s, 3H), 2.03-2.23 (m, 4H), 1.69-1.89 (m, 4H), 1.56 (t, J=2.20 Hz, 3H). MS (ESI) 511 (M+H).

實例 34

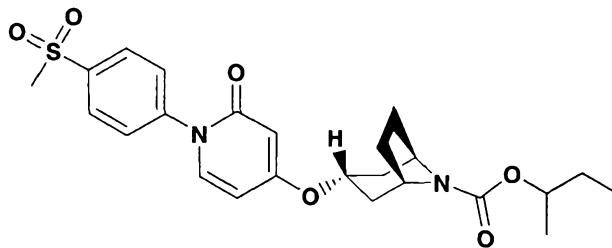
3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸(3-外向)-1,1,1-三氟丙-2-基酯之製備



實例 34 係根據實例 2 步驟中所述之程序，以(3-外向)-4-(8-氮雙環并[3.2.1]辛-3-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽取代1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.24 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.16 (s, 1H), 6.01-6.11 (m, 1H), 5.23-5.36 (m, 1H), 4.72-4.83 (m, 1H), 4.38-4.49 (m, 2H), 3.10 (s, 3H), 1.65-2.31 (m, 8H), 1.38-1.51 (m, 3H). MS (ESI) 515 (M+H).

實例 35

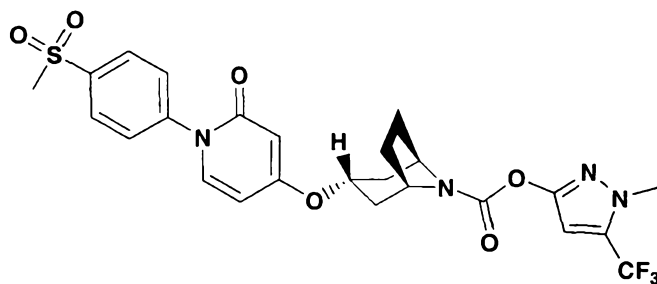
3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙
環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸(3-外向)-第二-丁酯之製備



實例 35 係根據實例 2 步驟 B-C 中所述之程序，於步驟 B 中，以 2-丁醇取代 1,1,1-三氟-2-丙醇，且在步驟 C 中，以 (3-外向)-4-(8-氮雙環并[3.2.1]辛-3-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽取代 1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.25 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.22 (d, J=2.75 Hz, 1H), 6.09 (dd, J=7.42, 2.47 Hz, 1H), 4.72-4.84 (m, 2H), 4.33-4.46 (m, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.00-2.23 (m, 4H), 1.50-1.95 (m, 6H), 1.25 (d, J=6.05 Hz, 3H), 0.94 (表觀寬廣 s, 3H). MS (ESI) 475 (M+H).

實例 36

3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙
環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸(3-外向)-1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-吡唑
-3-基酯之製備

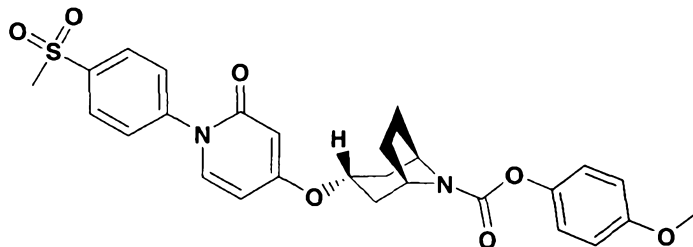


實例 36 係根據實例 2 步驟 B-C 中所述之程序，於步驟 B 中，以 1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-吡唑-3-醇取代 1,1,1-三氟-2-丙

醇，且在步驟C中，以(3-外向)-4-(8-氮雙環并[3.2.1]辛-3-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽取代1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.10 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.32 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.61 (d, J=2.75 Hz, 1H), 6.54 (s, 1H), 6.22 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 4.82-4.94 (m, 1H), 4.58-4.65 (m, 1H), 4.48-4.57 (m, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 2.07-2.35 (m, 4H), 1.84-2.00 (m, 4H). MS (ESI) 567 (M+H).

實例 37

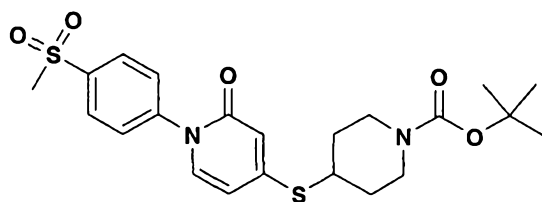
3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸(3-外向)-4-甲氧苯酯之製備



實例 37 係根據實例 2 步驟 C 中所述之程序，以(3-外向)-4-(8-氮雙環并[3.2.1]辛-3-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽取代1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽，且以氯甲酸4-甲氧苯酯取代氯甲酸1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.09 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.28 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.06 (d, J=8.80 Hz, 2H), 6.89 (d, J=8.80 Hz, 2H), 6.35 (d, J=2.75 Hz, 1H), 6.14 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H), 4.79-4.92 (m, 1H), 4.60 (表觀寬廣 s, 1H), 4.51 (表觀寬廣 s, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.11 (s, 3H), 2.08-2.35 (m, 4H), 1.77-2.01 (m, 4H). MS (ESI) 525 (M+H).

實例 38

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基硫基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備



步驟 A. 4-溴基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備

將 4-羥基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮 (106.1 毫克, 0.4 毫莫耳) 與 溴化磷醯 (573.4 毫克, 2.0 毫莫耳, Alfa Aesar) 之混合物在 100°C 下加熱 45 分鐘, 然後冷卻至室溫。於上述殘留物中, 在 0°C 下添加飽和 NaHCO₃ 水溶液, 接著以 CH₂Cl₂ 萃取 (3x)。將合併之萃液以飽和 NaHCO₃ 水溶液與鹽水洗滌, 脫水乾燥 (Na₂SO₄), 及蒸發。使殘留物藉急驟式層析純化 (0 至 100% EtOAc/己烷), 產生 60.7 毫克 (46%) 產物, 為黃色固體。MS (ESI) 328 (M+H).

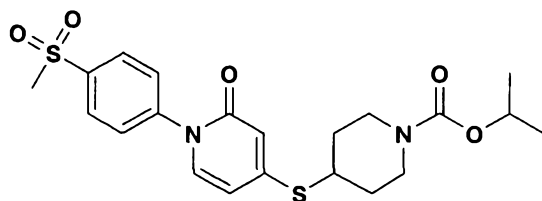
步驟 B. 實例 38

於 4-巯基六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯 (65.2 毫克, 0.3 毫莫耳, 根據美國專利 6,566,384 B1 中所述之程序製成) 在 DMF (1.5 毫升) 中之溶液內, 在 0°C 下, 添加氫化鈉 (37 毫克, 1.0 毫莫耳, 在礦油中之 65% 分散液, Aldrich)。於 0°C 下攪拌 30 分鐘後, 添加 DMF (1.2 毫升) 中之 4-溴基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮 (82 毫克, 0.25 毫莫耳)。將所形成之混合物在室溫下攪拌 50 分鐘, 然後, 以飽和 NH₄Cl 水溶液 (0.5 毫升) 使反應淬滅。將反應混合物以 EtOAc 與 H₂O 稀釋, 並以 EtOAc 進一

步萃取 (3x) 水層。將合併之萃液以鹽水/H₂O (1:1, 3x) 洗滌，脫水乾燥 (Na₂SO₄)，及蒸發。使殘留物藉急驟式層析純化 (0 至 100% EtOAc/ 己烷)，產生 100.6 毫克 (72%) 實例 38，為淡黃色固體。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.08 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.18 (d, J=7.15 Hz, 1H), 6.41 (d, J=2.20 Hz, 1H), 6.14 (dd, J=7.15, 2.20 Hz, 1H), 3.98 (表觀寬廣 s, 2H), 3.43-3.52 (m, 1H), 3.03-3.16 (m, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.06-2.16 (m, 2H), 1.61-1.73 (m, 2H), 1.47 (s, 9H). MS (ESI) 465 (M+H).

實例 39

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基硫基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備

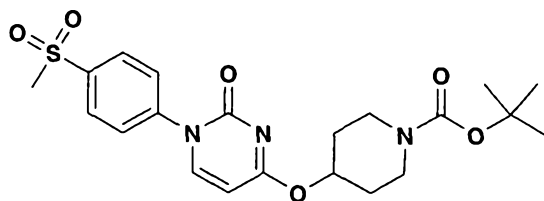


實例 39 係根據實例 3 中所述之程序，以 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基硫基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.09 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.22 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.66 (d, J=1.65 Hz, 1H), 6.27 (dd, J=7.42, 1.92 Hz, 1H), 4.88-5.00 (m, 1H), 4.04 (表觀寬廣 s, 2H), 3.47-3.58 (m, 1H), 3.12-3.17 (m, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.08-2.16 (m, 2H), 1.61-1.73 (m, 2H), 1.26 (d, J=6.05 Hz, 6H). MS (ESI) 451 (M+H).

實例 40

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫嘧啶-4-基氧基)六氫吡

啶-1-羧酸第三-丁酯之製備



步驟 A. 4-(2-氯基嘧啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備

於 4-羥基六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯 (1.0 克, 5.0 毫莫耳, Aldrich) 在 DMF (15.0 毫升) 中之溶液內, 在 0°C 下, 以數份添加氫化鈉 (0.55 克, 15.0 毫莫耳, 在礦油中之 65% 分散液, 可市購得自 Sigma-Aldrich 公司)。於 0°C 下攪拌 10 分鐘後, 添加 DMF (10.0 毫升) 中之 2,4-二氯嘧啶 (745 毫克, 5.0 毫莫耳, 可市購得自 Sigma-Aldrich 公司)。將所形成之混合物在 0°C 下攪拌 10 分鐘, 並於室溫下 2 小時, 然後, 以飽和 NH₄Cl 水溶液 (1.5 毫升) 使反應淬滅。將反應混合物以 EtOAc 與 H₂O 稀釋, 且以 EtOAc 進一步萃取 (2x) 水溶液。將合併之有機萃液以 H₂O (3x) 與鹽水洗滌, 脫水乾燥 (Na₂SO₄), 及蒸發。使殘留物藉急驟式層析純化 (0 至 50% EtOAc/己烷), 產生 409.3 毫克 (26%) 產物, 為灰白色半固體。MS (ESI) 314 (M+H).

步驟 B. 4-(2-酮基-1,2-二氫嘧啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備

將 4-(2-氯基嘧啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯 (341.5 毫克, 0.90 毫莫耳)、碳酸鉀 (225.6 毫克, 1.64 毫莫耳,

EMD) 及 1,4-二氮環 [2,2,2]辛烷 (48.8 毫克, 0.44 毫莫耳, 可市購得自 Alfa Aesar) 在二氧陸園 /H₂O (10 毫升 /10 毫升) 中之混合物於 70°C 下加熱 6 小時, 冷卻至室溫, 然後蒸發。使殘留物藉急驟式層析純化 (0 至 10% MeOH/CH₂Cl₂), 產生 275 毫克 (85%) 產物, 為灰白色固體。

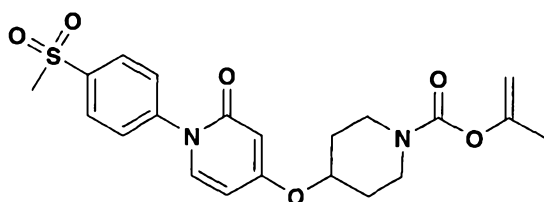
步驟 C. 實例 40

將 4-(2-酮基 -1,2-二氮嘧啶 -4-基氧基)六氮吡啶 -1-羧酸第三 - 丁酯 (266.5 毫克, 0.90 毫莫耳)、4-溴苯基甲基砒 (212.2 毫克, 0.90 毫莫耳, 可市購得自 Sigma-Aldrich 公司)、碘化銅 (I) (60.4 毫克, 0.32 毫莫耳, 可市購得自 Sigma-Aldrich 公司)、8-羥基喹啉 (47 毫克, 0.32 毫莫耳, 可市購得自 Alfa Aesar) 及碳酸鉀 (188 毫克, 1.35 毫莫耳, EMD) 在 DMSO (7.5 毫升) 中之混合物於微波條件 (160°C, 30 分鐘) 下加熱, 並冷卻至室溫。以 EtOAc 稀釋反應混合物, 然後過濾。以 H₂O 洗滌濾液, 且以 EtOAc 逆萃取 (2x) 水層。將合併之有機層以 H₂O/鹽水 (1:1, 4x) 洗滌, 脫水乾燥 (Na₂SO₄), 及蒸發。使殘留物藉急驟式層析純化 (0 至 100% EtOAc/己烷, 兩次), 產生 168.5 毫克 (55%) 實例 40, 為黃色固體。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.63 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.54 (d, J=7.15 Hz, 1H), 6.05 (d, J=7.70 Hz, 1H), 5.44-5.57 (m, 1H), 3.80 (表觀寬廣 s, 2H), 3.18-3.31 (m, 2H), 3.10 (s, 3H), 1.95-2.08 (m, 2H), 1.65-1.85 (m, 2H), 1.48 (s, 9H). MS (ESI) 450 (M+H).

實例 41

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基 -1,2-二氮吡啶 -4-基氧基)六氮吡

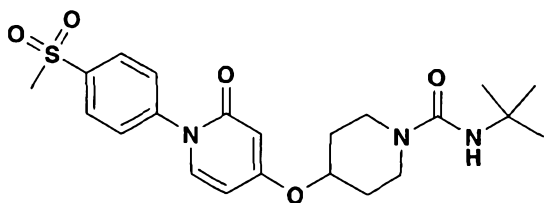
吡啶-1-羧酸丙-1-烯-2-基酯之製備



實例 41 係根據實例 2 步驟 C 中所述之程序，以氯甲酸異丙烯酯取代氯甲酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.07 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.24 (d, J=7.15 Hz, 1H), 6.06 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 5.98 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.69 (d, J=5.50 Hz, 2H), 4.50-4.59 (m, 1H), 3.72-3.83 (m, 2H), 3.43-3.53 (m, 2H), 3.09 (s, 3H), 1.99-2.08 (m, 2H), 1.97 (s, 3H), 1.86 (表觀寬廣 s, 2H). MS (ESI) 433 (M+H).

實例 42

N-第三-丁基-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺之製備

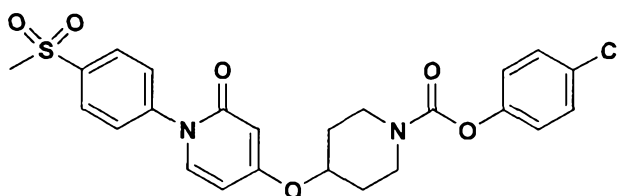


於 1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮醯酸鹽 (20 毫克, 0.052 毫莫耳) 在 CH₂Cl₂ (1.0 毫升) 中之懸浮液內，添加 Et₃N (36.2 毫升, 0.26 毫莫耳)，接著添加異氰酸第三-丁酯 (14.8 毫升, 0.13 毫莫耳, 可市購得自 Sigma-Aldrich 公司)。將反應混合物攪拌 1.5 小時，及在減壓下蒸發。使粗產物藉預備之 HPLC 純化 (C₁₈ 管柱；0-100% 甲醇在含有 0.05% 三氟醋酸之水中)，獲得 15.4 毫克 (62%) 實例 42，為灰白色固體。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.10 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.61

(d, J=8.25 Hz, 2H), 7.36 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.51 (d, J=2.75 Hz, 1H), 6.30 (dd, J=7.42, 2.47 Hz, 1H), 4.54-4.68 (m, 1H), 3.55-3.70 (m, 2H), 3.26-3.39 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.01-2.13 (m, 2H), 1.80-1.95 (m, 2H), 1.37 (s, 9H). MS (ESI) 448 (M+H).

實例 43

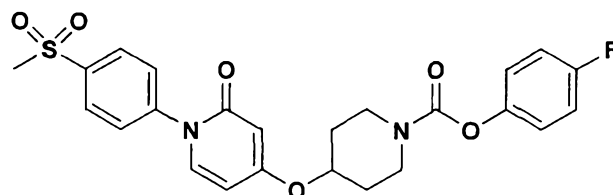
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-氯苯酯之製備



實例 43 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 C，以氯甲酸 4-氯苯酯取代氯甲酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.01 (d, J=8.3 Hz, 2H), 7.55 (d, J=8.3 Hz, 2H), 7.25 (d, J=7.5 Hz, 2H), 7.20 (d, J=7.5 Hz, 1H), 7.00 (d, J=7.5 Hz, 2H), 6.07-6.09 (m, 2H), 4.55 (表觀寬廣 s, 1H), 3.70-3.89 (m, 2H), 3.47-3.63 (m, 2H), 3.04 (s, 3H), 1.94-2.09 (m, 2H), 1.89-1.91 (m, 2H). MS (ESI) 503 (M+H).

實例 44

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-氟苯酯之製備

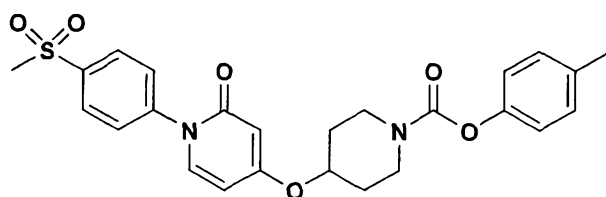


實例 44 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 C，以氯甲酸 4-氟苯酯取代氯甲酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR (400

MHz, CDCl₃) δ 8.02 (d, J=7.5 Hz, 2H), 7.55 (d, J=7.5 Hz, 2H), 7.20 (d, J=7.5 Hz, 1H), 7.09 (d, J=8.5 Hz, 2H), 6.93 (d, J=8.5 Hz, 2H), 6.15-6.20 (m, 2H), 4.57 (表觀寬廣 s, 1H), 3.70-3.89 (m, 2H), 3.45-3.63 (m, 2H), 3.05 (s, 3H), 1.92-2.06 (m, 2H), 1.79-1.89 (m, 2H). MS (ESI) 487 (M+H).

實例 45

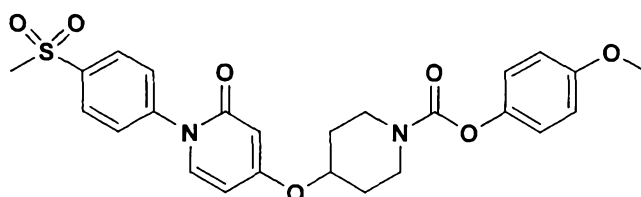
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-甲基苯酯之製備



實例 45 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 C，以氯甲酸 4-甲基苯酯取代氯甲酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.02 (d, J=7.5 Hz, 2H), 7.56 (d, J=7.5 Hz, 2H), 7.20 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.98-7.02 (m, 4H), 6.15-6.20 (m, 2H), 4.57 (表觀寬廣 s, 1H), 3.70-3.89 (m, 2H), 3.45-3.63 (m, 2H), 3.05 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 1.92-2.06 (m, 2H), 1.79-1.89 (m, 2H). MS (ESI) 483 (M+H).

實例 46

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-甲氧基苯酯之製備



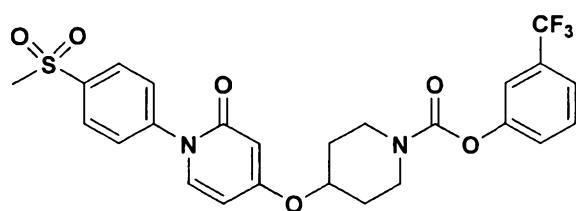
實例 46 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 C，以氯甲酸 4-甲氧基苯酯取代氯甲酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR

(400 MHz, CDCl_3) δ 8.02 (d, $J=7.5$ Hz, 2H), 7.55 (d, $J=7.5$ Hz, 2H), 7.20 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 6.95 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 6.81 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 6.07-6.10 (m, 2H), 4.55 (表觀寬廣 s, 1H), 3.74-3.89 (m, 2H), 3.73 (s, 3H), 3.44-3.59 (m, 2H), 3.03 (s, 3H), 1.92-2.06 (m, 2H), 1.79-1.89 (m, 2H). MS (ESI) 499 (M+H).

實例 47

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡

啶-1-羧酸 3-三氟甲基苯酯之製備

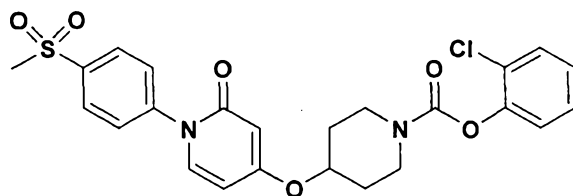


實例 47 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 C，以氣甲酸 3-三氟甲基苯酯取代氣甲酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.02 (d, $J=7.5$ Hz, 2H), 7.55 (d, $J=7.5$ Hz, 2H), 7.40-7.47 (m, 2H), 7.34 (s, 1H), 7.25-7.30 (m, 1H), 7.22 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 6.07-6.10 (m, 2H), 4.57 (表觀寬廣 s, 1H), 3.70-3.89 (m, 2H), 3.47-3.64 (m, 2H), 3.03 (s, 3H), 1.92-2.06 (m, 2H), 1.79-1.89 (m, 2H). MS (ESI) 537 (M+H).

實例 48

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡

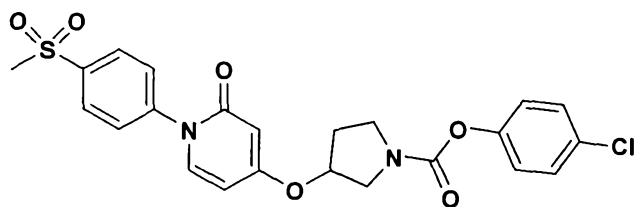
啶-1-羧酸 2-氯苯酯之製備



實例 48 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 C，以氯甲酸 2-氯苯酯取代氯甲酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.02 (d, J=7.5 Hz, 2H), 7.55 (d, J=7.5 Hz, 2H), 7.37 (d, J=7.5 Hz, 1H), 7.06-7.22 (m, 4H), 6.07-6.09 (m, 2H), 4.56 (表觀寬廣 s, 1H), 3.89-3.95 (m, 1H), 3.72-3.82 (m, 1H), 3.61-3.69 (m, 1H), 3.45-3.55 (m, 1H), 3.03 (s, 3H), 1.92-2.06 (m, 2H), 1.79-1.89 (m, 2H). MS (ESI) 503 (M+H).

實例 49

(±)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)四氫吡咯-1-羧酸 4-氯苯酯之製備

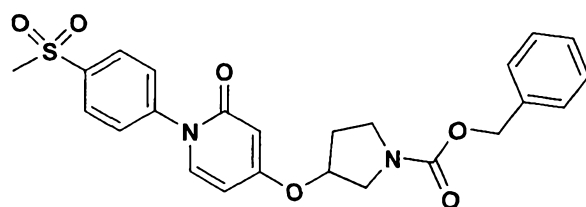


實例 49 係根據實例 1 與 2 中所述之程序，於實例 1 步驟 C 中，以 3-(甲磺醯基氧基)四氫吡咯-1-羧酸第三-丁酯取代 4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯，且在實例 2 步驟 C 中，以氯甲酸 4-氯苯酯取代氯甲酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.01 (d, J=8.3 Hz, 2H), 7.55 (d, J=8.3 Hz, 2H), 7.26 (d, J=7.5 Hz, 2H), 7.20 (d, J=7.5 Hz, 1H), 7.04 (d, J=7.5 Hz, 2H), 6.00-6.05 (m, 1H), 5.95 (s, 1H) 4.92 (表觀寬廣 s, 1H), 3.70-3.89 (m, 2H), 3.53-3.86 (m, 2H), 3.04 (s, 3H), 2.13-2.35 (m, 2H). MS (ESI) 489 (M+H).

實例 50

(±)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)四

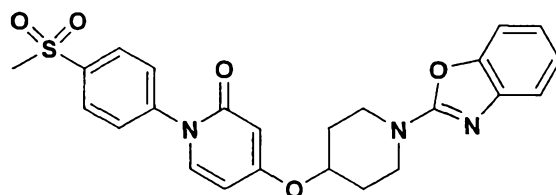
氫吡咯-1-羧酸苄酯之製備



實例 50 係根據實例 49 中所述之程序，以氯甲酸苄酯取代氯甲酸 4-氯苯酯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.00 (d, J=8.3 Hz, 2H), 7.53 (d, J=8.3 Hz, 2H), 7.22-7.35 (m, 5H), 7.18 (d, J=7.5 Hz, 1H), 5.98 (d, J=7.8 Hz, 2H), 5.88 (d, J=7.8 Hz, 2H), 5.09 (s, 2H), 4.84 (表觀寬廣 s, 1H), 3.45-3.79 (m, 4H), 3.02 (s, 3H), 2.06-2.25 (m, 2H). MS (ESI) 469 (M+H).

實例 51

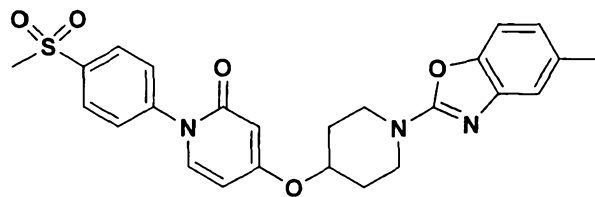
4-(1-(苯并[d]呋唑-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 51 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 C，以 2-氯基苯并呋唑取代氯甲酸 1,1,1-三氯丙-2-基酯而製成，並將反應物於 100°C 下加熱 10 分鐘。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.00 (d, J=7.5 Hz, 2H), 7.55 (d, J=7.5 Hz, 2H), 7.35 (d, J=7.5 Hz, 1H), 7.20 (表觀 t, J=8.5 Hz, 2H), 7.14 (t, J=8.5 Hz, 1H), 7.01 (t, J=8.5 Hz, 1H), 6.01 (d, J=7.5 Hz, 1H), 5.94 (s, 1H), 4.56 (表觀寬廣 s, 1H), 3.87-3.95 (m, 2H), 3.68-3.75 (m, 2H), 3.02 (s, 3H), 2.03-2.12 (m, 2H), 1.89-1.97 (m, 2H). MS (ESI) 466 (M+H).

實例 52

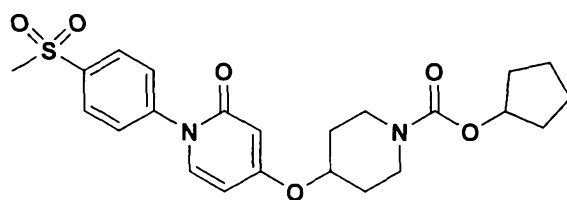
4-(1-(5-甲基苯并[d]呋唑-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 52 係根據實例 51 中所述之程序，以 2-氯基-5-甲基-苯并呋唑取代 2-氯基苯并呋唑而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.07 (d, J=7.5 Hz, 2H), 7.61 (d, J=7.5 Hz, 2H), 7.22-7.26 (m, 2H), 7.15 (d, J=8.5 Hz, 1H), 6.88 (d, J=8.0 Hz, 1H), 6.08 (d, J=7.5 Hz, 1H), 5.99 (s, 1H), 4.62 (表觀寬廣 s, 1H), 3.91-3.98 (m, 2H), 3.68-3.85 (m, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.10-2.28 (m, 2H), 1.98-2.07 (m, 2H). MS (ESI) 480 (M+H).

實例 53

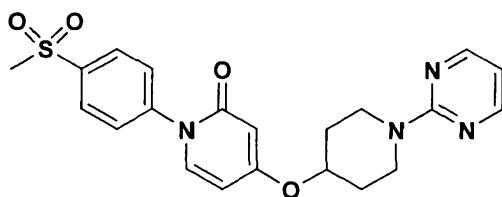
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸環丙酯之製備



實例 53 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 C，以氯甲酸環丙酯取代氯甲酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.05 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.60 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.23 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.04 (d, J=7.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 1H), 5.09-5.13 (m, 1H), 4.47-4.50 (m, 1H), 3.69-3.76 (m, 2H), 3.34-3.40 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 1.55-2.06 (m, 12H). MS (ESI) 461 (M+H).

實例 54

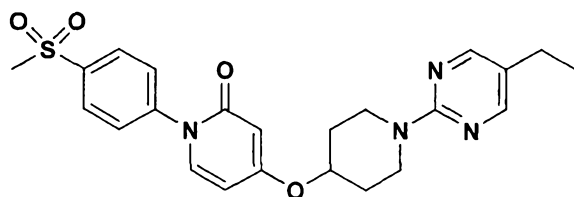
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 54 係根據實例 51 中所述之程序，以 2-氯基嘧啶取代 2-氯基苯并呋唑而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.29 (d, J=4.8 Hz, 2H), 8.00 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.55 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.17 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.49 (d, J=4.8 Hz, 1H), 6.00 (d, J=7.5 Hz, 1H), 5.95 (s, 1H), 4.52-4.55 (m, 1H), 4.10-4.19 (m, 2H), 3.65-3.76 (m, 2H), 3.03 (s, 3H), 1.98-2.06 (m, 2H), 1.77-1.89 (m, 2H). MS (ESI) 427 (M+H).

實例 55

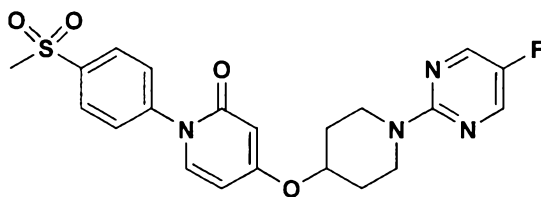
4-(1-(5-乙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 55 係根據實例 51 中所述之程序，以 2-氯基-5-乙基嘧啶取代 2-氯基苯并呋唑而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.27 (s, 2H), 8.05 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.23 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.09 (d, J=7.5 Hz, 1H), 5.99 (s, 1H), 4.60-4.64 (m, 1H), 4.10-4.19 (m, 2H), 3.85-4.02 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.51 (q, J=7.1 Hz, 2H), 2.03-2.14 (m, 2H), 1.89-1.98 (m, 2H), 1.23 (t, J=7.1 Hz, 3H). MS (ESI) 455 (M+H).

實例 56

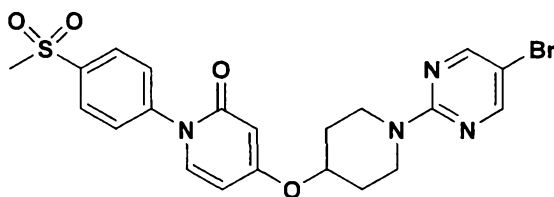
4-(1-(5-氟基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 56 係根據實例 51 中所述之程序，以 2-氟基-5-氟基嘧啶取代 2-氟基苯并嘧啶而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.23 (s, 2H), 8.05 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.60 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.23 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.08 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.01 (s, 1H), 4.56-4.61 (m, 1H), 4.10-4.19 (m, 2H), 3.69-4.76 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.03-2.11 (m, 2H), 1.80-1.92 (m, 2H). MS (ESI) 445 (M+H).

實例 57

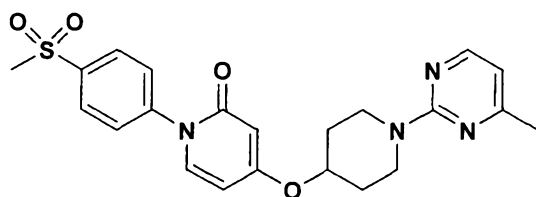
4-(1-(5-溴基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 57 係根據實例 51 中所述之程序，以 2-氟基-5-溴基嘧啶取代 2-氟基苯并嘧啶而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.33 (s, 2H), 8.07 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.24 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.08 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.03 (s, 1H), 4.58-4.64 (m, 1H), 4.08-4.15 (m, 2H), 3.72-4.82 (m, 2H), 3.09 (s, 3H), 1.99-2.12 (m, 2H), 1.82-1.94 (m, 2H). MS (ESI) 505 (M+H).

實例 58

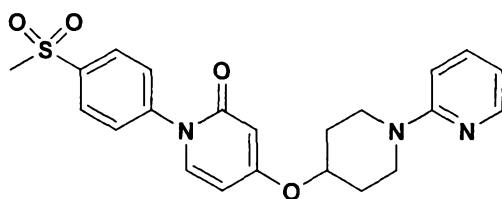
4-(1-(4-甲基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 58 係根據實例 51 中所述之程序，以 2-氯基-4-甲基嘧啶取代 2-氯基苯并嘧啶而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.16 (d, J=6.1 Hz, 1H), 8.10 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.55 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.19 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.45 (d, J=6.1 Hz, 1H), 6.00 (d, J=7.5 Hz, 1H), 5.94 (s, 1H), 4.55-4.60 (m, 1H), 4.11-4.18 (m, 2H), 3.87-4.96 (m, 2H), 3.03 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.01-2.12 (m, 2H), 1.82-1.94 (m, 2H). MS (ESI) 441 (M+H).

實例 59

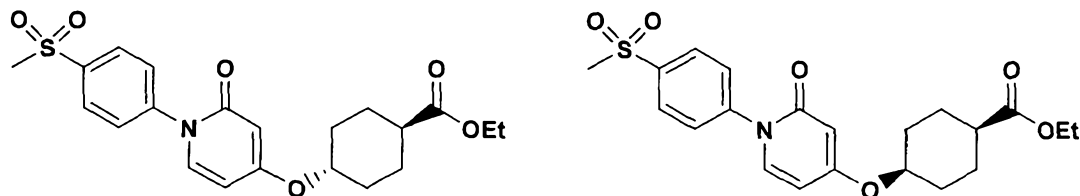
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 59 係根據實例 51 中所述之程序，以 2-氯-吡啶取代 2-氯基苯并嘧啶而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.10 (d, J=8.5 Hz, 2H), 8.09 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.68 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.55-7.61 (m, 2H), 6.92 (d, J=8.1 Hz, 1H), 6.87 (t, J=8.1 Hz, 1H), 6.26 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.09 (s, 1H), 4.83-4.89 (m, 1H), 3.88-3.96 (m, 2H), 3.43-3.51 (m, 2H), 3.07 (s, 3H), 2.09-2.17 (m, 2H), 1.80-1.90 (m, 2H). MS (ESI) 426 (M+H).

實例 60 與 61

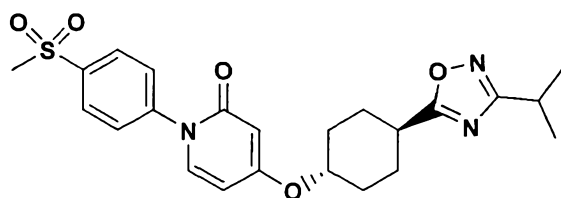
反式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸乙酯與順式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸乙酯之製備



實例 60 與 61 係根據實例 1 中所述之程序，以順式與反式 4-羥基環己烷-羧酸乙酯之混合物取代 4-羥基-1-六氫吡啶羧酸第三-丁酯而製成，以藉急驟式層析(0 至 100% EtOAc 在己烷中)產生分離之產物。實例 60: $^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ 8.06 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 7.23 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 6.09 (s, 1H), 6.06 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 4.24-4.31 (m, 1H), 4.13 (q, $J=7.2$ Hz, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.31-2.46 (m, 2H), 2.10-2.25 (m, 2H), 1.47-1.70 (m, 5H), 1.26 (t, $J=7.2$ Hz, 3H). MS (ESI) 420 (M+H); 與實例 61: $^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ 8.06 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 7.29 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 6.35 (s, 1H), 6.21 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 4.54-4.61 (m, 1H), 4.13 (q, $J=7.2$ Hz, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.31-2.46 (m, 2H), 2.10-2.25 (m, 2H), 1.47-1.70 (m, 5H), 1.25 (t, $J=7.2$ Hz, 3H). MS (ESI) 420 (M+H).

實例 62

4-((反式)-4-(3-異丙基-1,2,4-嘓二唑-5-基)環己基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



步驟 A. 反式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸酯之製備

於反式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸乙酯(500毫克, 1.19毫莫耳)在MeOH(10毫升)、水(1毫升)及DMF(1毫升)中之正在攪拌溶液內, 在室溫下添加氫氧化鈉(120毫克, 3.0毫莫耳, 可市購得自EM Science)。將反應混合物攪拌過夜, 然後在真空中濃縮至乾涸。使殘留物於EtOAc與水之間分配。接著, 以濃HCl使反應物酸化至pH 2, 並攪拌20分鐘。過濾固體, 且以EtOAc洗滌。使固體在真空中乾燥, 產生454毫克所要之產物, 為白色固體。MS (ESI) 392 (M+H).

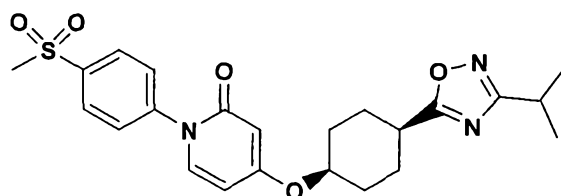
步驟 B. 實例 62

於反式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸酯(100毫克, 0.26毫莫耳)在無水DMF(2毫升)中之正在攪拌溶液內, 在室溫下添加羰基二咪唑(41毫克, 0.26毫莫耳, 可市購得自Sigma-Aldrich公司)。將反應物加熱至100°C, 歷經30分鐘, 並添加異丙基脲(27毫克, 0.26毫莫耳)。將反應物攪拌過夜, 然後, 以鹽水使反應淬滅。以EtOAc萃取反應物。合併有機層, 以Na₂SO₄脫水乾燥, 及在真空中濃縮成淡黃色油。使此油藉急驟式層析純化(0至100% EtOAc在己烷中), 產生52毫克實例62, 為白色固體。¹H NMR

(400 MHz, CDCl₃) δ 8.06 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.60 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.25 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.26 (s, 1H), 6.15 (d, J=7.5 Hz, 1H), 4.31-4.42 (m, 1H), 3.09 (s, 3H), 2.96-3.08 (m, 2H), 2.21-2.45 (m, 5H), 1.76-1.88 (m, 3H), 1.61-1.73 (m, 2H), 1.31 (d, J=6.9 Hz, 6H). MS (ESI) 458 (M+H).

實例 63

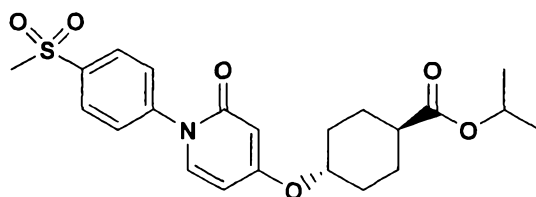
4-((順式)-4-(3-異丙基-1,2,4-噁二唑-5-基)環己基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 63 係根據實例 62 中所述之程序，以順式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸乙酯取代反式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸乙酯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.04 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.59 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.20 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.05 (d, J=7.5 Hz, 1H), 5.94 (s, 1H), 4.52-4.58 (m, 1H), 3.09 (s, 3H), 2.99-3.08 (m, 2H), 1.95-2.19 (m, 6H), 1.73-1.85 (m, 2H), 1.32 (d, J=7.0 Hz, 6H). MS (ESI) 458 (M+H).

實例 64

反式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸異丙酯之製備

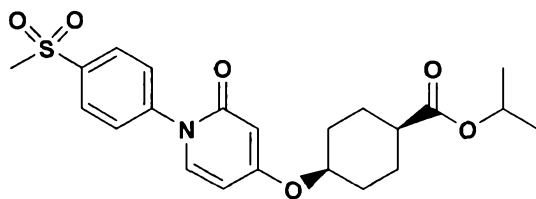


於反式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸酯(100毫克, 0.26毫莫耳)與二異丙基乙胺(65毫克, 0.5毫莫耳, 可市購得自Sigma-Aldrich公司)在無水DMF(2毫升)中之正在攪拌溶液內, 在室溫下, 添加2-碘丙烷(85毫克, 0.5毫莫耳, 可市購得自Sigma-Aldrich公司)。將反應物加熱至100°C過夜。使反應物冷卻至室溫, 然後於真空中濃縮成褐色固體。使此固體藉急驟式層析純化(30至100% EtOAc在己烷中), 產生65毫克實例64, 為白色固體。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.06 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.60 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.24 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.08 (s, 1H), 6.06 (d, J=7.5 Hz, 1H), 5.01 (七重峰, J=6.0 Hz, 1H), 4.24-4.28 (m, 1H), 3.09 (s, 3H), 2.28-2.35 (m, 1H), 2.18-2.25 (m, 2H), 2.06-2.11 (m, 2H), 1.47-1.73 (m, 4H), 1.23 (d, J=6.0 Hz, 6H). MS (ESI) 434 (M+H).

實例 65

順式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)

環己烷羧酸異丙酯之製備

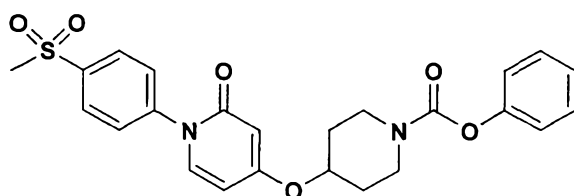


實例 65 係根據實例 66 中所述之程序, 以順式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸乙酯取代反式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸乙酯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.03 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.59 (d, J=8.5 Hz, 2H), 7.20 (d, J=7.5 Hz, 1H), 6.05 (d,

J=7.5 Hz, 1H), 5.96 (s, 1H), 5.00 (七重峰, J=6.2 Hz, 1H), 4.44-4.48 (m, 1H), 3.08 (s, 3H), 2.36-2.41 (m, 1H), 1.99-2.08 (m, 2H), 1.83-1.95 (m, 2H), 1.63-1.79 (m, 4H), 1.21 (d, J=6.2 Hz, 6H). MS (ESI) 434 (M+H).

實例 66

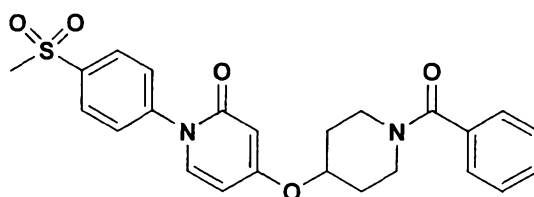
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸苯酯之製備



實例 66 係根據實例 3 中所述之程序，以氯甲酸苯酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 469 (M+H).

實例 67

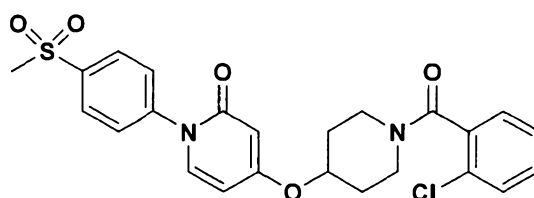
4-(1-苯甲醯基六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 67 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化苯甲醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 453 (M+H).

實例 68

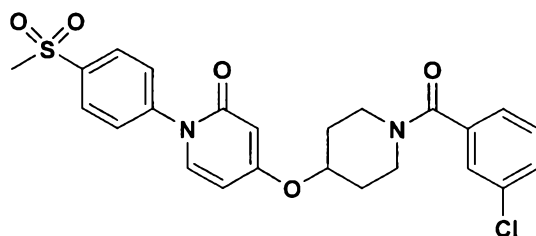
4-(1-(2-氯基苯甲醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 68 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化 2-氯基苯甲醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 488 (M+H).

實例 69

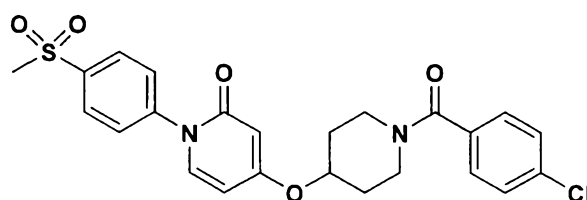
4-(1-(3-氯基苯甲醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 69 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化 3-氯基苯甲醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 488 (M+H).

實例 70

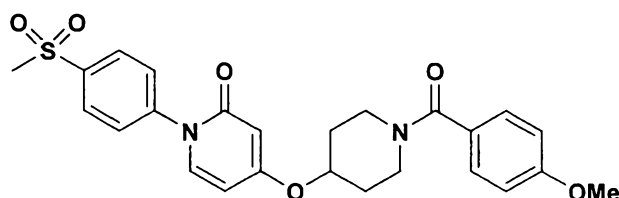
4-(1-(4-氯基苯甲醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 70 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化 4-氯基苯甲醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 488 (M+H).

實例 71

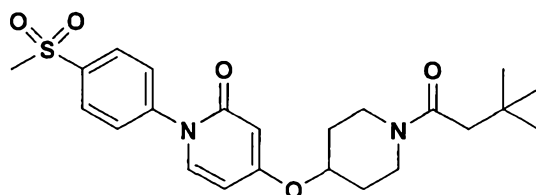
4-(1-(4-甲氧基苯甲醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 71 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化 4-甲氧苯甲醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 483 (M+H).

實例 72

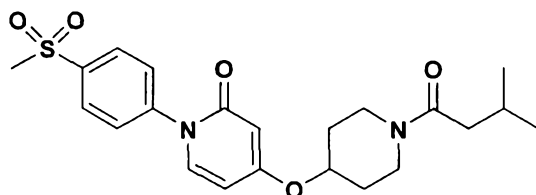
4-(1-(3,3-二甲基丁醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 72 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化 3,3-二甲基丁醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 447 (M+H).

實例 73

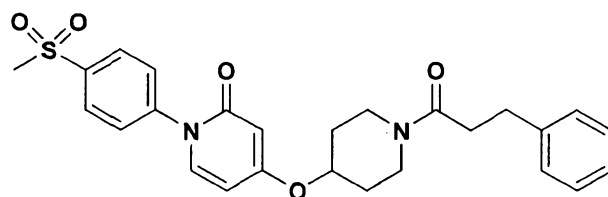
4-(1-(3-甲基丁醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 73 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化 3-甲基丁醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 433 (M+H).

實例 74

1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(3-苯丙醯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



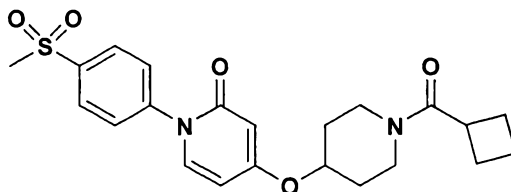
實例 74 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化 3-苯丙醯取代

氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 481 (M+H).

實例 75

4-(1-(環丁烷羰基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶

-2(1H)-酮之製備

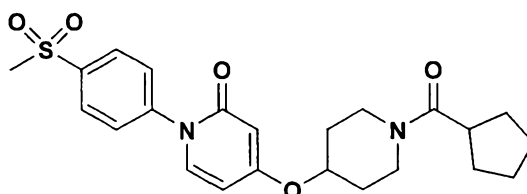


實例 75 係根據實例 3 中所述之程序，以環丁烷氯化碳醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 431 (M+H).

實例 76

4-(1-(環戊羰基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶

-2(1H)-酮之製備

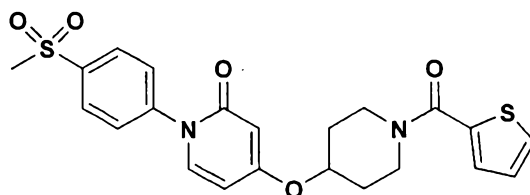


實例 76 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化環戊碳醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 445 (M+H).

實例 77

1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(噻吩-2-羰基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶

-2(1H)-酮之製備

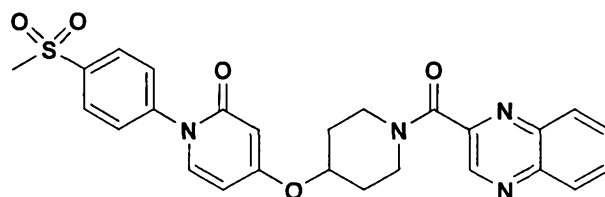


實例 77 係根據實例 3 中所述之程序，以噻吩-2-氯化碳醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 459 (M+H).

實例 78

1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(喹啉-2-羰基)六氫吡啶-4-基氧基)

吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備

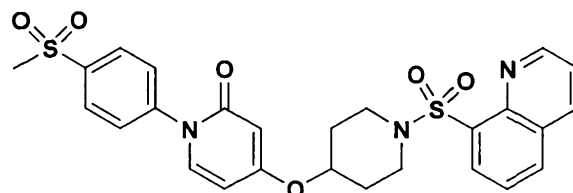


實例 78 係根據實例 3 中所述之程序，以喹啉-2-氯化碳醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 505 (M+H).

實例 79

1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(喹啉-8-基磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)

吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備

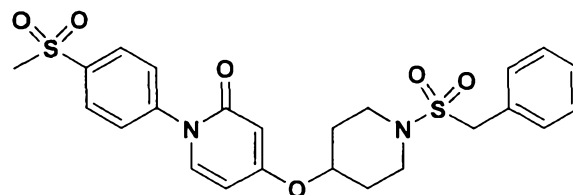


實例 79 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化喹啉-8-基磺醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 540 (M+H).

實例 80

4-(1-(苄基磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡

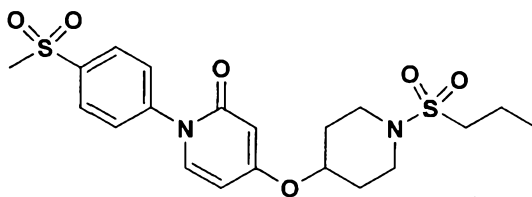
啶-2(1H)-酮之製備



實例 80 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化苄基磺醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 503 (M+H).

實例 81

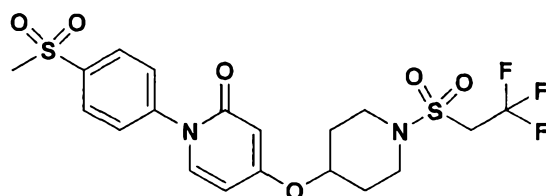
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(丙基磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 81 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化丙基磺醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 455 (M+H).

實例 82

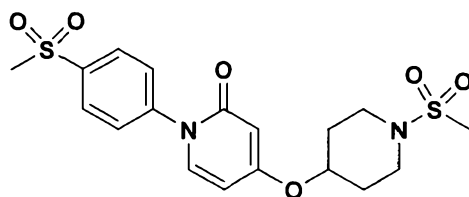
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(2,2,2-三氟乙基磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 82 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化 2,2,2-三氟乙基磺醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 495 (M+H).

實例 83

1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(甲磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

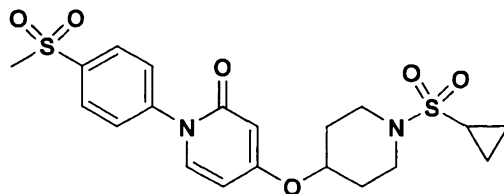


實例 83 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化甲基磺醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 427 (M+H).

實例 84

4-(1-(環丙基磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-甲磺醯基)苯基)

吡啶-2(1H)-酮之製備

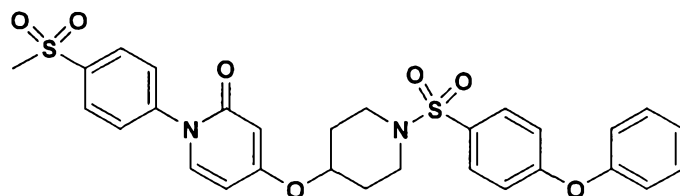


實例 84 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化環丙基磺醯取代氣甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 453 (M+H).

實例 85

1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(4-苯氧基苯磺醯基)六氫吡啶-4-基

氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

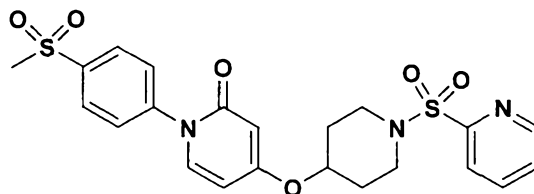


實例 85 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化苯氧基苯磺醯取代氣甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 581 (M+H).

實例 86

1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(吡啶-2-基磺醯基)六氫吡啶-4-基氧

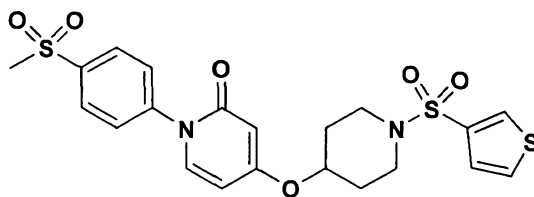
基)吡啶-2(1H)-酮，TFA 鹽之製備



實例 86 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化吡啶-2-基磺醯取代氣甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 490 (M+H).

實例 87

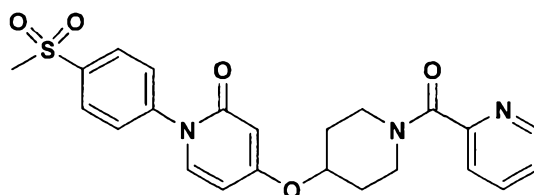
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(噻吩-3-基磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 87 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化噻吩-3-基磺醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 495 (M+H).

實例 88

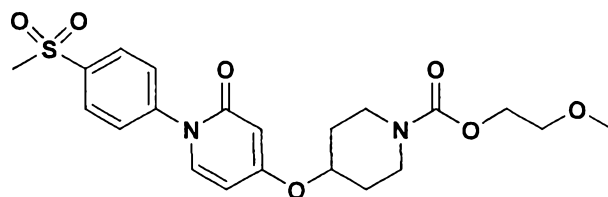
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-甲基吡啶醯基六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 88 係根據實例 3 中所述之程序，以氯化甲基吡啶醯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 454 (M+H).

實例 89

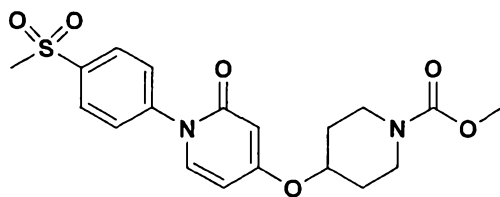
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 2-甲氧基乙酯之製備



實例 89 係根據實例 3 中所述之程序，以氯甲酸 2-甲氧基乙酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 451 (M+H).

實例 90

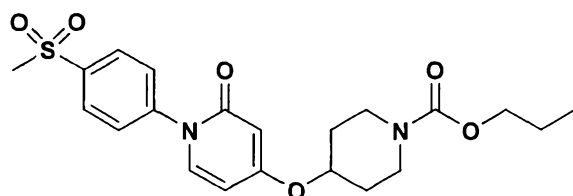
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸甲酯之製備



實例 90 係根據實例 3 中所述之程序，以氯甲酸甲酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 407 (M+H).

實例 91

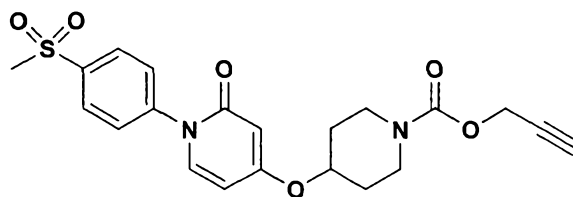
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸丙酯之製備



實例 91 係根據實例 3 中所述之程序，以氯甲酸丙酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 435 (M+H).

實例 92

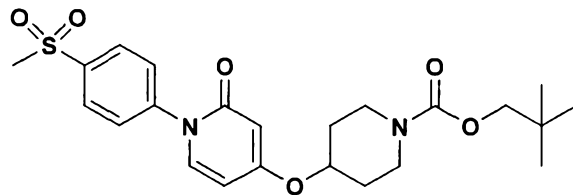
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸丙-2-炔酯之製備



實例 92 係根據實例 3 中所述之程序，以氯甲酸丙-2-炔酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 431 (M+H).

實例 93

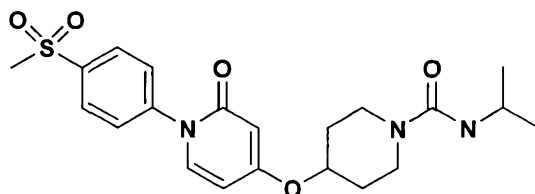
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 2,2-二甲基丙酯之製備



實例 93 係根據實例 3 中所述之程序，以氯甲酸 2,2-二甲基丙酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 463 (M+H).

實例 94

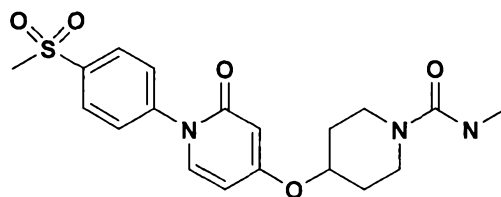
N-異丙基 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺之製備



實例 94 係根據實例 3 中所述之程序，以異氰酸異丙酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 434 (M+H).

實例 95

N-甲基 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺之製備

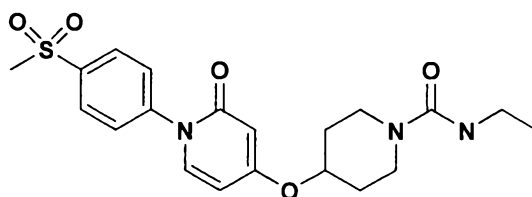


實例 95 係根據實例 3 中所述之程序，以異氰酸甲酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 406 (M+H).

實例 96

N-乙基 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)

六氫吡啶-1-羧醯胺之製備

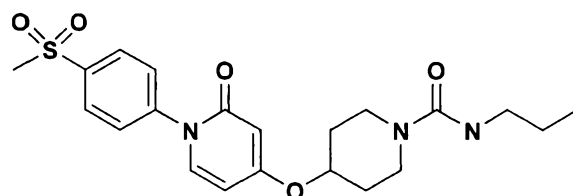


實例 96 係根據實例 3 中所述之程序，以異氰酸乙酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 420 (M+H).

實例 97

N-丙基 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)

六氫吡啶-1-羧醯胺之製備

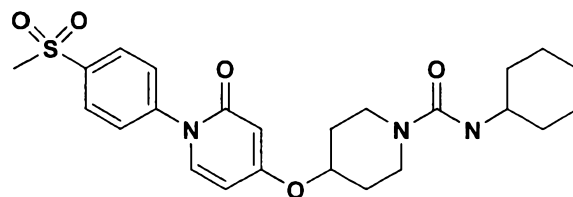


實例 97 係根據實例 3 中所述之程序，以異氰酸丙酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 434 (M+H).

實例 98

N-環己基 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)

六氫吡啶-1-羧醯胺之製備

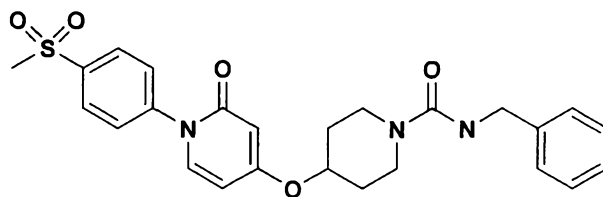


實例 98 係根據實例 3 中所述之程序，以異氰酸環己酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 474 (M+H).

實例 99

N-苄基 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)

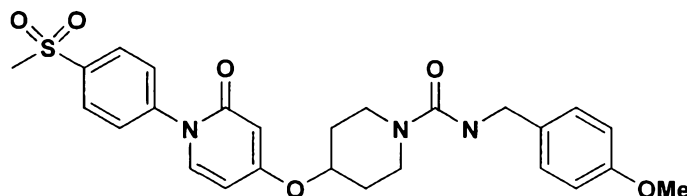
六氫吡啶-1-羧醯胺之製備



實例 99 係根據實例 3 中所述之程序，以異氰酸苄酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 481 (M+H).

實例 100

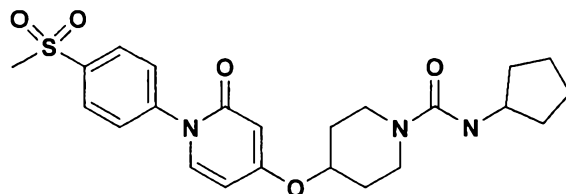
N-4-甲氧基苄基 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺之製備



實例 100 係根據實例 3 中所述之程序，以異氰酸 4-甲氧基苄酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 512 (M+H).

實例 101

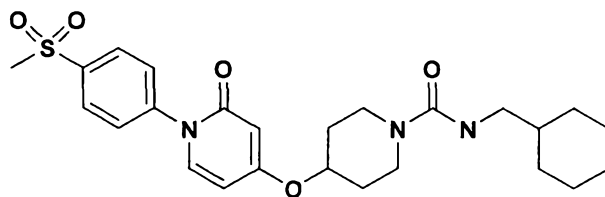
N-環戊基 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺之製備



實例 101 係根據實例 3 中所述之程序，以異氰酸環戊酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 460 (M+H).

實例 102

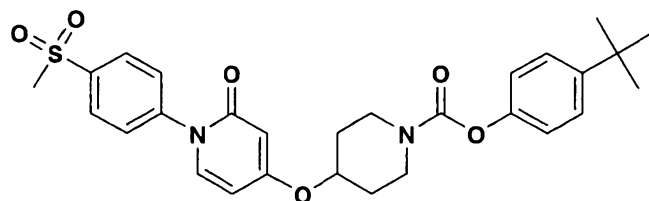
N-環己基甲基 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺之製備



實例 102 係根據實例 3 中所述之程序，以異氰酸環己基甲酯取代氯甲酸異丙酯而製成。MS (ESI) 488 (M+H).

實例 103

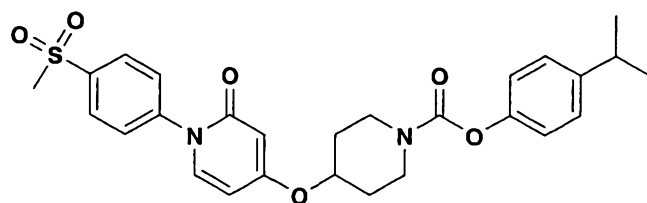
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-第三-丁基苯酯之製備



實例 103 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 4-第三-丁基酚取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.63 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.38 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.19-7.30 (m, 1H), 7.03 (d, J=8.80 Hz, 2H), 6.09 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 6.02 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.52-4.66 (m, 1H), 3.90 (表觀寬廣 s, 1H), 3.77-3.89 (m, 1H), 3.59-3.72 (m, 1H), 3.56 (表觀寬廣 s, 1H), 3.10 (s, 9H), 2.08 (m, 2H), 1.83-1.99 (m, 2H), 1.32 (s, 9H). MS (ESI) 525 (M+H).

實例 104

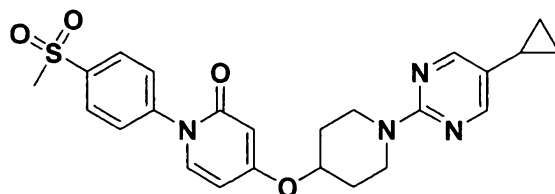
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-異丙基苯酯之製備



實例 104 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 4-異丙酚取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ 8.09 (d, $J=8.25$ Hz, 2H), 7.62 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.29 (d, $J=7.70$ Hz, 1H), 7.22 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.02 (d, $J=8.25$ Hz, 2H), 6.13-6.21 (m, 2H), 4.57-4.66 (m, 1H), 3.91 (表觀寬廣 s, 1H), 3.79-3.89 (m, 1H), 3.59-3.69 (m, 1H), 3.55 (表觀寬廣 s, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.85-2.96 (m, 1H), 2.09 (表觀寬廣 s, 2H), 1.84-2.00 (m, 2H), .24 (d, $J=6.60$ Hz, 6H). MS (ESI) 511 (M+H).

實例 105

4-(1-(5-環丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備

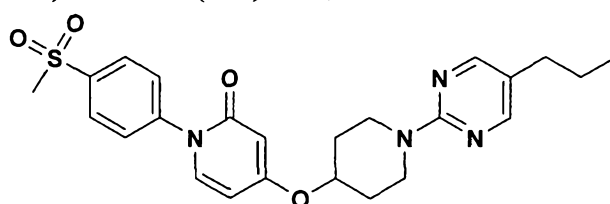


使 4-(1-(5-溴基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮 (47.0 毫克, 0.093 毫莫耳)、碳酸鉀 (64 毫克, 0.47 毫莫耳, EMD) 及環丙基二羥基硼烷 (24 毫克, 0.28 毫莫耳, Aldrich) 在 THF (0.8 毫升) 與水 (0.1 毫升) 中之混合物藉真空脫氣，並以氫滌氣。於所形成之混合物中，添加 1,1'-雙(二苯基膦基)二環戊二烯鐵-二氯化鈹(II)二氯甲烷錯合物 (7.65 毫克, 9.30 微莫耳, Aldrich)，然後在氫氣及 66°C 下攪拌 3 小時。使反應混合物冷卻至室溫，接著添加另一份環丙基

二羥基硼烷(24毫克, 0.28毫莫耳, Aldrich)與1,1'-雙(二苯基膦基)二環戊二烯鐵-二氯化鈹(II)二氯甲烷錯合物(7.65毫克, 9.30微莫耳, Aldrich)。將反應混合物於氫氣及66°C下再攪拌3小時, 然後在真空中濃縮成褐色固體。使此固體藉急驟式層析純化(SiO₂, 0至100% EtOAc在己烷中), 產生18毫克實例105, 為灰白色固體。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.13 (s, 2H), 8.07 (d, J=8.31 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.31 Hz, 2H), 7.23 (d, J=7.83 Hz, 1H), 6.06 (d, J=7.82 Hz, 1H), 6.00 (s, 1H), 4.55-4.59 (m, 1H), 4.15-4.21 (m, 2H), 3.59-3.66 (m, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.03-2.10 (m, 2H), 1.79-1.88 (m, 2H), 1.68-1.75 (m, 1H), 0.88-0.94 (m, 2H), 0.56-0.62 (m, 2H). MS (ESI) 467 (M+H).

實例 106

1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



步驟 A. 1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽之製備

將4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯(5.279克, 11.77毫莫耳)與氯化氫(37%, 在H₂O中, 40毫升, EMD)之混合物攪拌20分鐘, 然後於真空中濃縮。使所獲得之固體溶於甲醇(80毫升)中, 並添加乙醚(300毫升)。將所形成之固體過濾, 獲得4.52克

所要之產物，為灰白色固體。MS (ESI) 349 (M+H).

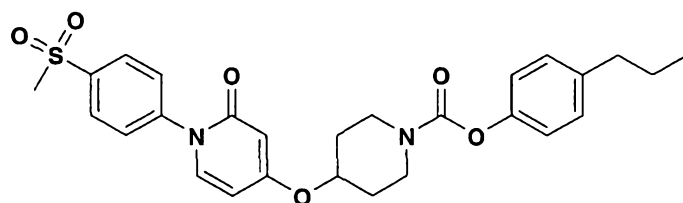
步驟 B. 實例 106

於 1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽 (4.50 克, 11.7 毫莫耳) 與碳酸鉀 (6.46 克, 46.8 毫莫耳, EMD) 在無水 DMF (180 毫升) 中之正在攪拌懸浮液內, 在室溫下, 添加 2-氯基-5-丙基嘧啶 (2.75 克, 17.54 毫莫耳, WAKO)。將反應混合物加熱至 100°C, 歷經 12 小時, 然後於真空中濃縮成褐色固體。使此固體藉急驟式層析純化 (SiO₂, 0 至 15% MeOH 在 CH₂Cl₂ 中, 及 SiO₂, 0 至 100% EtOAc 在 CH₂Cl₂ 中), 產生 3.988 克實例 106, 為淡黃色固體。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.17 (s, 2H), 8.07 (d, J=8.31 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.23 (d, J=7.83 Hz, 1H), 6.07 (dd, J=7.83, 2.45 Hz, 1H), 6.02 (d, J=2.45 Hz, 1H), 4.54-4.61 (m, 1H), 4.15-4.23 (m, 2H), 3.59-3.69 (m, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.41 (t, J=7.58 Hz, 2H), 2.04-2.12 (m, 2H), 1.79-1.90 (m, 2H), 1.53-1.62 (m, 2H), 0.94 (t, J=7.34 Hz, 3H). MS (ESI) 469 (M+H).

實例 107

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡

啶-1-羧酸 4-丙基苯酯之製備

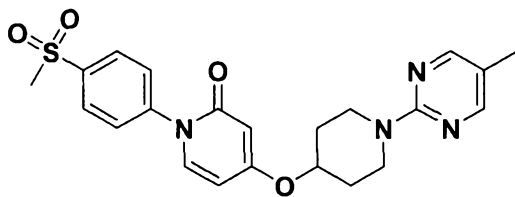


實例 107 係根據實例 2 中所述之程序, 在步驟 B, 以 4-丙酚取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.24-7.29 (m, 1H), 7.17 (d,

$J=8.25$ Hz, 2H), 7.01 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 6.11 (dd, $J=7.70, 2.20$ Hz, 1H), 6.07 (d, $J=2.75$ Hz, 1H), 4.53-4.66 (m, 1H), 3.91 (表觀寬廣 s, 1H), 3.78-3.88 (m, 1H), 3.59-3.71 (m, 1H), 3.52-3.60 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.50-2.64 (m, 2H), 2.09 (表觀寬廣 s, 2H), 1.80-1.98 (m, 2H), 1.55-1.72 (m, 2H), 0.94 (t, $J=7.42$ Hz, 3H). MS (ESI) 511 (M+H).

實例 108

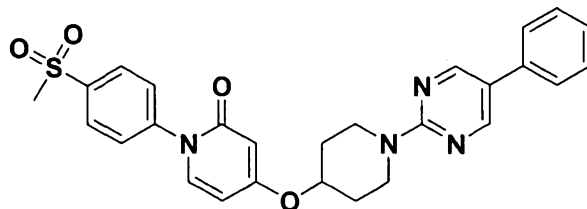
4-(1-(5-甲基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺酰基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



實例 108 係根據實例 105 中所述之程序，以甲基二羥基硼烷 (Aldrich) 取代環丙基二羥基硼烷而製成，惟使粗產物藉預備之 HPLC 純化 (C_{18} 管柱，10-100% MeOH 在含有 0.1% 三氟醋酸之水中)，於凍乾時，獲得實例 108。 ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ ppm 8.30 (s, 2H), 8.12 (d, $J=8.31$ Hz, 2H), 7.69 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J=7.83$ Hz, 1H), 6.28 (dd, $J=7.58, 2.69$ Hz, 1H), 6.10 (d, $J=2.45$ Hz, 1H), 4.78-4.85 (m, 1H), 4.12-4.20 (m, 2H), 3.68-3.77 (m, 2H), 3.18 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.05-2.17 (m, 2H), 1.80-1.90 (m, 2H). MS (ESI) 441 (M+H).

實例 109

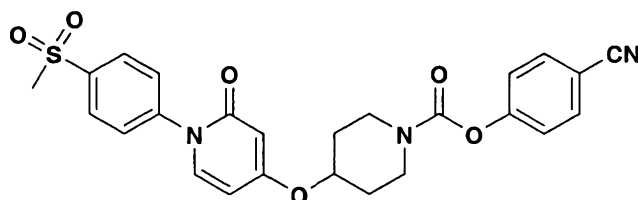
1-(4-(甲磺酰基)苯基)-4-(1-(5-苯基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



實例 109 係根據實例 105 中所述之程序，以苯基二羥基硼烷 (Aldrich) 取代環丙基二羥基硼烷，且以 DMF 取代 THF 而製成。將反應物於微波條件下在 120°C 下加熱 10 分鐘。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.56 (s, 2H), 8.06 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.40-7.50 (m, 4H), 7.31-7.38 (m, 1H), 7.23 (d, J=7.34 Hz, 1H), 6.07 (dd, J=7.83, 2.45 Hz, 1H), 6.02 (d, J=2.93 Hz, 1H), 4.57-4.66 (m, 1H), 4.19-4.28 (m, 2H), 3.70-3.80 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.05-2.15 (m, 2H), 1.83-1.94 (m, 2H). MS (ESI) 503 (M+H).

實例 110

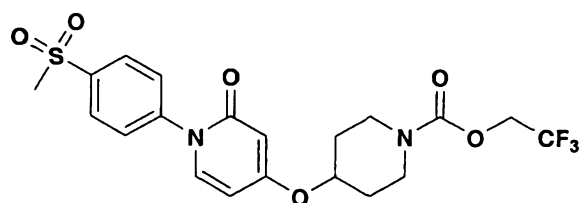
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-氰基苯酯之製備



實例 110 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 4-羥基苯甲腈取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.69 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.22-7.35 (m, 3H), 6.11 (dd, J=7.42, 2.47 Hz, 1H), 6.05 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.57-4.65 (m, 1H), 3.86-3.95 (m, 1H), 3.76-3.86 (m, 1H), 3.63-3.72 (m, 1H), 3.55-3.64 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.09 (表觀寬廣 s, 2H), 1.89-1.99 (m, 2H). MS (ESI) 494 (M+H).

實例 111

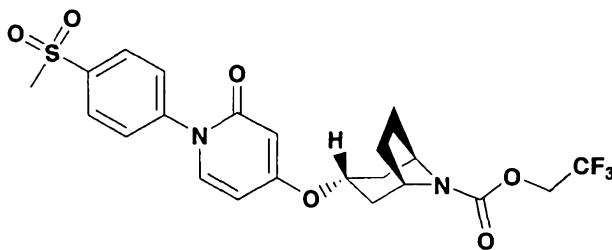
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 2,2,2-三氟乙酯之製備



實例 111 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 2,2,2-三氟乙醇取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.09 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.31 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.29 (d, J=2.20 Hz, 1H), 6.20 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 4.56-4.65 (m, 1H), 4.44-4.57 (m, 2H), 3.71-3.83 (m, 2H), 3.46-3.58 (m, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.02 (d 表觀寬廣 s, 2H), 1.86 (表觀寬廣 s, 2H). MS (ESI) 475 (M+H).

實例 112

(1R,5R)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸 2,2,2-三氟乙酯之製備

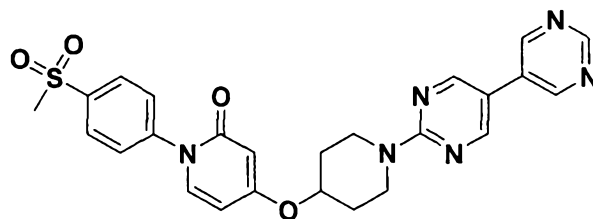


實例 112 係根據實例 2 中所述之程序，於步驟 A，以 (3-外向)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸第三-丁酯 (實例 25) 取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯，且在步驟 B，以 2,2,2-三氟乙醇取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.20-7.32 (m, 1H), 6.24 (d, J=2.75 Hz, 1H), 6.09 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 4.73-4.87 (m, 1H), 4.54-4.67 (m, 1H), 4.39-4.55

(m, 3H), 3.10 (s, 3H), 2.17-2.30 (m, 2H), 2.04-2.19 (m, 2H), 1.68-1.94 (m, 4H). MS (ESI) 501 (M+H).

實例 113

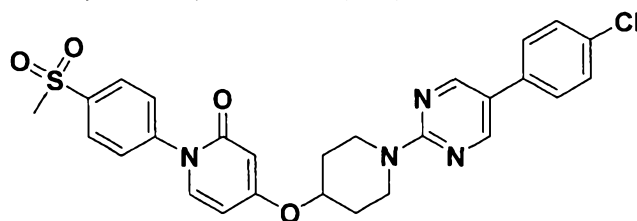
4-(1-(5,5'-雙嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 113 係根據實例 109 中所述之程序，以嘧啶-5-基二羥基硼烷(Maybridge)取代苯基二羥基硼烷而製成，惟使粗製固體藉急驟式層析純化(SiO₂，0 至 10% MeOH 在 CH₂Cl₂ 中)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 9.13 (s, 3H), 8.84 (s, 2H), 8.03 (d, J=8.31 Hz, 2H), 7.69 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.65 (d, J=7.34 Hz, 1H), 6.05-6.14 (m, 2H), 4.76-4.86 (m, 1H), 4.25-4.35 (m, 2H), 3.55-3.65 (m, 2H), 3.28 (s, 3H), 2.00-2.11 (m, 2H), 1.58-1.69 (m, 2H). MS (ESI) 505 (M+H).

實例 114

4-(1-(5-(4-氯苯基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備

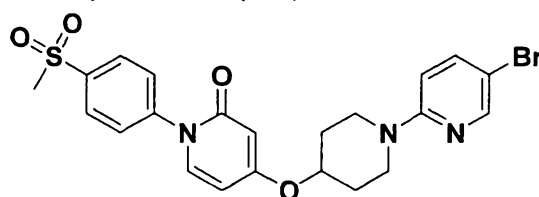


實例 114 係根據實例 106 中所述之程序，在步驟 B 中，以 2-氯基-5-(4-氯苯基)嘧啶(Peakdale)取代 2-氯基-5-丙基嘧啶而製成。將反應物於微波條件下在 140-160°C 下加熱 50 分鐘。使

粗製固體藉急驟式層析純化 (SiO₂, 0 至 100% EtOAc 在己烷中)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 8.72 (s, 2H), 8.00-8.05 (m, 2H), 7.67-7.71 (m, 4H), 7.65 (d, J=7.82 Hz, 1H), 7.40-7.55 (m, 2H), 6.07-6.13 (m, 2H), 4.76-4.83 (m, 1H), 4.24-4.33 (m, 2H), 3.53-3.62 (m, 2H), 3.28 (s, 3H), 2.01-2.09 (m, 2H), 1.58-1.68 (m, 2H). MS (ESI) 537 (M+H).

實例 115

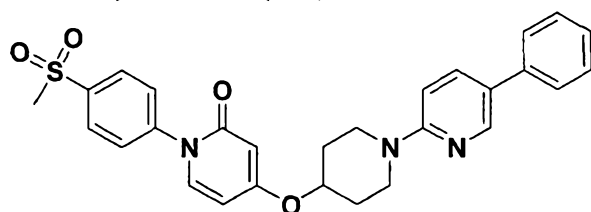
4-(1-(5-溴基吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 115 係根據實例 114 中所述之程序，以 5-溴基-2-氟基吡啶 (Aldrich) 取代 2-氟基-5-(4-氟苯基)吡啶而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.20 (d, J=2.45 Hz, 1H), 8.04-8.09 (m, 2H), 7.59-7.64 (m, 2H), 7.56 (dd, J=9.05, 2.20 Hz, 1H), 7.23 (d, J=7.82 Hz, 1H), 6.62 (d, J=9.29 Hz, 1H), 6.06 (dd, J=7.58, 2.69 Hz, 1H), 6.00 (d, J=2.45 Hz, 1H), 4.53-4.60 (m, 1H), 3.84-3.92 (m, 2H), 3.41-3.52 (m, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.05-2.14 (m, 2H), 1.84-1.94 (m, 2H). MS (ESI) 504 (M+H).

實例 116

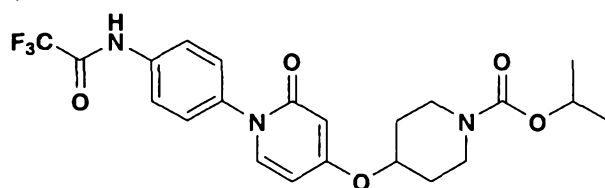
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-苯基吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 116 係根據實例 105 中所述之程序，以 4-(1-(5-溴基吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮取代 4-(1-(5-溴基吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮，以苯基二羥基硼烷 (Aldrich) 取代環丙基二羥基硼烷，及以 DMF 取代 THF 而製成。將反應物於微波條件下在 120°C 下加熱 10 分鐘。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 8.37 (d, J=2.45 Hz, 1H), 7.95 (d, J=8.31 Hz, 2H), 7.77 (dd, J=9.05, 2.20 Hz, 1H), 7.51-7.63 (m, 5H), 7.34 (t, J=7.58 Hz, 2H), 7.21 (t, J=7.82 Hz, 1H), 6.90 (d, J=8.80 Hz, 1H), 5.98-6.04 (m, 2H), 4.65-4.73 (m, 1H), 3.92-4.00 (m, 2H), 3.26-3.34 (m, 2H), 3.20 (s, 3H), 1.92-2.00 (m, 2H), 1.51-1.61 (m, 2H). MS (ESI) 502 (M+H).

實例 117

4-(2-酮基-1-(4-(2,2,2-三氟乙醯胺基)苯基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備



步驟 A. 4-(1-(4-胺基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備

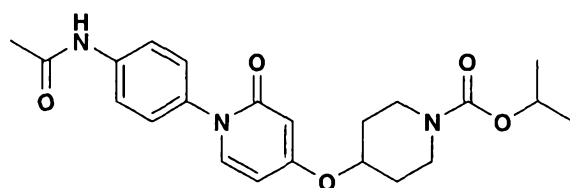
4-(1-(4-胺基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯係根據實例 8 中所述之程序，在步驟 C，以 4-碘苯基胺基甲酸第三-丁酯取代 4-溴基苯甲腈而製成，且於反應過程期間發生 BOC 保護基之分裂。MS (ESI) 372 (M+H).

步驟 B. 實例 117

將 4-(1-(4-胺基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯 (20 毫克, 0.054 毫莫耳)、吡啶 (0.022 毫升, 0.269 毫莫耳, EMD) 及氯化甲烷磺醯 (0.013 毫升, 0.162 毫莫耳, Aldrich) 在 CH_2Cl_2 (0.5 毫升) 中之混合物於室溫下攪拌 30 分鐘, 然後在減壓下蒸發。使殘留物藉預備之 HPLC 純化 (C_{18} 管柱; 20-100% 甲醇在含有 0.05% 三氟醋酸之水中), 於凍乾時, 獲得實例 117 (12.4 毫克, 灰白色固體 49%)。 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ 9.72 (s, 1H), 7.55 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.24-7.29 (m, 1H), 7.18 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 6.05-6.24 (m, 2H), 4.86-5.01 (m, 1H), 4.52-4.64 (m, 1H), 3.76 (表觀寬廣 s, 2H), 3.37-3.52 (m, 2H), 1.93-2.12 (m, 2H), 1.76-1.88 (m, 2H), 1.27 (d, $J=6.05$ Hz, 6H). MS (ESI) 468 (M+H).

實例 118

4-(1-(4-乙醯胺基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備

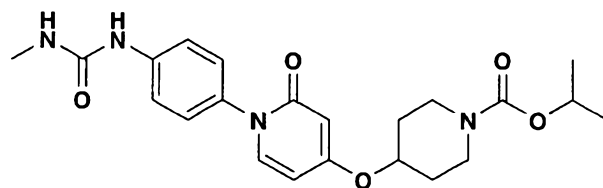


實例 118 係根據實例 117 中所述之程序, 在步驟 B, 以氯化乙醯取代氯化甲烷磺醯而製成。 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ 8.44 (d, $J=7.70$ Hz, 1H), 7.48 (d, $J=8.25$ Hz, 2H), 7.29 (d, $J=7.70$ Hz, 1H), 7.18 (d, $J=8.25$ Hz, 2H), 6.25 (d, $J=2.75$ Hz, 1H), 6.15 (dd, $J=7.42, 2.47$ Hz, 1H), 4.90-5.02 (m, 1H), 4.49-4.62 (m, 1H), 3.76 (表觀寬廣 s, 2H), 3.34-3.48 (m, 2H), 2.14 (s, 3H), 1.93-2.07 (m, 2H), 1.80 (表觀寬廣 s, 2H). MS (ESI) 449 (M+H).

實例 119

4-(1-(4-(3-甲基脲基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫

吡啶-1-羧酸異丙酯之製備

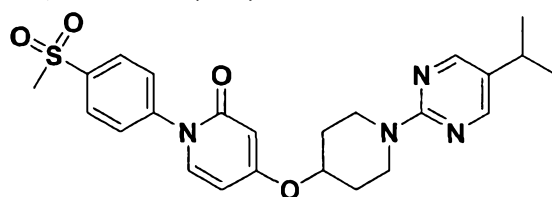


實例 118 係根據實例 117 中所述之程序，在步驟 B，以異氰酸甲酯取代氯化甲烷磺醯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 7.78 (寬廣 s, 1H), 7.23-7.29 (m, 1H), 7.11-7.18 (m, 2H), 7.05-7.11 (m, 1H), 6.05-6.17 (m, 2H), 4.88-5.00 (m, 1H), 4.51-4.60 (m, 1H), 3.68-3.81 (m, 2H), 3.36-3.50 (m, 2H), 2.79 (s, 3H), 1.99 (表觀寬廣 s, 2H), 1.82 (表觀寬廣 s, 2H), 1.27 (d, J=6.60 Hz, 6H). MS (ESI) 429 (M+H).

實例 120

4-(1-(5-異丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)

苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



步驟 A. 丙-1-烯-2-基二羥基硼烷之製備

於丙-1-烯-2-基溴化鎂 (0.5N，在 THF 中，20 毫升，10.00 毫莫耳，Aldrich) 在 THF (12.00 毫升) 中之正在攪拌溶液內，在室溫下，添加硼酸三甲酯 (3.34 毫升，30.0 毫莫耳，Aldrich)。將反應物在室溫下攪拌 2.5 小時，然後冷卻至 0°C。於反應物中添加氯化氫 (1N，在 H₂O 中，12 毫升)，並攪拌 10 分鐘。將所形成之混合物以乙醚 (2 x 20 毫升) 萃取。合併有機層，以

Na₂SO₄脫水乾燥，及在真空中濃縮，產生600毫克粗產物，為白色固體。

步驟 B. 1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(丙-1-烯-2-基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

將4-(1-(5-溴基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮(103毫克，0.20毫莫耳)、碳酸鉀(140毫克，1.02毫莫耳，EMD)及丙-1-烯-2-基二羥基硼烷(52.4毫克，0.610毫莫耳)在DMF(1.8毫升)與水(0.2毫升)中之混合物藉真空脫氣，並以氫滌氣。於所形成之混合物中，添加1,1'-雙(二苯基膦基)二環戊二烯鐵-二氯化鈹(II)二氯甲烷錯合物(16.72毫克，0.020毫莫耳，Aldrich)，然後在微波條件下，於120°C下加熱20分鐘。使反應混合物在真空中濃縮成褐色固體。使此固體藉急驟式層析純化(SiO₂，0至100% EtOAc在己烷中)，產生25毫克所要之產物，為淡黃色固體。MS (ESI) 467 (M+H).

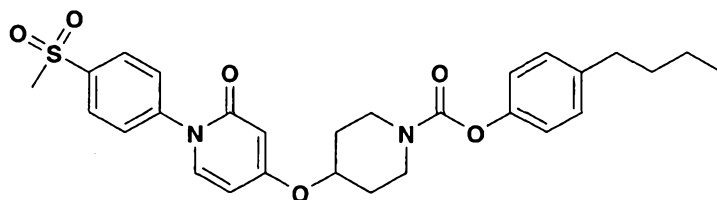
步驟 C. 實例 120

將1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(丙-1-烯-2-基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮(25毫克，0.054毫莫耳)與鈹/活性碳(20毫克，10重量%，潮濕，Aldrich)在MeOH(10毫升)中之正在攪拌懸浮液於氫(1大氣壓)下放置1小時。將所形成之混合物以氫滌氣，然後經過45微米注射濾器過濾。使濾液在真空中濃縮成黃色油。使此油藉預備之HPLC純化(C₁₈管柱，10-100% MeOH在含有0.1%三氟醋酸之水中)，於凍乾時，產生12.3毫克實例120，為白色固體。¹H NMR (400 MHz,

CDCl₃) δ ppm 8.22 (s, 2H), 7.97-8.04 (m, 2H), 7.52-7.59 (m, 2H), 7.17 (d, J=7.34 Hz, 1H), 6.02 (dd, J=7.82, 2.45 Hz, 1H), 5.98 (d, J=2.45 Hz, 1H), 4.48-4.60 (m, 1H), 4.04-4.15 (m, 2H), 3.59-3.72 (m, 2H), 3.03 (s, 3H), 2.68-2.81 (m, 1H), 1.95-2.09 (m, 2H), 1.75-1.90 (m, 2H), 1.18 (d, J=6.85 Hz, 6H). MS (ESI) 469 (M+H).

實例 121

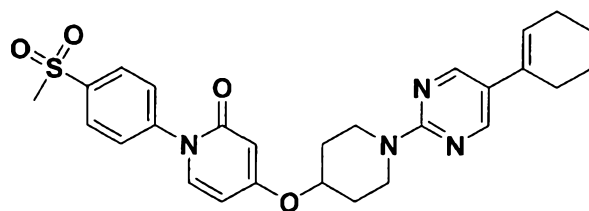
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-丁基苯酯之製備



實例 110 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 4-正-丁基酚取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.09 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.37 (d, J=7.15 Hz, 1H), 7.17 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.00 (d, J=8.25 Hz, 2H), 6.52 (d, J=2.75 Hz, 1H), 6.31 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H), 4.62-4.72 (m, 1H), 3.89-4.00 (m, 1H), 3.87 (表觀寬廣 s, 1H), 3.66 (表觀寬廣 s, 1H), 3.56 (表觀寬廣 s, 1H), 3.11 (s, 3H), 2.53-2.66 (m, 2H), 2.12 (表觀寬廣 s, 2H), 1.88-1.98 (m, 2H), 1.52-1.64 (m, 2H), 1.27-1.42 (m, 2H), 0.92 (t, J=7.42 Hz, 3H). MS (ESI) 525 (M+H).

實例 122

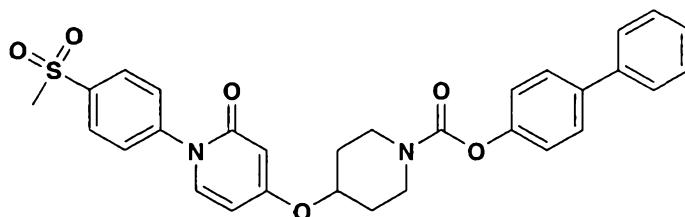
4-(1-(5-環己烯基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 122 係根據實例 109 中所述之程序，以環己烯基二羥基硼烷 (Combi-Phos) 取代苯基二羥基硼烷而製成。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 8.43 (s, 2H), 8.03 (d, J=8.31 Hz, 2H), 7.68 (d, J=8.31 Hz, 2H), 7.64 (d, J=7.82 Hz, 1H), 6.02-6.15 (m, 3H), 4.70-4.84 (m, 1H), 4.16-4.29 (m, 2H), 3.44-3.57 (m, 2H), 3.28 (s, 3H), 2.25-2.35 (m, 2H), 2.09-2.19 (m, 2H), 1.93-2.07 (m, 2H), 1.65-1.76 (m, 2H), 1.53-1.64 (m, 4H). MS (ESI) 507 (M+H).

實例 123

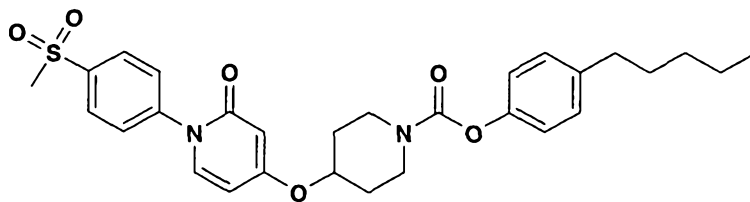
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸聯苯-4-基酯之製備



實例 123 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以聯苯基-4-醇取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.63 (d, J=7.70 Hz, 2H), 7.58 (t, J=7.97 Hz, 4H), 7.44 (t, J=7.42 Hz, 2H), 7.35 (t, J=6.87 Hz, 1H), 7.24-7.28 (m, 1H), 7.19 (d, J=8.25 Hz, 2H), 6.09 (dd, 1H), 6.01 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.54-4.66 (m, 1H), 3.94 (表觀寬廣 s, 1H), 3.84 (表觀寬廣 s, 1H), 3.67 (表觀寬廣 s, 1H), 3.69 (表觀寬廣 s, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.10 (表觀寬廣 s, 2H), 1.95 (表觀寬廣 s, 2H). MS (ESI) 555 (M+H).

實例 124

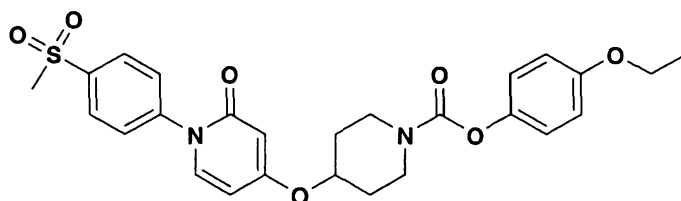
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-戊基苯酯之製備



實例 124 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 4-戊基酚 (Alfa Aesar) 取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.10 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.38 (d, J=7.15 Hz, 1H), 7.17 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.00 (d, J=8.25 Hz, 2H), 6.57 (d, J=2.20 Hz, 1H), 6.34 (dd, J=7.42, 2.47 Hz, 1H), 4.62-4.75 (m, 1H), 3.79-4.03 (m, 2H), 3.62 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.46-2.71 (m, 2H), 2.13 (表觀寬廣 s, 2H), 1.93 (m, 2H), 1.52-1.69 (m, 2H), 1.22-1.44 (m, 4H), 0.89 (t, J=6.87 Hz, 3H). MS (ESI) 539 (M+H).

實例 125

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-乙氧基苯酯之製備

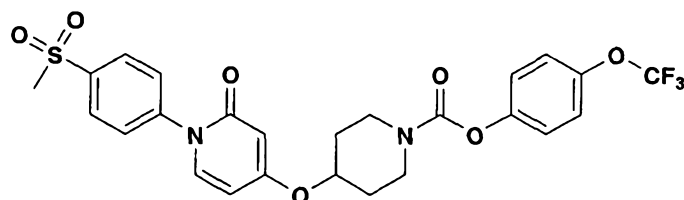


實例 125 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 4-乙氧基酚取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.09 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.35 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.01 (d, J=8.80 Hz, 2H), 6.87 (d, J=8.80 Hz, 2H), 6.48 (d, J=2.20 Hz, 1H), 6.29 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 4.61-4.72 (m, 1H), 4.01 (q, J=6.78 Hz,

2H), 3.93 (表觀寬廣 s, 1H), 3.80-3.89 (m, 1H), 3.60-3.70 (m, 1H), 3.55 (表觀寬廣 s, 1H), 3.11 (s, 3H), 2.12 (表觀寬廣 s, 2H), 1.86-1.98 (m, 2H), 1.41 (t, J=6.87 Hz, 3H). MS (ESI) 513 (M+H).

實例 126

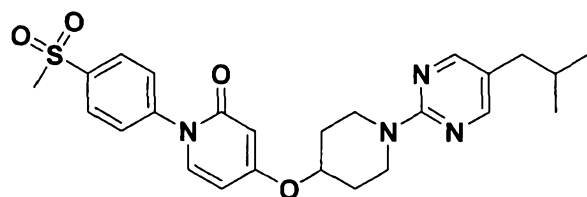
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-(三氟甲氧基)苯酯之製備



實例 126 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 4-(三氟甲氧基)酚 (Aldrich) 取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) 8.10 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.38 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.23 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.15 (d, J=8.80 Hz, 2H), 6.56 (d, J=2.75 Hz, 1H), 6.33 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H), 4.61-4.78 (m, 1H), 3.90-4.01 (m, 1H), 3.85 (表觀寬廣 s, 1H), 3.68 (表觀寬廣 s, 1H), 3.57 (表觀寬廣 s, 1H), 3.12 (s, 3H), 2.13 (表觀寬廣 s, 2H), 1.87-1.99 (m, 2H). MS (ESI) 553 (M+H).

實例 127

4-(1-(5-異丁基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備

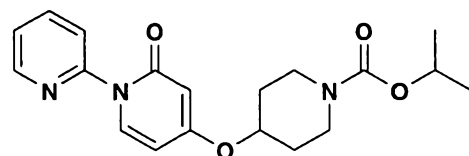


實例 127 係根據實例 120 步驟 B 與 C 中所述之程序，在步驟 B 中，以 2-甲基丙-1-烯基二羥基硼烷 (Synthonix) 取代丙-1-烯-2-

基二羥基硼烷而製成。使粗產物藉急驟式層析純化(SiO₂, 0 至 100% EtOAc 在 CH₂Cl₂ 中)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.14 (s, 2H), 8.07 (d, J=8.31 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.23 (d, J=7.82 Hz, 1H), 6.07 (dd, J=7.82, 2.45 Hz, 1H), 6.02 (d, J=2.45 Hz, 1H), 4.53-4.62 (m, 1H), 4.14-4.24 (m, 2H), 3.60-3.71 (m, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.30 (d, J=7.34 Hz, 2H), 2.03-2.13 (m, 2H), 1.81-1.90 (m, 2H), 1.70-1.80 (m, 1H), 0.91 (d, J=6.85 Hz, 6H). MS (ESI) 483 (M+H).

實例 128

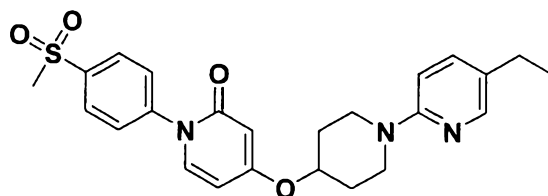
4-(2-酮基-1-(吡啶-2-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯, TFA 鹽之製備



實例 128 係根據實例 8 中所述之程序, 在步驟 C, 以 2-碘基吡啶 (TCI) 取代 4-溴基苯甲腈而製成。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.56 (d, J=4.0 Hz, 1H), 7.94 (td, J=7.7, 1.7 Hz, 1H), 7.82 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.74 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.44 (dd, J=6.8, 5.1 Hz, 1H), 6.09 (dd, J=7.8, 2.7 Hz, 1H), 5.99 (d, J=2.5 Hz, 1H), 4.77 (spt, J=6.3 Hz, 1H), 4.63-4.71 (m, 1H), 3.64-3.74 (m, 2H), 3.22 (t, J=10.0 Hz, 2H), 1.84-2.01 (m, 2H), 1.44-1.65 (m, 2H), 1.18 (d, J=6.3 Hz, 6H). MS (ESI) 358 (M+H).

實例 129

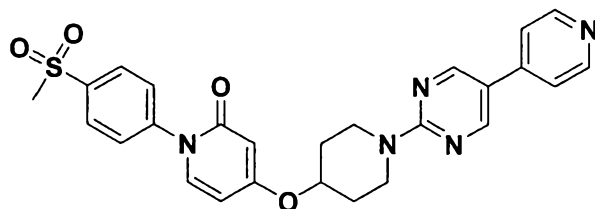
4-(1-(5-乙基吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



實例 129 係根據實例 116 中所述之程序，以乙基二羥基硼烷 (Alfa Aesar) 取代苯基二羥基硼烷而製成，惟將反應物於微波條件下在 120-130°C 下加熱 25 分鐘，並使粗產物藉預備之 HPLC 純化 (C₁₈ 管柱，10-100% MeOH 在含有 0.1% 三氟醋酸之水中)，於凍乾時，產生 4.7 毫克實例 129。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 8.02 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.97 (s, 1H), 7.69 (d, J=8.31 Hz, 1H), 7.55 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.22 (d, J=7.34 Hz, 1H), 6.90 (d, J=8.80 Hz, 1H), 6.06 (s, 1H), 6.04 (s, 1H), 4.59-4.70 (m, 1H), 3.73-3.90 (m, 4H), 3.03 (s, 3H), 2.54 (q, J=7.66 Hz, 2H), 1.99-2.19 (m, 4H), 1.18 (t, J=7.58 Hz, 3H). MS (ESI) 454 (M+H).

實例 130

1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(吡啶-4-基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

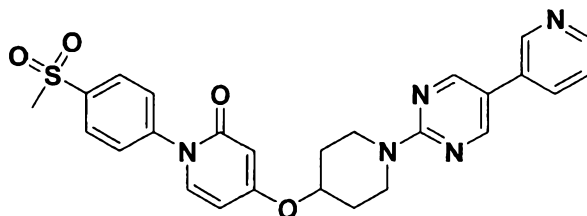


實例 130 係根據實例 113 中所述之程序，以吡啶-4-基二羥基硼烷 (Frontier Scientific) 取代嘧啶-5-基二羥基硼烷而製成。在最後純化步驟中，將所形成之固體以 CH₂Cl₂ 洗滌。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 8.88 (s, 2H), 8.56-8.62 (m, 2H), 7.99-8.08 (m, 2H), 7.67-7.75 (m, 4H), 7.65 (d, J=7.82 Hz, 1H), 6.10-6.14 (m, 1H), 6.09 (d, J=2.45 Hz, 1H), 4.78-4.86 (m, 1H), 4.24-4.44 (m, 2H), 3.55-3.72

(m, 2H), 3.29 (s, 3H), 1.99-2.15 (m, 2H), 1.58-1.75 (m, 2H). MS (ESI) 504 (M+H).

實例 131

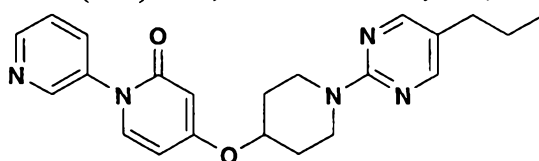
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(吡啶-3-基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 131 係根據實例 113 中所述之程序，以吡啶-3-基二羥基硼烷 (Frontier Scientific) 取代嘧啶-5-基二羥基硼烷而製成。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 8.89 (d, J=2.45 Hz, 1H), 8.78 (s, 2H), 8.53 (dd, J=4.65, 1.71 Hz, 1H), 8.05-8.10 (m, 1H), 8.00-8.05 (m, 2H), 7.67-7.73 (m, 2H), 7.65 (d, J=7.34 Hz, 1H), 7.43-7.49 (m, 1H), 6.10-6.15 (m, 1H), 6.09 (d, J=2.93 Hz, 1H), 4.76-4.86 (m, 1H), 4.24-4.35 (m, 2H), 3.55-3.66 (m, 2H), 3.29 (s, 3H), 2.00-2.12 (m, 2H), 1.57-1.71 (m, 2H). MS (ESI) 504 (M+H).

實例 132

4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(吡啶-3-基)吡啶-2(1H)-酮，TFA 鹽之製備



步驟 A. 4-(2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-1-(吡啶-3-基)吡啶-2(1H)-酮第三-丁酯之製備

將 4-羥基吡啶-2(1H)-酮 (1.2 克，10.8 毫莫耳，根據實例 8 步

驟A所述之程序製成)、4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯(4.83克, 17.3毫莫耳, 根據實例1步驟C所述之程序製成)及碳酸鉀(3.13克, 22.7毫莫耳)在DMF(45毫升)中之正在攪拌混合物於90°C下加熱14小時, 然後冷卻至室溫。將所形成之混合物以EtOAc與H₂O稀釋, 並以EtOAc進一步萃取(5x)水層。將合併之萃液以鹽水洗滌, 脫水乾燥(Na₂SO₄), 及在減壓下蒸發。使殘留物於矽膠上藉急驟式層析純化(0至10% MeOH/CH₂Cl₂), 產生1.23克(38.7%)產物, 為略帶粉紅色固體。MS (ESI) 295 (M+H).

步驟B. 4-(2-酮基-1-(吡啶-3-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備

將3-碘基吡啶(287毫克, 1.400毫莫耳, TCI)、4-(2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯(206毫克, 0.7毫莫耳)、喹啉-8-醇(40.6毫克, 0.280毫莫耳, Alfa Aesar)、碘化銅(I)(9.49微升, 0.280毫莫耳, Aldrich)及碳酸鈹(296毫克, 0.910毫莫耳, Aldrich)在DMSO(0.8毫升)中之混合物於125°C下加熱3小時。將反應混合物以EtOAc與水稀釋, 並過濾。分離濾液, 且以EtOAc進一步萃取水層。將合併之有機層以鹽水洗滌, 脫水乾燥(Na₂SO₄), 及在減壓下蒸發。使殘留物於矽膠上藉急驟式層析純化(0-10% MeOH/CH₂Cl₂), 而得標題化合物(165.7毫克, 64%), 為黃色固體。MS (ESI) 372 (M+H).

步驟C. 4-(六氫吡啶-4-基氧基)-1-(吡啶-3-基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽之製備

將4-(2-酮基-1-(吡啶-3-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶

-1-羧酸第三-丁酯(142毫克, 0.382毫莫耳)、氯化氫(4.0M, 在1,4-二氧陸園中, 1.5毫升, Aldrich)在MeOH(1.5毫升)中之混合物於室溫下攪拌45分鐘, 然後濃縮, 獲得產物(115毫克), 為淡橘色固體。將此物質使用在下一步驟中, 無需進一步純化。MS (ESI) 272 (M+H).

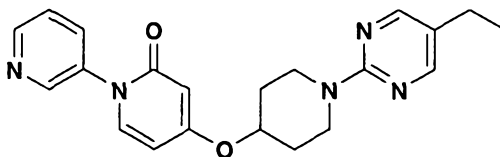
步驟D. 實例 132

將4-(六氫吡啶-4-基氧基)-1-(吡啶-3-基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽(30.8毫克, 0.1毫莫耳)、2-氯基-5-丙基嘓啶(31.3毫克, 0.200毫莫耳, Maybridge)及碳酸鈉(81毫克, 0.25毫莫耳, Aldrich)在DMF(0.6毫升)中之混合物於微波條件(160°C, 30分鐘)下加熱。使反應混合物藉預備之HPLC純化(C₁₈管柱; 0-85%甲醇在含有0.05%三氟醋酸之水中), 於凍乾時, 獲得實例132(4.1毫克, 灰白色黏性固體, 10.5%)。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.86 (s, 1H), 8.78 (d, J=4.40 Hz, 1H), 8.43 (s, 2H), 8.22 (d, J=8.25 Hz, 1H), 7.78 (dd, J=7.97, 5.22 Hz, 1H), 7.37 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.34 (d, J=2.20 Hz, 1H), 6.26 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 4.67-4.82 (m, 1H), 3.95-4.19 (m, 4H), 2.55 (t, J=7.70 Hz, 2H), 2.01-2.22 (m, 4H), 1.57-1.73 (m, 2H), 0.99 (t, J=7.42 Hz, 3H). MS (ESI) 292 (M+H).

實例 133

4-(1-(5-乙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(吡啶-3-基)吡啶

-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備

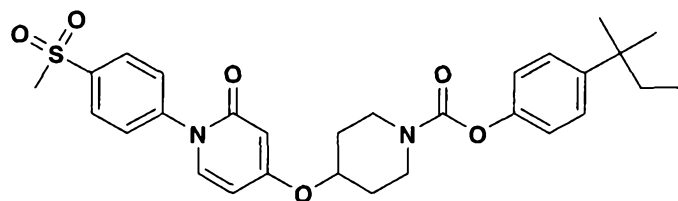


實例 133 係根據實例 132 中所述之程序, 在步驟 D, 以 2-

氣基-5-乙基嘧啶 (Aldrich) 取代 2-氣基-5-丙基嘧啶而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.94 (s, 1H), 8.81 (d, J=4.40 Hz, 1H), 8.43 (s, 2H), 8.31 (d, J=8.25 Hz, 1H), 7.86 (dd, J=7.70, 5.50 Hz, 1H), 7.42 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.38 (s, 1H), 6.30 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 2H), 4.74-4.81 (m, 1H), 3.94-4.18 (m, 4H), 2.63 (q, J=7.70 Hz, 2H), 2.01-2.23 (m, 4H), 1.28 (t, J=7.70 Hz, 3H). MS (ESI) 378 (M+H).

實例 134

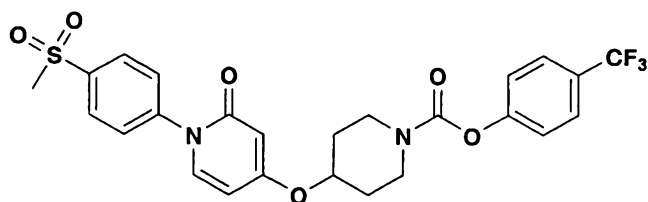
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-第三-戊基苯酯之製備



實例 134 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 4-第三-戊基酚 (Aldrich) 取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.09 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.29-7.33 (m, 3H), 7.03 (d, J=8.80 Hz, 2H), 6.25 (d, J=2.20 Hz, 1H), 6.19 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 4.54-4.68 (m, 1H), 3.93 (表觀寬廣 s, 1H), 3.84 (表觀寬廣 s, 1H), 3.64 (表觀寬廣 s, 1H), 3.55 (表觀寬廣 s, 1H), 3.11 (s, 3H), 2.10 (表觀寬廣 s, 2H), 1.85-1.98 (m, 2H), 1.63 (q, J=7.70 Hz, 2H), 1.27 (s, 6H), 0.68 (t, J=7.42 Hz, 3H). MS (ESI) 539 (M+H).

實例 135

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-(三氟甲基)苯酯之製備

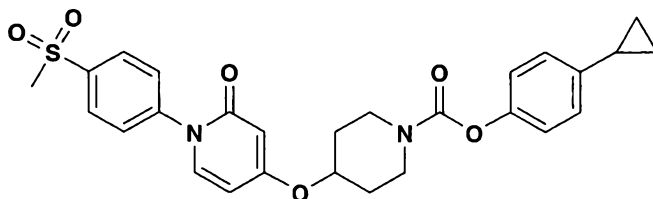


實例 135 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 4-(三氟甲基)酚 (Janssen) 取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.09 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.63 (dd, J=14.30, 8.80 Hz, 4H), 7.35 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.25 (d, J=8.25 Hz, 2H), 6.45 (d, J=2.75 Hz, 1H), 6.27 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 4.63-4.72 (m, 1H), 3.89-3.99 (m, 1H), 3.85 (表觀寬廣 s, 1H), 3.68 (表觀寬廣 s, 1H), 3.51-3.63 (m, 1H), 3.11 (s, 3H), 2.13 (表觀寬廣 s, 2H), 1.88-2.01 (m, 2H). MS (ESI) 537 (M+H).

實例 136

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡

啶-1-羧酸 4-環丙基苯酯之製備



步驟 A. 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-溴苯酯之製備

於 1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸 (154 毫克, 0.40 毫莫耳) 與二異丙基乙胺 (0.35 毫升, 0.20 毫莫耳) 在 CH₂Cl₂ (1.5 毫升) 中之混合物內，在室溫下，添加 CH₂Cl₂ (1.0 毫升) 中之氯甲酸 4-溴苯酯 (根據實例 2 步驟 B 所述之程序，以 4-溴酚取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成)。將所形成之混合物於室溫下攪拌 3 小時，以 CH₂Cl₂ 稀釋，並以水與鹽水洗滌。使有機層脫水乾燥 (Na₂SO₄)，及在減壓下蒸

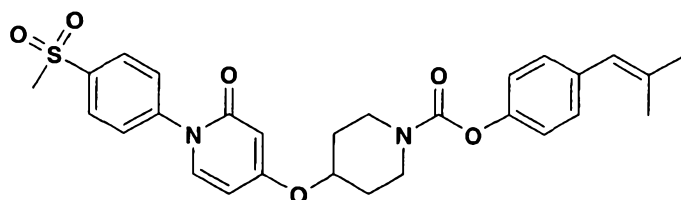
發。使粗產物於矽膠上藉急驟式層析純化(0-100% EtOAc/己烷)，而得標題化合物(159毫克，73%)，為淡黃色固體。MS (ESI) 547, 549 (M+H).

步驟 B. 實例 136

將 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-溴苯酯(38.3 毫克，0.07 毫莫耳)、1,1'-雙(二苯基膦基)二環戊二烯鐵-二氯化鈮(II)二氯甲烷錯合物(5.76 毫克，7.00 微莫耳，Combiphos Catalysts 公司)、環丙基二羥基硼烷(18.04 毫克，0.210 毫莫耳，Aldrich)及碳酸鈮(114 毫克，0.350 毫莫耳，Aldrich)在 DMF (0.5 毫升)與水(0.1 毫升)中之混合物於微波條件(120°C，20 分鐘)下加熱。使反應混合物藉預備之 HPLC 純化(C₁₈管柱；30-100% 甲醇在含有 0.05% 三氟醋酸之水中)，於凍乾時，獲得實例 136 (4.1 毫克，米黃色固體，19%)。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.28 (d, J=7.15 Hz, 1H), 7.06 (d, J=8.80 Hz, 2H), 6.99 (d, J=8.80 Hz, 2H), 6.12-6.19 (m, 2H), 4.53-4.67 (m, 1H), 3.91 (表觀寬廣 s, 1H), 3.83 (表觀寬廣 s, 1H), 3.63 (表觀寬廣 s, 1H), 3.49-3.57 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.09 (表觀寬廣 s, 2H), 1.81-1.99 (m, 3H), 0.94 (q, J=6.60 Hz, 2H), 0.59-0.73 (m, 2H). MS (ESI) 509 (M+H).

實例 137

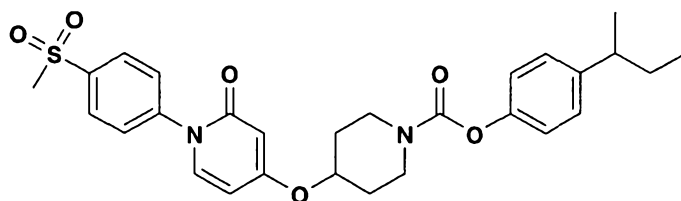
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-(2-甲基丙-1-烯基)苯酯之製備



實例 137 係根據實例 136 中所述之程序，在步驟 B，以 2-甲基丙-1-烯基二羥基硼烷 (Synthonix) 取代環丙基二羥基硼烷而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.09 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.32 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.21 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.05 (d, J=8.80 Hz, 2H), 6.33 (s, 1H), 6.19-6.26 (m, 2H), 4.65 (d, J=3.30 Hz, 1H), 3.94 (表觀寬廣 s, 1H), 3.85 (表觀寬廣 s, 1H), 3.65 (表觀寬廣 s, 1H), 3.56 (表觀寬廣 s, 1H), 3.11 (s, 3H), 2.11 (表觀寬廣 s, 2H), 1.88-1.96 (m, 2H), 1.90 (s, 3H), 1.85 (s, 3H). MS (ESI) 523 (M+H).

實例 138

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-第二-丁基苯酯之製備

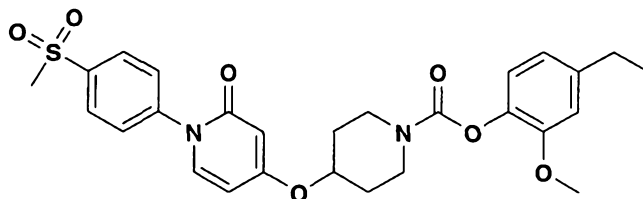


實例 138 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 4-第二-丁基酚 (Aldrich) 取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.09 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.37 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.17 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.02 (d, J=8.25 Hz, 2H), 6.52 (d, J=2.20 Hz, 1H), 6.31 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H), 4.64-4.72 (m, 1H), 3.97 (表觀寬廣 s, 1H), 3.85 (表觀寬廣 s, 1H), 3.66 (表觀寬廣 s, 1H), 3.56 (表觀寬廣 s, 1H), 3.11 (s, 3H), 2.54-2.65 (m, 1H), 2.12 (表觀寬廣 s, 2H), 1.86-1.96 (m, 2H), 1.53-1.63 (m, 2H), 1.22 (d, J=7.15 Hz, 3H),

0.82 (t, J=7.42 Hz, 3H). MS (ESI) 525 (M+H).

實例 139

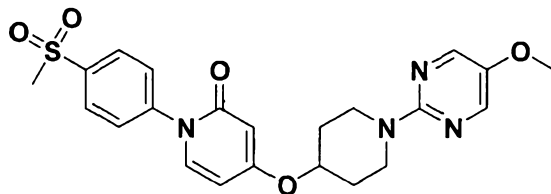
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-乙基-2-甲氧基苯酯之製備



實例 139 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 4-乙基-2-甲氧基酚 (Alfa Aesar) 取代 1,1,1-三氯-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.33 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.98 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.74-6.80 (m, 2H), 6.36 (d, J=2.75 Hz, 1H), 6.24 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 4.61-4.69 (m, 1H), 3.98 (表觀寬廣 s, 1H), 3.79-3.87 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.67 (表觀寬廣 s, 1H), 3.55 (表觀寬廣 s, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.64 (q, J=7.70 Hz, 2H), 2.11 (表觀寬廣 s, 2H), 1.92 (表觀寬廣 s, 2H), 1.24 (t, J=7.70 Hz, 3H). MS (ESI) 527 (M+H).

實例 141

4-(1-(5-甲氧基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備

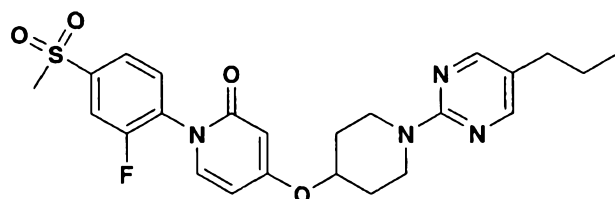


實例 141 係根據實例 106 中所述之程序，在步驟 B 中，以 2-氯基-5-甲氧基嘓啶 (Aldrich) 取代 2-氯基-5-丙基嘓啶而製成，惟將反應物於 100°C 下攪拌 3 天，並使粗製固體藉急驟式層

析純化 (SiO₂ , 0 至 100% EtOAc 在 己 烷 中) 。 ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 8.20 (s, 2H), 7.98-8.06 (m, 2H), 7.65-7.73 (m, 2H), 7.63 (d, J=7.34 Hz, 1H), 6.06-6.13 (m, 1H), 6.04 (d, J=2.45 Hz, 1H), 4.67-4.79 (m, 1H), 4.07-4.20 (m, 2H), 3.76 (s, 3H), 3.35-3.47 (m, 2H), 3.27 (s, 3H), 1.94-2.04 (m, 2H), 1.49-1.64 (m, 2H). MS (ESI) 457 (M+H).

實例 142

1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, 鹽酸鹽之製備



步驟 A. 1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-醇之製備

將六氫吡啶-4-醇 (12 克, 119 毫莫耳)、2-氟基-5-丙基嘧啶 (20.44 克, 131 毫莫耳) 及碳酸鉀 (49.2 克, 356 毫莫耳) 在 DMF (100 毫升) 中之懸浮液於 110°C 下加熱 12 小時。將混合物以 EtOAc (250 毫升) 稀釋, 並以水洗滌三次, 以 Na₂SO₄ 脫水乾燥, 及濃縮, 而得黃色油。使此油藉急驟式層析純化 (SiO₂, 0-10% MeOH/CH₂Cl₂), 產生產物 (19 克, 86 毫莫耳, 72.4% 產率), 為黃色固體。MS (ESI) 222.2 (M+1).

步驟 B. 甲烷磺酸 1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯之製備

於 1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-醇 (16.1 克, 72.8 毫莫耳) 與三乙胺 (10.14 毫升, 72.8 毫莫耳) 在 CH₂Cl₂ (150 毫升) 中之混合物內, 在 0°C 下, 慢慢添加氯化甲烷磺醯 (4.76 毫升, 80 毫莫耳)。於室溫下攪拌 1.5 小時後, 以 15 毫升水, 接著以 15

毫升 1N HCl 使混合物淬滅。收集有機層，並以 CH_2Cl_2 萃取水層。然後，將合併之有機層以飽和 NaHCO_3 水溶液與鹽水洗滌。在以 Na_2SO_4 脫水乾燥後，使有機層濃縮，而得所要之產物甲烷磺酸 1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯 (21 克, 70.1 毫莫耳, 96% 產率), 為黃色固體。MS (ESI) 300.2 (M+1).

步驟 C. 4-(苄氧基)-1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-吡啶-2(1H)-酮之製備

於 500 毫升回收燒瓶中之 4-(苄氧基)吡啶-2(1H)-酮 (6.12 克, 30.4 毫莫耳) 內, 施加真空 5 分鐘, 然後放置在氮大氣下, 並添加 DMF (100 毫升), 以產生懸浮液。當發現氣體緩慢釋出時, 添加 NaH (60%, 在油中) (1.271 克, 31.8 毫莫耳), 歷經 10 分鐘。在 60 分鐘內, 黃褐色懸浮液已變得較濃稠, 且在顏色上較淡。60 分鐘後, 添加 1,2-二氟-4-(甲磺醯基)苯 (5.31 克, 27.6 毫莫耳), 並將反應混合物於 110°C 油浴中在氮氣下放置 70 分鐘, 以產生黃褐色懸浮液。將 400 毫升水與 400 毫升 EtOAc 添加至反應物中, 移除水層, 將有機層以 400 毫升鹽水洗滌, 以 MgSO_4 脫水乾燥, 過濾, 及濃縮, 而得 12 克淡黃色粉末。使其藉急驟式層析純化 (0.75-1.00% MeOH/ CH_2Cl_2), 接著自 EtOAc 再結晶, 產生 5.39 克 (14.4 毫莫耳, 52% 產率) 產物, 為白色粉末。MS (ESI) 374.4 (M+1).

步驟 D. 1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-羥基吡啶-2(1H)-酮之製備

於 1 升回收燒瓶中, 添加 10% 鈀/碳 (1.75 克, 16.44 毫莫耳), 施加真空 5 分鐘, 然後破除真空至氮氣。將各 20 毫升之

CH₂Cl₂/MeOH/THF 添加至潮濕固體中，接著添加 4-(苄氧基)-1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮 (5.38 克，14.41 毫莫耳) 在各 ~80 毫升 CH₂Cl₂/MeOH/THF (總共 100 毫升各溶劑) 中之懸浮液，全部均同時保持氮流動於混合物上方。短暫地施加真空，然後於氮大氣下放置 105 分鐘，使用另外各 200 毫升之 MeOH 與 CH₂Cl₂，經過 60 x 60 毫米 Celite[®] 545 助濾劑之墊片過濾，及濃縮濾液，獲得 4.4 克粗產物，為灰白色粉末。MS (ESI) 284.3 (M+1).

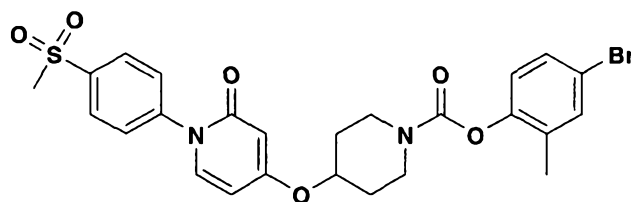
步驟 E. 實例 142

於 200 毫升回收燒瓶中之 1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-羥基吡啶-2(1H)-酮 (4.4 克，15.53 毫莫耳) 內，添加 75 毫升 DMF，將混合物攪拌 5 分鐘，以達成部份增溶作用，然後添加甲烷磺酸 1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯 (6.9 克，23.05 毫莫耳)，且顯示完全溶解，然而一部份吡啶酮顯示仍然保持不溶性。添加碳酸鈉 (15.18 克，46.6 毫莫耳)，並在 90°C 油浴中，於氮氣下放置 225 分鐘，以產生黃褐色漿液。將反應混合物添加至 500 毫升 EtOAc 中，接著以水 (250 毫升，然後為 3 x 150 毫升) 洗滌，使有機層以硫酸鎂脫水乾燥，過濾，然後濃縮，獲得 8.7 克黃色固體，將其藉急驟式層析純化 (50-100% EtOAc 在己烷中，接著為 0-50% MeOH 在 EtOAc 中)，獲得 5.3 克 (10.9 毫莫耳) 灰白色固體，然後，使其自 EtOAc/己烷再結晶，而得靜電白色固體。於此物質中，添加 100 毫升乙醇，獲得漿液，在其中添加 7.33 毫升 6N HCl 水溶液 (44 毫莫耳 = 4 當量)。幾乎全部溶解，接著，白色沉澱物開始形成。攪拌 45 分鐘，

然後於真空中移除溶劑，而得 5.2 克灰白色粉末。添加 100 毫升乙醇，並加熱至回流。固體僅部份為可溶性。使其冷卻至室溫，及攪拌。在室溫下 10 分鐘後，過濾，且以 2 x 10 毫升乙醇與 2 x 20 毫升己烷洗滌固體。於真空中乾燥，獲得實例 142 (4.8 克，9.1 毫莫耳，59%)，為灰白色粉末。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 0.98 (t, J=7.42 Hz, 3H) 1.60-1.70 (m, 2H) 2.07-2.20 (m, 4H) 2.55 (t, J=7.42 Hz, 2H) 3.12 (s, 3H) 4.05-4.22 (m, 2H) 4.28-4.43 (m, 2H) 4.73 (寬廣 s., 1H) 6.06 (s, 1H) 6.11 (d, J=7.70 Hz, 1H) 7.18 (d, J=7.70 Hz, 1H) 7.64 (t, J=7.15 Hz, 1H) 7.87 (t, J=8.80 Hz, 2H) 8.42 (s, 2H). MS (ESI) 487.6 (M+1).

實例 143

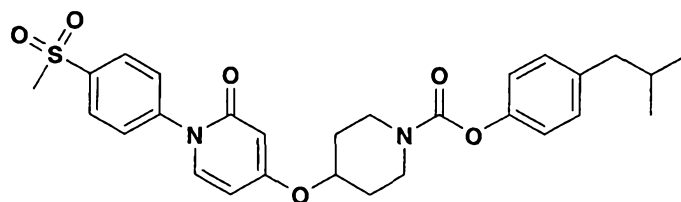
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-溴基-2-甲基苯酯之製備



實例 143 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 4-溴基-2-甲基酚取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.11 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.68 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.60 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.43 (d, J=1.65 Hz, 1H), 7.35 (dd, J=8.52, 2.47 Hz, 1H), 6.98 (d, J=8.25 Hz, 1H), 6.29 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 6.10 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.77-4.84 (m, 1H), 4.00 (表觀寬廣 s, 1H), 3.83 (表觀寬廣 s, 1H), 3.70 (表觀寬廣 s, 1H), 3.49-3.57 (m, 1H), 3.18 (s, 3H), 2.06-2.22 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.81-1.94 (m, 2H). MS (ESI) 561, 563 (M+H).

實例 144

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-異丁基苯酯之製備

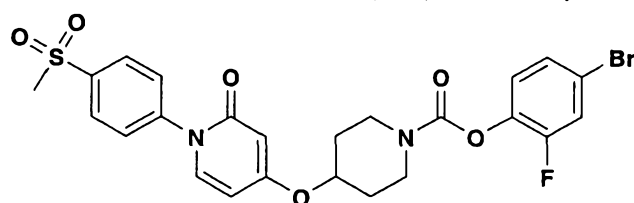


將 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-(2-甲基丙-1-烯基)苯酯 (30 毫克, 0.057 毫莫耳) 與 鈦/碳 (10 重量%, 潮濕) (20 毫克, 0.188 毫莫耳, Aldrich) 在 MeOH (4.0 毫升) 與 DMF (0.5 毫升) 中之懸浮液於氫 (氣瓶) 下放置 2 小時, 並添加另外之鈦/碳 (20 毫克)。將所形成之混合物在氫 (氣瓶) 下連續攪拌 1.5 小時, 以 CH₂Cl₂ 稀釋, 經過 Celite[®] 545 助濾劑之墊片過濾, 及在真空中濃縮。使殘留物藉預備之 HPLC 純化 (C₁₈ 管柱; 30-100% 甲醇在含有 0.05% 三氟醋酸之水中), 於凍乾時, 獲得實例 144 (21.4 毫克, 黃色固體 71%)。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) 8.10 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.38 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.14 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.00 (d, J=8.25 Hz, 2H), 6.56 (d, J=2.20 Hz, 1H), 6.33 (dd, J=7.42, 2.47 Hz, 1H), 4.62-4.74 (m, 1H), 3.89-4.04 (m, 1H), 3.85 (表觀寬廣 s, 1H), 3.85 (表觀寬廣 s, 1H), 3.57 (表觀寬廣 s, 1H), 3.12 (s, 3H), 2.46 (d, J=7.15 Hz, 2H), 2.13 (表觀寬廣 s, 2H), 1.89-1.98 (m, 2H), 1.80-1.89 (m, 1H), 0.90 (d, J=6.60 Hz, 6H). MS (ESI) 525 (M+H).

實例 145

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡

吡啶-1-羧酸 4-溴基-2-氟苯酯之製備

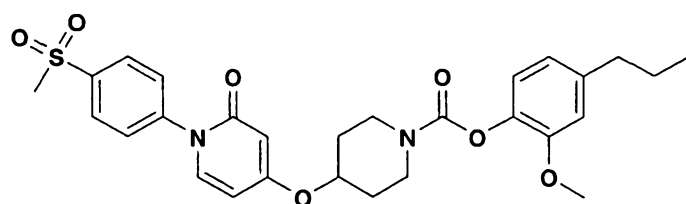


實例 145 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 4-溴基-2-氟基酚 (Aldrich) 取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.07 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.33 (dd, J=9.35, 2.20 Hz, 1H), 7.25-7.30 (m, 2H), 7.08 (t, J=8.52 Hz, 1H), 6.08 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 5.99 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.56-4.65 (m, 1H), 3.84-3.96 (m, 1H), 3.74-3.84 (m, 1H), 3.64-3.74 (m, 1H), 3.54-3.64 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.08 (表觀寬廣 s, 2H), 1.95 (表觀寬廣 s, 2H). MS (ESI) 565, 567 (M+H).

實例 146

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡

啶-1-羧酸 2-甲氧基-4-丙基苯酯之製備

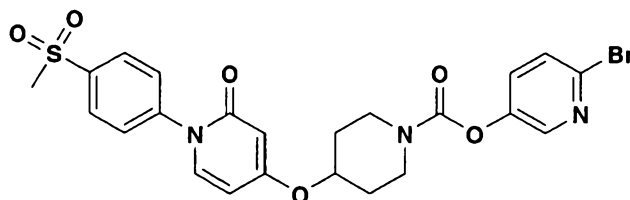


實例 146 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 2-甲氧基-4-丙基酚 (SAFC) 取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.09 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.33 (d, J=7.15 Hz, 1H), 6.97 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.71-6.79 (m, 2H), 6.37 (d, J=2.75 Hz, 1H), 6.25 (dd, J=7.42, 2.47 Hz, 1H), 4.58-4.70 (m, 1H), 3.91-4.02 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.77-3.88 (m, 1H), 3.61-3.71 (m, 1H), 3.55 (表觀寬廣 s, 1H), 3.11 (s, 3H), 2.57 (t, J=7.70 Hz, 2H), 2.12 (表觀寬廣 s, 2H), 1.93

(表觀寬廣 s, 2H), 1.58-1.69 (m, 2H), 0.95 (t, J=7.42 Hz, 3H). MS (ESI) 541 (M+H).

實例 147

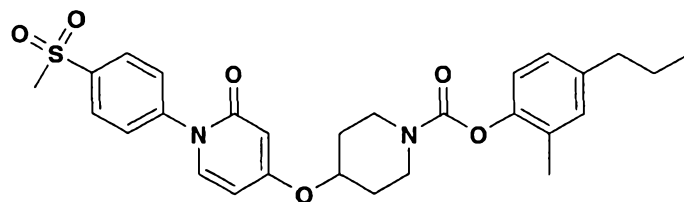
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 6-溴基吡啶-3-基酯之製備



實例 147 係根據實例 2 中所述之程序，在步驟 B，以 6-溴基吡啶-3-醇 (Synchem OHG) 取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成，惟使標題化合物於矽膠上藉急驟式層析純化。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.23 (d, J=3.30 Hz, 1H), 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.50 (d, J=8.25 Hz, 1H), 7.41 (dd, J=8.80, 2.75 Hz, 1H), 7.25 (d, J=7.24 Hz, 1H), 6.09 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H), 6.00 (d, J=2.20 Hz, 1H), 4.55-4.65 (m, 1H), 3.85-3.93 (m, 1H), 3.75-3.83 (m, 1H), 3.65-3.73 (m, 1H), 3.55-3.63 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.02-2.14 (m, 2H), 1.91-2.00 (m, 2H). MS (ESI) 548, 550 (M+H).

實例 148

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 2-甲基-4-丙基苯酯之製備



步驟 A. (Z)-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 2-甲基-4-(丙-1-烯基)苯酯之製備

將 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-溴基-2-甲基苯酯 (32.5 毫克, 0.058 毫莫耳, 實例 143)、1,1'-雙(二苯基膦基)二環戊二烯鐵-二氯化鈮(II)二氯甲烷錯合物 (4.76 毫克, 5.79 微莫耳, Combiphos Catalysts 公司)、(Z)-丙-1-烯基二羥基硼烷 (14.92 毫克, 0.174 毫莫耳, Aldrich) 及碳酸鈹 (94 毫克, 0.289 毫莫耳, Aldrich) 在 DMF (0.6 毫升) 與水 (0.12 毫升) 中之混合物於微波條件 (100°C, 20 分鐘) 下加熱。使反應混合物藉預備之 HPLC 純化 (C₁₈ 管柱; 40-100% 甲醇在含有 0.05% 三氟醋酸之水中), 於凍乾時, 獲得標題化合物 (21.8 毫克, 黃色固體, 72%)。MS (ESI) 523 (M+H).

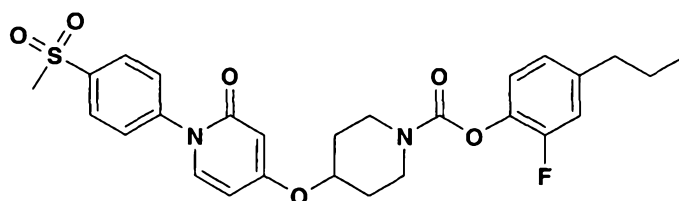
步驟 B. 實例 148

實例 148 係根據實例 144 中所述之程序, 以 (Z)-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 2-甲基-4-(丙-1-烯基)苯酯取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-(2-甲基丙-1-烯基)苯酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.10 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.35 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.93-7.04 (m, 3H), 6.48 (d, J=2.75 Hz, 1H), 6.29 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H), 4.64-4.71 (m, 1H), 3.92-4.04 (m, 1H), 3.81-3.92 (m, 1H), 3.68 (表觀寬廣 s, 1H), 3.56 (表觀寬廣 s, 1H), 3.12 (s, 3H), 2.54 (t, J=7.70 Hz, 2H), 2.07-2.22 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.93 (表觀寬廣 s, 2H), 1.56-1.68 (m, 2H), 0.94 (t, J=7.15 Hz, 3H). MS (ESI) 525 (M+H).

實例 149

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡

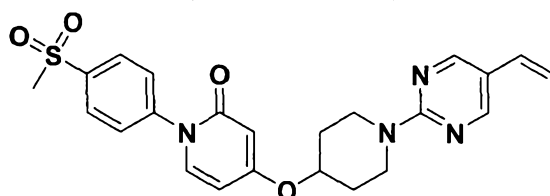
吡啶-1-羧酸 2-氟基-4-丙基苯酯之製備



實例 149 係根據實例 148 中所述之程序，在步驟 A，以 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-溴基-2-氟苯酯取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-溴基-2-甲基苯酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.09 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.32 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.07 (t, J=8.25 Hz, 1H), 6.91-7.00 (m, 2H), 6.31 (d, J=2.47 Hz, 2H), 6.22 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H), 4.60-4.72 (m, 1H), 3.88-3.99 (m, 1H), 3.83 (表觀寬廣 s, 1H), 3.68 (表觀寬廣 s, 1H), 3.57 (表觀寬廣 s, 1H), 3.11 (s, 3H), 2.50-2.61 (m, 2H), 2.11 (表觀寬廣 s, 2H), 1.94 (表觀寬廣 s, 2H), 1.57-1.69 (m, 2H), 0.94 (t, J=7.15 Hz, 3H). MS (ESI) 529 (M+H).

實例 150

(Z)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(丙-1-烯基)嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

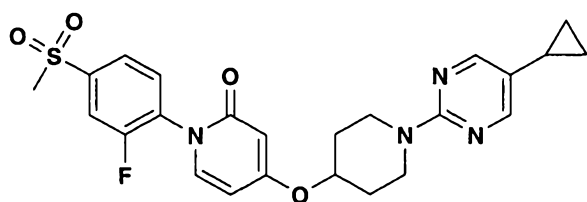


實例 150 係根據實例 109 中所述之程序，以 (Z)-丙-1-烯基二羥基硼烷 (Aldrich) 取代苯基二羥基硼烷而製成，惟使粗製固體藉急驟式層析純化 (SiO₂, 0 至 100% EtOAc 在 CH₂Cl₂ 中)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.31 (s, 2H) 8.07 (d, J=8.31 Hz, 2H) 7.62

(d, $J=8.31$ Hz, 2H) 7.23 (d, $J=7.34$ Hz, 1H) 6.17 (d, $J=10.76$ Hz, 1H) 6.05-6.10 (m, 1H) 6.02 (d, $J=2.45$ Hz, 1H) 5.72-5.83 (m, 1H) 4.55-4.63 (m, 1H) 4.16-4.25 (m, 2H) 3.65-3.76 (m, 2H) 3.09 (s, 3H) 2.02-2.14 (m, 2H) 1.88 (d, $J=7.34$ Hz, 3H) 1.80-1.86 (m, 2H). MS (ESI) 467 (M+H).

實例 151

4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(2-氟-4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



步驟 A. 4-(1-(5-溴基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備

將 1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽 (100 毫克, 0.248 毫莫耳, 根據實例 9 中所述之程序製成)、5-溴基-2-氟基嘧啶 (144 毫克, 0.745 毫莫耳) 及碳酸鈉 (324 毫克, 0.993 毫莫耳) 在 DMF (3 毫升) 中之混合物置於微波中, 並在 160°C 下加熱 20 分鐘。將反應混合物以 EtOAc (30 毫升) 稀釋, 且以水洗滌 3 次。使有機層以 Na_2SO_4 脫水乾燥, 及在減壓下濃縮, 而得粗製黃色固體。使殘留物藉急驟式層析純化 (SiO_2 , 0-100% EtOAc/己烷), 獲得白色固體 (70 毫克, 53.9%)。MS (ESI) 523 (M+H).

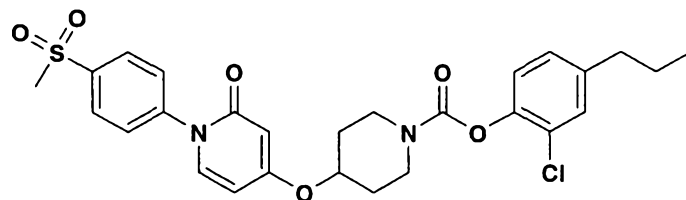
步驟 B. 實例 151

於微波小玻璃瓶中, 添加 4-(1-(5-溴基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮 (70 毫克,

0.134 毫莫耳)、環丙基二羥基硼烷(34.5 毫克, 0.401 毫莫耳)、1,1'-雙(二苯基膦基)二環戊二烯鐵-二氯化鈹(II)二氯甲烷錯合物(11.00 毫克, 0.013 毫莫耳)與 K_2CO_3 (55.5 毫克, 0.401 毫莫耳)、DMF (2 毫升)及水(0.5 毫升)。將混合物在 $125^\circ C$ 下於微波中加熱 20 分鐘。將混合物以 EtOAc (20 毫升)稀釋, 並以水洗滌(3x)。收集有機層, 及蒸發, 而得黃色油。使粗製物藉預備之 HPLC 純化(C_{18} 管柱; 20-90% MeOH 在含有 0.1% 三氟醋酸之水中), 獲得實例 151 (4.5 毫克, 7%), 為白色油。 1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 8.36 (s, 2H), 7.75-7.93 (m, 2H), 7.56-7.67 (m, 1H), 7.18-7.25 (m, 1H), 6.43 (d, $J=2.75$ Hz, 1H), 6.25 (dd, $J=7.70, 2.20$ Hz, 1H), 4.75-4.79 (m, 1H), 3.90-4.15 (m, 4H), 3.13 (s, 3H), 1.97-2.23 (m, 4H), 1.73-1.92 (m, 1H), 0.97-1.16 (m, 2H), 0.57-0.83 (m, 2H). MS (ESI) 485 (M+H).

實例 152

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 2-氯基-4-丙基苯酯之製備



步驟 A. 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-溴基-2-氯苯酯之製備

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-溴基-2-氯苯酯係根據實例 2 中所述之程序, 在步驟 B, 以 4-溴基-2-氯酚 (Aldrich) 取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製

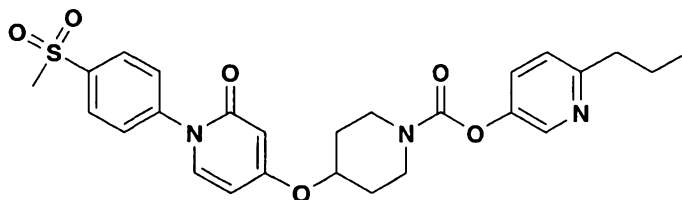
成。MS (ESI) 581, 583 (M+H).

步驟 B. 實例 152

實例 152 係根據實例 148 中所述之程序，在步驟 A，以 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-溴基-2-氯苯酯取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-溴基-2-甲基苯酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.21-7.29 (m, 1H), 7.02-7.15 (m, 2H), 6.11 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 6.04 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.55-4.68 (m, 1H), 3.96 (表觀寬廣 s, 1H), 3.82 (表觀寬廣 s, 1H), 3.70 (表觀寬廣 s, 1H), 3.58 (表觀寬廣 s, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.49-2.62 (m, 2H), 2.04-2.19 (m, 2H), 1.94 (表觀寬廣 s, 2H), 1.55-1.70 (m, 2H), 0.94 (t, J=7.42 Hz, 3H). MS (ESI) 545 (M+H).

實例 153

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 6-丙基吡啶-3-基酯，TFA 鹽之製備

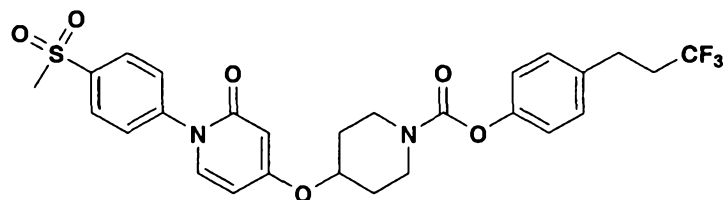


實例 153 係根據實例 148 中所述之程序，在步驟 A，以 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 6-溴基吡啶-3-基酯 (實例 147) 取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-溴基-2-甲基苯酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.63 (d, J=2.75

Hz, 1H), 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.76 (dd, J=8.80, 2.20 Hz, 1H), 7.62 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.38 (d, J=8.80 Hz, 1H), 7.26 (d, J=7.70, 1H), 6.10 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 6.02 (d, J=2.20 Hz, 1H), 4.57-4.68 (m, 1H), 3.84-3.95 (m, 1H), 3.74-3.81 (m, 1H), 3.65-3.74 (m, 1H), 3.57-3.65 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.92 (t, J=7.70 Hz, 2H), 2.04-2.15 (m, 2H), 1.91-2.02 (m, 2H), 1.73-1.86 (m, 2H), 1.00 (t, J=7.15 Hz, 3H). MS (ESI) 512 (M+H).

實例 154

4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸 4-(3,3,3-三氟丙基)苯酯之製備



步驟 A. (E)-1-(苄氧基)-4-(3,3,3-三氟丙-1-烯基)苯之製備

將 4-(苄氧基)苯基二羥基硼烷(1026 毫克, 4.50 毫莫耳, Alfa Aesar)、(E)-1-溴基-3,3,3-三氟丙-1-烯(262 毫克, 1.5 毫莫耳, SynQuest)、1,1'-雙(二苯基膦基)二環戊二烯鐵-二氯化鈣(II)二氯甲烷錯合物(122 毫克, 0.15, Combiphos Catalysts 公司)及碳酸鈉(2444 毫克, 7.50 毫莫耳, Aldrich)在水(0.5 毫升)與 DMF (3.0 毫升)中之混合物於微波條件(90°C, 20 分鐘)下加熱。以 EtOAc 稀釋反應混合物, 及過濾。將濾液以水與鹽水洗滌, 脫水乾燥(Na₂SO₄), 及在真空中濃縮。使殘留物於矽膠上藉急驟式層析純化(0 至 100% EtOAc/己烷), 產生標題化合物(310 毫克, 74%), 為淡黃色固體。

步驟 B. 4-(3,3,3-三氟丙基)酚之製備

將(E)-1-(苄氧基)-4-(3,3,3-三氟丙-1-烯基)苯(305毫克, 1.096毫莫耳)與鈀/碳(305毫克, 10重量%, 潮濕, Aldrich)在MeOH(15毫升)與THF(5毫升)中之溶液於氫(1大氣壓)下放置4小時。將所形成之混合物以CH₂Cl₂稀釋, 並經過Celite® 545助濾劑之墊片過濾。在減壓下蒸發濾液, 然後於矽膠上藉急驟式層析純化(0至30% EtOAc/己烷), 產生標題化合物(151毫克, 72%), 為無色油。MS (ESI) 189 (M-H).

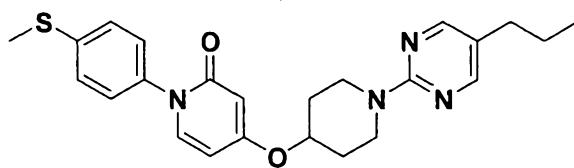
步驟 C. 實例 154

實例 154 係根據實例 2 中所述之程序, 在步驟 B, 以 4-(3,3,3-三氟丙基)酚取代 1,1,1-三氟-2-丙醇而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.10 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.33 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.20 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.06 (d, J=8.25 Hz, 2H), 6.40 (d, J=2.75 Hz, 1H), 6.25 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 4.59-4.71 (m, 1H), 3.94 (表觀寬廣 s, 1H), 3.79-3.91 (m, 1H), 3.60-3.71 (m, 1H), 3.51-3.60 (m, 1H), 3.11 (s, 3H), 2.81-2.94 (m, 2H), 2.29-2.47 (m, 2H), 2.11 (表觀寬廣 s, 2H), 1.84-1.98 (m, 2H). MS (ESI) 565 (M+H).

實例 155

1-(4-(甲硫基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)

吡啶-2(1H)-酮之製備



步驟 A. 4-(甲磺基氧基)六氫吡啶-1-羧酸苄酯之製備

於 4-羥基-1-六氫吡啶羧酸苄酯(3.55 毫升, 23.4 毫莫耳, Aldrich)與 Et₃N(7.18 毫升, 51.5 毫莫耳, Aldrich)在 CH₂Cl₂(25 毫

升)中之正在攪拌溶液內，在室溫下，逐滴添加氯化甲烷磺醯(1.99毫升，25.8毫莫耳，Acros)在 CH_2Cl_2 (25毫升)中之溶液。將反應混合物於室溫下攪拌1小時，並以1N HCl水溶液、 H_2O 及鹽水洗滌。使有機層以 Na_2SO_4 脫水乾燥，及在真空中濃縮，產生7.43克所要之產物，為黃色油。MS (ESI) 314 (M+H).

步驟 B. 4-(2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸苄酯之製備

將4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸苄酯(1.97克，6.30毫莫耳)、4-羥基吡啶-2(1H)-酮(0.50克，4.5毫莫耳，Aldrich)、碳酸鉀(1.43克，10.6毫莫耳，EMD)及DMF(25毫升)之正在攪拌懸浮液於 140°C 下加熱2.5小時，然後冷卻至室溫。將所形成之混合物以 H_2O 稀釋，並以EtOAc萃取(2x)。合併有機層，且以鹽水洗滌，以 Na_2SO_4 脫水乾燥，及在真空中濃縮成淡黃色油。使此油藉急驟式層析純化(SiO_2 ，0至10% MeOH在 CH_2Cl_2 中)，產生550毫克所要之產物，為白色固體。MS (ESI) 329 (M+H).

步驟 C. 4-(1-(4-(甲硫基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸苄酯之製備

將4-(2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸苄酯(697毫克，2.12毫莫耳)、(4-溴苯基)(甲基)硫烷(431毫克，2.12毫莫耳，Aldrich)、喹啉-8-醇(61.6毫克，0.425毫莫耳，Alfa Aesar)、碳酸鉀(381毫克，2.76毫莫耳，EMD)、碘化銅(I)(81毫克，0.43毫莫耳，Alfa Aesar)在DMSO(6毫升)中之混合物於 145°C 及氫氣下攪拌過夜。將所形成之混合物以 H_2O 稀釋，

並以 EtOAc 萃取 (2x)。將合併之有機層以鹽水洗滌，以 Na_2SO_4 脫水乾燥，及在真空中濃縮成綠色固體。使此固體藉急驟式層析純化 (SiO_2 ，0 至 5% MeOH 在 CH_2Cl_2 中)，產生 911 毫克所要之產物，為淺綠色固體。MS (ESI) 451 (M+H).

步驟 D. 1-(4-(甲硫基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

於 4-(1-(4-(甲硫基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸苄酯 (367 毫克，0.815 毫莫耳) 在 CH_2Cl_2 (5 毫升) 中之正在攪拌溶液內，在 0°C 下，添加碘基三甲基矽烷 (0.33 毫升，2.4 毫莫耳，Aldrich)。將反應物攪拌 40 分鐘，然後，於 0°C 下以 HCl (1N，在 H_2O 中，5 毫升) 使反應淬滅。將所形成之混合物以 CH_2Cl_2 稀釋，並以 H_2O 萃取。以 NaOH (1N，在 H_2O 中，10 毫升) 使 H_2O 層鹼化，且以 CH_2Cl_2 萃取 (2x)。將合併之有機層以鹽水洗滌，以 Na_2SO_4 脫水乾燥，及在真空中濃縮，產生 189 毫克粗產物，為灰白色固體。MS (ESI) 317 (M+H).

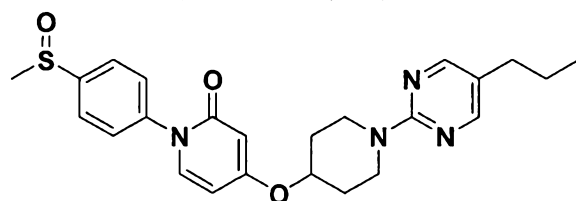
步驟 E. 實例 155

於 1-(4-(甲硫基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮 (175 毫克，0.552 毫莫耳) 與碳酸鉀 (305 毫克，2.21 毫莫耳，EMD) 在 DMF (8.5 毫升) 中之正在攪拌混合物內，在室溫下，添加 2-氯基-5-丙基嘧啶 (130 毫克，0.828 毫莫耳，Wako)。將反應混合物於 100°C 下加熱 9 小時，然後在真空中濃縮。使所獲得之油藉急驟式層析純化 (SiO_2 ，0 至 100% EtOAc 在 CH_2Cl_2 中)，產生 101 毫克實例 155，為白色固體。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.14 (s, 2H), 7.25-7.36 (m, 4H), 7.18 (d, J=7.34 Hz, 1H),

5.82-6.18 (m, 2H), 4.46-4.58 (m, 1H), 4.12-4.23 (m, 2H), 3.53-3.66 (m, 2H), 2.49 (s, 3H), 2.38 (t, J=7.58 Hz, 2H), 2.00-2.14 (m, 2H), 1.73-1.89 (m, 2H), 1.46-1.63 (m, 2H), 0.92 (t, J=7.34 Hz, 3H). MS (ESI) 437 (M+H).

實例 156

(±)-1-(4-(甲基亞磺基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

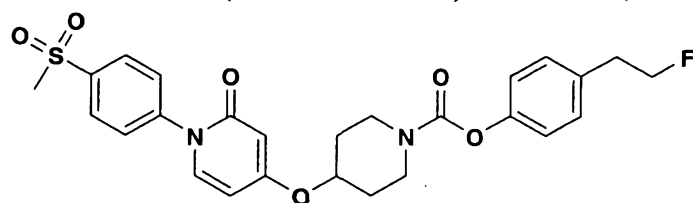


於 1-(4-(甲硫基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮 (51.4 毫克, 0.118 毫莫耳) 在 CH_2Cl_2 (15 毫升) 中之正在攪拌溶液內, 在 0°C 下, 添加 3-氯基過氧苯甲酸 (26.4 毫克, 0.118 毫莫耳) 在 5 毫升 CH_2Cl_2 中之溶液。將反應物於 0°C 下攪拌 15 分鐘, 然後, 以 Na_2SO_3 (在 H_2O 中之飽和溶液) 使反應淬滅。將有機層以 H_2O 、鹽水洗滌, 以 Na_2SO_4 脫水乾燥, 及在真空中濃縮成白色固體。使此固體藉急驟式層析純化 (SiO_2 , 0 至 10% MeOH 在 CH_2Cl_2 中), 產生 50 毫克所要之產物, 為白色固體。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.16 (s, 2H), 7.77 (d, J=8.31 Hz, 2H), 7.57 (d, J=8.31 Hz, 2H), 7.23 (d, J=7.34 Hz, 1H), 5.94-6.11 (m, 2H), 4.44-4.64 (m, 1H), 4.07-4.31 (m, 2H), 3.50-3.74 (m, 2H), 2.77 (s, 3H), 2.40 (t, J=7.58 Hz, 2H), 1.98-2.17 (m, 2H), 1.73-1.93 (m, 2H), 1.50-1.64 (m, 2H), 0.93 (t, J=7.34 Hz, 3H). MS (ESI) 453 (M+H).

實例 157

4-(1-(4-(甲磺基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡

吡啶-1-羧酸 4-(2-氟基乙基)苯酯之製備

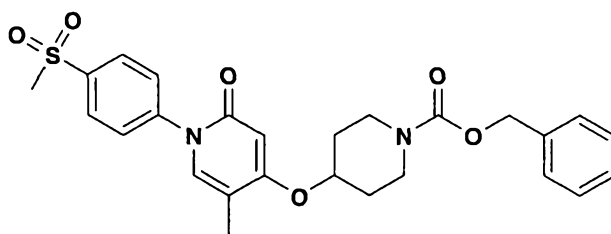


實例 157 係根據實例 154 中所述之程序，在步驟 A，以 (E)-1-溴基-2-氟基乙烯 (SynQuest) 取代 (E)-1-溴基-3,3,3-三氟丙-1-烯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.20-7.29 (m, 3H), 7.06 (d, J=8.25 Hz, 2H), 6.09 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H), 6.00 (d, J=2.20 Hz, 1H), 4.67 (t, J=6.32 Hz, 1H), 4.62-4.65 (m, 2H), 3.91 (表觀寬廣 s, 1H), 3.78-3.85 (m, 1H), 3.62-3.69 (m, 1H), 3.53-3.60 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 3.04 (t, J=6.60 Hz, 1H), 2.99 (t, J=6.32 Hz, 1H), 2.03-2.13 (m, 2H), 1.87-1.97 (m, 2H). MS (ESI) 515 (M+H).

實例 158

4-(5-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)

六氫吡啶-1-羧酸苄酯之製備



步驟 A. 4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸苄酯之製備

於 CH₂Cl₂ (400 毫升) 中之 4-羥基六氫吡啶-1-羧酸苄酯 (48.8 克, 207 毫莫耳) 內，添加三乙胺 (57.8 毫升, 415 毫莫耳)，使混合物在氮氣下冷卻至 0°C，然後添加氯化甲烷磺醯 (17.78 毫升, 228 毫莫耳)，歷經 15 分鐘，保持內部溫度低於 30°C。

在 0°C 下 2 小時後，以 300 毫升 0.1N HCl 水溶液使反應淬滅，將有機層以 300 毫升水、300 毫升鹽水洗滌，以 MgSO₄ 脫水乾燥，過濾，及濃縮，而得產物 (69.5 克)，為琥珀色液體，使用之而無需進一步純化。MS (ESI) 314.4 (M+1).

步驟 B. 6-氯基-4-羥基-5-甲基吡啶-2(1H)-酮之製備

於室溫及氫氣下，將二氯化丙二醯 (25 克，177 毫莫耳) 添加至戊酮腈 (30 毫升，420 毫莫耳) 中。將反應混合物在室溫下攪拌過夜。將 1,4-二氧陸園 (50 毫升) 添加至上述不均勻混合物中，產生沉澱物，將其藉過濾收集，以 1,4-二氧陸園 (2 x 20 毫升) 洗滌，並在真空烘箱中，於 55°C 下乾燥 4 小時，以提供 6-氯基-4-羥基-5-甲基吡啶-2(1H)-酮，HCl, H₂O (15.6 克，73 毫莫耳，34%)，為灰白色固體。MS (ESI) 314.4 (M+1).

步驟 C. 4-羥基-5-甲基吡啶-2(1H)-酮之製備

使 6-氯基-4-羥基-5-甲基吡啶-2(1H)-酮，HCl, H₂O (1 克，4.67 毫莫耳) 溶於 30 毫升 EtOH 中，然後添加三乙胺 (0.473 克，4.67 毫莫耳)。將反應物以真空沖洗，接著以氫三次，然後在氫氣瓶下放置 50 小時。使用另外之 4 x 5 毫升 EtOH，使反應混合物通過 20 x 20 毫米 Celite[®] 545 助濾劑之墊片，並使溶離劑濃縮成 1.62 克黃褐色泡沫物。添加 20 毫升水，加熱至回流，造成幾乎全部溶解，接著，使其冷卻至室溫。將此得自上文之懸浮液過濾，且以 3 x 3 毫升水洗滌，及在真空中乾燥成產物 (97 毫克，0.8 毫莫耳，17%)，為淡黃褐色粉末。MS (ESI) 126.1 (M+1).

步驟 D. 4-(5-甲基-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶

-1-羧酸苄酯之製備

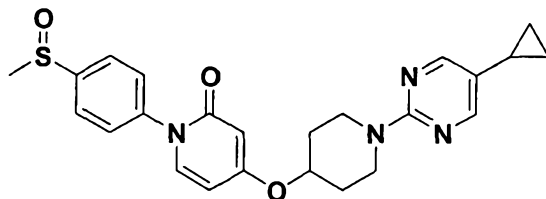
於 100°C 及 氮氣 下，將 4-羥基-5-甲基吡啶-2(1H)-酮 (554 毫克，4.43 毫莫耳)、4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸苄酯 (2081 毫克，6.64 毫莫耳) 及 碳酸鉀 (1224 毫克，8.86 毫莫耳) 在 DMF (12 毫升) 中攪拌 14 小時。添加 100 毫升水與 100 毫升 EtOAc，然後，以 2 x 100 毫升另外之水洗滌 EtOAc 層。使有機層以 Na₂SO₄ 脫水乾燥，過濾，及濃縮，而得 1454 毫克褐色油。使此油藉急驟式層析純化 (0-5% MeOH/CH₂Cl₂)，獲得產物 (280 毫克，0.82 毫莫耳，18%)，為淡黃褐色泡沫物。MS (ESI) 343.4 (M+1).

步驟 E. 實例 158

將 4-(5-甲基-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸苄酯 (34 毫克，0.099 毫莫耳)、4-溴苯基甲基砒 (23.35 毫克，0.099 毫莫耳)、碳酸鉀 (20.59 毫克，0.149 毫莫耳) 及 碘化銅 (I) (3.78 毫克，0.020 毫莫耳) 在 0.4 毫升 DMSO 中合併，以起泡之氮於液面下 20 秒而脫氣，然後於 100°C 油浴中加熱 16 小時。於反應混合物中，添加 5 毫升 EtOAc，接著，將其以各 3 毫升飽和 NH₄Cl 水溶液、NaHCO₃、NaCl、水洗滌，以 MgSO₄ 脫水乾燥，及過濾。然後，使 EtOAc 濾液以急驟式層析直接純化 (EtOAc 作為溶離劑)，產生產物 (24 毫克，0.048 毫莫耳，49%)，為黃色泡沫物。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 1.81-1.93 (m, 2H) 1.92-2.00 (m, 2H) 2.02 (s, 3H) 3.09 (s, 3H) 3.48-3.63 (m, 2H) 3.66-3.78 (m, 2H) 4.58 (寬廣 s., 1H) 5.16 (s, 2H) 5.96 (寬廣 s., 1H) 7.10 (寬廣 s., 1H) 7.30-7.45 (m, 5H) 7.61 (d, J=8.25 Hz, 2H) 8.06 (d, J=8.25 Hz, 2H). MS (ESI) 497.6 (M+1).

實例 159

(±)-4-(1-(5-環丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲基亞磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



步驟 A. 2-氯基-5-環丙基嘓啶之製備

將 5-溴基-2-氯基嘓啶 (100 毫克, 0.517 毫莫耳, Aldrich)、環丙基二羥基硼烷 (57.7 毫克, 0.672 毫莫耳, Aldrich)、三環己基膦 (14.50 毫克, 0.052 毫莫耳, Aldrich) 及 K_3PO_4 (384 毫克, 1.81 毫莫耳, EMD) 在甲苯 (2 毫升) 與水 (0.110 毫升) 中之混合物藉真空脫氣, 並以 Ar 滌氣。於所形成之混合物中, 添加醋酸鈣 (II) (5.80 毫克, 0.026 毫莫耳, Stem), 然後在微波條件下, 於 $120^\circ C$ 下加熱 10 分鐘。以 H_2O 使反應混合物淬滅, 接著以 EtOAc 萃取 (2x)。將合併之有機層以鹽水洗滌, 以 Na_2SO_4 脫水乾燥, 及在真空中濃縮成黃色油。使此油藉急驟式層析純化 (SiO_2 , 0 至 20% EtOAc 在己烷中), 產生 71 毫克所要之化合物, 為白色固體。MS (ESI) 155 (M+H).

步驟 B. 實例 159

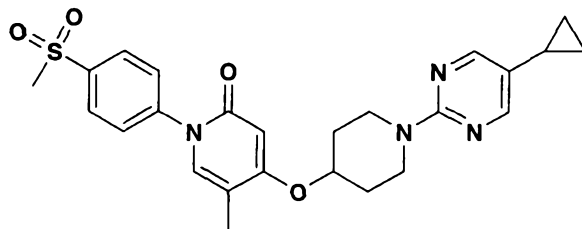
實例 159 係根據實例 155 與 156 中所述之程序, 在實例 155 步驟 E 中, 以 2-氯基-5-環丙基嘓啶取代 2-氯基-5-丙基嘓啶而製成。 1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 8.13 (s, 2H), 7.77 (d, J=8.31 Hz, 2H), 7.57 (d, J=8.31 Hz, 2H), 7.23 (d, J=7.34 Hz, 1H), 6.04-6.09 (m, 1H), 5.98-6.03 (m, 1H), 4.51-4.62 (m, 1H), 4.12-4.24 (m, 2H), 3.56-3.68

(m, 2H), 2.77 (s, 3H), 1.98-2.13 (m, 2H), 1.77-1.89 (m, 2H), 1.66-1.77 (m, 1H), 0.86-0.95 (m, 2H), 0.53-0.65 (m, 2H). MS (ESI) 451 (M+H).

實例 160

4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-5-甲基-1-(4-(甲磺

醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



步驟 A. 5-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

於 10% Pd/C (100 毫克, 0.940 毫莫耳) 在 5 毫升 MeOH 中之懸浮液內, 在氫氣下, 添加實例 158 (218 毫克, 0.439 毫莫耳), 以真空沖洗, 然後以氫三次, 接著於氫氣瓶下放置 150 分鐘。使反應物通過 15 毫米內徑 x 30 毫米 CELITE® 545 助濾劑填充柱, 以另外 15 毫升之 MeOH 溶離。使濾液濃縮成 135 毫克淡黃灰色泡沫物。MS (ESI) 363.2 (M+1).

步驟 B. 實例 160 之製備

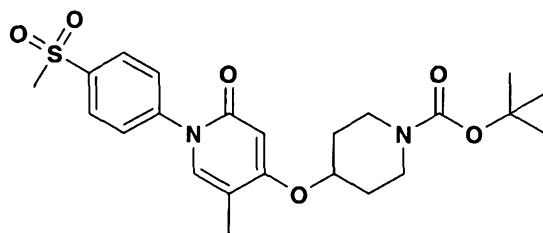
於得自上述步驟之化合物 (30 毫克, 0.083 毫莫耳) 中, 添加 0.3 毫升 DMF 中之 2-氯基-5-環丙基嘧啶 (25.6 毫克, 0.166 毫莫耳) 與碳酸鉀 (11.44 毫克, 0.083 毫莫耳), 然後在 100°C 油浴中加熱 15.5 小時。於反應混合物中, 添加 2 毫升 EtOAc, 接著以各 2 毫升飽和 NH₄Cl 水溶液、NaHCO₃、NaCl 及水洗滌。使 EtOAc 層通過 4 毫米內徑 x 25 毫米矽膠管柱, 以 ~7 毫升 EtOAc 溶離。使溶離液濃縮成 38 毫克淡黃色油, 使其自 EtOAc 結晶,

產生實例 160 (17 毫克, 0.034 毫莫耳, 42%), 為灰白色固體。
 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ ppm 0.51-0.66 (m, 2H) 0.86-0.97 (m, 2H)
 1.65-1.81 (m, 2H) 1.83-1.95 (m, 3H) 1.96-2.14 (m, 6H) 3.09 (s, 3H)
 3.71-3.88 (m, 2H) 3.99-4.11 (m, 2H) 4.55-4.70 (m, 1H) 6.00 (s, 1H) 7.07 (s,
 1H) 7.63 (d, $J=8.80$ Hz, 2H) 8.06 (d, $J=8.80$ Hz, 2H) 8.15 (s, 2H). MS
 (ESI) 481.3 (M+1).

實例 161

4-(5-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)

六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備

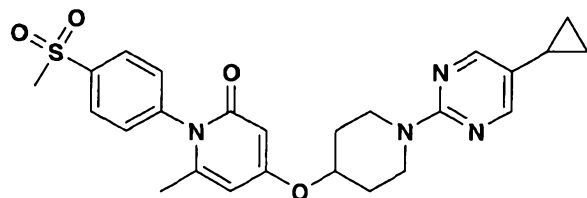


使實例 160 步驟 A 中獲得之化合物 (30 毫克, 0.083 毫莫耳)
 溶於二氯甲烷 (0.5 毫升) 與 N-乙基-N-異丙基丙-2-胺 (0.022 毫
 升, 0.124 毫莫耳) 中, 並添加 DMAP (1.011 毫克, 8.28 微莫耳),
 接著為二碳酸二-第三-丁酯 (19.87 毫克, 0.091 毫莫耳)。將混
 合物在室溫下攪拌 16 小時。於反應物中添加 2 毫升 CH_2Cl_2 ,
 然後, 將混合物以各 2 毫升飽和 NH_4Cl 水溶液、 NaHCO_3 、 NaCl
 及 2 毫升水洗滌。使有機層通過 4 毫米內徑 x 25 毫米矽膠管
 柱, 以 ~5 毫升 CH_2Cl_2 , 接著以 5 毫升 5% $\text{CH}_3\text{OH}/\text{CHCl}_3$ 溶離。5
 毫升 5% $\text{CH}_3\text{OH}/\text{CHCl}_3$ 之濃縮, 提供實例 161 (34 毫克, 0.074 毫
 莫耳, 89%), 為淡黃色固體。 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ ppm
 1.46 (s, 9H) 1.77-1.89 (m, 2H) 1.92-2.09 (m, 5H) 3.09 (s, 3H) 3.33-3.52 (m,
 2H) 3.57-3.71 (m, 2H) 4.48-4.63 (m, 1H) 5.98 (寬廣 s, 1H) 7.09 (s, 1H)

7.61 (d, J=8.25 Hz, 2H) 8.05 (d, J=8.80 Hz, 2H). MS (ESI) 463.3 (M+1).

實例 162

4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-6-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



步驟 A. 4-(6-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備

中間物係根據實例 1 中所述之程序，於步驟 A 中，以 4-羥基-6-甲基吡啶-2(1H)-酮取代 4-(苄氧基)吡啶-2(1H)-酮而製成。
MS (ESI) 463 (M+H).

步驟 B. 6-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽之製備

化合物係根據實例 2 中所述之程序，於步驟 A 中，以 4-(6-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯而製成。
MS (ESI) 363 (M+H).

步驟 C. 實例 162

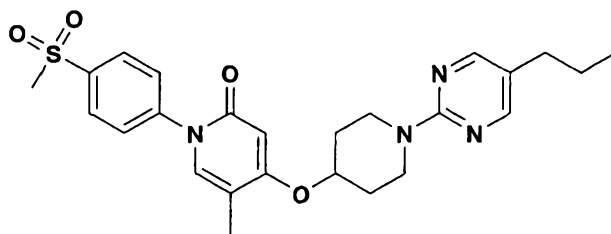
將 6-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽 (44 毫克，0.110 毫莫耳)、2-氯基-5-環丙基嘧啶 (20 毫克，0.129 毫莫耳) 及碳酸銨 (180 毫克，0.552 毫莫耳) 在 DMF (0.5 毫升) 中之混合物置於密閉小玻璃瓶中，並在 120°C

下攪拌 10 小時。將反應混合物以 EtOAc (20 毫升) 稀釋，且以水洗滌 3 次。然後，使有機層脫水乾燥 (Na_2SO_4)，及在減壓下蒸發，獲得黃色固體。使殘留物藉急驟式層析純化 (SiO_2 ，0-100% EtOAc/己烷)，而得實例 162 (16 毫克，30.2% 產率)，為白色固體。 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.03-8.17 (m, 4H), 7.44 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 5.91 (s, 2H), 4.48-4.58 (m, 1H), 4.10-4.22 (m, 2H), 3.62 (ddd, $J=13.20, 8.80, 3.85$ Hz, 2H), 3.12 (s, 3H), 1.96-2.13 (m, 2H), 1.90 (s, 3H), 1.75-1.86 (m, 2H), 1.67-1.76 (m, 1H), 1.62 (s, 4H), 0.81-0.96 (m, 2H), 0.47-0.64 (m, 2H). MS (ESI) 481 (M+H).

實例 163

5-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶

-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽之製備



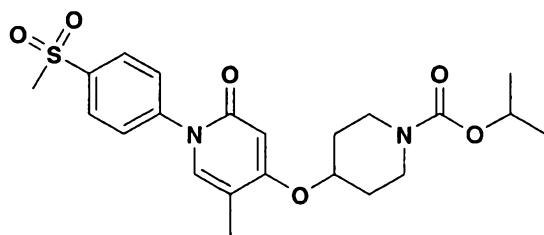
使實例 160 步驟 A 中獲得之化合物 (25 毫克，0.069 毫莫耳) 與 2-氯基-5-丙基嘓啶 (12.96 毫克，0.083 毫莫耳) 溶於 DMF (0.3 毫升) 中，添加碳酸鉀 (38.1 毫克，0.276 毫莫耳)，並將混合物在 100°C 油浴中放置 115 分鐘。於反應物中，添加 2 毫升 EtOAc，然後以各 2 毫升飽和 NH_4Cl 水溶液、 NaHCO_3 、 NaCl 及水連續洗滌。使反應物以 MgSO_4 脫水乾燥，過濾，及濃縮成 31 毫克黃褐色固體。於 31 毫克固體中，添加 0.6 毫升 EtOH，接著為 30 微升 6N HCl 水溶液 (0.18 毫莫耳 = 2.6 當量)，造成溶液完成。在真空中移除溶劑，提供 38 毫克淡黃褐色

泡沫物。使此物質立即溶於0.6毫升EtOH中。於此溶液中，以30微升增量添加己烷，直到添加180微升為止，此時發現混濁性，然後沉澱物形成。將混合物加熱至回流，但僅發生部份增溶作用。在室溫下攪拌過夜後，過濾混合物，並以EtOH(0.3毫升)，接著以2 x 1毫升己烷洗滌，提供實例163(22毫克，0.042毫莫耳，61%)，為白色粉末。¹H NMR (500 MHz, 甲醇-d₃) δ ppm 1.01 (t, J=7.42 Hz, 3H) 1.18 (t, J=7.15 Hz, 1H) 1.57-1.77 (m, 2H) 2.02-2.18 (m, 5H) 2.18-2.36 (m, 2H) 2.49-2.71 (m, 2H) 3.19 (s, 3H) 4.07 (t, J=5.50 Hz, 4H) 4.97-5.10 (m, 1H) 6.29 (s, 1H) 7.64 (s, 1H) 7.72 (d, J=8.25 Hz, 2H) 8.14 (d, J=8.80 Hz, 2H) 8.53 (s, 2H). MS (ESI) 483.5 (M+1).

實例 164

4-(5-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)

六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備



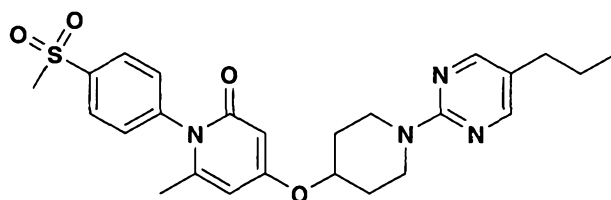
使實例160步驟A中獲得之化合物(25毫克，0.069毫莫耳)溶於二氯甲烷(0.5毫升)中，然後，於其中添加三乙胺(0.029毫升，0.207毫莫耳)與碳氯酸異丙酯(10.1毫克，0.083毫莫耳)。45分鐘後，在真空中移除溶劑，並使殘留物藉由通過UCT(聯合化學技術)2.5克C-18藥筒(#CEC181(2500)6)純化，且按下述溶離：

溶離份	體積	溶劑
1	25 毫升	水
2	25 毫升	30% MeOH/ 水
3-5	8 毫升	100% MeOH

使溶離份 3 在真空中濃縮，獲得實例 164 (24 毫克，0.052 毫莫耳，76%)，為黃褐色泡沫物。¹H NMR (500 MHz, 甲醇-d₃) δ ppm 1.27 (d, J=6.05 Hz, 6H) 2.02 (dd, J=8.52, 4.12 Hz, 2H) 2.05 (s, 3H) 3.18 (s, 3H) 3.47-3.55 (m, 2H) 3.67-3.76 (m, 2H) 4.77 (ddd, J=7.01, 3.44, 3.30 Hz, 1H) 4.88-4.92 (m, 1H) 6.06 (s, 1H) 7.45 (s, 1H) 7.67 (d, J=8.80 Hz, 2H) 8.10 (d, J=8.25 Hz, 2H). MS (ESI) 449.5.

實例 165

6-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

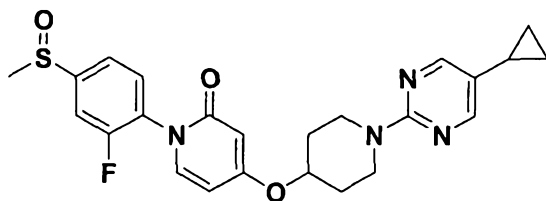


實例 165 係根據實例 162 步驟 C 中所述之程序，以 2-氯基-5-丙基嘧啶取代 2-氯基-5-環丙基嘧啶而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.16 (s, 2H), 7.87 (dd, J=14.57, 7.97 Hz, 2H), 7.43-7.57 (m, 1H), 5.92 (d, J=9.90 Hz, 2H), 4.48-4.59 (m, 1H), 4.18 (ddd, J=10.03, 7.01, 3.30 Hz, 2H), 3.56-3.70 (m, 2H), 3.14 (s, 3H), 2.40 (t, J=7.42 Hz, 2H), 1.99-2.13 (m, 2H), 1.94 (s, 3H), 1.83 (ddd, J=12.65, 8.25, 3.85 Hz, 2H), 1.46-1.66 (m, 4H), 0.94 (t, 3H). MS (ESI) 501 (M+H).

實例 166

(±)-4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(2-氯基

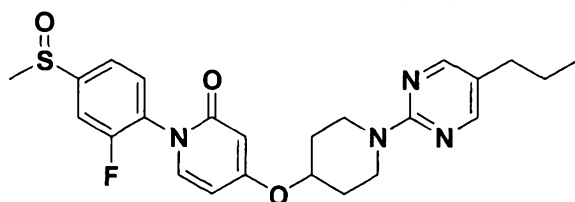
-4-(甲基亞磺酰基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 166 係根據實例 155 與 156 中所述之程序，在實例 155 中，於步驟 C 中，以 (4-溴基-3-氟苯基)(甲基)硫烷 (Combi-Blocks) 取代 (4-溴苯基)(甲基)硫烷，且在步驟 E 中，以 2-氯基-5-環丙基嘧啶 (根據實例 159 步驟 A 中所述之程序製成) 取代 2-氯基-5-丙基嘧啶而製成，惟將步驟 C 之產物藉預備之 HPLC 純化 (C_{18} 管柱，10-100% MeOH 在含有 0.1% 三氟醋酸之水中)。 1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 8.11 (s, 2H), 7.44-7.63 (m, 3H), 7.11 (d, $J=7.82$ Hz, 1H), 6.00-6.07 (m, 1H), 5.94-6.01 (m, 1H), 4.45-4.63 (m, 1H), 4.09-4.25 (m, 2H), 3.55-3.67 (m, 2H), 2.77 (s, 3H), 1.97-2.14 (m, 2H), 1.76-1.90 (m, 2H), 1.64-1.75 (m, 1H), 0.79-0.95 (m, 2H), 0.51-0.64 (m, 2H). MS (ESI) 469 (M+H).

實例 167

(±)-1-(2-氯基-4-(甲基亞磺酰基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



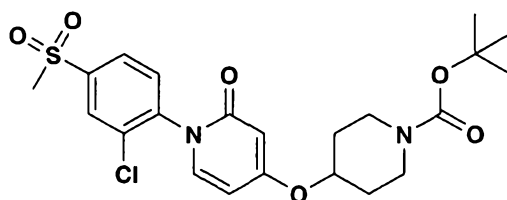
實例 167 係根據實例 155 與 156 中所述之程序，在實例 155 中，於步驟 C 中，以 (4-溴基-3-氟苯基)(甲基)硫烷 (Combi-Blocks) 取代 (4-溴苯基)(甲基)硫烷而製成，惟將步驟 C 之產物藉預備之 HPLC 純化 (C_{18} 管柱，10-100% MeOH 在含有 0.1% 三氟醋酸之

水中)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.18 (s, 2H), 7.48-7.66 (m, 3H), 7.14 (d, J=7.34 Hz, 1H), 6.06-6.09 (m, 1H), 6.01-6.06 (m, 1H), 4.54-4.66 (m, 1H), 4.14-4.27 (m, 2H), 3.59-3.72 (m, 2H), 2.80 (s, 3H), 2.42 (t, J=7.58 Hz, 2H), 2.02-2.16 (m, 2H), 1.80-1.95 (m, 2H), 1.50-1.69 (m, 2H), 0.95 (t, J=7.34 Hz, 3H). MS (ESI) 471 (M+H).

實例 168

4-(1-(2-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)

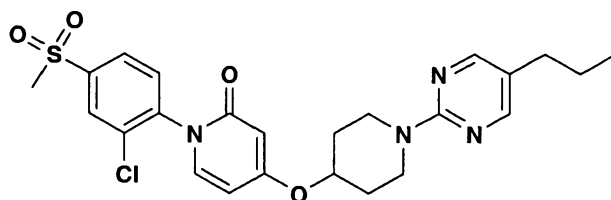
六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備



實例 168 係根據實例 1 中所述之程序，在步驟 A 中，以 2-氯基-1-氯基-4-(甲磺醯基)苯取代 1-溴基-4-(甲磺醯基)苯而製成，惟使用氫化鈉代替碘化銅(I)、8-羥基喹啉及碳酸鉀，並將混合物於 100°C 下加熱 2 小時代替在微波中於 145°C 下加熱。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.16 (s, 1H), 7.98 (dd, J=8.25, 2.20 Hz, 1H), 7.61 (d, J=8.25 Hz, 1H), 7.05 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.08 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 5.99 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.41-4.60 (m, 1H), 3.75 (d, J=4.95 Hz, 2H), 3.27-3.41 (m, 2H), 3.14 (s, 3H), 1.95-2.05 (m, 2H), 1.80 (dd, J=7.70, 4.40 Hz, 2H), 1.42-1.55 (m, 9H). MS (ESI) 483 (M+H).

實例 169

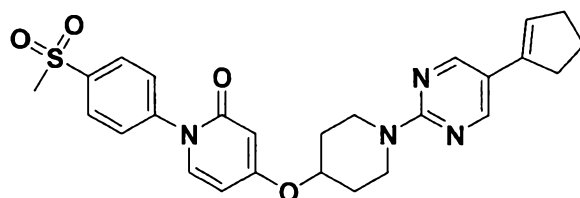
1-(2-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 169 係根據實例 168 與實例 162 中所述之程序，在步驟 C 中，以 1-(2-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽取代 6-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽，且以 2-氯基-5-丙基嘓啶取代 2-氯基-5-環丙基嘓啶而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.19 (s, 2H), 8.16 (s, 1H), 7.99 (dd, J=8.25, 2.20 Hz, 1H), 7.62 (d, J=8.25 Hz, 1H), 7.06 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.10 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 6.05 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.55-4.64 (m, 1H), 4.23 (dd, J=11.55, 6.05 Hz, 2H), 3.59-3.69 (m, 2H), 3.14 (s, 3H), 2.43 (t, J=7.42 Hz, 2H), 2.11 (td, J=6.32, 3.30 Hz, 2H), 1.88 (ddd, J=8.39, 4.40, 4.26 Hz, 2H), 1.55-1.61 (m, 2H), 0.96 (t, 3H). MS (ESI) 503 (M+H).

實例 170

4-(1-(5-環戊烯基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



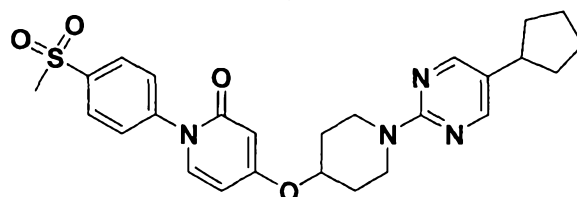
實例 170 係根據實例 109 中所述之程序，以環戊烯基二羥基硼烷 (Combi-Blocks) 取代苯基二羥基硼烷而製成，惟將反應物於微波條件下在 120°C 下加熱 15 分鐘，並使粗產物藉急驟式層析純化 (SiO₂，0 至 100% EtOAc 在 CH₂Cl₂ 中)。¹H NMR (400

MHz, CDCl₃) δ ppm 8.40 (s, 2H), 8.04-8.11 (m, 2H), 7.57-7.67 (m, 2H), 7.18-7.24 (m, 1H), 6.07-6.11 (m, 1H), 6.03-6.07 (m, 1H), 6.01 (d, J=1.47 Hz, 1H), 4.50-4.65 (m, 1H), 4.16-4.26 (m, 2H) 3.64-3.77 (m, 2H) 3.09 (s, 3H) 2.59-2.72 (m, 2H) 2.43-2.57 (m, 2H) 2.04-2.17 (m, 2H) 1.94-2.04 (m, 2H) 1.78-1.92 (m, 2H). MS (ESI) 493 (M+H).

實例 171

4-(1-(5-環戊基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)

苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備

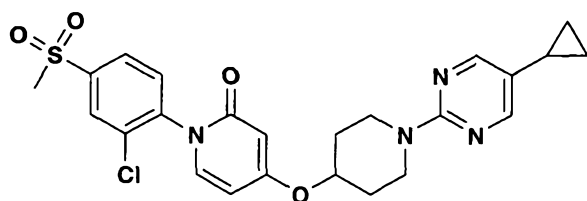


實例 171 係根據實例 120 步驟 C 中所述之程序，以 4-(1-(5-環戊烯基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮取代 1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(丙-1-烯-2-基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮而製成，惟將反應物攪拌 2 小時，並使粗產物藉急驟式層析純化 (SiO₂，0 至 100% EtOAc 在 CH₂Cl₂ 中)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.15 (s, 2H), 8.00 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.56 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.16 (d, J=7.34 Hz, 1H), 6.00 (dd, J=7.34, 2.45 Hz, 1H), 5.95 (d, J=2.45 Hz, 1H), 4.45-4.57 (m, 1H), 4.06-4.19 (m, 2H), 3.50-3.61 (m, 2H), 3.03 (s, 3H), 2.69-2.81 (m, 1H), 1.92-2.08 (m, 4H), 1.68-1.85 (m, 4H), 1.56-1.69 (m, 2H), 1.36-1.46 (m, 2H). MS (ESI) 495 (M+H).

實例 172

1-(2-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡

吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

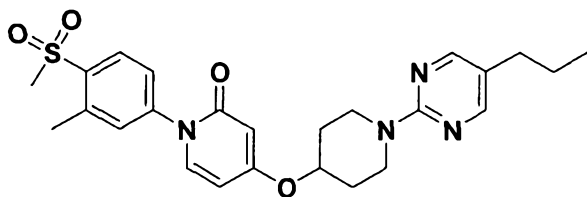


實例 172 係根據實例 169 中所述之程序，以 2-氯基-5-環丙基嘍啶取代 2-氯基-5-丙基嘍啶而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.14-8.15 (m, 3H), 7.91-8.03 (m, 1H), 7.60 (d, J=8.25 Hz, 1H), 7.03 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.07 (dd, J=7.42, 2.47 Hz, 1H), 6.01 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.58 (ddd, J=7.29, 3.85, 3.71 Hz, 1H), 4.12-4.24 (m, 1H), 3.67 (m, 2H), 3.10-3.18 (m, 1H), 3.09 (s, 3H), 1.97-2.15 (m, 2H), 1.86 (d, J=3.85 Hz, 2H), 1.65-1.77 (m, 1H), 0.85-1.00 (m, 2H), 0.48-0.66 (m, 2H). MS (ESI) 501 (M+H).

實例 173

1-(3-甲基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘍啶-2-基)六氫吡啶

-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



步驟 A. 1-(5-丙基嘍啶-2-基)六氫吡啶-4-醇之製備

於六氫吡啶-4-醇 (2.33 克, 23.0 毫莫耳, Aldrich) 與碳酸鉀 (6.36 克, 46.0 毫莫耳, EMD) 在 DMF (15 毫升) 中之正在攪拌溶液內, 在室溫下, 添加 2-氯基-5-丙基嘍啶 (4.33 克, 27.6 毫莫耳, Wako)。將反應混合物於 100°C 下加熱 3 小時, 然後以 H₂O 稀釋。以 EtOAc 萃取 (2x) 所形成之混合物。合併有機層, 以 Na₂SO₄ 脫水乾燥, 及在真空中濃縮成褐色油。使此油藉急

驟式層析純化(SiO_2 ，0至100% EtOAc在 CH_2Cl_2 中)，產生5.01克所要之產物，為白色固體。MS (ESI) 222 (M+H).

步驟 B. 甲烷磺酸 1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯之製備

於1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-醇(9.2克，41.6毫莫耳)、 Et_3N (12.85毫升，91毫莫耳，Aldrich)在 CH_2Cl_2 (80毫升)中之正在攪拌溶液內，在 0°C 下，逐滴添加氯化甲烷磺醯(3.54毫升，45.7毫莫耳，Acros)在 CH_2Cl_2 (20毫升)中之溶液。將反應混合物於室溫下攪拌1小時，並以 H_2O 中之1N HCl、 H_2O 中之飽和 NaHCO_3 及鹽水洗滌。使有機層以 Na_2SO_4 脫水乾燥，及在真空中濃縮，產生11.7克所要之產物，為灰白色固體。MS (ESI) 300 (M+H).

步驟 C. 4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

將4-羥基吡啶-2(1H)-酮(5.23克，47.1毫莫耳，Aldrich)、甲烷磺酸 1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯(11.7克，39.2毫莫耳)、碳酸鉀(12.5克，90.0毫莫耳，EMD)及DMSO (48毫升)之正在攪拌懸浮液於 100°C 下加熱3小時，然後冷卻至室溫。將所形成之混合物以 H_2O 稀釋，並以EtOAc萃取(2x)。合併有機層，及在真空中濃縮成褐色固體。使此固體藉急驟式層析純化(SiO_2 ，100% EtOAc，接著為 SiO_2 ，10% MeOH在 CH_2Cl_2 中)，產生5.00克所要之產物，為灰白色固體。MS (ESI) 315 (M+H).

步驟 D. 4-溴基-2-甲基-1-(甲磺醯基)苯之製備

將 4-溴基 -1-碘基 -2-甲 苯 (240 微升，1.68 毫莫耳，Aldrich)、碘化銅 (I) (353 毫克，1.85 毫莫耳，Alfa Aesar)、甲烷亞磺酸，鈉鹽 (688 毫克，6.74 毫莫耳，Alfa Aesar) 及 DMSO (7.2 毫升) 之混合物以氫滌氣，然後於微波條件下，在 125°C 下加熱 20 分鐘。將所形成之混合物於 100°C 下攪拌 3 小時，接著冷卻至室溫。將反應混合物以 H₂O 稀釋，並以 EtOAc 萃取 (2x)。合併有機層，且以鹽水洗滌，以 Na₂SO₄ 脫水乾燥，及在真空中濃縮成白色固體。使此固體藉急驟式層析純化 (SiO₂，0-50% EtOAc 在己烷中)，產生 270 毫克所要之產物，為白色固體。MS (ESI) 249 (M+H).

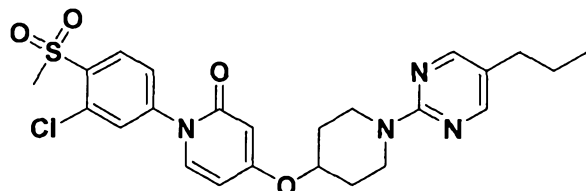
步驟 E. 實例 173

將 4-溴基 -2-甲 基 -1-(甲 磺 醯 基) 苯 (79 毫克，0.32 毫莫耳)、4-(1-(5-丙基嘧啶 -2-基)六氫吡啶 -4-基氧基)吡啶 -2(1H)-酮 (100 毫克，0.318 毫莫耳)、喹啉 -8-醇 (18.5 毫克，0.127 毫莫耳，Alfa Aesar)、碳酸鉀 (57.1 毫克，0.414 毫莫耳)、碘化銅 (I) (24.2 毫克，0.127 毫莫耳，Alfa Aesar) 在 DMSO (4 毫升) 中之混合物於 Ar 及 140°C 下攪拌過夜。將所形成之混合物以 H₂O 稀釋，並以 EtOAc 萃取 (2x)。將合併之有機層以鹽水洗滌，以 Na₂SO₄ 脫水乾燥，及在真空中濃縮成綠色油。使此油藉急驟式層析純化 (SiO₂，0 至 100% EtOAc 在 CH₂Cl₂ 中)，產生 107.7 毫克所要之產物，為黃色固體。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.10-8.22 (m, 3H), 7.34-7.43 (m, 2H), 7.18 (d, J=7.82 Hz, 1H), 6.03 (dd, J=7.58, 2.20 Hz, 1H), 5.99 (d, J=2.45 Hz, 1H), 4.47-4.63 (m, 1H), 4.13-4.22 (m, 2H), 3.56-3.69 (m, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.73 (s, 3H), 2.39 (t, J=7.58 Hz,

2H) 2.00-2.12 (m, 2H), 1.75-1.92 (m, 2H), 1.47-1.62 (m, 2H), 0.92 (t, J=7.34 Hz, 3H). MS (ESI) 483 (M+H).

實例 174

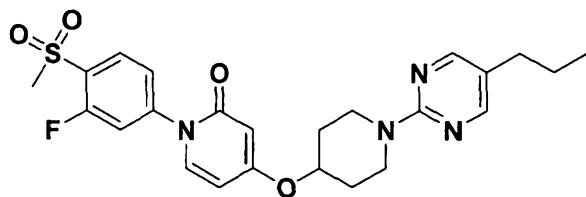
1-(3-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 174 係根據實例 173 中所述之程序，在步驟 D 中，以 4-溴基-2-氯基-1-碘苯 (Alfa-Aesar) 取代 4-溴基-1-碘基-2-甲苯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.28 (d, J=8.31 Hz, 1H) 8.18 (s, 2H) 7.69 (d, J=1.47 Hz, 1H) 7.52 (dd, J=8.07, 1.71 Hz, 1H) 7.21 (d, J=7.82 Hz, 1H) 6.08 (dd, J=7.58, 2.20 Hz, 1H) 6.01 (d, J=2.45 Hz, 1H) 4.52-4.63 (m, 1H) 4.13-4.27 (m, 2H) 3.58-3.71 (m, 2H) 3.30 (s, 3H) 2.42 (t, J=7.34 Hz, 2H) 2.04-2.16 (m, 2H) 1.78-1.94 (m, 2H) 1.51-1.66 (m, 2H) 0.95 (t, J=7.34 Hz, 3H). MS (ESI) 503 (M+H).

實例 175

1-(3-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



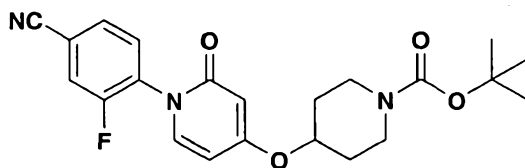
實例 175 係根據實例 173 中所述之程序，在步驟 D 中，以 4-溴基-2-氟基-1-碘苯 (Aldrich) 取代 4-溴基-1-碘基-2-甲苯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.15 (s, 2H), 8.06 (t, J=8.07 Hz,

1H), 7.42 (dd, J=10.27, 1.96 Hz, 1H), 7.34 (dd, J=8.56, 1.71 Hz, 1H), 7.19 (d, J=7.34 Hz, 1H), 6.06 (dd, J=7.82, 2.45 Hz, 1H), 5.98 (d, J=2.45 Hz, 1H), 4.50-4.61 (m, 1H), 4.12-4.25 (m, 2H), 3.53-3.70 (m, 2H), 3.23 (s, 3H), 2.39 (t, J=7.58 Hz, 2H), 1.99-2.15 (m, 2H), 1.75-1.90 (m, 2H), 1.45-1.62 (m, 2H), 0.92 (t, J=7.34 Hz, 3H). MS (ESI) 487 (M+H).

實例 176

4-(1-(4-氟基-2-氰基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡

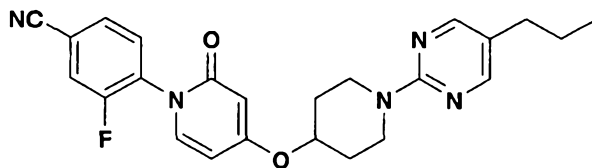
啶-1-羧酸第三-丁酯之製備



於 4-(2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯 (730 毫克, 2.480 毫莫耳, 實例 132 步驟 A) 與 DMF (12 毫升) 之混合物中, 在室溫下添加氫化鈉 (114 毫克, 2.85 毫莫耳)。於室溫下攪拌 1 小時後, 添加 3,4-二氟苯甲腈 (345 毫克, 2.480 毫莫耳, Aldrich), 並將反應混合物於 100°C 下加熱 1.5 小時, 且冷卻至室溫。以 EtOAc 與水稀釋所形成之混合物, 及以 EtOAc 進一步萃取 (3x) 水層。將合併之有機萃液以水與鹽水洗滌, 脫水乾燥 (MgSO₄), 及在減壓下蒸發。使殘留物於矽膠上藉急驟式層析純化 (0-100% EtOAc 在己烷中), 而得標題化合物 (602.4 毫克, 58.7%), 為灰白色固體。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 7.47-7.64 (m, 3H), 7.10 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.04 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H), 5.96 (d, J=2.20 Hz, 1H), 4.41-4.55 (m, 1H), 3.65-3.80 (m, 2H), 3.27-3.39 (m, 2H), 1.91-2.04 (m, 2H), 1.71-1.84 (m, 2H), 1.48 (s, 9H). MS (ESI) 358 (M+H-C₄H₈).

實例 177

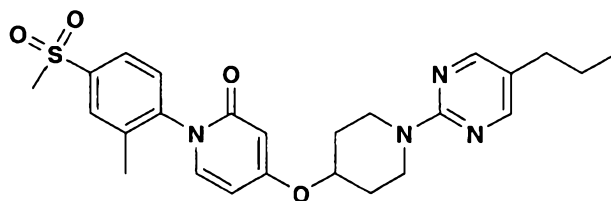
3-氟基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲腈, TFA 鹽之製備



實例 177 係根據實例 132 中所述之程序，在步驟 C，以 4-(1-(4-氟基-2-氟苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯 (實例 176) 取代 4-(2-酮基-1-(吡啶-3-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.17 (s, 2H), 7.49-7.64 (m, 3H), 7.10 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.06 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 6.01 (d, J=2.20 Hz, 1H), 4.53-4.62 (m, 1H), 4.15-4.25 (m, 2H), 3.56-3.70 (m, 2H), 2.41 (t, J=7.70 Hz, 2H), 2.02-2.14 (m, 2H), 1.76-1.92 (m, 2H), 1.51-1.65 (m, 2H), 0.94 (t, J=7.15 Hz, 3H). MS (ESI) 434 (M+H).

實例 178

1-(2-甲基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

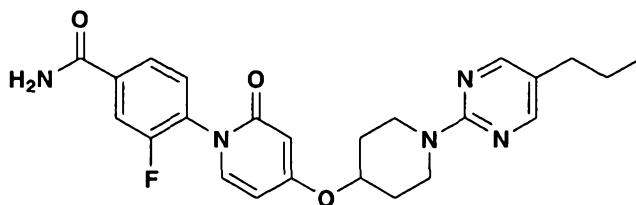


實例 178 係根據實例 162 中所述之程序，在步驟 C 中，以 4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮取代 4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯，且以 1-氟基-2-甲基-4-(甲磺醯基)苯取代 4-溴基苯甲腈而製成，惟按實例 1 步

驟 A 中所述，將反應物與碘化銅(I)、碳酸鉀及喹啉-8-醇於 160°C 下在微波中一起加熱 20 分鐘，代替於 120°C 下在碳酸鉀存在下回流 10 小時。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.21 (寬廣 s., 2H), 7.92 (s, 1H), 7.88 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.40 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.06 (d, J=6.05 Hz, 1H), 5.93-6.11 (m, 2H), 4.58 (寬廣 s., 1H), 4.21 (寬廣 s., 2H), 3.56-3.80 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.41 (t, J=7.42 Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.09 (d, J=9.90 Hz, 2H), 1.87 (寬廣 s., 2H), 1.48-1.65 (m, 2H), 0.93 (t, J=7.42 Hz, 3H). MS (ESI) 483 (M+H).

實例 179

3-氟基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲醯胺, TFA 鹽之製備

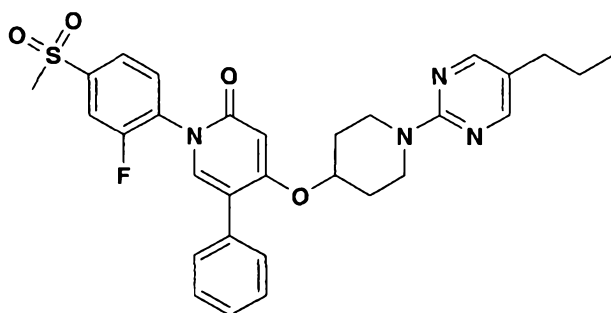


將 3-氟基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲腈 (55.9 毫克, 0.129 毫莫耳, 實例 177)、乙醯胺 (30.5 毫克, 0.516 毫莫耳, Aldrich) 及氯化鋅 (70.3 毫克, 0.516 毫莫耳, Alfa Aesar) 在水 (1.5 毫升) 與 THF (1.5 毫升) 中之混合物於微波條件 (155°C, 45 分鐘) 下加熱。添加另外之乙醯胺 (7.6 毫克, 1 當量) 與氯化鋅 (17.5 毫克, 1.0 當量), 並所形成之混合物於微波條件 (155°C, 15 分鐘) 下再一次加熱。以水與 CH₂Cl₂ 稀釋反應混合物, 並以 CH₂Cl₂ 進一步萃取 (2x) 水層。將合併之萃液以鹽水洗滌, 脫水乾燥 (Na₂SO₄), 及在減壓下蒸發。使殘留物藉預備之 HPLC 純化 (C₁₈ 管柱; 0-60%

乙腈在含有 0.05% 三氟醋酸之水中)，獲得實例 179 (36.1 毫克，62%)，為淡黃色固體。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.33 (s, 2H), 7.70 (t, J=9.01 Hz, 2H), 7.43 (t, J=7.69 Hz, 1H), 7.18 (d, J=7.47 Hz, 1H), 6.68 (寬廣 s, 1H), 6.06-6.17 (m, 2H), 5.89 (寬廣 s, 1H), 4.59-4.72 (m, 1H), 4.05-4.18 (m, 2H), 3.79-3.93 (m, 2H), 2.48 (t, J=7.69 Hz, 2H), 2.06-2.17 (m, 2H), 1.90-2.03 (m, 2H), 1.55-1.67 (m, 2H), 0.96 (t, J=7.25 Hz, 3H). MS (ESI) 452 (M+H).

實例 180

1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-5-苯基-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



步驟 A. 6-氯基-4-羥基-5-苯基吡啶-2(1H)-酮之製備

在氮氣下，於 200 毫升回收燒瓶中之二氯化丙二醯 (17.43 毫升，179 毫莫耳) 內，添加 2-苯基乙腈 (9.80 毫升，85 毫莫耳)，並將混合物在氮氣及室溫下攪拌 23 小時。於所形成之濃稠褐色混合物中，添加醚 (200 毫升)。其造成褐色粉末狀沉澱物之形成，將其在室溫下過濾，以醚 (4 x 50 毫升) 洗滌，然後於真空下乾燥，獲得粗產物，為黃褐琥珀色粉末 (7.28 克)。MS (ESI) 222 (M+H).

步驟 B. 4-羥基-5-苯基吡啶-2(1H)-酮之製備

將鈣/碳 (480 毫克，50 重量%，潮濕，0.451 毫莫耳) 與 6-氯

基-4-羥基-5-苯基吡啶-2(1H)-酮(1000毫克, 4.51毫莫耳)在EtOH(40毫升)中之懸浮液置於氫氣瓶下, 並在60°C下攪拌。於氫下攪拌30小時後, 使混合物趁熱經過Celite® 545助濾劑之墊片過濾, 且以熱乙醇沖洗。使濾液濃縮, 獲得490毫克粗產物, 為黃色固體。MS (ESI) 188 (M+H).

步驟 C. 5-苯基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

步驟C中之化合物係根據實例1中所述之程序, 在步驟D中, 以4-羥基-5-苯基吡啶-2(1H)-酮取代4-羥基-1-(4-(甲磺醯基)吡啶-2(1H)-酮), 且以甲烷磺酸1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯取代4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯而製成。MS (ESI) 391 (M+H).

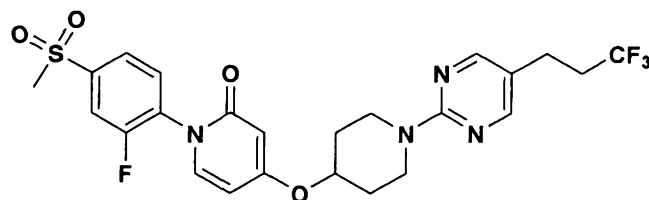
步驟 D. 實例 180

實例180係根據實例8中所述之程序, 以5-苯基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮取代4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯, 且在步驟C中, 以1,2-二氟-4-(甲磺醯基)苯取代4-溴基苯甲腈而製成, 惟使微波反應於180°C下進行25分鐘。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.16 (寬廣 s., 2H), 7.82-7.93 (m, 2H), 7.64-7.74 (m, 1H), 7.30-7.46 (m, 5H), 7.19 (s, 1H), 6.12 (s, 1H), 4.71 (寬廣 s., 1H), 3.85 (寬廣 s., 4H), 3.04-3.18 (m, 3H), 2.42 (t, J=7.47 Hz, 2H), 1.82-2.11 (m, 4H), 1.49-1.65 (m, 2H), 0.93 (t, J=7.25 Hz, 3H). MS (ESI) 563 (M+H).

實例 181

1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(3,3,3-三氟丙基)嘧啶-2-基)

六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽之製備



步驟 A. 2-氟基-5-(3,3,3-三氟丙基)嘓啶之製備

於 500 毫升裂縫形燒瓶中之鎂 (1.373 克, 56.5 毫莫耳) 內, 施加真空, 然後為氮, 添加 50 毫升 THF, 添加 3-溴基-1,1,1-三氟丙烷 (6.02 毫升, 56.5 毫莫耳), 接著為 1 顆碘結晶。在 1 分鐘內, 混合物變成溫熱, 且於 5 分鐘內回流。以冰浴使混合物冷卻 2 分鐘, 以控制放熱反應, 然後, 使其溫熱回復至室溫。在 65 分鐘內, 幾乎全部 Mg 已溶解。添加氯化鋅 (II) (3.85 克, 28.3 毫莫耳), 其造成少量熱產生。於 10 分鐘內, 幾乎全部溶解, 以提供 THF 中之 ~1.1M $\text{Zn}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3)_2$ 。於 5-溴基-2-氟基嘓啶 (7.72 克, 39.9 毫莫耳) 與雙(三-第三-丁基膦)鈮 (0) (404 毫克, 0.791 毫莫耳) 中, 施加真空, 然後放置在氮大氣下, 添加 80 毫升 THF, 接著添加 60 毫升在 THF 中之 ~1.1M $\text{Zn}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3)_2$, 歷經 ~2 分鐘。23 小時後, 以 300 毫升飽和 NH_4Cl + 300 毫升 EtOAc 使反應淬滅, 然後, 將有機層以 300 毫升飽和 NaHCO_3 , 接著以 300 毫升水洗滌, 以 MgSO_4 脫水乾燥, 過濾, 然後濃縮成 7.6 克褐色油狀固體。使此物質藉急驟式層析純化 (0-10% EtOAc/己烷), 產生產物 (3.86 克, 18.4 毫莫耳, 46% 產率), 為淡黃色固體。MS (ESI) 211.1 (M+1).

步驟 B. 甲烷磺酸 1-(5-(3,3,3-三氟丙基)嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯之製備

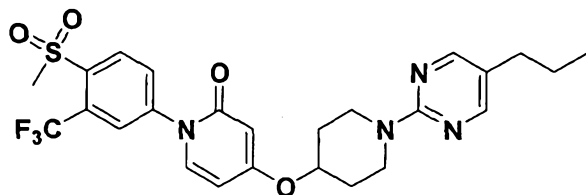
以類似實例 142 步驟 A 與 B 中所述之方式，使 2-氯基-5-(3,3,3-三氟丙基)嘧啶(實例 181 步驟 A)轉化成甲烷磺酸 1-(5-(3,3,3-三氟丙基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯。

步驟 C. 實例 181 之製備

於按實例 142 步驟 D 中所述獲得之 1-(2-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-羥基吡啶-2(1H)-酮(85 毫克，0.3 毫莫耳)中，添加甲烷磺酸 1-(5-(3,3,3-三氟丙基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯(106 毫克，0.300 毫莫耳)、碳酸鉀(54.0 毫克，0.900 毫莫耳)，然後為 1 毫升 DMF，將混合物在 90°C 油浴中放置 345 分鐘。於其中添加 5 毫升 EtOAc，並將混合物以 2 x 2 毫升水洗滌，以 MgSO₄ 脫水乾燥，過濾，及濃縮成 99 毫克(0.183 毫莫耳)黃色固體，於其中添加 2 毫升 EtOH，接著為 125 微升 6N HCl 水溶液(0.75 毫莫耳，4.1 當量)。在一分鐘內，伴隨著攪拌，全部物質溶解。再攪拌 5 分鐘，於真空中移除溶劑，產生 110 毫克淡黃色固體，在其中添加 3 毫升 EtOH，並將混合物加熱至回流，此時固體顯示變成白色至黃褐色及結晶性。冷卻至室溫，過濾，並以 2 x 0.5 毫升 EtOH 洗滌，然後在真空中乾燥，產生實例 181 (33 毫克，0.057 毫莫耳，19%)，為灰白色結晶性粉末。¹H NMR (500 MHz, 甲醇-d₃) δ ppm 2.01 (m, 2H) 2.13-2.31 (m, 2H) 2.43-2.70 (m, 2H) 2.79-3.01 (m, 2H) 3.22 (s, 3H) 3.86-4.03 (m, 2H) 4.05-4.30 (m, 2H) 6.13 (d, J=2.75 Hz, 1H) 6.31 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H) 7.57 (d, J=7.15 Hz, 1H) 7.67-7.82 (m, 1H) 7.87-8.07 (m, 2H) 8.58 (s, 2H). MS (ESI) 541.1.

實例 182

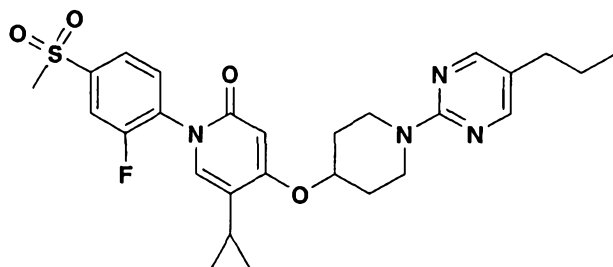
1-(4-(甲磺醯基)-3-(三氟甲基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 182 係根據實例 173 中所述之程序，在步驟 D 中，以 4-溴基-1-碘基-2-(三氟甲基)苯 (Oakwood) 取代 4-溴基-1-碘基-2-甲
 苯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.43 (d, J=8.80 Hz, 1H),
 8.16 (s, 2H), 7.95 (d, J=2.20 Hz, 1H), 7.85 (dd, J=8.25, 2.20 Hz, 1H), 7.23
 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.11 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H), 6.01 (d, J=2.75 Hz, 1H),
 4.51-4.63 (m, 1H), 4.14-4.24 (m, 2H), 3.60-3.69 (m, 2H), 3.21 (s, 3H), 2.40
 (t, J=7.70 Hz, 2H), 2.04-2.12 (m, 2H), 1.79-1.90 (m, 2H), 1.52-1.64 (m,
 2H), 0.94 (t, J=7.15 Hz, 3H). MS (ESI) 537 (M+H).

實例 183

5-環丙基-1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)
 六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮，TFA 鹽之製備



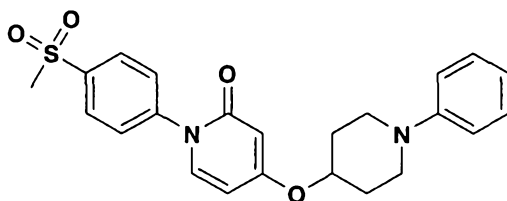
實例 183 係根據實例 180 中所述之程序，在步驟 A 中，以 2-
 環丙基乙腈取代 2-苯基乙腈而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃)
 δ ppm 8.34-8.50 (m, 2H), 7.77-7.95 (m, 2H), 7.60 (t, J=7.69 Hz, 1H), 6.95
 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 4.84 (寬廣 s., 1H), 4.24-4.39 (m, 2H), 3.89-4.06 (m,

2H), 3.12 (s, 3H), 2.55 (t, J=7.47 Hz, 2H), 2.17 (d, 4H), 1.71-1.80 (m, 1H), 1.55-1.70 (m, 2H), 0.91-1.05 (m, 3H), 0.81-0.92 (m, 2H), 0.40-0.54 (m, 2H). MS (ESI) 527 (M+H).

實例 185

1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-苯基六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-

酮, TFA 鹽之製備



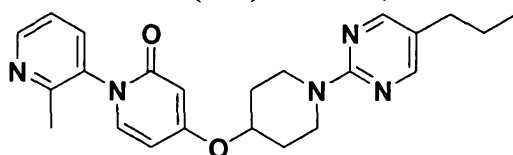
於 1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮、HCl 鹽 (35 毫克, 0.100 毫莫耳)、苯基二羥基硼烷 (24.50 毫克, 0.201 毫莫耳)、醋酸銅 (II) (27.4 毫克, 0.151 毫莫耳) 及 75 毫克 4Å 分子篩 (經烘箱乾燥) 中, 添加 1.5 毫升 CH_2Cl_2 , 然後為吡啶 (0.016 毫升, 0.201 毫莫耳)。將黃褐色懸浮液開放至空氣, 攪拌 2-3 分鐘, 然後加蓋, 並持續攪拌。在 3-4 分鐘內, 混合物展色成淡綠藍色。89 小時後, 添加 4 毫升 CH_2Cl_2 , 接著以 3 x 3 毫升飽和 NH_4Cl 水溶液洗滌, 使有機層以 MgSO_4 脫水乾燥, 過濾, 然後濃縮, 提供 14 毫克淡灰綠色固體, 使其藉預備之 HPLC 純化 (C18 管柱; MeOH 在含有 0.1% TFA 之水中), 產生實例 185 (1.27 毫克, 0.001 毫莫耳, 1%), 為淡黃色油。MS (ESI) 425.1 (M+1). ^1H NMR (500 MHz, 甲醇- d_3) δ ppm 2.05-2.18 (m, 2H) 2.23-2.38 (m, 2H) 3.17 (s, 3H) 3.44 (s, 1H) 3.57-3.74 (m, 1H) 6.11 (d, J=2.75 Hz, 1H) 6.31 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H) 7.16 (寬廣 s., 1H) 7.31 (d, J=7.70 Hz, 1H) 7.41 (t, J=7.70 Hz, 1H) 7.61 (d, J=7.70 Hz,

1H) 7.64-7.73 (m, 2H) 8.11 (d, 2H). MS (ESI) 425.1 (M+1).

實例 186

1-(2-甲基吡啶-3-基)-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)

吡啶-2(1H)-酮之製備

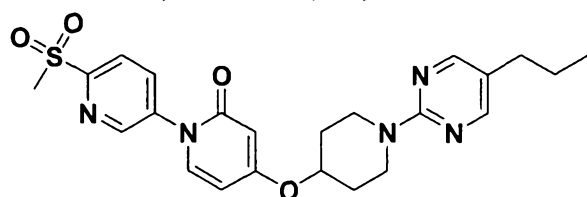


實例 186 係根據實例 173 中所述之程序，於步驟 E 中，以 3-溴基-2-甲基吡啶 (3B Pharmachem) 取代 4-溴基-2-甲基-1-(甲磺醯基)苯而製成，惟使粗製固體藉急驟式層析 (SiO_2 ，0 至 10% MeOH 在 CH_2Cl_2 中)，並藉預備之 HPLC (C_{18} 管柱，10-100% MeOH 在含有 0.1% 三氟醋酸之水中) 純化。 ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.52 (d, $J=3.85$ Hz, 1H), 8.10 (s, 2H), 7.47 (dd, $J=8.25$, 1.10 Hz, 1H), 7.20-7.23 (m, 1H), 6.98 (d, $J=7.70$ Hz, 1H), 5.97-5.99 (m, 1H), 5.96 (s, 1H), 4.48-4.53 (m, 1H), 4.12-4.18 (m, 2H), 3.53-3.58 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.34 (t, $J=7.70$ Hz, 2H), 2.00-2.05 (m, 2H), 1.75-1.82 (m, 2H), 1.47-1.55 (m, 2H), 0.87 (t, $J=7.42$ Hz, 3H). MS (ESI) 406 (M+H).

實例 187

1-(6-(甲磺醯基)吡啶-3-基)-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-

基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

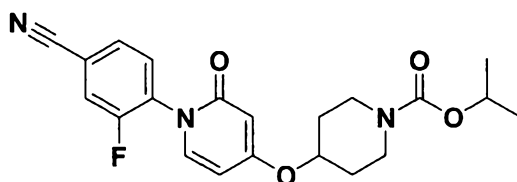


實例 187 係根據實例 173 中所述之程序，在步驟 E 中，以 5-溴基-2-(甲磺醯基)吡啶 (Synthonix) 取代 4-溴基-2-甲基-1-(甲磺

醯基)苯而製成，惟將反應物於微波條件下在 160°C 下加熱 30 分鐘。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.79 (d, J=2.20 Hz, 1H) 8.23 (d, J=8.24 Hz, 1H) 8.17 (s, 2H) 8.07 (dd, J=8.25, 2.20 Hz, 1H) 7.23 (d, J=7.70 Hz, 1H) 6.12 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H) 6.02 (d, J=2.20 Hz, 1H) 4.55-4.62 (m, 1H) 4.16-4.24 (m, 2H) 3.60-3.68 (m, 2H) 3.27 (s, 3H) 2.41 (t, 2H) 2.05-2.13 (m, 2H) 1.80-1.90 (m, 2H) 1.53-1.63 (m, 2H) 0.94 (t, J=7.42 Hz, 3H). MS (ESI) 470 (M+H).

實例 188

4-(1-(4-氟基-2-氰基-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備

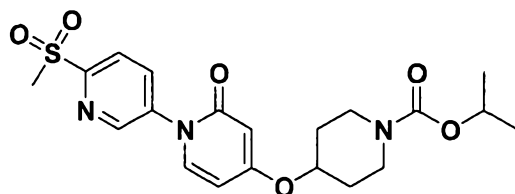


實例 188 係根據實例 132 中所述之程序，於步驟 C 中，以 4-(1-(4-氟基-2-氰基-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯(實例 176)取代 4-(2-酮基-1-(吡啶-3-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯，且在步驟 D 中，以碳氟酸異丙酯(1 莫耳濃度，在甲苯中，Aldrich)取代 2-氟基-5-丙基嘓啶，並以三乙胺取代碳酸銨而製成，惟將反應物於室溫下攪拌 20 分鐘，然後以 HCl 溶液(1 莫耳濃度，在 H₂O 中)洗滌。使粗製固體藉急驟式層析純化(SiO₂，0 至 100% EtOAc 在 CH₂Cl₂ 中)。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 7.49-7.58 (m, 3H), 7.08 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.02 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H), 5.93 (d, J=2.20 Hz, 1H), 4.87-4.95 (m, 1H), 4.45-4.49 (m, 1H), 3.69-3.77 (m, 2H),

3.32-3.39 (m, 2H), 1.92-2.00 (m, 2H), 1.72-1.81 (m, 2H), 1.24 (d, J=6.60 Hz, 6H). MS (ESI) 400 (M+H).

實例 189

4-(1-(6-(甲磺醯基)吡啶-3-基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六 氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備



步驟 A. 4-羥基六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備

於六氫吡啶-4-醇(5.22克，51.6毫莫耳，Aldrich)、Et₃N(13.2毫升，95毫莫耳，Aldrich)在CH₂Cl₂(50毫升)中之正在攪拌溶液內，在0°C下，逐滴添加氯甲酸異丙酯溶液(1莫耳濃度，在甲苯中，43.0毫升，43.0毫莫耳，Aldrich)。將反應混合物於室溫下攪拌1小時，並以H₂O中之1N HCl洗滌。以DCM萃取(2x) H₂O層。合併有機層，及在真空中濃縮，產生5.71克所要之產物，為淡褐色油。MS (ESI) 188 (M+H).

步驟 B. 實例 189

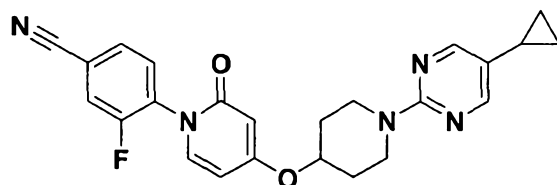
實例 189係根據實例 173中所述之程序，於步驟 B中，以4-羥基六氫吡啶-1-羧酸異丙酯取代1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-醇，且在步驟 E中，以5-溴基-2-(甲磺醯基)吡啶取代4-溴基-2-甲基-1-(甲磺醯基)苯而製成，惟將反應物於微波條件下在160°C下加熱30分鐘。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.78 (d, J=2.20 Hz, 1H), 8.22 (d, J=8.25 Hz, 1H), 8.06 (dd, J=8.25, 2.75 Hz, 1H), 7.23 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.11 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H), 5.98 (d,

J=2.75 Hz, 1H), 4.90-4.98 (m, 1H), 4.49-4.54 (m, 1H), 3.72-3.79 (m, 2H), 3.36-3.42 (m, 2H), 3.27 (s, 3H), 1.96-2.03 (m, 2H), 1.76-1.84 (m, 2H), 1.26 (d, J=6.05 Hz, 6H). MS (ESI) 436 (M+H).

實例 190

4-(4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶

-1(2H)-基)-3-氟基苯甲腈之製備

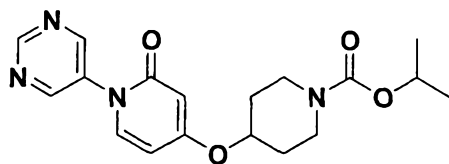


實例 190 係根據實例 132 中所述之程序，於步驟 C 中，以 4-(1-(4-氟基-2-氟苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯(實例 176)取代 4-(2-酮基-1-(吡啶-3-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯，且在步驟 D 中，以 2-氟基-5-環丙基嘧啶(根據實例 159 步驟 A 中所述之程序製成)取代 2-氟基-5-丙基嘧啶，並以碳酸鉀取代碳酸鈉而製成，惟將反應物於 100°C 下攪拌 7 小時。使粗製固體藉急驟式層析純化(SiO₂，0 至 100% EtOAc 在 CH₂Cl₂ 中)。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.14 (s, 2H), 7.51-7.62 (m, 3H), 7.11 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.06 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H), 6.01 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.52-4.62 (m, 1H), 4.15-4.26 (m, 2H), 3.58-3.68 (m, 2H), 1.96-2.14 (m, 2H), 1.79-1.96 (m, 2H), 1.69-1.77 (m, 1H), 0.88-0.96 (m, 2H), 0.57-0.64 (m, 2H). MS (ESI) 432 (M+H).

實例 191

4-(2-酮基-1-(嘧啶-5-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧

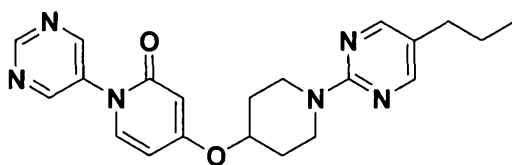
酸異丙酯之製備



實例 191 係根據實例 189 中所述之程序，在步驟 B 中，以 5-溴基嘓啶 (Aldrich) 取代 5-溴基 -2-(甲磺醯基) 吡啶而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 9.28 (寬廣 s., 1H), 8.91 (寬廣 s., 2H), 7.23 (d, J=7.53 Hz, 1H), 6.11 (dd, J=7.65, 2.64 Hz, 1H), 5.99 (d, J=2.76 Hz, 1H), 4.91-5.01 (m, 1H), 4.50-4.56 (m, 1H), 3.72-3.82 (m, 2H), 3.34-3.46 (m, 2H), 1.96-2.05 (m, 2H), 1.75-1.86 (m, 2H), 1.28 (d, J=6.27 Hz, 6H). MS (ESI) 359 (M+H).

實例 192

4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(嘓啶-5-基)吡啶-2(1H)-酮之製備

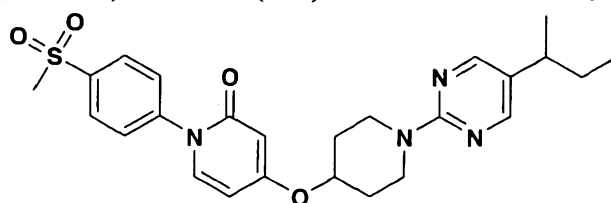


實例 192 係根據實例 187 中所述之程序，以 5-溴基嘓啶 (Aldrich) 取代 5-溴基 -2-(甲磺醯基) 吡啶而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 9.27 (寬廣 s., 1H), 8.91 (寬廣 s., 2H), 8.19 (s, 2H), 7.23 (d, J=7.78 Hz, 1H), 6.12 (dd, J=7.65, 2.64 Hz, 1H), 6.04 (d, J=2.76 Hz, 1H), 4.57-4.64 (m, 1H), 4.18-4.25 (m, 2H), 3.62-3.71 (m, 2H), 2.43 (t, J=7.53 Hz, 2H), 2.06-2.15 (m, 2H), 1.82-1.92 (m, 2H), 1.57-1.65 (m, 2H), 0.96 (t, J=7.28 Hz, 3H). MS (ESI) 393 (M+H).

實例 193

4-(1-(5-第二-丁基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯

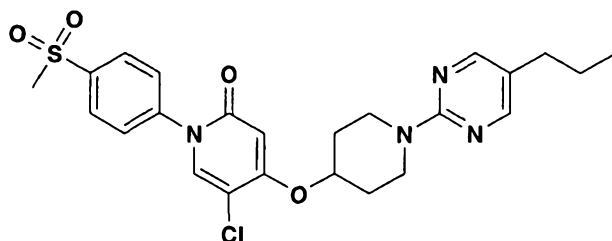
基)苯基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽之製備



於實例 57 (51 毫克, 0.101 毫莫耳) 與雙(三-第三-丁基磷)鉀 (4 毫克, 0.020 毫莫耳) 中, 在氮氣下添加 0.5 毫升 THF, 獲得淡黃褐色懸浮液。在室溫下添加 0.605 毫升溴化第二-丁基鋅 (II) (0.605 毫升, 0.303 毫莫耳, 0.5M, 在 THF 中), 並攪拌 19.5 小時, 此時, 以 2 毫升 EtOAc 使反應淬滅, 然後以各 1 毫升飽和 NH_4Cl 水溶液、 NaHCO_3 , 接著以 NaCl 洗滌。以 MgSO_4 脫水乾燥, 過濾, 然後濃縮成 43 毫克褐色固體。添加 ~1 毫升 90% MeOH/10% 水 / 0.1% TFA, 其並未使固體溶解。使此物質於 500 微米矽膠 TLC 板上純化, 以 5% MeOH/ CHCl_3 展開, 提供 28 毫克 (0.058 毫莫耳) 灰白色粉末。使此物質懸浮於 0.5 毫升 EtOH 中, 接著, 在其中添加 40 微升 6N HCl 水溶液 (0.240 毫莫耳, 4.1 當量), 造成完全溶解。於 2 分鐘內, 結晶開始形成。30 分鐘後, 過濾, 加上 2 x 0.3 毫升 EtOH 洗滌, 獲得實例 193 (18 毫克, 0.034 毫莫耳, 33%), 為淡黃褐色結晶。 $^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 1.04 (t, $J=7.25$ Hz, 3H) 1.43 (d, $J=7.03$ Hz, 3H) 1.67-1.87 (m, 2H) 2.15-2.36 (m, 4H) 2.77-2.89 (m, 1H) 3.28 (寬廣 s., 3H) 4.10-4.27 (m, 3H) 4.94 (寬廣 s., 1H) 6.19 (s, 1H) 6.28-6.39 (m, 1H) 7.45-7.54 (m, 3H) 7.47-7.53 (m, 2H) 7.77 (d, $J=8.35$ Hz, 2H) 8.23 (d, $J=8.35$ Hz, 2H) 8.57 (寬廣 s., 2H). MS (ESI) 483.1 (M+1).

實例 194

5-氯基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



步驟 A. 1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-醇之製備

將六氫吡啶-4-醇(12克, 119毫莫耳)、2-氯基-5-丙基嘧啶(20.44克, 131毫莫耳)及碳酸鉀(49.2克, 356毫莫耳)在DMF(100毫升)中之懸浮液於110°C下加熱12小時, 並冷卻至室溫。以EtOAc(250毫升)稀釋混合物, 且以H₂O洗滌(3x)。在以Na₂SO₄脫水乾燥後, 使有機層蒸發, 而得黃色油。使粗製油於急驟式層析上純化(SiO₂, 0至10% MeOH/CH₂Cl₂), 獲得黃色固體。MS (ESI) 222 (M+H).

步驟 B. 甲磺酸 1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯之製備

化合物係根據實例1中所述之程序, 在步驟C中, 以1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-醇取代4-羥基六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯而製成。MS (ESI) 300 (M+H).

步驟 C. 5-氯基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

將甲磺酸 1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯(800毫克, 2.67毫莫耳)、5-氯基-4-羥基吡啶-2(1H)-酮(389毫克, 2.67毫莫耳, AK Scientific)及碳酸鉍(2612毫克, 8.02毫莫耳)在DMF(20毫升)中之混合物於120°C下加熱6小時。使反應物冷卻至

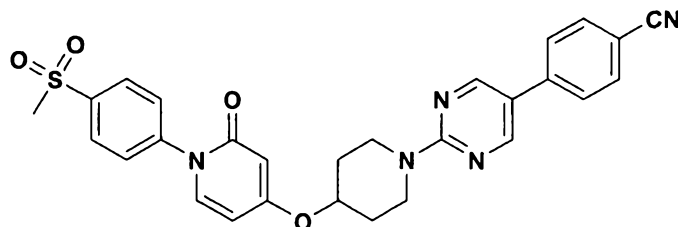
室溫，以 EtOAc (30 毫升) 稀釋，並以 H₂O 洗滌 (3x)。將有機層以 Na₂SO₄ 脫水乾燥，及在減壓下濃縮，而得黃色固體。使殘留物藉急驟式層析純化 (SiO₂，0-10% MeOH/CH₂Cl₂)，獲得所要之產物，為黃色固體。MS (ESI) 379 (M+H)。

步驟 4. 實例 194

實例 194 係根據實例 8 中所述之程序，以 5-氯基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮取代 4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯，且在步驟 C 中，以 1-溴基-4-(甲磺醯基)苯取代 4-溴基苯甲腈而製成，此外，使微波反應於 190°C 下進行 25 分鐘。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.43 (s, 2H), 8.12 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.55 (s, 1H), 6.64 (s, 1H), 4.89 (寬廣 s., 1H), 4.24-4.37 (m, 2H), 3.90-4.07 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.56 (t, J=7.70 Hz, 2H), 2.19 (寬廣 s., 4H), 1.57-1.75 (m, 2H), 0.84-1.10 (m, 3H)。MS (ESI) 503 (M+H)。

實例 195

4-(2-(4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-基)嘧啶-5-基)苯甲腈鹽酸鹽之製備

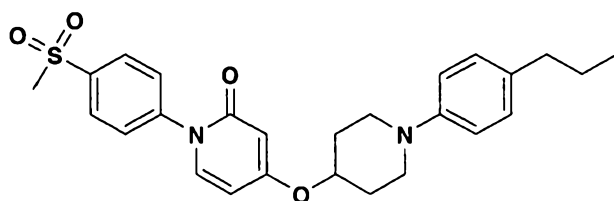


於 4-(1-(5-溴基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮 (51 毫克，0.101 毫莫耳) 與雙(三-第三-丁基磷)鈣 (4.08 毫克，0.020 毫莫耳) 在 0.5 毫升 THF 中之懸浮液內，在氮氣及室溫下，添加 0.605 毫升在 THF 中之 0.5M 溴化(4-

氰基苯基)鋅(II)(74.9毫克, 0.303毫莫耳)。25分鐘後, 以2毫升飽和NaHCO₃水溶液+ 4毫升EtOAc使反應淬滅, 然後移除EtOAc, 並以另外2毫升飽和NaHCO₃水溶液, 接著以2毫升鹽水洗滌。在此過程期間, 不良溶解性產物已沉澱析出, 且留在水相與有機相界面處之薄乳化液狀層中。在小心分離此液層時, 將其過濾, 並以EtOAc(毫升)洗滌固體, 產生17毫克淡黃色固體。使此物質懸浮於3毫升EtOH中, 在其中添加100微升6N HCl水溶液(0.6毫莫耳, 9.5當量), 且將混合物加熱至回流, 造成幾乎完成溶液, 然後, 使其冷卻至室溫。慢慢形成小結晶。過濾, 加上0.5毫升EtOH, 接著為2 x 0.5毫升己烷洗滌, 產生實例195(11毫克), 為鮮明黃色結晶。¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 1.54-1.76 (m, 2H) 2.07 (d, J=8.80 Hz, 2H) 3.35-3.55 (m, 5H) 3.62 (t, J=10.17 Hz, 2H) 4.31 (d, J=13.75 Hz, 2H) 4.82 (d, J=3.85 Hz, 1H) 6.08-6.15 (m, 2H) 7.66 (d, J=7.70 Hz, 1H) 7.70 (d, J=8.80 Hz, 2H) 7.83-7.96 (m, 4H) 8.04 (d, J=8.25 Hz, 2H) 8.84 (s, 2H). MS (ESI) 528.1 (M+1).

實例 196

1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(4-丙基苯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備

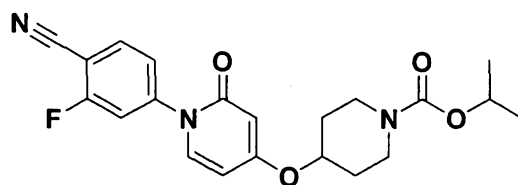


於1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽(50毫克, 0.130毫莫耳, 根據實例1中所述之程序

製成)、4-丙基苯基二羥基硼烷(42.6毫克, 0.260毫莫耳)及二乙醯氧基銅(35.4毫克, 0.195毫莫耳)在 CH_2Cl_2 (3毫升)中之混合物內, 添加吡啶(0.021毫升, 0.260毫莫耳)。在曝露至開放空氣5-10分鐘後, 將反應混合物加蓋, 並於室溫下與4Å分子篩一起攪拌48小時。將反應混合物以 CH_2Cl_2 稀釋, 並以飽和 NH_4Cl 水溶液洗滌(3x)。使有機層脫水乾燥(Na_2SO_4), 及在減壓下蒸發。使殘留物藉預備之HPLC純化(C_{18} 管柱; 20-90% MeOH在含有0.1%三氟醋酸之水中), 獲得實例196(6毫克, 9.90%), 為白色固體。 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.10 (d, $J=7.70$ Hz, 2H), 7.53-7.72 (m, 4H), 7.33 (d, $J=7.70$ Hz, 3H), 6.34-6.53 (m, 1H), 6.18-6.34 (m, 1H), 4.72-4.87 (m, 1H), 3.73 (d, $J=7.15$ Hz, 2H), 3.62 (寬廣 s., 2H), 3.11 (s, 3H), 2.84 (d, $J=4.40$ Hz, 2H), 2.63 (t, $J=7.42$ Hz, 2H), 2.38-2.53 (m, 2H), 1.55-1.73 (m, 2H), 0.95 (t, $J=7.15$ Hz, 3H). MS (ESI) 466 (M+H).

實例 197

4-(1-(4-氟基-3-氰基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備



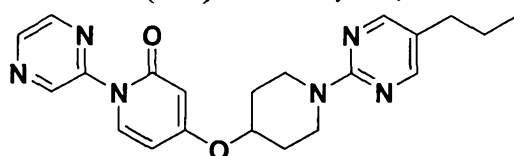
實例 197 係根據實例 189 中所述之程序, 在步驟 B 中, 以 4-溴基-2-氟基苯甲腈(Lancaster)取代 5-溴基-2-(甲磺醯基)吡啶而製成。 $^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ 7.76 (dd, $J=8.03, 7.03$ Hz, 1H), 7.32-7.43 (m, 2H), 7.22 (d, $J=7.78$ Hz, 1H), 6.07 (dd, $J=7.78, 2.51$ Hz, 1H),

5.96 (d, J=2.51 Hz, 1H), 4.91-5.00 (m, 1H), 4.48-4.55 (m, 1H), 3.72-3.82 (m, 2H), 3.36-3.44 (m, 2H), 1.96-2.05 (m, 2H), 1.75-1.85 (m, 2H), 1.28 (d, J=6.27 Hz, 6H). MS (ESI) 400 (M+H).

實例 198

4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(吡啶-2-基)吡啶

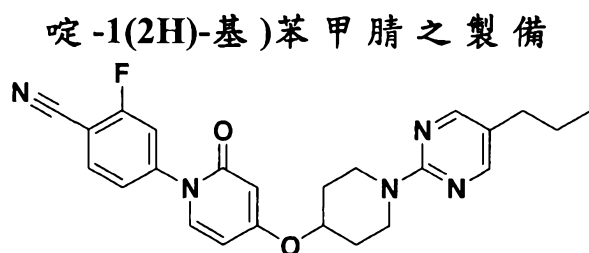
-2(1H)-酮之製備



實例 198 係根據實例 187 中所述之程序，以 2-碘基吡啶 (Aldrich) 取代 5-溴基-2-(甲磺醯基)吡啶而製成，惟將反應物於微波條件下在 140°C 下加熱 20 分鐘。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 9.40 (s, 1H), 8.58 (d, J=2.51 Hz, 1H), 8.50-8.55 (m, 1H), 8.19 (s, 2H), 7.85 (d, J=7.78 Hz, 1H), 6.12 (dd, J=7.91, 2.64 Hz, 1H), 6.02 (d, J=2.26 Hz, 1H), 4.58-4.65 (m, 1H), 4.17-4.25 (m, 2H), 3.63-3.71 (m, 2H), 2.40-2.46 (m, 2H), 2.07-2.14 (m, 2H), 1.82-1.92 (m, 2H), 1.55-1.64 (m, 2H), 0.96 (t, J=7.40 Hz, 3H). MS (ESI) 393 (M+H).

實例 199

2-氟基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲腈之製備



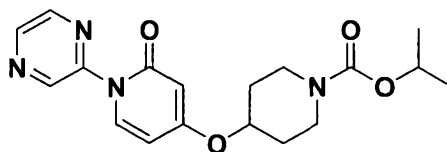
實例 199 係根據實例 187 中所述之程序，以 2-氟基-4-碘基苯甲腈 (Matrix Scientific) 取代 5-溴基-2-(甲磺醯基)吡啶而製成，惟

將反應物於微波條件下在 125°C 下加熱 1 小時。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.18 (s, 2H), 7.76 (dd, J=8.28, 7.03 Hz, 1H), 7.31-7.44 (m, 2H), 7.21 (d, J=7.78 Hz, 1H), 6.08 (dd, J=7.78, 2.51 Hz, 1H), 6.00 (d, J=2.51 Hz, 1H), 4.51-4.63 (m, 1H), 4.14-4.27 (m, 2H), 3.58-3.70 (m, 2H), 2.42 (t, J=7.53 Hz, 2H), 1.97-2.16 (m, 2H), 1.79-1.97 (m, 2H), 1.53-1.65 (m, 2H), 0.95 (t, J=7.40 Hz, 3H). MS (ESI) 434 (M+H).

實例 200

4-(2-酮基-1-(吡啶-2-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧

酸異丙酯之製備

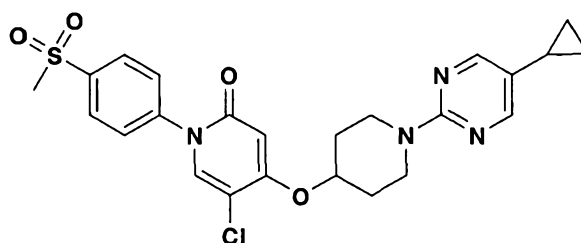


實例 200 係根據實例 189 中所述之程序，在步驟 B 中，以 2-碘基吡啶 (Aldrich) 取代 5-溴基-2-(甲磺醯基)吡啶而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 9.37 (d, J=1.51 Hz, 1H), 8.57 (d, J=2.51 Hz, 1H), 8.50-8.54 (m, 1H), 7.85 (d, J=8.03 Hz, 1H), 6.11 (dd, J=7.91, 2.64 Hz, 1H), 5.95 (d, J=2.51 Hz, 1H), 4.91-5.00 (m, 1H), 4.50-4.57 (m, 1H), 3.71-3.81 (m, 2H), 3.37-3.47 (m, 2H), 1.96-2.06 (m, 2H), 1.77-1.87 (m, 2H), 1.28 (d, J=6.27 Hz, 6H). MS (ESI) 359 (M+H).

實例 201

5-氯基-4-(1-(5-環丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺

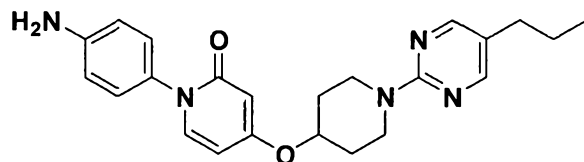
醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮，TFA 鹽之製備



實例 201 係根據實例 194 中所述之程序，在步驟 A 中，以 2-氯基-5-環丙基嘧啶取代 2-氯基-5-丙基嘧啶而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.37 (s, 2H), 8.11 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.62 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.53 (s, 1H), 6.55 (寬廣 s., 1H), 4.78-4.93 (m, 1H), 4.26 (寬廣 s., 2H), 3.96 (寬廣 s., 2H), 3.12 (s, 3H), 2.16 (寬廣 s., 4H), 1.83 (寬廣 s., 1H), 1.71-1.92 (m, 1H), 1.10 (d, J=8.25 Hz, 2H), 0.74 (d, J=5.50 Hz, 2H). MS (ESI) 501 (M+H).

實例 203

1-(4-胺基苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

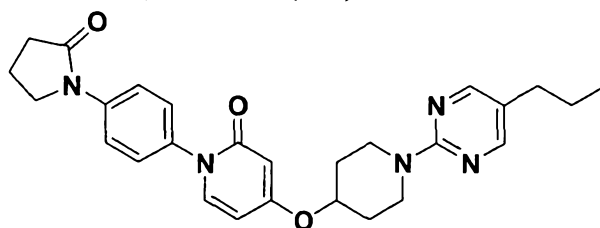


實例 203 係根據實例 173 中所述之程序，在步驟 E 中，以 4-碘苯基胺基甲酸第三-丁酯 (Oakwood) 取代 4-溴基-2-甲基-1-(甲磺醯基)苯而製成，惟將反應物於 100°C 下加熱過夜，然後在 140°C 下加熱 3 小時。使粗製固體藉急驟式層析純化 (SiO₂, 0 至 10% MeOH 在 CH₂Cl₂ 中)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.18 (s, 2H), 7.22 (d, J=7.53 Hz, 1H), 7.11-7.16 (m, 2H), 6.72-6.78 (m, 2H), 6.02 (d, J=2.76 Hz, 1H), 5.96 (dd, J=7.53, 2.76 Hz, 1H), 4.52-4.59 (m, 1H), 4.17-4.25 (m, 2H), 3.81 (s, 2H), 3.58-3.67 (m, 2H), 2.39-2.45 (m, 2H), 2.05-2.13 (m, 2H), 1.79-1.89 (m, 2H), 1.54-1.64 (m, 2H), 0.96 (t, J=7.40 Hz, 3H). MS (ESI) 406 (M+H).

實例 205

1-(4-(2-酮基四氫吡咯-1-基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡

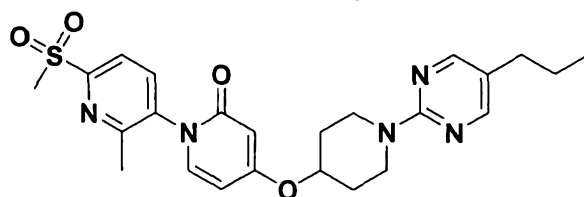
吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮鹽酸鹽之製備



實例 205 係根據實例 187 中所述之程序，以 1-(4-溴苯基)四氫吡咯-2-酮 (Oakwood) 取代 5-溴基-2-(甲磺醯基)吡啶而製成，惟使粗製固體藉急驟式層析純化 (SiO_2 ，0 至 100% EtOAc 在己烷中)，然後轉化成其鹽酸鹽，其方式是，將 1 當量之 HCl (在 Et_2O 中之 1N HCl) 添加至化合物中，在 CH_2Cl_2 中攪拌 5 分鐘，接著在真空中濃縮成所要之產物。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.43 (寬廣 s., 2H), 7.77 (d, $J=8.53$ Hz, 2H), 7.39 (d, $J=8.53$ Hz, 2H), 7.29-7.33 (m, 1H), 6.12 (寬廣 s., 1H), 6.06 (d, $J=7.53$ Hz, 1H), 4.68-4.77 (m, 1H), 4.27-4.38 (m, 2H), 4.07-4.19 (m, 2H), 3.92 (t, $J=7.03$ Hz, 2H), 2.66 (t, $J=8.16$ Hz, 2H), 2.55 (t, $J=7.53$ Hz, 2H), 2.16-2.26 (m, 2H), 2.10-2.16 (m, 4H), 1.61-1.71 (m, 2H), 1.00 (t, $J=7.28$ Hz, 3H). MS (ESI) 474 (M+H).

實例 206

1-(2-甲基-6-(甲磺醯基)吡啶-3-基)-4-(1-(5-丙基吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮，TFA 鹽之製備

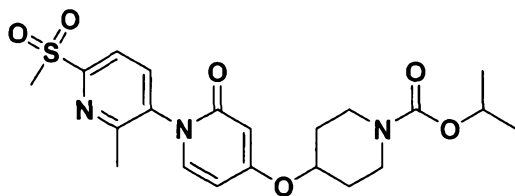


實例 206 係根據實例 173 中所述之程序，在步驟 D 中，以 3,6-二溴基-2-甲基吡啶 (Synchem) 取代 4-溴基-1-碘基-2-甲苯而製

成，並使最後產物藉預備之 HPLC 純化 (C_{18} 管柱，10-100% MeOH 在含有 0.1% 三氟醋酸之水中)。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.44 (s, 2H), 8.11 (d, $J=8.03$ Hz, 1H), 7.81 (d, $J=8.28$ Hz, 1H), 7.13 (d, $J=7.78$ Hz, 1H), 6.31 (d, $J=2.26$ Hz, 1H), 6.24 (dd, $J=7.65, 2.38$ Hz, 1H), 4.71-4.79 (m, 1H), 4.03-4.10 (m, 4H), 3.31 (s, 3H), 2.52-2.57 (m, 5H), 2.13-2.21 (m, 2H), 2.04-2.12 (m, 2H), 1.61-1.71 (m, 2H), 1.00 (t, $J=7.28$ Hz, 3H). MS (ESI) 484 (M+H).

實例 207

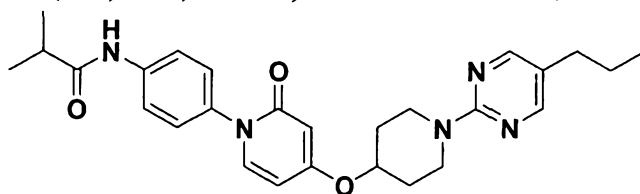
4-(1-(2-甲基-6-(甲磺醯基)吡啶-3-基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基
氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯，TFA 鹽之製備



實例 207 係根據實例 189 中所述之程序，在步驟 B 中，以 3-溴基-2-甲基-6-(甲磺醯基)吡啶(根據實例 173 步驟 D 中所述之程序，以 3,6-二溴基-2-甲基吡啶取代 4-溴基-1-碘基-2-甲苯製成)取代 5-溴基-2-(甲磺醯基)吡啶而製成，惟將反應物在 140 $^{\circ}\text{C}$ 下加熱過夜，並使粗產物藉預備之 HPLC 純化 (C_{18} 管柱，10-100% MeOH 在含有 0.1% 三氟醋酸之水中)。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.07 (d, $J=8.03$ Hz, 1H), 7.78 (d, $J=8.03$ Hz, 1H), 7.10 (d, $J=7.78$ Hz, 1H), 6.33 (d, $J=2.26$ Hz, 1H), 6.23 (dd, $J=7.65, 2.38$ Hz, 1H), 4.87-5.01 (m, 1H), 4.51-4.61 (m, 1H), 3.72-3.83 (m, 2H), 3.36-3.44 (m, 2H), 3.28 (s, 3H), 2.49 (s, 3H), 1.97-2.07 (m, 2H), 1.75-1.86 (m, 2H), 1.26 (d, $J=6.27$ Hz, 6H). MS (ESI) 450 (M+H).

實例 208

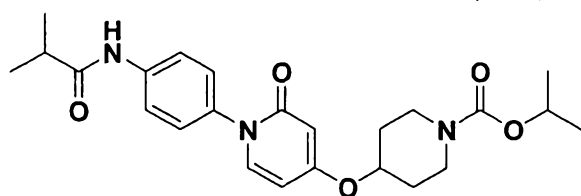
N-(4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)異丁醯胺之製備



於 1-(4-胺基苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮 (50 毫克, 0.12 毫莫耳) 與 Et_3N (0.052 毫升, 0.37 毫莫耳, Aldrich) 在 CH_2Cl_2 (1 毫升) 中之正在攪拌溶液內, 在室溫下添加氯化異丁烷 (0.014 毫升, 0.136 毫莫耳, Aldrich)。將反應混合物於室溫下攪拌 1 小時, 然後, 以 H_2O 使反應淬滅。蒸發溶劑, 並使粗製固體藉急驟式層析純化 (SiO_2 , 0 至 10% MeOH 在 CH_2Cl_2 中), 產生 34.2 毫克所要之產物, 為白色固體。 $^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.16 (s, 2H), 7.55-7.61 (m, 3H), 7.26-7.28 (m, 2H), 7.20 (d, $J=7.78$ Hz, 1H), 5.98-6.05 (m, 1H), 5.92-5.98 (m, 1H), 4.52-4.59 (m, 1H), 4.14-4.22 (m, 2H), 3.57-3.66 (m, 2H), 2.47-2.57 (m, 1H), 2.37-2.42 (m, 2H), 2.03-2.11 (m, 2H), 1.78-1.87 (m, 2H), 1.48-1.69 (m, 2H), 1.24 (d, $J=6.78$ Hz, 6H), 0.93 (t, $J=7.28$ Hz, 3H). MS (ESI) 476 (M+H).

實例 209

4-(1-(4-異丁醯胺基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備



步驟 A. 4-(1-(4-胺基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備

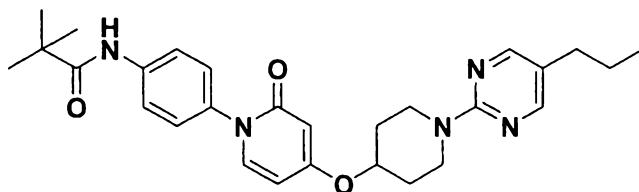
4-(1-(4-胺基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯係根據實例 189 中所述之程序，在步驟 B 中，以 4-碘苯基胺基甲酸第三-丁酯 (Oakwood) 取代 5-溴基-2-(甲磺醯基)吡啶而製成，惟將反應物於 100°C 下加熱過夜，然後在 140°C 下加熱 6 小時。使粗製固體藉急驟式層析純化 (SiO₂，0 至 10% MeOH 在 CH₂Cl₂ 中)。MS (ESI) 372 (M+H).

步驟 B. 實例 209

實例 209 係根據實例 208 中所述之程序，以 4-(1-(4-胺基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯取代 1-(4-胺基苯基)-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7.62 (寬廣 s., 1H), 7.59 (d, J=8.78 Hz, 2H), 7.25-7.30 (m, 2H), 7.22 (d, J=7.53 Hz, 1H), 6.00 (d, J=2.51 Hz, 1H), 5.93-5.99 (m, 1H), 4.87-5.00 (m, 1H), 4.44-4.56 (m, 1H), 3.70-3.82 (m, 2H), 3.33-3.43 (m, 2H), 2.45-2.61 (m, 1H), 1.94-2.07 (m, 2H), 1.72-1.87 (m, 2H), 1.22-1.29 (m, 12H). MS (ESI) 442 (M+H).

實例 210

N-(4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)三甲基乙醯胺鹽酸鹽之製備

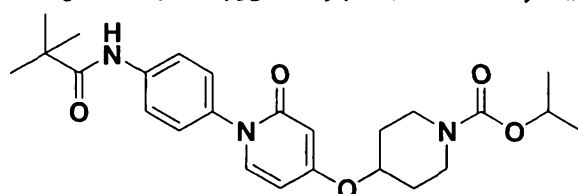


實例 210 係根據實例 208 中所述之程序，以氯化三甲基乙醯 (Aldrich) 取代異丁基氯而製成，然後轉化成其鹽酸鹽，其方式是，將 1 當量 HCl (在 Et₂O 中之 1N HCl) 添加至化合物中，於 CH₂Cl₂ 中攪拌 5 分鐘，接著在真空中濃縮成所要之產物。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.17 (s, 2H), 7.61-7.67 (m, 2H), 7.49 (s, 1H), 7.29-7.35 (m, 2H), 7.22 (d, J=7.53 Hz, 1H), 5.95-6.04 (m, 2H), 4.52-4.62 (m, 1H), 4.15-4.26 (m, 2H), 3.58-3.68 (m, 2H), 2.41 (t, J=7.53 Hz, 2H), 2.04-2.14 (m, 2H), 1.79-1.90 (m, 2H), 1.52-1.64 (m, 2H), 1.33 (s, 9H), 0.95 (t, J=7.28 Hz, 3H). MS (ESI) 490 (M+H).

實例 211

4-(2-酮基-1-(4-三甲基乙醯胺基苯基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)

六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備

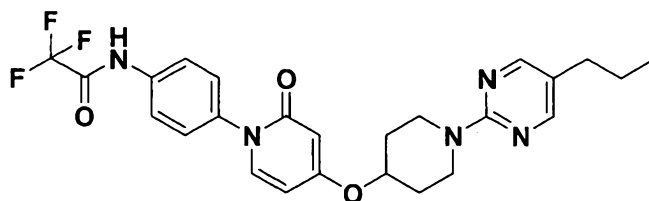


實例 211 係根據實例 208 中所述之程序，以 4-(1-(4-胺基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯 (根據實例 209 步驟 A 中所述之程序製成) 取代 1-(4-胺基苯基)-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮，且以氯化三甲基乙醯 (Aldrich) 取代異丁基氯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7.61-7.67 (m, 2H), 7.51 (s, 1H), 7.28-7.34 (m, 2H), 7.22 (d, J=7.53 Hz, 1H), 5.97-6.02 (m, 1H), 5.92-5.97 (m, 1H), 4.87-4.99 (m, 1H), 4.45-4.53 (m, 1H), 3.71-3.81 (m, 2H), 3.33-3.43 (m, 2H), 1.89-2.04 (m, 2H), 1.73-1.89 (m, 2H), 1.33 (s, 9H), 1.26 (d, J=6.27 Hz,

6H). MS (ESI) 456 (M+H).

實例 212

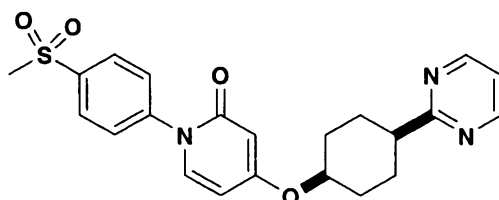
2,2,2-三氟-N-(4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)乙醯胺, TFA 鹽之製備



實例 212 係根據實例 208 中所述之程序，以 2,2,2-三氟醋酸酐 (Aldrich) 取代異丁基氯而製成，惟使粗產物藉預備之 HPLC 純化 (C₁₈ 管柱，10-100% MeOH 在含有 0.1% 三氟醋酸之水中)。
¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 11.43 (寬廣 s., 1H), 8.24 (s, 2H), 7.76 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.56 (d, J=7.70 Hz, 1H), 7.42 (d, J=8.80 Hz, 2H), 5.98-6.10 (m, 2H), 4.69-4.83 (m, 1H), 4.16-4.28 (m, 2H), 3.41-3.56 (m, 2H), 2.32-2.41 (m, 2H), 1.95-2.10 (m, 2H), 1.43-1.66 (m, 4H), 0.88 (t, J=7.15 Hz, 3H). MS (ESI) 502 (M+H).

實例 214

順式-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-((1r,4r)-4-(嘓啶-2-基)環己基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



步驟 A. 4-(苄氧基)環己烷甲腈之製備

於 4-(苄氧基)環己酮 (2.94 克，14.39 毫莫耳，根據 Goodman 等人，US2006/0292073 A1 中所述之程序製成) 在 1,2-二甲氧基乙烷 (14.39 毫升，Aldrich) 中之溶液內，以一份添加異氰化甲

苯磺醯甲烷(5.62克，28.8毫莫耳，Aldrich)。使所形成之混合物冷卻至0°C，並逐滴添加第三-丁醇鉀溶液(3.82毫升，3.82毫莫耳，1.0M，在2-甲基-2-丙醇中，Aldrich)。將反應混合物於0°C下攪拌10分鐘，且在室溫下5小時，然後，以1N HCl(45毫升)使反應淬滅。以EtOAc進一步萃取(3x)水層。將合併之有機萃液以鹽水洗滌，脫水乾燥(MgSO₄)，及在減壓下蒸發。使殘留物於矽膠上藉急驟式層析純化(0-40% EtOAc/己烷)，獲得4-(苄氧基)環己烷甲腈之順式與反式混合物(2.14克，69%)，為淡橘色油。MS (ESI) 216 (M+H)。

步驟B. 4-(苄氧基)環己烷羧醯亞胺醯胺之製備

於4-(苄氧基)環己烷甲腈(1.12克，5.20毫莫耳)在EtOH(8.0毫升)中之溶液內，在0°C下，使HCl氣體(Aldrich)起泡35分鐘，並將所形成之混合物於0°C下連續攪拌1小時，然後在減壓下蒸發。使殘留物溶於EtOH(6.0毫升)中，接著在0°C下添加NH₃/MeOH(7.0M，Aldrich)。於室溫下攪拌30分鐘後，蒸發混合物，且使殘留物在4N NaOH與氯仿之間作分液處理。以氯仿進一步萃取(3x)水層。將合併之有機層以水/鹽水(1:1)洗滌，脫水乾燥(MgSO₄)，及在減壓下蒸發，產生4-(苄氧基)環己烷羧醯亞胺醯胺之順式與反式混合物(1.193克，99%)，為淡黃色膠質。將此粗產物使用於下一步驟中，無需進一步純化。MS (ESI) 233 (M+H)。

步驟C. 2-(4-(苄氧基)環己基)嘧啶之製備

將4-(苄氧基)環己烷羧醯亞胺醯胺(330毫克，1.420毫莫耳)與(E)-3-(二甲胺基)丙烯醛(0.568毫升，5.68毫莫耳，Aldrich)在

吡啶(6.0 毫升)中之混合物於 100°C 下加熱 3 小時，及在減壓下蒸發。然後，使殘留物於醚與水之間作分液處理。以醚進一步萃取(3x)水層，並將合併之萃液以水與鹽水洗滌，脫水乾燥(Na_2SO_4)，及在真空中濃縮。使粗產物於矽膠上藉急驟式層析純化(0-100% EtOAc/己烷)，獲得 2-(4-(苄氧基)環己基)嘧啶之順式與反式混合物(239.3 毫克，62.8%)，為無色油。MS (ESI) 269 (M+H).

步驟 D. 4-(嘧啶-2-基)環己醇之製備

於 2-(4-(苄氧基)環己基)嘧啶(289.9 毫克，1.080 毫莫耳)在 CH_2Cl_2 (25 毫升)與水(1.0 毫升)中之溶液內，在室溫下，添加 2,3-二氯-5,6-二氰基-1,4-苯醌(392 毫克，1.728 毫莫耳，Aldrich)。將反應混合物於 40°C 下加熱 10 小時，冷卻至室溫，並以 CH_2Cl_2 與 NaHCO_3 水溶液稀釋。以 CH_2Cl_2 進一步萃取(3x)水層，且將合併之萃液以鹽水洗滌，脫水乾燥(Na_2SO_4)，及在減壓下蒸發。使殘留物於矽膠上藉急驟式層析純化(0-15% MeOH/ CH_2Cl_2)，獲得 4-(嘧啶-2-基)環己醇之順式與反式混合物(157.5 毫克，82%)，為橘色油。MS (ESI) 179 (M+H).

步驟 E. 實例 214

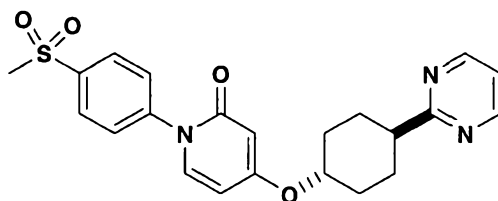
將 4-羥基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮(53.1 毫克，0.200 毫莫耳，實例 1)、甲烷磺酸 4-(嘧啶-2-基)環己酯(51.3 毫克，0.2 毫莫耳，根據實例 1 步驟 C 中所述之程序，以 4-(嘧啶-2-基)環己醇取代 4-羥基-1-六氫吡啶羧酸第三-丁酯而製成)與碳酸鉀(55.3 毫克，0.400 毫莫耳)在 DMF(1.0 毫升)中之混合物於 140°C 下加熱 3 小時，並在 100°C 下過夜，及冷卻至室溫。

將混合物以 EtOAc 與水稀釋，且以 EtOAc 進一步萃取 (4x) 水層。將合併之有機層以鹽水/水 (1:1, 2x) 洗滌，脫水乾燥 (Na_2SO_4)，及在減壓下蒸發。使殘留物首先藉預備之 HPLC 純化 (C_{18} 管柱；0-90% 甲醇在含有 0.05% 三氟醋酸之水中)，接著藉預備之 HPLC 進一步純化 (C_{18} 管柱；0-90% 乙腈在含有 0.05% 三氟醋酸之水中)，於凍乾時，提供實例 214 之順式異構物 (16.1 毫克，黃色固體，18%)。 ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 8.91 (d, $J=5.50$ Hz, 2H), 8.09 (d, $J=8.25$ Hz, 2H), 7.62 (d, $J=8.25$ Hz, 2H), 7.32 (d, $J=7.70$ Hz, 1H), 6.31-6.36 (m, 2H), 4.74 (表觀寬廣 s, 1H), 3.13-3.22 (m, 1H), 3.11 (s, 3H), 2.23-2.30 (m, 2H), 2.08-2.22 (m, 2H), 1.90-1.98 (m, 2H), 1.81-1.90 (m, 2H). MS (ESI) 426 (M+H).

實例 215

反式-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-((1r,4r)-4-(吡啶-2-基)環己基氧基)

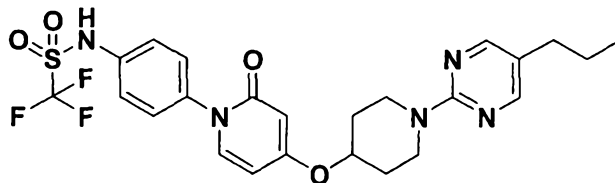
吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



實例 215 係按上文實例 214 中所述製成，並在步驟 E，藉預備之 HPLC 自順式異構物分離，產生標題化合物。 ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 8.79 (d, $J=4.95$ Hz, 2H), 8.08 (d, $J=8.80$ Hz, 2H), 7.62 (d, $J=8.25$ Hz, 2H), 7.23-7.31 (m, 2H), 6.19 (d, $J=2.75$ Hz, 1H), 6.15 (dd, $J=7.70, 2.20$ Hz, 1H), 4.32-4.44 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.99-3.09 (m, 1H), 2.31-2.40 (m, 2H), 2.16-2.23 (m, 2H), 1.80-1.93 (m, 2H), 1.62-1.75 (m, 2H). MS (ESI) 426 (M+H).

實例 217

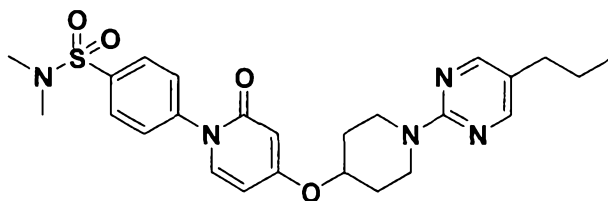
1,1,1-三氟-N-(4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)甲烷磺醯胺, TFA 鹽之製備



實例 217 係根據實例 212 中所述之程序，以三氟甲烷磺酸酐 (Aldrich) 取代 2,2,2-三氟醋酸酐而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.42 (s, 2H), 7.30 (d, J=7.53 Hz, 1H), 7.16-7.27 (m, 4H), 6.28 (d, J=2.26 Hz, 1H), 6.19 (dd, J=7.78, 2.51 Hz, 1H), 4.71-4.79 (m, 1H), 4.03-4.14 (m, 2H), 3.92-4.03 (m, 2H), 2.54 (t, J=7.53 Hz, 2H), 2.09-2.21 (m, 2H), 1.97-2.09 (m, 2H), 1.60-1.71 (m, 2H), 1.00 (t, J=7.28 Hz, 3H). MS (ESI) 538 (M+H).

實例 218

N,N-二甲基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯磺醯胺鹽酸鹽之製備

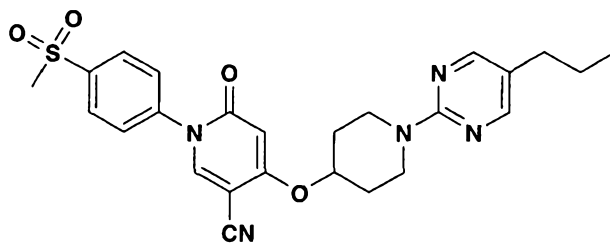


實例 218 係根據實例 187 中所述之程序，以 4-溴-N,N-二甲苯磺醯胺 (Alfa-Aesar) 取代 5-溴基-2-(甲磺醯基)吡啶而製成，然後轉化成其鹽酸鹽，其方式是，將 1 當量 HCl (在 Et₂O 中之 1N HCl) 添加至化合物中，於 CH₂Cl₂ 中攪拌 5 分鐘，接著在真空中濃縮成所要之產物。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.39 (寬廣 s., 2H), 7.92 (d, J=8.53 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.53 Hz, 2H), 7.29-7.33

(m, 1H), 6.09 (d, J=8.78 Hz, 1H), 5.96-6.05 (m, 1H), 4.65-4.79 (m, 1H), 4.07-4.31 (m, 4H), 2.80 (s, 6H), 2.54 (t, J=7.53 Hz, 2H), 2.06-2.22 (m, 4H), 1.60-1.70 (m, 2H), 0.99 (t, J=7.28 Hz, 3H). MS (ESI) 498 (M+H).

實例 221

1-(4-(甲磺醯基)苯基)-6-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1,6-二氫吡啶-3-甲腈, TFA 鹽之製備



步驟 A. 4-羥基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-6-酮基-1,6-二氫吡啶-3-甲腈之製備

將 4-羥基-6-酮基-1,6-二氫吡啶-3-甲腈 (200 毫克, 1.469 毫莫耳, Medinoah)、1-溴基-4-(甲磺醯基)苯 (345 毫克, 1.469 毫莫耳)、4,7-二甲氧基-1,10-二氮菲 (70.6 毫克, 0.294 毫莫耳)、碘化銅 (I) (56.0 毫克, 0.294 毫莫耳) 及碳酸鉀 (609 毫克, 4.41 毫莫耳) 在 DMSO (3 毫升) 中之混合物於 190°C 下加熱。於反應混合物中, 添加 H₂O (10 毫升), 並使用 1N HCl 將 pH 調整至 ~2。將所形成之含水混合物以 EtOAc (40 毫升, 2x) 萃取。使合併之萃液以 Na₂SO₄ 脫水乾燥, 及濃縮, 而得褐色油。使粗製油藉急驟式層析純化 (SiO₂, 0-5% MeOH/CH₂Cl₂), 獲得黃色固體 (35 毫克, 0.084 毫莫耳, 5.74%)。MS (ESI) 291 (M+H).

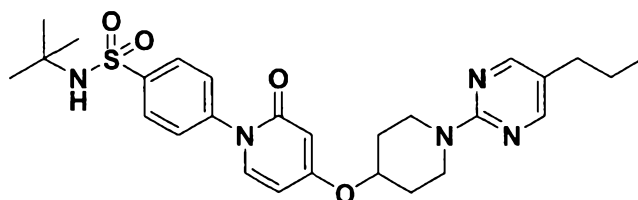
步驟 B. 實例 221

將甲磺酸 1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯 (46.4 毫克, 0.155 毫莫耳)、4-羥基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-6-酮基-1,6-

二氫吡啶-3-甲腈(30毫克, 0.103毫莫耳)及碳酸鈉(67.3毫克, 0.207毫莫耳)在DMF (1.5毫升)中之經攪拌混合物於120°C下加熱16小時, 然後冷卻至室溫。將所形成之混合物以EtOAc與H₂O稀釋, 並以EtOAc萃取(3x)水層。將合併之萃液以H₂O洗滌, 脫水乾燥(Na₂SO₄), 及蒸發。使殘留物藉預備之HPLC純化(C₁₈管柱; 20-90% MeOH在含有0.1%三氟醋酸之水中), 獲得實例221(5毫克, 10.13%), 為灰白色固體。¹H NMR(二氯甲烷) δ ppm 8.29-8.37(m, 2H), 8.09(d, J=8.80 Hz, 2H), 7.85(s, 1H), 7.59(d, J=8.80 Hz, 2H), 6.01(s, 1H), 4.76(d, J=3.30 Hz, 1H), 4.03-4.14(m, 2H), 3.88-4.03(m, 2H), 3.09(s, 3H), 2.48(t, J=7.42 Hz, 2H), 1.94-2.19(m, 4H), 1.52-1.69(m, 2H), 0.95(t, J=7.42 Hz, 3H). MS (ESI) 494 (M+H).

實例 223

N-第三-丁基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯磺醯胺之製備

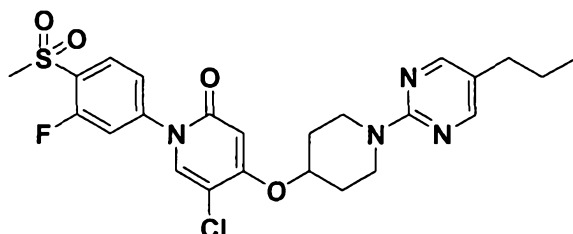


實例223係根據實例187中所述之程序, 以4-溴-N-第三-丁基苯磺醯胺(Combi-Blocks)取代5-溴基-2-(甲磺醯基)吡啶而製成。¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.18(s, 2H), 8.00(d, J=8.53 Hz, 2H), 7.53(d, J=8.53 Hz, 2H), 7.23(d, J=7.53 Hz, 1H), 6.05(dd, J=7.65, 2.38 Hz, 1H), 6.01(d, J=2.26 Hz, 1H), 4.54-4.63(m, 1H), 4.50(s, 1H), 4.15-4.25(m, 2H), 3.59-3.69(m, 2H), 2.42(t, J=7.53 Hz, 2H), 2.03-2.15(m, 2H), 1.79-1.91(m, 2H), 1.53-1.66(m, 2H), 1.30(s, 9H), 0.95(t, J=7.28

Hz, 3H). MS (ESI) 526 (M+H).

實例 224

5-氯基-1-(3-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六
 氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



步驟 A. 5-氯基-1-(3-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-羥基吡啶
 -2(1H)-酮之製備

5-氯基-1-(3-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-羥基吡啶-2(1H)-酮係
 根據實例 263 步驟 B 中所述之程序，以 4-溴基-2-氯基-1-(甲磺
 醯基)苯(根據實例 173 步驟 D 中所述之程序，以 4-溴基-2-氯基
 -1-碘苯取代 4-溴基-1-碘基-2-甲苯製成)取代 2-氯基-4-碘基苯
 甲腈而製成，惟將反應物於 190°C 下加熱 1 小時。MS (ESI) 318
 (M+H).

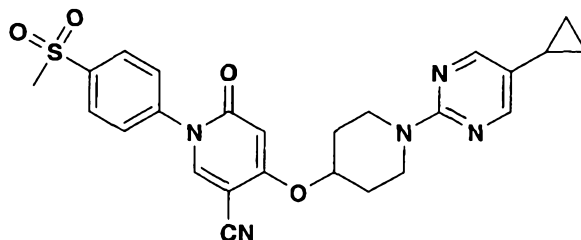
步驟 B. 實例 224

實例 224 係根據實例 173 步驟 C 中所述之程序，以 5-氯基
 -1-(3-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-羥基吡啶-2(1H)-酮取代 4-羥基
 吡啶-2(1H)-酮而製成，惟將反應物於 140°C 下加熱 6 小時。使
 粗產物藉預備之 HPLC 純化 (C₁₈ 管柱，10-100% MeOH 在含有
 0.1% 三氟醋酸之水中)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.45 (s,
 2H), 8.14 (t, J=7.91 Hz, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.35-7.47 (m, 2H), 6.27 (s, 1H),
 4.78-4.87 (m, 1H), 4.20-4.29 (m, 2H), 3.90-4.02 (m, 2H), 3.28 (s, 3H), 2.55
 (t, J=7.53 Hz, 2H), 2.08-2.22 (m, 4H), 1.60-1.72 (m, 2H), 1.00 (t, J=7.28

Hz, 3H). MS (ESI) 521 (M+H).

實例 225

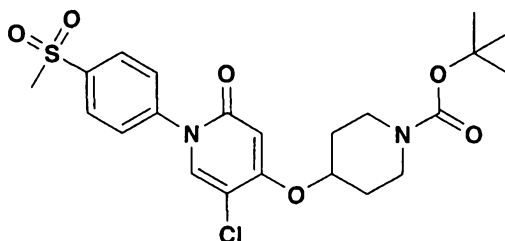
4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-6-酮基-1,6-二氫吡啶-3-甲腈, TFA 鹽之製備



實例 225 係根據實例 221 中所述之程序，在步驟 B 中，以甲烷磺酸 1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯取代甲烷磺酸 1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.37 (s, 2H), 8.13 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.86 (s, 1H), 7.60 (d, J=8.80 Hz, 2H), 6.17 (s, 1H), 4.84 (寬廣 s., 1H), 4.35 (d, J=14.85 Hz, 2H), 3.93-4.01 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.08-2.23 (m, 4H), 1.83-1.85 (m, 1H), 1.10-1.25 (m, 2H), 0.74 (m, 2H). MS (ESI) 491 (M+H).

實例 226

4-(5-氯基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備

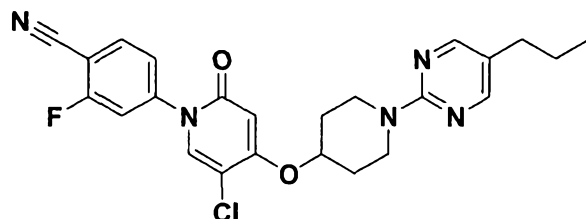


實例 226 係根據實例 221 中所述之程序，在步驟 B 中，以 4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯取代甲烷磺酸 1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯，以 2-(5-氯基-4-羥基-2-

酮基吡啶-1(2H)-基)-5-(甲磺醯基)苯-1-基氮鹽取代4-羥基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-6-酮基-1,6-二氫吡啶-3-甲腈而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.07 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.42 (s, 1H), 6.03 (s, 1H), 4.52-4.68 (m, 1H), 3.57-3.73 (m, 2H), 3.40-3.56 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 1.76-2.02 (m, 4H), 1.46 (s, 9H). MS (ESI) 482 (M+H).

實例 227

4-(5-氯基-2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈之製備

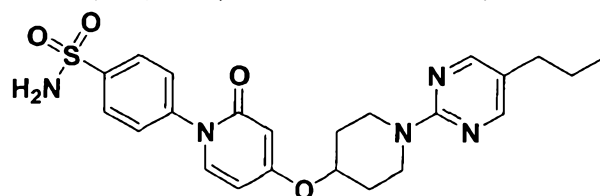


實例 227 係根據實例 173 步驟 C 中所述之程序，以 4-(5-氯基-4-羥基-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈(根據實例 263 步驟 B 中所述之程序製成)取代 4-羥基吡啶-2(1H)-酮而製成，惟將反應物在 140°C 下加熱 5 小時，並使粗製固體藉急驟式層析純化(SiO₂，0 至 100% EtOAc 在 CH₂Cl₂ 中)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.18 (s, 2H), 7.77 (dd, J=8.28, 6.78 Hz, 1H), 7.37-7.43 (m, 2H), 7.34 (dd, J=8.41, 1.63 Hz, 1H), 6.05 (s, 1H), 4.63-4.71 (m, 1H), 3.96-4.14 (m, 2H), 3.77-3.96 (m, 2H), 2.42 (t, J=7.53 Hz, 2H), 2.01-2.14 (m, 2H), 1.88-2.01 (m, 2H), 1.53-1.62 (m, 2H), 0.95 (t, J=7.28 Hz, 3H). MS (ESI) 468 (M+H).

實例 228

4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶

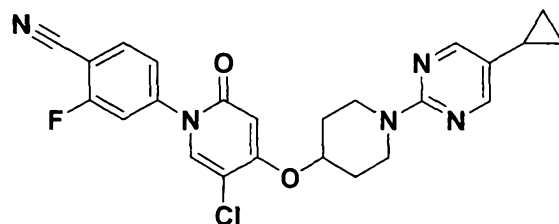
-1(2H)-基)苯磺醯胺之製備



於N-第三-丁基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯磺醯胺(23毫克, 0.044毫莫耳)在 CH_2Cl_2 (1毫升)中之正在攪拌溶液內, 添加三氟醋酸(0.4毫升, 5毫莫耳, Aldrich)。將反應物於室溫下攪拌2天, 然後在真空中濃縮成黃色油。使此油藉急驟式層析純化(SiO_2 , 0至5% MeOH在 CH_2Cl_2 中), 產生11毫克所要之產物, 為灰白色固體。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.18 (s, 2H), 8.03 (d, $J=8.53$ Hz, 2H), 7.54 (d, $J=8.28$ Hz, 2H), 7.23 (d, $J=7.78$ Hz, 1H), 6.07 (dd, $J=7.65, 2.63$ Hz, 1H), 6.03 (d, $J=2.51$ Hz, 1H), 4.56-4.65 (m, 1H), 4.16-4.25 (m, 2H), 3.60-3.71 (m, 2H), 2.42 (t, $J=7.53$ Hz, 2H), 2.04-2.14 (m, 2H), 1.80-1.90 (m, 2H), 1.53-1.64 (m, 2H), 0.95 (t, $J=7.28$ Hz, 3H). MS (ESI) 470 (M+H).

實例 229

4-(5-氟基-4-(1-(5-環丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈之製備



步驟 A. 甲烷磺酸1-(5-環丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯之製備

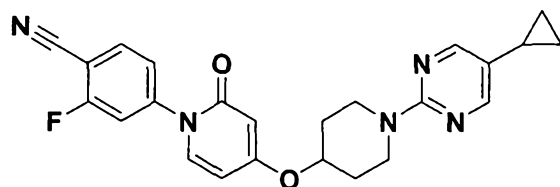
甲烷磺酸 1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯係根據實例 173 步驟 A 與 B 中所述之程序，在步驟 A 中，以 2-氯基-5-環丙基嘧啶取代 2-氯基-5-丙基嘧啶而製成。

步驟 B. 實例 229

實例 229 係根據實例 173 步驟 C 中所述之程序，以 4-(5-氯基-4-羥基-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈(根據實例 263 步驟 B 中所述之程序製成)取代 4-羥基吡啶-2(1H)-酮而製成，惟將反應物於 140°C 下加熱 2 小時，並在 100°C 下過夜。使粗製固體藉急驟式層析純化(SiO₂，0 至 100% EtOAc 在 CH₂Cl₂ 中)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.15 (s, 2H), 7.77 (dd, J=8.28, 6.78 Hz, 1H), 7.38-7.43 (m, 2H), 7.34 (dd, J=8.41, 1.88 Hz, 1H), 6.05 (s, 1H), 4.63-4.71 (m, 1H), 4.01-4.11 (m, 2H), 3.79-3.88 (m, 2H), 2.00-2.11 (m, 2H), 1.88-2.00 (m, 2H), 1.69-1.79 (m, 1H), 0.89-0.96 (m, 2H), 0.56-0.66 (m, 2H). MS (ESI) 466 (M+H).

實例 230

4-(4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈之製備



步驟 A. 4-(2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備

4-(2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯係根據實例 8 步驟 B 中所述之程序，以 4-(甲磺醯基氧基)

六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯(根據實例1步驟C中所述之程序製成)取代4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯而製成。MS (ESI) 295 (M+H).

步驟 B. 4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮係根據實例106步驟A中所述之程序，以4-(2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯取代4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯而製成。MS (ESI) 195 (M+H).

步驟 C. 4-(1-(5-環丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

4-(1-(5-環丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮係根據實例106步驟B中所述之程序，以2-氯基-5-環丙基嘓啶取代2-氯基-5-丙基嘓啶而製成，惟使粗製固體藉急驟式層析純化(SiO₂，100% EtOAc在CH₂Cl₂中，然後為0至10% MeOH在CH₂Cl₂中)。MS (ESI) 313 (M+H).

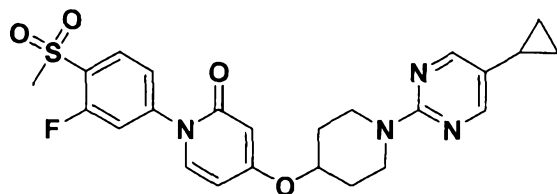
步驟 D. 實例 230

實例230係根據實例173步驟E中所述之程序，以2-氯基-4-碘基苯甲腈(Matrix Scientific)取代4-溴基-2-甲基-1-(甲磺醯基)苯而製成，惟將反應物於微波條件下在125°C下加熱30分鐘。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.14 (s, 2H), 7.75 (dd, J=8.28, 7.03 Hz, 1H), 7.31-7.43 (m, 2H), 7.21 (d, J=7.78 Hz, 1H), 6.07 (dd, J=7.65, 2.64 Hz, 1H), 5.99 (d, J=2.51 Hz, 1H), 4.52-4.62 (m, 1H), 4.13-4.25 (m, 2H), 3.56-3.71 (m, 2H), 1.96-2.12 (m, 2H), 1.78-1.91 (m, 2H), 1.65-1.78

(m, 1H), 0.76-0.96 (m, 2H), 0.57-0.76 (m, 2H). MS (ESI) 432 (M+H).

實例 231

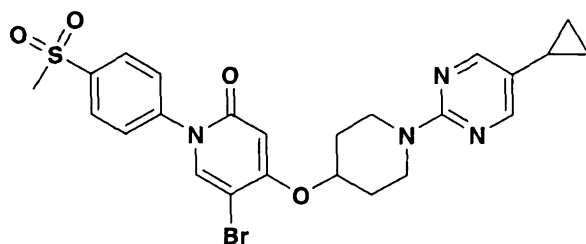
4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(3-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 231 係根據實例 230 中所述之程序，在步驟 D 中，以 4-溴基-2-氟基-1-(甲磺醯基)苯 (根據實例 173 步驟 D 中所述之程序，以 4-溴基-2-氟基-1-碘苯取代 4-溴基-1-碘基-2-甲苯製成) 取代 2-氟基-4-碘基苯甲腈而製成，惟將反應物於微波條件下在 160°C 下加熱 30 分鐘。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.07 (s, 2H), 8.02 (t, J=7.91 Hz, 1H), 7.37 (dd, J=10.29, 1.76 Hz, 1H), 7.30 (dd, J=8.41, 1.88 Hz, 1H), 7.15 (d, J=7.78 Hz, 1H), 6.01 (dd, J=7.65, 2.64 Hz, 1H), 5.93 (d, J=2.51 Hz, 1H), 4.43-4.56 (m, 1H), 4.05-4.17 (m, 2H), 3.50-3.62 (m, 2H), 3.19 (s, 3H), 1.89-2.07 (m, 2H), 1.70-1.89 (m, 2H), 1.60-1.70 (m, 1H), 0.68-0.92 (m, 2H), 0.46-0.68 (m, 2H). MS (ESI) 485 (M+H).

實例 233

5-溴基-4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮，TFA 鹽之製備



步驟 A. 3,5-二溴基-4-羥基吡啶-2(1H)-酮之製備

於4-羥基吡啶-2(1H)-酮(5.55克，50毫莫耳)中，添加48%氫溴酸水溶液(50毫升，921毫莫耳)，以產生淡黃褐色溶液。添加溴(5.67毫升，110毫莫耳)，以產生琥珀色溶液。3天後，黃色沉澱物已形成。於反應物中，添加300毫升水，造成濃稠白色漿液形成，將其攪拌1小時。過濾反應物，並以4 x 50毫升水洗滌，產生產物(13.506克，1.81毫莫耳，定量產率)，為白色粉末。MS (ESI) 190 (M+1).

步驟 B. 5-溴基-4-羥基吡啶-2(1H)-酮之製備

於200毫升回收燒瓶中之3,5-二溴基-4-羥基吡啶-2(1H)-酮(5.4克，20.08毫莫耳)內，添加溴化氫(50毫升，442毫莫耳，48%水溶液)，以產生灰白色懸浮液。於反應物中，添加苯胺(1.830毫升，20.08毫莫耳)，以產生淡黃褐色懸浮液，並將混合物在60°C下攪拌4小時。白色沉澱物形成。於冷卻至室溫後，將固體過濾，且以25毫升水洗滌，產生純產物(2.071克，10.9毫莫耳，54%)，為黃褐色粉末。使用21毫升50% NaOH水溶液，將含水混合物調整至pH~12 (pH紙)，造成更多灰白色膠狀沉澱物形成。收集沉澱物，並以水洗滌，產生另外之純產物(1.1克，29%)。MS (ESI) 190 (M+H).

步驟 C. 5-溴基-4-羥基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備

中間物係根據實例221中所述之程序，在步驟A中，以5-溴基-4-羥基吡啶-2(1H)-酮取代4-羥基-6-酮基-1,6-二氫吡啶-3-甲腈而製成。MS (ESI) 345 (M+H).

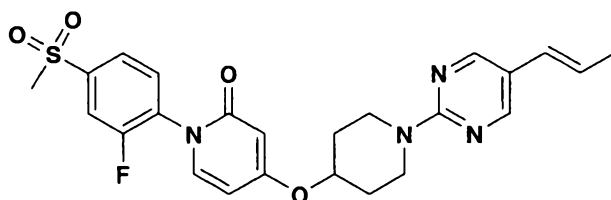
步驟 D. 實例 233

實例 233 係根據實例 221 中所述之程序，在步驟 B 中，以 5-溴基-4-羥基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮取代 4-羥基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-6-酮基-1,6-二氫吡啶-3-甲腈而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.36 (s, 2H), 8.11 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.48-7.70 (m, 3H), 6.55 (s, 1H), 4.88 (s, 1H), 4.28 (d, J=13.75 Hz, 2H), 3.92 (t, J=10.17 Hz, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.06-2.25 (m, 4H), 1.77-1.92 (m, 1H), 1.02-1.15 (m, 2H), 0.66-0.78 (m, 2H). MS (ESI) 494 (M+H).

實例 235

(E)-1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(丙-1-烯基)嘓啶-2-基)

六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



步驟 A. (E)-2-氟基-5-(丙-1-烯基)嘓啶之製備

於甲苯 (20 毫升) 與水 (0.5 毫升) 中之 5-溴基-2-氟基嘓啶 (2.027 克, 10.48 毫莫耳)、(E)-丙-1-烯基二羥基硼烷 (1.350 克, 15.72 毫莫耳)、PdCl₂(dppf)-CH₂Cl₂ (0.428 克, 0.524 毫莫耳) 及碳酸鉀 (4.35 克, 31.4 毫莫耳) 內，使氮於液面下起泡 1 分鐘，然後在 90°C 油浴中放置 5 小時。添加 200 毫升 EtOAc，接著，將反應物以 3 x 200 毫升水洗滌，以 MgSO₄ 脫水乾燥，過濾，及濃縮成 1.53 克褐色固體。使其藉急驟式層析純化 (5% EtOAc 在己烷中)，產生產物 (681 毫克)，為灰白色固體。MS (ESI) 155.7 (M+1).

步驟 B. (E)-1-(5-(丙-1-烯基)嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-醇之製備

使用 (E)-2-氟基-5-(丙-1-烯基)嘧啶 (實例 235 步驟 A)，(E)-1-(5-(丙-1-烯基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-醇係按實例 142 步驟 A 中所述製成。MS (ESI) 220.2 (M+1).

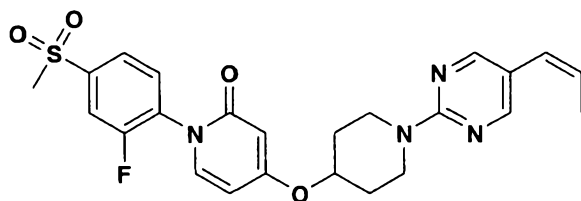
步驟 C. 實例 235 之製備

於得自實例 142 步驟 D 之 1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-羥基吡啶-2(1H)-酮 (28 毫克，0.099 毫莫耳)、(E)-1-(5-(丙-1-烯基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-醇 (26.0 毫克，0.119 毫莫耳) 及三苯膦 (33.7 毫克，0.128 毫莫耳) 中，添加 THF (0.5 毫升)。於此白色懸浮液中，添加偶氮二羧酸二乙酯 (0.020 毫升，0.128 毫莫耳)，以產生黃色溶液。在 135 分鐘內，淡黃褐色沉澱物形成。於 230 分鐘後，添加 2 毫升醚。將反應物過濾，然後以 3 x 1 毫升醚洗滌，獲得實例 235 (24 毫克，0.049 毫莫耳，49%)，為灰白色固體。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.81-1.86 (m, 1H) 1.88 (d, J=6.60 Hz, 4H) 2.08 (ddd, J=13.06, 3.71, 3.57 Hz, 2H) 3.12 (s, 3H) 3.64-3.73 (m, 2H) 4.16-4.24 (m, 2H) 4.56-4.62 (m, 1H) 6.02 (d, J=2.20 Hz, 1H) 6.06-6.14 (m, 2H) 6.20 (d, 1H) 7.13 (d, J=7.15 Hz, 1H) 7.64 (t, J=7.70 Hz, 1H) 7.80-7.93 (m, 2H) 8.32 (s, 2H). MS (ESI) 485.2 (M+1).

實例 236

(Z)-1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(丙-1-烯基)嘧啶-2-基)

六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



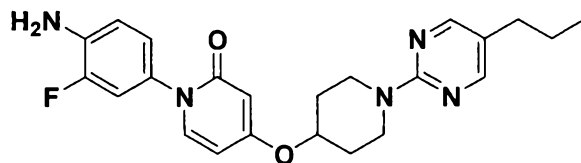
實例 236 係使用關於實例 235 所述之順序，且在步驟 A 中，

以 (Z)-丙-1-烯基二羥基硼烷取代 (E)-丙-1-烯基二羥基硼烷而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.77-1.97 (m, 3H) 2.04-2.17 (m, 1H) 3.12 (s, 3H) 3.49 (q, J=6.78 Hz, 1H) 3.63-3.80 (m, 1H) 4.11-4.30 (m, 1H) 4.60 (ddd, J=7.29, 3.85, 3.71 Hz, 1H) 5.79 (dq, J=11.55, 7.15 Hz, 1H) 6.03 (d, J=2.20 Hz, 1H) 6.09 (dd, J=7.70, 2.75 Hz, 1H) 6.18 (d, J=11.55 Hz, 1H) 7.14 (d, J=7.70 Hz, 1H) 7.64 (t, J=7.70 Hz, 1H) 7.79-7.95 (m, 1H) 8.33 (s, 1H). MS (ESI) 485.2 (M+1).

實例 238

1-(4-胺基-3-氟苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)

吡啶-2(1H)-酮之製備

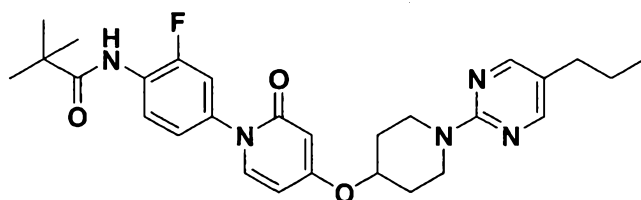


實例 238 係根據實例 173 中所述之程序，在步驟 E 中，以 2-氟基-4-碘基苯胺 (Aldrich) 取代 4-溴基-2-甲基-1-(甲磺醯基)苯而製成，惟將反應物於微波條件下在 100°C 下加熱 30 分鐘，然後於 130°C 下 30 分鐘。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.18 (s, 2H), 7.20 (d, J=7.53 Hz, 1H), 7.07 (dd, J=11.29, 2.26 Hz, 1H), 6.92-6.99 (m, 1H), 6.80-6.88 (m, 1H), 6.01 (d, J=2.51 Hz, 1H), 5.97 (dd, J=7.53, 2.51 Hz, 1H), 4.51-4.62 (m, 1H), 4.15-4.28 (m, 2H), 3.88 (寬廣 s., 2H), 3.57-3.69 (m, 2H), 2.42 (t, J=7.53 Hz, 2H), 1.97-2.18 (m, 2H), 1.77-1.97 (m, 2H), 1.53-1.66 (m, 2H), 0.96 (t, J=7.28 Hz, 3H). MS (ESI) 424 (M+H).

實例 239

N-(2-氟基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)

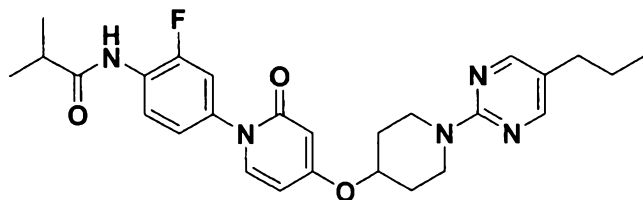
吡啶-1(2H)-基)苯基)三甲基乙醯胺之製備



實例 239 係根據實例 208 中所述之程序，以 1-(4-胺基-3-氟苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮取代 1-(4-胺基苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮，且以氯化三甲基乙醯 (Aldrich) 取代氯化異丁醯而製成，惟使粗製固體藉急驟式層析純化 (SiO_2 ，0 至 100% EtOAc 在 CH_2Cl_2 中)。 $^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.51 (t, $J=8.66$ Hz, 1H), 8.19 (s, 2H), 7.68 (d, $J=3.51$ Hz, 1H), 7.25-7.30 (m, 1H), 7.17-7.25 (m, 1H), 7.12 (d, $J=8.78$ Hz, 1H), 5.96-6.06 (m, 2H), 4.51-4.63 (m, 1H), 4.15-4.26 (m, 2H), 3.59-3.69 (m, 2H), 2.43 (t, $J=7.53$ Hz, 2H), 1.97-2.15 (m, 2H), 1.79-1.97 (m, 2H), 1.54-1.65 (m, 2H), 1.36 (s, 9H), 0.96 (t, $J=7.28$ Hz, 3H). MS (ESI) 508 (M+H).

實例 240

N-(2-氟基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)異丁醯胺之製備

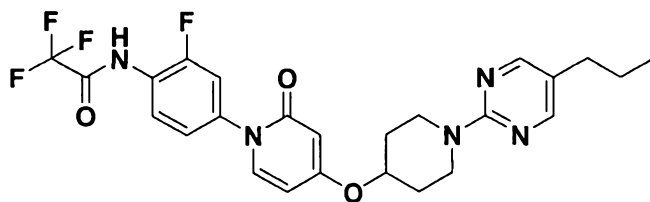


實例 240 係根據實例 208 中所述之程序，以 1-(4-胺基-3-氟苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮取代 1-(4-胺基苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮而製成，惟使粗製固體藉急驟式層析純化 (SiO_2 ，0 至 100% EtOAc 在 CH_2Cl_2 中)。 $^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm

8.54 (t, J=8.66 Hz, 1H), 8.43 (s, 2H), 7.46 (d, J=3.26 Hz, 1H), 7.32 (d, J=7.53 Hz, 1H), 7.25 (dd, J=11.42, 2.38 Hz, 1H), 7.12 (d, J=8.78 Hz, 1H), 6.39 (d, J=2.51 Hz, 1H), 6.18 (dd, J=7.65, 2.64 Hz, 1H), 4.67-4.77 (m, 1H), 4.05-4.18 (m, 2H), 3.93-4.05 (m, 2H), 2.57-2.70 (m, 1H), 2.53 (t, J=7.53 Hz, 2H), 2.10-2.21 (m, 2H), 1.97-2.10 (m, 2H), 1.59-1.71 (m, 2H), 1.31 (d, J=7.03 Hz, 6H), 1.00 (t, J=7.28 Hz, 3H). MS (ESI) 494 (M+H).

實例 241

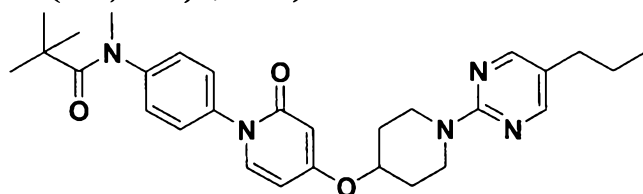
2,2,2-三氟-N-(2-氟基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)乙醯胺之製備



實例 241 係根據實例 239 中所述之程序，以 2,2,2-三氟醋酸酐 (Aldrich) 取代氯化三甲基乙醯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.29-8.42 (m, 2H), 8.19 (s, 2H), 7.36 (dd, J=11.17, 2.38 Hz, 1H), 7.16-7.25 (m, 2H), 6.05 (dd, J=7.65, 2.64 Hz, 1H), 6.02 (d, J=2.51 Hz, 1H), 4.53-4.65 (m, 1H), 4.15-4.26 (m, 2H), 3.60-3.71 (m, 2H), 2.43 (t, J=7.53 Hz, 2H), 2.00-2.15 (m, 2H), 1.75-1.98 (m, 2H), 1.52-1.66 (m, 2H), 0.96 (t, J=7.40 Hz, 3H). MS (ESI) 520 (M+H).

實例 242

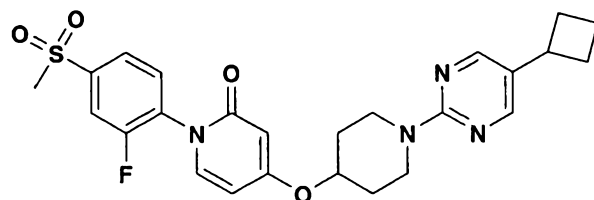
N-甲基-N-(4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)三甲基乙醯胺之製備



於氫化鈉(9.1毫克，0.23毫莫耳)、N-(4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)三甲基乙醯胺(15毫克，0.030毫莫耳)在DMF(2毫升)中之正在攪拌懸浮液內，添加碘化甲烷(10微升，0.16毫莫耳)。將反應物在室溫下攪拌1.5小時。以H₂O使反應淬滅，並以EtOAc萃取。使有機層在真空中濃縮成白色固體。使此固體藉急驟式層析純化(SiO₂，0至100% EtOAc在CH₂Cl₂中)，產生10毫克所要之產物，為白色固體。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.19 (s, 2H), 7.39-7.48 (m, 2H), 7.32-7.39 (m, 2H), 7.26 (d, J=2.01 Hz, 1H), 5.98-6.09 (m, 2H), 4.55-4.64 (m, 1H), 4.16-4.28 (m, 2H), 3.59-3.71 (m, 2H), 3.27 (s, 3H), 2.43 (t, J=7.40 Hz, 2H), 1.98-2.22 (m, 2H), 1.74-1.98 (m, 2H), 1.53-1.66 (m, 2H), 1.12 (s, 9H), 0.96 (t, J=7.28 Hz, 3H). MS (ESI) 504 (M+H).

實例 243

4-(1-(5-環丁基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(2-氟基-4-(甲磺基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



步驟 A. 2-氟基-5-環丁基嘧啶之製備

於含有5-溴基-2-氟基嘧啶(816毫克，4.22毫莫耳)之100毫升回收燒瓶中，施加真空，然後放置在氮大氣下。於燒瓶中添加二氯甲烷(3毫升)、PdCl₂(dppf)-CH₂Cl₂(172毫克，0.211毫莫耳)，接著為溴化環丁基鋅(II)(8.44毫升，4.22毫莫耳，

1.3M，在 THF 中)，歷經 1-2 分鐘。在 2 小時內，以 20 毫升飽和 NH_4Cl 水溶液與 50 毫升 EtOAc 使反應淬滅。將有機層以各 20 毫升飽和 NaHCO_3 水溶液，然後以 NaCl 洗滌，以 MgSO_4 脫水乾燥，過濾，及濃縮成 0.88 克含有一些固體之黃色油。使其藉急驟式層析純化 (5-10% EtOAc 在己烷中)，產生產物 (253 毫克，1.50 毫莫耳，36%)，為具有一部份少量結晶性物質之微淡黃色液體。MS (ESI) 169.1 (M+1).

步驟 B. 1-(5-環丁基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-醇之製備

此物質係按實例 142 步驟 A 中所述，以 2-氟基-5-環丁基嘧啶取代 2-氟基-5-丙基嘧啶而製成。MS (ESI) 234.2 (M+1).

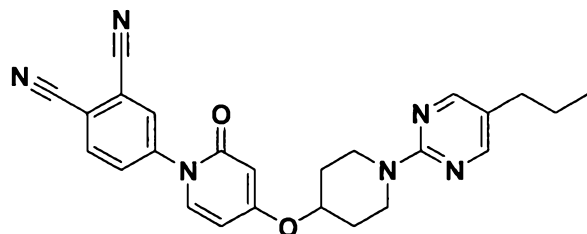
步驟 C. 實例 243 之製備

於 1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-羥基吡啶-2(1H)-酮 (56.7 毫克，0.20 毫莫耳)、1-(5-環丁基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-醇 (56.0 毫克，0.240 毫莫耳) 及三苯膦 (68.2 毫克，0.260 毫莫耳) 中，添加 THF (1 毫升)，以產生白色懸浮液，然後添加 (E)-重氮烯-1,2-二羧酸二乙酯 (0.041 毫升，0.260 毫莫耳)，導致固體完全溶解，且在 1-2 分鐘內，產生黃色溶液。55 分鐘後，隨著反應物仍為透明淡黃色溶液，添加 5 毫升醚，造成灰白色沉澱物形成。在攪拌 5 分鐘後，過濾，並以 4 x 1 毫升醚洗滌，產生實例 243 (74 毫克，0.145 毫莫耳，73%)，為灰白色粉末。
 $^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 1.21 (t, $J=7.03$ Hz, 2H) 1.75-1.95 (m, 3H) 1.96-2.18 (m, 5H) 2.25-2.40 (m, 2H) 3.12 (s, 3H) 3.38 (t, $J=8.57$ Hz, 1H) 3.48 (q, $J=7.03$ Hz, 1H) 3.58-3.70 (m, 2H) 4.21 (ddd, $J=13.51, 6.92, 3.73$ Hz, 2H) 4.45-4.69 (m, 1H) 4.58 (ddd, $J=7.58, 3.95, 3.84$ Hz, 1H) 6.02

(d, J=2.64 Hz, 1H) 6.08 (dd, J=7.91, 2.64 Hz, 1H) 7.13 (d, J=7.47 Hz, 1H)
7.51-7.70 (m, 1H) 7.80-7.93 (m, 2H) 8.23 (s, 2H). MS (ESI) 499.2 (M+1).

實例 244

4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)鄰苯二甲腈之製備

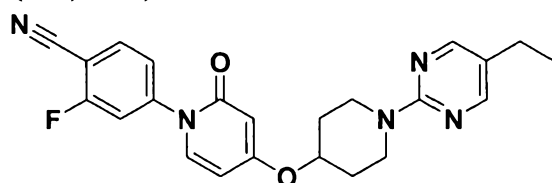


實例 244 係根據實例 173 中所述之程序，在步驟 E 中，以 4-碘基鄰苯二甲腈 (Aldrich) 取代 4-溴基-2-甲基-1-(甲磺醯基)苯而製成，惟將反應物於微波條件下在 140°C 下加熱 30 分鐘。

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.19 (s, 2H), 7.92-8.00 (m, 2H), 7.84 (dd, J=8.53, 2.01 Hz, 1H), 7.22 (d, J=7.53 Hz, 1H), 6.13 (dd, J=7.78, 2.51 Hz, 1H), 6.01 (d, J=2.51 Hz, 1H), 4.55-4.65 (m, 1H), 4.16-4.27 (m, 2H), 3.60-3.71 (m, 2H), 2.43 (t, J=7.53 Hz, 2H), 1.98-2.15 (m, 2H), 1.81-1.98 (m, 2H), 1.54-1.66 (m, 2H), 0.96 (t, J=7.28 Hz, 3H). MS (ESI) 441 (M+H).

實例 245

4-(4-(1-(5-乙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈之製備



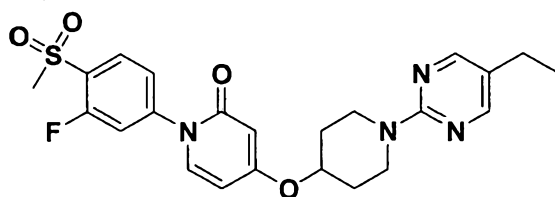
實例 245 係根據實例 230 中所述之程序，在步驟 C 中，以 2-氟基-5-乙基嘧啶 (Aldrich) 取代 2-氟基-5-環丙基嘧啶而製成。

於步驟D中，將反應物在微波條件下於140°C下加熱30分鐘。

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.20 (s, 2H) 7.76 (dd, $J=8.16$, 6.90 Hz, 1H) 7.32-7.42 (m, 2H) 7.21 (d, $J=7.78$ Hz, 1H) 6.07 (dd, $J=7.65$, 2.64 Hz, 1H) 6.00 (d, $J=2.76$ Hz, 1H) 4.53-4.62 (m, 1H) 4.14-4.26 (m, 2H) 3.58-3.70 (m, 2H) 2.49 (q, $J=7.70$ Hz, 2H) 1.97-2.14 (m, 2H) 1.76-1.97 (m, 2H) 1.21 (t, $J=7.53$ Hz, 3H). MS (ESI) 420 (M+H).

實例 246

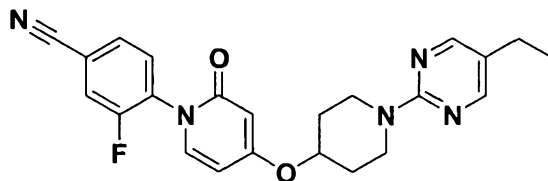
4-(1-(5-乙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(3-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 246 係根據實例 230 中所述之程序，於步驟 C 中，以 2-氟基-5-乙基嘓啶 (Aldrich) 取代 2-氟基-5-環丙基嘓啶，且在步驟 D 中，以 4-溴基-2-氟基-1-(甲磺醯基)苯 (根據實例 173 步驟 D 中所述之程序，以 4-溴基-2-氟基-1-碘苯取代 4-溴基-1-碘基-2-甲苯製成) 取代 2-氟基-4-碘基苯甲腈而製成，惟將反應物於微波條件下在 160°C 下加熱 30 分鐘。 $^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.21 (s, 2H), 8.05-8.17 (m, 1H), 7.46 (dd, $J=10.29$, 1.76 Hz, 1H), 7.38 (dd, $J=8.28$, 2.01 Hz, 1H), 7.23 (d, $J=7.78$ Hz, 1H), 6.10 (dd, $J=7.78$, 2.51 Hz, 1H), 6.02 (d, $J=2.51$ Hz, 1H), 4.54-4.64 (m, 1H), 4.16-4.27 (m, 2H), 3.60-3.71 (m, 2H), 3.27 (s, 3H), 2.50 (q, $J=7.53$ Hz, 2H), 1.98-2.16 (m, 2H), 1.80-1.98 (m, 2H), 1.22 (t, $J=7.65$ Hz, 3H). MS (ESI) 473 (M+H).

實例 247

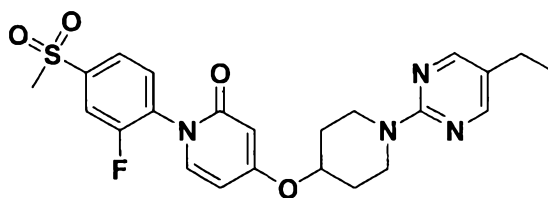
4-(4-(1-(5-乙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-3-氟基苯甲腈之製備



實例 247 係根據實例 190 中所述之程序，以 2-氟基-5-乙基嘧啶 (Aldrich) 取代 2-氟基-5-環丙基嘧啶而製成，惟將反應物於 120°C 下攪拌 6 小時。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.21 (s, 2H), 7.52-7.63 (m, 3H), 7.12 (dd, J=7.78, 1.00 Hz, 1H), 6.08 (dd, J=7.78, 2.51 Hz, 1H), 6.02 (d, J=2.51 Hz, 1H), 4.54-4.64 (m, 1H), 4.17-4.26 (m, 2H), 3.60-3.71 (m, 2H), 2.50 (q, J=7.61 Hz, 2H), 2.04-2.16 (m, 2H), 1.79-1.93 (m, 2H), 1.22 (t, J=7.65 Hz, 3H). MS (ESI) 420 (M+H).

實例 248

4-(1-(5-乙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮之製備

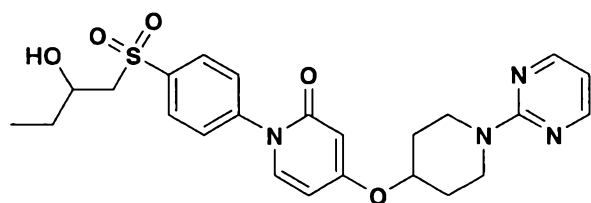


將 4-(1-(5-乙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮 (127 毫克，0.424 毫莫耳，根據實例 230 步驟 C 中所述之程序，以 2-氟基-5-乙基嘧啶 (Aldrich) 取代 2-氟基-5-環丙基嘧啶而製成)、氫化鈉 (60 wt% 礦油，21 毫克，0.51 毫莫耳) 及 DMF (5 毫升) 之懸浮液以氫滌氣，然後在室溫下攪拌 1 小時。於反應物中，添加 1,2-二氟-4-(甲磺醯基)苯 (90 毫克，0.47 毫莫耳，

Matrix Scientific)，接著在 110°C 下加熱 1 小時。以 H₂O 使所形成之混合物淬滅，並以 EtOAc 萃取。使有機層在真空中濃縮成黃色固體。使此固體藉急驟式層析純化 (SiO₂，0 至 100% EtOAc 在 CH₂Cl₂ 中)，產生 91 毫克所要之產物，為灰白色固體。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.20 (s, 2H), 7.83-7.91 (m, 2H), 7.64 (dd, J=8.53, 6.78 Hz, 1H), 7.13 (dd, J=7.53, 1.00 Hz, 1H), 6.08 (dd, J=7.65, 2.64 Hz, 1H), 6.03 (d, J=2.51 Hz, 1H), 4.54-4.63 (m, 1H), 4.16-4.27 (m, 2H), 3.60-3.70 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.49 (q, J=7.53 Hz, 2H), 1.97-2.15 (m, 2H), 1.78-1.97 (m, 2H), 1.21 (t, J=7.53 Hz, 3H). MS (ESI) 473 (M+H).

實例 249

1-(4-(2-羥丁基磺醯基)苯基)-4-(1-(嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮，TFA 鹽之製備

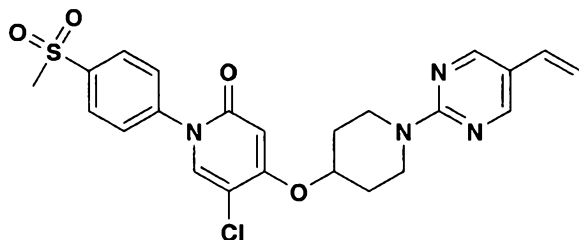


使(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮(104 毫克，0.206 毫莫耳)在 THF (12 毫升)中之懸浮液冷卻至 -78°C，並添加第三-丁基鋰(0.242 毫升，0.411 毫莫耳，1.7M，在戊烷中)。淡黃色微細懸浮液變得較濃稠。30 分鐘後，添加丙醛(0.030 毫升，0.411 毫莫耳)，然後移除冷卻浴。在 10 分鐘內，以 20 毫升飽和 NH₄Cl 水溶液使反應淬滅，接著以 30 毫升 CH₂Cl₂ 萃取。使有機層以 MgSO₄ 脫水乾燥，過濾，及濃縮，而得 102 毫克黃褐色-黃色固體。使此物質藉預備之 HPLC 純化 (C18，10-90% MeOH 在含有 0.1% TFA 之水中)，獲得實例 249 (15 毫克，0.028

毫莫耳，14%)，為淡黃色油。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 0.82-0.94 (m, 3H) 1.41-1.58 (m, 2H) 1.76-1.96 (m, 2H) 1.93-2.15 (m, 2H) 3.13-3.40 (m, 6H) 3.64-3.80 (m, 2H) 3.95-4.18 (m, 2H) 4.48-4.71 (m, 1H) 6.00 (d, J=2.20 Hz, 1H) 6.05-6.17 (m, 1H) 6.54 (t, J=4.83 Hz, 1H) 7.25 (d, J=7.91 Hz, 2H) 7.55 (d, J=8.35 Hz, 2H) 8.03 (d, J=8.79 Hz, 2H) 8.33 (d, J=4.83 Hz, 1H). MS (ESI) 485.2 (M+1).

實例 250

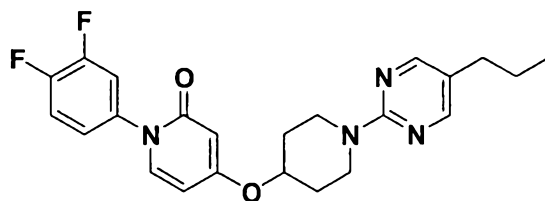
(Z)-5-氯基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(丙-1-烯基)嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



於 5-氯基-4-羥基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮 (35 毫克，0.117 毫莫耳)、(Z)-1-(5-(丙-1-烯基)嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-醇 (30.7 毫克，0.140 毫莫耳，按實例 236 中所述製成) 及三苯膦 (39.8 毫克，0.152 毫莫耳) 在 THF (2 毫升) 中之混合物內，慢慢添加 (E)-重氮烯-1,2-二羧酸二乙酯 (0.024 毫升，0.125 毫莫耳)。將混合物在室溫下攪拌 16 小時。於反應混合物中，添加乙醚 (10 毫升)。收集沉澱物，並以乙醚洗滌 (2x)，獲得實例 250 (5 毫克，8.55%)，為白色固體。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.31-8.44 (m, 2H), 8.09 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.63 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.43 (s, 1H), 6.18 (d, J=11.55 Hz, 1H), 6.02-6.10 (m, 1H), 5.81-5.93 (m, 1H), 4.74 (寬廣 s., 1H), 3.98-4.11 (m, 4H), 3.49 (s, 3H), 3.09 (s, 3H), 2.07 (寬廣 s., 4H). MS (ESI) 501 (M+H).

實例 251

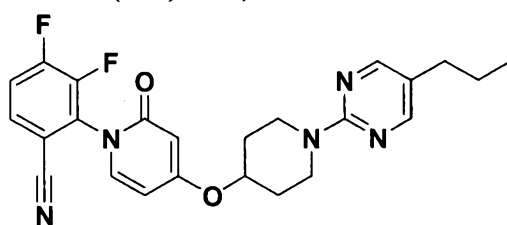
1-(3,4-二氟苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備



實例 251 係根據實例 244 中所述之程序，以 1,2-二氟-4-碘苯 (Matrix Scientific) 取代 4-碘基鄰苯二甲腈而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.19 (s, 2H), 7.29-7.33 (m, 1H), 7.24-7.28 (m, 1H), 7.20 (d, J=7.28 Hz, 1H), 7.13 (d, J=8.03 Hz, 1H), 5.88-6.18 (m, 2H), 4.49-4.68 (m, 1H), 4.09-4.32 (m, 2H), 3.48-3.77 (m, 2H), 2.43 (t, J=7.40 Hz, 2H), 2.00-2.23 (m, 2H), 1.75-1.95 (m, 2H), 1.47-1.70 (m, 2H), 0.96 (t, J=7.28 Hz, 3H). MS (ESI) 427 (M+H).

實例 252

3,4-二氟-2-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲腈之製備



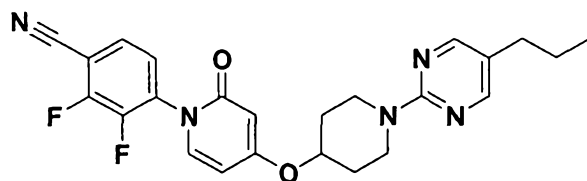
實例 252 係根據實例 248 中所述之程序，以 4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮 (根據實例 173 步驟 C 中所述之程序製成) 取代 4-(1-(5-乙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮，且以 2,3,4-三氟苯甲腈 (Oakwood) 取代 1,2-二氟-4-(甲磺醯基)苯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ

ppm 8.10 (s, 2H), 7.43-7.60 (m, 1H), 7.27-7.43 (m, 1H), 7.02 (d, J=7.78 Hz, 1H), 6.05 (dd, J=7.65, 2.64 Hz, 1H), 5.96 (d, J=2.51 Hz, 1H), 4.43-4.60 (m, 1H), 4.08-4.24 (m, 2H), 3.49-3.66 (m, 2H), 2.34 (t, J=7.53 Hz, 2H), 1.99-2.08 (m, 2H), 1.71-1.88 (m, 2H), 1.43-1.59 (m, 2H), 0.87 (t, J=7.28 Hz, 3H). MS (ESI) 452 (M+H).

實例 253

2,3-二氟-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)

吡啶-1(2H)-基)苯甲腈之製備

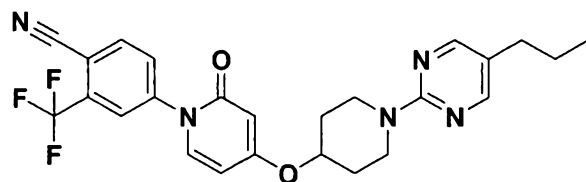


實例 253 係根據實例 248 中所述之程序，以 4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮 (根據實例 173 步驟 C 中所述之程序製成) 取代 4-(1-(5-乙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮，且以 2,3,4-三氟苯甲腈 (Oakwood) 取代 1,2-二氟-4-(甲磺醯基)苯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.10 (s, 2H), 7.35-7.53 (m, 1H), 7.21-7.35 (m, 1H), 7.03 (d, J=7.03 Hz, 1H), 6.01 (dd, J=7.65, 2.64 Hz, 1H), 5.93 (d, J=2.51 Hz, 1H), 4.43-4.54 (m, 1H), 4.05-4.19 (m, 2H), 3.50-3.66 (m, 2H), 2.34 (t, J=7.53 Hz, 2H), 1.93-2.11 (m, 2H), 1.72-1.83 (m, 2H), 1.42-1.56 (m, 2H), 0.87 (t, J=7.28 Hz, 3H). MS (ESI) 452 (M+H).

實例 254

4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-

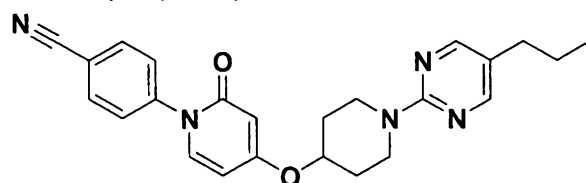
-1(2H)-基)-2-(三氟甲基)苯甲腈之製備



實例 254 係根據實例 244 中所述之程序，以 4-碘基-2-(三氟甲基)苯甲腈 (Aldrich) 取代 4-碘基鄰苯二甲腈而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.19 (s, 2H), 7.98 (d, J=8.28 Hz, 1H), 7.88 (d, J=2.01 Hz, 1H), 7.80 (dd, J=8.28, 2.01 Hz, 1H), 7.24 (d, J=7.78 Hz, 1H), 6.12 (dd, J=7.65, 2.64 Hz, 1H), 6.02 (d, J=2.51 Hz, 1H), 4.55-4.65 (m, 1H), 4.14-4.28 (m, 2H), 3.60-3.73 (m, 2H), 2.43 (t, J=7.53 Hz, 2H), 2.05-2.15 (m, 2H), 1.80-1.93 (m, 2H), 1.53-1.66 (m, 2H), 0.96 (t, J=7.28 Hz, 3H). MS (ESI) 484 (M+H).

實例 255

4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘍啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲腈之製備

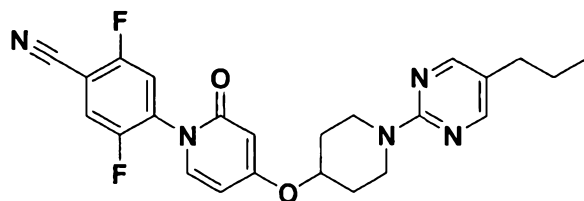


實例 255 係根據實例 244 中所述之程序，以 4-碘基苯甲腈 (Transworld) 取代 4-碘基鄰苯二甲腈而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.19 (s, 2H), 7.77-7.83 (m, 2H), 7.53-7.59 (m, 2H), 7.23 (d, J=7.53 Hz, 1H), 6.07 (dd, J=7.65, 2.64 Hz, 1H), 6.02 (d, J=2.51 Hz, 1H), 4.54-4.64 (m, 1H), 4.16-4.28 (m, 2H), 3.59-3.70 (m, 2H), 2.43 (t, J=7.53 Hz, 2H), 1.98-2.17 (m, 2H), 1.78-1.98 (m, 2H), 1.51-1.66 (m, 2H), 0.96 (t, J=7.40 Hz, 3H). MS (ESI) 416 (M+H).

實例 256

2,5-二氟-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)

吡啶-1(2H)-基)苯甲腈之製備

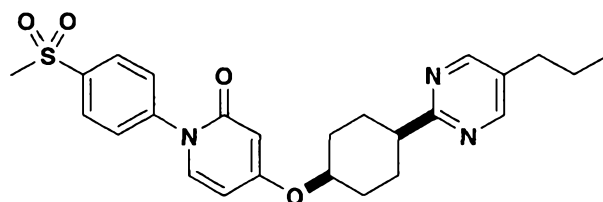


實例 256 係根據實例 252 中所述之程序，以 2,4,5-三氟苯甲腈 (Aldrich) 取代 2,3,4-三氟苯甲腈而製成。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.13 (s, 2H), 7.49 (dd, J=8.25, 5.50 Hz, 1H), 7.33 (dd, J=8.25, 5.50 Hz, 1H), 7.06 (d, J=7.70 Hz, 1H), 6.03 (dd, J=7.70, 2.20 Hz, 1H), 5.96 (d, J=2.75 Hz, 1H), 4.48-4.59 (m, 1H), 4.10-4.20 (m, 2H), 3.52-3.69 (m, 2H), 2.37 (t, J=7.70 Hz, 2H), 2.00-2.09 (m, 2H), 1.75-1.85 (m, 2H), 1.45-1.59 (m, 2H), 0.90 (t, J=7.42 Hz, 3H). MS (ESI) 452 (M+H).

實例 257

順式-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(4-(5-丙基嘧啶-2-基)環己基氧基)

吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



步驟 A. 2-((二甲胺基)亞甲基)戊醛之製備

於氯化磷醯(2.330 毫升, 25.00 毫莫耳, Aldrich) 在 1,2-二氯乙烷(5.0 毫升)中之溶液內, 在 0°C 下, 於 10 分鐘過程期間內, 添加 1,2-二氯乙烷(10.0 毫升)中之 DMF (7.74 毫升, 100 毫莫耳, EMD)。將混合物在 0°C 下攪拌 20 分鐘, 然後溫熱至室溫。於室溫下攪拌 3 小時後, 逐滴添加(5 分鐘) 1,2-二氯乙烷(5.0

毫升)中之戊醛(2.66毫升, 25.0毫莫耳, Aldrich), 並將所形成之混合物在室溫下攪拌50分鐘, 且於85°C下50分鐘。將已冷卻之反應混合物倒入冰與K₂CO₃之混合物(7.5克)中, 接著添加飽和K₂CO₃水溶液, 直到混合物之pH值約10為止。於上述混合物中, 添加二甲胺(8.0毫升, 在水中之40重量%溶液, Aldrich), 並將反應混合物於80°C下加熱1小時, 冷卻, 及在減壓下蒸發, 以移除1,2-二氯乙烷。然後, 將所形成之混合物在95°C下加熱1小時, 冷卻至室溫, 且以EtOAc萃取(3x)。將合併之萃液以鹽水洗滌, 脫水乾燥(Na₂SO₄), 及在真空中濃縮。使殘留物於減壓下蒸餾(1托, 在145-155°C下之油浴), 產生標題化合物(200毫克, 5.7%), 為橘色油。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.85 (s, 1H), 6.48 (s, 1H), 3.13 (s, 6H), 2.30-2.45 (m, 2H), 1.32-1.53 (m, 2H), 0.93 (t, J=7.42 Hz, 3H).

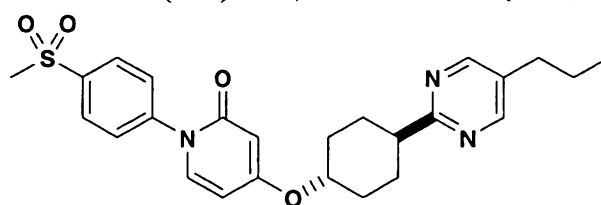
步驟 B. 實例 257

實例 257 係根據實例 214 中所述之程序, 在步驟 C, 以 2-((二甲胺基)亞甲基)戊醛取代(E)-3-(二甲胺基)丙烯醛而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.59 (s, 2H), 8.08 (d, J=8.61 Hz, 2H), 7.64 (d, J=8.42 Hz, 2H), 7.24 (d, J=7.69 Hz, 1H), 6.16 (dd, J=7.69, 2.38 Hz, 1H), 6.05 (d, J=2.38 Hz, 1H), 4.67 (表觀寬廣 s, 1H), 3.11 (s, 3H), 3.00-3.10 (m, 1H), 2.60 (t, J=7.60 Hz, 2H), 2.07-2.29 (m, 4H), 1.90-1.98 (m, 2H), 1.82 (t, J=13.37 Hz, 2H), 1.63-1.75 (m, 2H), 1.01 (t, J=7.33 Hz, 3H). MS (ESI) 468 (M+H).

實例 258

反式-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(4-(5-丙基嘧啶-2-基)環己基氧基)

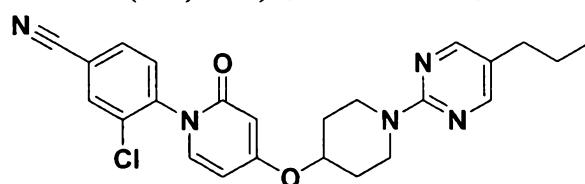
吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



實例 258 係按上文實例 257 中所述製成，並藉預備之 HPLC 自順式異構物分離，產生標題化合物。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.57 (s, 2H), 8.09 (d, $J=8.61$ Hz, 2H), 7.64 (d, $J=8.61$ Hz, 2H), 7.24 (d, $J=7.51$ Hz, 1H), 6.03-6.13 (m, 2H), 4.30-4.44 (m, 1H), 3.11 (s, 3H), 2.88-3.06 (m, 1H), 2.60 (t, $J=7.69$ Hz, 2H), 2.30-2.41 (m, 2H), 2.24-2.36 (m, 2H), 2.14-2.26 (m, 2H), 1.78-1.92 (m, 2H), 1.64-1.75 (m, 2H), 1.01 (t, $J=7.33$ Hz, 3H). MS (ESI) 468 (M+H).

實例 259

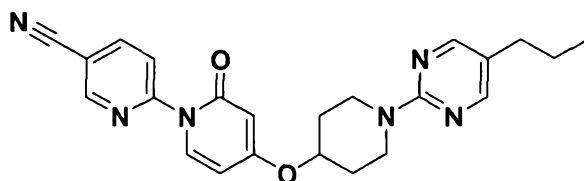
3-氯基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲腈之製備



實例 259 係根據實例 252 中所述之程序，以 3-氯基-4-氯基苯甲腈 (Aldrich) 取代 2,3,4-三氯苯甲腈而製成，惟將反應物於 80°C 下加熱 3 小時。 ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.19 (s, 2H), 7.88 (d, $J=1.76$ Hz, 1H), 7.72 (dd, $J=8.16, 1.63$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J=8.03$ Hz, 1H), 7.04 (d, $J=7.53$ Hz, 1H), 6.08 (dd, $J=7.78, 2.51$ Hz, 1H), 6.03 (d, $J=2.26$ Hz, 1H), 4.54-4.66 (m, 1H), 4.13-4.32 (m, 2H), 3.57-3.72 (m, 2H), 2.43 (t, $J=7.53$ Hz, 2H), 2.05-2.19 (m, 2H), 1.79-2.00 (m, 2H), 1.53-1.67 (m, 2H), 0.96 (t, $J=7.40$ Hz, 3H). MS (ESI) 450 (M+H).

實例 260

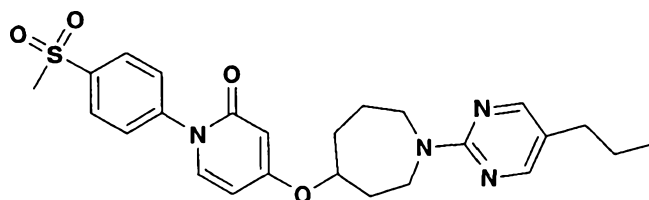
6-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)菸鹼脛之製備



實例 260 係根據實例 244 中所述之程序，以 6-溴基菸鹼脛 (Matrix Scientific) 取代 4-碘基鄰苯二甲脛而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.82 (d, J=1.76 Hz, 1H), 8.35 (d, J=8.78 Hz, 1H), 8.19 (s, 2H), 8.08 (dd, J=8.66, 2.13 Hz, 1H), 8.02 (d, J=8.03 Hz, 1H), 6.12 (dd, J=8.03, 2.51 Hz, 1H), 5.98 (d, J=2.51 Hz, 1H), 4.55-4.68 (m, 1H), 4.14-4.28 (m, 2H), 3.60-3.73 (m, 2H), 2.43 (t, J=7.53 Hz, 2H), 1.99-2.18 (m, 2H), 1.77-1.99 (m, 2H), 1.51-1.66 (m, 2H), 0.96 (t, J=7.28 Hz, 3H). MS (ESI) 417 (M+H).

實例 261

1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)-1,2,2-二氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備

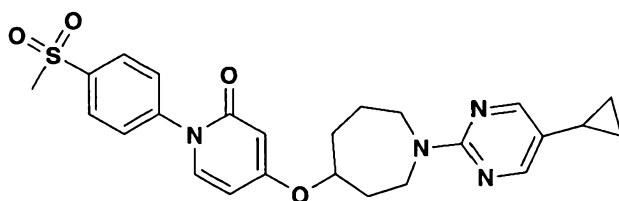


實例 261 係根據實例 132 中所述之程序，在步驟 C，以 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2,2-二氫吡啶-4-基氧基)-1,2,2-二氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯 (實例 6) 取代 4-(2-酮基-1-(吡啶-3-基)-1,2,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.44 (s, 2H), 8.08 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d,

J=8.25 Hz, 2H), 7.24 (d, J=7.15 Hz, 1H), 6.01-6.08 (m, 2H), 4.55-4.61 (m, 1H), 3.90-4.04 (m, 3H), 3.77-3.88 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.46-2.56 (m, 2H), 2.04-2.27 (m, 4H), 1.84-2.01 (m, 2H), 1.56-1.69 (m, 2H), 0.98 (t, J=7.15 Hz, 3H). MS (ESI) 483 (M+H).

實例 262

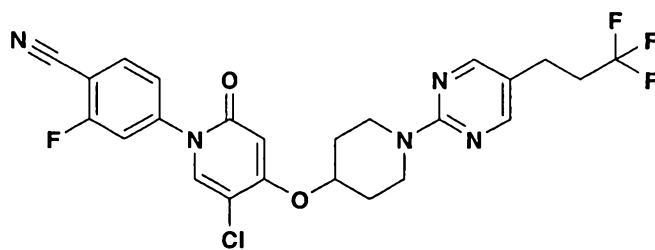
4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)-1,2,3,4-四氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺酰基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



實例 262 係根據實例 132 中所述之程序，於步驟 C，以 4-(1-(4-(甲磺酰基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-1,2,3,4-四氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯取代 4-(2-酮基-1-(吡啶-3-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯，且在步驟 D，以 2-氯基-5-環丙基嘧啶取代 2-氯基-5-丙基嘧啶而製成。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.40 (s, 2H), 8.08 (d, J=8.25 Hz, 2H), 7.61 (d, J=8.80 Hz, 2H), 7.25-7.28 (m, 1H), 6.13 (d, J=2.20 Hz, 1H), 6.06 (dd, J=7.42, 2.47 Hz, 1H), 4.55-4.63 (m, 1H), 3.87-4.03 (m, 3H), 3.78-3.88 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 2.03-2.28 (m, 4H), 1.86-2.00 (m, 2H), 1.77-1.89 (m, 1H), 1.02-1.07 (m, 2H), 0.65-0.77 (m, 2H). MS (ESI) 481 (M+H).

實例 263

4-(5-氯基-2-酮基-4-(1-(5-(3,3,3-三氟丙基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)-2-氯基苯甲腈, TFA 鹽之製備



步驟 A. 4-(5-氯基-4-羥基-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈之製備

將2-氟基-4-氯基苯甲腈(4000毫克, 16.19毫莫耳)、5-氯基-4-羥基吡啶-2(1H)-酮(2357毫克, 16.19毫莫耳)、4,7-二甲氧基-1,10-二氮菲(778毫克, 3.24毫莫耳)、碘化銅(I)(617毫克, 3.24毫莫耳)及碳酸鉀(4476毫克, 32.4毫莫耳)在DMSO(40毫升)中之混合物於140°C及N₂下攪拌3小時。在冷卻至室溫後, 將反應混合物以H₂O(50毫升)稀釋, 並添加1N HCl, 以調整pH至~2(pH紙)。以EtOAc(400毫升, 2x)萃取所形成之混合物。使合併之萃液脫水乾燥(Na₂SO₄), 及在減壓下蒸發, 獲得黑色油。使殘留物藉急驟式層析純化(SiO₂, 0至7% MeOH/CH₂Cl₂), 而得褐色油(3.2克, 43.3%)。MS (ESI) 265 (M+H).

步驟 B. 4-(5-氯基-1-(4-氯基-3-氟苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備

中間物係根據實例221中所述之程序, 以4-(5-氯基-4-羥基-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈取代4-羥基-6-酮基-1,6-二氫吡啶-3-甲腈, 且在步驟B中, 以4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯取代甲磺酸1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯而製成。MS (ESI) 392 (M+H).

步驟 C. 4-(5-氯基-2-酮基-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-

基)-2-氟基苯甲腈之製備

於4-(5-氟基-1-(4-氟基-3-氟苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯(2.2克, 4.18毫莫耳)在MeOH(15毫升)中之懸浮液內, 添加氯化氫(4M, 在1,4-二氧陸園中)(0.609克, 16.70毫莫耳), 並在室溫下攪拌。於攪拌6小時後, 蒸發溶劑MeOH, 且以EtOAc(50毫升)稀釋所形成之粗製物。在添加飽和NaHCO₃水溶液, 以調整pH > 7後, 將所形成之混合物激烈攪拌2小時。收集有機層, 並以EtOAc逆萃取2x水層。使合併之萃液脫水乾燥(Na₂SO₄), 及在減壓下蒸發, 獲得褐色固體, 為粗產物(1克, 2.88毫莫耳)。MS (ESI) 348 (M+H).

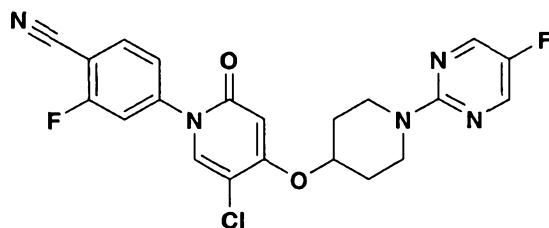
步驟D. 實例263

將4-(5-氟基-2-酮基-4-(六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈(50毫克, 0.144毫莫耳)、2-氟基-5-(3,3,3-三氟丙基)嘧啶(60.6毫克, 0.288毫莫耳, 按實例181中所述製成)及碳酸鉀(59.6毫克, 0.431毫莫耳)在DMF(0.4毫升)中之混合物, 於90°C下, 在密閉小玻璃瓶中攪拌24小時。於冷卻至室溫後, 將反應混合物以EtOAc(60毫升)與H₂O(40毫升)稀釋。藉由1N HCl使水相酸化至pH = 2。收集有機萃液, 以Na₂SO₄脫水乾燥, 及蒸發, 而得褐色油。使粗製油藉預備之HPLC純化(C₁₈管柱; 20-90% MeOH在含有0.05%三氟醋酸之水中), 獲得實例263, 為褐色固體(5毫克, 6.33%)。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.50 (s, 2H), 7.80 (t, J=7.42 Hz, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.36 (dd, J=18.42, 8.52 Hz, 2H), 6.41 (s, 1H), 4.84 (寬廣s., 1H), 4.29 (d,

J=12.65 Hz, 2H), 3.89-4.05 (m, 2H), 2.79-2.92 (m, 2H), 2.34-2.52 (m, 2H), 2.16 (寬廣 s., 4H). MS (ESI) 522 (M+H).

實例 264

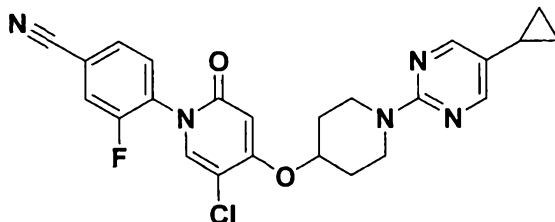
4-(5-氟基-4-(1-(5-氟基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈, TFA 鹽之製備



實例 264 係根據實例 263 中所述之程序，在步驟 4 中，以 2-氟基-5-氟基嘧啶取代 2-氟基-5-(3,3,3-三氟丙基)嘧啶而製成。
 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, CDCl_3) δ ppm 8.24 (s, 2H), 7.75-7.80 (m, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.38 (d, $J=9.35$ Hz, 1H), 7.34 (d, $J=8.25$ Hz, 1H), 6.18 (s, 1H), 4.67-4.73 (m, 1H), 4.01 (td, $J=8.80, 3.85$ Hz, 2H), 3.85-3.93 (m, 2H), 2.06 (dt, $J=8.80, 4.40$ Hz, 2H), 1.96 (td, 2H). MS (ESI) 444 (M+H).

實例 265

4-(5-氟基-4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-3-氟基苯甲腈之製備



步驟 A. 5-氟基-4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮之製備

於 5-氟基-4-羥基吡啶-2(1H)-酮 (212 毫克, 1.46 毫莫耳)、1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-醇 (320 毫克, 1.459 毫莫耳, 根

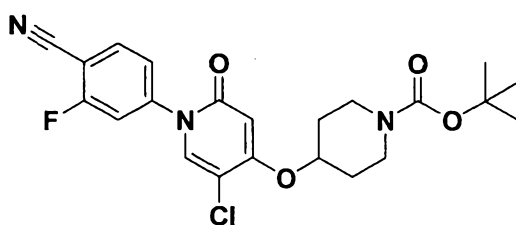
據實例 173 步驟 A 中所述之程序，以 2-氯基-5-環丙基嘧啶取代 2-氯基-5-丙基嘧啶製成) 及三苯膦 (574 毫克，2.19 毫莫耳) 在 DMF (10 毫升) 中之正在攪拌混合物內，在 0°C 下，添加偶氮二羧酸二異丙酯 (0.43 毫升，2.2 毫莫耳)。將反應物於 Ar 及室溫下攪拌 2 天，然後添加 H₂O。使所形成之混合物在真空中濃縮成黃色油。使此油藉急驟式層析純化 (SiO₂，0 至 100% EtOAc 在 CH₂Cl₂ 中，接著為 SiO₂，0 至 10% MeOH 在 CH₂Cl₂ 中)，產生 153 毫克所要之產物，為白色固體。MS (ESI) 347 (M+H).

步驟 B. 實例 265

實例 265 係根據實例 252 中所述之程序，以 5-氯基-4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮取代 4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮，且以 3,4-二氟苯甲腈 (Aldrich) 取代 2,3,4-三氟苯甲腈而製成，惟將反應物於 110°C 下加熱 3 天，然後在 140°C 下 5 小時。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.07 (s, 2H), 7.42-7.60 (m, 3H), 7.23 (s, 1H), 5.99 (s, 1H), 4.50-4.69 (m, 1H), 3.93-4.04 (m, 2H), 3.67-3.82 (m, 2H), 1.93-2.07 (m, 2H), 1.78-1.92 (m, 2H), 1.61-1.72 (m, 1H), 0.78-0.91 (m, 2H), 0.47-0.61 (m, 2H). MS (ESI) 466 (M+H).

實例 267

4-(5-氯基-1-(4-氯基-3-氯苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)
六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備

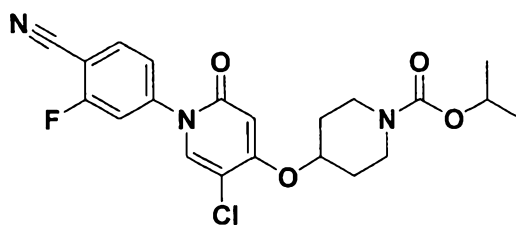


實例 267 係根據實例 173 步驟 C 中所述之程序，以 4-(5-氯基-4-羥基-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈(根據實例 263 步驟 B 中所述之程序製成)取代 4-羥基吡啶-2(1H)-酮，且以 4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯(根據實例 1 步驟 C 中所述之程序製成)取代甲磺酸 1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯而製成，惟使粗產物藉急驟式層析純化(SiO₂，0 至 100% EtOAc 在 CH₂Cl₂ 中)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7.77 (t, J=7.53 Hz, 1H), 7.37-7.46 (m, 2H), 7.30-7.36 (m, 1H), 6.00 (s, 1H), 4.54-4.68 (m, 1H), 3.58-3.71 (m, 2H), 3.40-3.56 (m, 2H), 1.93-2.07 (m, 2H), 1.78-1.93 (m, 2H), 1.49 (s, 9H). MS (ESI) 392 (M-56+H).

實例 268

4-(5-氯基-1-(4-氯基-3-氟苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)

六氫吡啶-1-羧酸異丙酯之製備

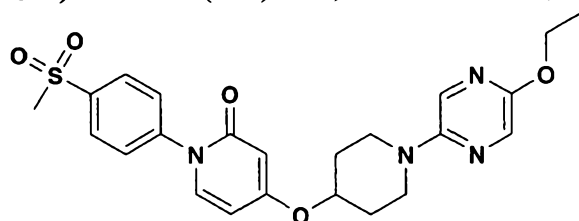


實例 268 係根據實例 2 中所述之程序，於步驟 A 中，以 4-(5-氯基-1-(4-氯基-3-氟苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯取代 4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯，且在步驟 C 中，以氯甲酸異丙酯取代氯甲酸 1,1,1-三氟丙-2-基酯而製

成，惟使粗產物藉急驟式層析純化(SiO₂，0至100% EtOAc在CH₂Cl₂中)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7.67-7.87 (m, 1H), 7.30-7.49 (m, 3H), 6.00 (s, 1H), 4.86-5.11 (m, 1H), 4.53-4.70 (m, 1H), 3.44-3.76 (m, 4H), 1.79-2.15 (m, 4H), 1.26 (s, 6H). MS (ESI) 434 (M+H).

實例 269

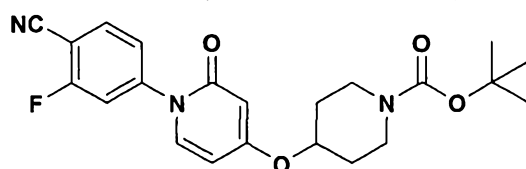
4-(1-(5-乙氧基吡啞-2-基)六氫吡啞-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啞-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備



將 1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(六氫吡啞-4-基氧基)吡啞-2(1H)-酮、HCl (39.5 毫克, 0.113 毫莫耳)、2-溴基-5-乙氧基吡啞 (23 毫克, 0.113 毫莫耳) 及碳酸鉀 (20.39 毫克, 0.340 毫莫耳) 在 DMSO (0.2 毫升) 中之混合物於 180°C 油浴中加熱 1.5 小時。將反應混合物添加至 2 毫升 EtOAc 中，並以 3 x 2 毫升水洗滌，使 EtOAc 以 MgSO₄ 脫水乾燥，過濾，及濃縮成 6 毫克琥珀色油。使此物質藉預備之 HPLC 純化 (C18, 50-90% MeOH 在含有 0.1% TFA 之水中)，獲得實例 269 (2.3 毫克, 0.003 毫莫耳, 3%)，為褐色油。MS (ESI) 471.2 (M+1).

實例 270

4-(1-(4-氟基-3-氰基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啞-4-基氧基)六氫吡啞-1-羧酸第三-丁酯之製備



步驟 A. 4-(2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備

於 100 毫升圓底燒瓶中之 4-羥基吡啶-2(1H)-酮 (11.11 克, 100 毫莫耳) 與 4-(甲磺醯基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯 (27.9 克, 100 毫莫耳) 內, 施加真空 5 分鐘, 破除真空至氮氣, 添加 DMSO (100 毫升), 然後添加碳酸鉀 (13.20 克, 220 毫莫耳)。在 90°C 油浴中, 於氮氣下放置 4.5 小時。將反應混合物添加至 1000 毫升水與 1000 毫升 EtOAc 中, 接著, 將 EtOAc 以另外之水 (4 x 500 毫升) 洗滌, 以 MgSO₄ 脫水乾燥, 過濾, 及濃縮成 27.3 克油狀白色固體。將此物質在 200 毫升回流之 EtOAc 中配成漿液, 使其冷卻至室溫, 過濾, 並以 2 x 50 毫升 EtOAc, 然後以 2 x 50 毫升己烷洗滌, 獲得產物 (4.86 克, 16.5 毫莫耳, 17%), 為白色結晶性粉末。MS (ESI) 239.1 (M+1-56, 顯示在 MS 中喪失第三-丁基 Boc 基團)。

步驟 B. 4-(2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯之製備

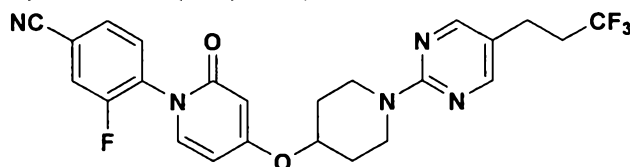
於 4-(2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯 (294 毫克, 1 毫莫耳)、碘化銅 (I) (229 毫克, 1.200 毫莫耳)、喹啉-8-醇 (174 毫克, 1.200 毫莫耳) 及碳酸鉀 (180 毫克, 3.00 毫莫耳) 中, 添加 DMSO (5 毫升), 使氮於液面下起泡 20 秒, 在氮氣下加蓋, 並於室溫下攪拌 20 分鐘, 然後添加 2-氟基-4-碘基苯甲腈 (296 毫克, 1.200 毫莫耳), 使氮於液面下起泡 20 秒, 在氮氣下加蓋, 且於 90°C 油浴中放置 60 分鐘。將反應混合物添加至 50 毫升 EtOAc + 25 毫升水中, 接著過

濾，以移除固體，且使乳化液破碎。移除下方水層，並將綠色 EtOAc 層以另外 4 x 25 毫升水洗滌，以 MgSO₄ 脫水乾燥，過濾，及濃縮成 419 毫克淺綠色油。使此物質藉急驟式層析純化 (0-1% MeOH 在 CH₂Cl₂ 中)，提供實例 270 (28 毫克，0.067 毫莫耳，7%)，為淡黃色固體。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.48 (s, 9H) 1.72-1.84 (m, 2H) 1.92-2.03 (m, 2H) 3.28-3.38 (m, 2H) 3.72 (寬廣 s., 2H) 4.49 (寬廣 s., 1H) 5.95 (寬廣 s., 1H) 6.06 (d, J=7.70 Hz, 1H) 7.21 (d, J=7.70 Hz, 1H) 7.33 (d, J=8.25 Hz, 1H) 7.38 (d, J=9.35 Hz, 1H) 7.75 (t, J=7.70 Hz, 1H). MS (ESI) 414.2 (M+1).

實例 271

3-氟基-4-(2-酮基-4-(1-(5-(3,3,3-三氟丙基)嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-

基氧基)嘓啶-1(2H)-基)苯甲腈，TFA 鹽之製備



步驟 A. 4-(4-(苄氧基)-2-酮基嘓啶-1(2H)-基)-3-氟基苯甲腈之製備

於 4-(苄氧基)嘓啶-2(1H)-酮 (0.358 克，1.779 毫莫耳) 中，在氮氣下添加 DMF (5 毫升)，以產生黃褐色懸浮液。於反應物中，添加 NaH (60%，在油中) (0.074 克，1.860 毫莫耳)，並攪拌 1.5 小時，然後添加 3,4-二氟苄甲腈 (0.225 克，1.618 毫莫耳)。將反應物於 90°C 油浴中放置 2 小時。於黃褐色懸浮液中，添加 50 毫升 EtOAc，且以 4 x 25 毫升水洗滌混合物。以 MgSO₄ 脫水乾燥，過濾，及濃縮，而得 0.42 克淡黃色固體。使此物質藉急驟式層析純化 (1-5% MeOH 在 CH₂Cl₂ 中)，產生產物 (263 毫克，

0.805 毫莫耳，50%)，為黃褐色固體。MS (ESI) 321.2 (M+1).

步驟 B. 3-氟基-4-(4-羥基-2-酮基吡啶-1(2H)-基)苯甲腈之製備

於 4-(4-(苄氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-3-氟基苯甲腈 (250 毫克，0.780 毫莫耳) 與 10% 鈦/碳 (50 毫克，0.470 毫莫耳) 中，施加真空，然後放置在氮大氣下。添加甲醇 (5 毫升)，並短暫地施加真空。將反應物於氮大氣下放置 6 小時。使反應混合物通過 10 x 10 毫米 CELITE® 545 助濾劑填充柱，以另外各 10 毫升之 MeOH 與 CH₂Cl₂ 溶離。使濾液濃縮成 170 毫克淡黃褐色泡沫物。添加 5 毫升 MeOH，並加熱至回流，熱過濾，且以 3 x 2 毫升溫熱 MeOH 沖洗。使濾液濃縮成粗產物 (166 毫克，0.577 毫莫耳，74%)，為淡黃色固體，將其以所獲得使用於後續步驟中。MS (ESI) 231.1 (M+1).

步驟 C. 實例 271 之製備

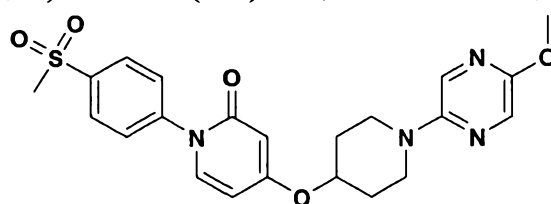
將 DMF (1 毫升) 中之 3-氟基-4-(4-羥基-2-酮基吡啶-1(2H)-基) 苯甲腈 (46.0 毫克，0.2 毫莫耳)、甲烷磺酸 1-(5-(3,3,3-三氟丙基) 嘧啶-2-基) 六氫吡啶-4-基酯 (70.7 毫克，0.200 毫莫耳) 及碳酸鉀 (36.0 毫克，0.600 毫莫耳) 於 90°C 油浴中放置 15 小時。將反應混合物添加至各 5 毫升 EtOAc 與水中。分離液層，並以 2 毫升另外之水洗滌有機層。將最初水溶液以 5 毫升 EtOAc 逆萃取，合併 EtOAc 溶液，然後以第三份水體積 (2 毫升) 洗滌。使 EtOAc 以 MgSO₄ 脫水乾燥，過濾，及濃縮成 43 毫克。使此物質藉預備之 HPLC 純化 (C18，50-90% MeOH 在含有 0.1% TFA 之水中)，獲得實例 271 (23 毫克，0.003 毫莫耳，3%)，為淡黃色泡沫物。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 2.07 (d, J=4.40 Hz,

2H) 2.11-2.28 (m, 2H) 2.31-2.54 (m, 2H) 2.86 (t, J=7.70 Hz, 2H) 3.79-4.18 (m, 4H) 4.75 (寬廣 s., 1H) 6.25 (d, J=7.70 Hz, 1H) 6.45 (寬廣 s., 1H) 7.23 (d, J=7.70 Hz, 1H) 7.48-7.70 (m, 3H) 8.49 (s, 2H). MS (ESI) 488.2 (M+1).

實例 272

4-(1-(5-甲氧基吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺酰基)

苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備

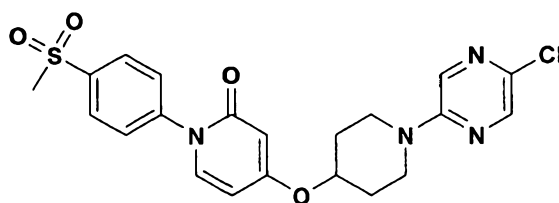


實例 272 係使用關於實例 269 所述之程序，並以 2-溴基-5-甲氧基吡啶取代 2-溴基-5-乙氧基吡啶而製成。MS (ESI) 457.3 (M+1).

實例 273

4-(1-(5-氯基吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺酰基)苯

基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽之製備

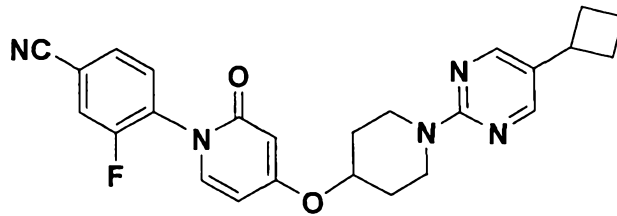


實例 273 係自用以產生實例 272 之反應混合物單離，且由於被包含在試劑 2-溴基-5-甲氧基吡啶內之不純物 2-氯基-5-甲氧基吡啶所造成。MS (ESI) 461.1 (M+1).

實例 274

4-(4-(1-(5-環丁基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶

-1(2H)-基)-3-氟基苯甲腈之製備



於 3-氟基-4-(4-羥基-2-酮基吡啶-1(2H)-基)苯甲腈 (46.0 毫克，0.2 毫莫耳)、甲磺酸 1-(5-環丁基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基酯 (62.3 毫克，0.200 毫莫耳) 及碳酸鉀 (36.0 毫克，0.600 毫莫耳) 之混合物中，添加 DMF (1 毫升)，加蓋，並在 90°C 油浴中放置 110 分鐘。將反應混合物添加至 5 毫升 EtOAc 加上 5 毫升水中，以 2 x 2 毫升 EtOAc 逆洗滌水層，然後，將已合併之 EtOAc 溶液以 2 x 2 毫升水洗滌。使 EtOAc 以 MgSO₄ 脫水乾燥，過濾，及濃縮成 71 毫克淡黃色固體。使此物質藉預備之 HPLC 純化 (C18，50-90% MeOH 在含有 0.1% TFA 之水中)，獲得實例 274 (42 毫克，0.074 毫莫耳，37%)，為灰白色泡沫物。¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.86-2.01 (m, 1H) 2.01-2.23 (m, 6H) 2.32-2.50 (m, 2H) 3.39-3.57 (m, 1H) 4.07 (寬廣 s., 3H) 4.73 (寬廣 s., 1H) 6.21 (d, J=7.70 Hz, 1H) 6.34 (寬廣 s., 1H) 7.21 (d, J=7.70 Hz, 1H) 7.48-7.69 (m, 3H) 8.45 (s, 2H). MS (ESI) 446.3 (M+1).

關於 GPR119 G 蛋白偶合受體活性之檢測

重組人類 GPR119 之活體外調制係按下述測定。

HIT-T15 cAMP 檢測

HIT-T15 大頰鼠胰島腺瘤細胞系係購自 ATCC，且在由 ATCC 所建議之培養基中生長 (意即生長培養基：F12K 培養基 (Invitrogen 21127-022；10% D-馬血清；與 2.5% FBS)。

為進行 cAMP 檢測，將表現 GPR119 受體之細胞覆蓋於 96 井

板(例如 BD Falcon: REF 353948, 黑色側面透明底部 TC 表面)上, 在密度為每井約 4.5×10^4 個細胞下, 於生長培養基中, 並培養過夜。在培養之後, 自井移除生長培養基, 接著為以得自 Hit Hunter cAMP 套件之檢測緩衝液(100 毫升/井)之單次沖洗。在沖洗之後, 將 20 毫升檢測緩衝液添加至各井中, 接著添加 10 毫升 3X 濃度之化合物工作溶液。然後, 將溶液充分混合。化合物之最後濃度範圍為約 10^{-5} M 至約 10^{-11} M。反應係在 37°C 下, 於 5% CO_2 中培養 1 小時。在培養之後, cAMP 濃度係使用 Hit Hunter cAMP 套件, 根據製造者之擬案測定。

人類 Tet-可引致之 cAMP 檢測

表現 GPR119 之細胞系係使用 Flp-In-T-REx 293 四環素可引致之基因表現系統產生, 在包含下列成份之培養物培養基中培養: DMEM#11965, 10% FBS, 2mM L-麩醯胺, 200 微克/毫升潮霉素 B 及 15 微克/毫升殺稻瘟菌素。

關於 cAMP 檢測, 係將細胞覆蓋於 96 井板(例如 BD Falcon: REF 353948, 黑色側面透明底部 TC 表面)上, 在密度為每井約 4.5×10^4 個細胞下, 於含有 1.0 微克/毫升四環素(1.0 毫克/毫升儲備液)之生長培養基中。然後, 將細胞在 37°C 下培養 48 小時。

在培養之後, 自井移除生長培養基, 並將井以被包含在 Hit Hunter cAMP 套件中之檢測緩衝液(100 毫升/井)沖洗(一次)。在洗滌之後, 將 20 毫升檢測緩衝液添加至各井中, 接著添加 10 毫升 3X 濃度之化合物工作溶液。接著, 混合溶液。化合物之最後濃度範圍為約 10^{-5} M 至約 10^{-11} M。然後,

將試劑在 37°C 下，於 5% CO₂ 中培養 1 小時。

可按照製造者之擬案以供 cAMP 測定。Hit Hunter cAMP 套件擬案係針對上述 HIT-T15 cAMP 檢測概述。

本發明之化合物係於剛才在上文所述之人類 Tet-可引致 cAMP 檢測中測試，且獲得下表 1 中所示之結果。

表 1

實例	hGPR119 EC ₅₀ (nM)
12	3489
27	3502
51	314
74	275
78	303
82	4027
83	4340
84	3274
86	3519
91	304
108	261
125	293
133	250
143	274
153	273
162	5000
165	5000
175	8
177	8
178	265
179	276
184	5000

實例	hGPR119 EC ₅₀ (nM)
189	7143
191	5088
192	241
194	5
199	7
202	2
206	293
207	7075
209	3388
224	6
227	1
229	4
239	9
243	9
261	257
263	4
265	4
267	4

蟲螢光素酶檢測

可將 HEK 293 細胞覆蓋於聚-D-離胺酸處理之 96-井 BD 黑色側面/透明底板上，在密度為約 3×10^4 個細胞/井下，於生長培養基中。生長培養基可包含下列：具有高葡萄糖與 10% 牛胎兒血清之 D-MEM (目錄#12430)。

可使細胞以包含原本或非原本 GPR119 順序之載體，使用市購可得之載體 (例如 Stratagene) 與轉移感染試劑進行轉染。可按照標準製造者擬案，以使細胞轉染。在轉染之後，可移除轉染培養基，並將檢測培養基添加至檢測板之井中。

一旦製成檢測板，即可製成化合物稀釋液板。為如此進行，製造第一個化合物稀釋液板，使用在DMSO中經稀釋至約1 mM之10 mM吾人感興趣之化合物。然後，使用自動化液體處理器，製造化合物(在DMSO中)之12點半對數稀釋液。接著，藉由使用檢測培養基，將第一個板中之井稀釋十倍(10X)，以製造第二個稀釋板。一旦完成此等板，最高劑量即為約10 μ M，而最低劑量為約0.03 nM。

一旦完成稀釋液板，吾人即可添加約10微升10X化合物稀釋液至含有檢測培養基短暫地轉染細胞之檢測板中。輕敲此板以混合試劑，並將板在37°C，95% O₂及5% CO₂下，於培養器中培養過夜。

在培養之後，可根據製造者之說明書，使用蟲螢光素酶檢測系統(例如得自Promega之Stead-Glo蟲螢光素酶檢測系統)。在完成反應之後，使用頂部計數發光計立即度量檢測之示值讀數。

老鼠口服葡萄糖容許度試驗

將24隻雄性C57BL/6J老鼠(8-10週大，平均重量28克)隨機分成每組6隻老鼠之4個組群(1隻老鼠/籠子)，以所餵食之血漿葡萄糖與體重為基礎。在起始此研究之前，使老鼠斷食過夜，且隔天早上將其稱重，並置於實驗室中。在此環境中30分鐘之後，將老鼠在-30分鐘下，經由尾尖端採血，且立即給予其第一個口服投予之媒劑(0.5% Methocel, 0.1% Tween 80在水中)或化合物溶液(5毫升/公斤)。在時間0下，將老鼠採血，並給予50%葡萄糖(2克/公斤)，以引發口服葡

萄糖容許度試驗 (oGTT)。老鼠係在葡萄糖負載後 30、60 及 120 分鐘採血。將血液試樣抽出至 EDTA 鉀中，於研究期間放置在冰上，且接著於 4°C 下，在 3000 rpm 下離心 10 分鐘。將血漿試樣稀釋 11-倍，以供在 Cobas Mira 系統 (Roche Diagnostics) 中之葡萄糖分析。曲線下方面積係計算自血漿葡萄糖時間過程數據，使用梯形體規則，以斷食血漿葡萄糖作為基線 (GraphPad Prism 軟體)。在由於不同處理作業所造成葡萄糖 AUC 上之改變之統計意義係藉由單向 ANOVA，接著為 Dunnett 試驗，使用媒劑組作為對照組測定 (JMP 軟體，5.1.2 版)。

表 2

實例	葡萄糖降低 (%)
3	-29

利用性與組合

A. 利用性

本發明化合物係具有作為 GPR119 受體之激動劑之活性，因此，可用於治療與 GPR119 受體活性有關聯之疾病。經由 GPR119 受體之活化作用，較佳可採用本發明化合物，以增加胰島素生產或增加 GLP-1 分泌或兩者。

因此，可將本發明化合物投予哺乳動物，較佳為人類，供治療多種症狀與病症，包括但不限於治療、預防或減緩糖尿病及相關症狀、與糖尿病有關聯之微血管併發症、與糖尿病有關聯之巨血管併發症、心血管疾病、代謝徵候簇及其成份症狀、炎性疾病以及其他病恙之進展。因此，咸

信本發明化合物可用於預防、抑制或治療糖尿病、高血糖、減弱之葡萄糖容許度、胰島素抗藥性、胰島素過多、視網膜病、神經病、腎病、傷口癒合、動脈粥瘤硬化及其後遺症(急性冠狀徵候簇、心肌梗塞、心绞痛、末梢血管疾病、間歇性跛行、心肌絕血、中風、心臟衰竭)、代謝徵候簇、高血壓、肥胖、脂血症障礙、血脂肪過多、血三酸甘油酯過多、高膽固醇血症、低HDL、高LDL、血管再狹窄、末梢動脈疾病、脂質病症、骨質疾病(包括骨質疏鬆症)、PCOS、HIV蛋白酶有關聯之脂肪代謝障礙、青光眼，及炎性疾病，譬如牛皮癬、風濕性關節炎及骨關節炎，以及治療與來自皮質類固醇治療之糖尿病、脂肪代謝障礙及骨質疏鬆症有關聯之副作用。

代謝徵候簇或"徵候簇X"係被描述於Ford等人, *J. Am. Med. Assoc.*, 287: 356-359 (2002)與Arbeeny等人, *Curr. Med. Chem. - Imm., Endoc & Metab. Agents*, 1: 1-24 (2001)中。

B. 組合

本發明在其範圍內係包括醫藥組合物，其包含作為活性成份之治療上有效量之至少一種式I與IA化合物，單獨或併用醫藥載劑或稀釋劑。本發明化合物可視情況單獨使用，併用其他本發明化合物，或併用一或多種其他治療劑，例如抗糖尿病劑或其他醫藥活性物質。

本發明化合物可與其他GPR119受體激動劑或一或多種其他可用於治療前文所提及病症之適當治療劑合併採用，包括：抗糖尿病劑、抗高血糖劑、抗胰島素過多劑、抗視網

膜病劑、抗神經病原性劑、抗腎病劑、抗動脈粥瘤硬化劑、抗絕血劑、抗高血壓劑、抗肥胖劑、抗脂血症障礙劑、抗血脂肪過多劑、抗血甘油三酯過多劑、抗高膽固醇血症劑、抗再狹窄劑、抗胰劑、脂質降低劑、食慾抑制劑、關於心臟衰竭之治療藥品、關於末梢動脈疾病之治療藥品及消炎劑。

與本發明化合物合併使用之適當抗糖尿病劑之實例，包括胰島素與胰島素類似物(例如 LysPro 胰島素、包含胰島素之吸入配方)；似胰高血糖素肽；磺醯基脲類與類似物(例如 氣磺丙脲、優降糖(glibenclamide)、甲苯磺丁脲、甲磺氮革脲、醋磺環己脲、葛來吡再得(glypizide)、葛來布賴得(glyburide)、葛利美皮利得(glimepiride)、瑞巴葛奈(repaglinide)、美革里汀奈(meglitinide))；雙縮脲類(例如二甲雙脲(metformin)、苯乙雙脲(phenformin)、丁二脲(buformin))； α 拮抗劑與二氫咪唑(例如米達利唑(midaglizole)、衣沙葛利啉(isaglihole)、迭里葛利啉(deriglihole)、衣達坐山(idazoxan)、約發洛山(efaroxan)、弗巴洛散(fluparoxan))；其他胰島素促分泌素(例如利諾利來得(linoglriride)、親胰島素、乙先素(exendin)-4、N,N-二甲基-N'-[2-(4-嗎福啉基)苯基]脲(E)-2-丁烯二酸鹽(BTS-675820)、(-)-N-(反式-4-異丙基環丙烷羰基)-D-苯丙胺酸(-4166))；噻唑啉二酮與 PPAR- γ 激動劑(例如西葛塔宗(ciglitazone)、皮歐葛塔宗(pioglitazone)、卓葛塔宗(troglitazone)、若西葛塔宗(rosiglitazone))；PPAR- α 激動劑，例如非諾纖酸酯(fenofibrate)、傑非布洛吉(gemfibrozil)；PPAR α/γ 雙重激動劑(例如目拉葛塔札

(muraglitazar)、佩利葛塔札 (peliglitazar)); SGLT2 抑制劑 (例如 3-(苯并 [b] 咪喃 -5-基) -2',6'-二羥基 -4'-甲基苯丙酮 -2'-O-(6-O-甲氧羰基) - β -D-呷喃葡糖苷 (T-1095 Tanabe Seiyaku)、根皮苷、TS-033 (Taisho)、達巴葛弗吡 (dapagliflozin)(BMS)、色吉弗吡 (sergiflozin) (Kissei)、AVE 2268 (Sanofi-Aventis)); 11- β -羥基類固醇脫氫酶類型 I 抑制劑 (例如 AMG221, INCB13739); 二肽基肽酶 -IV (DPP4) 抑制劑 (例如沙克沙葛菌素 (saxagliptin)、西塔葛菌素 (sitagliptin)、威達葛菌素 (vildagliptin) 及登那葛菌素 (denagliptin)); 似胰高血糖素肽 -1 (GLP-1) 受體激動劑 (例如約辛那太得 (Exenatide) (Byetta™)、NN2211 (利拉葡肽 (Liraglutide), Novo Nordisk)、AVE0010 (Sanofi-Aventis)、R1583 (Roche/Ipsen)、SUN E7001 (Daiichi/Santory)、GSK-716155 (GSK/人類基因組科學) 及乙先素 (Exendin)-4 (PC-DACTM)); 醛糖還原酶抑制劑 (例如在 WO 99/26659 中所揭示者); RXR 激動劑 (例如瑞葛提札 (reglitazar) (JTT-501)、5-[[6-[(2-氟苯基)甲氧基]-2-萘基]甲基]-2,4-噻唑啉二酮 (MCC-555)、5-[[3-(5,6,7,8-四氫 -3,5,5,8,8-五甲基 -2-萘基)-4-(三氟甲氧基)苯基]亞甲基]-2,4-噻唑啉二酮 (MX-6054)、DRF2593、發葛利塔札 (farglitazar)、(+)-5-[(2,4-二氧噻唑啉 -5-基)甲基]-2-甲氧基 -N-[[4-(三氟甲基)苯基]甲基]苯甲醯胺 (KRP-297)、6-[1-(5,6,7,8-四氫 -3,5,5,8,8-五甲基 -2-萘基)環丙基]-3-吡啶羧酸 (LG100268)); 脂肪酸氧化作用抑制劑 (例如可洛莫捨 (clomoxir)、約托莫捨 (etomoxir)); α -葡萄糖苷酶抑制劑: 普瑞可糖 (precose)、阿卡糖 (acarbose)、米葛利妥 (miglitol)、約米葛利特 (emiglitate)、沃葛利糖 (voglibose)、2,6-二去氧 -2,6-亞胺基 -7-O- β -D-呷喃葡糖基 -D-

甘油基-L-古洛-庚糖醇(MDL-25,637)、卡蜜葛利糖(camiglibose));
 β -激動劑(例如甲酯[4-[(2R)-2-[[[(2R)-2-(3-氯苯基)-2-羥乙基]胺基]丙基]苯氧基]-醋酸(BRL 35135)、2-[4-[(2S)-2-[[[(2S)-2-(3-氯苯基)-2-羥乙基]胺基]丙基]苯氧基]-醋酸(BRL 37344)、
4-[(3R)-3-[雙[(2R)-2-羥基-2-苯基乙基]胺基]丁基]-苯甲醯胺(Ro 16-8714)、2-[4-[2-[[[(2S)-2-羥基-3-苯氧基丙基]胺基]乙氧基]苯氧基]-N-(2-甲氧基乙基)-乙醯胺(ICI D7114)、5-[(2R)-2-[[[(2R)-2-(3-氯苯基)-2-羥乙基]胺基]丙基]-3-苯并二氧伍園烯-2,2-二羧酸二鈉鹽(CL 316,243)、TAK-667、AZ40140); 磷酸二酯酶抑制劑, cAMP與cGMP類型兩者(例如席墊那費(sildenafil)、9-((1S,2R)-2-氟基-1-甲基丙基)-2-甲氧基-6-(1-六氫吡咩基)嘌呤鹽酸鹽(L-686398)、L-386,398); 糊精激動劑(例如普拉林太(pramlintide)); 脂肪氧化酶抑制劑(例如馬索普洛卡(masoprocal)); 生長激素釋放抑制因子類似物(例如蘭瑞歐太得(lanreotide)、謝葛利太(seglitide)、八瑞歐肽(octreotide)); 胰高血糖素拮抗劑(例如BAY 276-9955); 胰島素發出訊息激動劑、胰島素擬似物、PTP1B抑制劑(例如2-[2-(1,1-二甲基-2-丙烯基)-1H-吡啶-3-基]-3,6-二羥基-5-[7-(3-甲基-2-丁烯基)-1H-吡啶-3-基]-2,5-環己二烯-1,4-二酮(L-783281)、TER17411、TER17529); 糖生成作用抑制劑(例如GP3034); 生長激素釋放抑制因子類似物與拮抗劑; 抗脂肪分解劑(例如菸鹼酸、阿西皮莫克斯(acipimox)、N-環己基-2'-O-甲基-腺苷(WAG 994)); 葡萄糖輸送刺激劑(例如4-氯- α -[(4-甲基苯基)磺醯基]-苯庚酸(BM-130795)); 葡萄糖合成酶激酶抑制劑(例如氯化鋰、CT98014、CT98023); 高良薑黃素受體激動

劑；化學細胞活素受體拮抗劑 CCR2/5 (例如 NCB3284、MK-0812、INCB8696、瑪拉維洛 (maraviroc)(Pfizer) 及維利維洛 (vicriviroc))；甲狀腺受體激動劑(例如 KB-2115 (KaroBio))；葡萄糖激酶活化劑(例如 RO-27-4375、RO-28-1675 (Roche)、6-[[3-[(1S)-2-甲氧基-1-甲基乙氧基]-5-[(1S)-1-甲基-2-苯基乙氧基]苯甲醯基]胺基]-3-吡啶羧酸(GKA-50 AstraZeneca))；GPR119 激動劑(例如 1,1-二甲基乙酯 4-[[3-(4-吡啶基)-1,2,4-噁二唑-5-基]甲氧基]-1-六氫吡啶羧酸(PSN-632408 OSI Prosidion))；GDIR 激動劑(例如 APD668 (Arena))；GPR40 調劑劑(例如 (S)-4-(二甲胺基)-3-(4-((4-甲基-2-對-甲苯基噻唑-5-基)甲氧基)苯基)-4-酮基丁酸、6-氯基-2-(4-氯苄基硫基)-1-(4-(甲氧基甲氧基)苯基)-1H-苯并[d]咪唑)。

與本發明化合物合併使用之適當脂質降低劑與抗動脈粥瘤硬化劑之實例，包括一或多種MTP/ApoB分泌抑制劑(例如得洛巴肽 (dirlopatide)、N-(2,2,2-三氟乙基)-9-[4-[4-[[[4'-(三氟甲基)[1,1'-聯苯基]-2-基]羰基]-胺基]-1-六氫吡啶基]丁基]-9H-第-9-羧醯胺甲烷磺酸鹽、CP-741952 (Pfizer)、SLx-4090 (Surface Logix))；HMG CoA 還原酶抑制劑(例如阿托瓦制菌素 (atorvastatin)、洛蘇伐制菌素 (rosuvastatin)、辛伐制菌素 (simvastatin)、普拉伐制菌素 (pravastatin)、洛伐制菌素 (lovastatin)、弗伐制菌素 (fluvastatin))；角鯊烯合成酶抑制劑、PPAR α 激動劑及纖維酸衍生物(例如非諾纖酸酯 (fenofibrate)、傑非布洛吉 (gemfibrozil))；ACAT 抑制劑；脂肪氧化酶抑制劑；膽固醇吸收抑制劑(例如也吉提麥伯

(ezetimibe)); 甲狀腺受體激動劑(例如, 如上文所提出者); 迴腸Na⁺/膽汁酸共輸送子抑制劑(例如, 如在未來藥物, 24: 425-430 (1999)中所揭示之化合物; LDL受體活性之向上調節劑(例如(3R)-3-[(13R)-13-羥基-10-酮基十四基]-5,7-二甲氧基-1(3H)-異苯并呋喃酮(Taisho 醫藥公司)與(3 α ,4 α ,5 α)-4-(2-丙烯基)-膽基-3-醇(Eli Lilly); 膽汁酸多價螯合劑(例如WELCHOL[®]、COLESTID[®]、LOCHOLEST[®]及QUESTRAN[®]; 及纖維酸衍生物, 譬如ATROMID[®]、LOPID[®]及TRICOT[®]); 膽固醇酯轉移蛋白質抑制劑(例如妥西卓比(torcetrapib)與(2R)-3-{[3-(4-氯基-3-乙基-苯氧基)-苯基]-[[3-(1,1,2,2-四氟基乙氧基)苯基]甲基]胺基}-1,1,1-三氟-2-丙醇); 菸鹼酸及其衍生物(例如尼克酸、阿西皮莫克斯(acipimox)); PCSK9抑制劑; LXR激動劑(例如在美國專利申請案公報2003/01814206、2005/0080111及2005/0245515中所揭示者); 脂肪氧化酶抑制劑(例如苯并咪唑衍生物, 如在WO 97/12615中所揭示, 15-LO抑制劑, 如在WO 97/12613中所揭示, 異噻唑酮, 如在WO 96/38144中所揭示, 及15-LO抑制劑, 如由Sendobry等人, "在兔子中飲食引致之動脈粥瘤硬化以缺乏顯著抗氧化性質之高度選擇性15-脂肪氧化酶抑制劑之減弱", *Brit. J. Pharmacology*, 120: 1199-1206 (1997)與Cornicelli等人, "15-脂肪氧化酶及其抑制: 關於血管疾病之新穎治療標的", *現行醫藥設計*, 5: 11-20 (1999))所揭示。

較佳血脂肪過少劑為普拉伐制菌素(pravastatin)、洛伐制菌素(lovastatin)、辛伐制菌素(simvastatin)、阿托瓦制菌素(atorvastatin)、弗伐制菌素(fluvastatin)、些利伐制菌素(cerivastatin)

、阿他伐制菌素 (atavastatin) 及洛蘇伐制菌素 (rosuvastatin)。

與本發明化合物合併使用之適當抗高血壓劑之實例，包括 β 腎上腺素能阻斷劑、鈣通道阻斷劑 (L-型與 T-型；例如迪耳替阿簡 (diltiazem)、異博停 (verapamil)、硝苯吡啶 (nifedipine)、胺若地平 (amlodipine) 及麥貝弗拉迪 (mybefradil))、利尿劑 (例如氣噻吡、氫氣噻吡、氣甲噻吡、氫氣甲噻吡、苜氣甲噻吡、甲基氣噻吡、三氣甲噻吡、多噻吡、苜噻吡、利尿酸三可利那吩 (tricrynafen)、氣噻酮、利尿磺胺、目索里敏 (musolimine)、丁苯氧酸 (bumetanide)、三安催寧 (triamtrenene)、胺氣吡咪、螺甾內酯)、腎造素抑制劑 (例如阿利吉倫 (aliskiren))、ACE 抑制劑 (例如卡普脫普利 (captopril)、坐非諾普利 (zofenopril)、弗新諾普利 (fosinopril)、安那拉普利 (enalapril)、謝拉諾普利 (ceranopril)、西拉坐普利 (cilazopril)、迪拉普利 (delapril)、片投普利 (pentopril)、奎那普利 (quinapril)、瑞米普利 (ramipril)、利辛諾普利 (lisinopril))、AT-1 受體拮抗劑 (例如若沙坦 (losartan)、愛貝沙坦 (irbesartan)、法沙坦 (valsartan))、ET 受體拮抗劑 (例如西塔仙坦 (sitaxsentan)、阿特仙坦 (atrsentan) 及揭示於美國專利案號 5,612,359 與 6,043,265 中之化合物)、雙重 ET/AII 拮抗劑 (例如揭示於 WO 00/01389 中之化合物)、中性內肽酶 (NEP) 抑制劑、血管肽酶抑制劑 (雙 NEP-ACE 抑制劑) (例如歐馬巴列特 (omapatrilat) 與吉莫巴列特 (gemopatrilat))、硝酸鹽、中樞 α 激動劑 (例如可樂寧 (clonidine))、 α 阻斷劑 (例如哌唑吡 (prazosin))、動脈血管擴張劑 (例如明諾西迪 (minoxidil))、抑交感劑 (例如瑞斯伯林 (resperine))、腎造素抑制劑 (例如

阿利吉倫 (Aliskiren)(Novartis)。

與本發明化合物合併使用之適當抗肥胖劑之實例，包括類大麻苷受體 1 拮抗劑或逆激動劑 (例如利夢那班 (rimonabant)、(4S)-3-(4-氯苯基)-N-[(4-氯苯基)磺醯基]-4,5-二氫-N'-甲基-4-苯基-1H-吡唑-1-羧醯亞胺鹽 (SLV 319)、CP-945598 (Pfizer)、速利那班 (Surinabant)(SR-147778、Sanofi-Aventis)、N-[(1S,2S)-3-(4-氯苯基)-2-(3-氰基苯基)-1-甲基丙基]-2-甲基-2-{{[5-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基}丙醯胺 (Merck) 及在 Hertzog, D.L., **Expert Opin. Ther. Patents**, 14: 1435-1452 (2004) 中所討論者); β 腎上腺素能激動劑 (例如拉發貝隆 (rafabegron)(AJ9677, Takeda/Dainippon)、N-[4-[2-[[[(2S)-3-[(6-胺基-3-吡啶基)氧基]-2-羥丙基]胺基]乙基]苯基]-4-(1-甲基乙基)-苯磺醯胺 (L750355, Merck) 或 CP331648 (Pfizer)，或其他已知 β 激動劑，如在美國專利案號 5,541,204、5,770,615、5,491,134、5,776,983 及 5,488,064 中所揭示者，其中拉發貝隆 (rafabegron)、N-[4-[2-[[[(2S)-3-[(6-胺基-3-吡啶基)氧基]-2-羥丙基]胺基]乙基]苯基]-4-(1-甲基乙基)-苯磺醯胺及 CP331648 為較佳); 脂肪酶抑制劑 (例如奧麗斯特 (orlistat) 或些替麗斯特 (cetilistat)，其中奧麗斯特 (orlistat) 為較佳); 血清素與正腎上腺素再攝取抑制劑 (例如希布拉胺 (sibutramine)、Abbott 及提索吩辛 (tesofensine), Neurosearch)，其中希布拉胺 (sibutramine) 為較佳; 多巴胺再攝取抑制劑 (例如布若普利翁 (bupropion), GSK); 或 5-HT_{2C} 激動劑 (例如洛卡色林 (lorcaserin) 鹽酸鹽 (Arena)、WAY-163909 [(7bR,10aR)-1,2,3,4,8,9,10,10a-八氫-7bH-環戊-[b][1,4]二氮七園并[6,7,1hi]吡啶])：其中洛卡色林

(lorcaserin) 鹽酸鹽為較佳)；5-HT6 受體拮抗劑 (Suven, Biovitrum, Epix)、抗癲癇劑托皮拉美 (topiramate) (Johnson & Johnson) 與坐尼斯醯胺 (zonisamide)、睫狀神經營養因子激動劑 (例如約克索活素 (axokine) (Regeneron)；腦部衍生之神經營養因子 (BDNF)、奧瑞辛 (orexin) 拮抗劑、組織胺受體-3 (H3) 調劑劑、黑色素聚集激素受體 (MCHR) 拮抗劑 (例如 GSK-856464 (GlaxoSmithKline)、T-0910792 (Amgen))；二醯基甘油醯基轉移酶 (DGAT) 抑制劑 (例如 BAY-74-4113 (Bayer))；乙醯基-CoA 羧化酶 (ACC) 抑制劑 (例如 N-(4-(4-(4-異丙氧基苯氧基)苯基)丁-3-炔-2-基)乙醯胺 (A-80040, Abbott)、(R)-蔥-9-基(3-(嗎福啉-4-羰基)-1,4'-雙六氫吡啶-1'-基)甲酮 (CP-640186, Pfizer))，SCD-1 抑制劑，如由 Jiang 等人，糖尿病 (2004) 53, (abs 653-p) 所述；糊精受體激動劑 (例如揭示於 WO 2005/025504 中之化合物)；甲狀腺受體激動劑 (例如，如上文所提出)；生長激素促分泌素受體 (GHSR) 拮抗劑 (例如 A-778193 (Abbott)、勒帕茄鹼與勒帕茄鹼擬似物 (例如 OB-3 (Aegis/腦白質醫學院)、勒帕茄鹼類似物 A-100 與 A-200 (Amgen)、CBT-001452 (Cambridge 生物技術)、ML-22952 (Millennium))、PYY 受體激動劑 (例如 AC-162352 (Amylin)、PYY-3-36 (Emisphere)、PYY(3-36)NH₂ (Unigene))、NPY-Y4 激動劑 (7TM Pharma WO 2005/089786(A₂,A₃)-1)、NPY-5 拮抗劑 (例如 NPY5RA-972 (AstraZeneca)、GW-594884A (GlaxoSmithKline)、J-104870 (Banyu))；MTP/apoB 分泌抑制劑 (如上文所提出) 及 / 或減食慾劑。

可視情況與本發明化合物合併採用之減食慾劑，包括右旋安非他命、吩特明 (phentermine)、苯丙醇胺或氯苯咪唑

(mazindol)，其中右旋安非他命為較佳。

可與本發明化合物合併使用之其他化合物，包括CCK受體激動劑(例如SR-27895B)；高良薑黃素受體拮抗劑；MCR-4拮抗劑(例如N-乙醯基-L-正白胺醯基-L-麩醯胺醯基-L-組胺醯基-D-苯丙胺醯基-L-精胺醯基D-色胺醯基-甘胺醯胺、(HP-228)；尿可體素擬似物、CRF拮抗劑及CRF結合蛋白質(例如米非普利史東(mifepristone)(RU-486)、尿可體素)。

再者，本發明化合物可與HIV蛋白酶抑制劑合併使用，包括但不限於Reyataz[®]與Kaletra[®]。

與本發明化合物合併使用之適當記憶增強劑、抗癡呆症劑或認知力促進劑之實例，包括但不限於阿利謝普特(aricept)、瑞札定(razadyne)、多臬佩吉(donepezil)、利發史替明(rivastigmine)、雪花蓮胺、美漫汀(memantine)、塔克林(tacrine)、美三風特(metrifonate)、蠅蕈鹼、詹諾美林(xanomelline)、地普瑞尼(deprenyl)及毒扁豆鹼。

與本發明化合物合併使用之適當消炎劑之實例，包括但不限於NSAIDS、潑尼松、乙醯胺吩(acetaminophen)、阿斯匹靈、可待因、芬太尼(fentanyl)、異丁苯丙酸(ibuprofen)、吲哚美薩辛(indomethacin)、酮洛拉克(ketorolac)、嗎啡、那丙新(naproxen)、非那西汀(phenacetin)、吡氧胺(piroxicam)、磺非塔尼(sufentanyl)、山林達克(sunlindac)、干擾素 α 、氫化潑尼松、甲基氫化潑尼松、去氧甲脞(dexamethazone)、弗卡替松(flucatisone)、 β -美塞松、氫基可體松、貝可美塞松(beclomethasone)、瑞米卡得(remicade)、歐倫西亞(orencia)及恩

布瑞爾 (enbrel)。

前述專利與專利申請案均併於本文供參考。

上述其他治療劑，當與本發明化合物合併採用時，可例如以醫師之桌上參考資料 (Physicians' Desk Reference) 中所指示之量使用，如在上文所提出之專利中者，或如一般熟諳此藝者以其他方式所測得者。

式 I 與 IA 化合物可藉任何適當方式投藥，以供任何本文中所述之用途使用，例如口服，譬如呈片劑、膠囊、顆粒或粉末形式；舌下方式；面頰方式；非經腸方式，譬如藉由皮下、靜脈內、肌內或腦池內注射或灌注技術 (例如作成無菌可注射水性或非水性溶液或懸浮液)；經鼻方式，包括對鼻膜投藥，譬如藉由吸入噴霧；局部方式，譬如呈乳膏或軟膏形式；或直腸方式，譬如呈栓劑形式；在含有無毒性藥學上可接受之媒劑或稀釋劑之劑量單位配方中。

在進行本發明之方法以治療糖尿病及相關疾病上，將採用含有式 I 及 / 或 IA 化合物之醫藥組合物，使用或未使用其他抗糖尿病劑及 / 或抗高血脂劑及 / 或其他類型治療劑，伴隨著醫藥媒劑或稀釋劑。醫藥組合物可經調配，採用對所要之投藥模式為適當類型之習用固體或液體媒劑或稀釋劑及醫藥添加劑，譬如藥學上可接受之載劑、賦形劑、黏合劑等。化合物可藉口服途徑投予哺乳動物病患，包括人類、猴子、狗等，例如呈片劑、膠囊、珠粒、顆粒或粉末之形式。對於成人之劑量，較佳係在每天 1 與 2,000 毫克之間，其可在單一劑量中或以個別劑量形式，每天投予 1-4 次。

供口服投藥之典型膠囊，係含有式 I 及 / 或 IA 之化合物 (250 毫克)、乳糖 (75 毫克) 及硬脂酸鎂 (15 毫克)。使混合物通過 60 網目篩網，且包裝至編號 1 明膠膠囊中。

典型可注射製劑係經由以無菌方式將 250 毫克之式 I 及 / 或 IA 化合物放置在小玻璃瓶中，以無菌方式冷凍乾燥與密封而製成。關於使用，係將小玻璃瓶之內容物與 2 毫升生理食鹽水混合，以製造可注射製劑。

五、中文發明摘要：

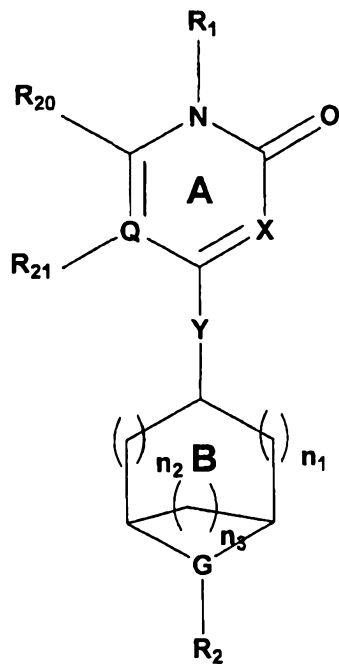
本發明係提供新穎化合物，其係為 GPR119 G 蛋白偶合受體調劑。GPR119 G 蛋白偶合受體調劑可用於治療、預防或減緩需要 GPR119 G 蛋白偶合受體調劑療法之疾病之進展。此等新穎化合物具有結構式 I 或式 IA。

六、英文發明摘要：

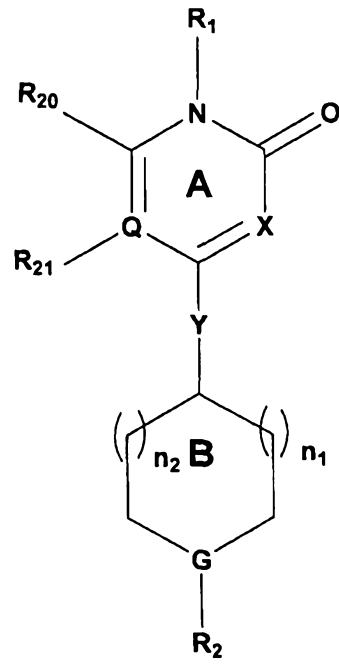
Novel compounds are provided which are GPR119 G protein-coupled receptor modulators. GPR119 G protein-coupled receptor modulators are useful in treating, preventing, or slowing the progression of diseases requiring GPR119 G protein-coupled receptor modulator therapy. These novel compounds have the structure Formula I or Formula IA.

十、申請專利範圍：

1. 一種化合物，其係選自式I與式IA化合物：



式 I



式 IA

及其對掌異構物、非對映異構物、溶劑合物及藥學上可接受之鹽，具有環A與環B，其中：

環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C或N；

X為CH或N，其條件是，Q與X不皆為N；

Y為 CH_2 、 $N(R_3)$ 、 $C(=O)$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $S(=O)$ 或 $S(O)_2$ ；

n_1 為0-2；

n_2 為0-2；

n_3 為1-2；

R_1 為6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、

-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、
-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、
-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其
中烷基、烯基、炔基、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各視情況被0-5個
R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、
烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-NH₂、
-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、
-SH、-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、
-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、
-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、
-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、
-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、
=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、
芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個
R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜
環基、雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、
-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、
-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、

-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₄、
-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、
-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄
、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、
-NR₁₄C(=O)OR₁₄及-NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、
芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、
雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜
環基、雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、
-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、
-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₀、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₀、
-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、
-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄
、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、
-NR₁₄S(O₂)R₈、=O及芳烷基；

R₁₀在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷
基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基
烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、
雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R_{10a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯

基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、

環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

2. 如請求項1之化合物，其係選自包括式I與IA化合物，其中：

環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C或N；

X為CH或N，其條件是，Q與X不皆為N；

Y為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為0-2；

n_2 為0-2；

n_3 為1-2；

R_1 為苯基、吡啶基、吡嗪基或嘓啶基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、

-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、
-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₁、-S(O)₂R₁₁、
-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中：(a)烯基、炔基、環烷
基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個R₆取代；與(b)
烷基可視情況被一或多個R₇取代；

R₂為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、-S(O)₂R₅、
-C(=O)NR₃R₅、-C(=O)R₅或-C(=O)OR₅，其中環烷基、芳基、雜
芳基及雜環基可各視情況被一或多個R₆取代；

R₃為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳
基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R₅為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其
每一個可視情況被一或多個R₆取代；

R₆在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、
-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、
-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、
-OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、
-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其
中烷基、烯基、炔基、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各視情況被0-5個
R_{9a}取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $=O$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 及 $-NR_{14}S(O_2)R_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、

芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ 、 $=O$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、

-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、
-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、
-NR₁₄S(O₂)R₈及芳烷基；

R₁₁在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{11a}取代；

R_{11a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈及芳烷基；

R₁₂在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R₁₄在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R₂₀與R₂₁各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、

$-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

3. 如請求項 1 之化合物，其係選自包括式 I 與 IA 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C 或 N；

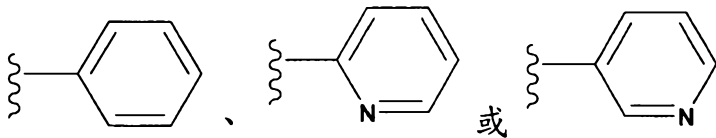
X 為 CH 或 N，其條件是，Q 與 X 不皆為 N；

Y 為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為 0-2；

n_2 為 0-2；

n_3 為 1-2；

R_1 為 ，其每一個可

視情況被一或多個選自包括 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b)

烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-S(O)_2 R_5$ 、 $-C(=O)NR_3 R_5$ 、 $-C(=O)R_5$ 或 $-C(=O)OR_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3 H$ 、 $-P(O)_3 H_2$ 、 $-C(=O)NR_9 R_9$ 、 $-NR_9 R_9$ 、 $-S(O)_2 NR_9 R_9$ 、 $-NR_9 S(O)_2 CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9 S(O)_2 R_9$ 、 $-S(O)_2 NR_9 C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2 NR_9 C(=O)NR_9 R_9$ 、 $-C(=O)NR_9 S(O)_2 CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9 C(=O)H$ 、 $-NR_9 C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9 R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14} R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2 R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9 C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9 S(O)_2 R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3 H$ 、 $-P(O)_3 H_2$ 、 $-C(=O)NR_9 R_9$ 、 $-NR_9 R_9$ 、

$-\text{S}(\text{O})_2 \text{NR}_9 \text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9 \text{S}(\text{O})_2 \text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9 \text{S}(\text{O})_2 \text{R}_9$ 、
 $-\text{S}(\text{O})_2 \text{NR}_9 \text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2 \text{NR}_9 \text{C}(=\text{O})\text{NR}_9 \text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9 \text{S}(\text{O})_2 \text{CF}_3$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9 \text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9 \text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、
 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9 \text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14} \text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2 \text{R}_{10}$ 、
 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9 \text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9 \text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、
 芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個
 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
 雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
 基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜
 環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、
 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3 \text{H}$ 、
 $-\text{P}(\text{O})_3 \text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14} \text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14} \text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2 \text{NR}_{14} \text{R}_{14}$ 、
 $-\text{NR}_{14} \text{S}(\text{O})_2 \text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14} \text{S}(\text{O})_2 \text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2 \text{NR}_{14} \text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、
 $-\text{S}(\text{O})_2 \text{NR}_{14} \text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14} \text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14} \text{S}(\text{O})_2 \text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、
 $-\text{NR}_{14} \text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14} \text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14} \text{R}_{14}$
 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14} \text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2 \text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、
 $-\text{NR}_{14} \text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14} \text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、
 芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
 其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、
 雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯

基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷

基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 及 $-OC(=O)R_{10}$ 。

4. 如請求項 1 之化合物，其係選自包括式 I 與 IA 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C 或 N；

X 為 CH 或 N，其條件是，Q 與 X 不皆為 N；

Y 為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(\text{=O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(\text{=O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為 0-2；

n_2 為 0-2；

n_3 為 1-2；

R_1 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(\text{=NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(\text{=NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_5$ ，其中芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳

基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、

芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $=O$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 及 $-NR_{14}S(O)_2R_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、

-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、
-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、
-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、
-NR₁₄S(O₂)R₈、=O 及 芳烷基；

R₁₀在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、
-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、
-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₉、
-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、
-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、
-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、
-NR₁₄S(O₂)R₈ 及 芳烷基；

R₁₁在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜

環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

5. 如請求項1之化合物，其係選自包括式I與IA化合物，其中：

環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C或N；

X為CH或N，其條件是，Q與X不皆為N；

Y為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為0-2；

n_2 為0-2；

n_3 為 1-2 ;

R_1 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、

-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、
 -C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
 -C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、
 -C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、
 -OC(=O)R₁₀、-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、
 -S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其
 中烷基、烯基、炔基、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各視情況被0-5個
 R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、
 烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-NH₂、
 -CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、
 -SH、-SR₁₀、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、
 -S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、
 -S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、
 -C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、
 -C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、
 =O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、
 芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個
 R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
 雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
 基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜

環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基

烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$

、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R_{20} 與 R_{21} 各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

6. 如請求項1之化合物，其係選自包括式I與式IA化合物，其中：

環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C或N；

X為CH或N，其條件是，Q與X不皆為N；

Y為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為0-2；

n_2 為0-2；

n_3 為1-2；

R_1 為6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、

炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與(b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基，其可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被0-5個

R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $=O$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 及 $-NR_{14}S(O_2)R_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ 、 $=O$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、

-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、
 -NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄
 、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、
 -NR₁₄S(O₂)R₈及芳烷基；

R₁₁在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{11a}取代；

R_{11a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈及芳烷基；

R₁₂在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R₁₄在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；且

R₂₀與R₂₁各獨立選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、

鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

7. 如請求項1之化合物，其係選自式IA化合物，其中：

環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C；

X為CH；

Y為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(=\text{O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為0-2；

n_2 為0-2；

R_1 為6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與(b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-S(O)_2R_5$ 、 $-C(=O)NR_3R_5$ 、 $-C(=O)R_5$ 或 $-C(=O)OR_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O)_2R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、

-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、
-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、
-C(=NR₁₄)NR₉R₉、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、
=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、
芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個
R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜
環基、雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、
-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、
-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₄、
-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、
-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄
、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、
-NR₁₄C(=O)OR₁₄及-NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、
芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、
雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜

環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 、 $=\text{O}$ 及芳烷基；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、

芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 及 $-OC(=O)R_{10}$ 。

8. 如請求項 1 之化合物，其係選自式 I 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 CH_2 、 $\text{N}(\text{R}_3)$ 、 $\text{C}(\text{=O})$ 、O、 OCR_9R_9 、S、 $\text{S}(\text{=O})$ 或 $\text{S}(\text{O})_2$ ；

n_1 為 0-2；

n_2 為 0-2；

n_3 為 2；

R_1 為 6-員單環狀芳基、5-員單環狀雜芳基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(\text{=NR}_{14})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NHC}(\text{=NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為環烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_3\text{R}_5$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_5$ 或 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_5$ ，其中環烷基、芳基、雜芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_3 為氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳

基、雜芳烷基、雜環基或雜環基烷基；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_9R_9$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、

芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-C(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-NHC(=NR_{14})NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $=O$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 及 $-NR_{14}S(O)_2R_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-S(O)_3H$ 、 $-P(O)_3H_2$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、

-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、
-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、
-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、
-NR₁₄S(O₂)R₈、=O 及 芳烷基；

R₁₀在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、
-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-S(O)₃H、
-P(O)₃H₂、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₉、
-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、
-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、
-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、
-NR₁₄S(O₂)R₈ 及 芳烷基；

R₁₁在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜

環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(\text{O})_3\text{H}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{NR}_{14})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及芳烷基；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

9. 如請求項1之化合物，其係選自式IA化合物，其中：

環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為CH或N；

Q為C；

X為CH；

Y為O、 OCR_9R_9 或S；

n_1 為1；

n_2 為 1；

R_1 為苯基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} , R_{1b} , R_{1c} , R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} , R_{1b} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、

-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀
、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、
烯基、炔基、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各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、
烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-CN、
-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、
-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、
-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、
-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、
環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
-NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、
芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、
雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ 及 $=\text{O}$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及

$-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$;

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

10. 如請求項 1 之化合物，其係選自式 I 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 CH 或 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 O、 OCR_9R_9 或 S；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

n_3 為 2；

R_1 為苯基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、

-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、
-S(=O)R₁₁、-S(O)₂R₁₁、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中：
(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個R₆取代；與
(b) 烷基可視情況被一或多個R₇取代；

R_{1c}係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、
雜環基、鹵基、-CN、-OCF₃、-OR₁₁、-OH、-SR₁₁、-C(=O)NR₉R₉、
-NR₁₂R₁₂、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₁、
-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、
-S(=O)R₁₁、-S(O)₂R₁₁、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中：
(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或
多個R₆取代；與(b) 烷基可視情況被一或多個R₇取代；

R₂為雜芳基或-C(=O)OR₅，其中雜芳基可視情況被一或多
個R₆取代；

R₅為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其
每一個可視情況被一或多個R₆取代；

R₆在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、
炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、
雜環基烷基、鹵基、-CN、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、
-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、
-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀
、-S(O)₂R₁₀、=O、-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、
烯基、炔基、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各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₇在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、

烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、-CN、
 -C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、
 -NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、
 -NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、
 -NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O₂)R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、
 環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基、芳基、環烷基、
 雜芳基及雜環基，其每一個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
 基、炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
 -OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
 -NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
 -OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
 -NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烷氧基、環烷基、
 芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，
 其中烷基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、
 雜環基及雜環基烷基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
 基、炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
 -OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
 -NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
 -OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈
 及=O；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 及 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 及 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基，其中環烷基、芳基、芳烷基、雜環基及雜環基烷基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-C(=O)NR₉R₉、-C(=O)R₁₀ 及 -OC(=O)R₁₀。

11. 如請求項 1 之化合物，其係選自式 IA 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 N；

Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 O；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

R_1 為苯基或 6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、-CN、-OCF₃、-OR₁₁、-OH、-C(=O)NR₉R₉、-NR₁₂R₁₂、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₁、-NR₉C(=O)H、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₉R₉、-S(=O)R₁₁、-S(O)₂R₁₁、-NR₉C(=O)OR₈ 及 -NR₉S(O)₂R₈，其中：
(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與
(b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、-CN、-OCF₃、-OR₁₁、-OH、-SR₁₁、-C(=O)NR₉R₉、-NR₁₂R₁₂、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₁、-NR₉C(=O)H

、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與(b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一

個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $=O$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 及 $-NR_{14}S(O_2)R_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ 及 $=O$ ；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 及 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 及 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 。

12. 如請求項1之化合物，其係選自式I化合物，其中：

環A係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之R取代；

G為N；

Q為C；

X為CH；

Y為O；

n_1 為1；

n_2 為1；

n_3 為2；

R_1 為苯基或6-員單環狀雜芳基，其每一個可視情況被一或多個選自 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 之成員取代；

R_{1a} , R_{1b} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：
 (a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與
 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為雜芳基或 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_5$ ，其中雜芳基可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、烯基、芳基、環烷基、雜芳基或雜環基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、

烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_{14}$ ；

R_9 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_{9a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$

及 =O；

R_{10} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{10a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 及 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被 0-3 個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)H$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 及 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、環烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 及 $-OC(=O)R_{10}$ 。

13. 如請求項 1 之化合物，其係選自式 IA 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 N；

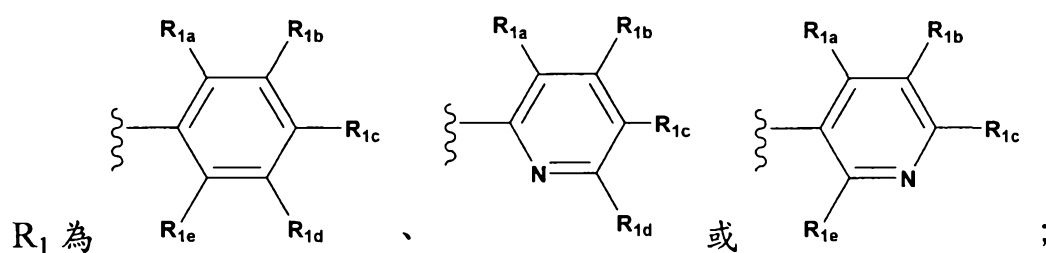
Q 為 C；

X 為 CH；

Y 為 O；

n_1 為 1；

n_2 為 1；



R_{1a} , R_{1b} , R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：
 (a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與
 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為吡啶基、嘧啶基或 $-C(=O)OR_5$ ，其中吡啶基與嘧啶基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、芳基或環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-CN$ 、 $-C(=O)OR_{10}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{10}$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-NR_9C(=O)H$ 、 $-NR_9C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)R_{10}$ 、 $-S(=O)R_{10}$ 、 $-S(O)_2R_{10}$ 、 $=O$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 及 $-NR_9S(O_2)R_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_8 在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_{8a} 取代；

R_{8a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、

-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
-NR₁₄S(O₂)R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，
其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈
及=O；

R₁₀在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其
可各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R_{10a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、
-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃
、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、
-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈及-NR₁₄S(O₂)R₈；

R₁₁在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其
可各視情況被0-3個R_{11a}取代；

R_{11a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯
基、炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、

$-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、
 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及
 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，
 其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被 0-3 個 R_{10a} 取代；

R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

R_{20} 為氫；且

R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、鹵基及 $-\text{CN}$ 。

14. 如請求項 1 之化合物，其係選自式 I 化合物，其中：

環 A 係視情況被一或多個以 R_{20} 與 R_{21} 顯示之 R 取代；

G 為 N；

Q 為 C；

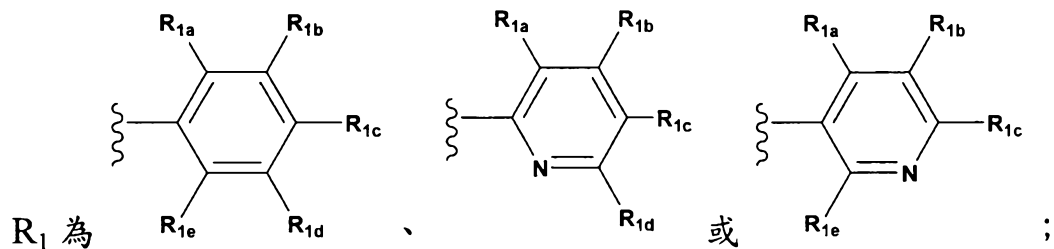
X 為 CH；

Y 為 O；

n_1 為 1；

n_2 為 1；

n_3 為 2；



R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1d} 及 R_{1e} 各獨立選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、
 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、
 $-\text{NR}_9\text{C}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{11}$ 、

$-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基及環烷基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_{1c} 係選自包括氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{11}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SR}_{11}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{12}\text{R}_{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{11}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中：(a) 烯基、炔基、環烷基、芳基及雜環基可各視情況被一或多個 R_6 取代；與 (b) 烷基可視情況被一或多個 R_7 取代；

R_2 為吡啶基、嘧啶基或 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_5$ ，其中吡啶基與嘧啶基可各視情況被一或多個 R_6 取代；

R_5 為烷基、芳基或環烷基，其每一個可視情況被一或多個 R_6 取代；

R_6 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜芳基、雜芳烷基、雜環基、雜環基烷基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}_{10}$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_9\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{=O})\text{R}_{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{10}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{NR}_9\text{C}(\text{=O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_9\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ，其中烷基、烯基、炔基、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各視情況被 0-5 個 R_{9a} 取代；

R_7 在每一存在處係獨立選自包括烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、雜環基、鹵基、 $-\text{CN}$ 、

-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、
-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)H、
-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、=O、
-NR₉C(=O)OR₈及-NR₉S(O)₂R₈，其中烷基、烯基、炔基、芳基、
環烷基、環烷基烷基及雜環基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R₈在每一存在處係獨立選自包括烷基與環烷基，其每一個可視情況被一或多個R_{8a}取代；

R_{8a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、=O、-NR₁₄C(=O)OR₁₄及
-NR₁₄S(O)₂R₁₄；

R₉在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-5個R_{9a}取代；

R_{9a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、-NH₂、-CN、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、
-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、
-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)H、-NR₁₄C(=O)R₁₄、
-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O)₂R₈
及=O；

R₁₀在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被0-3個R_{10a}取代；

R_{10a}在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯

基、炔基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{11} 在每一存在處係獨立選自烷基、環烷基及芳基，其可各視情況被0-3個 R_{11a} 取代；

R_{11a} 在每一存在處係獨立選自烷基、鹵烷基、芳基、烯基、炔基、環烷基、鹵基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}_{14}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}_{14}\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_{14}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_{14}$ 、 $-\text{NR}_{14}\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ 及 $-\text{NR}_{14}\text{S}(\text{O}_2)\text{R}_8$ ；

R_{12} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基，其中烷基、環烷基及芳基可各視情況被0-3個 R_{10a} 取代；

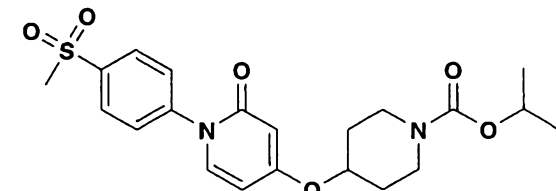
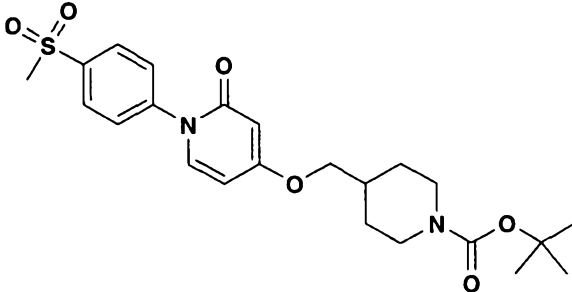
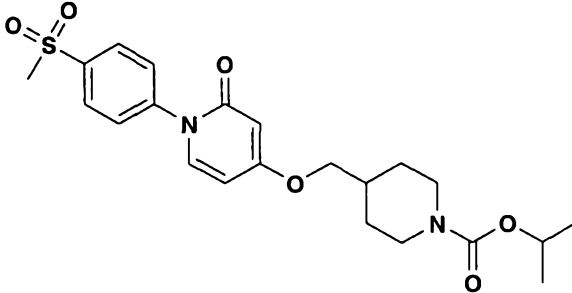
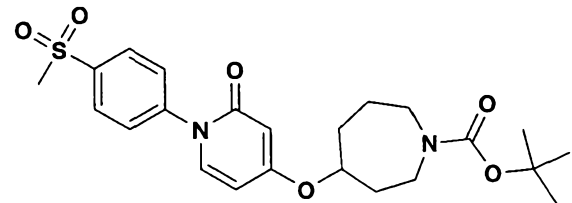
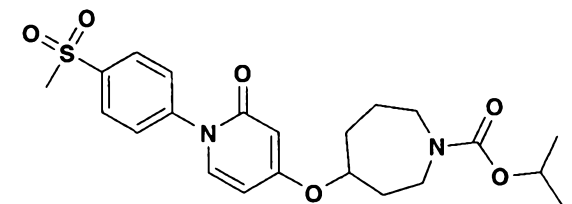
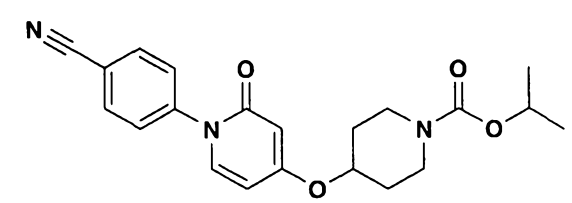
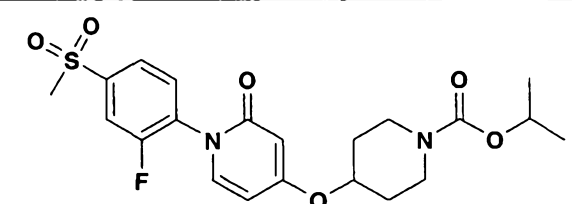
R_{14} 在每一存在處係獨立選自氫、烷基、環烷基及芳基；

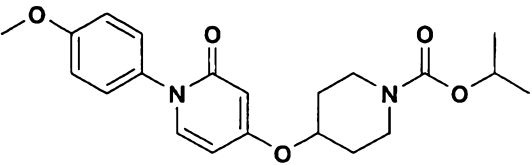
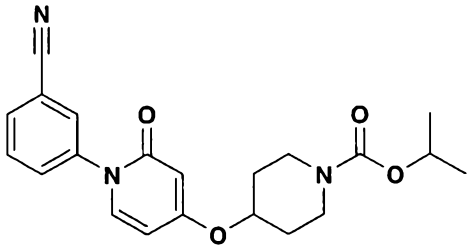
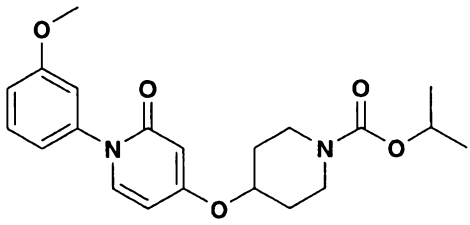
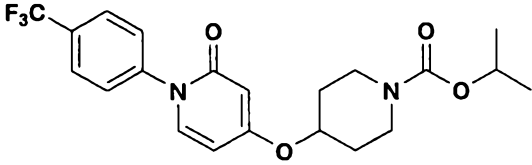
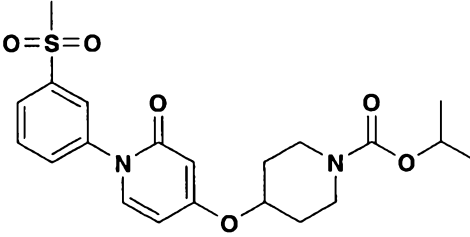
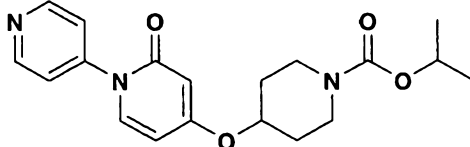
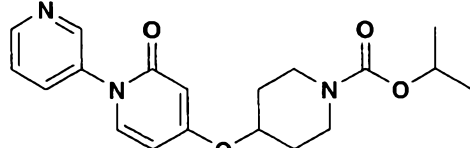
R_{20} 為氫；且

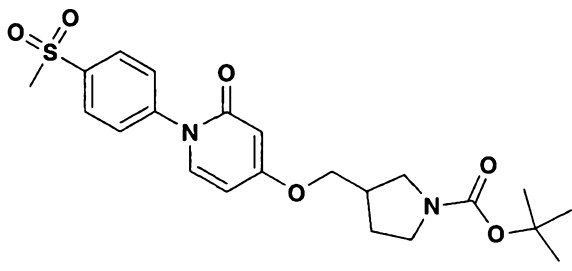
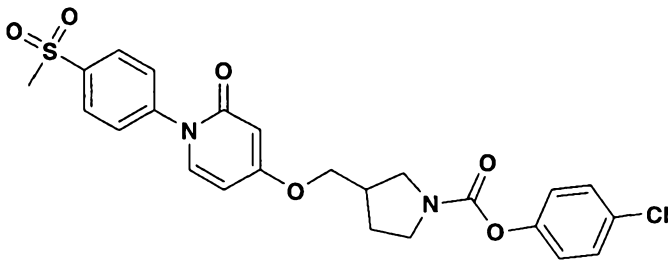
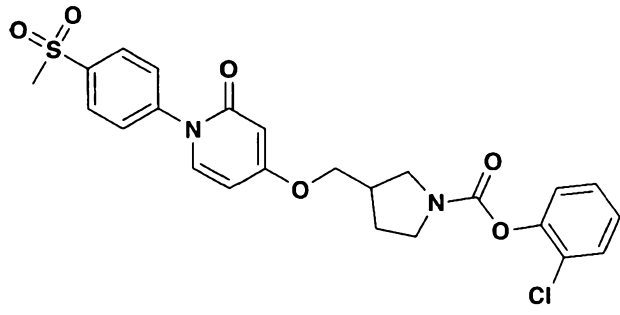
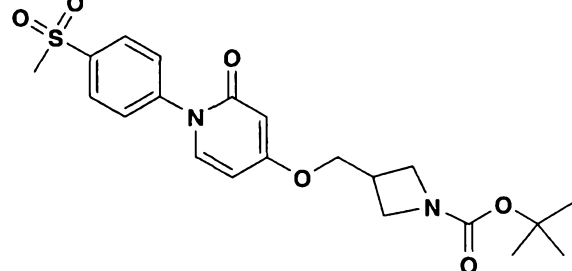
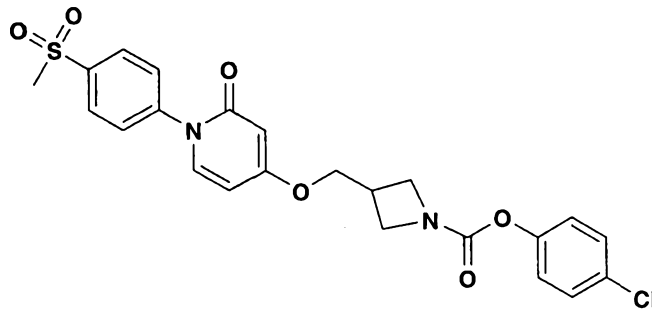
R_{21} 係選自包括氫、烷基、鹵烷基、鹵基及 $-\text{CN}$ 。

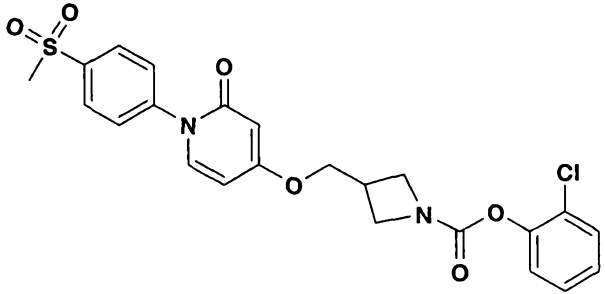
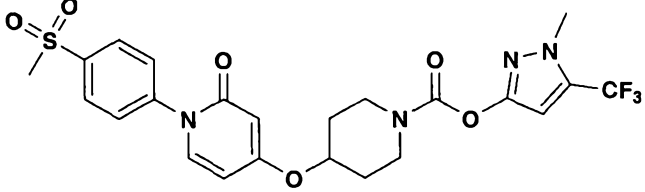
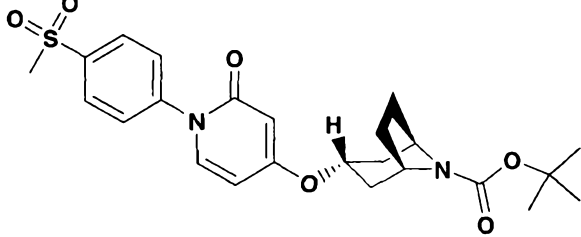
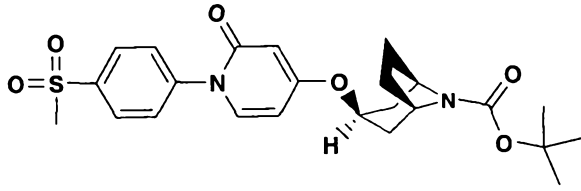
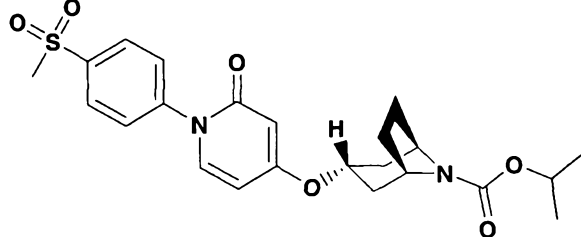
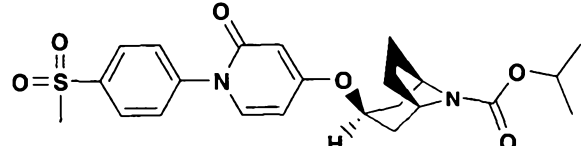
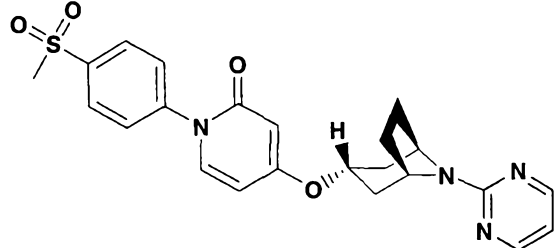
15. 如請求項1之化合物，其係選自包括：

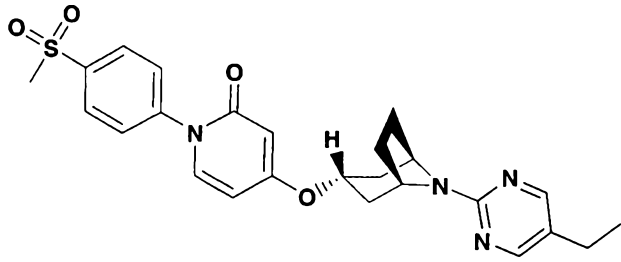
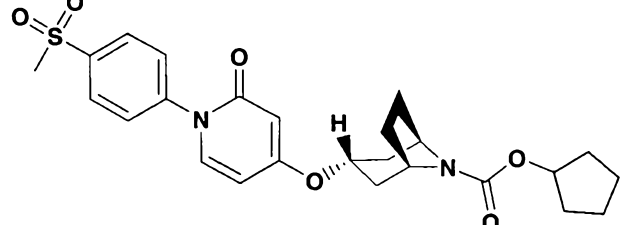
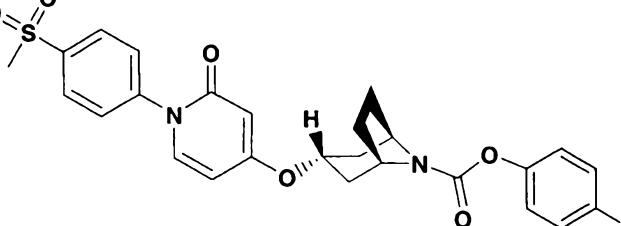
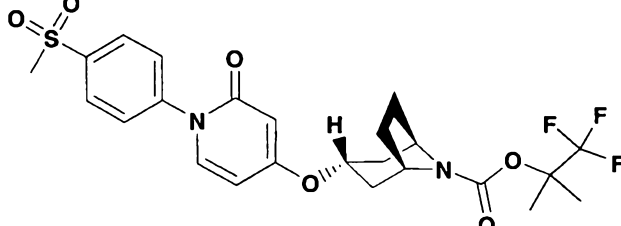
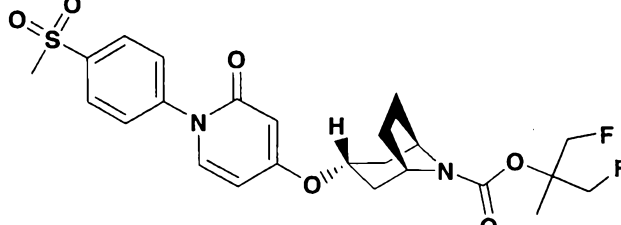
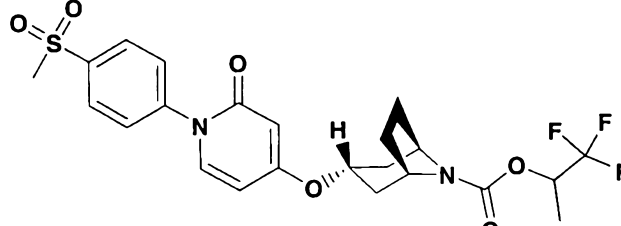
名稱	結構
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯	
4-(1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸1,1,1-三氟丙-2-基酯	

名稱	結構
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯	
4-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)一氫七圓烷-1-羧酸第三-丁酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)一氫七圓烷-1-羧酸異丙酯	
4-(1-(4-氰基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-(1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	

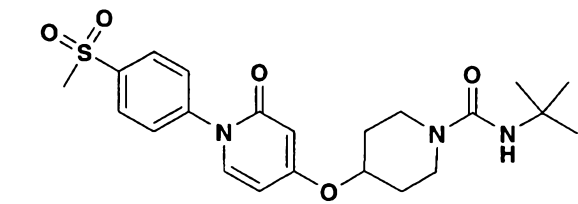
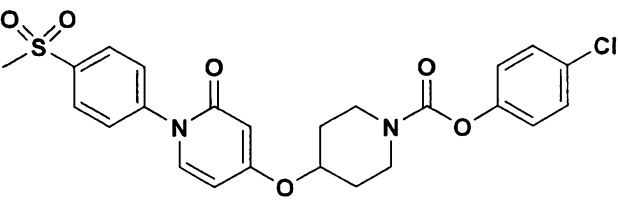
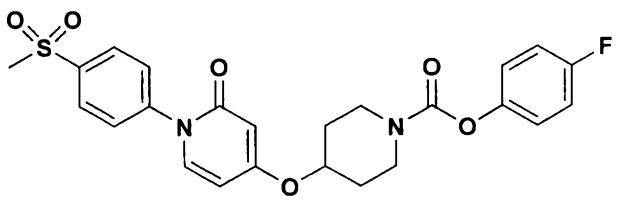
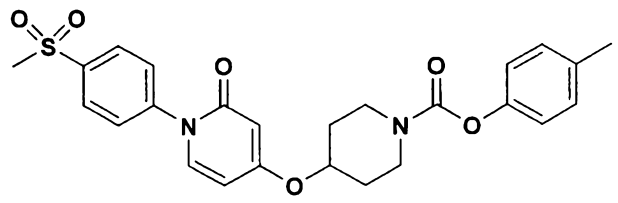
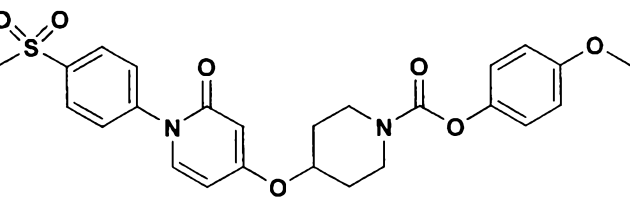
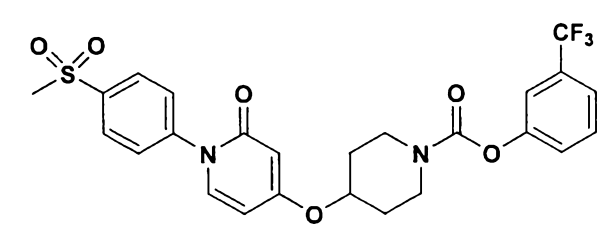
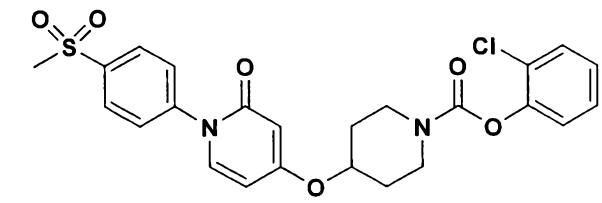
名稱	結構
4-(1-(4-甲氧苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-(1-(3-氰基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-(1-(3-甲氧苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-(2-酮基-1-(4-(三氟甲基)苯基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-(1-(3-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-(2-酮基-1-(吡啶-4-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯, TFA鹽	
4-(2-酮基-1-(吡啶-3-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	

名稱	結構
3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)四氫吡咯-1-羧酸第三-丁酯	
3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)四氫吡咯-1-羧酸4-氯苯酯	
3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)四氫吡咯-1-羧酸2-氯苯酯	
3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)一氮四環-1-羧酸第三-丁酯	
3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)一氮四環-1-羧酸4-氯苯酯	

名稱	結構
3-((1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)甲基)一氮四環-1-羧酸2-氯苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-吡唑-3-基酯	
(3-外向)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸第三-丁酯	
(3-內向)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸第三-丁酯	
(3-外向)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸異丙酯	
(3-內向)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸異丙酯	
(3-外向)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(8-(嘓啶-2-基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛-3-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	

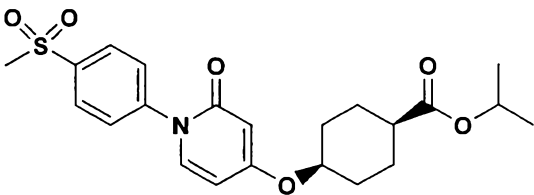
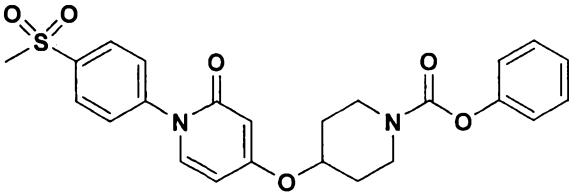
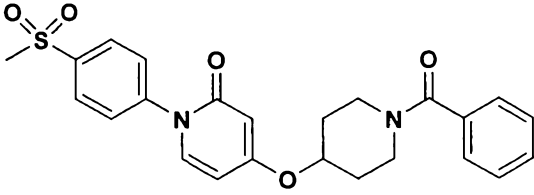
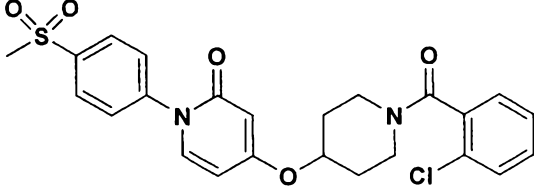
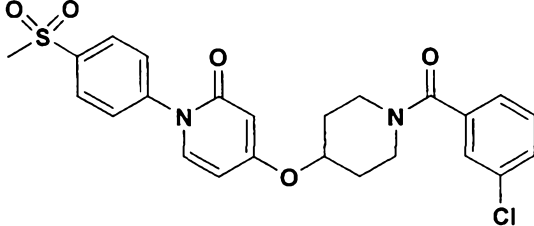
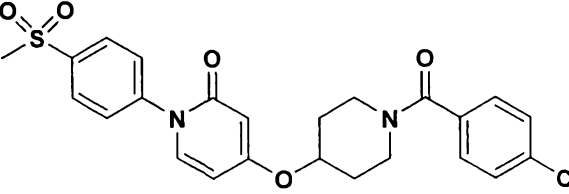
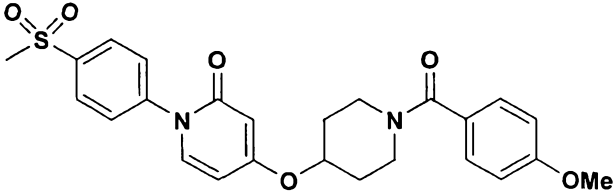
名稱	結構
(3-外向)-4-(8-(5-乙基嘓啶-2-基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛-3-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	
(3-外向)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸環戊酯	
(3-外向)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸4-氯苯酯	
(3-外向)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸1,1,1-三氟-2-甲基丙-2-基酯	
(3-外向)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸1,3-二氟-2-甲基丙-2-基酯	
(3-外向)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸1,1,1-三氟丙-2-基酯	

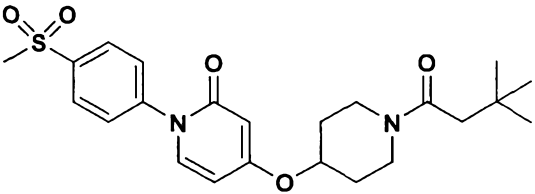
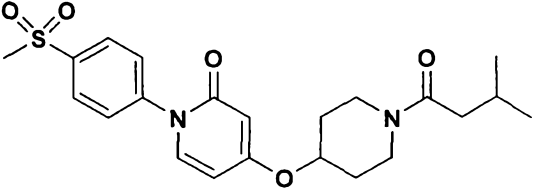
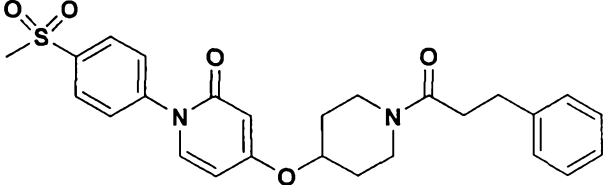
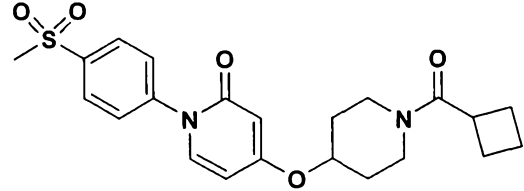
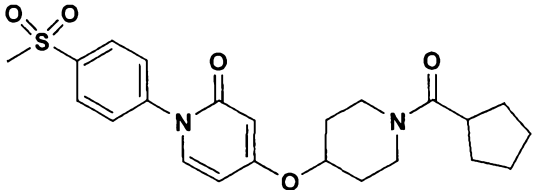
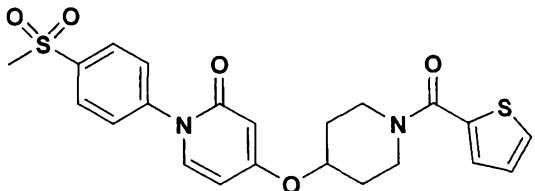
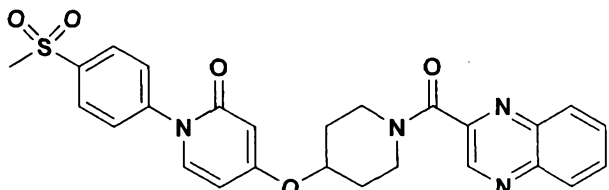
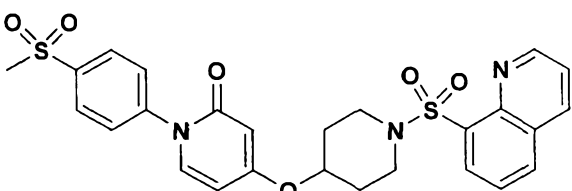
名稱	結構
(3-外向)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸第二-丁酯	
(3-外向)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸1-甲基-5-(三氟甲基)-1H-吡唑-3-基酯	
(3-外向)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸4-甲氧苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基硫基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基硫基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫嘓啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸丙-1-烯-2-基酯	

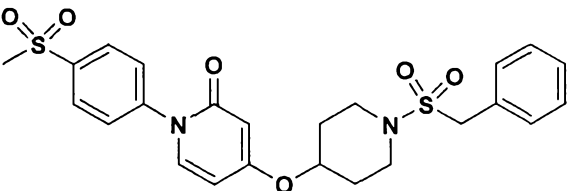
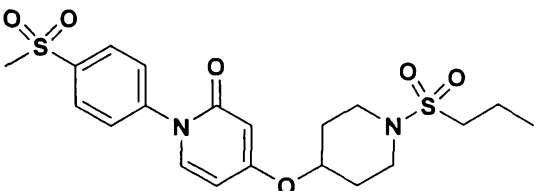
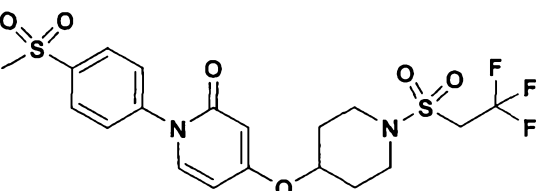
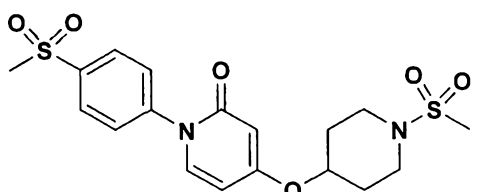
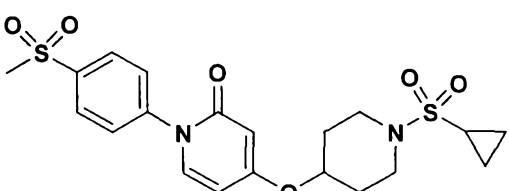
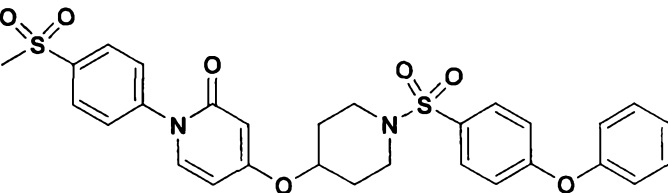
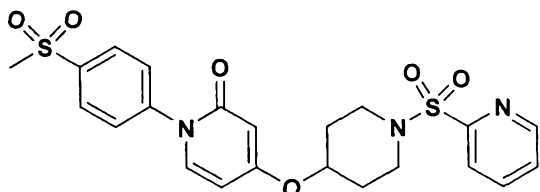
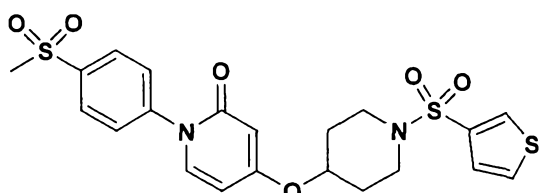
名稱	結構
N-第三-丁基-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-氯苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-氟苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-甲基苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-甲氧基苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸3-三氟甲基苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸2-氯苯酯	

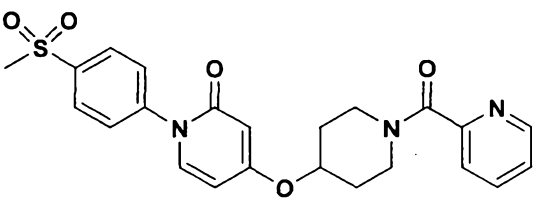
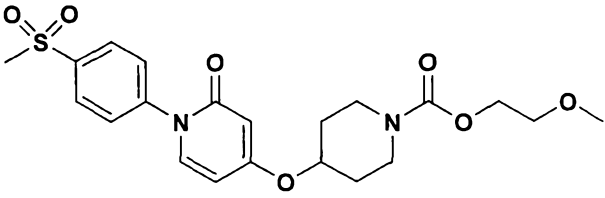
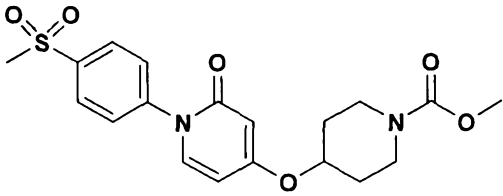
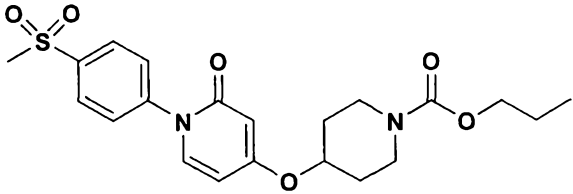
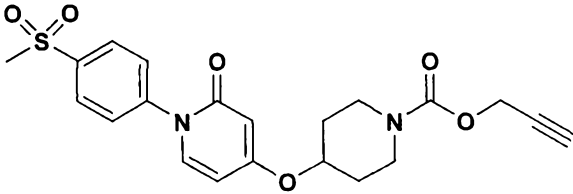
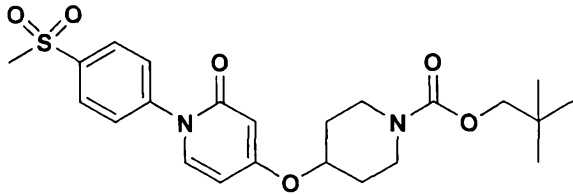
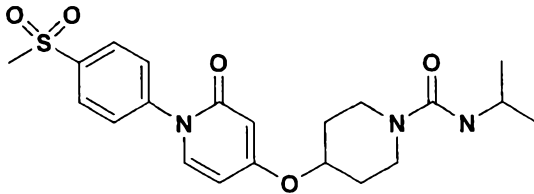
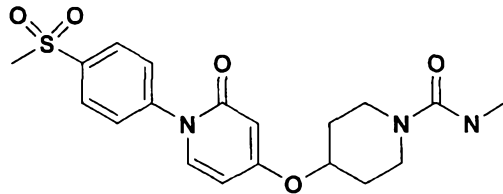
名稱	結構
(±)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)四氫吡咯-1-羧酸4-氯苯酯	
(±)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)四氫吡咯-1-羧酸苄酯	
4-(1-(苯并[d]呋唑-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(5-甲基苯并[d]呋唑-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸環丙酯	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(5-乙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(5-氟基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	

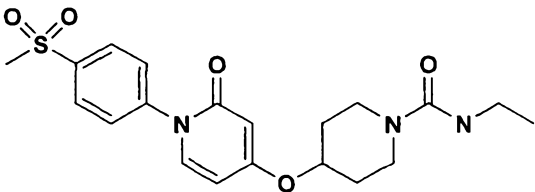
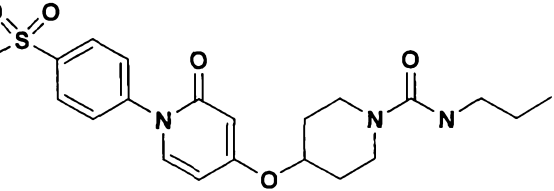
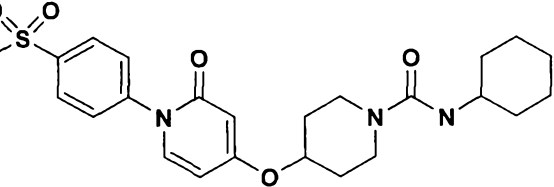
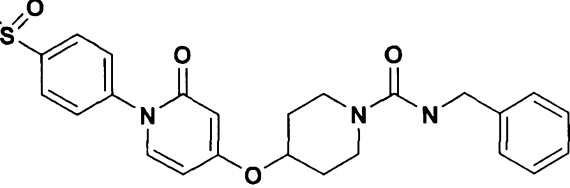
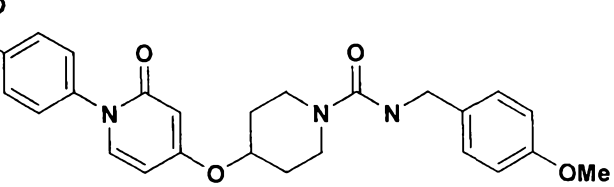
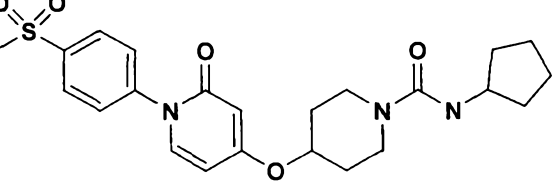
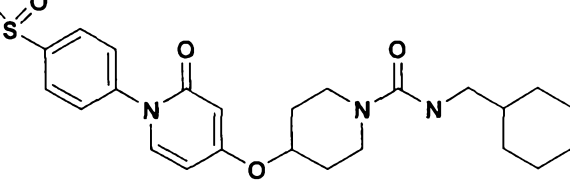
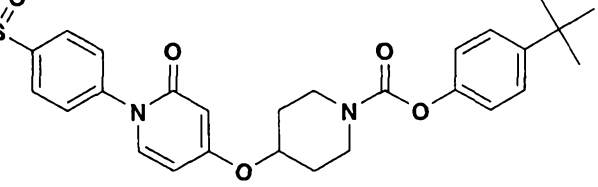
名稱	結構
4-(1-(5-溴基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(4-甲基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
反式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸乙酯	
順式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸乙酯	
4-((反式)-4-(3-異丙基-1,2,4-噁二唑-5-基)環己基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-((順式)-4-(3-異丙基-1,2,4-噁二唑-5-基)環己基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
反式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸異丙酯	

名稱	結構
順式-4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)環己烷羧酸異丙酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸苯酯	
4-(1-苯甲醯基六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(2-氯基苯甲醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(3-氯基苯甲醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(4-氯基苯甲醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(4-甲氧基苯甲醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	

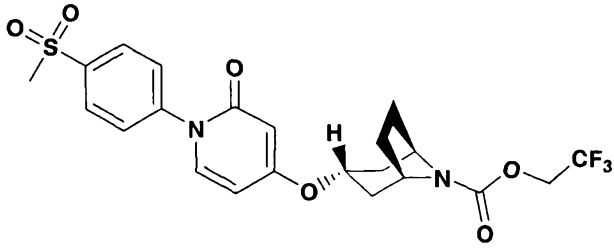
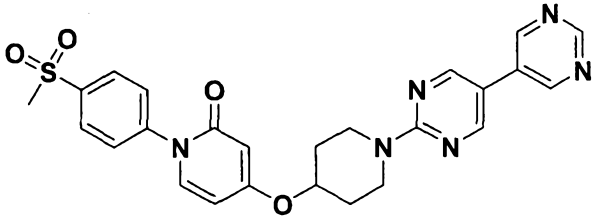
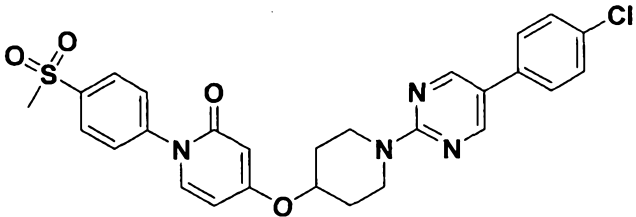
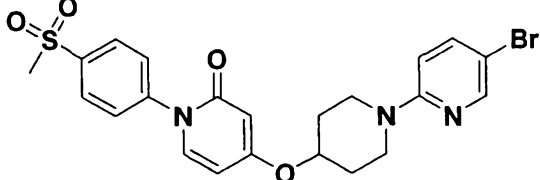
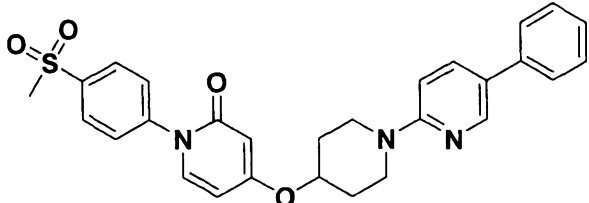
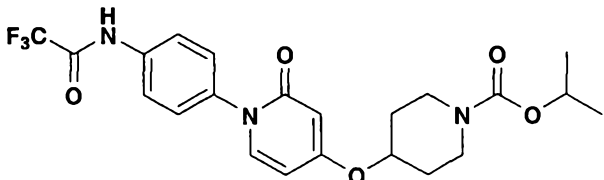
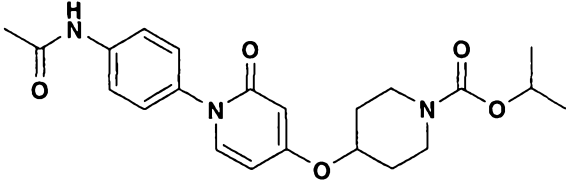
名稱	結構
4-(1-(3,3-二甲基丁醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(3-甲基丁醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(3-苯丙醯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(環丁烷羧基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(環戊羧基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(噻吩-2-羧基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(喹啉-2-羧基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(喹啉-8-基磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	

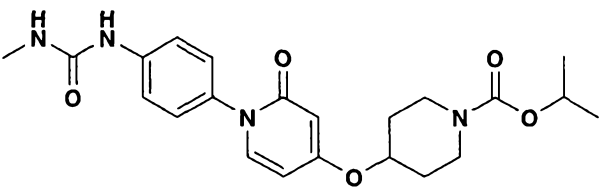
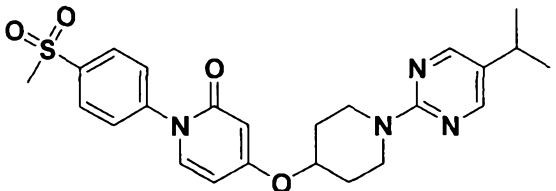
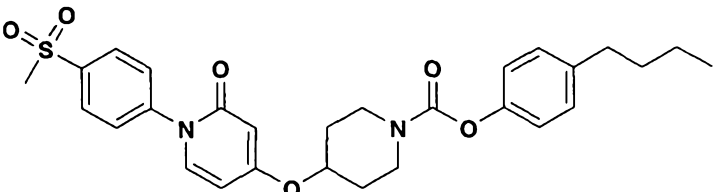
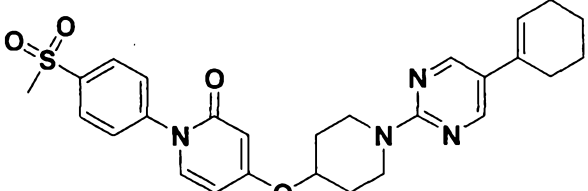
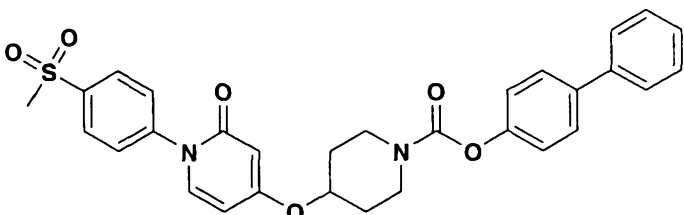
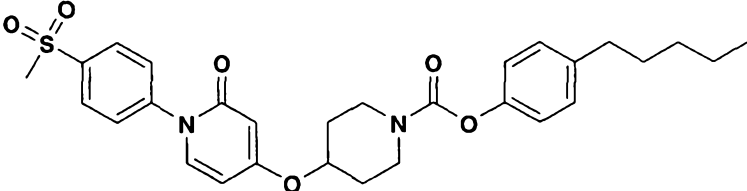
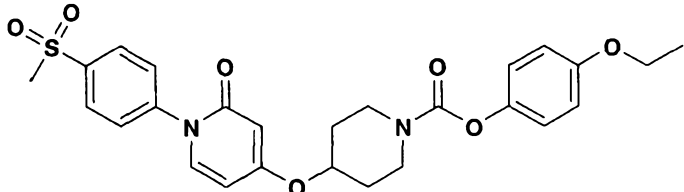
名稱	結構
4-(1-(苄基磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苄基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-(甲磺醯基)苄基)-4-(1-(丙基磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-(甲磺醯基)苄基)-4-(1-(2,2,2-三氟乙基磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-(甲磺醯基)苄基)-4-(1-(甲磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(環丙基磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苄基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-(甲磺醯基)苄基)-4-(1-(4-苯氧基苄磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-(甲磺醯基)苄基)-4-(1-(吡啶-2-基磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	
1-(4-(甲磺醯基)苄基)-4-(1-(噻吩-3-基磺醯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	

名稱	結構
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-甲基吡啶醯基六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸2-甲氧基乙酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸甲酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸丙酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸丙-2-炔酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸2,2-二甲基丙酯	
N-異丙基4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺	
N-甲基4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺	

名稱	結構
N-乙基4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺	
正-丙基4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺	
N-環己基4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺	
N-苄基4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺	
N-4-甲氧基苄基4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺	
N-環戊基4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺	
N-環己基甲基4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧醯胺	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-第三-丁基苯酯	

名稱	結構
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-異丙基苯酯	
4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-丙基苯酯	
4-(1-(5-甲基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-苯基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-氰基苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸2,2,2-三氟乙酯	

名稱	結構
(1R,5R)-3-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)-8-氮雙環并[3.2.1]辛烷-8-羧酸2,2,2-三氟乙酯	
4-(1-(5,5'-雙嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(5-(4-氯苯基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(5-溴基吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-苯基吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(2-酮基-1-(4-(2,2,2-三氟乙醯胺基)苯基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-(1-(4-乙醯胺基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	

名稱	結構
4-(1-(4-(3-甲基脲基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-(1-(5-異丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-丁基苯酯	
4-(1-(5-環己烯基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸聯苯-4-基酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-戊基苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-乙氧基苯酯	

名稱	結構
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-(三氟甲氧基)苯酯	
4-(1-(5-異丁基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(2-酮基-1-(吡啶-2-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯, TFA 鹽	
4-(1-(5-乙基吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(吡啶-4-基)嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(吡啶-3-基)嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(吡啶-3-基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽	
4-(1-(5-乙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(吡啶-3-基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽	

名稱	結構
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-第三-戊基苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-(三氟甲基)苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-環丙基苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-(2-甲基丙-1-烯基)苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-第二-丁基苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-乙基-2-甲氧基苯酯	
4-(1-(5-甲氧基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮，鹽酸鹽	

名稱	結構
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-溴基-2-甲基苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-異丁基苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-溴基-2-氟苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸2-甲氧基-4-丙基苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸6-溴基吡啶-3-基酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸2-甲基-4-丙基苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸2-氟基-4-丙基苯酯	
(Z)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(丙-1-烯基)嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	

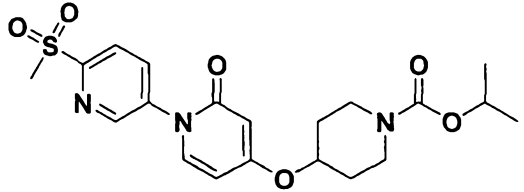
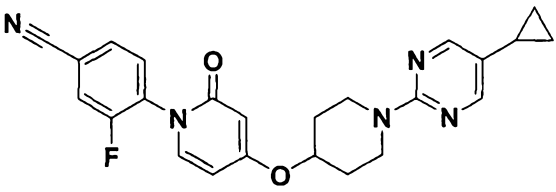
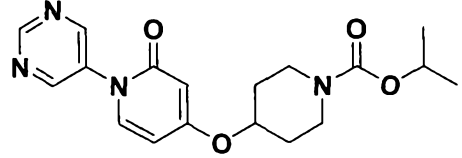
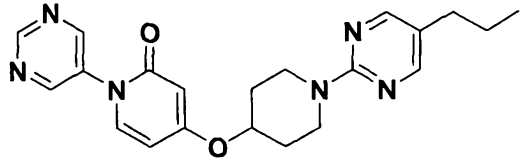
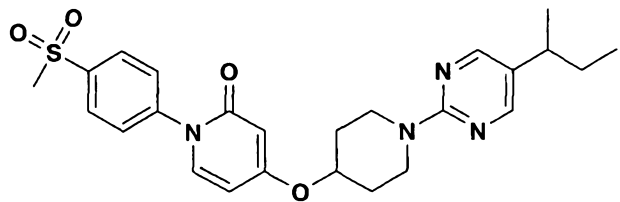
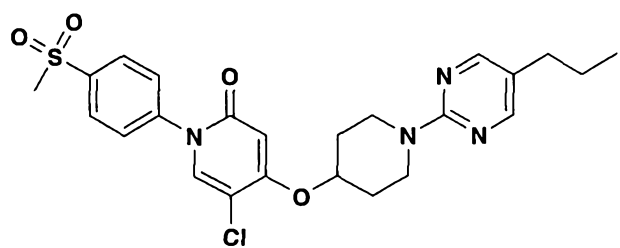
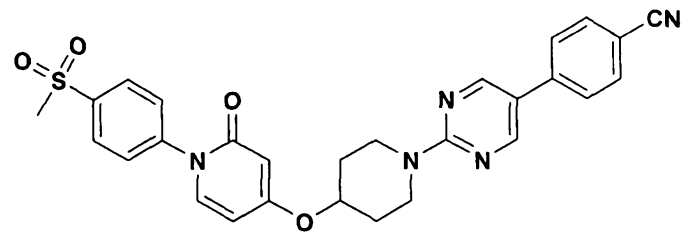
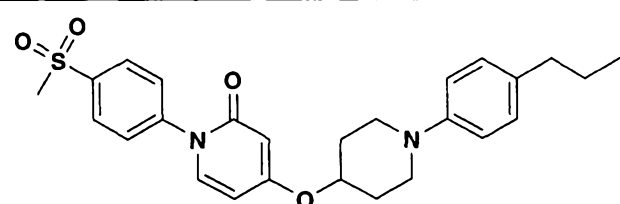
名稱	結構
4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸2-氯基-4-丙基苯酯	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸6-丙基吡啶-3-基酯, TFA鹽	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-(3,3,3-三氟丙基)苯酯	
1-(4-(甲硫基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
(±)-1-(4-(甲基亞磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸4-(2-氟基乙基)苯酯	
4-(5-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸苄酯	

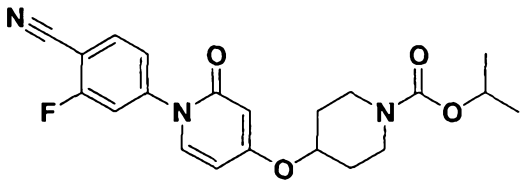
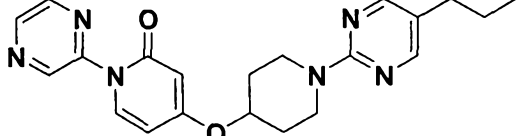
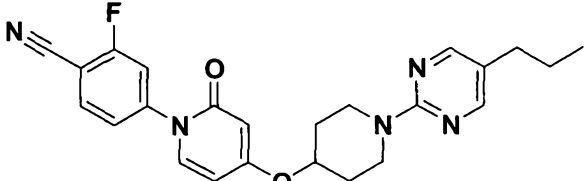
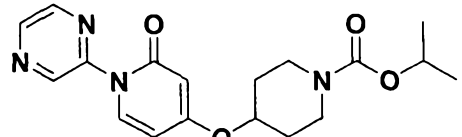
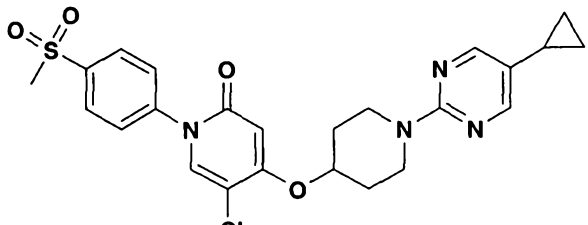
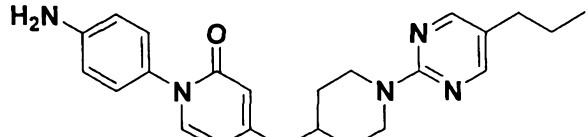
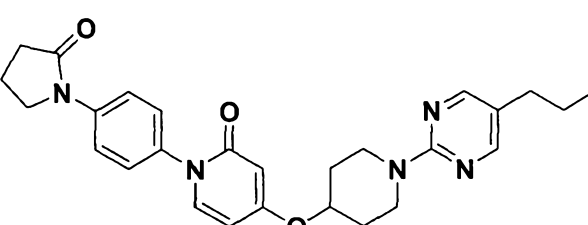
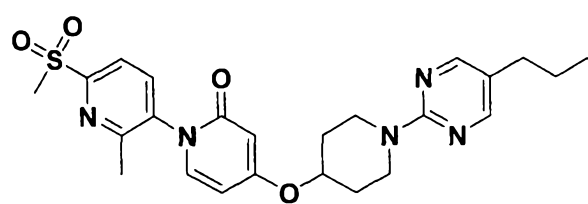
名稱	結構
(±)-4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲基亞磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-5-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(5-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯	
4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-6-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
5-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, 鹽酸鹽	
4-(5-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
6-甲基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	

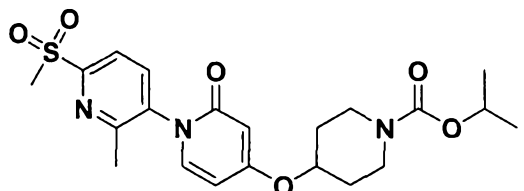
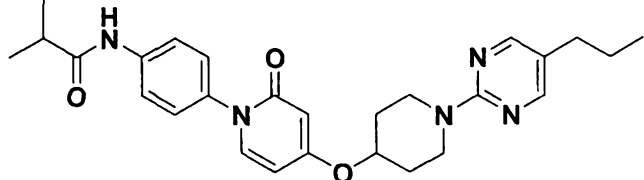
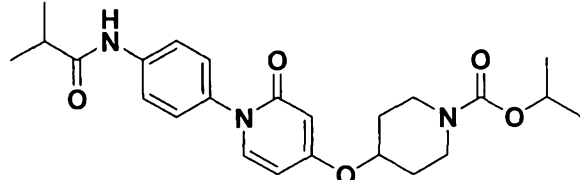
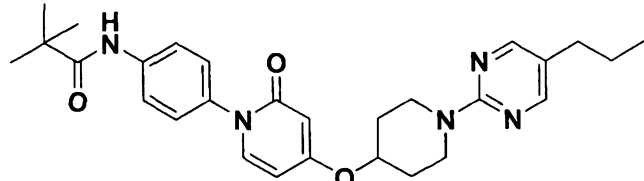
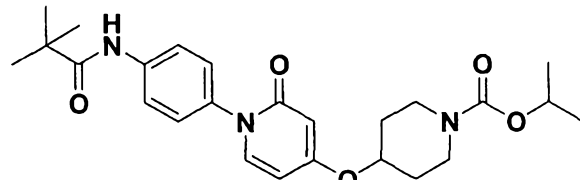
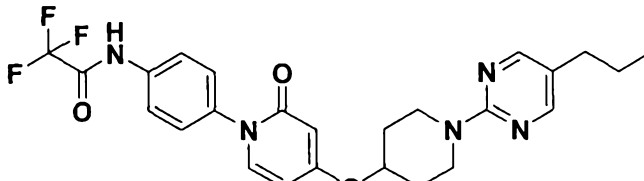
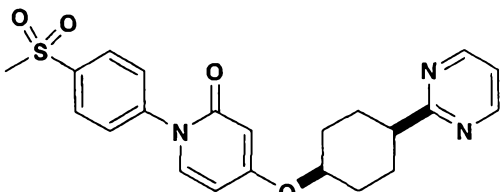
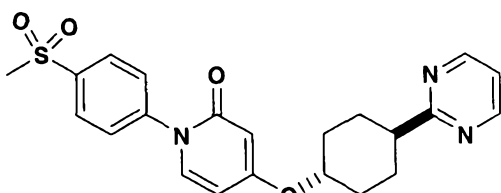
名稱	結構
(±)-4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(2-氟基-4-(甲基亞磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
(±)-1-(2-氟基-4-(甲基亞磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(2-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯	
1-(2-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(5-環戊烯基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(5-環戊基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(2-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(3-甲基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	

名稱	結構
1-(3-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(3-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(4-氯基-2-氟苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯	
3-氯基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲腈, TFA鹽	
1-(2-甲基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
3-氯基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲醯胺, TFA鹽	
1-(2-氯基-4-(甲磺醯基)苯基)-5-苯基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	

名稱	結構
1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(3,3,3-三氟丙基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, 鹽酸鹽	
1-(4-(甲磺醯基)-3-(三氟甲基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
5-環丙基-1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-苯基六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	
1-(2-甲基吡啶-3-基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(6-(甲磺醯基)吡啶-3-基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(4-氰基-2-氟苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	

名稱	結構
4-(1-(6-(甲磺醯基)吡啶-3-基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-(4-(1-(5-環丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-3-氟基苯甲腈	
4-(2-酮基-1-(嘓啶-5-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(嘓啶-5-基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(1-(5-第二-丁基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, 鹽酸鹽	
5-氯基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽	
4-(2-(4-(1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-基)嘓啶-5-基)苯甲腈, 鹽酸鹽	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(4-丙基苯基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽	

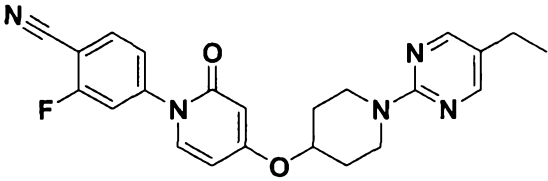
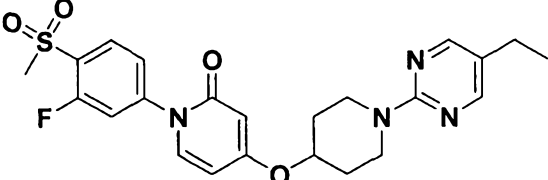
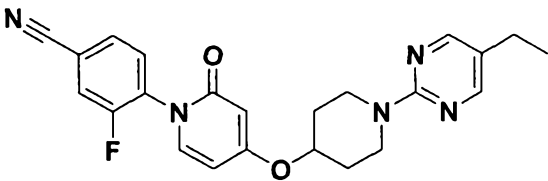
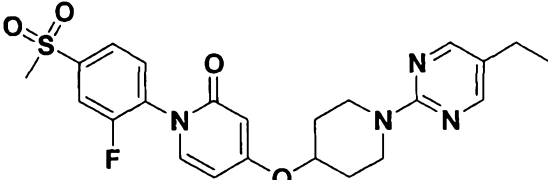
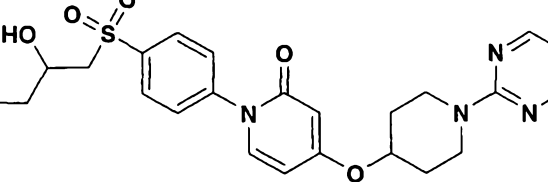
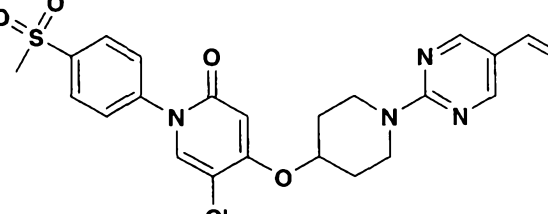
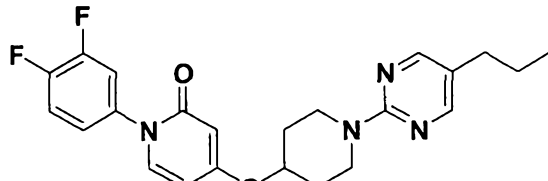
名稱	結構
4-(1-(4-氟基-3-氰基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(吡啶-2-基)吡啶-2(1H)-酮	
2-氟基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲腈	
4-(2-酮基-1-(吡啶-2-基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
5-氟基-4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺酰基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽	
1-(4-胺基苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-(2-酮基四氫吡咯-1-基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, 鹽酸鹽	
1-(2-甲基-6-(甲磺酰基)吡啶-3-基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽	

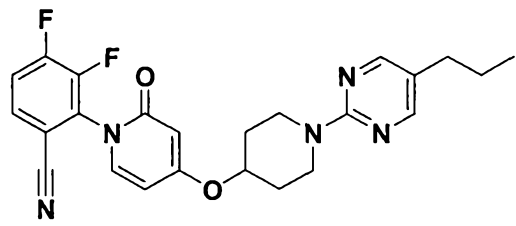
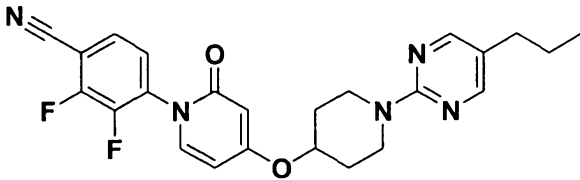
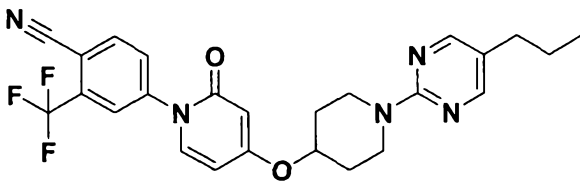
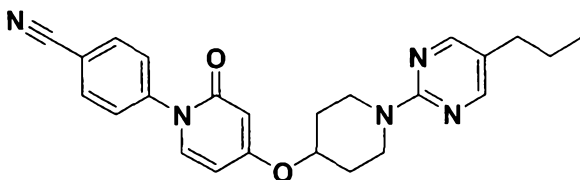
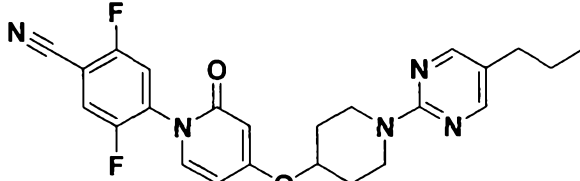
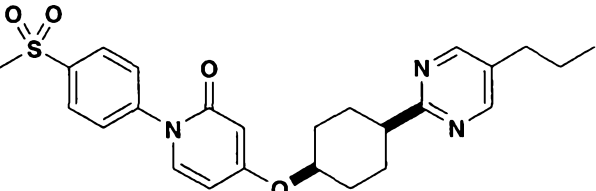
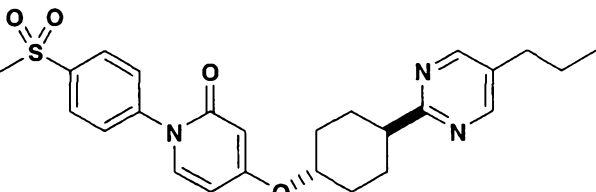
名稱	結構
4-(1-(2-甲基-6-(甲磺醯基)吡啶-3-基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯, TFA鹽	
N-(4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)異丁醯胺	
4-(1-(4-異丁醯胺基苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
N-(4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)三甲基乙醯胺, 鹽酸鹽	
4-(2-酮基-1-(4-三甲基乙醯胺基苯基)-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
2,2,2-三氟-N-(4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)乙醯胺, TFA鹽	
順式-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-((1r,4r)-4-(嘧啶-2-基)環己基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	
反式-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-((1r,4r)-4-(嘧啶-2-基)環己基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	

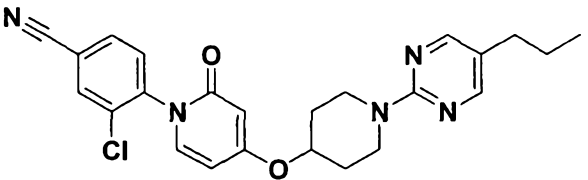
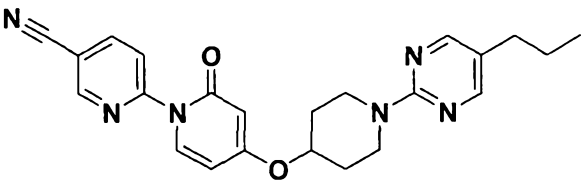
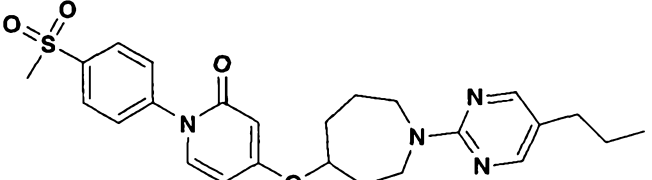
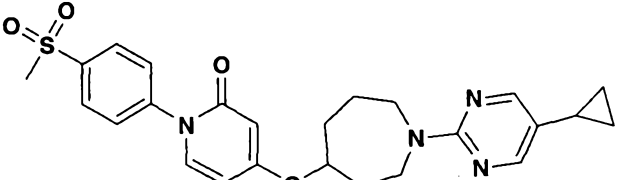
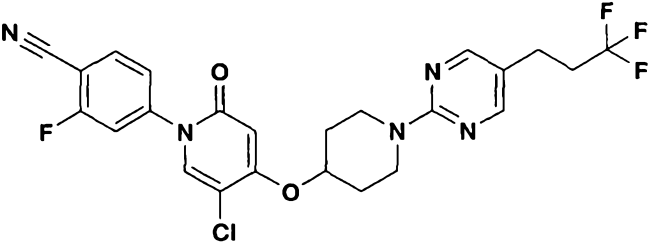
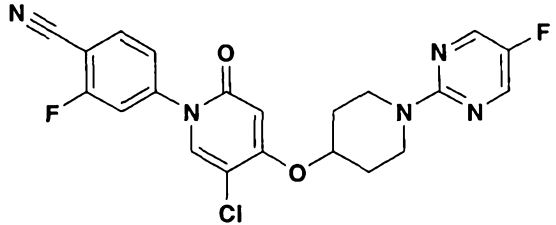
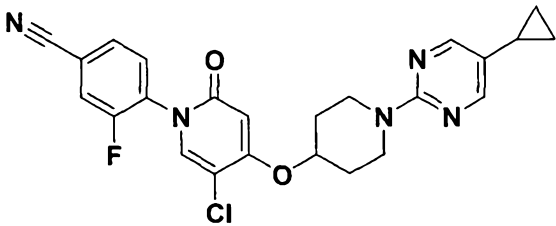
名稱	結構
1,1,1-三氟-N-(4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)甲烷磺醯胺, TFA鹽	
N,N-二甲基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯磺醯胺, 鹽酸鹽	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-6-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1,6-二氫吡啶-3-甲腈, TFA鹽	
N-第三-丁基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯磺醯胺	
5-氯基-1-(3-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	
4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-6-酮基-1,6-二氫吡啶-3-甲腈, TFA鹽	
4-(5-氯基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯	

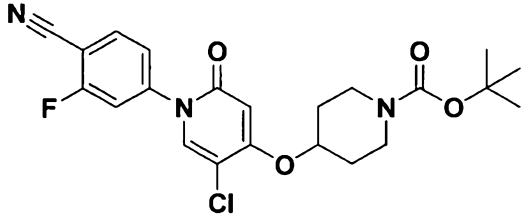
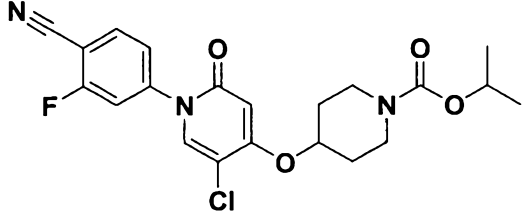
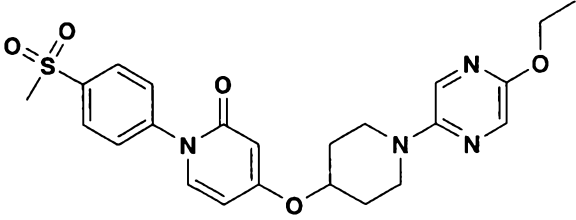
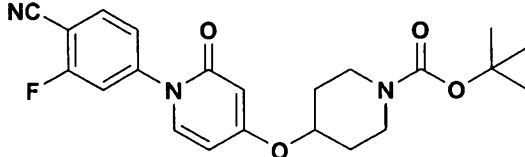
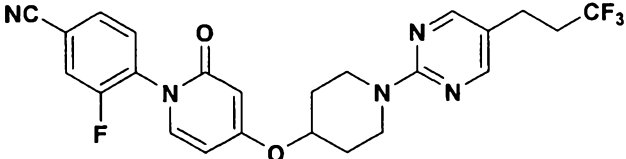
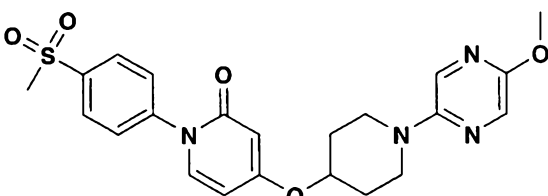
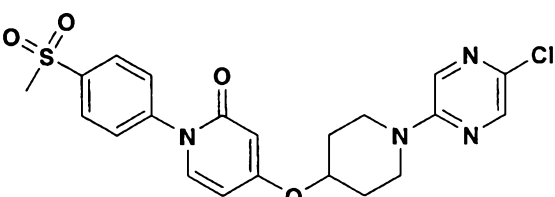
名稱	結構
4-(5-氯基-2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈	
4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯磺醯胺	
4-(5-氯基-4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈	
4-(4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈	
4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(3-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
5-溴基-4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	
(E)-1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(丙-1-烯基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	

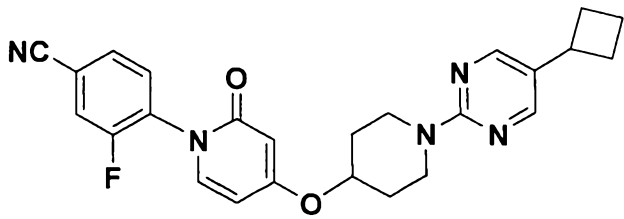
名稱	結構
(Z)-1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(丙-1-烯基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-胺基-3-氟苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	
N-(2-氟基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)三甲基乙醯胺	
N-(2-氟基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)異丁醯胺	
2,2,2-三氟-N-(2-氟基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)乙醯胺	
N-甲基-N-(4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯基)三甲基乙醯胺	
4-(1-(5-環丁基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)鄰苯二甲腈	

名稱	結構
4-(4-(1-(5-乙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈	
4-(1-(5-乙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(3-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
4-(4-(1-(5-乙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-3-氟基苯甲腈	
4-(1-(5-乙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(2-氟基-4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮	
1-(4-(2-羥丁基磺醯基)苯基)-4-(1-(嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽	
(Z)-5-氯基-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-(丙-1-烯基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽	
1-(3,4-二氟苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮	

名稱	結構
3,4-二氟-2-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲腈	
2,3-二氟-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲腈	
4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)-2-(三氟甲基)苯甲腈	
4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲腈	
2,5-二氟-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲腈	
順式-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(4-(5-丙基嘧啶-2-基)環己基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽	
反式-1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(4-(5-丙基嘧啶-2-基)環己基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽	

名稱	結構
3-氯基-4-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲腈	
6-(2-酮基-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)菸鹼脛	
1-(4-(甲磺醯基)苯基)-4-(1-(5-丙基嘧啶-2-基)一氮七圍烷-4-基氧基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽	
4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)一氮七圍烷-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA 鹽	
4-(5-氯基-2-酮基-4-(1-(5-(3,3,3-三氟丙基)嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈, TFA 鹽	
4-(5-氯基-4-(1-(5-氟基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-2-氟基苯甲腈, TFA 鹽	
4-(5-氯基-4-(1-(5-環丙基嘧啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-3-氟基苯甲腈	

名稱	結構
4-(5-氯基-1-(4-氯基-3-氟苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯	
4-(5-氯基-1-(4-氯基-3-氟苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸異丙酯	
4-(1-(5-乙氧基吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	
4-(1-(4-氯基-3-氟苯基)-2-酮基-1,2-二氫吡啶-4-基氧基)六氫吡啶-1-羧酸第三-丁酯	
3-氟基-4-(2-酮基-4-(1-(5-(3,3,3-三氟丙基)嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)吡啶-1(2H)-基)苯甲腈, TFA鹽	
4-(1-(5-甲氧基吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	
4-(1-(5-氯基吡啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-1-(4-(甲磺醯基)苯基)吡啶-2(1H)-酮, TFA鹽	

名稱	結構
4-(4-(1-(5-環丁基嘓啶-2-基)六氫吡啶-4-基氧基)-2-酮基吡啶-1(2H)-基)-3-氟基苯甲腈	

16. 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，與視情況選用之一種藥學上可接受之載劑。
17. 如請求項16之醫藥組合物，其進一步包含一或多種其他治療活性劑。
18. 一種如請求項1之至少一種化合物於藥劑製造上之用途，該藥劑視情況與另一種會調制 GPR119 G 蛋白偶合受體活性之治療劑合併使用。
19. 一種如請求項1之至少一種化合物於藥劑製造上之用途，該藥劑視情況與另一種治療劑合併使用，以預防、抑制或治療與 GPR119 G 蛋白偶合受體活性有關聯疾病或病症之進展或展開，其中：

(a) 該疾病或病症係選自包括糖尿病、高血糖、減弱之葡萄糖容許度、胰島素抗藥性、胰島素過多、視網膜病、神經病、腎病、延遲傷口癒合、動脈粥瘤硬化及其後遺症、異常心臟功能、心肌絕血、中風、代謝徵候簇、高血壓、肥胖、脂血症障礙、脂血症異常、血脂肪過多、血三酸甘油酯過多、高膽固醇血症、低HDL、高LDL、非心臟絕血感染、癌症、血管再狹窄、胰腺炎、神經變性疾病、脂質病症、認知力減弱與癡呆症、骨質疾病、HIV蛋白酶有關聯之脂肪代謝障礙及青光眼；與

(b) 該其他治療劑係選自包括抗糖尿病劑、抗高血糖劑、抗胰島素過多劑、抗視網膜病劑、抗神經病原性劑、抗腎病劑、抗動脈粥瘤硬化劑、抗絕血劑、抗高血壓劑、抗肥胖劑、抗脂血症障礙劑、抗血脂肪過多劑、抗血甘油三酯過多劑、抗高膽固醇血症劑、抗再狹窄劑、抗胰劑、脂質降低劑、食慾抑制劑、關於心臟衰竭之治療藥品、關於末梢動脈疾病之治療藥品及消炎劑。

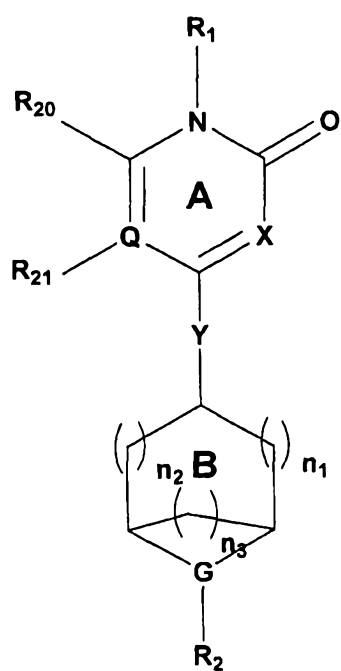
20. 一種醫藥組合物，其包含治療上有效量之如請求項1之化合物，及治療上有效量之二肽基肽酶-IV (DPP4) 抑制劑。

七、指定代表圖：

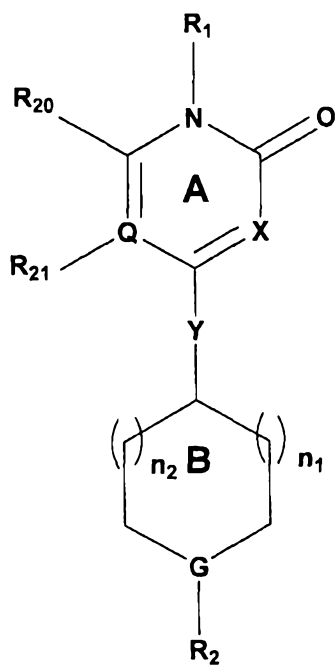
(一)本案指定代表圖為：(無)

(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：



式 I



式 IA