



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201238950 A1

(43)公開日：中華民國 101 (2012) 年 10 月 01 日

(21)申請案號：100141323

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 11 月 11 日

(51)Int. Cl.：

C07D209/44 (2006.01)

C07D403/12 (2006.01)

C07D413/12 (2006.01)

C07D471/04 (2006.01)

A61K31/4035 (2006.01)

A61K31/407 (2006.01)

A61P9/10 (2006.01)

A61P19/02 (2006.01)

A61P29/00 (2006.01)

A61P35/00 (2006.01)

A61P37/06 (2006.01)

(30)優先權：2010/11/15

美國

61/413,722

2011/04/11

美國

61/474,015

2011/08/19

美國

61/525,405

(71)申請人：亞培公司 (美國) ABBOTT LABORATORIES (US)

美國

(72)發明人：古汀 麥克 L CURTIN, MICHAEL L. (US)；索倫桑 布來恩 K SORENSEN,

BRYAN K. (US)；海曼 霍華 R HEYMAN, HOWARD R. (US)；克拉克 理查 F

CLARK, RICHARD F. (US)；渥勒 凱文 R WOLLER, KEVIN R. (US)；珊 歐瑪

傑 SHAH, OMAR J. (US)；米雪利德 麥可 MICHAELIDES, MICHAEL (US)；

謝 克里斯 TSE, CHRIS (US)；維蘇德汎 安諾 VASUDEVAN, ANIL (IN)；馬克

海穆 MACK, HELMUT (DE)；漢森 陶德 M HANSEN, TODD M. (US)；史威斯

拉姆茲 SWEIS, RAMZI (US)；波魯胥齊夫 瑪瑞納 A PLIUSHCHEV, MARINA

A. (US)

(74)代理人：陳長文

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：20 項 圖式數：0 共 1687 頁

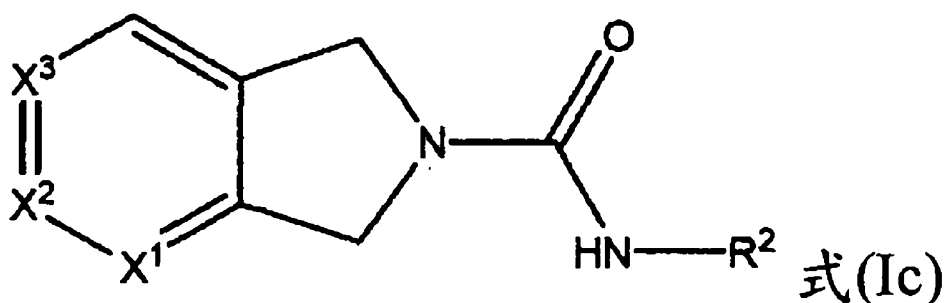
(54)名稱

NAMPT 及 ROCK 抑制劑

NAMPT AND ROCK INHIBITORS

(57)摘要

本發明揭示抑制 NAMPT 活性之化合物、含有該等化合物之組合物及治療其中表現 NAMPT 之疾病之方法。揭示抑制 ROCK 活性之化合物、含有該等化合物之組合物及治療其中表現 ROCK 之疾病之方法。





(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201238950 A1

(43)公開日：中華民國 101 (2012) 年 10 月 01 日

(21)申請案號：100141323

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 11 月 11 日

(51)Int. Cl.：

C07D209/44 (2006.01)

C07D403/12 (2006.01)

C07D413/12 (2006.01)

C07D471/04 (2006.01)

A61K31/4035 (2006.01)

A61K31/407 (2006.01)

A61P9/10 (2006.01)

A61P19/02 (2006.01)

A61P29/00 (2006.01)

A61P35/00 (2006.01)

A61P37/06 (2006.01)

(30)優先權：2010/11/15

美國

61/413,722

2011/04/11

美國

61/474,015

2011/08/19

美國

61/525,405

(71)申請人：亞培公司 (美國) ABBOTT LABORATORIES (US)

美國

(72)發明人：古汀 麥克 L CURTIN, MICHAEL L. (US)；索倫桑 布來恩 K SORENSEN,

BRYAN K. (US)；海曼 霍華 R HEYMAN, HOWARD R. (US)；克拉克 理查 F

CLARK, RICHARD F. (US)；渥勒 凱文 R WOLLER, KEVIN R. (US)；珊 歐瑪

傑 SHAH, OMAR J. (US)；米雪利德 麥可 MICHAELIDES, MICHAEL (US)；

謝 克里斯 TSE, CHRIS (US)；維蘇德汎 安諾 VASUDEVAN, ANIL (IN)；馬克

海穆 MACK, HELMUT (DE)；漢森 陶德 M HANSEN, TODD M. (US)；史威斯

拉姆茲 SWEIS, RAMZI (US)；波魯胥齊夫 瑪瑞納 A PLIUSHCHEV, MARINA

A. (US)

(74)代理人：陳長文

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：20 項 圖式數：0 共 1687 頁

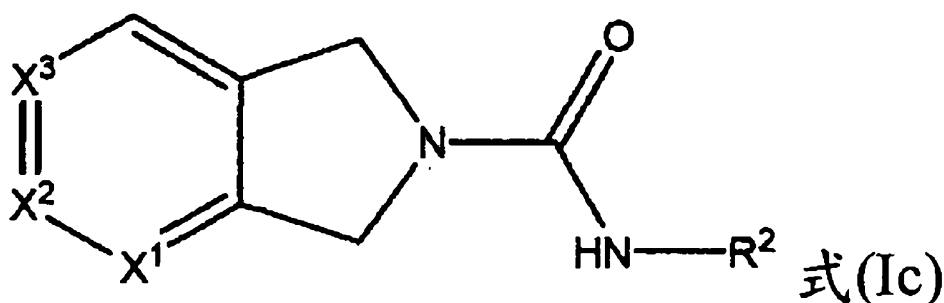
(54)名稱

NAMPT 及 ROCK 抑制劑

NAMPT AND ROCK INHIBITORS

(57)摘要

本發明揭示抑制 NAMPT 活性之化合物、含有該等化合物之組合物及治療其中表現 NAMPT 之疾病之方法。揭示抑制 ROCK 活性之化合物、含有該等化合物之組合物及治療其中表現 ROCK 之疾病之方法。



六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

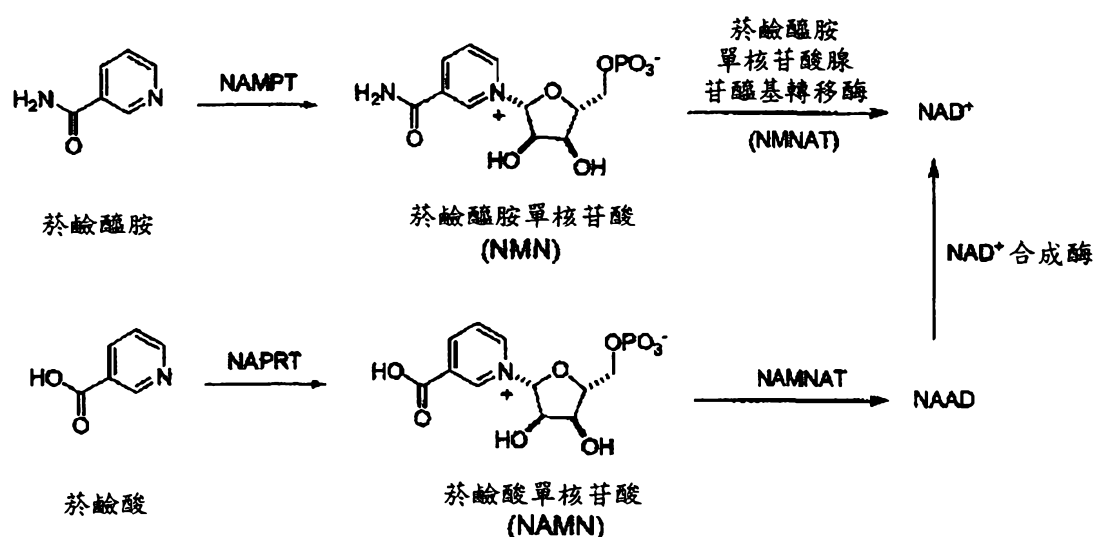
本發明係關於抑制NAMPT活性之化合物、含有該等化合物之組合物及治療其中表現NAMPT之疾病之方法。本發明亦關於抑制ROCK活性之化合物、含有該等化合物之組合物及治療其中表現ROCK之疾病之方法。

本申請案主張2010年11月15日申請之美國臨時專利申請案第61/413,722號、2011年4月11日申請之美國臨時專利申請案第61/474,015號及2011年8月19日申請之美國臨時專利申請案第61/525,405號之權益，該等專利申請案每一者之內容均以引用的方式併入本文中。

【先前技術】

NAD⁺(菸鹼醯胺腺嘌呤二核苷酸)為一種輔酶，其在許多生理基本過程中起關鍵作用(Ziegkel, M. *Eur. J. Biochem.* 267, 1550-1564, 2000)。NAD為若干信號傳導路徑，尤其包括DNA修復中之聚ADP核糖基化、免疫系統與G蛋白偶合信號傳導中之單ADP核糖基化所需，且NAD亦為斯圖因(sirtuin)之去乙醯化酶活性所需(Garten, A.等人, *Trends in Endocrinology and Metabolism*, 20, 130-138, 2008)。

NAMPT(亦稱為前B細胞群落增強因子(PBEF)及內脂素(visfatin))為一種催化菸鹼醯胺磷酸核糖基化且作為兩條救護NAD路徑之一中之限速酶的酶。



越來越多之證據表明NAMPT抑制劑可作為抗癌劑。與正常細胞相比，癌細胞之NAD基礎週轉率較高且能量需求亦較高。另外，已報導結腸直腸癌中NAMPT表現增加(Van Beijnum, J.R.等人, *Int. J. Cancer* **101**, 118-127, 2002)且NAMPT與血管生成有關(Kim, S.R.等人, *Biochem. Biophys. Res. Commun.* **357**, 150-156, 2007)。NAMPT之小分子抑制劑顯示引起細胞內NAD⁺含量減少且最終誘發腫瘤細胞死亡(Hansen, CM等人, *Anticancer Res.* **20**, 4211-4220, 2000)以及抑制異種移植模型中腫瘤生長(Olese, U.H.等人, *Mol Cancer Ther.* **9**, 1609-1617, 2010)。

NAMPT抑制劑亦可作為發炎病症及代謝障礙中之治療劑(Galli, M.等人, *Cancer Res.* **70**, 8-11, 2010)。舉例而言，NAMPT為T淋巴細胞及B淋巴細胞中之主要酶。選擇性抑制NAMPT可引起淋巴細胞中NAD⁺減少，阻斷伴隨自體免疫疾病進展之擴大，而表現其他NAD⁺產生路徑之細胞類型則未受傷害。小分子NAMPT抑制劑(FK866)顯示選擇性地阻斷活化T細胞增殖且誘發其細胞凋亡，並在關節

炎動物(膠原蛋白誘發之關節炎)模型中有效(Busso, N.等人, *Plos One* 3, e2267, 2008)。FK866改善實驗性自體免疫性腦脊髓炎(EAE)(一種T細胞介導之自體免疫病症模型)之表現形式。(Bruzzzone, S等人, *Plos One* 4, e7897, 2009)。NaMPT活性增加人類血管內皮細胞中NF- κ B轉錄活性,引起MMP-2及MMP-9活化,表明NAMPT抑制劑具有預防肥胖症及2型糖尿病之發炎介導之併發症的作用(Adya, R.等人, *Diabetes Care*, 31, 758-760, 2008)。

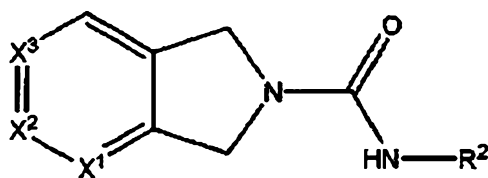
○ 作為將描述之第一Rho效應子, Rho激酶(ROCK)為對細胞遷移、細胞增殖及細胞存活之基本過程而言具有重要意義之絲胺酸/蘇胺酸激酶。已在多種病症中注意到Rho/ROCK路徑之異常活化。ROCK抑制化合物在其中因具有抗血管痙攣活性而具有潛在有益治療作用之疾病病況的實例包括心血管疾病(諸如高血壓)、慢性及充血性心臟衰竭、心臟肥大、再狹窄、慢性腎衰竭、蛛網膜下腔出血後腦血管痙攣、肺高血壓及動脈粥樣硬化。此肌肉放鬆特性亦有利於治療哮喘、男性勃起障礙、女性性功能障礙及膀胱過度活動症候群。成年脊椎動物腦與脊髓之損傷會活化ROCK,從而抑制神經突生長及發展。抑制ROCK可誘導新的軸突生長、軸突跨越CNS內病變重新佈線、加速再生及加強哺乳動物中急性神經元損傷(脊髓損傷、創傷性腦損傷)後功能恢復。抑制Rho/ROCK路徑亦證明在其他如中風、發炎及脫髓鞘疾病、阿茲海默氏症(Alzheimer's disease)之神經退化動物模型中有效,以及有效治療疼

痛。因此，Rho/ROCK路徑抑制劑可用於預防神經退化且刺激包括脊髓損傷、阿茲海默氏症、中風、多發性硬化症、肌萎縮性側索硬化之各種神經病症中之神經退化，以及用於治療疼痛。ROCK抑制劑已顯示具有消炎特性。因此，本發明之化合物可用於治療神經發炎疾病，諸如中風、多發性硬化症、阿茲海默氏症、亨廷頓氏病(Huntington's disease)、帕金森氏症(Parkinson's disease)、肌萎縮性側索硬化及發炎性疼痛以及其他疾病，諸如類風濕性關節炎、骨關節炎、哮喘、大腸急躁症、克羅恩氏病(Crohn's disease)、牛皮癬、潰瘍性結腸炎、狼瘡及發炎性腸道疾病。因為ROCK抑制劑減少細胞增殖及細胞遷移，所以其可用於治療癌症及腫瘤轉移。此外，有證據表明ROCK抑制劑抑制病毒侵襲後細胞骨架重排，因此其在抗病毒及抗細菌應用中亦具有潛在治療價值。ROCK抑制劑亦適用於治療胰島素抗性及糖尿病。另外，ROCK抑制劑顯示改善囊腫性纖維化之進展(Abstract S02.3, 8th World Congress on Inflammation, Copenhagen, Denmark, 2007年6月16-20日)。

此外，Rho相關捲曲螺旋形成蛋白激酶(ROCK)-1及-2顯示藉由抑制肌球蛋白輕鏈(MLC)磷酸酶以及磷酸化MLC，增強MLC磷酸化。此引起肌動蛋白-肌球蛋白收縮之調節。最近報導證明在與哮喘有關之肺部發炎模型中抑制ROCK可破壞發炎細胞趨化性以及抑制平滑肌收縮。因此，Rho/ROCK路徑之抑制劑可用於治療哮喘。

【發明內容】

因此，本發明之一個實施例係關於適用作 NAMPT 或 ROCK 之抑制劑的化合物及醫藥學上可接受之鹽，該等化合物具有式 (Ic)



式 (Ic)

其中

X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N；或

X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH；或

X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH；或

X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、

$\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、 OH 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 CF_3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 或 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ ；

R^2 為烷基、烯基、炔基、苯基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^2 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^4 、 OR^4 、 SR^4 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^4$ 、 SO_2R^4 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^4$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^4$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^4$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^4$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^4$ 、 $\text{NR}^4\text{C}(\text{O})\text{R}^4$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^4$ 、 $\text{NR}^4\text{S}(\text{O})_2\text{R}^4$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^4$ 、 $\text{NR}^4\text{C}(\text{O})\text{OR}^4$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^4$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^4)_2$ 、 $\text{NR}^4\text{C}(\text{O})\text{NHR}^4$ 、 $\text{NR}^4\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^4)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^4$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^4)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^4$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^4\text{SO}_2\text{R}^4$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^4 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^4)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^2 苯基視情況在對位經 1 個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^5$ 、 SO_2R^5 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 NH_2 、 NHR^5 、 $\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{S}(\text{O})_2\text{R}^5$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^5$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{NHR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^5$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 CHNOR^5 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^5$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 Br 或 I 取代；其中各 R^2 苯基視情況另外

經1個F取代；其中各 R^2 雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)R^5$ 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 $OC(O)R^5$ 、 $OC(O)OR^5$ 、 NH_2 、 NHR^5 、 $N(R^5)_2$ 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NR^5C(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $NR^5S(O)_2R^5$ 、 $NHC(O)OR^5$ 、 $NR^5C(O)OR^5$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^5$ 、 $NHC(O)N(R^5)_2$ 、 $NR^5C(O)NHR^5$ 、 $NR^5C(O)N(R^5)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^5$ 、 $C(O)NHSO_2R^5$ 、 $C(O)NR^5SO_2R^5$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、 $SO_2N(R^5)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)R^6$ 、 SO_2R^6 、 $C(O)R^6$ 、 $CO(O)R^6$ 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NHS(O)_2R^6$ 、 $NR^6S(O)_2R^6$ 、 $NHC(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^6$ 、 $NHC(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^6C(O)NHR^6$ 、 $NR^6C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^6$ 、 $C(O)NHSO_2R^6$ 、 $C(O)NR^6SO_2R^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $SO_2N(R^6)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^4 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳

基、環烷基或雜環基；其中各 R^4 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^7 、 OR^7 、 SR^7 、 $S(O)R^7$ 、 SO_2R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $OC(O)R^7$ 、 $OC(O)OR^7$ 、 NH_2 、 NHR^7 、 $NHC(O)R^7$ 、 $NR^7C(O)R^7$ 、 $NHS(O)_2R^7$ 、 $NR^7S(O)_2R^7$ 、 $NHC(O)OR^7$ 、 $NR^7C(O)OR^7$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^7$ 、 $NHC(O)N(R^7)_2$ 、 $NR^7C(O)NHR^7$ 、 $NR^7C(O)N(R^7)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^7$ 、 $C(O)N(R^7)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^7$ 、 $C(O)NHSO_2R^7$ 、 $C(O)NR^7SO_2R^7$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^7 、 $SO_2N(R^7)_2$ 、 $C(O)H$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^4 芳基及雜環基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^8 、 OR^8 、 SR^8 、 $S(O)R^8$ 、 SO_2R^8 、 $C(O)R^8$ 、 $CO(O)R^8$ 、 $OC(O)R^8$ 、 $OC(O)OR^8$ 、 NH_2 、 NHR^8 、 $NHC(O)R^8$ 、 $NR^8C(O)R^8$ 、 $NHS(O)_2R^8$ 、 $NR^8S(O)_2R^8$ 、 $NHC(O)OR^8$ 、 $NR^8C(O)OR^8$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^8$ 、 $NHC(O)N(R^8)_2$ 、 $NR^8C(O)NHR^8$ 、 $NR^8C(O)N(R^8)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^8$ 、 $C(O)N(R^8)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^8$ 、 $C(O)NHSO_2R^8$ 、 $C(O)NR^8SO_2R^8$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^8 、 $SO_2N(R^8)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $S(O)R^9$ 、 SO_2R^9 、 $C(O)R^9$ 、 $CO(O)R^9$ 、 $OC(O)R^9$ 、 $OC(O)OR^9$ 、

NH_2 、 NHR^9 、 $\text{N(R}^9)_2$ 、 NHC(O)R^9 、 $\text{NR}^9\text{C(O)R}^9$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^9$ 、
 $\text{NR}^9\text{S(O)}_2\text{R}^9$ 、 NHC(O)OR^9 、 $\text{NR}^9\text{C(O)OR}^9$ 、 NHC(O)NH_2 、
 NHC(O)NHR^9 、 $\text{NHC(O)N(R}^9)_2$ 、 $\text{NR}^9\text{C(O)NHR}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、
 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^9 、 $\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、 C(O)NHOH 、
 C(O)NHOR^9 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^9$ 、 $\text{C(O)NR}^9\text{SO}_2\text{R}^9$ 、 SO_2NH_2 、
 SO_2NHR^9 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^9)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、
 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、
 Br 或 I 取代；



R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、
 S(O)R^{10} 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $\text{N(R}^{10})_2$ 、 C(O)R^{10} 、 C(O)NH_2 、
 C(O)NHR^{10} 、 $\text{C(O)N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)R^{10} 、 $\text{NR}^{10}\text{C(O)R}^{10}$ 、
 $\text{NHSO}_2\text{R}^{10}$ 、 NHC(O)OR^{10} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、
 $\text{SO}_2\text{N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{10} 、 OH 、 (O) 、
 C(O)OH 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；



R^7 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^7 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{11} 、 OR^{11} 、 SR^{11} 、
 S(O)R^{11} 、 SO_2R^{11} 、 NHR^{11} 、 $\text{N(R}^{11})_2$ 、 C(O)R^{11} 、 C(O)NH_2 、
 C(O)NHR^{11} 、 $\text{C(O)N(R}^{11})_2$ 、 NHC(O)R^{11} 、 $\text{NR}^{11}\text{C(O)R}^{11}$ 、
 $\text{NHSO}_2\text{R}^{11}$ 、 NHC(O)OR^{11} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{11}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{11})_2$ 、
 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{11} 、 OH 、 (O) 、 C(O)OH 、 N_3 、

CN、NH₂、CF₃、CF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；

R⁸在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各R⁸烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之R¹²、OR¹²、SR¹²、S(O)R¹²、SO₂R¹²、NHR¹²、N(R¹²)₂、C(O)R¹²、C(O)NH₂、C(O)NHR¹²、C(O)N(R¹²)₂、NHC(O)R¹²、NR¹²C(O)R¹²、NH₂SO₂R¹²、NHC(O)OR¹²、SO₂NH₂、SO₂NHR¹²、SO₂N(R¹²)₂、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR¹²、OH、(O)、C(O)OH、N₃、CN、NH₂、CF₃、CF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；

R⁹在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各R⁹烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、OH、環烷基、芳基或雜環基取代；

R¹⁰在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

R¹¹在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

R¹²在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各R¹²烷基、烯基及炔基視情況經一或多個烷氧基取代；

其中由R³、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹及R¹²表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之R¹³、OR¹³、SR¹³、S(O)R¹³、SO₂R¹³、C(O)R¹³、CO(O)R¹³、OC(O)R¹³、OC(O)OR¹³、NH₂、NHR¹³、N(R¹³)₂、NHC(O)R¹³、

$\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{R}^{13}$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{13}$ 、
 $\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{13}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、
 $\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{13}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{13}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{13}\text{SO}_2\text{R}^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、
 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫呋喃-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{14}\text{SO}_2\text{R}^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、

Br或I取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2*H*-硫呋喃-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、 $NR^{15}C(O)NHR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{15}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{15}$ 、 $C(O)NR^{15}SO_2R^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{15} 、 $SO_2N(R^{15})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中 R^{14} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；其中 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH且 R^2 為苯基時， R^5 不為甲基；

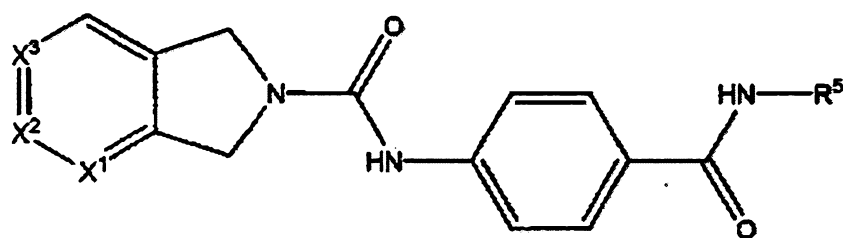
其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH且 R^2 為經 OR^5 取代之苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 R^2 為未經取代之烷基或視情況經取代之烷基時， R^2 為 C_4 - C_6 烷基；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為N。

另一個實施例係關於具有式(Vc)之化合物及其醫藥學上可接受之鹽，



(Vc)

其中

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N；或

X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH；或

X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH；或

X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、OH、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$ 或 $C(O)NH_2$ ；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)R^6$ 、 SO_2R^6 、 $C(O)R^6$ 、 $CO(O)R^6$ 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NHS(O)_2R^6$ 、 $NR^6S(O)_2R^6$ 、 $NHC(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^6$ 、 $NHC(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^6C(O)NHR^6$ 、 $NR^6C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、

$C(O)NHR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^6$ 、 $C(O)NHOSO_2R^6$ 、 $C(O)NR^6SO_2R^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $SO_2N(R^6)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $S(O)R^9$ 、 SO_2R^9 、 $C(O)R^9$ 、 $CO(O)R^9$ 、 $OC(O)R^9$ 、 $OC(O)OR^9$ 、 NH_2 、 NHR^9 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)R^9$ 、 $NHS(O)_2R^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^9$ 、 $NHC(O)OR^9$ 、 $NR^9C(O)OR^9$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^9$ 、 $NHC(O)N(R^9)_2$ 、 $NR^9C(O)NHR^9$ 、 $NR^9C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^9$ 、 $C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^9$ 、 $C(O)NHOSO_2R^9$ 、 $C(O)NR^9SO_2R^9$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $SO_2N(R^9)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $S(O)R^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $N(R^{10})_2$ 、 $C(O)R^{10}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{10}$ 、 $C(O)N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)R^{10}$ 、 $NR^{10}C(O)R^{10}$ 、 $NHSO_2R^{10}$ 、 $NHC(O)OR^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{10} 、 $SO_2N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、

CN、NH₂、CF₃、CF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；

R⁹在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各R⁹烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、OH、環烷基、芳基或雜環基取代；

R¹⁰在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由R³、R⁵、R⁶、R⁹及R¹⁰表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之R¹³、OR¹³、SR¹³、S(O)R¹³、SO₂R¹³、C(O)R¹³、CO(O)R¹³、OC(O)R¹³、OC(O)OR¹³、NH₂、NHR¹³、N(R¹³)₂、NHC(O)R¹³、NR¹³C(O)R¹³、NHS(O)₂R¹³、NR¹³S(O)₂R¹³、NHC(O)OR¹³、NR¹³C(O)OR¹³、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR¹³、NHC(O)N(R¹³)₂、NR¹³C(O)NHR¹³、NR¹³C(O)N(R¹³)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR¹³、C(O)N(R¹³)₂、C(O)NHOH、C(O)NHOR¹³、C(O)NHSO₂R¹³、C(O)NR¹³SO₂R¹³、SO₂NH₂、SO₂NHR¹³、SO₂N(R¹³)₂、C(O)H、C(O)OH、OH、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、SCF₃、F、Cl、Br或I取代；

R¹³在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩

基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、 $NR^{14}S(O)_2R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)OR^{14}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{14}$ 、 $NHC(O)N(R^{14})_2$ 、 $NR^{14}C(O)NHR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{14}$ 、 $C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{14}$ 、 $C(O)NHOSO_2R^{14}$ 、 $C(O)NR^{14}SO_2R^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{14} 、 $SO_2N(R^{14})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫嘧啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、 $NR^{15}C(O)NHR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{15}$ 、

$C(O)NHSO_2R^{15}$ 、 $C(O)NR^{15}SO_2R^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{15} 、 $SO_2N(R^{15})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為 N 。

另一個實施例係關於具有式(Ic)或式(Vc)之化合物及其醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為 CH ，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。

另一個實施例係關於具有式(Ic)或式(Vc)之化合物及其

醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為N；或 X^2 為CH，且 X^1 及 X^3 為N； X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為N；或 X^1 為CH， X^2 為N，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為N，且 X^3 為CH；或 X^1 為N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為CH；或 X^1 為N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為N。

另一個實施例係關於具有式(Ic)之化合物及其醫藥學上可接受之鹽，其中 R^2 為在對位經 R^5 取代之苯基；且 R^5 為酞嗪-1(2H)-酮基、異喹啉基、異喹啉-1(2H)-酮基、5,6,7,8-四氫酞嗪-1(2H)-酮基、5-氟酞嗪-1(2H)-酮基、(Z)-3H-苯并[d][1,2]二氮呋-4(5H)-酮基、5-(三氟甲基)酞嗪-1(2H)-酮基、吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮或異吲哚啉-1-酮基。

另一個實施例係關於如下式(Ic)化合物：

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(胺基甲基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(呋喃并[3,2-c]吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯

基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(苯甲基胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(噻吩并[3,2-c]吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(噻嗪-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二氫-1,4-苯并二氧雜環己烯-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氟苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲

啉-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吡啉-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-
異吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異
吡啉-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡
啉-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯
基)-1,3-二氮-2H-異吡啉-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基基)胺甲醯基]苯基}-5-甲基-1,3-二氮-
2H-異吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(4-氟基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-
2H-異吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡
啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吡啉-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-3-基基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啉-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-氟-5-(三氟甲基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氯苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-硝基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-

2-甲醯胺；

5-甲基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-噻吩基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-甲氧基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二

氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(3-甲氧基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(4-乙醯基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,3-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-噻吩基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

4-氯-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(6-氨基己基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶

啉-2-甲醯胺；

4-氯-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-[4-(苯甲基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(噻嗪-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(3-氟苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲

基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二羥基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-丙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-氟基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基-2-甲基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基-1H-吲唑-5-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯甲基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-({4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}胺基)-1H-吡唑-3-甲酸甲酯；

N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啶-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(5-氯吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吲哚-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,3-二氫-1,4-苯并二氧雜環己烯-6-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(5-甲氧基-1H-吲哚-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-氯苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-丙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[5-(三氟甲基)吡啶-2-基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[4-(二甲基胺基)苯基]乙基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(三氟甲氧基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟-4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-氟基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(異丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氟-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-氟苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N²-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

N-{4-[(2-苯氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-羥基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3-氟苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(3S)-四氫呋喃-3-基]-1H-吡唑-4-基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(甲基硫基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-乙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[(三氟甲基)硫基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(2-氟苯基)吡咯啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(1H-咪唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3-氯苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲

啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二
氮-2H-異吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(羥基甲基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-
異吡啉-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基胺甲醯基)苯基]-
1,3-二氮-2H-異吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-異丙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
氮-2H-異吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡
啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,5-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-
異吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異
吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-
異吡啉-2-甲醯胺；

N-[4-(硫嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啉-2-甲
醯胺；

N-[4-(5,6-二氮咪唑并[1,5-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯甲基哌啶-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(5-乙醯胺基-2-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[3-(三氟甲基)苯基]乙基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-咪唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-1-(3-氰基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-

二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[苯甲基(2-羥基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氯基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-氯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(吡啶-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(氯基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(環己基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[丁基(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(3,4-二氮異喹啉-2(1H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3-二氮-2H-異吡啶-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-

異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,3-二氫-1H-吡啶-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(苯基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(二乙基胺基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-苯基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

(1-{4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}哌啶-4-基)胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(環己基甲基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-氯苯基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二乙基胺甲醯基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-羥基乙基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-6-甲基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5,6-二氫[1,2,4]三唑并[4,3-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(5-氟吡啶-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基甲基)(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3,4,9-四氫-2H-β-吡啶-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(第三丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[4-(三氟甲基)苯基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二氟吡咯啉-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-苯甲基吡咯啉-3-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異

吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(3-氟苯基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-[4-(環戊基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(4-胺甲酰基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-[4-(環丙基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-[4-(甲基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-[4-(戊-2-基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-[4-(戊-3-基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-[4-(環丁基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(1,3-二氧戊環-2-基甲基)(甲基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[1-(4-氟苯基)-1H-吡唑-4-基]胺甲酰基}苯基)-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[4-(三氟甲基)苯基]乙基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(第二丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-乙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[丁基(乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯

胺；

N-{4-[異丁基(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-胺甲醯基苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-(三氟甲基)吡咯啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基吡咯啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[乙基(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,6-二甲基嗎啉-4-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,5-二甲基吡咯啉-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙-2-炔-1-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[異丙基(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[異丙基(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氟基乙基)(環丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[乙基(異丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟吡咯啉-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}-N-異丙基-β-丙胺酸；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5,6-二甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(4-氯苯氧基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯基-1,3-噻唑-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

2-{[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]胺甲鹽基}異吲哚啉-5-甲酸甲酯；

2-{[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]胺甲鹽基}異吲哚啉-5-甲酸；

5-胺基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-(羥基甲基)-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-(胺基甲基)-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-[(2-羥基-2-甲基丙鹽基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-乙鹽胺基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-[(N,N-二甲基甘胺鹽基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-5-(1H-吡唑-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-5-(1H-吡唑-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-[(甲氧基乙鹽基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-[(甲基磺醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二
氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-溴-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-
甲醯胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氯苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4,4,4-三氟丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡
啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡
啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-
2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲基戊醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-
2-甲醯胺；

N-(4-{[(苯甲氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-
2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[N-(2-呋喃甲醯基)甘胺醯基]胺基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-噻吩基)丁醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-側氧基-4-苯基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(N-苯甲醯基甘胺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯氧基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯
胺；

N-[4-(戊醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯
胺；

N-[4-(己醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯
胺；

N-[4-(庚醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯
胺；

N-[4-(戊-4-烯醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸甲酯；

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸；

○ N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-環戊基乙基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}-3,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯；

N-[4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1E)-5-苯基戊-1-烯-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基乙基)-1H-吡唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[6-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)吡啶-3-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-苯基戊基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[2-氟-4-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{2-氟-4-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(異丙基磺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-苯甲醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-苯甲醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(異丙基磺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯基磺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(苯甲醯基胺基)吡咯啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(丁醯基胺基)吡咯啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}哌嗪-1-甲酸第三丁酯；

N-[4-(4-丙醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環丙基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
 吡啶-2-甲醯胺；

N-(2-丁醯基-2,3-二氫-1H-異吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-異
 吡啶-2-甲醯胺；

N-(2-異丁醯基-2,3-二氫-1H-異吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-
 異吡啶-2-甲醯胺；

N-(2-苯甲醯基-2,3-二氫-1H-異吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-
 異吡啶-2-甲醯胺；

N-[2-(3-甲基丁基)-2,3-二氫-1H-異吡啶-5-基]-1,3-二氫-
 2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(己氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-
 2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-3-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-
 異吡啶-2-甲醯胺；

N-[6-(4-氯苯氧基)己基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯
 胺；

N-[4-(哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N,N'-己-1,6-二基雙(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺)；

N-(4-苯基丁基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

6-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]己酸乙酯；

N-己基-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-辛基-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)胺基]-6-側氧基己基}-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[6-(甲基胺基)-6-側氧基己基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-側氧基-6-[(3-苯基丙基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-甲基丁基)胺基]-6-側氧基己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(5-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}吡啶-2-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]-1,3-噻唑-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]-1,3-噻唑-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4,5,6,7,8-六氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(8-氟-4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-5-(吡咯啶-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(嗎啉-4-基甲基)-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氯-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-4,5-二氫-3H-2,3-苯并二氫呋-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-5-(吡咯啶-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-側氧基-8-(三氟甲基)-3,4-二氫酞嗪-1-基]苯基}-

1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-[(二甲基胺基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-[(二乙基胺基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-[(二甲基胺基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-[(二乙基胺基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-側氧基-8-(三氟甲基)-3,4-二氫酞嗪-1-基]苯基}-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-[(1-甲基哌啶-4-基)氧基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-{[(3R)-3-氟吡咯啉-1-基]甲基}-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-{[(3S)-3-氟吡咯啉-1-基]甲基}-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-(氮雜環丁烷-1-基甲基)-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)

苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}哌啶-1-甲酸第三丁酯；

N-[4-(5-丙基-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(3-甲基丁基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-苯甲基-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲

啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(5-氯吡啶-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
 吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基-4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-
 2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-
 2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-側氧基吡咯啶-1-基)苯基]胺甲醯基}苯
 基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基-2,3-二氫-1H-茛-1-基]胺甲醯基}
 苯基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-羥基環丙基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-
 2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
 氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
 氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
 氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

4-{6-[(1,3-二氫-2H-異吲啉-2-基羰基)胺基]-1H-苯并咪
 唑-2-基}哌嗪-1-甲酸第三丁酯；

N-[2-(哌嗪-1-基)-1H-苯并咪唑-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲
 啉-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-乙烯基-1,3-二氫-2H-異吲

噪-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯甲醯基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲噪-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(四氫呋喃-3-基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲噪-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲噪-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基丁基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(3-苯基丙基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲噪-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲噪-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(四氫呋喃-3-基甲基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲噪-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲噪-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-甲氧基乙基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-(2-羥基乙基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-3-基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-4-基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N⁵-(2-甲氧基乙基)-N²-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

N-(4-氟基苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(三氟甲基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-吡啶-2-基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基丁基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(四氫呋喃-3-基甲基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(4-吡啶-2-基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-吡啶-2-基乙基]胺基}羰基)苯基]-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(1,2-二羥基乙基)-N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-5-氰基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-丁醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；及

N-[2-(4-乙醯基哌嗪-1-基)-1H-苯并咪唑-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-D-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(甲氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(乙氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-氯苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(二甲基胺基)苯甲醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[4-(二甲基胺基)苯甲醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-呋喃甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-噻吩基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡咯-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,5-二甲基-1H-吡咯-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,3-噻唑-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡唑-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3,5-二甲基-1,2-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫

吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異菸鹼醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(噻嗪-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嘧啶-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-苯甲醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[6-(苯甲醯基胺基)己基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[(苯甲醯基胺基)甲基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-

5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(5-側氧基-L-脯胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(5-側氧基-D-脯胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(1-乙醯基哌啶-4-基)羰基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-乙醯胺基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[4-(甲基磺醯基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-丁醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-異丁醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-甲基丁醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3,3,3-三氟丙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(甲氧基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫呋喃-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫呋喃-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環戊基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環己基羧基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-氯苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-氯苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-氟基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-氟基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[3-(二甲基胺基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[4-(二甲基胺基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3,4-二甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3,5-二甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)乙醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(1H-吡咯-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(1H-吡唑-5-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡啶-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡啶-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-異菸鹼醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(噻嗪-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡嗪-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(嘧啶-4-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(N,N-二甲基-β-丙胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-乙醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-

甲醯胺；

N-{4-[4-(2-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異

吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(1,3-噻唑-4-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(嗎啉-4-基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-苯基丁基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二

氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二

氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-2,3-二氫-1H-異吲哚-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)環己-3-烯-1-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)環己-3-烯-1-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)環己-3-烯-1-基]-5-(吡咯啶-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1-(2-苯基乙基)-1H-吡唑-4-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N^5 -[2-(二甲基胺基)乙基]- N^2 -[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

5-(嗎啉-4-基羰基)-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-[4-(異丁氧基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-溴-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{[(5-氟基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲酸甲酯；

○ N-(4-{(E)-[(苯甲氧基)亞胺基]甲基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(3-胺基吡咯啶-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{6-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{6-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{6-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N²-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

N-[4-({苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}甲基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(1H-吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(1-甲基-1H-吡啶-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N^2 -{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}- N^5 -(2-甲氧基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

N^2 -{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}- N^5 -(2-羥基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

5-(胺基甲基)-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-(甲基硫基)丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[(2S,3S)-1-羥基-3-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S,3R)-1,3-二羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基己-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[(2S)-1-羥基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基環戊基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2R)-2-羥基環戊基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-環己基-3-羥基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({(2R)-1-羥基-3-[(4-甲基苯基)硫基]丙-2-基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-第三丁基苯基)-2-羥基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-甲氧基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲氧基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[6-(苯甲鹽基胺基)己基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(吡啶-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-{6-[(環戊基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ 5-(羥基甲基)-N-(4-苯基丁基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]吡嗪-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-乙醯胺基己基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-

基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{(1E)-3-[苯甲基(甲基)胺基]丙-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-苯氧基哌啶-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3-苯氧基氮雜環丁烷-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[苯甲基(甲基)胺基]甲基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-

吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(5,6-二氫咪唑并[1,5-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲基-1H-1,2,3-三唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[2-(2-側氧基吡咯啶-1-基)乙基]-1H-1,2,3-三唑-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1-苯甲基哌啶-4-基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-苯基丙基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]-1H-1,2,3-三唑-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基-1H-1,2,3-三唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基甲基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲氧基丙基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]吡啶-2-基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氮-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(1'-苯甲醯基-1',2',3',6'-四氮-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氮-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{1'-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1',2',3',6'-四氮-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[4-(甲基磺醯基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(乙氧基乙醯基)胺基]己基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-

2-甲醯胺；

N-{6-[(環戊基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(2-羥基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-羥基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(4-羥基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(2-甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(4-甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(2-氟苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-氟苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(4-氟苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(2-氯苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-氯苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-

2-甲醯胺；

N-{6-[(4-氯苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-

2-甲醯胺；

N-{6-[(3-氯基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲

哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(4-氯基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲

哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[3-(二甲基胺基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[4-(二甲基胺基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[3-(三氟甲基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[4-(三氟甲基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[3-(三氟甲氧基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(2,3-二甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(2,4-二甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(2,5-二甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(苯基乙醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-

甲 醯 胺 ；

N-(6-{[(3-氟苯基)乙醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺 ；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫呋喃-2-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺 ；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺 ；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺 ；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(嗎啉-4-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺 ；

N-[4-(嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺 ；

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺 ；

N-[6-(苯甲醯基胺基)己基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺 ；

4-氟-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺 ；

5-氟-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺 ；

5-甲氧基-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺 ；

N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-5-(三氟甲基)-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氟基-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲基-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氯-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氯-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(吡啶-2-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-2-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氮-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氮-2H-哌喃-4-基羰基)-1',2',3',6'-四氮-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氮-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氮-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1',2',3',6'-

四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡咯啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(7-側氧基-7-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺基}庚基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{7-側氧基-7-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺基]庚基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(氮雜環丁烷-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氯-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(異丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(環戊基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-噻吩基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯

并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[苯甲基(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡

咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(嗎啉-4-基甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-{[(3-甲基丁基)胺基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-羥基哌啶-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-氯苯甲醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]

苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-胺基乙基)-1H-咪唑-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-甲氧基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(4S)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(4R)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-2-側氧基乙

基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(3-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-3-側氧基丙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

4-氟基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-甲基-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

4-氯-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氯-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(6-溴-2-側氧基喹啉-1(2H)-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[6-(3-乙醯基苯基)-2-側氧基喹啉-1(2H)-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯

基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(嗎啉-4-基乙醯基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(嗎啉-4-基乙醯基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(2-{(4-氟苯基)[4-(吡啶-3-基)苯基]胺基}-1,3-噻唑-5-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2-苯基-1,3-噻唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(7-{苯基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-7-側氧基庚基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1,3-噻唑-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(4-甲基苯基)乙基]胺甲醯基}苯

基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1,3-二羥基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(2-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(四氫呋喃-2-基羰基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(乙基磺醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(2,3-二羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1-羥基-4-甲基戊-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲醯基}苯

基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(5-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}吡啶-2-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[3.3]庚-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[3.4]辛-6-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氫雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氫雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氫雜螺[4.4]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氫雜螺[4.4]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氫雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氫雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-3-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(六氮-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(四氮-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(六氮呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-4-側氧基丁
基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-苯基丁基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯

胺；

N-[4-(2-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-乙醯基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(1-羥基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丁醯基胺基)苯基]-5-氟基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡咯啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-吡咯啶-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲氧基苯甲基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-6-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)

苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氫雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氫雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氫雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氫雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氫雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(2-氧雜-7-氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(六氫-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(四氫-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(六氫呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[6-(3-乙醯基苯基)-4-(3-羥基丙基)-2-側氧基喹啉-1(2H)-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-(乙醯胺基甲基)-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[2-(2-氯苯甲基)-1,3-噻唑-4-基]-2-噻吩基}-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-氟苯基)丁基]-5-(羥基甲基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(3R)-1-異丁醯基吡咯啉-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-[4-({[(3R)-1-苯甲醯基吡咯啉-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(四氫呋喃-3-基羰基)吡咯啉-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(甲基磺醯基)吡咯啉-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基-1,2,3,6-四氮吡啉-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)-1,2,3,6-四氮吡啉-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮-2H-哌喃-4-基甲基)-1,2,3,6-四氮吡啉-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基哌啉-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)哌啉-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮-2H-哌喃-4-基甲基)哌啉-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(2-羥基丙-2-基)-

1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

{4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯甲基}胺基甲酸第三丁酯；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(甲氧基甲基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(5-{[(四氫呋喃-2-基甲基)胺基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-甲氧基哌啶-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(5-{[4-(2-甲氧基乙基)哌嗪-1-基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(嗎啉-4-基)環戊基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-戊醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丁醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-

二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(1-乙醯基哌啶-4-基)氧基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(1-異丁醯基哌啶-4-基)氧基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(4,4,4-三氟丁醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-

基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環丙基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環丁基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環戊基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

(2-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}乙基)胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-

基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(4,4,4-三氟丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為 N。

在式 (VIIIc) 之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH；或 X^1 及 X^3 為 CH，且 X^2 為 N；或 X^1 及 X^3 為 CH，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為 CH，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為 CH，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為 CH，且 X^1 及 X^3 為 N；或 X^2 及 X^3 為 CH，且 X^1 為 N；或 X^1 為 CH， X^2 為 N，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為 N，且 X^3 為 CH；或 X^1 為 N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 CH；或 X^1 為 N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 N。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N。

在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、

$C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立

選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、

NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 C(O)NH_2 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (VIIIc) 之另一

個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各

烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中，

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 為

CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3

為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式 (VIIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{R}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIIIc) 之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或

X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 N ；或

X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為 CH ；且 X^1 及 X^3 為 N ；或

X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 N ；或

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、

$C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基或雜環基；其中各 R^3 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、OH、F、Cl、Br或I取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基或雜環基；其中各 R^6 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之F、Cl、Br或I取代；

○ R^8 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^8 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{12} 、 OR^{12} 、OH、 CF_3 、F、Cl、Br或I取代；

R^{12} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、雜環基或環烷基；其中各 R^{12} 烷基視情況經一或多個烷氧基取代；

其中由 R^3 、 R^6 、 R^8 及 R^{12} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 NH_2 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、OH、CN、 CF_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、F、Cl、Br或I取代；

○ R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩

N-(4-{[1-(環戊基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-苯基丙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(苯基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-甲氧基苯基)乙醯基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯甲醯基吡咯啉-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-乙氧基丙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2-甲基環丙基)羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SO_2R^{14} 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 OH 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^{14} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基及環烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；其中 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為N。

在式(VIIIc)之另一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基或雜環基；其中各 R^3 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或OH取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基或雜環基；

R^8 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^8 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{12} 、 OR^{12} 、OH或 CF_3 取代；

R^{12} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、雜環基或環烷基；其中各 R^{12} 烷基視情況經一或多個烷氧基取代；

其中由 R^3 、 R^6 、 R^8 及 R^{12} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SO_2R^{13} 、

$C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 NH_2 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、 F 或 Cl 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫嘧啶基、嘧啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SO_2R^{14} 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 OH 或 CF_3 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫嘧啶基、嘧啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 CN 、 OH 、 CF_3 、 F 或 Cl 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^{14} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基或 OH 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基及

環烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、OH或Cl取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；其中 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為N。

另一個實施例係關於具有式(VIIIc)之化合物，其包括

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-3-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-5-氟基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-2-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-氯苯甲醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4,4-二氟環己基)羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(丙-2-基氧基)乙醯基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4,4,4-三氟丁醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氮-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

醫藥組合物、組合療法、治療方法及投藥

另一個實施例包含包括具有式(I)之化合物及賦形劑的醫藥組合物。

另一個實施例包含治療哺乳動物之癌症的方法，其包含向該哺乳動物投與治療上可接受之量的具有式(I)之化合物。

另一個實施例係關於治療其中表現NAMPT之疾病的組合物，該等組合物包含賦形劑及治療有效量之具有式(I)之化合物。

另一個實施例係關於治療其中表現ROCK之疾病的組合物，該等組合物包含賦形劑及治療有效量之具有式(I)之化合物。

另一個實施例係關於治療患者之其中表現NAMPT之疾病的方法，該等方法包含向該患者投與治療有效量之具有式(I)之化合物。

另一個實施例係關於治療患者之其中表現ROCK之疾病的方法，該等方法包含向該患者投與治療有效量之具有式(I)之化合物。

另一個實施例係關於用於治療如下病症之組合物，該等組合物包含賦形劑及治療有效量之具有式(I)之化合物，該等病症為發炎及組織修復病症；尤其類風濕性關節炎、發炎性腸道疾病、哮喘及COPD(慢性阻塞性肺病)、骨關節

炎、骨質疏鬆症及纖維化疾病；皮膚病，包括牛皮癬、異位性皮炎及紫外線誘發之皮膚損害；自體免疫疾病，包括全身性紅斑狼瘡、多發性硬化症、牛皮癬性關節炎、強直性脊柱炎、組織及器官排斥反應、阿茲海默氏症、中風、動脈粥樣硬化、再狹窄、糖尿病、腎小球性腎炎、癌症(尤其其中癌症係選自乳癌、前列腺癌、肺癌、結腸癌、子宮頸癌、卵巢癌、皮膚癌、CNS癌、膀胱癌、胰臟癌、白血病、淋巴瘤或霍奇金氏病)、惡病質、與感染有關之發炎及某些病毒感染，包括後天免疫缺乏症候群(AIDS)、成人呼吸窘迫症候群及共濟失調毛細管擴張症。

另一個實施例係關於用於治療如下病症、用於減少缺血-再灌注損傷、心肌梗塞面積及心肌纖維化、用於預防移植失敗及囊腫性纖維化之組合物，該等組合物包含賦形劑及治療有效量之具有式(I)之化合物，該等病症為高血壓、慢性及充血性心臟衰竭、心臟肥大、再狹窄、慢性腎衰竭、蛛網膜下腔出血後腦血管痙攣、肺高血壓、動脈粥樣硬化、哮喘、男性勃起障礙、女性性功能障礙、膀胱過度活動症候群、脊髓損傷、創傷性腦損傷、中風、發炎及脫髓鞘疾病、阿茲海默氏症、疼痛、多發性硬化症、肌萎縮性側索硬化、亨廷頓氏病、帕金森氏症、發炎性疼痛、類風濕性關節炎、骨關節炎、大腸急躁症、克羅恩氏病、牛皮癬、潰瘍性結腸炎、狼瘡、發炎性腸道疾病、癌症、腫瘤轉移、病毒感染、細菌感染、胰島素抗性、糖尿病、眼高壓、早產、動脈粥樣硬化、脊髓性肌萎縮、腦脊髓

炎、骨質疏鬆症、HIV-1、腦炎、缺血性CNS病症、血管型或AD型癡呆、青光眼、視網膜病、良性前列腺肥大、精神病症(尤其抑鬱症、精神分裂症、強迫症及躁鬱症)、癲癇症及癲癇發作病症。

另一個實施例係關於治療患者之如下病症之方法，該等方法包含向該患者投與治療有效量之具有式(I)之化合物，該等病症為發炎及組織修復病症；尤其類風濕性關節炎、發炎性腸道疾病、哮喘及COPD(慢性阻塞性肺病)、骨關節炎、骨質疏鬆症及纖維化疾病；皮膚病，包括牛皮癬、異位性皮炎及紫外線誘發之皮膚損害；自體免疫疾病，包括全身性紅斑狼瘡、多發性硬化症、牛皮癬性關節炎、強直性脊柱炎、組織及器官排斥反應、阿茲海默氏症、中風、動脈粥樣硬化、再狹窄、糖尿病、腎小球性腎炎、癌症(尤其其中癌症係選自乳癌、前列腺癌、肺癌、結腸癌、子宮頸癌、卵巢癌、皮膚癌、CNS癌、膀胱癌、胰臟癌、白血病、淋巴瘤或霍奇金氏病)、惡病質、與感染有關之發炎及某些病毒感染，包括後天免疫缺乏症候群(AIDS)、成人呼吸窘迫症候群及共濟失調毛細管擴張症。

另一個實施例係關於治療如下病症、用於減少缺血-再灌注損傷、心肌梗塞面積及心肌纖維化、用於預防移植失敗及囊腫性纖維化之方法，該等方法包含向患者投與治療有效量之具有式(I)之化合物，該等病症為高血壓、慢性及充血性心臟衰竭、心臟肥大、再狹窄、慢性腎衰竭、蛛網膜下腔出血後腦血管痙攣、肺高血壓、動脈粥樣硬化、哮

喘、男性勃起障礙、女性性功能障礙、膀胱過度活動症候群、脊髓損傷、創傷性腦損傷、中風、發炎及脫髓鞘疾病、阿茲海默氏症、疼痛、多發性硬化症、肌萎縮性側索硬化、亨廷頓氏病、帕金森氏症、發炎性疼痛、類風濕性關節炎、骨關節炎、大腸急躁症、克羅恩氏病、牛皮癬、潰瘍性結腸炎、狼瘡、發炎性腸道疾病、癌症、腫瘤轉移、病毒感染、細菌感染、胰島素抗性、糖尿病、眼高壓、早產、動脈粥樣硬化、脊髓性肌萎縮、腦脊髓炎、骨質疏鬆症、HIV-1、腦炎、缺血性CNS病症、血管型或AD型癡呆、青光眼、視網膜病、良性前列腺肥大、精神病症(尤其抑鬱症、精神分裂症、強迫症及躁鬱症)、癲癇症及癲癇發作病症。

另一個實施例係關於治療其中表現NAMPT之疾病的組合物，該等組合物包含賦形劑及治療有效量之具有式(I)之化合物及治療有效量之一種其他治療劑或一種以上其他治療劑。

另一個實施例係關於治療其中表現ROCK之疾病的組合物，該等組合物包含賦形劑及治療有效量之具有式(I)之化合物及治療有效量之一種其他治療劑或一種以上其他治療劑。

另一個實施例係關於治療患者的其中表現NAMPT之疾病的方法，該等方法包含向該患者投與治療有效量之具有式(I)之化合物及治療有效量之一種其他治療劑或一種以上其他治療劑。

另一個實施例係關於治療患者的其中表現ROCK之疾病的方法，該等方法包含向該患者投與治療有效量之具有式(I)之化合物及治療有效量之一種其他治療劑或一種以上其他治療劑。

另一個實施例係關於用於治療如下病症之組合物，該等組合物包含賦形劑及治療有效量之具有式(I)之化合物及治療有效量之一種其他治療劑或一種以上其他治療劑，該等病症為發炎及組織修復病症；尤其類風濕性關節炎、發炎性腸道疾病、哮喘及COPD(慢性阻塞性肺病)、骨關節炎、骨質疏鬆症及纖維化疾病；皮膚病，包括牛皮癬、異位性皮炎及紫外線誘發之皮膚損害；自體免疫疾病，包括全身性紅斑狼瘡、多發性硬化症、牛皮癬性關節炎、強直性脊柱炎、組織及器官排斥反應、阿茲海默氏症、中風、動脈粥樣硬化、再狹窄、糖尿病、腎小球性腎炎、癌症(尤其其中癌症係選自乳癌、前列腺癌、肺癌、結腸癌、子宮頸癌、卵巢癌、皮膚癌、CNS癌、膀胱癌、胰臟癌、白血病、淋巴瘤或霍奇金氏病)、惡病質、與感染有關之發炎及某些病毒感染，包括後天免疫缺乏症候群(AIDS)、成人呼吸窘迫症候群及共濟失調毛細管擴張症。

另一個實施例係關於用於治療如下病症、用於減少缺血-再灌注損傷、心肌梗塞面積及心肌纖維化、用於預防移植失敗及囊腫性纖維化之組合物，該等組合物包含賦形劑及治療有效量之具有式(I)之化合物及治療有效量之一種其他治療劑或一種以上其他治療劑，該等病症為高血壓、

N-[4-({1-[(1-甲基環丙基)羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基吡咯啉-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(4,4,4-三氟丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙氧基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基哌啶-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡

慢性及充血性心臟衰竭、心臟肥大、再狹窄、慢性腎衰竭、蛛網膜下腔出血後腦血管痙攣、肺高血壓、動脈粥樣硬化、哮喘、男性勃起障礙、女性性功能障礙、膀胱過度活動症候群、脊髓損傷、創傷性腦損傷、中風、發炎及脫髓鞘疾病、阿茲海默氏症、疼痛、多發性硬化症、肌萎縮性側索硬化、亨廷頓氏病、帕金森氏症、發炎性疼痛、類風濕性關節炎、骨關節炎、大腸急躁症、克羅恩氏病、牛皮癬、潰瘍性結腸炎、狼瘡、發炎性腸道疾病、癌症、腫瘤轉移、病毒感染、細菌感染、胰島素抗性、糖尿病、眼高壓、早產、動脈粥樣硬化、脊髓性肌萎縮、腦脊髓炎、骨質疏鬆症、HIV-1、腦炎、缺血性CNS病症、血管型或AD型癡呆、青光眼、視網膜病、良性前列腺肥大、精神病症(尤其抑鬱症、精神分裂症、強迫症及躁鬱症)、癲癇症及癲癇發作病症。

另一個實施例係關於治療患者之如下病症之方法，該等方法包含向該患者投與治療有效量之具有式(I)之化合物及治療有效量之一種其他治療劑或一種以上其他治療劑，該等病症為發炎及組織修復病症；尤其類風濕性關節炎、發炎性腸道疾病、哮喘及COPD(慢性阻塞性肺病)、骨關節炎、骨質疏鬆症及纖維化疾病；皮膚病，包括牛皮癬、異位性皮炎及紫外線誘發之皮膚損害；自體免疫疾病，包括全身性紅斑狼瘡、多發性硬化症、牛皮癬性關節炎、強直性脊柱炎、組織及器官排斥反應、阿茲海默氏症、中風、動脈粥樣硬化、再狹窄、糖尿病、腎小球性腎炎、癌症

(尤其其中癌症係選自乳癌、前列腺癌、肺癌、結腸癌、子宮頸癌、卵巢癌、皮膚癌、CNS癌、膀胱癌、胰臟癌、白血病、淋巴瘤或霍奇金氏病)、惡病質、與感染有關之發炎及某些病毒感染，包括後天免疫缺乏症候群(AIDS)、成人呼吸窘迫症候群及共濟失調毛細管擴張症。

另一個實施例係關於用於治療患者之如下病症、用於減少患者之缺血-再灌注損傷、心肌梗塞面積及心肌纖維化、用於預防患者之移植失敗及囊腫性纖維化的方法，該等方法包含向該患者投與治療有效量之具有式(I)之化合物及治療有效量之一種其他治療劑或一種以上其他治療劑，該等病症為高血壓、慢性及充血性心臟衰竭、心臟肥大、再狹窄、慢性腎衰竭、蛛網膜下腔出血後腦血管痙攣、肺高血壓、動脈粥樣硬化、哮喘、男性勃起障礙、女性性功能障礙、膀胱過度活動症候群、脊髓損傷、創傷性腦損傷、中風、發炎及脫髓鞘疾病、阿茲海默氏症、疼痛、多發性硬化症、肌萎縮性側索硬化、亨廷頓氏病、帕金森氏症、發炎性疼痛、類風濕性關節炎、骨關節炎、大腸急躁症、克羅恩氏病、牛皮癬、潰瘍性結腸炎、狼瘡、發炎性腸道疾病、癌症、腫瘤轉移、病毒感染、細菌感染、胰島素抗性、糖尿病、眼高壓、早產、動脈粥樣硬化、脊髓性肌萎縮、腦脊髓炎、骨質疏鬆症、HIV-1、腦炎、缺血性CNS病症、血管型或AD型癡呆、青光眼、視網膜病、良性前列腺肥大、精神病症(尤其抑鬱症、精神分裂症、強迫症及躁鬱症)、癲癇症及癲癇發作病症。

藉由活體外或活體內代謝過程產生的具有式(I)之化合物之代謝物亦可用於治療與NAMPT相關之疾病。

藉由活體外或活體內代謝過程產生的具有式(I)之化合物之代謝物亦可用於治療與ROCK相關之疾病。

某些可在活體外或活體內代謝形成具有式(I)之化合物的前驅化合物亦可用於治療與NAMPT相關之疾病。

某些可在活體外或活體內代謝形成具有式(I)之化合物的前驅化合物亦可用於治療與ROCK相關之疾病。

具有式(I)之化合物可呈酸加成鹽、鹼加成鹽或兩性離子形式存在。化合物之鹽在化合物分離期間或純化後製備。化合物之酸加成鹽為由化合物與酸反應而產生之鹽。預期本發明涵蓋例如化合物之乙酸鹽、己二酸鹽、海藻酸鹽、碳酸氫鹽、檸檬酸鹽、天冬胺酸鹽、苯甲酸鹽、苯磺酸鹽、硫酸氫鹽、丁酸鹽、樟腦酸鹽、樟腦磺酸鹽、二葡萄糖酸鹽、甲酸鹽、反丁烯二酸鹽、甘油磷酸鹽、麩胺酸鹽、半硫酸鹽、庚酸鹽、己酸鹽、鹽酸鹽、氫溴酸鹽、氫碘酸鹽、乳糖酸鹽、乳酸鹽、順丁烯二酸鹽、均三甲苯磺酸鹽、甲烷磺酸鹽、苯磺酸鹽、菸鹼酸鹽、乙二酸鹽、雙羥萆酸鹽、果膠酸鹽、過硫酸鹽、磷酸鹽、苦味酸鹽、丙酸鹽、丁二酸鹽、酒石酸鹽、硫氰酸鹽、三氯乙酸鹽、三氯乙酸鹽、對甲苯磺酸鹽及十一烷酸鹽。化合物之鹼加成鹽為由化合物與諸如鋰、鈉、鉀、鈣及鎂之陽離子之氫氧化物、碳酸鹽或碳酸氫鹽反應所產生的鹽。

具有式(I)之化合物可例如經頰、經眼、經口、滲透、非

經腸(肌肉內、腹膜內、胸骨內、靜脈內、皮下)、經直腸、局部、經皮或經陰道投與。

具有式(I)之化合物的治療有效量視治療之接受者、治療之病症及其嚴重程度、含有化合物之組合物、投藥時間、投藥途徑、治療持續時間、化合物效力、其清除率及是否有另一藥物共同投與而定。用以製成每日以單次劑量或分次劑量投與患者之組合物的具有式(I)之本發明化合物之量為每公斤體重約0.03至約200 mg。單次劑量組合物含有此等量或其次分量組合。

具有式(I)之化合物可在賦形劑存在或不存在下投與。賦形劑包括例如囊封材料或添加劑，諸如吸收促進劑、抗氧化劑、黏合劑、緩衝劑、塗佈劑、著色劑、稀釋劑、崩解劑、乳化劑、增量劑、填充劑、調味劑、保濕劑、潤滑劑、香料、防腐劑、推進劑、釋放劑、滅菌劑、甜味劑、增溶劑、濕潤劑及其混合物。

用於製備欲以固體劑型經口投與的包含具有式(I)之化合物之組合物的賦形劑包括例如瓊脂、海藻酸、氫氧化鋁、苯甲醇、苯甲酸苯甲酯、1,3-丁二醇、卡波姆(carbomer)、蓖麻油、纖維素、醋酸纖維素、可可脂、玉米澱粉、玉米油、棉籽油、交聯聚維酮、二酸甘油酯、乙醇、乙基纖維素、月桂酸乙酯、油酸乙酯、脂肪酸酯、明膠、胚芽油、葡萄糖、甘油、落花生油、羥丙基甲基纖維素、異丙醇、等張生理食鹽水、乳糖、氫氧化鎂、硬脂酸鎂、麥芽糖、甘露糖醇、單酸甘油酯、橄欖油、花生油、磷酸鉀鹽、馬

鈴薯澱粉、聚維酮、丙二醇、林格氏溶液(Ringer's solution)、紅花子油、芝麻油、羧甲基纖維素鈉、磷酸鈉鹽、月桂基硫酸鈉、山梨糖醇鈉、大豆油、硬脂酸、硬脂醯反丁烯二酸鹽、蔗糖、界面活性劑、滑石、黃耆膠、四氫糠醇、三酸甘油酯、水及其混合物。用於製備欲以液體劑型經眼或經口投與的包含具有式(I)之本發明化合物之組合物的賦形劑包括例如1,3-丁二醇、蓖麻油、玉米油、棉籽油、乙醇、脫水山梨糖醇之脂肪酸酯、胚芽油、落花生油、甘油、異丙醇、橄欖油、聚乙二醇、丙二醇、芝麻油、水及其混合物。用於製備欲滲透性投與的包含具有式(I)之本發明化合物之組合物的賦形劑包括例如氯氟烴、乙醇、水及其混合物。用於製備欲非經腸投與的包含具有式(I)之本發明化合物之組合物的賦形劑包括例如1,3-丁二醇、蓖麻油、玉米油、棉籽油、右旋糖、胚芽油、落花生油、脂質體、油酸、橄欖油、花生油、林格氏溶液、紅花子油、芝麻油、大豆油、U.S.P.或等張氯化鈉溶液、水及其混合物。用於製備欲經直腸或經陰道投與的包含具有式(I)之本發明化合物之組合物的賦形劑包括例如可可脂、聚乙二醇、蠟及其混合物。

具有式(I)之化合物預期在與以下一起使用時為適用的：烷基化劑、血管生成抑制劑、抗體、抗代謝物、抗有絲分裂劑、抗增生劑、抗病毒劑、極光激酶(aurora kinase)抑制劑、細胞凋亡促進劑(例如Bcl-xL、Bcl-w及Bfl-1)抑制劑、死亡受體路徑活化劑、Bcr-Abl激酶抑制劑、BiTE(雙

特異性T細胞誘引體)抗體、抗體藥物結合物、生物反應調節劑、週期素依賴性激酶抑制劑、細胞週期抑制劑、環加氧酶-2抑制劑、DVD、白血病毒致癌基因同源物(ErbB2)受體抑制劑、生長因子抑制劑、熱休克蛋白(HSP)-90抑制劑、組蛋白脫乙酰基酶(HDAC)抑制劑、激素治療劑、免疫藥物、細胞凋亡蛋白抑制劑(IAP)之抑制劑、嵌入抗生素、激酶抑制劑、運動素抑制劑、Jak2抑制劑、哺乳動物雷帕黴素標靶抑制劑(mammalian target of rapamycin inhibitor)、微核糖核酸、有絲分裂原活化之細胞外信號調節激酶抑制劑、多價結合蛋白、非類固醇消炎藥(NSAID)、聚ADP(二磷酸腺苷)-核糖聚合酶(PARP)抑制劑、鉑化學治療劑、polo樣激酶(polo-like kinase, Plk)抑制劑、磷酸肌醇-3激酶(PI3K)抑制劑、蛋白酶體抑制劑、嘌呤類似物、嘧啶類似物、受體酪氨酸激酶抑制劑、類視黃素/類維生素D(deltoid)、植物鹼、小型抑制性核糖核酸(siRNA)、拓撲異構酶抑制劑、泛素連接酶抑制劑及其類似物，及與一或多種此等藥劑之組合。

BiTE抗體為藉由同時結合T細胞與癌細胞來引導T細胞攻擊癌細胞之雙特異性抗體。T細胞接著攻擊標靶癌細胞。BiTE抗體之實例包括阿達木單抗(adecatumumab)(Micromet MT201)、布林莫單抗(blinatumomab)(Micromet MT103)及其類似物。不受理論限制，T細胞引起標靶癌細胞出現細胞凋亡之機制之一為胞外分泌包括穿孔素及顆粒酶B在內之細胞溶解性顆粒組分。就此而言，Bcl-2已展示

其會削弱穿孔素與顆粒酶B對細胞凋亡之誘導作用。此等資料表明，抑制Bcl-2可增強T細胞在靶向癌細胞時所引起之細胞毒作用(V.R. Sutton, D.L. Vaux及J.A. Trapani, *J. of Immunology* 1997, 158 (12), 5783)。

siRNA為具有內源性RNA鹼基或經化學修飾之核苷酸的分子。該等修飾不但不會消除細胞活性，反而可提高穩定性及/或增強細胞效能。化學修飾之實例包括硫代磷酸酯基、2'-去氧核苷酸、含有2'-OCH₃之核糖核苷酸、2'-F-核糖核苷酸、2'-甲氧基乙基核糖核苷酸、其組合及其類似物。siRNA可具有不同長度(例如10-200 bp)及結構(例如髮夾、單/雙股、突起、缺口/間隙、錯配)且在細胞中經加工以提供活性基因沉默。雙股siRNA(dsRNA)可在各股上具有相同數目之核苷酸(鈍端)或具有不對稱末端(突出物)。具有1-2個核苷酸之突出物可存在於有義股及/或反義股上，以及存在於既定股之5'末端及/或3'末端上。

多價結合蛋白為包含兩個或兩個以上抗原結合位點之結合蛋白。多價結合蛋白經工程改造以具有三個或三個以上抗原結合位點且一般不為天然存在之抗體。術語「多特異性結合蛋白」意謂能夠結合兩種或兩種以上相關或不相關標靶之結合蛋白。雙可變域(DVD)結合蛋白為包含兩個或兩個以上抗原結合位點之四價或多價結合蛋白。該等DVD可具單特異性(亦即能夠結合一種抗原)或多特異性(亦即能夠結合兩種或兩種以上抗原)。包含兩個重鏈DVD多肽及兩個輕鏈DVD多肽之DVD結合蛋白稱為DVD Ig。每一半

DVD Ig皆包含一個重鏈DVD多肽、一個輕鏈DVD多肽及兩個抗原結合位點。各結合位點包含重鏈可變域及輕鏈可變域，其中每個抗原結合位點具有總共6個參與抗原結合之CDR。

烷基化劑包括六甲蜜胺(altretamine)、AMD-473、AP-5280、阿紫吡醌(apaziquone)、苯達莫司汀(bendamustine)、布斯利辛(brostallicin)、白消安(busulfan)、卡波醌(carboquone)、卡莫司汀(carmustine)(BCNU)、苯丁酸氮芥(chlorambucil)、CLORETAZINE®(拉莫司汀(laromustine)，VNP 40101M)、環磷醯胺(cyclophosphamide)、達卡巴嗪(decarbazine)、雌莫司汀(estramustine)、福莫司汀(fotemustine)、葡磷醯胺(glufosfamide)、異環磷醯胺(ifosfamide)、KW-2170、洛莫司汀(lomustine)(CCNU)、馬磷醯胺(mafosfamide)、美法倫(melphalan)、二溴甘露醇(mitobronitol)、二溴衛矛醇(mitolactol)、尼莫司汀(nimustine)、氮芥N-氧化物、雷莫司汀(ranimustine)、替莫唑胺(temozolomide)、噻替派(thiotepa)、TREANDA®(苯達莫司汀)、曲奧舒凡(treosulfan)、曲磷胺(trofosfamide)及其類似物。

血管生成抑制劑包括內皮特異性受體酪胺酸激酶(Tie-2)抑制劑、表皮生長因子受體(EGFR)抑制劑、胰島素生長因子-2受體(IGFR-2)抑制劑、基質金屬蛋白酶-2(MMP-2)抑制劑、基質金屬蛋白酶-9(MMP-9)抑制劑、血小板衍生生長因子受體(PDGFR)抑制劑、凝血栓蛋白類似物、血管內

皮生長因子受體酪胺酸激酶(VEGFR)抑制劑及其類似物。

抗代謝物包括 ALIMTA[®](培美曲塞二鈉 (pemetrexed disodium), LY231514, MTA)、5-阿紫胞苷(5-azacitidine)、XELODA[®](卡西他濱(capecitabine))、卡莫氟(carmofur)、LEUSTAT[®](克拉屈濱(cladribine))、氯法拉濱(clofarabine)、阿糖胞苷(cytarabine)、阿糖胞苷十八烷基磷酸鹽(cytarabine ocfosfate)、胞嘧啶阿拉伯糖(cytosine arabinoside)、地西他濱(decitabine)、去鐵胺(deferoxamine)、去氧氟尿苷(doxifluridine)、依氟鳥胺酸(eflornithine)、EICAR(5-乙炔基-1-β-D-呋喃核糖基咪唑-4-甲鹽胺)、依諾他濱(enocitabine)、乙炔胞苷(ethnlycytidine)、氟達拉濱(fludarabine)、單獨或與甲鹽四氫葉酸(leucovorin)組合之5-氟尿嘧啶(5-fluorouracil)、GEMZAR[®](吉西他濱(gemcitabine))、羥基脲(hydroxyurea)、ALKERAN[®](美法侖)、巯嘌呤(mercaptopurine)、6-巯嘌呤核糖苷、甲胺喋呤(methotrexate)、黴酚酸(mycophenolic acid)、奈拉濱(nelarabine)、諾拉曲特(nolatrexed)、十八烷基磷酸鹽、培利曲索(pelitrexol)、噴司他汀(pentostatin)、雷替曲賽(raltitrexed)、病毒唑(Ribavirin)、三安平(triapine)、三甲曲沙(trimetrexate)、S-1、噻唑呋林(tiazofurin)、喃氟啶(tegafur)、TS-1、阿糖腺苷(vidarabine)、UFT及其類似物。

抗病毒劑包括利托那韋(ritonavir)、羥氯奎(hydroxychloroquine)及其類似物。

極光激酶抑制劑包括 ABT-348、AZD-1152、MLN-8054、VX-680、極光A特異性激酶抑制劑、極光B特異性激酶抑制劑及全極光激酶抑制劑及其類似物。

Bcl-2 蛋白抑制劑包括 AT-101((-) 棉子酚)、GENASENSE®(G3139或奧利默森(oblimersen)(靶向Bcl-2之反義寡核苷酸))、IPI-194、IPI-565、N-(4-(4-((4'-氯(1,1'-聯苯)-2-基)甲基)哌嗪-1-基)苯甲醯基)-4-(((1R)-3-(二甲基胺基)-1-((苯基硫基)甲基)丙基)胺基)-3-硝基苯磺醯胺(ABT-737)、N-(4-(4-((2-(4-氯苯基)-5,5-二甲基-1-環己-1-烯-1-基)甲基)哌嗪-1-基)苯甲醯基)-4-(((1R)-3-(嗎啉-4-基)-1-((苯基硫基)甲基)丙基)胺基)-3-((三氟甲基)磺醯基)苯磺醯胺(ABT-263)、GX-070(奧巴拉西(obatoclox))及其類似物。

Bcr-Abl 激酶抑制劑包括 DASATINIB®(BMS-354825)、GLEEVEC®(伊馬替尼(imatinib))及其類似物。

CDK 抑制劑包括 AZD-5438、BMI-1040、BMS-032、BMS-387、CVT-2584、夫拉平度(flavopyridol)、GPC-286199、MCS-5A、PD0332991、PHA-690509、司利昔布(seliciclib)(CYC-202，R-羅斯維汀(R-roscovitine))、ZK-304709及其類似物。

COX-2 抑制劑包括 ABT-963、ARCOXIA®(依他昔布(etoricoxib))、BEXTRA®(戊地昔布(valdecoxib))、BMS347070、CELEBREX®(塞內昔布(celecoxib))、COX-189(羅美昔布(lumiracoxib))、CT-3、DERAMAXX®(德拉昔

啖-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

[(1-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}氮雜環丁烷-3-基)甲基]胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(嗎啉-4-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二

布 (deracoxib))、JTE-522、4-甲基-2-(3,4-二甲基苯基)-1-(4-胺磺醯基苯基-1H-吡咯)、MK-663(依他昔布)、NS-398、帕瑞昔布 (parecoxib)、RS-57067、SC-58125、SD-8381、SVT-2016、S-2474、T-614、VIOXX[®](羅非昔布 (rofecoxib))及其類似物。

EGFR抑制劑包括ABX-EGF、抗-EGFR免疫微脂囊、EGF疫苗、EMD-7200、ERBITUX[®](西妥昔單抗 (cetuximab))、HR3、IgA抗體、IRESSA[®](吉非替尼 (gefitinib))、TARCEVA[®](埃羅替尼 (erlotinib) 或 OSI-774)、TP-38、EGFR融合蛋白、TYKERB[®](拉帕替尼 (lapatinib))及其類似物。

ErbB2受體抑制劑包括CP-724-714、CI-1033(卡拉替尼 (canertinib))、HERCEPTIN[®](曲妥珠單抗 (trastuzumab))、TYKERB[®](拉帕替尼)、OMNITARG[®](2C4，帕妥珠單抗 (pertuzumab))、TAK-165、GW-572016(洛那法尼 (ionafarnib))、GW-282974、EKB-569、PI-166、dHER2(HER2疫苗)、APC-8024(HER-2疫苗)、抗-HER/2neu雙特異性抗體、B7.her2IgG3、AS HER2三官能雙特異性抗體、mAB AR-209、mAB 2B-1及其類似物。

組蛋白脫乙酰醯基酶抑制劑包括縮肽、LAQ-824、MS-275、曲泊辛 (trapoxin)、辛二醯苯胺異羧肟酸 (SAHA)、TSA、丙戊酸及其類似物。

HSP-90抑制劑包括17-AAG-nab、17-AAG、CNF-101、CNF-1010、CNF-2024、17-DMAG、格爾德黴素 (geldanamycin)、

IPI-504、KOS-953、MYCOGRAB[®](抗HSP-90之人類重組抗體)、NCS-683664、PU24FC1、PU-3、根赤殼菌素(radicalcol)、SNX-2112、STA-9090 VER49009及其類似物。

細胞凋亡蛋白抑制劑之抑制劑包括HGS1029、GDC-0145、GDC-0152、LCL-161、LBW-242及其類似物。

抗體藥物結合物包括抗-CD22-MC-MMAF、抗-CD22-MC-MMAE、抗-CD22-MCC-DM1、CR-011-vcMMAE、PSMA-ADC、MEDI-547、SGN-19Am、SGN-35、SGN-75及其類似物。

死亡受體路徑活化劑包括TRAIL、靶向TRAIL或死亡受體(例如DR4及DR5)之抗體或其他藥劑，諸如阿撲單抗(Apomab)、康納木單抗(conatumumab)、ETR2-ST01、GDC0145(來沙木單抗(lexatumumab))、HGS-1029、LBY-135、PRO-1762及曲妥珠單抗。

運動素抑制劑包括Eg5抑制劑，諸如AZD4877、ARRY-520；CENPE抑制劑，諸如GSK923295A及其類似物。

JAK-2抑制劑包括CEP-701(來沙替尼(lesaurtinib))、XL019及INCB018424及其類似物。

MEK抑制劑包括ARRY-142886、ARRY-438162、PD-325901、PD-98059及其類似物。

mTOR抑制劑包括AP-23573、CCI-779、依維莫司(everolimus)、RAD-001、雷帕黴素、西羅莫司脂化物(temsirolimus)、ATP競爭性TORC1/TORC2抑制劑(包括PI-

103、PP242、PP30、托林(Torin1)及其類似物。

非類固醇消炎藥包括 AMIGESIC[®](雙水楊酸酯(salsalate))、DOLOBID[®](二氟尼柳(diflunisal))、MOTRIN[®](布洛芬(ibuprofen))、ORUDIS[®](酮洛芬(ketoprofen))、RELAFFEN[®](萘丁美酮(nabumetone))、FELDENE[®](吡羅昔康(piroxicam))、布洛芬乳膏、ALEVE[®](萘普生(naproxen))及 NAPROSYN[®](萘普生)、VOLTAREN[®](雙氯芬酸(diclofenac))、INDOCIN[®](吲哚美辛(indomethacin))、CLINORIL[®](舒林酸(sulindac))、TOLECTIN[®](托美丁(tolmetin))、LODINE[®](依託度酸(etodolac))、TORADOL[®](酮洛酸(ketorolac))、DAYPRO[®](噁丙嗪(oxaprozin))及其類似物。

PDGFR抑制劑包括C-451、CP-673、CP-868596及其類似物。

鉑化學治療劑包括順鉑(cisplatin)、ELOXATIN[®](奧沙利鉑(oxaliplatin))、依鉑(eptaplatin)、洛鉑(lobaplatin)、奈達鉑(nedaplatin)、PARAPLATIN[®](卡鉑(carboplatin))、賽特鉑(satraplatin)、吡鉑(picoplatin)及其類似物。

Polo樣激酶抑制劑包括BI-2536及其類似物。

磷酸肌醇-3激酶(PI3K)抑制劑包括渥曼青黴素(wortmannin)、LY294002、XL-147、CAL-120、ONC-21、AEZS-127、ETP-45658、PX-866、GDC-0941、BGT226、BEZ235、XL765及其類似物。

凝血栓蛋白類似物包括ABT-510、ABT-567、ABT-898、

TSP-1及其類似物。

VEGFR 抑制劑包括 AVASTIN[®](貝伐單抗 (bevacizumab))、ABT-869、AEE-788、ANGIOZYME[™](一種抑制血管生成之核糖核酸酶(Ribozyme Pharmaceuticals (Boulder, CO.) 及 Chiron(Emeryville, CA)))、阿西替尼 (axitinib)(AG-13736)、AZD-2171、CP-547,632、IM-862、MACUGEN(哌加他尼(pegaptamib))、NEXAVAR[®](索拉非尼 (sorafenib)，BAY43-9006)、帕佐泮尼 (pazopanib)(GW-786034)、瓦他拉尼 (vatalanib)(PTK-787、ZK-222584)、SUTENT[®](舒尼替尼 (sunitinib)，SU-11248)、VEGF 捕獲劑、ZACTIMA[™](凡德他尼 (vandetanib)，ZD-6474)及其類似物。

抗生素包括嵌入抗生素阿柔比星(aclarubicin)、放線菌素 D(actinomycin D)、胺柔比星(amrubicin)、安納黴素(annamycin)、阿黴素(adriamycin)、BLENOXANE[®](博萊黴素(bleomycin))、道諾黴素(daunorubicin)、CAELYX[®]或 MYOCET[®](脂質小紅莓(liposomal doxorubicin))、依沙蘆星(elsamitrucin)、表柔比星(epirubicin)、格拉比星(glarbuicin)、ZAVEDOS[®](伊達比星(idarubicin))、絲裂黴素C(mitomycin C)、奈莫柔比星(nemorubicin)、新制癌菌素(neocarzinostatin)、培洛黴素(peplomycin)、吡柔比星(pirarubicin)、蝴蝶黴素(rebeccamycin)、司替拉姆(stimalamer)、鏈脲黴素(streptozocin)、VALSTAR[®](伐柔比星(valrubicin))、淨司他丁(zinostatin)及其類似物。

拓撲異構酶抑制劑包括阿柔比星、9-胺基喜樹鹼 (9-aminocamptothecin)、胺蔡非特 (amonafide)、安吖啶 (amsacrine)、貝克卡林 (becatecarin)、貝洛替康 (belotecan)、BN-80915、CAMPTOSAR[®](伊立替康鹽酸鹽 (irinotecan hydrochloride))、喜樹鹼 (camptothecin)、CARDIOXANE[®](右雷佐生 (dexrazoxine))、二氟替康 (diflomotecan)、艾特卡林 (edotecarin)、ELLENCE[®] 或 PHARMORUBICIN[®](表柔比星 (epirubicin))、依託泊苷 (etoposide)、依喜替康 (exatecan)、10-羥基喜樹鹼、吉馬替康 (gimatecan)、勒托替康 (lurtotecan)、米托蒽醌 (mitoxantrone)、奧拉熱星 (orathecin)、吡柔比星 (pirarbucin)、匹蒽醌 (pixantrone)、盧比替康 (rubitecan)、索布佐生 (sobuzoxane)、SN-38、塔呋泊苷 (tafluposide)、拓朴替康 (topotecan) 及其類似物。

抗體包括 AVASTIN[®](貝伐單抗)、CD40 特異性抗體、chTNT-1/B、地諾單抗 (denosumab)、ERBITUX[®](西妥昔單抗)、HUMAX-CD4[®](紫木單抗 (zanolimumab))、IGF1R 特異性抗體、林妥珠單抗 (lintuzumab)、PANOREX[®](依決洛單抗 (edrecolomab))、RENCAREX[®](WX G250)、RITUXAN[®](利妥昔單抗 (rituximab))、替西單抗 (ticilimumab)、曲妥珠單抗 (trastuzumab)、I 型及 II 型 CD20 抗體及其類似物。

激素治療劑包括 ARIMIDEX[®](阿那曲唑 (anastrozole))、AROMASIN[®](依西美坦 (exemestane))、阿佐昔芬 (arzoxifene)、CASODEX[®](比卡魯胺 (bicalutamide))、

CETROTIDE[®](西曲瑞克(cetrorelix))、地加瑞克(degarelix)、
 地洛瑞林(deslorelin)、DESOPAN[®](曲洛司坦(trilostane))、
 地塞米松(dexamethasone)、DROGENIL[®](氟他胺
 (flutamide))、EVISTA[®](雷洛昔芬(raloxifene))、AFEMA[™]
 (法屈唑(fadrozole))、FARESTON[®](托瑞米芬(toremifene))、
 FASLODEX[®](氟維司群(fulvestrant))、FEMARA[®](來曲唑
 (letrozole))、福美司坦(formestane)、糖皮質激素、
 HECTOROL[®](度骨化醇(doxercalciferol))、RENAGEL[®](碳
 酸司維拉姆(sevelamer carbonate))、拉索昔芬(lasofloxifene)、
 醋酸亮丙瑞林(leuprolide acetate)、MEGACE[®](甲地孕酮
 (megesterol))、MIFEPREX[®](米非司酮(mifepristone))、
 NILANDRON[™](尼魯米特(nilutamide))、NOLVADEX[®](檸
 檬酸他莫昔芬(tamoxifen citrate))、PLENAXIS[™](阿倍瑞克
 (abarelix))、潑尼松(prednisone)、PROPECIA[®](非那雄安
 (finasteride))、利洛司坦(rilostane)、SUPREFACT[®](布舍瑞
 林(buserelin))、TRELSTAR[®](促黃體素釋放激素(LHRH))、
 VANTAS[®](組胺瑞林植入物(Histrelin implant))、VETORYL[®]
 (曲洛司坦或莫達司坦(modrastane))、ZOLADEX[®](福司瑞
 林(fosrelin)、戈舍瑞林(goserelin))及其類似物。

類維生素D及類視黃素包括西奧骨化醇(seocalcitol)
 (EB1089、CB1093)、來沙骨化三醇(lexacalcitrol)
 (KH1060)、芬維A胺(fenretinide)、PANRETIN[®](亞利崔托
 寧(aliretinoin))、ATRAGEN[®](脂質維甲酸(liposomal
 tretinoin))、TARGRETIN[®](貝沙羅汀(bexarotene))、LGD-

1550及其類似物。

PARP抑制劑包括ABT-888(維利帕尼(veliparib))、奧拉帕尼(olaparib)、KU-59436、AZD-2281、AG-014699、BSI-201、BGP-15、INO-1001、ONO-2231及其類似物。

植物鹼包括(但不限於)長春新鹼(vincristine)、長春鹼(vinblastine)、長春地辛(vindesine)、長春瑞濱(vinorelbine)及其類似物。

蛋白酶體抑制劑包括VELCADE®(硼替佐米(bortezomib))、MG132、NPI-0052、PR-171及其類似物。

免疫藥物之實例包括干擾素及其他免疫增強劑。干擾素包括干擾素 α 、干擾素 α -2a、干擾素 α -2b、干擾素 β 、干擾素 γ -1a、ACTIMMUNE®(干擾素 γ -1b)或干擾素 γ -n1、其組合及其類似物。其他藥劑包括ALFAFERONE®(IFN- α)、BAM-002(氧化型麩胱甘肽)、BEROMUN®(他索納明(tasonermin))、BEXXAR®(托西莫單抗(tositumomab))、CAMPATH®(阿倫單抗(alemtuzumab))、CTLA4(細胞毒性淋巴細胞抗原4)、達卡巴嗪、地尼白介素(denileukin)、依帕珠單抗(epratuzumab)、GRANOCYTE®(來格司亭(lenograstim))、香菇多糖(lentinan)、白血球 α 干擾素、咪喹莫特(imiquimod)、MDX-010(抗-CTLA-4)、黑素瘤疫苗、米妥莫單抗(mitumomab)、莫拉司亭(molgramostim)、MYLOTARG™(吉妥珠單抗奧唑米星(gemtuzumab ozogamicin))、NEUPOGEN®(非格司亭(filgrastim))、OncoVAC-CL、OVAREX®(奧戈伏單抗(oregovomab))、潘

妥莫單抗(pemtumomab)(Y-muHMFG1)、PROVENGE®(西普亮塞T(sipuleucel-T))、沙格司亭(sargaramostim)、裂皺菌素(sizofilan)、替西白介素(teceleukin)、THERACYS®(卡介苗(Bacillus Calmette-Guerin))、烏苯美司(ubenimex)、VIRULIZIN®(免疫藥物, Lorus Pharmaceuticals)、Z-100(丸山之特異物質(Specific Substance of Maruyama, SSM))、WF-10(四氯十氧化物(TCDO))、PROLEUKIN®(阿地白介素(aldesleukin))、ZADAXIN®(胸腺法新(thymalfasin))、ZENAPAX®(達利珠單抗(daclizumab))、ZEVALIN®(90Y替伊莫單抗(90Y-Ibritumomab tiuxetan))及其類似物。

生物反應調節劑為調節活生物體之防禦機制或組織細胞之生物反應(諸如存活、生長或分化)以引導其具有抗腫瘤活性的藥劑，且包括雲芝多糖(krestin)、香菇多糖、西佐喃(sizofiran)、畢西巴尼(picibanil)、PF-3512676(CpG-8954)、烏苯美司及其類似物。

嘧啶類似物包括阿糖胞苷(ara C或阿拉伯糖苷C)、胞嘧啶阿拉伯糖苷、去氧氟尿苷、FLUDARA®(氟達拉濱)、5-FU(5-氟尿嘧啶)、氮尿苷(floxuridine)、GEMZAR®(吉西他濱)、TOMUDEX®(雷替曲賽)、TROXATYL™(三乙醯尿苷曲沙他濱(triacetyluridine troxacitabine))及其類似物。

嘌呤類似物包括LANVIS®(硫鳥嘌呤(thioguanine))及PURI-NETHOL®(甙嘌呤)。

抗有絲分裂劑包括巴他布林(batabulin)、埃博黴素D

(epothilone D)(KOS-862)、N-(2-((4-羥基苯基)胺基)吡啶-3-基)-4-甲氧基苯磺醯胺、伊沙匹隆(ixabepilone)(BMS 247550)、太平洋紫杉醇(paclitaxel)、TAXOTERE[®](多烯紫杉醇(docetaxel))、PNU100940(109881)、帕妥匹隆(patupilone)、XRP-9881(拉若泰索(larotaxel))、長春氟寧(vinflunine)、ZK-EPO(合成埃博黴素)及其類似物。

泛素連接酶抑制劑包括MDM2抑制劑(諸如努特林(nutlin))、NEDD8抑制劑(諸如MLN4924)及其類似物。

本發明之化合物亦可用作增強放射療法功效之放射增敏劑。放射療法之實例包括外粒子束放射療法、遠隔療法、近接療法及密封型、非密封型放射源放射療法及其類似療法。

另外，具有式(I)之化合物可與其他化學治療劑組合，該等化學治療劑諸如ABRAXANE[™](ABI-007)、ABT-100(法尼基轉移酶抑制劑(farnesyl transferase inhibitor))、ADVEXIN[®](Ad5CMV-p53 疫苗)、ALTOCOR[®]或MEVACOR[®](洛伐他汀(lovastatin))、AMPLIGEN[®](poly I:poly C12U，一種合成核糖核酸)、APTOSYN[®](依昔舒林(exisulind))、AREDIA[®](帕米膦酸(pamidronic acid))、阿加來濱(arglabin)、L-天冬醯胺酶(L-asparaginase)、阿他美坦(atamestane)(1-甲基-3,17-二酮-雄固-1,4-二烯)、AVAGE[®](他紫羅汀(tazarotene))、AVE-8062(康普瑞汀衍生物(combrestatin derivative))、BEC2(米妥莫單抗(mitumomab))、惡病質素(cachectin)或惡病質蛋白

(cachexin)(腫瘤壞死因子)、康維辛(canvaxin)(疫苗)、CEAVAC[®](癌症疫苗)、CELEUK[®](西莫白介素(celmoleukin))、CEPLENE[®](組織胺二鹽酸鹽(histamine dihydrochloride))、CERVARIX[®](人類乳頭狀瘤病毒疫苗)、CHOP[®](C：CYTOXAN[®](環磷醯胺)；H：ADRIAMYCIN[®](羥基小紅莓(hydroxydoxorubicin))；O：長春新鹼(ONCOVIN[®])；P：潑尼松)、CYPAT[™](醋酸環妊酮(cyproterone acetate))、康普瑞丁A4P(combrestatin A4P)、DAB(389)EGF(經由His-Ala連接子融合於人類表皮生長因子之白喉毒素(diphtheria toxin)之催化及轉運結構域)或TransMID-107R[™](白喉毒素)、達卡巴嗪、放線菌素D、5,6-二甲基二苯并哌喃酮-4-乙酸(DMXAA)、恩尿嘧啶(eniluracil)、EVIZON[™](角鯊胺乳酸酯(squalamine lactate))、DIMERICINE[®](T4N5脂質體洗劑)、迪斯德莫來(discodermolide)、DX-8951f(甲磺酸依喜替康(exatecan mesylate))、恩紫妥林(enzastaurin)、EPO906(埃博黴素B)、GARDASIL[®](四價人類乳頭狀瘤病毒(6、11、16、18型)重組疫苗)、GASTRIMMUNE[®]、GENASENSE[®]、GMK(神經結苷脂結合疫苗)、GVAX[®](前列腺癌疫苗)、鹵夫酮(halofuginone)、組胺瑞林(histerelin)、羥基尿素(hydroxycarbamide)、伊班膦酸(ibandronic acid)、IGN-101、IL-13-PE38、IL-13-PE38QQR(辛曲德開貝舒托(cintredekin besudotox))、IL-13假單胞菌外毒素、干擾素 α 、干擾素 γ 、JUNOVAN[™]或MEPACT[™](米伐木肽(mifamurtide))、

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,3-二甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-

二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-

1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氮-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯

基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-

二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氮呋喃-3-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-

1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氮呋喃-2-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}

苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氮-2H-哌喃-4-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]

氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯

基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-

洛那法尼(lonafarnib)、5,10-亞甲基四氫葉酸、米替福新(miltefosine)(十六烷基磷酸膽鹼(hexadecylphosphocholine))、NEOVASTAT[®](AE-941)、NEUTREXIN[®](葡萄糖醛酸三甲曲沙(trimetrexate glucuronate))、NIPENT[®](噴司他汀)、ONCONASE[®](一種核糖核酸酶)、ONCOPHAGE[®](黑素瘤疫苗治療)、ONCOVAX[®](IL-2疫苗)、ORATHECIN[™](魯比替康(rubitecan))、OSIDEM[®](基於抗體之細胞藥物)、OVAREX[®] MAb(鼠類單株抗體)、太平洋紫杉醇、PANDIMEX[™](得自人參之包含20(S)原人參二醇(aPPD)及20(S)原人參三醇(aPPT)之糖苷配基皂素)、盤尼圖單抗(panitumumab)、PANVAC[®]-VF(研究中之癌症疫苗)、培門冬酶(pegaspargase)、PEG干擾素A、苯妥帝爾(phenoxodiol)、丙卡巴肼(procarbazine)、瑞馬司他(rebimastat)、REMOVAB[®](卡妥索單抗(catumaxomab))、REVLIMID[®](來那度胺(lenalidomide))、RSR13(乙丙昔羅(efaproxiral))、SOMATULINE[®] LA(蘭瑞肽(lanreotide))、SORIATANE[®](阿曲汀(acitretin))、星形孢菌素(staurosporine)(鏈黴菌星狀孢子(Streptomyces staurospores))、塔拉司他(talabostat)(PT100)、TARGRETIN[®](貝沙羅汀(bexarotene))、TAXOPREXIN[®](DHA-太平洋紫杉醇)、TELCYTA[®](堪佛司非米德(canfosfamide), TLK286)、特米利芬(temilifene)、TEMODAR[®](替莫唑胺(temozolomide))、替米利芬(tesmilifene)、沙立度胺(thalidomide)、THERATOPE[®](STn-KLH)、賽米他(thymitaq)(2-胺基-3,4-二氫-6-甲基-4-側氧基-5-(4-吡啶

基硫基)喹唑啉二鹽酸鹽)、TNFERADE™(腺病毒載體：含有腫瘤壞死因子 α 基因之DNA載體)、TRACLEER®或ZAVESCA®(波生坦(bosentan))、維甲酸(瑞汀A(Retin-A))、漢防己鹼(tetrandrine)、TRISENOX®(三氧化二砷)、VIRULIZIN®、伍克蘭(ukrain)(得自白屈菜植物之生物鹼之衍生物)、維他欣(vitaxin)(抗- $\alpha\text{v}\beta 3$ 抗體)、XCYTRIN®(莫特沙芬釐(motexafin gadolinium))、XINLAY™(阿曲生坦(atrasentan))、XYOTAX™(聚麝胺酸太平洋紫杉醇(paclitaxel poliglumex))、YONDELIS®(曲貝替定(trabectedin))、ZD-6126、ZINECARD®(右雷佐生)、ZOMETA®(唑來膦酸(zolendronic acid))、左柔比星(zorubicin)及其類似物。

資料

使用時差式螢光共振能量轉移(TR-FRET)結合分析確定具有式(I)之化合物作為NAMPT結合劑及抑制劑之效用。

NAMPT之時差式螢光共振能量轉移(TR-FRET)結合分析

該分析係在18 μL 低容量盤(Owens Corning)中在反應緩衝液(50 mM HEPES(NaOH)(pH 7.5)、100 mM NaCl、10 mM MgCl_2 、1 mM DTT、1%甘油)中使用6.8 nM重組人類C-末端His標記之NAMPT、1 nM Tb-抗-His抗體(Invitrogen, 目錄號PV5895)及200 nM探針(俄勒岡綠(Oregon Green)488結合之APO866; A-1251667.0(探針1)或A-1287128.0(探針2))進行。蓋上培養盤,且反應進行2-3小時。2至3小時後,用Envision(Laser Lantha低容量方案)

讀取培養盤。激發在337 nm下進行，且測定俄勒岡綠(520 nm)與鈦(492 nm)之發射比率並用以計算測試化合物之 IC_{50} 值。

表1展示具有式I之化合物在功能上抑制NAMPT之效用。

表 1

實例	TR-FRET結合 IC_{50} (μ M)探針1、探針2	實例	TR-FRET結合 IC_{50} (μ M)探針1、探針2
1	0.0125、nd	781	nd、0.0158
2	0.00278、nd	782	nd、0.0296
3	0.00309、0.00252	783	nd、0.029
4	0.00371、nd	784	nd、0.0224
5	0.00692、0.00832	785	nd、0.0262
6	0.00425、nd	786	nd、0.0262
7	0.0046、nd	787	nd、0.13
8	0.00488、nd	788	nd、0.0785
9	0.00502、nd	789	nd、0.00318
10	0.00525、nd	790	nd、0.159
11	0.00618、nd	791	nd、0.00977
12	0.00656、nd	792	nd、0.0217
13	0.00807、nd	793	nd、0.0118
14	0.00888、nd	794	nd、0.017
15	0.00991、nd	795	nd、0.991
16	0.0101、nd	796	nd、0.00322
17	0.0105、nd	797	nd、0.00295
18	0.011、nd	798	nd、0.00221
19	0.011、nd	799	nd、0.00361
20	0.011、nd	800	nd、0.0821
21	0.0112、nd	801	nd、0.30
22	0.0116、nd	802	nd、0.0258
23	0.0119、nd	803	nd、0.0132
24	0.0123、nd	804	nd、0.0373
25	0.008、0.00299	805	nd、0.0287
26	0.0126、nd	806	nd、0.286
27	0.0138、nd	807	nd、0.0417
28	0.0141、nd	808	nd、0.696
29	0.0145、nd	809	nd、0.00207
30	0.0146、nd	810	nd、nd
31	0.0149、nd	811	nd、0.00359

32	0.015 、nd	812	nd 、0.00679
33	0.015 、nd	813	nd 、0.0446
34	0.0151 、nd	814	nd 、0.00713
35	0.0152 、nd	815	nd 、0.00287
36	0.0157 、nd	816	nd 、0.0243
37	0.0161 、nd	817	nd 、0.00251
38	0.0164 、nd	818	nd 、0.0128
39	0.0166 、nd	819	nd 、0.00428
40	0.0171 、nd	820	nd 、0.00631
41	0.0174 、nd	821	nd 、0.012
42	0.0174 、0.0173	822	nd 、0.00207
43	0.0178 、nd	823	nd 、0.00176
44	0.018 、nd	824	nd 、0.0066
45	0.0181 、nd	825	nd 、0.0107
46	0.0183 、nd	826	nd 、0.00918
47	0.0185 、nd	827	nd 、0.00311
48	0.0186 、nd	828	nd 、0.00737
49	0.0186 、nd	829	nd 、0.00359
50	nd 、nd	830	nd 、nd
51	0.0191 、nd	831	nd 、0.00918
52	0.0197 、nd	832	nd 、0.00888
53	0.0197 、nd	833	nd 、0.0034
54	0.0201 、nd	834	nd 、0.00358
55	0.0202 、nd	835	nd 、0.00353
56	0.0203 、nd	836	nd 、0.00454
57	0.0211 、nd	837	nd 、0.00367
58	0.0212 、nd	838	nd 、0.00203
59	0.0229 、0.0154	839	nd 、0.0191
60	0.0224 、nd	840	nd 、0.725
61	0.0225 、nd	841	nd 、1.61
62	0.0231 、nd	842	nd 、0.0746
63	0.0236 、nd	843	nd 、0.704
64	0.0237 、nd	844	nd 、2.62
65	0.0238 、nd	845	nd 、5.64
66	0.024 、nd	846	nd 、2.99
67	0.0241 、nd	847	nd 、0.24
68	0.0247 、nd	848	nd 、1.19
69	0.0248 、nd	849	nd 、5.71
70	0.0248 、nd	850	nd 、2.1
71	0.0256 、nd	851	nd 、0.277
72	0.0258 、nd	852	nd 、5.48
73	0.0267 、nd	853	nd 、12.5
74	0.0273 、nd	854	nd 、5.66

75	0.0274 、 nd	855	nd 、 0.839
76	0.0278 、 nd	856	nd 、 0.00913
77	0.0284 、 nd	857	nd 、 0.061
78	0.0293 、 nd	858	nd 、 0.0082
79	0.0295 、 nd	859	nd 、 2.14
80	0.0299 、 nd	860	nd 、 12.5
81	0.0301 、 nd	861	nd 、 3.15
82	0.0301 、 nd	862	nd 、 0.599
83	0.0306 、 nd	863	nd 、 0.143
84	0.0308 、 nd	864	nd 、 0.122
85	0.0313 、 nd	865	nd 、 1.56
86	0.0319 、 nd	866	nd 、 0.14
87	0.0326 、 nd	867	nd 、 0.0593
88	0.033 、 nd	868	nd 、 0.128
89	0.0334 、 nd	869	nd 、 0.229
90	0.0335 、 nd	870	nd 、 0.12
91	0.0342 、 nd	871	nd 、 0.036
92	0.0346 、 nd	872	nd 、 0.00746
93	0.0351 、 nd	873	nd 、 0.00465
94	0.0354 、 nd	874	nd 、 0.00231
95	nd 、 nd	875	nd 、 0.00419
96	0.0365 、 nd	876	nd 、 0.0022
97	0.037 、 nd	877	nd 、 0.00882
98	0.0381 、 nd	878	nd 、 0.0525
99	0.0382 、 nd	879	nd 、 0.00298
100	nd 、 nd	880	nd 、 0.0517
101	0.0393 、 nd	881	nd 、 0.0463
102	0.0395 、 nd	882	nd 、 0.0377
103	0.0395 、 nd	883	nd 、 0.0156
104	0.0395 、 nd	884	nd 、 0.0154
105	0.0397 、 nd	885	nd 、 0.466
106	0.0263 、 nd	886	nd 、 0.0246
107	0.0408 、 nd	887	nd 、 0.826
108	0.0408 、 nd	888	nd 、 0.0934
109	0.0412 、 nd	889	nd 、 1.47
110	0.0422 、 nd	890	nd 、 1.38
111	0.044 、 nd	891	nd 、 1.72
112	0.0445 、 nd	892	nd 、 1.84
113	0.0445 、 nd	893	nd 、 0.154
114	0.0461 、 nd	894	nd 、 0.00302
115	0.0465 、 nd	895	nd 、 0.0261
116	0.0465 、 nd	896	nd 、 0.444
117	0.0481 、 nd	897	nd 、 0.969

118	0.0481 、 nd	898	nd 、 0.288
119	0.0484 、 nd	899	nd 、 0.19
120	0.049 、 nd	900	nd 、 0.0437
121	0.0493 、 nd	901	nd 、 0.0676
122	0.0511 、 nd	902	nd 、 0.35
123	0.0515 、 nd	903	nd 、 0.0491
124	0.0517 、 nd	904	nd 、 0.0351
125	0.0518 、 nd	905	nd 、 0.0383
126	0.0537 、 nd	906	nd 、 0.0569
127	0.0539 、 nd	907	nd 、 0.0711
128	0.0553 、 nd	908	nd 、 0.0334
129	0.0567 、 nd	909	nd 、 0.0019
130	0.0567 、 nd	910	nd 、 0.00638
131	0.0573 、 nd	911	nd 、 0.0133
132	0.0581 、 nd	912	nd 、 0.00832
133	0.0582 、 nd	913	nd 、 0.0074
134	0.0613 、 nd	914	nd 、 0.00486
135	0.0615 、 nd	915	nd 、 0.0188
136	0.0616 、 nd	916	nd 、 0.0221
137	0.0629 、 nd	917	nd 、 0.00207
138	0.0632 、 nd	918	nd 、 0.0128
139	0.0638 、 nd	919	nd 、 0.00708
140	0.0655 、 nd	920	nd 、 0.548
141	0.0656 、 nd	921	nd 、 0.0602
142	0.0664 、 nd	922	nd 、 0.00567
143	0.0665 、 nd	923	nd 、 0.00395
144	0.0666 、 nd	924	nd 、 0.00277
145	0.0692 、 nd	925	nd 、 0.00683
146	0.0694 、 nd	926	nd 、 0.0508
147	0.0701 、 nd	927	nd 、 0.0406
148	0.0702 、 nd	928	nd 、 0.0725
149	0.0717 、 nd	929	nd 、 0.21
150	0.0728 、 nd	930	nd 、 0.146
151	0.0733 、 nd	931	nd 、 0.0981
152	0.0759 、 nd	932	nd 、 1.31
153	0.0799 、 nd	933	nd 、 0.206
154	0.0813 、 nd	934	nd 、 0.00168
155	0.0834 、 nd	935	nd 、 0.00584
156	0.0836 、 nd	936	nd 、 0.121
157	0.0846 、 nd	937	nd 、 0.0398
158	0.0857 、 nd	938	nd 、 0.0877
159	0.0858 、 nd	939	nd 、 0.0105
160	0.0861 、 nd	940	nd 、 0.0168

161	0.0876 、 nd	941	nd 、 0.136
162	0.0882 、 nd	942	nd 、 0.0238
163	0.0893 、 nd	943	nd 、 0.0090
164	0.0907 、 nd	944	nd 、 0.0328
165	0.0931 、 nd	945	nd 、 0.0433
166	0.0999 、 nd	946	nd 、 0.0172
167	0.101 、 nd	947	nd 、 0.0459
168	0.105 、 nd	948	nd 、 0.0192
169	0.108 、 nd	949	nd 、 0.0309
170	0.108 、 nd	950	nd 、 0.0198
171	0.11 、 nd	951	nd 、 0.00968
172	0.111 、 nd	952	nd 、 0.0128
173	0.115 、 nd	953	nd 、 0.426
174	0.12 、 nd	954	nd 、 0.341
175	0.12 、 nd	955	nd 、 0.222
176	0.12 、 nd	956	nd 、 0.346
177	0.123 、 nd	957	nd 、 0.374
178	nd 、 nd	958	nd 、 0.148
179	0.128 、 nd	959	nd 、 0.307
180	0.131 、 nd	960	nd 、 0.22
181	0.133 、 nd	961	nd 、 0.161
182	0.136 、 nd	962	nd 、 0.201
183	0.14 、 nd	963	nd 、 0.198
184	0.141 、 nd	964	nd 、 0.128
185	0.142 、 nd	965	nd 、 0.17
186	0.145 、 nd	966	nd 、 0.223
187	0.146 、 nd	967	nd 、 0.0047
188	0.148 、 nd	968	nd 、 0.00259
189	0.149 、 nd	969	nd 、 0.0234
190	0.15 、 nd	970	nd 、 0.0213
191	0.154 、 nd	971	nd 、 0.0205
192	0.155 、 nd	972	nd 、 0.00919
193	0.164 、 nd	973	nd 、 0.0435
194	0.164 、 nd	974	nd 、 0.034
195	0.172 、 nd	975	nd 、 0.0115
196	0.176 、 nd	976	nd 、 0.0225
197	0.178 、 nd	977	nd 、 0.0214
198	0.179 、 nd	978	nd 、 0.0236
199	0.179 、 nd	979	nd 、 0.0365
200	0.186 、 nd	980	nd 、 0.0173
201	0.189 、 nd	981	nd 、 0.034
202	0.192 、 nd	982	nd 、 0.0144
203	0.198 、 nd	983	nd 、 0.0296

204	0.20 、 nd	984	nd 、 0.0689
205	0.203 、 nd	985	nd 、 0.00963
206	0.216 、 nd	986	nd 、 0.0407
207	0.219 、 nd	987	nd 、 0.111
208	0.223 、 nd	988	nd 、 nd
209	0.146 、 0.258	989	nd 、 0.0269
210	0.235 、 Nd	990	nd 、 0.031
211	0.241 、 nd	991	nd 、 0.0408
212	0.252 、 nd	992	nd 、 0.0168
213	0.255 、 nd	993	nd 、 0.00941
214	0.265 、 nd	994	nd 、 0.00802
215	0.267 、 nd	995	nd 、 0.0285
216	0.271 、 nd	996	nd 、 0.101
217	0.274 、 nd	997	nd 、 0.175
218	0.279 、 nd	998	nd 、 0.0277
219	0.284 、 nd	999	nd 、 0.0166
220	0.293 、 nd	1000	nd 、 0.0391
221	0.295 、 nd	1001	nd 、 0.00157
222	0.297 、 nd	1002	nd 、 0.0426
223	0.302 、 nd	1003	nd 、 0.0489
224	0.317 、 nd	1004	nd 、 0.0461
225	0.333 、 nd	1005	nd 、 0.0385
226	0.339 、 nd	1006	nd 、 0.0252
227	0.359 、 nd	1007	nd 、 0.0598
228	0.359 、 nd	1008	nd 、 0.0349
229	0.361 、 nd	1009	nd 、 0.0266
230	0.369 、 nd	1010	nd 、 0.114
231	0.414 、 nd	1011	nd 、 0.0264
232	0.42 、 nd	1012	nd 、 0.0923
233	0.43 、 nd	1013	nd 、 0.389
234	0.43 、 nd	1014	nd 、 0.00661
235	0.455 、 nd	1015	nd 、 0.00631
236	0.457 、 nd	1016	nd 、 0.00375
237	0.46 、 nd	1017	nd 、 0.00201
238	0.504 、 nd	1018	nd 、 0.0244
239	0.519 、 nd	1019	nd 、 0.00144
240	0.52 、 nd	1020	nd 、 10.0
241	0.523 、 nd	1021	nd 、 1.17
242	0.524 、 nd	1022	nd 、 0.0135
243	0.543 、 nd	1023	nd 、 0.0127
244	0.574 、 nd	1024	nd 、 0.0921
245	0.585 、 nd	1025	nd 、 0.00795
246	0.618 、 nd	1026	nd 、 0.035

247	0.624 、nd	1027	nd 、0.0842
248	0.738 、nd	1028	nd 、0.0519
249	0.778 、nd	1029	nd 、0.035
250	0.78 、nd	1030	nd 、0.0116
251	0.83 、nd	1031	nd 、0.0251
252	0.837 、nd	1032	nd 、0.156
253	0.852 、nd	1033	nd 、0.113
254	0.877 、nd	1034	nd 、0.164
255	0.969 、nd	1035	nd 、0.376
256	1.23 、nd	1036	nd 、0.20
257	1.36 、nd	1037	nd 、0.048
258	1.52 、nd	1038	nd 、0.0248
259	1.54 、nd	1039	nd 、0.105
260	1.57 、0.152	1040	nd 、0.0163
261	1.63 、nd	1041	nd 、0.0128
262	1.66 、nd	1042	nd 、0.00968
263	1.66 、nd	1043	nd 、0.00489
264	1.92 、nd	1044	nd 、0.00621
265	2.24 、nd	1045	nd 、0.00924
266	2.29 、nd	1046	nd 、0.0469
267	2.75 、nd	1047	nd 、0.0542
268	2.85 、nd	1048	nd 、0.0345
269	3.62 、nd	1049	nd 、0.0398
270	4.7 、nd	1050	nd 、0.102
271	11.1 、nd	1051	nd 、0.0626
272	0.0816 、nd	1052	nd 、0.0318
273	1.0 、nd	1053	nd 、0.0764
274	1.03 、nd	1054	nd 、0.0563
275	0.197 、nd	1055	nd 、1.55
276	0.298 、nd	1056	nd 、0.335
277	1.02 、nd	1057	nd 、2.32
278	0.385 、nd	1058	nd 、1.12
279	1.91 、nd	1059	nd 、0.394
280	0.04453 、0.0612	1060	nd 、1.57
281	0.0383 、nd	1061	nd 、1.78
282	0.14 、nd	1062	nd 、0.222
283	0.387 、nd	1063	nd 、0.00988
284	0.0333 、0.0344	1064	nd 、0.0621
285	0.00192 、0.00259	1065	nd 、0.00445
286	0.00206 、nd	1066	nd 、0.318
287	0.00435 、nd	1067	nd 、0.738
288	0.00447 、nd	1068	nd 、0.365
289	0.00743 、nd	1069	nd 、0.122

290	0.0104 、 nd	1070	nd 、 0.332
291	0.0277 、 nd	1071	nd 、 0.993
292	0.0361 、 nd	1072	nd 、 0.117
293	0.00877 、 nd	1073	nd 、 0.0659
294	0.00814 、 nd	1074	nd 、 0.0674
295	0.0141 、 nd	1075	nd 、 0.0931
296	0.0247 、 nd	1076	nd 、 0.0389
297	0.012 、 nd	1077	nd 、 0.0069
298	0.097 、 nd	1078	nd 、 0.00347
299	0.00673 、 nd	1079	nd 、 0.0259
300	0.0103 、 nd	1080	nd 、 0.00297
301	0.0546 、 nd	1081	nd 、 0.00682
302	0.0157 、 nd	1082	nd 、 0.0195
303	0.251 、 nd	1083	nd 、 0.0117
304	0.0133 、 nd	1084	nd 、 0.0296
305	0.0121 、 nd	1085	nd 、 0.029
306	0.0133 、 nd	1086	nd 、 0.0152
307	0.0254 、 nd	1087	nd 、 0.00733
308	0.0808 、 nd	1088	nd 、 0.0155
309	0.0634 、 nd	1089	nd 、 0.0771
310	0.0368 、 nd	1090	nd 、 0.0493
311	0.00524 、 nd	1091	nd 、 0.0289
312	0.114 、 nd	1092	nd 、 0.0192
313	0.00541 、 0.00587	1093	nd 、 0.0117
314	0.021 、 nd	1094	nd 、 0.044
315	0.00762 、 nd	1095	nd 、 0.0118
316	0.287 、 nd	1096	nd 、 0.028
317	0.0421 、 nd	1097	nd 、 0.0756
318	0.249 、 nd	1098	nd 、 0.0111
319	0.0319 、 nd	1099	nd 、 0.145
320	0.272 、 nd	1100	nd 、 0.0263
321	0.203 、 nd	1101	nd 、 0.0448
322	0.0255 、 nd	1102	nd 、 0.108
323	0.0988 、 nd	1103	nd 、 0.00784
324	0.333 、 nd	1104	nd 、 1.69
325	0.0987 、 nd	1105	nd 、 0.0619
326	0.0743 、 nd	1106	nd 、 0.364
327	0.223 、 nd	1107	nd 、 0.152
328	0.331 、 nd	1108	nd 、 0.0061
329	2.02 、 nd	1109	nd 、 0.048
330	0.00618 、 nd	1110	nd 、 0.0151
331	0.00611 、 nd	1111	nd 、 0.0139
332	0.0042 、 nd	1112	nd 、 0.0498

1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3-二甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(三環[3.3.1.1~3,7~]癸-1-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-甲氧基環己基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[4-(乙醯基胺基)苯基]磺醯基}胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-丙基苯基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(丁基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[({(1S,4R)-7,7-二甲基-2-側氧基雙環[2.2.1]庚-1-基]甲基}磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并

333	0.00315 、 nd	1113	nd 、 0.00326
334	0.0223 、 nd	1114	nd 、 0.0281
335	0.00669 、 nd	1115	nd 、 0.0188
336	0.0259 、 nd	1116	nd 、 0.0419
337	0.0261 、 nd	1117	nd 、 0.0332
338	0.0785 、 nd	1118	nd 、 0.00548
339	0.315 、 nd	1119	nd 、 0.0224
340	0.783 、 nd	1120	nd 、 0.0227
341	0.101 、 nd	1121	nd 、 0.0302
342	0.103 、 nd	1122	nd 、 0.162
343	0.0791 、 nd	1123	nd 、 0.0309
344	0.216 、 nd	1124	nd 、 0.0143
345	0.84 、 nd	1125	nd 、 0.0764
346	0.0498 、 nd	1126	nd 、 0.311
347	0.297 、 nd	1127	nd 、 0.00569
348	1.56 、 nd	1128	nd 、 0.199
349	0.0022 、 nd	1129	nd 、 0.546
350	0.00825 、 nd	1130	nd 、 0.0354
351	0.064 、 nd	1131	nd 、 0.0414
352	1.19 、 nd	1132	nd 、 0.201
353	0.00763 、 nd	1133	nd 、 0.703
354	0.0405 、 nd	1134	nd 、 0.175
355	0.124 、 nd	1135	nd 、 0.121
356	0.404 、 nd	1136	nd 、 0.0498
357	9.88 、 nd	1137	nd 、 0.0119
358	0.0711 、 nd	1138	nd 、 0.0874
359	0.0881 、 nd	1139	nd 、 0.333
360	0.239 、 nd	1140	nd 、 0.138
361	0.436 、 nd	1141	nd 、 0.0099
362	0.578 、 nd	1142	nd 、 0.136
363	2.04 、 nd	1143	nd 、 0.328
364	6.48 、 nd	1144	nd 、 0.00515
365	11.2 、 nd	1145	nd 、 0.00619
366	3.34 、 nd	1146	nd 、 0.0148
367	4.84 、 nd	1147	nd 、 0.00824
368	0.00373 、 nd	1148	nd 、 0.0409
369	0.00656 、 nd	1149	nd 、 0.0824
370	0.0075 、 nd	1150	nd 、 0.0132
371	0.0395 、 nd	1151	nd 、 0.048
372	0.0535 、 nd	1152	nd 、 0.233
373	0.0234 、 nd	1153	nd 、 0.00492
374	nd 、 nd	1154	nd 、 0.00962
375	0.595 、 nd	1155	nd 、 0.033

376	nd、nd	1156	nd、0.216
377	0.105、nd	1157	nd、0.0725
378	0.492、0.377	1158	nd、0.0125
379	0.0511、0.0404	1159	nd、0.0179
380	nd、0.201	1160	nd、0.237
381	0.547、nd	1161	nd、0.0044
382	0.257、nd	1162	nd、0.00954
383	1.99、1.34	1163	nd、0.0174
384	0.00974、0.00889	1164	nd、0.00544
385	0.040、0.0484	1165	nd、nd
386	0.0707、nd	1166	nd、0.0562
387	0.17、nd	1167	nd、0.0298
388	5.7、4.55	1168	nd、nd
389	0.266、nd	1169	nd、0.239
390	0.727、0.616	1170	nd、0.0214
391	0.0465、1.41	1171	nd、0.0105
392	0.282、0.288	1172	nd、0.00867
393	0.415、0.281	1173	nd、0.0437
394	2.07、1.45	1174	nd、0.0156
395	1.84、1.67	1175	nd、0.00662
396	0.474、0.278	1176	nd、0.00915
397	0.405、0.353	1177	nd、0.0496
398	0.346、0.272	1178	nd、0.112
399	0.0903、0.0736	1179	nd、0.0791
400	1.89、2.35	1180	nd、0.0102
401	0.072、nd	1181	nd、0.128
402	0.183、nd	1182	nd、nd
403	0.606、nd	1183	nd、0.0404
404	0.0277、nd	1184	nd、0.109
405	0.012、nd	1185	nd、0.0503
406	0.011、nd	1186	nd、0.0106
407	0.00145、nd	1187	nd、0.00878
408	0.372、nd	1188	nd、0.00494
409	1.02、nd	1189	nd、0.0291
410	0.0295、nd	1190	nd、0.0843
411	0.0197、nd	1191	nd、0.0607
412	0.168、0.109	1192	nd、0.17
413	2.01、nd	1193	nd、0.00776
414	0.032、nd	1194	nd、0.171
415	0.0121、nd	1195	nd、0.0205
416	0.041、nd	1196	nd、0.0102
417	4.91、nd	1197	nd、0.101
418	0.506、0.0514	1198	nd、nd

419	0.010 、nd	1199	nd 、0.165
420	0.0182 、nd	1200	nd 、nd
421	0.0404 、nd	1201	nd 、0.0422
422	3.94 、nd	1202	nd 、0.0227
423	12.5 、nd	1203	nd 、0.378
424	0.0826 、nd	1204	nd 、0.0772
425	0.0814 、nd	1205	nd 、0.345
426	0.0104 、nd	1206	nd 、0.394
427	0.0154 、nd	1207	nd 、0.283
428	0.0327 、nd	1208	nd 、0.028
429	0.179 、nd	1209	nd 、0.0387
430	0.191 、nd	1210	nd 、0.0192
431	0.0607 、nd	1211	nd 、0.879
432	0.00874 、nd	1212	nd 、0.144
433	0.00807 、nd	1213	nd 、nd
434	0.0507 、nd	1214	nd 、0.035
435	0.00589 、nd	1215	nd 、0.133
436	0.00933 、nd	1216	nd 、0.054
437	0.0080 、nd	1217	nd 、0.0316
438	0.60 、nd	1218	nd 、0.158
439	1.69 、nd	1219	nd 、0.0613
440	0.0355 、nd	1220	nd 、0.0181
441	0.0237 、0.015	1221	nd 、1.13
442	0.0492 、nd	1222	nd 、0.0513
443	0.365 、nd	1223	nd 、0.0192
444	0.281 、nd	1224	nd 、0.497
445	0.0141 、nd	1225	nd 、0.0767
446	0.011 、nd	1226	nd 、0.0116
447	0.0466 、nd	1227	nd 、0.0534
448	0.021 、nd	1228	nd 、0.418
449	0.0257 、nd	1229	nd 、0.393
450	1.03 、nd	1230	nd 、0.0674
451	0.000946 、0.00124	1231	nd 、0.576
452	0.0512 、nd	1232	nd 、0.0248
453	0.0527 、nd	1233	nd 、0.351
454	0.0803 、nd	1234	nd 、0.0174
455	12.2 、nd	1235	nd 、0.0668
456	0.0598 、0.0475	1236	nd 、0.078
457	0.0756 、nd	1237	nd 、0.561
458	nd 、nd	1238	nd 、0.748
459	0.00362 、nd	1239	nd 、0.328
460	0.0193 、nd	1240	nd 、0.592
461	nd 、0.00815	1241	nd 、0.0122

462	0.00694 、 nd	1242	nd 、 0.0488
463	0.0215 、 0.013	1243	nd 、 0.142
464	0.0166 、 0.0272	1244	nd 、 2.23
465	0.00823 、 0.0238	1245	nd 、 0.0214
466	nd 、 nd	1246	nd 、 0.803
467	0.0165 、 0.047	1247	nd 、 0.212
468	0.00339 、 0.00726	1248	nd 、 0.373
469	0.00597 、 0.00947	1249	nd 、 0.17
470	0.00445 、 0.0080	1250	nd 、 0.335
471	0.00811 、 0.019	1251	nd 、 0.111
472	0.0149 、 0.0107	1252	nd 、 0.125
473	0.00321 、 0.00381	1253	nd 、 0.669
474	0.00389 、 0.00775	1254	nd 、 0.00222
475	0.0090 、 0.0139	1255	nd 、 0.00211
476	0.0125 、 0.0468	1256	nd 、 0.00328
477	0.00996 、 nd	1257	nd 、 0.00482
478	0.015 、 0.386	1258	nd 、 0.00831
479	nd 、 0.00399	1259	nd 、 0.00191
480	0.00571 、 0.0676	1260	nd 、 0.00491
481	nd 、 nd	1261	nd 、 0.0583
482	0.00511 、 nd	1262	nd 、 0.109
483	0.00479 、 0.00937	1263	nd 、 0.0116
484	nd 、 nd	1264	nd 、 0.309
485	0.00557 、 0.0118	1265	nd 、 0.0393
486	0.0047 、 0.00497	1266	nd 、 0.113
487	0.00884 、 0.0573	1267	nd 、 0.285
488	0.00825 、 0.0211	1268	nd 、 0.932
489	0.0123 、 nd	1269	nd 、 0.216
490	0.0212 、 0.028	1270	nd 、 0.0109
491	0.00455 、 0.0113	1271	nd 、 0.0627
492	0.0396 、 0.0417	1272	nd 、 0.0224
493	0.0336 、 0.013	1273	nd 、 0.132
494	0.016 、 0.021	1274	nd 、 0.199
495	0.0516 、 0.0607	1275	nd 、 0.097
496	0.0139 、 0.0257	1276	nd 、 0.0269
497	0.00331 、 0.0048	1277	nd 、 0.0429
498	0.307 、 nd	1278	nd 、 0.0136
499	0.806 、 nd	1279	nd 、 0.00784
500	0.182 、 nd	1280	nd 、 0.00438
501	0.0459 、 0.018	1281	nd 、 0.00122
502	0.157 、 nd	1282	nd 、 0.00134
503	0.0786 、 nd	1283	nd 、 0.00151
504	0.0766 、 0.0563	1284	nd 、 0.00172

505	0.0204 、 0.0182	1285	nd 、 0.0432
506	0.0332 、 0.0227	1286	nd 、 0.00323
507	0.186 、 nd	1287	nd 、 0.00325
508	0.184 、 nd	1288	nd 、 0.0228
509	0.211 、 nd	1289	nd 、 0.0267
510	0.0337 、 0.0221	1290	nd 、 0.409
511	0.0176 、 0.0275	1291	nd 、 0.00847
512	0.0436 、 0.0443	1292	nd 、 0.0252
513	0.0539 、 0.0681	1293	nd 、 0.0165
514	0.0481 、 0.0673	1294	nd 、 0.0327
515	0.0723 、 0.0666	1295	nd 、 0.0607
516	0.0106 、 0.00847	1296	nd 、 0.0175
517	0.0758 、 nd	1297	nd 、 0.0238
518	0.266 、 nd	1298	nd 、 0.032
519	0.0968 、 nd	1299	nd 、 0.0424
520	0.0488 、 nd	1300	nd 、 0.0111
521	0.0601 、 0.0631	1301	nd 、 0.0197
522	0.0296 、 0.0611	1302	nd 、 0.0734
523	0.187 、 nd	1303	nd 、 0.209
524	0.115 、 nd	1304	nd 、 0.204
525	0.0375 、 0.060	1305	nd 、 0.431
526	0.076 、 0.0644	1306	nd 、 0.224
527	0.0168 、 0.0243	1307	nd 、 0.401
528	0.0521 、 0.0454	1308	nd 、 0.139
529	0.103 、 nd	1309	nd 、 0.0767
530	0.124 、 nd	1310	nd 、 nd
531	0.159 、 nd	1311	nd 、 0.0917
532	0.488 、 nd	1312	nd 、 0.0265
533	0.294 、 nd	1313	nd 、 0.0783
534	0.14 、 nd	1314	nd 、 0.0247
535	0.743 、 nd	1315	nd 、 0.214
536	0.187 、 nd	1316	nd 、 0.379
537	0.0132 、 0.0106	1317	nd 、 0.074
538	0.072 、 0.0829	1318	nd 、 0.0456
539	0.072 、 0.0417	1319	nd 、 0.0147
540	0.137 、 nd	1320	nd 、 0.0163
541	0.225 、 nd	1321	nd 、 0.0148
542	0.00277 、 0.0026	1322	nd 、 nd
543	0.00213 、 0.00302	1323	nd 、 nd
544	0.00302 、 0.00305	1324	nd 、 0.0779
545	0.00278 、 0.0020	1325	nd 、 0.0903
546	0.00332 、 0.00322	1326	nd 、 0.0216
547	nd 、 nd	1327	nd 、 1.46

548	nd 、 nd	1328	nd 、 0.147
549	nd 、 nd	1329	nd 、 0.0143
550	nd 、 nd	1330	nd 、 0.0179
551	nd 、 nd	1331	nd 、 0.206
552	nd 、 nd	1332	nd 、 0.0414
553	0.00755 、 0.00582	1333	nd 、 0.0195
554	0.00401 、 0.00519	1334	nd 、 nd
555	0.0196 、 0.0114	1335	nd 、 0.0855
556	0.0145 、 0.0102	1336	nd 、 0.0746
557	0.862 、 1.98	1337	nd 、 0.105
558	1.84 、 5.63	1338	nd 、 0.0244
559	1.98 、 nd	1339	nd 、 0.0202
560	5.02 、 nd	1340	nd 、 0.257
561	0.268 、 nd	1341	nd 、 0.195
562	0.0189 、 0.0177	1342	nd 、 0.0269
563	0.00166 、 0.00361	1343	nd 、 0.0114
564	0.00196 、 0.00159	1344	nd 、 0.0821
565	0.0083 、 0.00737	1345	nd 、 0.183
566	0.193 、 nd	1346	nd 、 0.275
567	0.00675 、 0.00624	1347	nd 、 0.0292
568	0.00412 、 0.00501	1348	nd 、 0.0565
569	0.00808 、 0.0085	1349	nd 、 0.029
570	0.00913 、 0.00995	1350	nd 、 0.0149
571	0.0138 、 0.0104	1351	nd 、 0.0184
572	0.00845 、 0.00972	1352	nd 、 0.0113
573	1.26 、 nd	1353	nd 、 0.00584
574	0.0794 、 0.0621	1354	nd 、 0.00438
575	0.0538 、 0.0378	1355	nd 、 0.00307
576	0.0902 、 0.0507	1356	nd 、 0.00784
577	0.00439 、 0.00297	1357	nd 、 0.0082
578	0.060 、 0.0707	1358	nd 、 0.013
579	0.00314 、 0.00247	1359	nd 、 0.0129
580	0.00239 、 0.00201	1360	nd 、 0.00654
581	0.0040 、 0.00338	1361	nd 、 0.00515
582	0.00205 、 0.00169	1362	nd 、 0.0055
583	0.00282 、 0.0027	1363	nd 、 0.00534
584	0.0147 、 0.0117	1364	nd 、 0.0149
585	nd 、 0.0271	1365	nd 、 0.0119
586	nd 、 0.0338	1366	nd 、 0.0476
587	nd 、 0.444	1367	nd 、 0.0291
588	nd 、 0.739	1368	nd 、 0.0151
589	nd 、 0.044	1369	nd 、 0.056
590	nd 、 0.0428	1370	nd 、 0.00237

591	nd 、 0.661	1371	nd 、 0.0176
592	nd 、 0.0884	1372	nd 、 0.0106
593	nd 、 0.0269	1373	nd 、 0.0937
594	nd 、 0.021	1374	nd 、 nd
595	nd 、 0.0651	1375	nd 、 0.436
596	nd 、 0.00448	1376	nd 、 0.381
597	nd 、 0.0631	1377	nd 、 0.275
598	nd 、 0.0322	1378	nd 、 nd
599	nd 、 0.0582	1379	nd 、 0.0867
600	nd 、 0.0385	1380	nd 、 0.0936
601	nd 、 0.0326	1381	nd 、 0.189
602	nd 、 0.0392	1382	nd 、 0.237
603	nd 、 0.056	1383	nd 、 0.225
604	nd 、 0.0224	1384	nd 、 0.0123
605	nd 、 0.00759	1385	nd 、 0.00676
606	nd 、 0.0139	1386	nd 、 0.0815
607	nd 、 0.00159	1387	nd 、 0.0275
608	nd 、 0.00985	1388	nd 、 0.00403
609	nd 、 0.196	1389	nd 、 0.00592
610	nd 、 1.3	1390	nd 、 0.0148
611	nd 、 0.328	1391	nd 、 0.00956
612	nd 、 0.365	1392	nd 、 nd
613	nd 、 0.119	1393	nd 、 0.0129
614	nd 、 0.0482	1394	nd 、 nd
615	nd 、 0.0842	1395	nd 、 0.0176
616	nd 、 0.097	1396	nd 、 0.00585
617	nd 、 1.13	1397	nd 、 nd
618	nd 、 0.00755	1398	nd 、 0.0559
619	nd 、 0.0827	1399	nd 、 0.179
620	nd 、 0.00755	1400	nd 、 0.0241
621	nd 、 0.0118	1401	nd 、 0.018
622	nd 、 0.0595	1402	nd 、 0.0412
623	nd 、 1.48	1403	nd 、 0.0322
624	nd 、 0.046	1404	nd 、 0.0561
625	nd 、 0.0107	1405	nd 、 0.127
626	nd 、 0.00759	1406	nd 、 0.194
627	nd 、 0.164	1407	nd 、 0.227
628	nd 、 0.0234	1408	nd 、 0.222
629	nd 、 0.0335	1409	nd 、 0.0823
630	nd 、 0.0725	1410	nd 、 0.0722
631	nd 、 0.0506	1411	nd 、 0.135
632	nd 、 0.104	1412	nd 、 nd
633	nd 、 0.0873	1413	nd 、 0.364

634	nd、0.0361	1414	nd、0.00826
635	nd、0.129	1415	nd、0.0111
636	nd、1.21	1416	nd、0.00622
637	nd、0.0542	1417	nd、0.0125
638	nd、0.102	1418	nd、0.0113
639	nd、0.0882	1419	nd、0.0116
640	nd、0.135	1420	nd、nd
641	nd、0.163	1421	nd、0.00753
642	nd、0.507	1422	nd、0.0069
643	nd、0.0633	1423	nd、0.00831
644	nd、0.0594	1424	nd、0.0135
645	nd、0.125	1425	nd、0.035
646	nd、0.00568	1426	nd、0.0267
647	nd、0.0385	1427	nd、0.033
648	nd、0.845	1428	nd、0.0184
649	nd、0.0445	1429	nd、0.0069
650	nd、0.106	1430	nd、0.266
651	nd、0.0207	1431	nd、0.011
652	nd、0.00488	1432	nd、nd
653	nd、0.0144	1433	nd、0.0587
654	nd、0.0256	1434	nd、0.0574
655	nd、0.0224	1435	nd、0.0266
656	nd、0.116	1436	nd、0.0484
657	nd、0.0533	1437	nd、0.0738
658	nd、0.00549	1438	nd、0.0276
659	nd、0.00585	1439	nd、nd
660	nd、0.0221	1440	nd、nd
661	nd、0.00253	1441	nd、0.032
662	nd、0.00977	1442	nd、0.0136
663	nd、0.0136	1443	nd、0.0148
664	nd、0.00412	1444	nd、0.00577
665	nd、0.00814	1445	nd、0.0128
666	nd、0.0111	1446	nd、0.0113
667	nd、0.00905	1447	nd、0.0105
668	nd、0.00698	1448	nd、0.0223
669	nd、0.0136	1449	nd、0.0186
670	nd、0.0183	1450	nd、0.0154
671	nd、0.0238	1451	nd、0.0139
672	nd、0.011	1452	nd、0.00765
673	nd、0.0248	1453	nd、0.0617
674	nd、0.00839	1454	nd、0.0678
675	nd、0.0414	1455	nd、0.124
676	nd、0.0165	1456	nd、0.0422

677	nd 、 0.0126	1457	nd 、 0.0715
678	nd 、 0.00265	1458	nd 、 0.0764
679	nd 、 0.00461	1459	nd 、 0.0669
680	nd 、 0.126	1460	nd 、 0.126
681	nd 、 0.0603	1461	nd 、 0.0487
682	nd 、 0.019	1462	nd 、 0.0694
683	nd 、 0.0669	1463	nd 、 0.0779
684	nd 、 0.0153	1464	nd 、 0.109
685	nd 、 0.0205	1465	nd 、 0.101
686	nd 、 0.653	1466	nd 、 0.0125
687	nd 、 0.0238	1467	nd 、 0.0164
688	nd 、 0.00303	1468	nd 、 0.00486
689	nd 、 0.0123	1469	nd 、 0.0138
690	nd 、 0.00616	1470	nd 、 0.00221
691	nd 、 0.0392	1471	nd 、 0.0109
692	nd 、 0.0247	1472	nd 、 0.0125
693	nd 、 0.0264	1473	nd 、 0.00872
694	nd 、 0.0359	1474	nd 、 0.00888
695	nd 、 0.027	1475	nd 、 0.00744
696	nd 、 0.00223	1476	nd 、 0.21
697	nd 、 0.0049	1477	nd 、 0.0452
698	nd 、 0.0327	1478	nd 、 0.0682
699	nd 、 0.00558	1479	nd 、 0.0015
700	nd 、 0.0204	1480	nd 、 0.00425
701	nd 、 0.0227	1481	nd 、 0.00416
702	nd 、 0.0232	1482	nd 、 0.00488
703	nd 、 0.0829	1483	nd 、 nd
704	nd 、 0.0126	1484	nd 、 0.00149
705	nd 、 0.00742	1485	nd 、 0.00323
706	nd 、 0.00581	1486	nd 、 0.00137
707	nd 、 0.00573	1487	nd 、 0.00234
708	nd 、 0.00997	1488	nd 、 0.00844
709	nd 、 0.00601	1489	nd 、 0.00656
710	nd 、 0.00336	1490	nd 、 nd
711	nd 、 0.0462	1491	nd 、 nd
712	nd 、 0.0453	1492	nd 、 0.00153
713	nd 、 0.0529	1493	nd 、 0.00295
714	nd 、 0.121	1494	nd 、 0.00202
715	nd 、 0.136	1495	nd 、 0.00877
716	nd 、 0.102	1496	nd 、 0.00844
717	nd 、 0.0718	1497	nd 、 0.00135
718	nd 、 0.012	1498	nd 、 0.00228
719	nd 、 0.0347	1499	nd 、 0.00152

720	nd、0.164	1500	nd、0.00415
721	nd、0.14	1501	nd、0.00264
722	nd、0.00157	1502	nd、0.0101
723	nd、0.0209	1503	nd、0.0067
724	nd、0.0851	1504	nd、0.0101
725	nd、0.477	1505	nd、nd
726	nd、0.577	1506	nd、0.00219
727	nd、1.22	1507	nd、nd
728	nd、0.00752	1508	nd、0.00244
729	nd、0.0445	1509	nd、0.00397
730	nd、0.45	1510	nd、0.00326
731	nd、0.0183	1511	nd、0.00664
732	nd、0.0241	1512	nd、nd
733	nd、0.0598	1513	nd、0.0028
734	nd、0.0845	1514	nd、0.00183
735	nd、0.126	1515	nd、0.00159
736	nd、0.281	1516	nd、0.00457
737	nd、0.186	1517	nd、0.00103
738	nd、0.00417	1518	nd、0.00155
739	nd、0.0049	1519	nd、0.00168
740	nd、0.204	1520	nd、0.00203
741	nd、0.0165	1521	nd、0.0019
742	nd、0.0331	1522	nd、0.0316
743	nd、0.00971	1523	nd、0.0134
744	nd、0.00446	1524	nd、0.00324
745	nd、0.00868	1525	nd、0.0063
746	nd、0.0768	1526	nd、0.00714
747	nd、0.00434	1527	nd、0.0026
748	nd、0.00455	1528	nd、0.00881
749	nd、0.0161	1529	nd、0.00174
750	nd、0.0118	1530	nd、0.00389
751	nd、0.229	1531	nd、0.124
752	nd、0.0108	1532	nd、0.00541
753	nd、0.0655	1533	nd、0.0102
754	nd、0.0683	1534	nd、0.0213
755	nd、0.0407	1535	nd、0.0201
756	nd、0.0488	1536	nd、0.0114
757	nd、0.00201	1537	nd、0.0118
758	nd、0.0293	1538	nd、0.0257
759	nd、0.00581	1539	nd、0.0611
760	nd、0.00483	1540	nd、0.0644
761	nd、0.0131	1541	nd、0.031
762	nd、0.0173	1542	nd、0.762

[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(苯甲基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-氟苯基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯
并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(噻吩-2-基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯
并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二
氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二
氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二
氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二
氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯

763	nd、0.00528	1543	nd、0.20
764	nd、0.0581	1544	nd、0.193
765	nd、0.0532	1545	nd、0.774
766	nd、0.0468	1546	nd、0.0241
767	nd、0.169	1547	nd、0.00501
768	nd、0.13	1548	nd、0.000973
769	nd、0.0695	1549	nd、0.00471
770	nd、0.135	1550	nd、0.0112
771	nd、0.0893	1551	nd、0.00472
772	nd、0.0534	1552	nd、0.00086
773	nd、0.297	1553	nd、0.0216
774	nd、0.0826	1554	nd、0.0385
775	nd、0.0951	1555	nd、0.0104
776	nd、0.00746	1556	nd、0.0488
777	nd、0.00625	1557	nd、0.0058
778	nd、0.0259	1558	nd、0.0165
779	nd、0.0385	1559	nd、0.0447
780	nd、0.109	1560	nd、0.0655

nd=未測定

ROCK2激酶活性分析

[³³P]-ATP分析：ROCK2活性最初使用基於放射性閃爍盤之分析測定。以96孔格式，使用生物素標記肽受質(2 μM最終濃度；S6-ROCK2之簡稱)、γ-[³³P]-ATP(5 μM，2 mCi/μmol)、化合物(2% DMSO中0.1-10000 nM)及ROCK2(0.2 nM；Upstate)催化結構域。

HTRF分析：此分析使用CisBio HTRF KinEASE套組(套組62ST2PEZ)及含有0.2 μM生物素標記受質肽(S2，CisBio)、5 μM、100 μM或1 mM ATP、抑制劑(2% DMSO中0.1-10,000 nM)及如上述³³P-ATP分析中之酶的激酶反應物。

表2展示HTRF分析之結果及具有式I之化合物在功能上抑制ROCK2之效用。

表 2

實例	ROCK2 HTRF 結合 Ki(μ M)	實例	ROCK2 HTRF 結合 Ki(μ M)
374	0.0036	391	0.00049
375	4.06	392	nd
376	0.00526	393	nd
377	0.0195	394	0.0093
378	0.00237	395	0.0321
379	0.0024	396	0.182
380	0.0023	397	0.138
381	0.00412	398	0.0022
382	0.00614	399	nd
383	0.00361	400	0.0251
384	0.00424	547	0.179
385	0.00651	548	0.014
386	10	549	0.0031
387	0.00139	550	0.0154
388	0.0112	551	0.0184
389	0.00174	552	3.27
390	0.00245		

nd=未測定

抑制NAMPT之化合物適用於治療其中涉及到NF-KB活化之疾病。該等方法適用於治療多種疾病，包括發炎及組織修復病症；尤其類風濕性關節炎、發炎性腸道疾病、哮喘及COPD(慢性阻塞性肺病)、骨關節炎、骨質疏鬆症及纖維化疾病；皮膚病，包括牛皮癬、異位性皮炎及紫外線誘發之皮膚損害；自體免疫疾病，包括全身性紅斑狼瘡、多發性硬化症、牛皮癬性關節炎、強直性脊柱炎、組織及器官排斥反應、阿茲海默氏症、中風、動脈粥樣硬化、再狹窄、糖尿病、腎小球性腎炎、癌症(尤其其中癌症係選自乳癌、前列腺癌、肺癌、結腸癌、子宮頸癌、卵巢癌、皮膚癌、CNS癌、膀胱癌、胰臟癌、白血病、淋巴瘤或霍奇

金氏病)、惡病質、與感染有關之發炎及某些病毒感染，包括後天免疫缺乏症候群(AIDS)、成人呼吸窘迫症候群及共濟失調毛細管擴張症。

WO 97/48696 中描述 NAMPT 與癌症治療有關。WO 97/48397 中描述 NAMPT 與免疫抑制有關。WO 2003/80054 中描述 NAMPT 與涉及到血管生成之疾病之治療有關。WO 2008/025857 中描述 NAMPT 與類風濕性關節炎及敗血性休克之治療有關。WO 2009/109610 中描述 NAMPT 與局部缺血之預防及治療有關。

癌症包括(但不限於)血液及實體腫瘤類型，諸如聽神經瘤、急性白血病、急性淋巴母細胞白血病、急性骨髓性白血病(單核細胞性、骨髓母細胞性、腺癌、血管肉瘤、星形細胞瘤、骨髓單核細胞性及前髓細胞性)、急性t細胞白血病、基底細胞癌、膽管癌、膀胱癌、腦癌、乳癌(包括雌激素受體陽性乳癌)、支氣管癌、伯基特氏淋巴瘤(Burkitt's lymphoma)、子宮頸癌、軟骨肉瘤、脊索瘤、絨膜癌、慢性白血病、慢性淋巴細胞性白血病、慢性髓細胞(粒細胞)白血病、慢性骨髓性白血病、結腸癌、結腸直腸癌、顱咽管瘤、囊腺癌、增殖異常變化(發育不良及化生)、胚胎癌、子宮內膜癌、內皮肉瘤、室管膜瘤、上皮癌、紅白血病、食道癌、雌激素受體陽性乳癌、原發性血小板增多症、尤因氏瘤(Ewing's tumor)、纖維肉瘤、胃癌、生殖細胞睪丸癌、妊娠滋養細胞疾病、神經膠母細胞瘤、頭頸癌、重鏈病、血管母細胞瘤、肝細胞瘤、肝細胞

癌、激素不敏感型前列腺癌、平滑肌肉瘤、脂肪肉瘤、肺癌(包括小細胞肺癌及非小細胞肺癌)、淋巴管內皮細胞肉瘤、淋巴管肉瘤、淋巴母細胞白血症、淋巴瘤(淋巴瘤，包括彌漫性大B細胞淋巴瘤、濾泡性淋巴瘤、霍奇金氏淋巴瘤及非霍奇金氏淋巴瘤)、膀胱、乳房、結腸、肺、卵巢、胰臟、前列腺、皮膚及子宮之惡性腫瘤及過度增殖病症、T細胞或B細胞根源之淋巴惡性腫瘤、白血症、髓性癌、神經管胚細胞瘤、黑色素瘤、腦脊膜瘤、間皮瘤、多發性骨髓瘤、骨髓性白血症、骨髓瘤、黏液肉瘤、神經母細胞瘤、少突神經膠質瘤、口腔癌、骨肉瘤、卵巢癌、胰臟癌、乳頭狀腺癌、乳頭狀癌、周邊T細胞淋巴瘤、松果體瘤、真性紅血球增多症、前列腺癌(包括激素不敏感(難治)型前列腺癌)、直腸癌、腎細胞癌、視網膜母細胞瘤、橫紋肌肉瘤、肉瘤、皮脂腺癌、精原細胞瘤、皮膚癌、小細胞肺癌、實體腫瘤(癌瘤及肉瘤)、胃癌、鱗狀細胞癌、滑膜瘤、汗腺癌、睪丸癌(包括生殖細胞睪丸癌)、甲狀腺癌、瓦爾登斯特倫巨球蛋白血症(Waldenström's macroglobulinemia)、睪丸腫瘤、子宮癌、韋爾姆斯氏瘤(Wilms' tumor)及其類似癌症。

已在多種病症中觀測到 Rho/ROCK 路徑異常活化 (Wettschureck, N., Offennanns, S., Rho/Rho-kinase mediated signaling in physiology and pathophysiology. J. Mol. Med. 80, 2002, 629-638 ; Müller, B.K., Mack, H., Teusch, N., Rho kinase, a promising drug target for

neurological disorders. *Nat. Drug Discov. Rev.* 4, 2005, 387-398 ; Hu, E, Lee, D., ROCK inhibitors as potential therapeutic agents for cardiovascular diseases. *Curr. Opin. Investig. Drugs.* 4, 2003, 1065-1075)。如已提及，ROCK磷酸化肌球蛋白輕鏈(MLC)磷酸酶(MLCP)之肌球蛋白結合次單元，引起肌球蛋白磷酸化及肌動蛋白-肌球蛋白收縮增強(Somlyo, A.P., Somlyo, A.V., Ca^{2+} sensitivity of smooth muscle and nonmuscle myosin II: modulated by G proteins, kinases, and myosin phosphatase. *Physiol. Rev.* 83, 2003, 1325-1358)。與異常Rho/ROCK活性相關、尤其與血管痙攣活性相關之疾病病況的實例包括諸如高血壓之心血管疾病(Satoh S., Kreutz R., Wilm C, Ganten D., Pfitzer G., Augmented agonist-induced Ca^{2+} -sensitization of coronary artery contraction in genetically hypertensive rats. Evidence for altered signal transduction in the coronary smooth muscle cells. *J. Clin. Invest.* 94, 1994, 1397-1403 ; Mukai, Y., Shimokawa, H., Matoba, T., Kandabashi, T., Satoh, S., Hiroki, J., Kaibuchi, K., Takeshita, A., Involvement of Rho-kinase in hypertensive vascular disease: a novel therapeutic target in hypertension. *FASEB J.* 15, 2001, 1062-1064 ; Uehata, M., Ishizaki, T., Satoh, H., Ono, T., Kawahara, T., Morishita, T., Tamakawa, H., Yamagami, K., Inui, J., Maekawa, M., Narumiya, S., Calcium sensitization of smooth muscle mediated by a Rho-

associated protein kinase in hypertension. *Nature* 389, 1997, 990-994 ; Masumoto, A., Hirooka, Y., Shimokawa, H., Hironaga, K., Setoguchi, S., Takeshita, A., Possible involvement of Rhokinase in the pathogenesis of hypertension in humans. *Hypertension* 38, 2001, 1307-1310)、慢性及充血性心臟衰竭(Fuster, V., Badimon, L., Badimon, JJ, Chesebro, JH, The pathogenesis of coronary artery disease and the acute coronary syndromes (2). *N Engl J Med* 326, 1992, 310-318 ; Shimokawa, H., Cellular and molecular mechanisms of coronary artery spasm: lessons from animal models. *Jpn Circ J* 64, 2000, 1-12 ; Shimokawa, H., Morishige, K., Miyata, K., Kandabashi, T., Eto, Y., Ikegaki, I., Asano, T., Kaibuchi, K., Takeshita, A., Longterm inhibition of Rho-kinase induces a regression of arteriosclerotic coronary lesions in a porcine model in vivo. *Cardiovasc Res* 51, 2001, 169-177 ; Utsunomiya, T., Satoh, S., Ikegaki, I., Toshima, Y., Asano, T., Shimokawa, H., Antianginal effects of hydroxyfasudil, a Rho-kinase inhibitor, in a canine model of effort angina. *Br J Pharmacol* 134, 2001, 1724-1730)、心臟肥大(Hoshijima, M., Sah, V.P., Wang, Y., Chien, K.R., Brown, J.H., The low molecular weight GTPase Rho regulates myofibril formation and organization in neonatal rat ventricular myocytes. Involvement of Rho kinase. *J Biol Chem* 273, 1998, 7725-

77230 ; Sah, V.P., Hoshijima, M., Chien, K.R., Brown, J.H., Rho is required for Galphaq and alphas-adrenergic receptor signal-637 ing in cardiomyocytes. Dissociation of Ras and Rho pathways. J Biol Chem 271, 1996, 31185-1190 ; Kuwahara, K., Saito, Y., Nakagawa, O., Kishimoto, I., Harada, M., Ogawa, E., Miyamoto, Y., Hamanaka, I., Kajiyama, N., Takahashi, N., Izumi, T., Kawakami, R., Tamura, N., Ogawa, Y., Nakao, K., The effects of the selective ROCK inhibitor, Y27632, on ET-1-induced hypertrophic response in neonatal rat cardiacmyocytes-possible involvement of Rho/ROCK pathway in cardiac muscle cell hypertrophy. FEBS Lett 452, 1999, 314-318) 、慢性腎衰竭(Sharpe, C.C., Hendry, B., M. Signaling: focus on Rho in renal disease. J. Am. Soc. Nephrol. 14, 2003, 261-264) 、蛛網膜下腔出血後腦血管痙攣(Shibuya, M., Suzuki, Y., Sugita, K., Saito, I., Sasaki, T., Takakura, K., Okamoto, S., Kikuchi, H., Takemae, T., Hidaka, H., Dose escalation trial of a novel calcium antagonist, AT877, in patients 636 with aneurysmal subarachnoid haemorrhage. Acta Neurochir (Wien) 107, 1990, 11-15 ; Shibuya, M., Suzuki, Y., Sugita, K., Saito, I., Sasaki, T., Takakura, K., Nagata, I., Kikuchi, H., Takemae, T., Hidaka, H. 等人 , Effect of AT877 on cerebral vasospasm after aneurysmal subarachnoid hemorrhage. Results of a prospective placebo-

controlled double-blind trial. *J Neurosurg* 76, 1992, 571-577 ; Sato, M., Tani, E., Fujikawa, H., Kaibuchi, K., Involvement of Rho-kinase-mediated phosphorylation of myosin light chain in enhancement of cerebral vasospasm. *Circ Res* 87, 2000, 195-200 ; Miyagi, Y., Carpenter, R.C., Meguro, T., Parent, A.D., Zhang, J.H., Upregulation of rho A and rho kinase messenger RNAs in the basilar artery of a rat model of subarachnoid hemorrhage. *J Neurosurg* 93, 2000, 471-476 ; Tachibana, E., Harada, T., Shibuya, M. Saito, K., Takayasu, M., Suzuki, Y., Yoshida, J., Intra-arterial infusion of fasudil hydrochloride for treating vasospasm following subarachnoid haemorrhage. *Acta Neurochir (Wien)* 141, 1999, 13-19)、肺高血壓(Sylvester, J.T., *Am. J. Physiol. Lung Cell. Mol. Physiol.* 287, 2004, L624-L630)及眼高壓(Honjo, M., Inatani, M., Kido, N., Sawamura, T., Yue, B.Y., Honda, Y., Tanihara, H., Effects of protein kinase inhibitor, HA1077, on intraocular pressure and outflow facility in rabbit eyes. *Arch Ophthalmol* 119, 2001, 1171-1178 ; Rao, P.V., Deng, P.F., Kumar, J. Epstein, D.L., Modulation of aqueous humor outflow facility by the Rho kinase-specific inhibitor Y-27632. *Invest Ophthalmol Vis Sci* 42, 2001, 1029-1037)。與異常Rho/ROCK活性相關之其他疾病為癌症(Aznar, S., Fernandez-Valeron, P., Espina, C., Lacal, J.C., Rho GTPases: potential candidates

for anticancer therapy. *Cancer Lett.* 206, 2004, 181-191 ;

Yin, L. 等人, Fasudil inhibits vascular endothelial growth factor-induced angiogenesis in vitro and in vivo. *Mol Cancer Ther* 5, 2007, 1517-25 ; Itoh, K., Yoshioka, K., Akedo, H., Uehata, M., Ishizaki, T., Narumiya, S., An essential part for Rho-associated kinase in the transcellular invasion of tumor cells. *Nat Med* 5, 1999, 221-225 ; Genda, T. Sakamoto, M., Ichida, T., Asakura, H., Kojiro, M., Narumiya, S., Hirohashi, S., Cell motility mediated by rho and Rho-associated protein kinase plays a critical role in intrahepatic metastasis of human hepatocellular carcinoma. *Hepatology* 30, 1999, 1027-1036 ; Somlyo, A.V., Bradshaw, D., Ramos, S., Murphy, C., Myers, C.E., Somlyo, A.P., Rho-kinase inhibitor retards migration and in vivo dissemination of human prostate cancer cells. *Biochem Biophys Res Commun* 269, 2000, 652-659) 、 哮喘 (Roberts, J.A., Raeburn, D., Rodger, I.W., Thomson, N.C., Comparison of in vivo airway responsiveness and in vitro smooth muscle sensitivity to methacholine in man. *Thorax* 39; 1984, 837-843 ; Chiba, Y., Misawa, M., Characteristics of muscarinic cholinceptors in airways of antigen-induced airway hyperresponsive rats. *Comp Biochem Physiol C Pharmacol Toxicol Endocrinol* 111, 1995, 351-357 ; Chiba, Y., Takada, Y., Miyamoto, S., MitsuiSaito, M., Karaki, H., Misawa, M.,

Augmented acetylcholine-induced, Rho mediated Ca^{2+} sensitization of bronchial smooth muscle contraction in antigen-induced airway hyperresponsive rats. *Br J Pharmacol* 127, 1999, 597-600 ; Chiba, Y., Sakai, H. Misawa, M., Augmented acetylcholine-induced translocation of RhoA in bronchial smooth muscle from antigen-induced airway hyperresponsive rats. *Br J Pharmacol* 133, 2001, 886-890 ; Iizuka, K., Shimizu, Y., Tsukagoshi, H., Yoshii, A., Harada, T. Dobashi, K., Murozono, T., Nakazawa, T., Mori, M., Evaluation of Y-27632, a rho-kinase inhibitor, as a bronchodilator in guinea pigs. *Eur J Pharmacol* 406, 2000, 273-279)、男性勃起障礙(Andersson, K. E., Hedlund, P., New directions for erectile dysfunction therapies. *Int. J. Impot. Res.* 14 (增刊 1), 2002, S82-S92 ; Chitale, K., Wingard, C.J., Clinton Webb, R., Branam, H., Stopper, V.S., Lewis, R.W., Mills, T.M., Antagonism of Rho-kinase stimulates rat penile erection via a nitric oxide independent pathway. *Nat Med* 7, 2001, 119-122 ; Mills, T.M., Chitale, K., Wingard, C.J., Lewis, R.W., Webb, R.C., Effect of Rho-kinase inhibition on vasoconstriction in the penile circulation. *J Appl Physiol* 91, 2001, 1269-1273)、女性性功能障礙、膀胱過度活動症候群(Peters, S.L.等人, Rho kinase: a target for treating urinary bladder dysfunction. *Trends Pharmacol Sci.* 27, 2006, 492-7)及早產(Niir, N.,

基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(六氫-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(四氫-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-

Nishimura, J., Sakihara, C, Nakano, H., Kanaide, H., Up-regulation of rho A and rho-kinase mRNAs in the rat myometrium during pregnancy. *Biochem Biophys Res Commun* 230, 1997, 356-359 ; Tahara, M., Morishige, K., Sawada, K., Ikebuchi, Y., Kawagishi, R., Tasaka, K., Murata, Y., RhoA/Rho-kinase cascade is involved in oxytocin-induced rat uterine contraction. *Endocrinology* 143, 2002, 920-929 ; Kupittayanant, S., Burdyga, T., Wray, S., The effects of inhibiting Rho-associated kinase with Y-27632 on force and intracellular calcium in human myometrium. *Pflugers Arch.* 443, 2001, 112-114)。

已提出ROCK抑制劑用於治療多種疾病。該等疾病包括諸如高血壓之心血管疾病(Satoh S., Kreutz R., Wilm C, Ganten D., Pfitzer G., Augmented agonist-induced Ca^{2+} -sensitization of coronary artery contraction in genetically hypertensive rats. Evidence for altered signal transduction in the coronary smooth muscle cells. *J. Clin. Invest.* 94, 1994, 1397-1403 ; Mukai, Y., Shimokawa, H., Matoba, T., Kandabashi, T., Satoh, S., Hiroki, J., Kaibuchi, K., Takeshita, A., Involvement of Rho-kinase in hypertensive vascular disease: a novel therapeutic target in hypertension. *FASEB J.* 15, 2001, 1062-1064 ; Uehata, M., Ishizaki, T., Satoh, H., Ono, T., Kawahara, T., Morishita, T., Tamakawa, H., Yamagami, K., Inui, J., Maekawa, M., Narumiya, S.,

Calcium sensitization of smooth muscle mediated by a Rho-associated protein kinase in hypertension. *Nature* 389, 1997, 990-994 ; 及 Masumoto, A., Hirooka, Y., Shimokawa, H., Hironaga, K., Setoguchi, S., Takeshita, A., Possible involvement of Rhokinase in the pathogenesis of hypertension in humans. *Hypertension* 38, 2001, 1307-1310)、慢性及充血性心臟衰竭(Fuster, V., Badimon, L., Badimon, JJ, Chesebro, JH, The pathogenesis of coronary artery disease and the acute coronary syndromes (2). *N Engl J Med* 326, 1992, 310-318 ; Shimokawa, H., Cellular and molecular mechanisms of coronary artery spasm: lessons from animal models. *Jpn Circ J* 64, 2000, 1-12 ; Shimokawa, H., Morishige, K., Miyata, K., Kandabashi, T., Eto, Y., Ikegaki, I., Asano, T., Kaibuchi, K., Takeshita, A., Longterm inhibition of Rho-kinase induces a regression of arteriosclerotic coronary lesions in a porcine model in vivo. *Cardiovasc Res* 51, 2001, 169-177 ; Utsunomiya, T., Satoh, S., Ikegaki, I., Toshima, Y., Asano, T., Shimokawa, H., Antianginal effects of hydroxyfasudil, a Rho-kinase inhibitor, in a canine model of effort angina. *Br J Pharmacol* 134, 201, 1724-1730)、心臟肥大(Hoshijima, M., Sah, V.P., Wang, Y., Chien, K.R., Brown, J.H., The low molecular weight GTPase Rho regulates myofibril formation and organization in neonatal rat ventricular myocytes.

Involvement of Rho kinase. *J Biol Chem* 273, 1998, 7725-77230 ; Sah, V.P., Hoshijima, M., Chien, K.R., Brown, J.H., Rho is required for Galphaq and alphas-adrenergic receptor signal-637 ing in cardiomyocytes. Dissociation of Ras and Rho pathways. *J Biol Chem* 271, 1996, 31185-1190 ; Kuwahara, K., Saito, Y., Nakagawa, O., Kishimoto, I., Harada, M., Ogawa, E., Miyamoto, Y., Hamanaka, I., Kajiyama, N., Takahashi, N., Izumi, T., Kawakami, R., Tamura, N., Ogawa, Y., Nakao, K., The effects of the selective ROCK inhibitor, Y27632, on ET-1-induced hypertrophic response in neonatal rat cardiacmyocytes-possible involvement of Rho/ROCK pathway in cardiac muscle cell hypertrophy. *FEBS Lett* 452, 1999, 314-318) 、慢性腎衰竭(Sharpe, C.C., Hendry, B., M. Signaling: focus on Rho in renal disease. *J. Am. Soc. Nephrol.* 14, 2003, 261-264) 、還有蛛網膜下腔出血後腦血管痙攣(Shibuya, M., Suzuki, Y., Sugita, K., Saito, I., Sasaki, T., Takakura, K., Okamoto, S., Kikuchi, H., Takemae, T., Hidaka, H., Dose escalation trial of a novel calcium antagonist, AT877, in patients 636 with aneurysmal subarachnoid haemorrhage. *Acta Neurochir (Wien)* 107, 1990, 11-15 ; Shibuya, M, Suzuki, Y., Sugita, K., Saito, I., Sasaki, T., Takakura, K., Nagata, I., Kikuchi, H., Takemae, T., Hidaka, H. 等人 , Effect of AT877 on cerebral vasospasm after aneurysmal

subarachnoid hemorrhage. Results of a prospective placebo-controlled double-blind trial. *J Neurosurg* 76, 1992, 571-577 ; Sato, M., Tani, E., Fujikawa, H., Kaibuchi, K., Involvement of Rho-kinase-mediated phosphorylation of myosin light chain in enhancement of cerebral vasospasm. *Circ Res* 87, 2000, 195-200 ; Miyagi, Y., Carpenter, R.C., Meguro, T., Parent, A.D., Zhang, J.H., Upregulation of rho A and rho kinase messenger RNAs in the basilar artery of a rat model of subarachnoid hemorrhage. *J Neurosurg* 93, 2000, 471-476 ; Tachibana, E., Harada, T., Shibuya, M. Saito, K., Takayasu, M., Suzuki, Y., Yoshida, J., Intra-arterial infusion of fasudil hydrochloride for treating vasospasm following subarachnoid haemorrhage. *Acta Neurochir (Wien)* 141, 1999, 13-19)、肺高血壓(Sylvester, J.T., *Am. J. Physiol. Lung Cell. Mol. Physiol.* 287, 2004, L624-L630)及眼高壓(Honjo, M., Inatani, M., Kido, N., Sawamura, T., Yue, B.Y., Honda, Y., Tanihara, H., Effects of protein kinase inhibitor, HA1077, on intraocular pressure and outflow facility in rabbit eyes. *Arch Ophthalmol* 119, 2001, 1171-1178 ; Rao, P.V., Deng, P.F., Kumar, J. Epstein, D.L., Modulation of aqueous humor outflow facility by the Rho kinase-specific inhibitor Y-27632. *Invest Ophthalmol Vis Sci* 42, 2001, 1029-1037)。此外，因為其具有放鬆肌肉之特性，所以其亦適於哮喘(Roberts, J.A., Raeburn, D.,

Rodger, I.W., Thomson, N.C., Comparison of in vivo airway responsiveness and in vitro smooth muscle sensitivity to methacholine in man. *Thorax* 39 ; 1984, 837-843 ; Chiba, Y., Misawa, M., Characteristics of muscarinic cholinergic receptors in airways of antigen-induced airway hyperresponsive rats. *Comp Biochem Physiol C Pharmacol Toxicol Endocrinol* 111, 1995, 351-357 ; Chiba, Y., Takada, Y., Miyamoto, S., MitsuiSaito, M., Karaki, H., Misawa, M., Augmented acetylcholine-induced, Rho mediated Ca^{2+} sensitization of bronchial smooth muscle contraction in antigen-induced airway hyperresponsive rats. *Br J Pharmacol* 127, 1999, 597-600 ; Chiba, Y., Sakai, H. Misawa, M., Augmented acetylcholine-induced translocation of RhoA in bronchial smooth muscle from antigen-induced airway hyperresponsive rats. *Br J Pharmacol* 133, 2001, 886-890 ; Iizuka, K., Shimizu, Y., Tsukagoshi, H., Yoshii, A., Harada, T. Dobashi, K., Murozono, T., Nakazawa, T., Mori, M., Evaluation of Y-27632, a rho-kinase inhibitor, as a bronchodilator in guinea pigs. *Eur J Pharmacol* 406, 2000, 273-279)、男性勃起障礙(Andersson, K. E., Hedlund, P., New directions for erectile dysfunction therapies. *Int. J. Impot. Res.* 14 (増刊 1), 2002, S82-S92 ; Chitale, K., Wingard, C.J., Clinton Webb, R., Branam, H., Stopper, V.S., Lewis, R.W., Mills, T.M., Antagonism of Rho-kinase

stimulates rat penile erection via a nitric oxide independent pathway. *Nat Med* 7, 2001, 119-122 ; Mills, T.M., Chitaley, K., Wingard, C.J., Lewis, R.W., Webb, R.C., Effect of Rho-kinase inhibition on vasoconstriction in the penile circulation. *J Appl Physiol* 91, 2001, 1269-1273)、女性性功能障礙及膀胱過度活動症候群(Peters, S.L.等人, Rho kinase: a target for treating urinary bladder dysfunction. *Trends Pharmacol Sci.* 27, 2006, 492-7)及早產(Niuro, N., Nishimura, J., Sakihara, C., Nakano, H., Kanaide, H., Up-regulation of rho A and rho-kinase mRNAs in the rat myometrium during pregnancy. *Biochem Biophys Res Commun* 230, 1997, 356-359 ; Tahara, M., Morishige, K., Sawada, K., Ikebuchi, Y., Kawagishi, R., Tasaka, K., Murata, Y., RhoA/Rho-kinase cascade is involved in oxytocin-induced rat uterine contraction. *Endocrinology* 143, 2002, 920-929 ; Kupittayanant, S, Burdyga, T., Wray, S., The effects of inhibiting Rho-associated kinase with Y-27632 on force and intracellular calcium in human myometrium. *Pflugers Arch.* 443, 2001, 112-114)。若干近來之研究報導ROCK抑制劑在缺血-再灌注及心肌梗塞中之有益作用。在此等研究中，ROCK抑制劑Y-27632及法舒地爾(fasudil)顯示回應於實驗性心肌梗塞(MI)且在慢性高血壓誘發之充血性心臟衰竭之大鼠模型中減少缺血-再灌注損傷、心肌梗塞面積及心肌纖維化(參見上文(Fuster, V.,

Badimon, L., Badimon, JJ, Chesebro, JH, The pathogenesis of coronary artery disease and the acute coronary syndromes (2). N Engl J Med 326, 1992, 310-318 ; Shimokawa, H., Cellular and molecular mechanisms of coronary artery spasm: lessons from animal models. Jpn Circ J 64, 2000, 1-12 ; Shimokawa, H., Morishige, K., Miyata, K., Kandabashi, T., Eto, Y., Ikegaki, I., Asano, T., Kaibuchi, K., Takeshita, A., Longterm inhibition of Rho-kinase induces a regression of arteriosclerotic coronary lesions in a porcine model in vivo. Cardiovasc Res 51, 2001, 169-177 ; Utsunomiya, T., Satoh, S., Ikegaki, I., Toshima, Y., Asano, T., Shimokawa, H., Antianginal effects of hydroxyfasudil, a Rho-kinase inhibitor, in a canine model of effort angina. Br J Pharmacol 134, 201, 1724-1730)、心臓肥大)及 Masumoto, A., Mohri, M., Shimokawa, H., Urakami, L., Usui, M., Takeshita, A., Suppression of coronary artery spasm by the rho-kinase inhibitor fasudil in patients with vasospastic angina. Circulation 105, 2002, 1545-1547 ; Shimokawa, H., Iinuma, H., Kishida, H. 等人, Antianginal effect of fasudil, a Rho-kinase inhibitor, in patients with stable effort angina: a multicenter study (abstract). Circulation 104[増刊II], 2001, II691 ; Morishige K, Shimokawa H, Eto Y, Kandabashi T, Miyata K, Matsumoto Y, Hoshijima M, Kaibuchi K, Takeshita A,

Adenovirus-mediated transfer of dominant-negative rho-kinase induces a regression of coronary arteriosclerosis in pigs in vivo. *Arterioscler Thromb Vasc Biol* 21, 2001, 548-554 ; Kandabashi T, Shimokawa H, Mukai Y, Matoba T, Kunihiro I, Morikawa K, Ito M, Takahashi S, Kaibuchi K, Takeshita A, Involvement of rho-kinase in agonists-induced contractions of arteriosclerotic human arteries. *Arterioscler Thromb Vasc Biol* 22, 2002, 243-248 ; Liu MW, Roubin GS, King SB 3rd, Restenosis after coronary angioplasty. Potential biologic determinants and role of intimal hyperplasia. *Circulation* 79, 1989, 1374-1387 ; Shibata R, Kai H, Seki Y, Kato S, Morimatsu M, Kaibuchi K, Imaizumi T, Role of Rho-associated kinase in neointima formation after vascular injury. *Circulation* 103, 2001, 284-289)。

另外，ROCK可與其他信號傳導路徑相互作用，抑制磷酸肌醇-3激酶(PI-3K)、內皮一氧化氮合成酶(eNOS)路徑及活化可能導致內皮功能障礙(如再狹窄及動脈粥樣硬化)之纖維蛋白溶酶原活化因子抑制劑-1(PAI-1)。因此提出ROCK抑制劑用於治療再狹窄及動脈粥樣硬化(參見上文(Morishige K, Shimokawa H, Eto Y, Kandabashi T, Miyata K, Matsumoto Y, Hoshijima M, Kaibuchi K, Takeshita A, Adenovirus-mediated transfer of dominant-negative rho-kinase induces a regression of coronary arteriosclerosis in pigs in vivo. *Arterioscler Thromb Vasc Biol* 21, 2001, 548-

554 ; Kandabashi T, Shimokawa H, Mukai Y, Matoba T, Kunihiro I, Morikawa K, Ito M, Takahashi S, Kaibuchi K, Takeshita A, Involvement of rho-kinase in agonists-induced contractions of arteriosclerotic human arteries. *Arterioscler Thromb Vasc Biol* 22, 2002, 243-248 ; Liu MW, Roubin GS, King SB 3rd, Restenosis after coronary angioplasty. Potential biologic determinants and role of intimal hyperplasia. *Circulation* 79, 1989, 1374-1387 ; Shibata R, Kai H, Seki Y, Kato S, Morimatsu M, Kaibuchi K, Imaizumi T, Role of Rho-associated kinase in neointima formation after vascular injury. *Circulation* 103, 2001, 284-289) 及 Iwasaki, H. 等人, High glucose induces plasminogen activator inhibitor-1 expression through Rho/Rho-kinase-mediated NF-kappaB activation in bovine aortic endothelial cells. *Atherosclerosis*, 2007年1月31日)。

手術後靜脈移植物中血管內膜增厚為後期移植失敗之主要原因。在ROCK抑制劑法舒地爾之研究中，在程序後之數週內，內膜增厚及血管平滑肌細胞(VSMC)增殖得到顯著抑制，而VSMC細胞凋亡則增強，此表明ROCK抑制劑可用作預防移植物之治療劑(Morishige K, Shimokawa H, Eto Y, Kandabashi T, Miyata K, Matsumoto Y, Hoshijima M, Kaibuchi K, Takeshita A, Adenovirus-mediated transfer of dominant-negative rho-kinase induces a regression of coronary arteriosclerosis in pigs in vivo. *Arterioscler*

Thromb Vasc Biol 21, 2001, 548-554 ; Kandabashi T, Shimokawa H, Mukai Y, Matoba T, Kunihiro I, Morikawa K, Ito M, Takahashi S, Kaibuchi K, Takeshita A, Involvement of rho-kinase in agonists-induced contractions of arteriosclerotic human arteries. Arterioscler Thromb Vasc Biol 22, 2002, 243-248 ; Liu MW, Roubin GS, King SB 3rd, Restenosis after coronary angioplasty. Potential biologic determinants and role of intimal hyperplasia. Circulation 79, 1989, 1374-1387 ; Shibata R, Kai H, Seki Y, Kato S, Morimatsu M, Kaibuchi K, Imaizumi T, Role of Rho-associated kinase in neointima formation after vascular injury. Circulation 103, 2001, 284-289)。

成年脊椎動物腦及脊髓之損傷會活化ROCK，從而引起神經退化且抑制如神經突生長及發展之神經再生(Bito, H., Furuyashiki, T., Ishihara, H., Shibasaki, Y., Ohashi, K., Mizuno, K., Maekawa, M., Ishizaki, T., Narumiya, S., A critical role for a Rho-associated kinase, p160ROCK, in determining axon outgrowth in mammalian CNS neurons. Neuron 26, 2000, 431-441)。抑制ROCK可誘導新的軸突生長、軸突跨越CNS內病變重新佈線、加速再生及加強哺乳動物中急性神經元損傷(脊髓損傷、創傷性腦損傷)後功能恢復(參見上文(Peters, S.L.等人, Rho kinase: a target for treating urinary bladder dysfunction. Trends Pharmacol Sci. 27, 2006, 492-7)及Hara, M.等人, Protein kinase inhibition

1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(六氫呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(N,N-二甲基甘胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-2-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環己基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(4,4-二氟環己基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

by fasudil hydrochloride promotes neurological recovery after spinal cord injury in rats. *J. Neurosurg. Spine* 93, 94-101 ; Fournier, A. E., Takizawa, B. T.及 Strittmatter, S. M., ROCK inhibition enhances axonal regeneration in the injured CNS. *J. Neurosci.* 23, 2003, 1416-1423 ; Sung, J. K. 等人, A possible role of RhoA/Rho-kinase in experimental spinal cord injury in rat. *Brain Res.* 959, 2003, 29-38 ; Tanaka, H. 等人, Cytoplasmic p21(Cip1/WAF1) enhances axonal regeneration and functional recovery after spinal cord injury in rats. *Neuroscience* 127, 2004, 155-164)。因此，ROCK抑制劑可用於諸如脊髓損傷、急性神經元損傷(中風、創傷性腦損傷)(Okamura N等人, Vasodilator effects of fasudil, a Rho-kinase inhibitor, on retinal arterioles in stroke-prone spontaneously hypertensive rats. *J Ocul Pharmacol Ther.* 23, 2007, 207-12 ; Yagita Y 等人, Rho-kinase activation in endothelial cells contributes to expansion of infarction after focal cerebral ischemia. *J Neurosci Res.* 85, 2007, 2460-9)、帕金森氏症、阿茲海默氏症 (Pedrini S 等人, Modulation of statin-activated shedding of Alzheimer APP ectodomain by ROCK. *PLoS Med.* 2, 2005, 18 ; Burton A., NSAIDS and Alzheimer's disease: it's only Rock and Rho. *Lancet Neurol.* 3(1), 2004, 6)及其他神經退化性病變之CNS病症的再生(恢復)治療。預計ROCK抑制劑適用之其他神經退化性病變為亨廷頓氏

病 (Shao J, Welch WJ, Diprospero NA, Diamond MI. Phosphorylation of profilin by ROCK1 regulates polyglutamine aggregation. *Mol Cell Biol.* 2008 年 9 月 ; 28(17):5196-208 ; Shao J, Welch WJ, Diamond MI. ROCK and PRK-2 mediate the inhibitory effect of Y-27632 on polyglutamine aggregation. *FEBS Lett.* 2008 年 5 月 28 日 ; 582(12): 1637-42)、脊髓性肌萎縮 (Bowerman M, Shafey D, Kothary R.. Smn depletion alters profilin II expression and leads to upregulation of the RhoA/ROCK pathway and defects in neuronal integrity. *J Mol Neurosci.* 2007; 32(2): 120-31)及肌萎縮性側索硬化。抑制 Rho/ROCK 路徑亦證明在如中風之神經退化之其他動物模型中 (Okamura N 等人, Vasodilator effects of fasudil, a Rho-kinase inhibitor, on retinal arterioles in stroke-prone spontaneously hypertensive rats. *J Ocul Pharmacol Ther.* 23, 2007, 207-12 ; Yagita Y 等人, Rho-kinase activation in endothelial cells contributes to expansion of infarction after focal cerebral ischemia. *J Neurosci Res.* 85, 2007, 2460-9)及如多發性硬化症之發炎性及脫髓鞘疾病 (Sun X 等人, The selective Rho-kinase inhibitor Fasudil is protective and therapeutic in experimental autoimmune encephalomyelitis. *J Neuroimmunol.* 180, 2006, 126-34)、急性及慢性疼痛 (Inoue, M. 等人, Initiation of neuropathic pain requires lysophosphatidic acid receptor signaling. *Nature Med.* 10,

2004, 712-718 ; Ramer, L. M., Borisoff, J. F.及Ramer, M. S., Rho-kinase inhibition enhances axonal plasticity and attenuates cold hyperalgesia after dorsal rhizotomy. J Neurosci. 24, 2004, 10796-10805 ; Tatsumi, S. 等人 , Involvement of Rho-kinase in inflammatory and neuropathic pain through phosphorylation of myristoylated alanine-rich C-kinase substrate (MARCKS). Neuroscience 131, 2005, 491-498)中有效。

ROCK抑制劑顯示藉由減少例如TNF α 之細胞因子釋放而具有消炎特性。因此，其可用於治療神經發炎疾病，諸如中風、多發性硬化症、阿茲海默氏症、帕金森氏症、肌萎縮性側索硬化及發炎性疼痛以及其他發炎疾病，諸如類風濕性關節炎、骨關節炎、骨質疏鬆症、哮喘、大腸急躁症或發炎性腸道疾病 (Segain J.P., Rho kinase blockade prevents inflammation via nuclear factor kappa B inhibition: evidence in Crohn's disease and experimental colitis. Gastroenterology. 124(5), 2003, 1180-7)。此外，最近報導證明在與哮喘有關之肺部發炎模型中抑制ROCK可破壞發炎細胞趨化性以及抑制平滑肌收縮。因此，Rho/ROCK路徑之抑制劑可用於治療哮喘(參見上文(Sun X 等人 , The selective Rho-kinase inhibitor Fasudil is protective and therapeutic in experimental autoimmune encephalomyelitis. J Neuroimmunol. 180, 2006, 126-34)及 Kawaguchi A, Ohmori M, Harada K, Tsuruoka S, Sugimoto

K, Fujimura A., The effect of a Rho kinase inhibitor Y-27632 on superoxide production, aggregation and adhesion in human polymorphonuclear leukocytes. *Eur J Pharmacol* 403, 2000, 203-208 ; Lou Z, Billadeau DD, Savoy DN, Schoon RA, Leibson P.J., A role for a RhoA/ROCK/LIM-kinase pathway in the regulation of cytotoxic lymphocytes. *J Immunol* 167, 2001, 5749-5757 ; Vicente-Manzanares M, Cabrero JR, Rey M, Perez-Martinez M, Ursa A, Itoh K, Sanchez-Madrid F., A role for the Rho-pl60 Rho coiled-coil kinase axis in the chemokine stromal cell-derived factor-1alpha-induced lymphocyte actomyosin and microtubular organization and chemotaxis. *J Immunol* 168, 2002, 400-410 ; Thorlacius K等人, Protective effect of fasudil, a Rho-kinase inhibitor, on chemokine expression, leukocyte recruitment, and hepatocellular apoptosis in septic liver injury. *J Leukoc Biol.* 79, 2006, 923-31)。

因為 ROCK 抑制劑減少細胞增殖及細胞遷移，所以其可用於治療癌症及腫瘤轉移 (Aznar, S., Fernandez-Valeron, P., Espina, C., Lacal, J.C., Rho GTPases: potential candidates for anticancer therapy. *Cancer Lett.* 206, 2004, 181-191 ; Yin, L.等人, Fasudil inhibits vascular endothelial growth factor-induced angiogenesis in vitro and in vivo. *Mol Cancer Ther* 5, 2007, 1517-25. Itoh, K., Yoshioka, K., Akedo, H., Uehata, M., Ishizaki, T., Narumiya, S., An

essential part for Rho-associated kinase in the transcellular invasion of tumor cells. *Nat Med* 5, 1999, 221-225 ; Genda, T. Sakamoto, M., Ichida, T., Asakura, H., Kojiro, M., Narumiya, S., Hirohashi, S., Cell motility mediated by rho and Rho-associated protein kinase plays a critical role in intrahepatic metastasis of human hepatocellular carcinoma. *Hepatology* 30, 1999, 1027-1036 ; Somlyo, A.V., Bradshaw, D., Ramos, S., Murphy, C, Myers, C.E., Somlyo, A.P., Rho-kinase inhibitor retards migration and in vivo dissemination of human prostate cancer cells. *Biochem Biophys Res Commun* 269, 2000, 652-659) 。 ROCK抑制劑在血腦屏障功能損傷之疾病(例如 HIV-1 腦炎)(Persidski Y 等人, Rho-mediated regulation of tight junctions during monocyte migration across the blood-brain barrier in HIV-1 encephalitis (HIVE). *Blood*. 107, 2006, 4770-4780)及阿茲海默氏症(Man S-M 等人, Peripheral T cells overexpress MIP-1a to enhance its transendothelial migration in Alzheimer's disease. *Neurobiol. Of Aging* 28, 2007, 485-496)中亦可為有益的。

此外，有證據表明 ROCK抑制劑抑制病毒侵襲後細胞骨架重排，因此其在抗病毒及抗細菌應用中亦具有潛在治療價值(Favoreel HW, Cytoskeletal rearrangements and cell extensions induced by the US3 kinase of an alphaherpesvirus are associated with enhanced spread. *Proc*

Natl Acad Sci U S A. 102(25), 2006, 8990-5)。

據報導 ROCK 在培養之 VSMC 中經由胰島素受體受質-1(IRS-1)之絲胺酸磷酸化干擾胰島素信號傳導。在紫克肥胖大鼠(Zucker obese rat)之骨骼肌及主動脈組織中觀測到 RhoA/ROCK 活化。藉由使用法舒地爾 4 週抑制 ROCK 降低血壓，調整葡萄糖及脂質代謝，改良胰島素信號傳導及內皮功能障礙。在另一實驗中，在 OLETF 大鼠中投與高劑量法舒地爾完全抑制糖尿病、肥胖症及血脂異常之發展且提高血清脂聯素含量。因此，ROCK 抑制劑可用於治療胰島素抗性 & 糖尿病 (Nakamura Y 等人, Marked increase of insulin gene transcription by suppression of the Rho/Rho-kinase pathway. Biochem Biophys Res Commun. 350(1), 2006, 68-73 ; Kikuchi Y 等人, A Rho-kinase inhibitor, fasudil, prevents development of diabetes and nephropathy in insulin-resistant diabetic rats. J Endocrinol. 192(3), 2007, 595-603 ; Goyo A 等人, The Rho-kinase inhibitor, fasudil, attenuates diabetic nephropathy in streptozotocin-induced diabetic rats. Eur J Pharmacol. 568(1-3), 2007, 242-7)。

ROCK 抑制劑法舒地爾提高腦血流量且在 CNS 缺血病狀下具有神經保護作用。預計 ROCK 抑制劑適用於治療 CNS 缺血病症，因此可改良罹患中風、血管型或 AD 型癡呆之患者中的功能結果 (Okamura N 等人, Vasodilator effects of fasudil, a Rho-kinase inhibitor, on retinal arterioles in

stroke-prone spontaneously hypertensive rats. *J Ocul Pharmacol Ther.* 23, 2007, 207-12 ; Yagita Y 等人, Rho-kinase activation in endothelial cells contributes to expansion of infarction after focal cerebral ischemia. *J Neurosci Res.* 85, 2007, 2460-9)。

歸因於 Y-27632 及法舒地爾在癲癇發生之動物模型中之功效，提出 ROCK 抑制劑用於治療癲癇症及癲癇發作病症 (Inan SY, Büyükafsar K. Antiepileptic effects of two Rho-kinase inhibitors, Y-27632 and fasudil, in mice. *Br. J. Pharmacol.* advance online publication, 2008 年 6 月 9 日 ; doi:10.1038/bjp.2008.225)。

ROCK 抑制劑亦預計可用於治療青光眼 (Honjo, M., Inatani, M., Kido, N., Sawamura, T., Yue, B.Y., Honda, Y., Tanihara, H., Effects of protein kinase inhibitor, HA 1077, on intraocular pressure and outflow facility in rabbit eyes. *Arch Ophthalmol* 119, 2001, 1171-1178 ; Rao, P.V., Deng, P.F., Kumar, J. Epstein, D.L., Modulation of aqueous humor outflow facility by the Rho kinase-specific inhibitor Y-27632. *Invest Ophthalmol Vis Sci* 42, 2001, 1029-1037)、牛皮癬、視網膜病及良性前列腺肥大。

此外，有證據表明 ROCK 抑制劑抑制病毒侵襲後細胞骨架重排，因此其在抗病毒及抗細菌應用中亦具有潛在治療價值。

因為 ROCK 一般與神經元形態形成、連接性及可塑性有

✓

流程及實驗

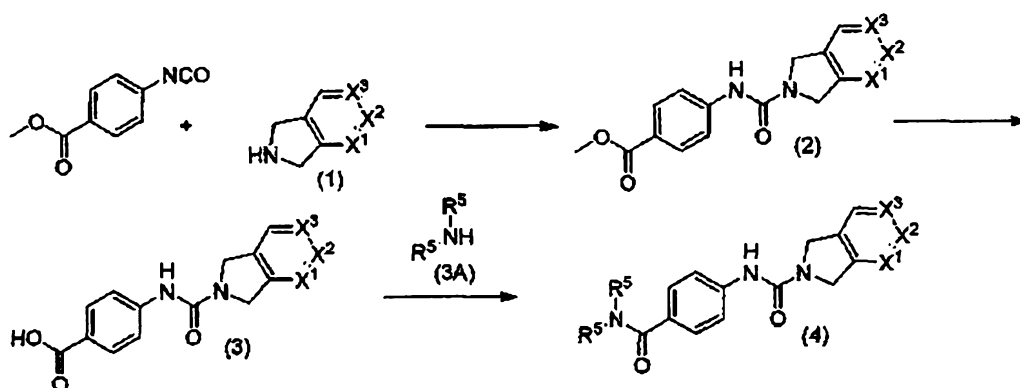
•

基吡咯啉； PPh_3 意謂三苯膦。

呈現以下流程以提供據信為本發明之程序及概念態樣之最適用及容易理解描述的內容。本發明之化合物可由合成化學方法製造，該等方法之實例展示於本文中。應瞭解方法中之步驟次序可變化，試劑、溶劑及反應條件可取代具體提及之試劑、溶劑及反應條件，且易受攻擊之部分可根據需要保護及脫除保護基。

流程

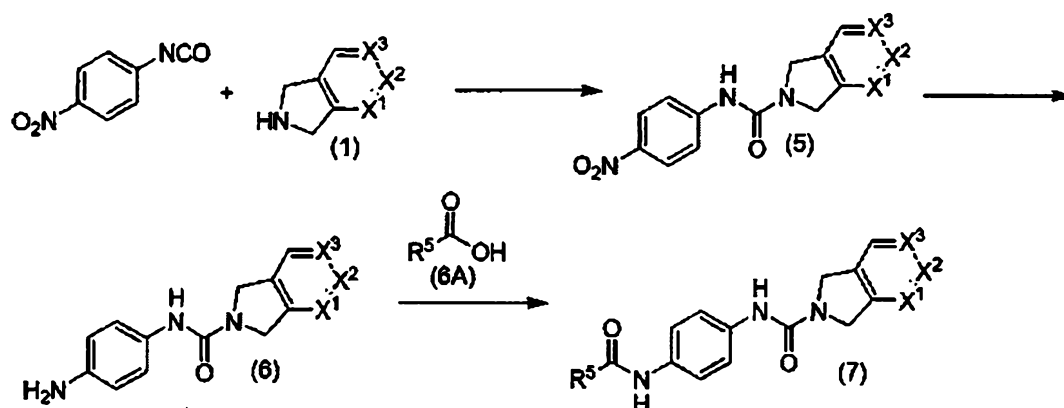
流程 1



如流程1中所示，式(1)化合物(其中 X^1 、 X^2 及 X^3 如本文所述)可與4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯反應，得到式(2)化合物。反應通常在諸如(但不限於)四氫呋喃之溶劑中進行。4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯通常在低溫下添加，接著在室溫下攪拌。式(3)化合物可藉由使式(2)化合物與氫氧化鋰水溶液反應來製備。反應通常在諸如(但不限於)四氫呋喃、甲醇或其混合物之溶劑中進行。式(3)化合物可與式(3A)之胺(其中 R^5 為氫或如本文所述)使用熟習此項技術者已知且文獻中容易獲得之偶合條件反應，得到式(4)化合物，其代

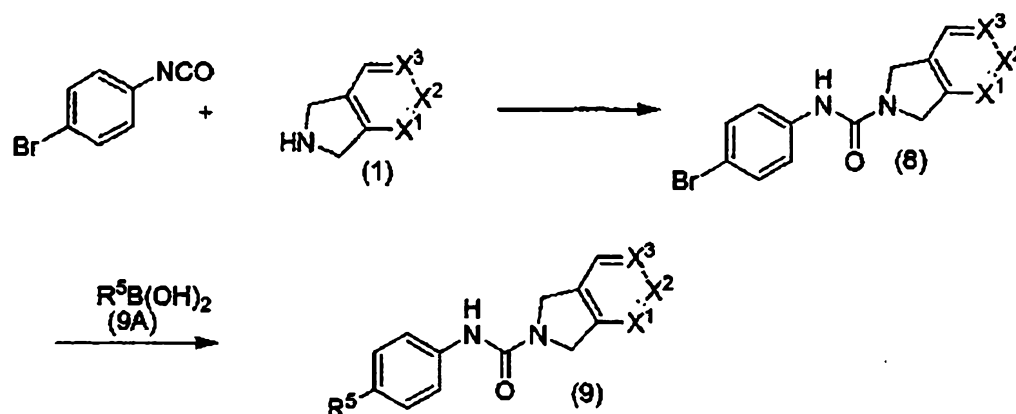
表本發明之化合物。

流程 2



如流程2中所示，式(1)化合物(其中 X^1 、 X^2 及 X^3 如本文所述)可與異氰酸4-硝基苯酯反應，得到式(5)化合物。反應通常在諸如(但不限於)四氫呋喃之溶劑中進行。式(5)化合物可在10% Pd/碳存在下用氫氣球處理，得到式(6)化合物。反應通常在諸如(但不限於)二甲基甲醯胺之溶劑中在周圍溫度下進行。式(6)化合物可與式(6A)之酸(其中 R^5 如本文所述)使用熟習此項技術者已知且文獻中容易獲得之偶合條件反應，得到式(7)化合物，其代表本發明之化合物。

流程 3



N-(4-{4-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(哌啶-1-基磺醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4,4-二氟環己基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

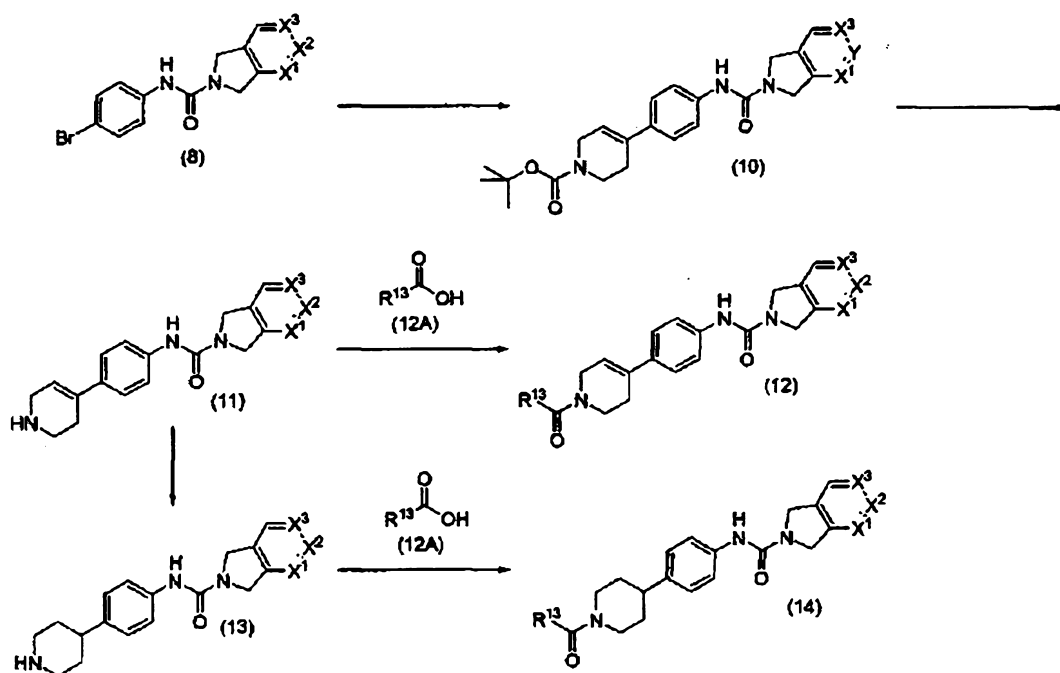
5-氟-N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

Na-(4-{[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲醯基)-D-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[2-(乙醯基胺基)苯基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

如流程3中所示，式(1)化合物(其中 X^1 、 X^2 及 X^3 如本文所述)可與異氰酸4-溴苯酯反應，得到式(8)化合物。反應通常在諸如(但不限於)四氫呋喃之溶劑中進行。式(8)化合物可與式(9A)之酮酸(或適當酮酸酯)(其中 R^5 如本文所述)使用熟習此項技術者已知且文獻中容易獲得之鈴木偶合條件(Suzuki Coupling condition)反應，得到式(9)化合物，其代表本發明之化合物。

流程 4

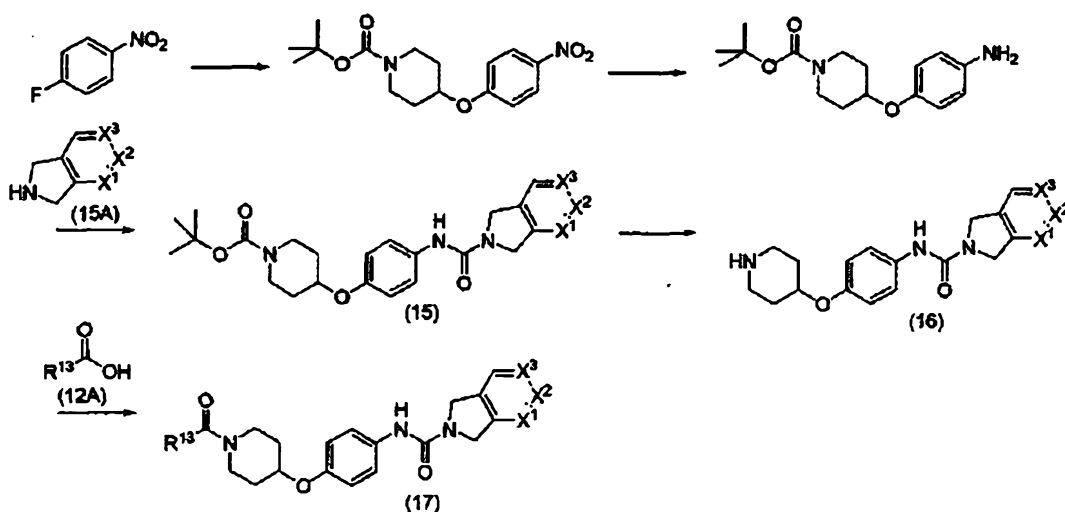


如流程4中所示，式(8)化合物(其中 X^1 、 X^2 及 X^3 如本文所述)可與4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯在熟習此項技術者已知且文獻中廣泛可得之鈴木偶合條件下反應，得到式(10)化合物。式(11)化合物可藉由用諸如(但不限於)三氟乙酸之酸處理式(10)化合物來製備。反應通常在諸如(但不限於)二氯甲烷之溶劑中在室溫下進行。式(11)化合物可與式(12A)化合物

(其中 R^{13} 如本文所述) 在羧基活化劑(諸如(但不限於)N-(3-二甲胺基丙基)-N'-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽)及偶合劑(諸如(但不限於)1-羥基苯并三唑水合物)存在下反應, 得到式(12)化合物。反應通常在諸如(但不限於)N,N-二甲基甲醯胺之溶劑中在室溫下進行。

或者, 式(12)化合物可在鈀/碳存在下用氫處理, 得到式(13)化合物。反應通常在諸如(但不限於)四氫呋喃或N,N-二甲基甲醯胺之溶劑中在壓力下進行。式(13)化合物可與式(12A)化合物(其中 R^{13} 如本文所述)在羧基活化劑(諸如(但不限於)N-(3-二甲胺基丙基)-N'-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽)及偶合劑(諸如(但不限於)1-羥基苯并三唑水合物)存在下反應, 得到式(14)化合物。反應通常在諸如(但不限於)N,N-二甲基甲醯胺之溶劑中在室溫下進行。

流程 5



氫氧化鉀水溶液及相轉移催化劑(諸如(但不限於)溴化四丁銨)可添加至4-羥基-1-哌啶-1-甲酸第三丁酯與1-氟-4-硝基苯之混合物中, 得到4-(4-硝基苯氧基)哌啶-1-甲酸第三

丁酯。4-(4-胺基苯氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯可藉由使4-(4-硝基苯氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯與氫在鈀/碳存在下反應來製備。反應通常在諸如(但不限於)四氫呋喃或N,N-二甲基甲醯胺之溶劑中在壓力下進行。4-(4-胺基苯氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯可與碳酸雙(2,5-二側氧基吡咯啶-1-基)酯及吡啶在乙腈中反應，接著添加鹼(諸如(但不限於)二異丙基乙胺)及式(15A)化合物，得到式(15)化合物。反應通常在室溫下進行。式(16)化合物可藉由用諸如(但不限於)三氟乙酸之酸處理式(15)化合物來製備。反應通常在諸如(但不限於)二氯甲烷之溶劑中在室溫下進行。式(16)化合物可與式(12A)化合物(其中R¹³如本文所述)在羧基活化劑(諸如(但不限於)N-(3-二甲胺基丙基)-N'-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽)及偶合劑(諸如(但不限於)1-羥基苯并三唑水合物)存在下反應，得到式(17)化合物。反應通常在諸如(但不限於)N,N-二甲基甲醯胺之溶劑中在室溫下進行。

呈現以下實例以提供據信為本發明之程序及概念態樣之最適用及容易理解描述的內容。例示化合物使用ACD/ChemSketch 12.01版(2009年5月13日, Advanced Chemistry Development Inc., Toronto, Ontario)或ChemDraw® 9.0.5版(CambridgeSoft, Cambridge, MA)命名。中間物使用ChemDraw® 9.0.5版(CambridgeSoft, Cambridge, MA)命名。

實驗

實例 1

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-
2-甲醯胺

實例 1A

4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯

異吲哚啉(1.693 ml, 14.47 mmol)溶於四氫呋喃(20 ml)中且冷卻至 0°C；且 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯(2.18 g, 12.06 mmol)藉由注射器添加且所得混合物升溫至周圍溫度，接著攪拌隔夜。溶液濃縮成漿狀物，用乙醚稀釋且過濾，得到標題化合物。

實例 1B

4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸

4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯(1.65 g, 5.57 mmol)溶於四氫呋喃(30 ml)及甲醇(15.00 ml)中，接著添加氫氧化鋰(11.14 ml, 22.27 mmol)且混合物在周圍溫度下攪拌過週末。有機溶劑真空移除，水層用 2 N HCl 水溶液調至約 pH 3 且所得固體藉由水洗過濾，乾燥後得到標題化合物。

實例 1C

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-
2-甲醯胺

4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸(150 mg, 0.531 mmol)及 1-羥基苯并三唑水合物(122 mg, 0.797 mmol)溶於二甲基甲醯胺(3 ml)中，接著添加 3-苯基丙-1-胺(110 mg, 0.797 mmol)及 N-(3-二甲基胺基丙基)-N'-乙基碳化二亞胺

鹽酸鹽 (153 mg, 0.797 mmol)。均質溶液在周圍溫度下攪拌隔夜。溶液用水稀釋，得到沈澱，其經過濾，先後用冷乙酸乙酯及乙醚洗滌且真空乾燥，得到標題化合物。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆, 溫度=90°C) δ ppm 8.27-8.34 (bs, 1H), 7.93-7.98 (m, 1H), 7.73-7.76 (m, 2H), 7.61-7.64 (m, 2H), 7.32-7.36 (m, 2H), 7.27-7.32 (m, 2H), 7.24-7.28 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.13-7.18 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 3.30 (q, *J*=6.5 Hz, 2H), 2.65 (t, *J*=7.6 Hz, 2H), 1.86 (p, *J*=7.3 Hz, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 400 (M+H)⁺。

實例 2

N-(4-{[4-(胺基甲基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 2A

4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯

標題化合物如實例 1A 中所述，用 5-氟異吲哚啉代替異吲哚啉製備。

實例 2B

4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸

標題化合物如實例 1B 中所述，用 4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯製備。

實例 2C

4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基
胺基甲酸第三丁酯

標題化合物如實例1C中所述，用4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸及4-(胺基甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯代替3-苯基丙-1-胺製備。

實例 2D

N-(4-{[4-(胺基甲基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二
氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯 (392 mg, 0.756 mmol) 溶於二氯甲烷中，用三氟乙酸 (582 μ l, 7.56 mmol) 處理，在周圍溫度下攪拌3小時，接著濃縮至乾。所得固體用乙醚濕磨，收集且真空乾燥，得到標題化合物。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 4.01 (q, J =5.6 Hz, 2 H), 4.46 (d, J =6.0 Hz, 2 H), 4.76 (d, J =7.9 Hz, 4 H), 7.08 - 7.29 (m, 2 H), 7.32 - 7.44 (m, 5 H), 7.67 (d, J =8.7 Hz, 2 H), 7.76 - 7.86 (m, 2 H), 8.12 (s, 2 H), 8.63 (s, 1 H), 8.91 (t, J =6.2 Hz, 1 H); MS (ESI(+)) m/e 419 (M+H)⁺。

表 3.

以下實例基本上如實例1中所述，在實例1A中用適當經取代之異吲哚啉代替異吲哚啉及在實例1C中用適當胺代替3-苯基丙-1-胺製備。一些產物藉由急驟層析純化，而其他產物藉由逆相HPLC純化；一些化合物如實例2D中所述，在醯胺偶合後亦需要脫除Boc保護基。因此，一些實例呈三氟乙酸鹽形式分離。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
3	5-氟基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.65 (s, 1H), 8.29 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.75-7.81 (m, 3H), 7.63-7.68 (m, 2H), 7.59 (d, <i>J</i> =8.0 Hz, 1H), 7.15-7.32 (m, 5H), 4.82-4.86 (m, 4H), 3.22-3.30 (m, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> =7.6 Hz, 2H), 1.82 (p, <i>J</i> =7.4 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 425 (M+H) ⁺
4	N-{4[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 1.16-1.33 (m, 2 H), 1.41-1.75 (m, 6 H), 2.04-2.23 (m, 1 H), 3.11-3.22 (m, 2 H), 4.76 (d, <i>J</i> =7.9 Hz, 4 H), 7.08-7.19 (m, 1 H), 7.24 (dd, <i>J</i> =9.12, 2.4 Hz, 1 H), 7.39 (dd, <i>J</i> =8.3, 5.16 Hz, 1 H), 7.60-7.68 (m, 2 H), 7.72-7.82 (m, 2 H), 8.27 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1 H), 8.58 (s, 1 H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) ⁺
5	5-氟基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.65 (s, 1H), 8.26 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.79 (dd, <i>J</i> =8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.74-7.79 (m, 2H), 7.62-7.67 (m, 2H), 7.59 (d, <i>J</i> =7.9 Hz, 1H), 4.84 (d, <i>J</i> =7.5 Hz, 4H), 3.14-3.27 (m, 2H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 349 (M+H) ⁺
6	N-(4-{[4-(呋喃并[3,2-c]吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.65 (s, 1H), 8.26 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.79 (dd, <i>J</i> =8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.74-7.79 (m, 2H), 7.62-7.67 (m, 2H), 7.59 (d, <i>J</i> =7.9 Hz, 1H), 4.84 (d, <i>J</i> =7.5 Hz, 4H), 3.14-3.27 (m, 2H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 468 (M+H) ⁺
7	5-氟基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.64 (s, 1H), 8.13 (dd, <i>J</i> =5.0, 1.9 Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.79 (d, <i>J</i> =8.0 Hz, 1H), 7.64-7.68 (m, 2H), 7.51-7.61 (m, 2H), 7.36-7.40 (m, 2H), 6.85 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 1H), 6.65-6.69 (m, 1H), 4.82-4.85 (bs, 4H), 3.48-3.69 (m, 8H)	(ESI(-)) m/e 451 (M-H) ⁻
8	5-氟-N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.93 (t, <i>J</i> =6.0 Hz, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.51 (ddd, <i>J</i> =4.8, 1.8, 0.9 Hz, 1H), 7.83-7.87 (m, 2H), 7.75 (td, <i>J</i> =7.7, 1.8 Hz, 1H), 7.66-7.70 (m, 2H), 7.40 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.2 Hz, 1H), 7.22-7.33 (m, 3H), 7.15 (td, <i>J</i> =8.9, 2.5 Hz, 1H), 4.75-4.80 (m, 4H), 4.55 (d, <i>J</i> =5.8 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) ⁺
9	N-[4-(苯甲基胺甲鹽基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.86 (t, <i>J</i> =6.0 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.80-7.85 (m, 2H), 7.64-7.70 (m, 2H), 7.39 (dd, <i>J</i> =8.7, 5.2 Hz, 1H), 7.29-7.35 (m, 4H), 7.20-7.28 (m, 2H), 7.15 (ddd, <i>J</i> =9.4, 8.5, 2.5 Hz, 1H), 4.74-4.79 (m, 4H), 4.47 (d, <i>J</i> =5.9 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 390 (M+H) ⁺
10	N-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氫) δ ppm 7.80-7.82 (m, 2H), 7.64-7.67 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.32-7.35 (m, 2H), 6.96 (d, <i>J</i> =1.9 Hz, 1H), 6.91 (d, <i>J</i> =8.2 Hz, 1H), 6.86 (dd, <i>J</i> =8.2, 2.0	(ESI(-)) m/e 430 (M-H) ⁻

	2H-異吲哚-2-甲醯胺	Hz, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.39-4.40 (bs, 2H), 3.78 (s, 3H)	
11	5-甲基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.54 (s, 1H), 8.13 (ddd, <i>J</i> =4.9, 2.0, 0.8 Hz, 1H), 7.65-7.68 (m, 2H), 7.55 (ddd, <i>J</i> =8.6, 7.1, 2.0 Hz, 1H), 7.35-7.39 (m, 2H), 7.25 (d, <i>J</i> =7.7 Hz, 1H), 7.17-7.19 (m, 1H), 7.13 (d, <i>J</i> =7.8 Hz, 1H), 6.85 (dt, <i>J</i> =8.6, 0.8 Hz, 1H), 6.67 (ddd, <i>J</i> =7.1, 4.9, 0.8 Hz, 1H), 4.73-4.75 (bs, 4H), 3.48-3.68 (m, 8H), 2.33 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 442 (M+H) ⁺
12	N-(4-{[4-(噻吩并[3,2- <i>c</i>]吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.56 (s, 1H), 8.03 (d, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.78 (d, <i>J</i> =5.5 Hz, 1H), 7.64-7.71 (m, 2H), 7.58 (t, <i>J</i> =5.3 Hz, 2H), 7.30-7.41 (m, 6H), 4.79 (s, 4H), 3.61-3.94 (m, 4H), 3.39-3.63 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 484 (M+H) ⁺
13	N-{4-[(2,3-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.30-8.37 (bs, 1H), 8.27-8.31 (m, 1H), 8.13-8.16 (m, 2H), 7.91-7.93 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.16-7.18 (m, 2H), 7.16-7.17 (m, 1H), 6.98 (t, <i>J</i> =7.8 Hz, 1H), 6.86 (dd, <i>J</i> =8.1, 1.5 Hz, 1H), 4.91 (d, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 4.83-4.85 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 3.71 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 432 (M+H) ⁺
14	5-氟-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.29 (t, <i>J</i> =5.5 Hz, 1H), 7.75-7.78 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.39 (dd, <i>J</i> =8.5, 5.1 Hz, 1H), 7.11-7.32 (m, 7H), 4.74-4.78 (m, 4H), 3.22-3.31 (m, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> =7.6 Hz, 2H), 1.82 (p, <i>J</i> =7.4 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 418 (M+H) ⁺
15	5-氟-N-(4-{[4-(噻吩-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.58-8.59 (m, 1H), 8.57-8.60 (m, 1H), 7.65-7.69 (m, 2H), 7.37-7.44 (m, 4H), 7.22-7.29 (m, 2H), 7.15 (td, <i>J</i> =8.9, 2.5 Hz, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =8.3 Hz, 4H), 3.49-3.81 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 447 (M+H) ⁺
16	N-{4-[(2,3-二氫-1,4-苯并二氧雜環己烯-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.33 (d, <i>J</i> =1.8 Hz, 1H), 8.28-8.29 (bs, 1H), 8.13-8.16 (m, 2H), 7.91-7.93 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 7.10-7.13 (m, 1H), 6.86 (dd, <i>J</i> =8.1, 1.8 Hz, 1H), 6.80 (dd, <i>J</i> =8.1, 7.4 Hz, 1H), 4.87 (d, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.03-4.10 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 430 (M+H) ⁺
17	5-氟-N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡啶-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 10.22 (s, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.85-7.89 (m, 2H), 7.69-7.73 (m, 2H), 7.56 (d, <i>J</i> =0.7 Hz, 1H), 7.40 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.2 Hz, 1H), 7.25 (dd, <i>J</i> =9.1, 2.4 Hz, 1H), 7.15 (td, <i>J</i> =8.9, 2.5 Hz, 1H), 4.73-4.85 (m, 4H), 4.06-4.14 (m, 2H), 1.65 (q, <i>J</i> =7.0 Hz, 2H), 1.40-1.54 (m, 1H), 0.90 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 6H)	(ESI(-)) m/e 434 (M-H) ⁻
18	N-{4-[(2-氟苯甲基)]	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氫) δ ppm	(APCI+)

	胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.92 (t, $J=5.9$ Hz, 1H), 8.67 (s, 1H), 7.81-7.84 (m, 2H), 7.66-7.68 (m, 2H), 7.30-7.40 (m, 6H), 7.18 (d, $J=7.2$ Hz, 1H), 7.16-7.20 (m, 1H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 4.52 (d, $J=5.2$ Hz, 2H)	m/e 390 (M+H) $^+$
19	5-氟-N-(4-{[4-(噁啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.37-8.40 (m, 2H), 7.64-7.68 (m, 2H), 7.36-7.43 (m, 3H), 7.24 (dd, $J=9.1, 2.4$ Hz, 1H), 7.15 (td, $J=8.9, 2.5$ Hz, 1H), 6.67 (t, $J=4.7$ Hz, 1H), 4.75-4.79 (m, 4H), 3.70-3.85 (m, 4H), 3.49-3.69 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 447 (M+H) $^+$
20	5-氟-N-(4-{(3-甲基丁基)胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.22 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.73-7.77 (m, 2H), 7.62-7.66 (m, 2H), 7.39 (dd, $J=8.4, 5.2$ Hz, 1H), 7.24 (dd, $J=9.1, 2.5$ Hz, 1H), 7.15 (td, $J=8.9, 2.5$ Hz, 1H), 4.74-4.78 (m, 4H), 3.21-3.32 (m, 2H), 1.61 (dp, $J=13.3, 6.6$ Hz, 1H), 1.37-1.45 (m, 2H), 0.90 (d, $J=6.6$ Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 370 (M+H) $^+$
21	N-{4-[(2-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.27-8.29 (bs, 2H), 8.12-8.14 (m, 2H), 7.90-7.93 (m, 2H), 7.52-7.55 (m, 1H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 6.91 (td, $J=7.4, 1.0$ Hz, 1H), 6.85 (dd, $J=8.2, 1.1$ Hz, 1H), 4.89 (d, $J=5.7$ Hz, 2H), 4.83 (s, 4H), 3.65 (s, 3H)	(APCI+) m/e 402 (M+H) $^+$
22	5-氟-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.10 (dd, $J=5.5, 1.8$ Hz, 1H), 7.74-7.81 (m, 1H), 7.65-7.69 (m, 2H), 7.37-7.43 (m, 3H), 7.24 (dd, $J=9.1, 2.4$ Hz, 1H), 7.07-7.19 (m, 2H), 6.82 (t, $J=6.2$ Hz, 1H), 4.77 (d, $J=7.9$ Hz, 4H), 3.61-3.69 (bs, 8H)	(ESI(+)) m/e 446 (M+H) $^+$
23	N-{4-[(3-氟苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 8.99 (t, $J=6.0$ Hz, 1H), 7.81-7.84 (m, 2H), 7.66-7.69 (m, 2H), 7.36-7.46 (m, 3H), 7.32-7.35 (m, 2H), 7.17 (d, $J=7.7$ Hz, 1H), 7.12 (dd, $J=10.3, 2.6$ Hz, 1H), 7.07 (td, $J=8.5, 2.8$ Hz, 1H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 4.48 (d, $J=5.8$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 390 (M+H) $^+$
24	5-氟-N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.26 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.39 (dd, $J=8.4, 5.2$ Hz, 1H), 7.24 (dd, $J=9.1, 2.8$ Hz, 1H), 7.15 (ddd, $J=9.4, 8.5, 2.6$ Hz, 1H), 4.74-4.79 (m, 4H), 3.33-3.38 (m, 2H), 3.16-3.27 (m, 4H), 2.22 (t, $J=8.0$ Hz, 2H), 1.93 (p, $J=7.5$ Hz, 2H), 1.69 (p, $J=7.0$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 425 (M+H) $^+$
25	5-氟基-N-(4-{(3-甲基丁基)胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.65 (s, 1H), 8.22 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.79 (dd, $J=7.9, 1.6$ Hz, 1H), 7.73-7.78 (m, 2H), 7.62-7.67 (m, 2H), 7.59 (d, $J=7.9$ Hz, 1H), 4.77-4.91 (m, 4H), 3.22-3.32 (m, 2H), 1.53-1.70 (m, 1H), 1.37-1.45 (m, 2H), 0.90 (d, $J=6.6$ Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 377 (M+H) $^+$
26	N-{4-[(環戊基甲基)]	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.54 (s, 1H), 8.26 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 7.13-7.78 (m, 2H),	(ESI(+)) m/e 378

	胺甲醯基]苯基}-5- 甲基-1,3-二氫-2H- 異吲哚-2-甲醯胺	7.63-7.67 (m, 2H), 7.24 (d, $J=7.7$ Hz, 1H), 7.17 (s, 1H), 7.11-7.14 (m, 1H), 4.73-4.74 (bs, 4H), 3.14-3.19 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.07-2.21 (m, 1H), 1.42-1.75 (m, 6H), 1.16-1.34 (m, 2H)	(M+H) ⁺
27	N-(4-{[4-(4-氟基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.34-8.35 (bs, 1H), 7.93-7.96 (m, 2H), 7.56-7.59 (m, 2H), 7.49-7.52 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.84-6.86 (m, 2H), 4.87 (s, 4H), 3.71-3.74 (m, 4H), 3.24-3.29 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 452 (M+H) ⁺
28	N-{4-[(4-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 8.95 (t, $J=6.0$ Hz, 1H), 7.80-7.82 (m, 2H), 7.65-7.68 (m, 2H), 7.32-7.40 (m, 6H), 7.13-7.17 (m, 2H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 4.45 (d, $J=5.7$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 390 (M+H) ⁺
29	N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 7.80-7.83 (m, 2H), 7.66-7.69 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 2H), 6.49 (d, $J=2.3$ Hz, 2H), 6.38 (t, $J=2.3$ Hz, 1H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 4.40-4.41 (m, 2H), 3.72 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 492 (M+H) ⁺
30	5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-3-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.39 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.63-7.68 (m, 2H), 7.40 (dd, $J=8.4, 5.2$ Hz, 1H), 7.24 (dd, $J=9.1, 2.5$ Hz, 1H), 7.15 (td, $J=8.9, 2.5$ Hz, 1H), 4.75-4.79 (m, 4H), 3.57-3.78 (m, 3H), 3.48 (dd, $J=8.5, 5.2$ Hz, 1H), 3.16-3.30 (m, 2H), 2.40-2.51 (m, 1H), 1.87-1.99 (m, 1H), 1.54-1.66 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 383 (M+H) ⁺
31	N-{4-[(2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.28-8.30 (bs, 1H), 8.08-8.11 (m, 2H), 7.90-7.93 (m, 2H), 7.66-7.71 (bs, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.41 (d, $J=6.3$ Hz, 2H), 0.98 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 352 (M+H) ⁺
32	5-氟-N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啶-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.31-8.34 (m, 1H), 7.71-7.75 (m, 2H), 7.62-7.66 (m, 2H), 7.39 (dd, $J=8.4, 5.1$ Hz, 1H), 7.24 (dd, $J=9.0, 2.4$ Hz, 1H), 7.15 (td, $J=8.9, 2.5$ Hz, 1H), 4.74-4.79 (m, 4H), 3.34-3.46 (m, 6H), 2.17 (t, $J=8.0$ Hz, 2H), 1.91 (p, $J=7.4$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 411 (M+H) ⁺
33	N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 7.81-7.83 (m, 2H), 7.66-7.68 (m, 2H), 7.43-7.47 (m, 2H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.31-7.35 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.49 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 456 (M+H) ⁺
34	N-(4-{[3-氟-5-(三氟甲基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 9.07 (t, $J=6.0$ Hz, 1H), 7.81-7.83 (m, 2H), 7.67-7.70 (m, 2H), 7.53-7.56 (m, 2H), 7.45-7.48 (m, 1H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 2H), 4.80 (s, 4H), 4.56 (d, $J=5.4$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 458 (M+H) ⁺

5-氟-N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

Na-(4-{[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲醯基)-L-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(甲基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

35	5-氯-N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.34 (d, <i>J</i> =1.5 Hz, 1H), 8.10 (dd, <i>J</i> =2.6, 1.4 Hz, 1H), 7.87 (d, <i>J</i> =2.6 Hz, 1H), 7.64-7.68 (m, 2H), 7.36-7.43 (m, 3H), 7.24 (dd, <i>J</i> =9.1, 2.4 Hz, 1H), 7.11-7.19 (m, 1H), 4.75-4.79 (m, 4H), 3.58-3.69 (bs, 8H)	(ESI(+)) m/e 447 (M+H) ⁺
36	N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.31 (s, 1H), 7.86-7.89 (m, 1H), 7.72-7.75 (m, 2H), 7.60-7.64 (m, 2H), 7.28-7.36 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.28 (q, <i>J</i> =6.7 Hz, 2H), 1.58-1.71 (m, 1H), 1.45 (q, <i>J</i> =7.1 Hz, 2H), 0.92 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 352 (M+H) ⁺
37	5-甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.55 (s, 1H), 8.29 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.74-7.79 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.15-7.32 (m, 6H), 6.94 (d, <i>J</i> =2.3 Hz, 1H), 6.88 (dd, <i>J</i> =8.3, 2.4 Hz, 1H), 4.65-4.79 (m, 4H), 3.77 (s, 3H), 3.22-3.31 (m, 2H), 2.60-2.68 (m, 2H), 1.77-1.88 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 429 (M+H) ⁺
38	N-{4-[(4-氯苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 8.97 (t, <i>J</i> =6.0 Hz, 1H), 8.67 (s, 1H), 7.80-7.83 (m, 2H), 7.66-7.68 (m, 2H), 7.32-7.40 (m, 8H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 4.45 (d, <i>J</i> =5.4 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 406 (M+H) ⁺
39	N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.28-8.29 (bs, 1H), 8.09-8.12 (m, 2H), 7.90-7.94 (m, 2H), 7.84-7.91 (m, 1H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.14-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.51 (dd, <i>J</i> =7.2, 5.8 Hz, 2H), 2.20-2.32 (m, 1H), 1.67-1.76 (m, 2H), 1.51-1.62 (m, 2H), 1.40-1.51 (m, 2H), 1.27-1.38 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 364 (M+H) ⁺
40	N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.59-8.64 (m, 1H), 8.29-8.32 (m, 1H), 8.17-8.19 (m, 2H), 7.92-7.94 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.18 (m, 2H), 6.82 (s, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.77 (d, <i>J</i> =5.8 Hz, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.69 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 462 (M+H) ⁺
41	N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.56 (s, 1H), 8.37-8.40 (m, 2H), 7.66-7.69 (m, 2H), 7.30-7.40 (m, 6H), 6.67 (t, <i>J</i> =4.7 Hz, 1H), 4.79 (s, 4H), 3.77-3.81 (m, 4H), 3.58 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 429 (M+H) ⁺
42	5-硝基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.68 (s, 1H), 8.23-8.30 (m, 2H), 8.21 (dd, <i>J</i> =8.3, 2.4 Hz, 1H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 3H), 4.88-4.91 (m, 4H), 3.16-3.23 (m, 2H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 369 (M+H) ⁺
43	5-甲基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.54 (s, 1H), 8.21 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.73-7.77 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.24 (d, <i>J</i> =7.7 Hz, 1H), 7.17 (s, 1H), 7.11-7.14 (m, 1H), 4.72-4.74 (bs, 4H), 3.22-3.31 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.61 (dp,	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺

		$J=13.3, 6.6 \text{ Hz, 1H}$), 1.37-1.45 (m, 2H), 0.90 (d, $J=6.6 \text{ Hz, 6H}$)	
44	N-(4-{[4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.56 (s, 1H), 7.65-7.69 (m, 2H), 7.30-7.39 (m, 6H), 6.96-7.14 (m, 4H), 4.78-4.80 (bs, 4H), 3.52-3.77 (m, 4H), 3.03-3.20 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 445 (M+H) $^+$
45	N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.46-8.51 (bs, 1H), 8.27-8.29 (bs, 1H), 8.14-8.16 (m, 2H), 7.91-7.93 (m, 2H), 7.36-7.39 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.18 (m, 2H), 6.88-6.90 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.74 (d, $J=5.8 \text{ Hz, 2H}$), 3.65 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 402 (M+H) $^+$
46	N-{4-[(2-噻吩基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.73-8.79 (m, 1H), 8.30 (d, $J=2.1 \text{ Hz, 1H}$), 8.11-8.14 (m, 2H), 7.90-7.93 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.20-7.21 (m, 1H), 7.15-7.18 (m, 2H), 7.05-7.07 (m, 1H), 6.90 (dd, $J=5.0, 3.5 \text{ Hz, 1H}$), 4.94 (d, $J=5.8 \text{ Hz, 2H}$), 4.84 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 378 (M+H) $^+$
47	N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.64 (s, 1H), 8.37-8.40 (m, 2H), 7.77 (s, 1H), 7.66-7.71 (m, 1H), 7.64-7.69 (m, 2H), 7.61 (d, $J=8.1 \text{ Hz, 1H}$), 7.37-7.40 (m, 2H), 6.67 (t, $J=4.7 \text{ Hz, 1H}$), 4.85-4.88 (bs, 4H), 3.73-3.87 (m, 4H), 3.50-3.69 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 497 (M+H) $^+$
48	N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 10.22 (s, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.85-7.89 (m, 2H), 7.68-7.75 (m, 2H), 7.57 (d, $J=0.7 \text{ Hz, 1H}$), 7.40 (dd, $J=8.4, 5.2 \text{ Hz, 1H}$), 7.25 (dd, $J=9.1, 2.5 \text{ Hz, 1H}$), 7.15 (td, $J=8.9, 2.5 \text{ Hz, 1H}$), 4.71-4.80 (m, 4H), 4.11 (q, $J=7.2 \text{ Hz, 2H}$), 1.36 (t, $J=7.2 \text{ Hz, 3H}$)	(ESI(+)) m/e 394 (M+H) $^+$
49	N-{4-[(1-苯甲基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 10.26 (s, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.11 (d, $J=0.7 \text{ Hz, 1H}$), 7.84-7.88 (m, 2H), 7.68-7.73 (m, 2H), 7.61 (d, $J=0.7 \text{ Hz, 1H}$), 7.38-7.43 (m, 1H), 7.28-7.38 (m, 3H), 7.22-7.27 (m, 3H), 7.11-7.19 (m, 1H), 5.31 (s, 2H), 4.70-4.85 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 456 (M+H) $^+$
50	N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 8.08 (ddd, $J=5.4, 1.9, 0.8 \text{ Hz, 1H}$), 7.77 (ddd, $J=8.9, 7.0, 1.9 \text{ Hz, 1H}$), 7.65-7.68 (m, 2H), 7.38-7.42 (m, 2H), 7.32-7.39 (m, 4H), 7.03-7.06 (m, 1H), 6.83 (ddd, $J=7.0, 5.4, 0.8 \text{ Hz, 1H}$), 4.82 (s, 4H), 3.64-3.72 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 428 (M+H) $^+$
51	N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 8.33-8.34 (bs, 1H), 8.13-8.14 (bs, 1H), 7.88-7.89 (bs, 1H), 7.65-7.67 (m, 2H), 7.38-7.42 (m, 2H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 2H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 3.52-3.75 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 429 (M+H) $^+$
52	N-(4-{[4-(2-甲氧基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.30-8.32 (bs, 1H), 7.92-7.96 (m, 2H),	(ESI(+)) m/e 457

	基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	7.56-7.59 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.97-7.03 (m, 1H), 6.90-6.96 (m, 3H), 4.86 (s, 4H), 3.78-3.81 (m, 4H), 3.75 (s, 3H), 3.04-3.07 (m, 4H)	(M+H) ⁺
53	N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.56 (s, 1H), 8.20 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 7.74-7.76 (m, 2H), 7.64-7.66 (m, 2H), 7.34-7.40 (m, 2H), 7.29-7.34 (m, 2H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.24-3.28 (m, 2H), 1.43-1.46 (m, 2H), 0.93 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
54	N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.33 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 1H), 8.08-8.10 (m, 2H), 7.90-7.96 (bs, 1H), 7.89-7.93 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.14-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.10-4.19 (m, 1H), 3.74-3.83 (m, 2H), 3.56-3.67 (m, 2H), 1.79-1.91 (m, 1H), 1.56-1.80 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
55	N-(4-{[4-(3-甲氧基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.32-8.33 (bs, 1H), 7.93-7.96 (m, 2H), 7.55-7.58 (m, 2H), 7.15-7.27 (m, 5H), 6.63 (t, <i>J</i> =2.3 Hz, 1H), 6.60 (ddd, <i>J</i> =8.2, 2.4, 0.8 Hz, 1H), 6.54 (ddd, <i>J</i> =8.1, 2.3, 0.8 Hz, 1H), 4.86 (s, 4H), 3.72-3.76 (m, 4H), 3.71 (s, 3H), 3.14-3.17 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 457 (M+H) ⁺
56	N-(4-{[4-(4-乙醯基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.34 (d, <i>J</i> =2.2 Hz, 1H), 7.98-8.02 (m, 2H), 7.93-7.96 (m, 2H), 7.56-7.60 (m, 2H), 7.20-7.26 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 6.89-6.93 (m, 2H), 4.87 (s, 4H), 3.73-3.76 (m, 4H), 3.26-3.32 (m, 4H), 2.47 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 469 (M+H) ⁺
57	N-(4-{[2-(2,3-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.25-8.26 (bs, 1H), 8.08-8.13 (bs, 1H), 8.07-8.11 (m, 2H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.17-7.19 (m, 2H), 6.93-6.97 (m, 1H), 6.91 (dd, <i>J</i> =7.6, 2.0 Hz, 1H), 6.82 (dd, <i>J</i> =7.7, 1.9 Hz, 1H), 4.84 (s, 4H), 3.85-3.89 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 3.11 (t, <i>J</i> =7.2 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 446 (M+H) ⁺
58	N-{4-[(3-噻吩基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.54-8.60 (m, 1H), 8.27-8.31 (bs, 1H), 8.12-8.14 (m, 2H), 7.90-7.93 (m, 2H), 7.26-7.30 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 3H), 4.84 (s, 4H), 4.77 (d, <i>J</i> =5.8 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 378 (M+H) ⁺
59	5-甲氧基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.55 (s, 1H), 8.22 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.73-7.78 (m, 2H), 7.62-7.67 (m, 2H), 7.26 (d, <i>J</i> =8.3 Hz, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> =2.0 Hz, 1H), 6.89 (dd, <i>J</i> =8.3, 2.4 Hz, 1H), 4.70-4.75 (m, 4H), 3.77 (s, 3H), 3.22-3.30 (m, 2H), 1.53-1.69 (m, 1H), 1.37-1.45 (m, 2H), 0.91 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) ⁺
60	N-{4-[(吡啶-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.93 (t, <i>J</i> =6.0 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.51 (ddd, <i>J</i> =4.8, 1.8, 0.9 Hz, 1H), 7.83-7.87 (m, 2H), 7.75 (td,	(ESI(+)) m/e 372 (M+H) ⁺

	吲哚-2-甲醯胺	$J=7.7, 1.8 \text{ Hz, 1H}$, 7.67-7.72 (m, 2H), 7.29-7.40 (m, 5H), 7.26 (ddd, $J=7.5, 4.8, 1.1 \text{ Hz, 1H}$), 4.80 (s, 4H), 4.56 (d, $J=5.8 \text{ Hz, 2H}$)	
61	5-氟-N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.45 (t, $J=5.6 \text{ Hz, 1H}$), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.40 (dd, $J=8.4, 5.2 \text{ Hz, 1H}$), 7.33 (dd, $J=5.0, 1.3 \text{ Hz, 1H}$), 7.24 (dd, $J=9.1, 2.3 \text{ Hz, 1H}$), 7.10-7.19 (m, 1H), 6.96 (dd, $J=5.0, 3.4 \text{ Hz, 1H}$), 6.90-6.93 (m, 1H), 4.71-4.84 (m, 4H), 3.44-3.53 (m, 2H), 3.06 (t, $J=7.2 \text{ Hz, 2H}$)	(ESI(+)) m/e 410 (M+H) ⁺
62	N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.27-8.31 (bs, 1H), 8.06-8.12 (m, 2H), 7.89-7.93 (m, 2H), 7.89-7.92 (m, 1H), 7.18-7.25 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.14 (qd, $J=6.7, 4.5 \text{ Hz, 1H}$), 3.73-3.83 (m, 2H), 3.55-3.68 (m, 2H), 1.80-1.91 (m, 1H), 1.56-1.79 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
63	N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 10.21 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.03 (d, $J=0.7 \text{ Hz, 1H}$), 7.85-7.89 (m, 2H), 7.70-7.74 (m, 2H), 7.56 (d, $J=0.7 \text{ Hz, 1H}$), 7.30-7.40 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 4.10 (t, $J=7.1 \text{ Hz, 2H}$), 1.65 (q, $J=7.0 \text{ Hz, 2H}$), 1.40-1.56 (m, 1H), 0.90 (d, $J=6.6 \text{ Hz, 6H}$)	(ESI(+)) m/e 418 (M+H) ⁺
64	4-氯-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.66 (s, 1H), 8.13 (dd, $J=4.9, 1.9 \text{ Hz, 1H}$), 7.64-7.71 (m, 2H), 7.56 (ddd, $J=8.7, 7.0, 1.9 \text{ Hz, 1H}$), 7.34-7.41 (m, 5H), 6.85 (d, $J=8.6 \text{ Hz, 1H}$), 6.67 (dd, $J=6.9, 4.8 \text{ Hz, 1H}$), 4.76-4.92 (m, 4H), 3.45-3.74 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 462 (M+H) ⁺
65	N-{4-[(4-苯基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.56 (s, 1H), 7.65-7.69 (m, 2H), 7.29-7.41 (m, 6H), 7.18-7.27 (m, 2H), 6.94-6.98 (m, 2H), 6.81 (t, $J=7.3 \text{ Hz, 1H}$), 4.79-4.80 (bs, 4H), 3.58-3.74 (m, 4H), 3.14-3.22 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 427 (M+H) ⁺
66	N-{4-[(6-胺基己基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.26 (t, $J=5.6 \text{ Hz, 1H}$), 7.73-7.80 (m, 2H), 7.64-7.68 (m, 2H), 7.61-7.69 (m, 2H), 7.30-7.39 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.21-3.26 (m, 2H), 2.72-2.84 (m, 2H), 1.48-1.57 (m, 4H), 1.31-1.35 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 381 (M+H) ⁺
67	4-氯-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.66 (s, 1H), 8.22 (t, $J=5.6 \text{ Hz, 1H}$), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.63-7.68 (m, 2H), 7.35-7.42 (m, 3H), 4.76-4.92 (m, 4H), 3.22-3.30 (m, 2H), 1.54-1.68 (m, 1H), 1.37-1.45 (m, 2H), 0.91 (d, $J=6.6 \text{ Hz, 6H}$)	(ESI(+)) m/e 386 (M+H) ⁺
68	N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.45 (t, $J=5.6 \text{ Hz, 1H}$), 7.75-7.78 (m, 2H), 7.65-7.68 (m, 2H), 7.25-7.44 (m, 5H), 6.96 (dd, $J=5.1, 3.4 \text{ Hz, 1H}$), 6.90-6.93 (m, 1H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.45-3.52 (m, 2H), 3.06 (t, $J=7.2 \text{ Hz, 2H}$)	(ESI(+)) m/e 390 (M+H) ⁺

69	5-甲氧基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.56 (s, 1H), 8.10 (dd, $J=5.5, 1.8$ Hz, 1H), 7.75-7.82 (m, 1H), 7.65-7.69 (m, 2H), 7.37-7.41 (m, 2H), 7.27 (d, $J=8.3$ Hz, 1H), 7.08-7.12 (m, 1H), 6.95 (d, $J=2.3$ Hz, 1H), 6.89 (dd, $J=8.3, 2.4$ Hz, 1H), 6.82 (t, $J=6.2$ Hz, 1H), 4.71-4.75 (m, 4H), 3.95-4.67 (m, 8H), 3.77 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 458 (M+H) $^+$
70	N-{4-[(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 7.79-7.81 (m, 2H), 7.65-7.67 (m, 2H), 7.32-7.39 (m, 4H), 6.89 (d, $J=1.6$ Hz, 1H), 6.86 (d, $J=7.9$ Hz, 1H), 6.81 (dd, $J=8.0, 1.4$ Hz, 1H), 5.97 (s, 2H), 4.79 (s, 4H), 4.37 (d, $J=5.2$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 416 (M+H) $^+$
71	N-{4-[(3-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.83 (t, $J=6.0$ Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 7.77-7.87 (m, 2H), 7.68 (d, $J=8.7$ Hz, 2H), 7.28-7.42 (m, 4H), 7.24 (t, $J=8.1$ Hz, 1H), 6.75-6.94 (m, 3H), 4.79 (s, 4H), 4.43 (d, $J=6.0$ Hz, 2H), 3.73 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 402 (M+H) $^+$
72	N-(4-{[4-(吡啶-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.56 (s, 1H), 8.33 (d, $J=2.9$ Hz, 1H), 8.03 (dd, $J=4.5, 1.3$ Hz, 1H), 7.66-7.69 (m, 2H), 7.30-7.41 (m, 7H), 7.24 (dd, $J=8.4, 4.5$ Hz, 1H), 4.79 (s, 4H), 3.64-3.67 (m, 4H), 3.21-3.29 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 428 (M+H) $^+$
73	N-[4-(苯甲基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.86 (t, $J=6.0$ Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 7.80-7.84 (m, 2H), 7.66-7.70 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 9H), 4.79 (s, 4H), 4.47 (d, $J=5.9$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 372 (M+H) $^+$
74	N-(4-{[4-(噻吩-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.56-8.60 (m, 1H), 8.57-8.58 (m, 1H), 7.64-7.72 (m, 2H), 7.24-7.45 (m, 8H), 4.80 (s, 4H), 3.60-3.70 (m, 8H)	(ESI(-)) m/e 427 (M-H) $^-$
75	N-{4-[(嘧啶-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 9.21 (d, $J=1.4$ Hz, 1H), 8.86-8.90 (m, 1H), 8.61 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 8.34-8.36 (bs, 1H), 8.17-8.20 (m, 2H), 7.95-7.97 (m, 2H), 7.41-7.43 (m, 1H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.87 (d, $J=5.8$ Hz, 2H), 4.85 (s, 4H)	(ESI(-)) m/e 372 (M-H) $^-$
76	N-(4-{[4-(3-氟苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.56 (s, 1H), 7.65-7.69 (m, 2H), 7.15-7.46 (m, 7H), 6.70-6.84 (m, 2H), 6.54-6.61 (m, 1H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 3.54-3.75 (m, 4H), 3.12-3.28 (m, 4H)	(ESI(-)) m/e 443 (M-H) $^-$
77	N-{4-[(2-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.28-8.30 (bs, 1H), 8.09-8.12 (m, 2H), 7.90-7.93 (m, 2H), 7.84 (d, $J=6.2$ Hz, 1H), 7.16-7.26 (m, 4H), 4.84 (s, 4H), 3.51 (dt, $J=13.2, 6.1$ Hz, 1H), 3.39 (ddd, $J=13.2, 7.1, 6.0$ Hz, 1H), 1.71-1.83 (m, 1H), 1.42-1.53 (m, 1H), 1.08-1.24 (m, 1H), 0.93 (d, $J=6.7$ Hz, 3H), 0.86 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 352 (M+H) $^+$

78	N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.65 (s, 1H), 8.10 (dd, $J=5.5, 1.8$ Hz, 1H), 7.46-7.82 (m, 6H), 7.38-7.42 (m, 2H), 7.06-7.10 (m, 1H), 6.81 (t, $J=6.2$ Hz, 1H), 4.85-4.88 (bs, 4H), 3.56-3.73 (bs, 8H)	(ESI(+)) m/e 496 (M+H) $^+$
79	N-{4-[(3-丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.27-8.29 (bs, 1H), 8.07-8.10 (m, 2H), 7.93-7.98 (m, 1H), 7.90-7.94 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.69 (td, $J=6.7, 5.6$ Hz, 2H), 3.51 (t, $J=6.1$ Hz, 2H), 3.36 (t, $J=6.5$ Hz, 2H), 1.95 (p, $J=6.4$ Hz, 2H), 1.44-1.60 (m, 2H), 1.25-1.42 (m, 2H), 0.85 (t, $J=7.3$ Hz, 3H)	(ESI(-)) m/e 394 (M-H) $^-$
80	N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.28-8.30 (bs, 1H), 8.14-8.18 (m, 1H), 8.07-8.11 (m, 2H), 7.87-7.89 (m, 2H), 7.60-7.65 (m, 2H), 7.26-7.32 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 3H), 7.14-7.18 (m, 3H), 5.67-5.73 (m, 1H), 4.83 (s, 4H), 4.21-4.25 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 402 (M+H) $^+$
81	N-(4-{[2-(3,4-二羥基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 7.74-7.76 (m, 2H), 7.64-7.67 (m, 2H), 7.32-7.40 (m, 4H), 6.66 (d, $J=10.7$ Hz, 1H), 6.66 (d, $J=2.4$ Hz, 1H), 6.51 (dd, $J=8.0, 2.1$ Hz, 1H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 3.39 (t, $J=7.5$ Hz, 2H), 2.66 (t, $J=7.5$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 418 (M+H) $^+$
82	N-{4-[(3-丙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.28-8.30 (bs, 1H), 8.07-8.10 (m, 2H), 7.93-8.00 (m, 1H), 7.90-7.94 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.66-3.71 (m, 2H), 3.51 (t, $J=6.1$ Hz, 2H), 3.30 (t, $J=6.5$ Hz, 2H), 1.94 (p, $J=6.4$ Hz, 2H), 1.48-1.57 (m, 2H), 0.85 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(-)) m/e 380 (M-H) $^-$
83	N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.37-8.53 (m, 1H), 8.28-8.31 (bs, 1H), 8.10-8.13 (m, 2H), 7.90-7.93 (m, 2H), 7.52-7.54 (m, 1H), 7.41 (t, $J=1.7$ Hz, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.18 (m, 2H), 6.51-6.53 (m, 1H), 4.84 (s, 4H), 4.60-4.62 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 362 (M+H) $^+$
84	N-(4-{[4-(2-氟基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.32-8.33 (bs, 1H), 7.92-7.95 (m, 2H), 7.55-7.58 (m, 1H), 7.53-7.59 (m, 2H), 7.39-7.44 (m, 1H), 7.20-7.25 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 6.93-6.99 (m, 2H), 4.80-4.87 (m, 4H), 3.80-3.83 (m, 4H), 3.15-3.17 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 452 (M+H) $^+$
85	N-{4-[(3-羥基-2-甲基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 7.89-7.92 (m, 2H), 7.69-7.72 (m, 2H), 7.38-7.41 (m, 2H), 7.33-7.36 (m, 2H), 7.02 (t, $J=7.9$ Hz, 1H), 6.79 (d, $J=7.8$ Hz, 1H), 6.74 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 4.80-4.82 (bs, 4H), 2.02 (s, 3H)	(ESI(-)) m/e 386 (M-H) $^-$

86	N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.64 (s, 1H), 8.21 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.74-7.78 (m, 3H), 7.56-7.70 (m, 4H), 4.85-4.87 (bs, 4H), 3.22-3.30 (m, 2H), 1.51-1.72 (m, 1H), 1.37-1.45 (m, 2H), 0.91 (d, $J=6.6$ Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) $^+$
87	N-{4-[(3-甲基-1H-吲哚-5-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 10.02-10.04 (bs, 1H), 8.41-8.42 (m, 1H), 8.33-8.35 (bs, 1H), 8.23-8.26 (m, 2H), 7.95-7.98 (m, 2H), 7.86 (dd, $J=8.8, 1.9$ Hz, 1H), 7.48-7.53 (m, 1H), 7.20-7.25 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 2.58 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 412 (M+H) $^+$
88	N-{4-[(3-乙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.27-8.28 (bs, 1H), 8.07-8.10 (m, 2H), 7.94-7.99 (m, 1H), 7.89-7.94 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.68 (td, $J=6.7, 5.7$ Hz, 2H), 3.49 (t, $J=6.1$ Hz, 2H), 3.38 (q, $J=6.9$ Hz, 2H), 1.93 (p, $J=6.4$ Hz, 2H), 1.10 (t, $J=6.9$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) $^+$
89	N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.65 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.09-8.12 (bs, 1H), 7.87 (d, $J=2.6$ Hz, 1H), 7.76-7.78 (bs, 1H), 7.64-7.73 (m, 3H), 7.58-7.64 (m, 1H), 7.37-7.41 (m, 2H), 4.85-4.88 (bs, 4H), 3.62-3.65 (m, 8H)	(ESI(-)) m/e 495 (M-H) $^-$
90	N-(4-{[2-(2,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 7.73-7.75 (m, 2H), 7.62-7.65 (m, 2H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.32-7.35 (m, 2H), 6.90 (d, $J=8.6$ Hz, 1H), 6.76-6.78 (m, 2H), 4.78-4.80 (bs, 4H), 3.78 (s, 3H), 3.44 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 2.81 (t, $J=7.2$ Hz, 2H)	(ESI(-)) m/e 444 (M-H) $^-$
91	N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.39 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.65-7.68 (m, 2H), 7.30-7.39 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.57-3.78 (m, 3H), 3.48 (dd, $J=8.5, 5.2$ Hz, 1H), 3.17-3.28 (m, 2H), 2.41-2.51 (m, 1H), 1.93 (dtd, $J=12.2, 8.0, 5.7$ Hz, 1H), 1.54-1.66 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) $^+$
92	N-{4-[(1-苯甲基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 10.25 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.84-7.88 (m, 2H), 7.70-7.74 (m, 2H), 7.61 (d, $J=0.7$ Hz, 1H), 7.23-7.40 (m, 9H), 5.31 (s, 2H), 4.79-4.80 (bs, 4H)	(ESI(+)) m/e 438 (M+H) $^+$
93	5-({4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}胺基)-1H-吲哚-3-甲酸甲酯	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 10.25-10.26 (bs, 1H), 8.92 (d, $J=1.9$ Hz, 1H), 8.34-8.36 (bs, 1H), 8.23-8.25 (m, 2H), 8.17 (dd, $J=8.9, 2.0$ Hz, 1H), 7.95-7.98 (m, 2H), 7.64 (d, $J=8.9$ Hz, 1H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.90 (s, 3H)	(APCI(+)) m/e 456 (M+H) $^+$
94	N-(4-{[2-(2-側氧基	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬, 溫度	(ESI(+))

	吡咯啉-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	=90°C) δ ppm 7.73-7.75 (m, 2H), 7.62-7.65 (m, 2H), 7.32-7.40 (m, 4H), 4.82 (s, 4H), 3.38-3.47 (m, 6H), 2.23 (t, $J=8.0$ Hz, 2H), 1.91-1.99 (m, 2H)	m/e 393 (M+H) ⁺
95	N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲鹽基}苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.81-8.88 (m, 1H), 8.57-8.60 (m, 2H), 8.34-8.37 (bs, 1H), 8.16-8.19 (m, 2H), 7.94-7.98 (m, 2H), 7.30-7.32 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.17-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 4.74 (d, $J=6.0$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 373 (M+H) ⁺
96	N-(4-{[4-(5-氯吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.56 (s, 1H), 8.13 (d, $J=2.7$ Hz, 1H), 7.64-7.70 (m, 2H), 7.63 (dd, $J=9.2, 2.7$ Hz, 1H), 7.30-7.39 (m, 6H), 6.90 (d, $J=9.1$ Hz, 1H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 3.47-3.72 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 462 (M+H) ⁺
97	N-(4-{[2-(1H-吲哚-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.75-7.78 (m, 2H), 7.63-7.66 (m, 2H), 7.59-7.63 (m, 1H), 7.32-7.40 (m, 5H), 7.17 (s, 1H), 7.10 (ddd, $J=8.1, 6.9, 1.2$ Hz, 1H), 7.01 (ddd, $J=7.9, 6.9, 1.0$ Hz, 1H), 4.82 (s, 4H), 3.60 (t, $J=7.4$ Hz, 2H), 3.01 (t, $J=7.4$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 425 (M+H) ⁺
98	N-(4-{[4-(三氟甲基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 9.05 (t, $J=6.0$ Hz, 1H), 7.81-7.84 (m, 2H), 7.66-7.71 (m, 4H), 7.53-7.55 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.32-7.36 (m, 2H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 4.54-4.56 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 440 (M+H) ⁺
99	N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲鹽基}苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 7.88-7.91 (m, 2H), 7.71-7.74 (m, 2H), 7.38-7.41 (m, 2H), 7.33-7.36 (m, 2H), 7.06-7.07 (m, 2H), 6.27 (t, $J=2.2$ Hz, 1H), 4.80-4.81 (bs, 4H), 3.78 (s, 6H)	(APCI(+)) m/e 418 (M+H) ⁺
100	N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲鹽基}苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.81 (d, $J=2.3$ Hz, 1H), 8.75-8.80 (m, 1H), 8.53 (dd, $J=4.7, 1.6$ Hz, 1H), 8.31-8.33 (bs, 1H), 8.12-8.15 (m, 2H), 7.91-7.94 (m, 2H), 7.71-7.75 (m, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.18 (m, 2H), 7.10-7.14 (m, 1H), 4.84 (s, 4H), 4.75 (d, $J=5.8$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 373 (M+H) ⁺
101	N-[4-(2,3-二氫-1,4-苯并二氧雜環己烯-6-基)胺甲鹽基}苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 9.88-9.89 (bs, 1H), 8.30 (d, $J=2.0$ Hz, 1H), 8.13-8.16 (m, 2H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.77 (d, $J=2.5$ Hz, 1H), 7.41 (dd, $J=8.6, 2.5$ Hz, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.17-7.19 (m, 2H), 6.93 (d, $J=8.6$ Hz, 1H), 4.84 (s, 4H), 4.07-4.10 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 416 (M+H) ⁺
102	N-(4-{[4-(2-氯苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 7.63-7.65 (m, 2H), 7.50-7.57 (m, 1H), 7.42-7.46 (m, 1H), 7.35-7.41 (m, 4H), 7.28-7.35 (m, 4H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.71-3.76 (m, 2H), 3.51-3.62	(ESI(+)) m/e 473 (M+H) ⁺

	胺	(m, 4H), 3.30-3.33 (m, 2H)	
103	N-(4-{[2-(5-甲氧基-1H-吡啶-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.75-7.78 (m, 2H), 7.62-7.65 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 2H), 7.27 (dd, <i>J</i> =8.7, 0.6 Hz, 1H), 7.14 (q, <i>J</i> =0.7 Hz, 1H), 7.11 (dd, <i>J</i> =2.4, 0.5 Hz, 1H), 6.76 (dd, <i>J</i> =8.6, 2.4 Hz, 1H), 4.82 (s, 4H), 3.78 (s, 3H), 3.58 (t, <i>J</i> =7.3 Hz, 2H), 2.97 (t, <i>J</i> =7.3 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 455 (M+H) ⁺
104	N-{4-[(3-胺基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.39-8.43 (m, 1H), 8.30-8.32 (bs, 1H), 8.11-8.14 (m, 2H), 7.90-7.93 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.17-7.19 (m, 2H), 7.09 (t, <i>J</i> =7.7 Hz, 1H), 6.92 (t, <i>J</i> =1.9 Hz, 1H), 6.80 (dd, <i>J</i> =7.5, 1.4 Hz, 1H), 6.67-6.70 (m, 1H), 4.85 (s, 4H), 4.73 (d, <i>J</i> =5.8 Hz, 2H)	(APCI(+)) m/e 387 (M+H) ⁺
105	N-(4-{[2-(2-氯苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 8.49 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.73-7.75 (m, 2H), 7.63-7.65 (m, 2H), 7.43 (dd, <i>J</i> =7.4, 1.9 Hz, 1H), 7.36-7.40 (m, 2H), 7.35-7.37 (m, 1H), 7.32-7.36 (m, 2H), 7.24-7.31 (m, 1H), 4.78-4.80 (bs, 4H), 3.49-3.54 (m, 2H), 2.98 (t, <i>J</i> =7.2 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) ⁺
106	N-(4-{[(2R)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.56 (s, 1H) 7.71-7.86 (m, 3H) 7.59-7.71 (m, 2H) 7.20-7.45 (m, 4H) 4.79 (s, 4H) 4.64 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H) 3.90-4.16 (m, 1H) 3.21-3.52 (m, 2H) 1.54-1.72 (m, 1H) 1.28-1.53 (m, 2H) 0.88 (t, <i>J</i> =6.7 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) ⁺
107	N-{4-[(2-丙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.26-8.28 (bs, 1H), 8.08-8.11 (m, 2H), 7.99-8.06 (m, 1H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.77 (q, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.65 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.35 (t, <i>J</i> =6.5 Hz, 2H), 1.43-1.59 (m, 2H), 0.84 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) ⁺
108	N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.27-8.29 (bs, 1H), 8.08-8.10 (m, 2H), 7.92-7.98 (m, 1H), 7.90-7.94 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.66-3.72 (m, 2H), 3.51 (t, <i>J</i> =6.1 Hz, 2H), 3.13 (d, <i>J</i> =6.4 Hz, 2H), 1.95 (p, <i>J</i> =6.4 Hz, 2H), 1.75-1.87 (m, 1H), 0.87 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) ⁺
109	N-(4-{[4-(吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 8.16-8.20 (m, 2H), 7.65-7.69 (m, 2H), 7.30-7.40 (m, 6H), 6.81-6.85 (m, 2H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 3.60-3.64 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 428 (M+H) ⁺
110	N-[4-({4-[5-(三氟甲基)吡啶-2-基]哌嗪-1-基]羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 8.42-8.43 (m, 1H), 7.83 (dd, <i>J</i> =9.1, 2.6 Hz, 1H), 7.65-7.67 (m, 2H), 7.38-7.43 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.32-7.36 (m, 2H), 6.98 (d, <i>J</i> =9.1 Hz,	(ESI(-)) m/e 494 (M-H) ⁻

	咪-2-甲磺胺	¹ H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 3.50-3.74 (m, 8H)	
111	N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 9.91-9.93 (bs, 1H), 8.33-8.35 (bs, 1H), 8.17-8.20 (m, 2H), 7.92-7.95 (m, 2H), 7.43 (s, 2H), 7.20-7.25 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.87 (d, <i>J</i> =0.4 Hz, 3H), 3.74 (s, 6H)	(ESI(-)) m/e 446 (M-H) ⁻
112	N-{4-[(4-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.26-8.28 (bs, 1H), 7.90-7.92 (m, 2H), 7.51-7.54 (m, 2H), 7.19-7.25 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 4.21-4.27 (m, 2H), 2.82 (ddd, <i>J</i> =13.2, 12.1, 2.7 Hz, 2H), 1.44-1.50 (m, 3H), 1.01-1.12 (m, 2H), 0.83 (d, <i>J</i> =6.1 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 364 (M+H) ⁺
113	N-[4-({2-[4-(二甲基胺基)苯基]乙基}胺甲磺基)苯基]-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 7.73-7.76 (m, 2H), 7.64-7.66 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.30-7.36 (m, 4H), 7.21-7.25 (m, 2H), 4.78-4.80 (bs, 4H), 3.47 (t, <i>J</i> =7.3 Hz, 2H), 3.05 (s, 6H), 2.83-2.88 (m, 2H)	(APCI(+)) m/e 429 (M+H) ⁺
114	N-(4-{[3-(三氟甲氧基)苯甲基]胺甲磺基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 9.03 (t, <i>J</i> =6.0 Hz, 1H), 8.67-8.69 (bs, 1H), 7.81-7.83 (m, 2H), 7.67-7.69 (m, 2H), 7.48 (t, <i>J</i> =7.9 Hz, 1H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.34-7.37 (m, 1H), 7.31-7.35 (m, 2H), 7.28-7.29 (bs, 1H), 7.24 (dd, <i>J</i> =8.2, 2.2 Hz, 1H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 4.51 (d, <i>J</i> =5.6 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 456 (M+H) ⁺
115	N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲磺基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.45-8.49 (m, 1H), 8.28-8.29 (bs, 1H), 8.08-8.12 (m, 2H), 7.87-7.90 (m, 2H), 7.55-7.59 (m, 2H), 7.26-7.33 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 3H), 7.16-7.18 (m, 2H), 5.79 (td, <i>J</i> =7.9, 5.4 Hz, 1H), 4.82 (s, 4H), 3.88-3.99 (m, 2H), 2.19-2.43 (m, 2H)	(ESI(-)) m/e 414 (M-H) ⁻
116	N-{4-[(3-氟基苯基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 8.23 (t, <i>J</i> =1.8 Hz, 1H), 8.04 (ddd, <i>J</i> =8.0, 2.3, 1.5 Hz, 1H), 7.91-7.94 (m, 2H), 7.71-7.78 (m, 2H), 7.59 (t, <i>J</i> =7.9 Hz, 1H), 7.56 (dt, <i>J</i> =7.6, 1.5 Hz, 1H), 7.38-7.41 (m, 2H), 7.33-7.36 (m, 2H), 4.75-4.87 (m, 4H)	(ESI(-)) m/e 381 (M-H) ⁻
117	N-{4-[(3-氟-4-甲氧基苯基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 10.07-10.09 (bs, 1H), 8.33-8.34 (bs, 1H), 8.13-8.16 (m, 2H), 8.01 (dd, <i>J</i> =13.5, 2.5 Hz, 1H), 7.91-7.93 (m, 2H), 7.57-7.60 (m, 1H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 6.98 (t, <i>J</i> =9.1 Hz, 1H), 4.84 (s, 4H), 3.73 (s, 3H)	(ESI(-)) m/e 404 (M-H) ⁻
118	N-{4-[(2,3-二甲氧基苯基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 9.11-9.13 (bs, 1H), 8.40-8.44 (m, 1H), 8.37 (dd, <i>J</i> =8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.08-8.11 (m, 2H), 7.96-7.99 (m, 2H), 7.21-7.23 (m, 2H), 7.17-7.19 (m, 2H), 7.06 (t, <i>J</i> =8.3 Hz, 1H), 6.74 (dd, <i>J</i> =8.3, 1.3 Hz, 1H), 4.85 (s, 4H), 3.88 (s, 3H), 3.74 (s,	(ESI(+)) m/e 418 (M+H) ⁺

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-
 氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯
 基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯
 基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-
 1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲
 鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-
 1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-
 5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-氯-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-
 二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲鹽基}
 苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

		3H)	
119	N-(4-{[2-(2-氯苯基)乙基]胺甲磺基}苯基)-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氘) δ ppm 8.64-8.65 (bs, 1H), 8.48 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 7.72-7.74 (m, 2H), 7.62-7.66 (m, 2H), 7.36-7.42 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 2H), 7.25-7.32 (m, 2H), 7.12-7.17 (m, 2H), 4.79-4.88 (m, 4H), 3.47-3.51 (m, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> =7.2 Hz, 2H)	(ESI(-)) m/e 402 (M-H) ⁻
120	N-[4-(异丁基胺甲磺基)苯基]-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.27-8.29 (bs, 1H), 8.09-8.12 (m, 2H), 7.90-7.93 (m, 2H), 7.84-7.90 (m, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.39 (dd, <i>J</i> =6.8, 6.0 Hz, 2H), 1.91-2.03 (m, 1H), 0.93 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 338 (M+H) ⁺
121	N-(4-{[2-(1,3-苯并间二氧杂环戊烯-5-基)乙基]胺甲磺基}苯基)-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氘) δ ppm 8.64-8.66 (bs, 1H), 8.42 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.73-7.75 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 2H), 6.81-6.84 (m, 2H), 6.71 (dd, <i>J</i> =7.8, 1.7 Hz, 1H), 5.95 (s, 2H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.41-3.46 (m, 2H), 2.73-2.78 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 430 (M+H) ⁺
122	N-(4-{[2-(2-甲氧基苯基)乙基]胺甲磺基}苯基)-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.25-8.27 (bs, 1H), 8.05-8.08 (m, 2H), 7.98-8.02 (bs, 1H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.19-7.25 (m, 3H), 7.14-7.19 (m, 3H), 6.83-6.90 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.83-3.88 (m, 2H), 3.66 (s, 3H), 3.09 (t, <i>J</i> =7.1 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 416 (M+H) ⁺
123	N-[4-(丁基胺甲磺基)苯基]-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.27-8.28 (bs, 1H), 8.09-8.12 (m, 2H), 7.89-7.93 (m, 2H), 7.86-7.92 (m, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.48-3.61 (m, 2H), 1.62 (p, <i>J</i> =7.2 Hz, 2H), 1.26-1.44 (m, 2H), 0.85 (t, <i>J</i> =7.3 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 338 (M+H) ⁺
124	N-{4-[(2-异丙氧基乙基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氘, 溫度=90°C) δ ppm 7.75-7.78 (m, 2H), 7.63-7.66 (m, 2H), 7.26-7.40 (m, 4H), 4.82 (s, 4H), 3.58-3.68 (m, 1H), 3.52-3.56 (m, 2H), 3.42 (t, <i>J</i> =6.2 Hz, 2H), 1.12 (d, <i>J</i> =6.1 Hz, 6H)	(ESI(-)) m/e 366 (M-H) ⁻
125	N-{4-[(3-异丙氧基丙基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.28-8.30 (bs, 1H), 8.07-8.10 (m, 2H), 7.93-7.97 (m, 1H), 7.90-7.94 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.62-3.74 (m, 2H), 3.42-3.55 (m, 3H), 1.92 (p, <i>J</i> =6.4 Hz, 2H), 1.08 (d, <i>J</i> =6.1 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) ⁺
126	4-氯-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.66 (s, 1H), 8.29 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.64-7.68 (m, 2H), 7.33-7.41 (m, 3H), 7.13-7.32 (m, 5H), 4.77-4.89 (m, 4H), 3.19-3.31 (m, 2H), 2.58-2.68 (m, 2H), 1.76-1.89 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 434 (M+H) ⁺
127	N-(4-{[2-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲磺基}苯基)-1,3-二氢-	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氘) δ ppm 8.64-8.66 (bs, 1H), 8.43 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.73-7.76 (m, 2H), 7.63-7.65 (m, 2H), 7.36-7.41 (m,	(ESI(+)) m/e 416 (M+H) ⁺

	2H-異吲哚-2-甲醯胺	2H), 7.31-7.35 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.86-6.88 (m, 2H), 4.78-4.80 (bs, 4H), 3.72 (s, 3H), 3.42-3.51 (m, 2H), 2.78 (t, $J=7.4$ Hz, 2H)	
128	N-{4-[(3-甲氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 7.75-7.78 (m, 2H), 7.60-7.69 (m, 2H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.32-7.35 (m, 2H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 3.39 (t, $J=6.3$ Hz, 2H), 3.30 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 3.25 (s, 3H), 1.76 (p, $J=6.7$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 354 (M+H) $^+$
129	N-(4-{[2-(4-氟苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 8.64-8.66 (bs, 1H), 8.45 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.73-7.75 (m, 2H), 7.63-7.66 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.31-7.35 (m, 2H), 7.27-7.31 (m, 2H), 7.09-7.13 (m, 2H), 4.78-4.80 (bs, 4H), 3.47 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 2.84 (t, $J=7.3$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 404 (M+H) $^+$
130	N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.27 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.64-7.69 (m, 2H), 7.30-7.39 (m, 4H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.32-3.39 (m, 2H), 3.17-3.26 (m, 4H), 2.22 (t, $J=8.0$ Hz, 2H), 1.87-1.97 (m, 2H), 1.69 (p, $J=7.0$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) $^+$
131	N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.89-8.91 (bs, 1H), 8.53 (d, $J=8.7$ Hz, 1H), 8.36-8.37 (bs, 1H), 8.10-8.13 (m, 2H), 7.95-7.98 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 6.67 (d, $J=2.6$ Hz, 1H), 6.61 (dd, $J=8.7, 2.7$ Hz, 1H), 4.85 (s, 4H), 3.72 (s, 3H), 3.69 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 418 (M+H) $^+$
133	N-{4-[(2-苯氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.52 (t, $J=5.5$ Hz, 1H), 7.77-7.81 (m, 2H), 7.65-7.69 (m, 2H), 7.26-7.39 (m, 6H), 6.90-6.99 (m, 3H), 4.79 (s, 4H), 4.10 (t, $J=5.9$ Hz, 2H), 3.62 (q, $J=5.7$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 402 (M+H) $^+$
134	N-(4-{[2-(4-羥基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 7.73-7.76 (m, 2H), 7.63-7.66 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 2H), 7.04-7.07 (m, 2H), 6.69-6.71 (m, 2H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 3.41 (dd, $J=8.5, 6.5$ Hz, 2H), 2.73 (t, $J=7.5$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 402 (M+H) $^+$
135	N-(4-{[2-(3-氟苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 8.64-8.66 (bs, 1H), 8.46 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.72-7.75 (m, 2H), 7.63-7.66 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.31-7.35 (m, 3H), 7.08-7.11 (m, 2H), 7.00-7.05 (m, 1H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.50 (t, $J=6.9$ Hz, 2H), 2.88 (t, $J=7.2$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 404 (M+H) $^+$
136	N-[4-({1-[(3S)-四氫呋喃-3-基]-1H-吡唑-4-基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 10.25 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.85-7.89 (m, 2H), 7.70-7.75 (m, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.29-7.41 (m, 4H), 4.94-5.06 (m, 1H), 4.80-4.81 (bs, 4H), 3.93-4.01 (m, 2H), 3.78-3.89 (m, 2H), 2.30-2.46 (m, 1H), 2.14-2.30 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 418 (M+H) $^+$
137	5-甲基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]}	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.55 (s, 1H), 8.29 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.74-7.79 (m, 2H),	(ESI(+)) m/e 414

	苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	7.63-7.68 (m, 2H), 7.11-7.34 (m, 8H), 4.73-4.74 (bs, 4H), 3.20-3.30 (m, 2H), 2.63 (t, $J=7.6$ Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.82 (p, $J=7.4$ Hz, 2H)	(M+H) ⁺
138	N-[4-(1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-8-基羧基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.27-8.28 (bs, 1H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.52-7.55 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.18 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.84 (s, 4H), 3.73-3.76 (m, 4H), 1.71-1.75 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) ⁺
139	N-{4-[(2-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 8.38 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.73-7.77 (m, 2H), 7.64-7.67 (m, 2H), 7.20-7.39 (m, 9H), 4.79 (s, 4H), 3.43-3.50 (m, 2H), 2.80-2.88 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 386 (M+H) ⁺
140	N-(4-{[2-(2,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.25-8.26 (bs, 1H), 8.07-8.09 (m, 2H), 7.95-8.02 (m, 1H), 7.88-7.93 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.13-7.19 (m, 2H), 6.57 (d, $J=2.4$ Hz, 1H), 6.49 (dd, $J=8.1, 2.4$ Hz, 1H), 4.84 (s, 4H), 3.81-3.85 (m, 2H), 3.68 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.04 (t, $J=7.0$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 446 (M+H) ⁺
141	N-(4-{[3-(甲基硫基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.76-7.78 (m, 2H), 7.63-7.65 (m, 2H), 7.32-7.40 (m, 4H), 4.82 (s, 4H), 3.37 (t, $J=6.9$ Hz, 2H), 2.53-2.57 (m, 2H), 2.09 (s, 3H), 1.85 (p, $J=7.1$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 370 (M+H) ⁺
142	N-{4-[(2-乙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.28-8.34 (m, 1H), 8.07-8.12 (m, 2H), 8.01-8.08 (m, 1H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.14-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.76 (q, $J=5.7$ Hz, 2H), 3.63 (t, $J=5.7$ Hz, 2H), 3.43 (q, $J=6.9$ Hz, 2H), 1.09 (t, $J=6.9$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 354 (M+H) ⁺
143	N-{4-[(2-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 7.91-7.93 (m, 2H), 7.72-7.75 (m, 2H), 7.56-7.65 (m, 1H), 7.37-7.42 (m, 2H), 7.32-7.37 (m, 2H), 7.26-7.31 (m, 2H), 7.21-7.26 (m, 1H), 4.78-4.82 (m, 4H)	(ESI(-)) m/e 374 (M-H) ⁻
144	N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 8.45 (d, $J=2.2$ Hz, 1H), 8.41 (dd, $J=4.7, 1.6$ Hz, 1H), 8.38 (d, $J=5.5$ Hz, 1H), 7.71-7.75 (m, 2H), 7.63-7.68 (m, 3H), 7.29-7.39 (m, 5H), 4.79 (s, 4H), 3.46-3.53 (m, 2H), 2.87 (t, $J=7.1$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 387 (M+H) ⁺
145	N-[4-({4-[(三氟甲基)硫基]苯基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 9.03 (t, $J=6.0$ Hz, 1H), 8.67-8.70 (bs, 1H), 7.82-7.84 (m, 2H), 7.66-7.70 (m, 4H), 7.47-7.49 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 2H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 4.53 (d, $J=5.3$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 472 (M+H) ⁺
146	N-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)胺甲醯基]}	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 9.90-9.92 (bs, 1H), 8.32-8.33 (bs, 1H),	(ESI(+)) m/e 418 (M+H) ⁺

	苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 8.17-8.19 (m, 2H), 7.92-7.94 (m, 2H), 7.77 (d, $J=2.4$ Hz, 1H), 7.49-7.53 (m, 1H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 6.94 (d, $J=8.6$ Hz, 1H), 4.84 (s, 4H), 3.74 (s, 6H)	
147	N-(4-{[3-(2-氯苯基)吡咯啉-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 7.60-7.67 (m, 2H), 7.47-7.55 (m, 2H), 7.26-7.45 (m, 6H), 7.12-7.25 (m, 2H), 4.77-4.82 (m, 4H), 3.83-3.97 (m, 1H), 3.47-3.64 (m, 4H), 2.19-2.36 (m, 1H), 1.98-2.18 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 430 (M+H) $^+$
148	N-(4-{[3-(1H-咪唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.36-8.38 (bs, 1H), 8.24-8.31 (m, 1H), 8.08-8.12 (m, 2H), 8.00-8.05 (bs, 1H), 7.91-7.97 (m, 2H), 7.25-7.31 (bs, 1H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 4.06 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 3.55 (q, $J=6.4$ Hz, 2H), 2.11 (p, $J=6.9$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 390 (M+H) $^+$
149	N-(4-{[2-(3-氯苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 8.64-8.66 (bs, 1H), 8.45 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.72-7.75 (m, 2H), 7.63-7.66 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 4H), 7.25-7.29 (m, 1H), 7.21-7.24 (m, 1H), 4.76-4.81 (bs, 4H), 3.47-3.51 (m, 2H), 2.86 (t, $J=7.2$ Hz, 2H)	(APCI(+)) m/e 420 (M+H) $^+$
150	N-{4-[4-(羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.75-7.78 (m, 2H), 7.62-7.65 (m, 2H), 7.32-7.40 (m, 4H), 4.81 (s, 4H), 3.48 (t, $J=6.3$ Hz, 2H), 3.28-3.32 (m, 2H), 1.49-1.65 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 354 (M+H) $^+$
151	N-{4-[3-(苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-5-(三氯甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.65 (s, 1H), 8.30 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.74-7.81 (m, 3H), 7.57-7.73 (m, 4H), 7.15-7.32 (m, 5H), 4.85-4.87 (bs, 4H), 3.27 (q, $J=6.6$ Hz, 2H), 2.63 (t, $J=7.6$ Hz, 2H), 1.83 (p, $J=7.4$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 468 (M+H) $^+$
152	N-(4-{[4-(羥基甲基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 7.90-7.92 (m, 2H), 7.68-7.74 (m, 4H), 7.38-7.41 (m, 2H), 7.33-7.36 (m, 2H), 7.29-7.32 (m, 2H), 4.78-4.84 (m, 4H), 4.47 (s, 2H)	(APCI(+)) m/e 388 (M+H) $^+$
153	N-[4-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)胺甲醯基]苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 9.95-9.97 (bs, 1H), 8.28-8.36 (m, 1H), 8.13-8.15 (m, 2H), 7.90-7.93 (m, 2H), 7.76 (d, $J=2.1$ Hz, 1H), 7.32 (dd, $J=8.3, 2.1$ Hz, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 6.82 (d, $J=8.3$ Hz, 1H), 5.86 (s, 2H), 4.84 (s, 4H)	(APCI(+)) m/e 402 (M+H) $^+$
154	N-{4-[1-(異丙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 10.21 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.03 (d, $J=0.7$ Hz, 1H), 7.85-7.89 (m, 2H), 7.70-7.74 (m, 2H), 7.57 (d, $J=0.7$ Hz, 1H), 7.30-7.40 (m, 4H), 4.80-4.81 (bs, 4H), 4.41-4.55 (m, 1H), 1.41 (d, $J=6.7$ Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 390 (M+H) $^+$
155	N-{4-[4-(羥基苯基)]	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ	(ESI(+))

	胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	ppm 9.83-9.85 (bs, 1H), 8.29-8.33 (bs, 1H), 8.16-8.18 (m, 2H), 7.91-7.93 (m, 2H), 7.86-7.89 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.17-7.19 (m, 3H), 7.10-7.12 (m, 2H), 4.84 (s, 4H)	m/e 374 (M+H) ⁺
156	N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 10.22 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.85-7.90 (m, 2H), 7.70-7.74 (m, 2H), 7.57 (s, 1H), 7.30-7.40 (m, 4H), 4.80-4.81 (bs, 4H), 4.11 (q, <i>J</i> =7.2 Hz, 2H), 1.36 (t, <i>J</i> =7.2 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 376 (M+H) ⁺
157	N-{4-[(2,5-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.97-8.99 (bs, 1H), 8.56 (d, <i>J</i> =3.0 Hz, 1H), 8.40-8.42 (bs, 1H), 8.07-8.10 (m, 2H), 7.96-7.98 (m, 2H), 7.21-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.88 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 1H), 6.69 (dd, <i>J</i> =8.8, 3.0 Hz, 1H), 4.85 (s, 4H), 3.72 (s, 3H), 3.71 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 418 (M+H) ⁺
158	N-{4-[甲基(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.51 (s, 1H), 7.60-7.64 (m, 2H), 7.11-7.44 (m, 11H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.26-3.52 (m, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.34-2.70 (m, 2H), 1.82-1.91 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 414 (M+H) ⁺
159	N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.30-8.32 (bs, 1H), 8.06-8.09 (m, 2H), 7.89-7.95 (m, 1H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.70 (d, <i>J</i> =5.9 Hz, 2H), 1.38 (s, 6H)	(ESI(-)) m/e 352 (M-H) ⁻
160	N-(4-{[4-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.31-8.33 (bs, 1H), 7.91-7.94 (m, 2H), 7.50-7.55 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 4.34-4.39 (m, 2H), 2.83 (td, <i>J</i> =12.9, 2.8 Hz, 2H), 2.24-2.43 (m, 1H), 1.73-1.77 (m, 2H), 1.50 (qd, <i>J</i> =12.5, 4.4 Hz, 2H)	(ESI(-)) m/e 416 (M-H) ⁻
161	N-[4-(硫嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.29-8.31 (bs, 1H), 7.90-7.92 (m, 2H), 7.47-7.50 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.81-3.84 (m, 4H), 2.54-2.58 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) ⁺
162	N-[4-(5,6-二氫咪唑并[1,5-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.59 (s, 1H), 7.67-7.71 (m, 2H), 7.60-7.62 (bs, 1H), 7.30-7.43 (m, 6H), 6.72-6.77 (bs, 1H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 4.73-4.75 (bs, 2H), 4.06-4.18 (m, 2H), 3.81-3.88 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 388 (M+H) ⁺
163	N-(4-{[4-(2-呋喃甲鹽基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.31-8.34 (m, 1H), 7.92-7.95 (m, 2H), 7.57-7.59 (m, 1H), 7.53-7.57 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 7.08-7.09 (m, 1H), 6.45 (dd, <i>J</i> =3.4, 1.7 Hz, 1H), 4.86 (s, 4H), 3.75-3.80 (m, 4H), 3.64-3.70 (m, 4H)	(ESI(-)) m/e 443 (M-H) ⁻
164	N-{4-[(1-苯甲基哌啶-4-基)胺甲鹽基]	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.77-7.80 (m, 2H), 7.65-7.67 (m,	(ESI(+)) m/e 455

	苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.49-7.56 (m, 5H), 7.37-7.43 (m, 2H), 7.32-7.36 (m, 2H), 4.82 (s, 4H), 4.31-4.32 (bs, 2H), 4.03-4.10 (m, 1H), 3.39-3.44 (m, 2H), 3.12-3.19 (m, 2H), 2.08-2.14 (m, 2H), 1.88-1.99 (m, 2H)	(M+H) ⁺
165	N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 9.91-9.93 (bs, 1H), 8.33-8.34 (bs, 1H), 8.16-8.18 (m, 2H), 7.86-7.98 (m, 4H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 6.95-6.98 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.67 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 388 (M+H) ⁺
166	N-{4-[(3-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 9.99-10.01 (m, 1H), 8.34-8.35 (bs, 1H), 8.10-8.20 (m, 2H), 7.91-7.94 (m, 2H), 7.82 (t, <i>J</i> =2.2 Hz, 1H), 7.57-7.60 (m, 1H), 7.21-7.24 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 6.75 (dd, <i>J</i> =8.2, 2.5 Hz, 1H), 4.84 (s, 4H), 3.68 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 388 (M+H) ⁺
167	N-{4-[(5-乙醯胺基-2-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 9.89-9.92 (bs, 1H), 8.93-8.97 (m, 2H), 8.38-8.39 (bs, 1H), 8.04-8.07 (m, 2H), 7.93-7.96 (m, 2H), 7.87-7.93 (m, 1H), 7.20-7.25 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 6.91 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 1H), 4.85 (s, 4H), 3.71 (d, <i>J</i> =1.1 Hz, 3H), 2.14 (d, <i>J</i> =0.9 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 445 (M+H) ⁺
168	N-(4-{[2-(3,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.25-8.28 (bs, 1H), 8.08-8.13 (m, 1H), 8.07-8.11 (m, 2H), 7.87-7.92 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 6.56-6.59 (m, 2H), 6.47-6.50 (m, 1H), 4.84 (s, 4H), 3.82-3.88 (m, 2H), 3.65 (s, 6H), 3.00 (t, <i>J</i> =7.2 Hz, 2H)	(ESI(-)) m/e 444 (M-H) ⁻
169	N-[4-({2-[3-(三氟甲基)苯基]乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 8.63-8.66 (bs, 1H), 8.45 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.70-7.73 (m, 2H), 7.62-7.65 (m, 2H), 7.53-7.61 (m, 4H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.32-7.35 (m, 2H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.50-3.56 (m, 2H), 2.96 (t, <i>J</i> =7.1 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 454 (M+H) ⁺
170	N-{4-[(2-甲基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.26-8.28 (bs, 1H), 7.96-7.99 (m, 2H), 7.86-7.88 (m, 2H), 7.18-7.24 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 6.76-6.79 (bs, 1H), 4.83 (s, 4H), 1.94 (q, <i>J</i> =7.5 Hz, 2H), 1.47 (s, 6H), 0.90 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 352 (M+H) ⁺
171	N-(4-{[2-(1H-咪唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.48-8.52 (bs, 1H), 8.32-8.34 (bs, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.09-8.12 (m, 2H), 7.90-7.93 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.90-3.96 (m, 2H), 3.13 (t, <i>J</i> =6.7 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 376 (M+H) ⁺
172	N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.28-8.30 (bs, 1H), 8.06-8.10 (m, 2H), 8.03-8.09 (m, 1H), 7.88-7.91 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.25	(ESI(-)) m/e 338 (M-H) ⁻

		(dddd, $J=12.4, 7.0, 6.3, 4.2$ Hz, 1H), 3.78 (ddd, $J=13.4, 6.1, 4.3$ Hz, 1H), 3.61 (ddd, $J=13.4, 6.9, 5.4$ Hz, 1H), 1.31 (d, $J=6.2$ Hz, 3H)	
173	N-(4-{{[(1R)-1-(3-氯苯基)乙基]胺甲磺基}苯基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 温度=90°C) δ ppm 8.32-8.37 (m, 1H), 8.28-8.32 (bs, 1H), 8.09-8.12 (m, 2H), 7.88-7.90 (m, 2H), 7.83 (s, 1H), 7.69-7.72 (m, 1H), 7.43-7.47 (m, 1H), 7.30 (t, $J=7.8$ Hz, 1H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.14-7.18 (m, 2H), 5.55 (p, $J=7.1$ Hz, 1H), 4.83 (s, 4H), 1.56 (d, $J=7.0$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 411 (M+H) ⁺
174	N-(4-{{[(2S)-1-羧基-3-甲基丁-2-基]胺甲磺基}苯基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 温度=90°C) δ ppm 8.29-8.31 (bs, 1H), 8.05-8.08 (m, 2H), 7.87-7.90 (m, 2H), 7.46-7.53 (bs, 1H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.14-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.29-4.36 (m, 1H), 3.99 (d, $J=4.8$ Hz, 2H), 2.17-2.28 (m, 1H), 1.00-1.10 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
175	N-{4-[苯甲基(2-羧基乙基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 温度=90°C) δ ppm 8.20-8.21 (bs, 1H), 7.85-7.88 (m, 2H), 7.61-7.64 (m, 2H), 7.37-7.43 (m, 2H), 7.29-7.34 (m, 2H), 7.20-7.27 (m, 3H), 7.14-7.19 (m, 2H), 4.94-4.94 (bs, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.94-3.97 (m, 2H), 3.73 (t, $J=6.0$ Hz, 2H)	(ESI(-)) m/e 414 (M-H) ⁻
176	N-{4-[(4-氯苯基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氙) δ ppm 7.97-7.99 (m, 2H), 7.91-7.93 (m, 2H), 7.80-7.83 (m, 2H), 7.72-7.77 (m, 2H), 7.38-7.41 (m, 2H), 7.33-7.36 (m, 2H), 4.81 (s, 4H)	(ESI(-)) m/e 381 (M-H) ⁻
177	N-(4-{{[2-(4-氯苯基)乙基]胺甲磺基}苯基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氙) δ ppm 8.66 (s, 1H), 8.45 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.72-7.74 (m, 2H), 7.64 (dd, $J=8.7, 2.3$ Hz, 2H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.32-7.36 (m, 4H), 7.27-7.30 (m, 2H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.45-3.50 (m, 2H), 2.84 (t, $J=7.2$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) ⁺
178	N-(4-{{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲磺基}苯基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 温度=90°C) δ ppm 8.34-8.35 (bs, 1H), 8.08-8.12 (m, 2H), 8.06-8.10 (m, 1H), 7.92-7.94 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.17-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.71 (q, $J=5.9$ Hz, 2H), 2.85-2.90 (m, 4H), 2.81-2.85 (m, 4H), 2.76 (t, $J=6.3$ Hz, 2H), 2.48 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) ⁺
179	N-(4-{{[2-(吡啶-2-基)乙基]胺甲磺基}苯基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	$^1\text{H NMR}$ (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氙) δ ppm 8.77 (dd, $J=5.8, 1.6$ Hz, 1H), 8.45 (td, $J=7.8, 1.6$ Hz, 1H), 7.92 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 7.88 (ddd, $J=7.5, 6.0, 1.3$ Hz, 1H), 7.66-7.69 (m, 2H), 7.62-7.65 (m, 2H), 7.36-7.39 (m, 2H), 7.32-7.35 (m, 2H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.68-3.72 (m, 2H), 3.25 (t, $J=6.4$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 387 (M+H) ⁺
180	N-{4-[(氯基甲基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 /氧化氙, 温度=90°C) δ ppm 7.79-7.81 (m, 2H), 7.68-7.71 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 2H), 4.82 (s, 4H), 4.28 (s, 2H)	(APCI(+)) m/e 321 (M+H) ⁺

181	N-[4-(環己基胺甲 醯基)苯基]-1,3-二 氫-2H-異吲哚-2-甲 醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.26-8.28 (bs, 1H), 8.05-8.08 (m, 2H), 7.88-7.90 (m, 2H), 7.40-7.47 (m, 1H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.13- 4.20 (m, 1H), 2.05-2.08 (m, 2H), 1.63-1.67 (m, 2H), 1.47-1.54 (m, 1H), 1.28-1.41 (m, 4H), 1.04- 1.17 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 364 (M+H) $^+$
182	N-{4-[(3-羥基苯基) 胺甲醯基]苯基}- 1,3-二氫-2H-異吲 哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 9.93-9.94 (m, 1H), 8.30-8.32 (m, 1H), 8.10- 8.14 (m, 2H), 8.01 (t, $J=2.2$ Hz, 1H), 7.87-7.92 (m, 2H), 7.48 (ddd, $J=8.0, 2.0, 0.9$ Hz, 1H), 7.25 (t, $J=8.0$ Hz, 1H), 7.19-7.25 (m, 2H), 7.13-7.18 (m, 2H), 6.90 (ddd, $J=8.0, 2.4, 1.0$ Hz, 1H), 4.83 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 374 (M+H) $^+$
183	N-{4-[丁基(甲基)胺 甲醯基]苯基}-1,3- 二氫-2H-異吲哚-2- 甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.24-8.26 (bs, 1H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.49-7.52 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.41 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 2.95 (s, 3H), 1.52 (p, $J=7.3$ Hz, 2H), 1.15-1.33 (m, 2H), 0.82 (t, $J=7.3$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 350 (M+H) $^+$
184	N-(4-{[4-(二甲基胺 基)苯基]胺甲醯基} 苯基)-1,3-二氫-2H- 異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 9.76-9.77 (bs, 1H), 8.30-8.32 (bs, 1H), 8.16-8.19 (m, 2H), 7.91-7.95 (m, 2H), 7.84-7.86 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 6.73-6.81 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 2.77 (s, 6H)	(ESI(-)) m/e 399 (M-H) $^-$
185	N-[4-(3,4-二氫異喹 啉-2(1H)-基羰基)苯 基]-1,3-二氫-2H-異 吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.29-8.30 (bs, 1H), 7.91-7.94 (m, 2H), 7.54-7.60 (m, 2H), 7.19-7.26 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 7.11-7.15 (m, 2H), 7.05-7.11 (m, 1H), 6.98-7.04 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.80-4.81 (bs, 2H), 3.75 (t, $J=5.9$ Hz, 2H), 2.78 (t, $J=6.0$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 398 (M+H) $^+$
186	N-[4-(1,3-二氫-2H- 異吲哚-2-基羰基) 苯基]-1,3-二氫-2H- 異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.34-8.36 (bs, 1H), 7.96-7.98 (m, 2H), 7.72-7.75 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 4H), 7.16-7.20 (m, 4H), 4.87-4.90 (bs, 4H), 4.88 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 384 (M+H) $^+$
187	N-[4-(2,3-二氫-1H- 吲哚-1-基羰基)苯 基]-1,3-二氫-2H-異 吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.36-8.38 (m, 1H), 7.96-8.00 (m, 1H), 7.93- 7.97 (m, 2H), 7.63-7.65 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 7.11-7.15 (m, 2H), 6.96- 7.00 (m, 1H), 4.87 (s, 4H), 3.94-3.99 (m, 2H), 2.89 (t, $J=8.3$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 384 (M+H) $^+$
188	N-[4-(苯基胺甲醯 基)苯基]-1,3-二氫- 2H-異吲哚-2-甲醯 胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 7.90-7.92 (m, 2H), 7.72-7.77 (m, 4H), 7.33-7.40 (m, 6H), 7.12 (t, $J=7.3$ Hz, 1H), 4.80-4.82 (bs, 4H)	(ESI(-)) m/e 356 (M-H) $^-$
189	N-{4-[(4-氟苯基)胺 甲醯基]苯基}-1,3- 二氫-2H-異吲哚-2-	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 10.17-10.19 (bs, 1H), 8.72-8.74 (bs, 1H), 7.89- 7.91 (m, 2H), 7.74-7.79 (m, 2H), 7.71-7.75 (m,	(ESI(+)) m/e 376 (M+H) $^+$

	甲醯胺	2H), 7.37-7.41 (m, 2H), 7.33-7.36 (m, 2H), 7.18-7.22 (m, 2H), 4.80-4.81 (bs, 4H)	
190	N-(4-{[2-(二乙基胺基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.78-7.81 (m, 2H), 7.67-7.70 (m, 2H), 7.37-7.41 (m, 2H), 7.32-7.36 (m, 2H), 4.82 (s, 4H), 3.66 (t, <i>J</i> =6.4 Hz, 2H), 3.29-3.33 (m, 2H), 3.24 (q, <i>J</i> =7.5 Hz, 4H), 1.24-1.33 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 381 (M+H) ⁺
191	N-{4-[2-羥基-2-苯基乙基](甲基)胺甲醯基}苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.21 (d, <i>J</i> =1.6 Hz, 1H), 7.85-7.88 (m, 2H), 7.56-7.59 (m, 2H), 7.51-7.54 (m, 2H), 7.29-7.35 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 3H), 7.14-7.19 (m, 2H), 5.29-5.35 (m, 1H), 4.84 (s, 4H), 3.11 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 416 (M+H) ⁺
192	N-{4-[(2-胺基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 7.91-7.93 (m, 2H), 7.69-7.72 (m, 2H), 7.38-7.43 (m, 2H), 7.33-7.36 (m, 2H), 7.15-7.18 (m, 1H), 7.01 (ddd, <i>J</i> =8.0, 7.3, 1.5 Hz, 1H), 6.82 (dd, <i>J</i> =8.0, 1.4 Hz, 1H), 6.66 (td, <i>J</i> =7.5, 1.5 Hz, 1H), 4.81 (s, 4H)	(ESI(-)) m/e 371 (M-H) ⁻
193	N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.28-8.30 (bs, 1H), 8.05-8.10 (m, 2H), 8.04-8.09 (m, 1H), 7.88-7.91 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.25 (dq, <i>J</i> =6.9, 6.2, 4.2 Hz, 1H), 3.78 (ddd, <i>J</i> =13.4, 6.1, 4.2 Hz, 1H), 3.61 (ddd, <i>J</i> =13.4, 6.9, 5.4 Hz, 1H), 1.31 (d, <i>J</i> =6.2 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 340 (M+H) ⁺
194	N-(4-{[(2S)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.80-7.83 (m, 2H), 7.65-7.68 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 2H), 4.82 (s, 4H), 4.50 (dd, <i>J</i> =9.1, 5.0 Hz, 1H), 1.60-1.77 (m, 3H), 0.94 (dd, <i>J</i> =11.0, 6.1 Hz, 6H)	(ESI(-)) m/e 393 (M-H) ⁻
195	(1-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}吡啶-4-基)胺基甲酸第三丁酯	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 1.49-1.51 (m, 9H), 1.51-1.61 (m, 1H), 1.88-2.00 (m, 1H), 2.98-3.11 (m, 2H), 3.75-3.90 (m, 1H), 4.21 (d, <i>J</i> =13.4 Hz, 1H), 4.85 (s, 4H), 6.59 (d, <i>J</i> =6.1 Hz, 1H), 7.10-7.25 (m, 5H), 7.45-7.55 (m, 4H), 7.89 (d, <i>J</i> =8.5 Hz, 2H), 8.26 (s, 1H), 8.64 (s, 1H)	(ESI(+)) m/e 465 (M+H) ⁺
196	N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.75-7.78 (m, 2H), 7.63-7.66 (m, 2H), 7.26-7.42 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.82-3.86 (m, 4H), 3.37 (t, <i>J</i> =6.6 Hz, 2H), 3.20-3.26 (m, 4H), 3.12-3.18 (m, 2H), 1.89-2.03 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺
197	N-[4-({4-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.57-8.59 (m, 1H), 8.55-8.57 (bs, 1H), 8.23 (d, <i>J</i> =2.2 Hz, 1H), 7.65-7.69 (m, 2H), 7.37-7.41 (m, 2H), 7.29-7.38 (m, 4H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 3.59-3.84 (m, 4H), 3.45-3.58 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 530 (M+H) ⁺
198	N-(4-{[4-(環己基甲基)哌啶-1-基]羰基}	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.31-8.33 (bs, 1H), 7.91-7.95 (m, 2H),	(ESI(-)) m/e 445

	苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 7.50-7.57 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.63-3.74 (m, 4H), 2.40-2.43 (m, 4H), 2.16 (d, <i>J</i> =7.0 Hz, 2H), 1.75-1.81 (m, 2H), 1.56-1.70 (m, 3H), 1.43-1.56 (m, 1H), 1.09-1.29 (m, 3H), 0.82-0.97 (m, 2H)	(M-H) ⁻
199	N-(4-{[1-(3-氯苯基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 10.28 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.85-7.89 (m, 2H), 7.70-7.74 (m, 2H), 7.63 (s, 1H), 7.28-7.42 (m, 7H), 7.18-7.23 (m, 1H), 5.33-5.34 (bs, 2H), 4.79-4.81 (bs, 4H)	(ESI(-)) m/e 470 (M-H) ⁻
200	N-(4-{[3-(二乙基胺甲醯基)哌啶-1-基]羧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.27-8.29 (bs, 1H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.52-7.56 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 4.17-4.21 (m, 1H), 3.19-3.43 (m, 5H), 2.94 (ddd, <i>J</i> =13.0, 12.1, 3.3 Hz, 0H), 2.84 (tt, <i>J</i> =10.6, 4.1 Hz, 1H), 1.89-2.07 (m, 2H), 1.58-1.66 (m, 1H), 1.43-1.58 (m, 1H), 1.04 (t, <i>J</i> =7.1 Hz, 6H)	(ESI(-)) m/e 447 (M-H) ⁻
201	N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.45-8.51 (m, 1H), 8.32-8.36 (bs, 1H), 8.16-8.18 (m, 2H), 7.93-7.96 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.61 (q, <i>J</i> =6.1 Hz, 2H), 3.00-3.05 (m, 2H), 2.88-2.91 (m, 4H), 2.08-2.16 (m, 2H), 1.66-1.76 (m, 4H), 1.32-1.41 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) ⁺
202	N-(4-{[4-(2-羥基乙基)哌嗪-1-基]羧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.53 (s, 1H), 7.62-7.66 (m, 2H), 7.24-7.43 (m, 6H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 4.39-4.44 (m, 1H), 3.39-3.58 (m, 6H), 2.34-2.45 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 395 (M+H) ⁺
203	N-{4-[(2-羥基-6-甲基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 9.59-9.61 (bs, 1H), 8.38-8.40 (bs, 1H), 8.22-8.25 (m, 2H), 7.95-7.98 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 7.08 (d, <i>J</i> =7.1 Hz, 1H), 7.06 (d, <i>J</i> =2.0 Hz, 1H), 6.82 (dd, <i>J</i> =7.0, 1.8 Hz, 1H), 4.85 (s, 4H), 2.43 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 388 (M+H) ⁺
204	N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.76-7.79 (m, 2H), 7.64-7.67 (m, 2H), 7.37-7.42 (m, 2H), 7.32-7.36 (m, 2H), 4.82 (s, 4H), 3.32-3.37 (m, 2H), 3.10-3.15 (m, 2H), 2.81 (s, 6H), 1.68-1.79 (m, 2H), 1.59-1.67 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 381 (M+H) ⁺
205	N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.75-7.77 (m, 2H), 7.63-7.65 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 2H), 4.82 (s, 4H), 3.53 (t, <i>J</i> =6.3 Hz, 2H), 3.36 (t, <i>J</i> =6.9 Hz, 2H), 1.74 (p, <i>J</i> =6.6 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 340 (M+H) ⁺
206	N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羧基]苯基}-1,3-二氫-2H-異	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.31-8.33 (bs, 1H), 7.91-7.94 (m, 2H), 7.52-7.56 (m, 2H), 7.20-7.25 (m, 2H), 7.15-7.20	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) ⁺

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-胺甲鹽基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

Na-{4-[(5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-基羰基)胺基]苯甲鹽基}-L-苯基丙胺鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

	吡啶-2-甲酰胺	(m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.72-3.80 (m, 4H), 2.62-2.65 (m, 4H), 2.36-2.44 (m, 1H), 1.80-1.84 (m, 2H), 1.67-1.72 (m, 2H), 1.48-1.54 (m, 1H), 1.01-1.28 (m, 5H)	
207	N-[4-(5,6-二氫[1,2,4]三唑并[4,3-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.61 (s, 1H), 8.51 (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.68-7.70 (m, 1H), 7.41-7.47 (m, 2H), 7.35-7.40 (m, 2H), 7.29-7.35 (m, 2H), 4.86 (s, 2H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 4.15 (t, <i>J</i> =5.3 Hz, 2H), 3.83-3.95 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 389 (M+H) ⁺
208	N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.49-8.53 (bs, 1H), 7.60-7.67 (m, 2H), 7.26-7.40 (m, 6H), 4.78 (s, 4H), 3.16-3.49 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 1.13-1.79 (m, 3H), 0.48-1.12 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
209	N-[4-(丙基胺甲羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.75-7.78 (m, 2H), 7.62-7.65 (m, 2H), 7.32-7.40 (m, 4H), 4.82 (s, 4H), 3.22-3.30 (m, 2H), 1.53-1.63 (m, 2H), 0.93 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 324 (M+H) ⁺
210	N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.28-8.29 (bs, 1H), 8.06-8.08 (m, 2H), 7.87-7.90 (m, 2H), 7.57-7.61 (m, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.37-4.47 (m, 1H), 3.91-3.99 (m, 2H), 1.84-1.96 (m, 1H), 1.71-1.85 (m, 1H), 1.03 (t, <i>J</i> =7.5 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 354 (M+H) ⁺
211	N-{4-[(5-氟吡啶-2-基)胺甲羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 10.45-10.47 (bs, 1H), 8.58 (dd, <i>J</i> =9.1, 4.2 Hz, 1H), 8.42-8.44 (bs, 1H), 8.24 (d, <i>J</i> =3.0 Hz, 1H), 8.18-8.20 (m, 2H), 7.98-8.00 (m, 2H), 7.45 (ddd, <i>J</i> =9.0, 8.1, 3.1 Hz, 1H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 4.86 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 377 (M+H) ⁺
212	N-{4-[(環丙基甲基)(丙基)胺甲羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.23-8.24 (bs, 1H), 7.90-7.92 (m, 2H), 7.48-7.52 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.49-3.53 (m, 2H), 3.35 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 2H), 1.58-1.66 (m, 2H), 0.96-1.07 (m, 1H), 0.81 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H), 0.42-0.47 (m, 2H), 0.15-0.19 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 378 (M+H) ⁺
213	N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.28-8.34 (m, 1H), 8.05-8.08 (m, 2H), 7.88-7.90 (m, 2H), 7.54-7.63 (m, 1H), 7.18-7.24 (m, 2H), 7.15-7.18 (m, 2H), 4.83 (s, 4H), 4.54-4.64 (m, 1H), 3.53 (dd, <i>J</i> =9.5, 5.2 Hz, 1H), 3.45 (dd, <i>J</i> =9.5, 5.5 Hz, 1H), 3.27 (s, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> =6.8 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 354 (M+H) ⁺
214	N-[4-(1,3,4,9-四氫-2H-β-咔啉-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 11.10-11.13 (bs, 1H), 8.29-8.30 (bs, 1H), 7.91-7.94 (m, 2H), 7.57-7.61 (m, 2H), 7.57-7.60 (m, 1H), 7.45-7.48 (m, 1H), 7.16-7.25 (m, 6H), 4.96-4.97 (bs, 2H), 4.87 (s, 4H), 3.86-3.92 (m,	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) ⁺

	胺	2H), 2.85 (t, $J=5.7$ Hz, 2H)	
215	N-[4-(第三丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.24-8.26 (bs, 1H), 7.96-7.99 (m, 2H), 7.85-7.88 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 6.93-6.96 (bs, 1H), 4.83 (s, 4H), 1.52 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 338 (M+H) ⁺
216	N-[4-({4-[4-(三氟甲基)苯基]哌嗪-1-基}羧基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 7.64-7.67 (m, 2H), 7.53-7.55 (m, 2H), 7.36-7.42 (m, 4H), 7.31-7.36 (m, 2H), 7.09-7.11 (m, 2H), 4.79-4.80 (bs, 4H), 3.55-3.76 (m, 4H), 3.26-3.43 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 495 (M+H) ⁺
217	N-{4-[(3-甲基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.28-8.29 (bs, 1H), 8.06-8.09 (m, 2H), 7.88-7.92 (m, 2H), 7.30-7.35 (bs, 1H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.14-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.22-4.32 (m, 1H), 1.82-1.91 (m, 1H), 1.19 (d, $J=6.8$ Hz, 3H), 0.97 (d, $J=6.7$ Hz, 3H), 0.93 (d, $J=6.7$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 352 (M+H) ⁺
218	N-{4-[(3,3-二氟吡咯啶-1-基)羧基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.34-8.36 (bs, 1H), 7.91-7.94 (m, 2H), 7.61-7.65 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.96-4.04 (m, 2H), 3.76 (t, $J=7.4$ Hz, 2H), 2.21-2.35 (m, 2H)	(ESI(-)) m/e 370 (M-H) ⁻
219	N-{4-[(2-甲基哌啶-1-基)羧基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.26-8.28 (bs, 1H), 7.90-7.92 (m, 2H), 7.47-7.51 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 4.62-4.67 (m, 1H), 4.02-4.17 (m, 1H), 2.93 (td, $J=12.9, 3.1$ Hz, 1H), 1.30-1.65 (m, 6H), 1.14 (d, $J=6.9$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 364 (M+H) ⁺
220	N-(4-[(3S)-1-苯甲基吡咯啶-3-基]胺甲醯基)苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.26-8.31 (bs, 1H), 8.20-8.26 (m, 1H), 8.09-8.12 (m, 2H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.41-7.48 (m, 2H), 7.23-7.33 (m, 3H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 4.90-5.00 (m, 1H), 4.84 (s, 4H), 3.91 (s, 2H), 3.09-3.17 (m, 3H), 2.68-2.75 (m, 1H), 2.30-2.43 (m, 1H), 2.02 (dtd, $J=13.1, 7.8, 5.2$ Hz, 1H)	(ESI(-)) m/e 439 (M-H) ⁻
221	N-{4-[(4-羥基哌啶-1-基)羧基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.26-8.28 (bs, 1H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.52-7.56 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.99-4.12 (m, 3H), 3.35 (ddd, $J=13.2, 9.1, 3.8$ Hz, 2H), 1.82-1.98 (m, 2H), 1.59-1.75 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
222	N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.22-8.24 (bs, 1H), 7.88-7.92 (m, 2H), 7.54-7.57 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.75 (t, $J=5.8$ Hz, 4H), 3.57 (t, $J=5.8$ Hz, 4H), 3.23 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 398 (M+H) ⁺
223	N-{4-[(3-氟苯基)胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ	(ESI(+))

	甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	ppm 10.17-10.23 (m, 1H), 8.35-8.36 (bs, 1H), 8.12-8.14 (m, 2H), 8.04 (dt, $J=11.5, 2.3$ Hz, 1H), 7.90-7.93 (m, 2H), 7.66 (ddd, $J=8.1, 2.0, 1.0$ Hz, 1H), 7.20-7.31 (m, 3H), 7.15-7.19 (m, 2H), 6.83 (tdd, $J=8.4, 2.6, 0.9$ Hz, 1H), 4.84 (s, 4H)	m/e 376 (M+H) ⁺
224	N-[4-(環戊基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 7.76-7.78 (m, 2H), 7.60-7.68 (m, 2H), 7.37-7.42 (m, 2H), 7.32-7.35 (m, 2H), 4.76-4.82 (m, 4H), 4.17-4.25 (m, 1H), 1.86-1.93 (m, 2H), 1.66-1.71 (m, 2H), 1.50-1.59 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 350 (M+H) ⁺
225	N-{4-[(4-胺甲醯基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.62-7.64 (m, 2H), 7.30-7.40 (m, 6H), 4.81 (s, 4H), 4.01-4.09 (m, 2H), 2.96-3.04 (m, 2H), 2.42-2.50 (m, 1H), 1.76-1.82 (m, 2H), 1.51-1.62 (m, 2H)	(ESI(-)) m/e 393 (M-H) ⁻
226	N-[4-(環丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 7.73-7.76 (m, 2H), 7.60-7.67 (m, 2H), 7.36-7.40 (m, 2H), 7.32-7.36 (m, 2H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 2.79-2.84 (m, 1H), 0.67-0.75 (m, 2H), 0.53-0.60 (m, 2H)	(ESI(-)) m/e 320 (M-H) ⁻
227	N-[4-(甲基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.56 (s, 1H), 8.19-8.26 (m, 1H), 7.73-7.77 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.30-7.39 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 2.76 (d, $J=4.5$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 296 (M+H) ⁺
228	N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.77-7.80 (m, 2H), 7.65-7.68 (m, 2H), 7.37-7.44 (m, 2H), 7.32-7.36 (m, 2H), 4.82 (s, 4H), 3.39 (t, $J=6.7$ Hz, 2H), 3.09-3.19 (m, 2H), 2.83 (s, 6H), 1.89-2.03 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) ⁺
229	N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.24-8.26 (bs, 1H), 7.89-7.91 (m, 2H), 7.52-7.56 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 4.09-4.20 (m, 1H), 3.72-3.78 (m, 1H), 3.59-3.71 (m, 2H), 3.46-3.52 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 1.74-1.86 (m, 1H), 1.62-1.72 (m, 2H), 1.39-1.50 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 380 (M+H) ⁺
230	N-[4-(戊-2-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.26-8.28 (bs, 1H), 8.07-8.10 (m, 2H), 7.88-7.91 (m, 2H), 7.44 (d, $J=7.0$ Hz, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.14-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.35-4.45 (m, 1H), 1.58-1.67 (m, 1H), 1.34-1.56 (m, 3H), 1.24 (d, $J=6.6$ Hz, 3H), 0.88 (t, $J=7.2$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 352 (M+H) ⁺
231	N-[4-(戊-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.27-8.29 (bs, 1H), 8.08-8.11 (m, 2H), 7.89-7.91 (m, 2H), 7.31-7.37 (m, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.14-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.15-4.24 (m, 1H), 1.42-1.72 (m, 4H), 0.96 (t, $J=7.4$ Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 352 (M+H) ⁺

232	N-[4-(環丁基胺甲 醯基)苯基]-1,3-二 氫-2H-異吲哚-2-甲 醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.25-8.27 (m, 1H), 8.06-8.10 (m, 2H), 7.92- 8.00 (m, 1H), 7.88-7.90 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.14-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.71-4.80 (m, 1H), 2.27-2.46 (m, 2H), 1.99-2.17 (m, 2H), 1.53-1.74 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 336 (M+H) $^+$
233	N-{4-[(1,3-二氧戊 環-2-基甲基)(甲基) 胺甲醯基]苯基}- 1,3-二氫-2H-異吲 哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬, 溫度 =90°C) δ ppm 7.61-7.64 (m, 2H), 7.31-7.45 (m, 6H), 5.04 (t, $J=4.3$ Hz, 1H), 4.81 (s, 4H), 3.88- 3.94 (m, 2H), 3.82-3.86 (m, 2H), 3.54 (d, $J=4.3$ Hz, 2H), 3.04 (s, 3H)	(ESI(-)) m/e 280 (M-H) $^-$
234	N-(4-{[1-(4-氟苯 基)-1H-吡唑-4-基] 胺甲醯基}苯基)- 1,3-二氫-2H-異吲 哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 10.45 (s, 1H), 8.65-8.68 (m, 2H), 7.82-7.94 (m, 5H), 7.74- 7.78 (m, 2H), 7.31-7.40 (m, 6H), 4.80-4.82 (bs, 4H)	(ESI(+)) m/e 442 (M+H) $^+$
235	N-{4-[(1-羥基-2-甲 基丙-2-基)胺甲醯 基]苯基}-1,3-二氫- 2H-異吲哚-2-甲醯 胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.23-8.34 (m, 1H), 7.95-7.97 (m, 2H), 7.84- 7.88 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.18 (m, 2H), 4.83 (s, 4H), 3.91 (s, 2H), 1.59 (s, 6H)	(ESI(-)) m/e 352 (M-H) $^-$
236	N-{4-[(1-苯基-1H- 吡唑-4-基)胺甲醯 基]苯基}-1,3-二氫- 2H-異吲哚-2-甲醯 胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 10.45 (s, 1H), 8.67 (s, 2H), 7.90-7.95 (m, 3H), 7.80-7.84 (m, 2H), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.47-7.53 (m, 2H), 7.27-7.40 (m, 5H), 4.80-4.82 (bs, 4H)	(ESI(+)) m/e 424 (M+H) $^+$
237	N-[4-({2-[4-(三氟甲 基)苯基]乙基}胺甲 醯基)苯基]-1,3-二 氫-2H-異吲哚-2-甲 醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 7.72-7.74 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 4H), 7.48-7.50 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 2H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.52 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 2.95 (t, $J=7.2$ Hz, 2H)	(ESI(-)) m/e 452 (M-H) $^-$
238	N-{4-[(2-甲氧基乙 基)(丙基)胺甲醯基] 苯基}-1,3-二氫-2H- 異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.24-8.26 (bs, 1H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.49-7.53 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.65 (t, $J=5.7$ Hz, 2H), 3.56 (t, $J=5.7$ Hz, 2H), 3.46 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 3.24 (s, 3H), 1.53-1.67 (m, 2H), 0.78 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(-)) m/e 380 (M-H) $^-$
239	N-[4-(第二丁基胺 甲醯基)苯基]-1,3- 二氫-2H-異吲哚-2- 甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.26-8.28 (bs, 1H), 8.06-8.10 (m, 2H), 7.88-7.91 (m, 2H), 7.42-7.46 (m, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.21- 4.36 (m, 1H), 1.42-1.75 (m, 2H), 1.23 (d, $J=6.6$ Hz, 3H), 0.93 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 338 (M+H) $^+$
240	N-(4-{[3-(三氟甲 基)吡啶-1-基]羧基} 苯基)-1,3-二氫-2H-	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬) δ ppm 8.61-8.63 (bs, 1H), 7.63-7.65 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 4H), 4.78-4.79 (bs, 4H),	(ESI(-)) m/e 416 (M-H) $^-$

	異吲哚-2-甲醯胺	3.94-4.64 (m, 2H), 2.97-3.12 (m, 2H), 1.97-2.02 (m, 1H), 1.64-1.83 (m, 1H), 1.55-1.66 (m, 1H), 1.42-1.55 (m, 1H)	
241	N-{4-[雙(2-乙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.20-8.22 (bs, 1H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.57-7.60 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 3.77 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 4H), 3.62-3.65 (m, 4H), 3.42 (q, <i>J</i> =7.0 Hz, 4H), 1.11 (t, <i>J</i> =7.0 Hz, 6H)	(ESI(-)) m/e 424 (M-H) ⁻
242	N-{4-[丁基(乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.23-8.25 (bs, 1H), 7.89-7.93 (m, 2H), 7.48-7.51 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.35-3.47 (m, 4H), 1.56 (p, <i>J</i> =7.3 Hz, 2H), 1.19-1.32 (m, 2H), 1.10 (t, <i>J</i> =7.1 Hz, 3H), 0.83 (t, <i>J</i> =7.3 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
243	N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.28-8.32 (m, 1H), 8.05-8.08 (m, 2H), 7.88-7.90 (m, 2H), 7.56-7.60 (m, 1H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.54-4.64 (m, 1H), 3.53 (dd, <i>J</i> =9.6, 5.2 Hz, 1H), 3.45 (dd, <i>J</i> =9.5, 5.5 Hz, 1H), 3.27 (s, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 354 (M+H) ⁺
244	N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.23-8.28 (bs, 1H), 7.88-7.91 (m, 2H), 7.51-7.56 (m, 2H), 7.19-7.25 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.63 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 2H), 3.53 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 2H), 3.23 (s, 3H), 3.04 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 354 (M+H) ⁺
245	N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.29-8.31 (bs, 1H), 8.04-8.09 (ni, 2H), 7.97-8.04 (m, 1H), 7.88-7.90 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 4.80-4.87 (m, 1H), 4.80-4.87 (m, 4H), 4.02 (dd, <i>J</i> =9.0, 6.1 Hz, 1H), 3.85-3.93 (m, 2H), 3.72 (td, <i>J</i> =8.2, 6.1 Hz, 1H), 2.21 (tdd, <i>J</i> =7.9, 12.7, 6.4 Hz, 1H), 1.93-2.02 (m, 1H)	(ESI(-)) m/e 350 (M-H) ⁻
246	N-[4-(嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.62-7.65 (m, 2H), 7.31-7.41 (m, 6H), 4.81 (s, 4H), 3.63-3.65 (m, 4H), 3.50-3.58 (m, 4H)	(ESI(-)) m/e 350 (M-H) ⁻
247	N-{4-[異丁基(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.24-8.26 (bs, 1H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.48-7.52 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.30 (d, <i>J</i> =7.3 Hz, 2H), 2.94 (s, 3H), 1.91-2.07 (m, 1H), 0.83 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 352 (M+H) ⁺
248	N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.66-7.69 (m, 2H), 7.39-7.43 (m, 2H), 7.36-7.40 (m, 2H), 7.32-7.36 (m, 2H), 4.82 (s, 4H), 3.79-3.83 (m, 2H), 3.71-3.90 (m, 4H),	(ESI(+)) m/e 439 (M+H) ⁺

	咪-2-甲醯胺	3.58-3.63 (m, 2H), 3.53-3.58 (m, 2H), 3.32-3.35 (m, 2H), 3.22 (s, 4H)	
249	N-{4-[(3-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲咪-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.25-8.27 (bs, 1H), 7.90-7.92 (m, 2H), 7.51-7.55 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 4.09-4.19 (m, 2H), 2.88 (ddd, <i>J</i> =13.1, 11.1, 3.2 Hz, 1H), 2.57 (dd, <i>J</i> =12.9, 10.1 Hz, 1H), 1.63-1.69 (m, 1H), 1.47-1.61 (m, 2H), 1.34-1.45 (m, 1H), 1.03 (dddd, <i>J</i> =13.0, 11.3, 10.6, 4.4 Hz, 1H), 0.75 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 364 (M+H) ⁺
250	N-(4-胺甲醯基苯基)-1,3-二氫-2H-異吲咪-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.56 (s, 1H), 7.76-7.83 (m, 2H), 7.73-7.85 (bs, 1H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.30-7.39 (m, 4H), 7.09-7.19 (bs, 1H), 4.79 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 282 (M+H) ⁺
251	N-(4-{[(2S)-2-(三氟甲基)吡咯啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲咪-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.34-8.36 (bs, 1H), 7.91-7.93 (m, 2H), 7.65-7.68 (m, 2H), 7.20-7.25 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 5.25-5.34 (m, 1H), 4.85 (s, 4H), 3.50-3.56 (m, 2H), 1.95-2.02 (m, 2H), 1.80-1.89 (m, 1H), 1.58-1.70 (m, 1H)	(ESI(-)) m/e 402 (M-H) ⁻
252	N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲咪-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.29-8.30 (bs, 1H), 8.06-8.11 (m, 2H), 7.88-7.90 (m, 2H), 7.62 (d, <i>J</i> =8.0 Hz, 1H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.14-7.18 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.58-4.67 (m, 1H), 3.95 (d, <i>J</i> =4.9 Hz, 3H), 1.82-1.93 (m, 1H), 1.73 (ddd, <i>J</i> =14.0, 8.6, 5.5 Hz, 1H), 1.68 (ddd, <i>J</i> =13.7, 8.2, 5.5 Hz, 1H), 0.99 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) ⁺
253	N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲咪-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.29-8.30 (bs, 1H), 8.15-8.18 (m, 1H), 8.08-8.11 (m, 2H), 7.87-7.90 (m, 2H), 7.61-7.64 (m, 2H), 7.27-7.33 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 3H), 7.15-7.19 (m, 2H), 5.68-5.73 (m, 1H), 4.83 (s, 4H), 4.23 (d, <i>J</i> =5.6 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 402 (M+H) ⁺
254	N-{4-[(2-甲基吡咯啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲咪-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.26-8.28 (bs, 1H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.60-7.65 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 4.26-4.36 (m, 1H), 3.47 (t, <i>J</i> =6.8 Hz, 2H), 1.92 (dq, <i>J</i> =12.2, 7.1 Hz, 1H), 1.67-1.78 (m, 1H), 1.52-1.63 (m, 1H), 1.41 (dtd, <i>J</i> =12.2, 6.9, 5.2 Hz, 1H), 1.22 (d, <i>J</i> =6.2 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 350 (M+H) ⁺
255	N-{4-[乙基(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲咪-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.24-8.26 (bs, 1H), 7.89-7.91 (m, 2H), 7.49-7.53 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.62-3.66 (m, 2H), 3.53-3.58 (m, 2H), 3.50 (q, <i>J</i> =7.1 Hz, 2H), 3.24 (s, 3H), 1.11 (t, <i>J</i> =7.1 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) ⁺
256	N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.29-8.30 (bs, 1H), 8.05-8.08 (m, 2H),	(ESI(+)) m/e 368

	醯基}苯基)-1,3-二 氫-2H-異吲哚-2-甲 醯胺	7.87-7.90 (m, 2H), 7.46-7.53 (m, 1H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.29-4.36 (m, 1H), 3.99 (d, $J=4.8$ Hz, 2H), 2.19-2.28 (m, 1H), 1.08 (d, $J=2.3$ Hz, 3H), 1.06 (d, $J=2.4$ Hz, 3H)	(M+H) ⁺
257	N-{4-[(2,6-二甲基 嗎啉-4-基)羰基]苯 基}-1,3-二氫-2H-異 吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.33-8.40 (m, 1H), 7.92-7.96 (m, 2H), 7.54-7.58 (m, 2H), 7.19-7.25 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 4.14-4.22 (m, 1H), 3.93-4.01 (m, 1H), 3.70 (dd, $J=13.0, 3.4$ Hz, 1H), 3.51-3.61 (m, 1H), 3.32 (dd, $J=13.0, 6.3$ Hz, 1H), 2.64 (dd, $J=13.1, 10.5$ Hz, 1H), 1.02-1.15 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 380 (M+H) ⁺
258	N-(4-{[(2R)-1-羥基 丁-2-基]胺甲醯基} 苯基)-1,3-二氫-2H- 異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.25-8.31 (m, 1H), 8.05-8.08 (m, 2H), 7.87-7.90 (m, 2H), 7.58 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 4H), 4.36-4.47 (m, 1H), 3.95 (d, $J=4.9$ Hz, 2H), 1.85-1.96 (m, 1H), 1.72-1.84 (m, 1H), 1.02 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 354 (M+H) ⁺
259	N-{4-[(2,5-二甲基 吡咯啉-1-基)羰基] 苯基}-1,3-二氫-2H- 異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.23-8.25 (bs, 1H), 7.90-7.92 (m, 2H), 7.53-7.62 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 4.11-4.39 (m, 2H), 1.78-2.11 (m, 2H), 1.35-1.59 (m, 2H), 0.95-1.27 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 364 (M+H) ⁺
260	N-[4-(丙-2-炔-1-基 胺甲醯基)苯基]- 1,3-二氫-2H-異吲 哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 3.10 (t, $J=2.38$ Hz, 1H), 4.03 (dd, $J=5.55, 2.78$ Hz, 2H), 4.79 (s, 4H), 7.28-7.42 (m, 4H), 7.64-7.82 (m, 4H), 8.60 (s, 1H), 8.73 (t, $J=5.55$ Hz, 1H)	(ESI(+)) m/e 320 (M+H) ⁺
261	N-{4-[異丙基(2-甲 氧基乙基)胺甲醯 基]苯基}-1,3-二氫- 2H-異吲哚-2-甲醯 胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.26-8.28 (bs, 1H), 7.90-7.93 (m, 2H), 7.48-7.50 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.18 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 4.18-4.32 (m, 1H), 3.56-3.68 (m, 4H), 3.26 (s, 3H), 1.13 (d, $J=6.7$ Hz, 6H)	(ESI(-)) m/e 380 (M-H) ⁻
262	N-{4-[異丙基(丙基) 胺甲醯基]苯基}- 1,3-二氫-2H-異吲 哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.24-8.26 (bs, 1H), 7.90-7.92 (m, 2H), 7.46-7.48 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.18 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 4.20-4.32 (m, 1H), 3.25-3.30 (m, 2H), 1.59-1.77 (m, 2H), 1.12-1.17 (m, 6H), 0.82 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
263	N-{4-[(2-氧基乙 基)(環丙基)胺甲醯 基]苯基}-1,3-二氫- 2H-異吲哚-2-甲醯 胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.27-8.29 (bs, 1H), 7.90-7.93 (m, 2H), 7.65-7.68 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.81 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 2.90-2.96 (m, 1H), 2.83 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 0.54-0.61 (m, 2H), 0.45-0.52 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 375 (M+H) ⁺
264	N-{4-[乙基(異丙基)	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ	(ESI(+))

	胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	ppm 8.23-8.25 (bs, 1H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.45-7.48 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.18 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 4.27 (p, $J=6.7$ Hz, 1H), 3.36 (q, $J=7.0$ Hz, 2H), 1.18 (t, $J=6.9$ Hz, 3H), 1.11 (d, $J=6.7$ Hz, 6H)	m/e 352 (M+H) ⁺
265	N-{4-[(3-氟吡咯啉-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 7.63-7.66 (m, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.33-7.36 (m, 2H), 7.31-7.35 (m, 2H), 5.21-5.48 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 3.53-3.79 (m, 4H), 1.98-2.25 (m, 2H)	(APCI(+)) m/e 354 (M+H) ⁺
266	N-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲鹽基}-N-異丙基- β -丙胺酸	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 7.59-7.62 (m, 2H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 2H), 7.24-7.27 (m, 2H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 1.00-1.27 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) ⁺
267	N-{4-[甲基(丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 0.82 (t, $J=7.32$ Hz, 3 H), 1.49-1.62 (m, 2 H), 2.92 (s, 3 H), 3.27-3.34 (m, 2 H), 4.78 (s, 4 H), 7.23-7.37 (m, 6 H), 7.58-7.63 (m, 2 H), 8.26 (s, 1H)	(ESI(+)) m/e 338 (M+H) ⁺
268	5,6-二甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.54 (s, 1H), 8.29 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.75-7.78 (m, 2H), 7.61-7.68 (m, 2H), 7.15-7.32 (m, 5H), 6.95 (s, 2H), 4.69-4.70 (bs, 4H), 3.32 (s, 6H), 3.21-3.30 (m, 2H), 2.59-2.68 (m, 2H), 1.76-1.90 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 460 (M+H) ⁺
269	N-(4-{[3-(4-氯苯氧基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 8.36 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.64-7.68 (m, 2H), 7.29-7.39 (m, 6H), 6.94-6.98 (m, 2H), 4.79 (s, 4H), 4.03 (t, $J=6.1$ Hz, 2H), 3.37-3.44 (m, 2H), 1.97 (p, $J=6.5$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 450 (M+H) ⁺
270	N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬) δ ppm 7.89-7.93 (m, 2H), 7.85-7.89 (m, 2H), 7.72-7.75 (m, 2H), 7.33-7.41 (m, 6H), 4.80-4.82 (bs, 4H)	(ESI(+)) m/e 442 (M+H) ⁺
271	N-{4-[(4-苯基-1,3-噻唑-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 8.06-8.09 (m, 2H), 7.94-7.97 (m, 2H), 7.75-7.78 (m, 2H), 7.55 (s, 1H), 7.44-7.49 (m, 2H), 7.37-7.41 (m, 2H), 7.32-7.37 (m, 3H), 4.84 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 441 (M+H) ⁺
284	5-溴-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.25 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.62-7.67 (m, 2H), 7.59-7.62 (m, 1H), 7.50 (dd, $J=8.1, 1.9$ Hz, 1H), 7.34 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 4.70-4.82 (m, 4H), 3.15-3.26 (m, 2H), 1.45-1.61 (m, 2H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 402 (M+H) ⁺
373	5-氟-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.25 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.62-7.66 (m, 2H), 7.39 (dd, $J=8.4, 5.2$ Hz, 1H),	(ESI(+)) m/e 342 (M+H) ⁺

	甲醯胺	7.24 (dd, $J=9.1, 2.3$ Hz, 1H), 7.10-7.19 (m, 1H), 4.74-4.78 (m, 4H), 3.16-3.21 (m, 2H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	
412	N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 3.27 (s, 3 H), 3.35-3.49 (m, 4 H), 4.79 (s, 4 H), 7.25-7.40 (m, 4 H), 7.62-7.69 (m, 2 H), 7.74-7.81 (m, 2 H), 8.31 (t, $J=5.09$ Hz, 1 H), 8.57 (s, 1 H)	(ESI(+)) m/e 340 (M+H) $^+$
413	N-{4-[(5-氯吡啶-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 8.37 (d, $J=2.7$ Hz, 1H), 8.16 (d, $J=8.9$ Hz, 1H), 7.94-7.97 (m, 2H), 7.89 (dd, $J=8.8, 2.6$ Hz, 1H), 7.69-7.72 (m, 2H), 7.35-7.38 (m, 2H), 7.30-7.33 (m, 2H), 4.81 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 393 (M+H) $^+$
414	N-{4-[(3-羥基-4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.85-7.88 (m, 2H), 7.66-7.69 (m, 2H), 7.34-7.39 (m, 2H), 7.30-7.34 (m, 2H), 7.28-7.30 (m, 1H), 7.09 (dd, $J=8.6, 2.5$ Hz, 1H), 6.88 (d, $J=8.6$ Hz, 1H), 4.81 (s, 4H), 3.77 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 404 (M+H) $^+$
415	N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.77-7.79 (m, 2H), 7.61-7.64 (m, 2H), 7.33-7.38 (m, 2H), 7.28-7.34 (m, 2H), 7.14 (d, $J=8.2$ Hz, 1H), 6.55 (d, $J=2.4$ Hz, 1H), 6.48 (dd, $J=8.2, 2.4$ Hz, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.38-4.40 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.75 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 432 (M+H) $^+$
416	N-(4-{[4-(2-側氧基吡咯啶-1-基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.78-7.80 (m, 2H), 7.62-7.68 (m, 2H), 7.54-7.56 (m, 2H), 7.29-7.38 (m, 6H), 4.79 (s, 4H), 4.45-4.47 (m, 2H), 3.82 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 2.45-2.50 (m, 2H), 2.04-2.13 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 455 (M+H) $^+$
417	N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基-2,3-二氫-1H-茛-1-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 2.67-2.83 (m, 1 H), 3.18 (dd, $J=15.47, 7.14$ Hz, 1 H), 4.34-4.49 (m, 1 H), 4.79 (s, 4 H), 5.25-5.34 (m, 2 H), 7.06-7.24 (m, 4 H), 7.30-7.42 (m, 4 H), 7.69 (d, $J=8.73$ Hz, 2 H), 7.87 (d, $J=9.12$ Hz, 2 H), 8.50-8.62 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 414 (M+H) $^+$
418	N-(4-{[(1-羥基環丙基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 0.55 (s, 4 H), 3.42 (d, $J=5.55$ Hz, 2 H), 4.79 (s, 4 H), 5.41 (s, 1 H), 7.28-7.41 (m, 4 H), 7.64-7.70 (m, 2 H), 7.75-7.84 (m, 2 H), 8.20 (t, $J=5.75$ Hz, 1 H), 8.58 (s, 1 H)	(ESI(-)) m/e 350 (M+H) $^-$
419	N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.57 (s, 1H), 8.29 (t, $J=5.8$ Hz, 1H), 7.76-7.80 (m, 2H), 7.64-7.68 (m, 2H), 7.30-7.39 (m, 4H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.84-3.90 (m, 1H), 3.32-3.47 (m, 2H), 3.21-3.30 (m, 2H), 1.75-1.81 (m, 1H), 1.58-1.65 (m, 1H), 1.33-1.54 (m, 3H), 1.06-1.28 (m, 1H)	(ESI(-)) m/e 378 (M+H) $^-$
420	N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.57 (s, 1H), 8.27 (t, $J=5.8$ Hz, 1H), 7.74-7.79 (m, 2H), 7.64-7.68 (m, 2H), 7.30-7.39 (m, 4H), 4.78-4.79	(ESI(+)) m/e 380 (M+H) $^+$

	氫-2H-異吲哚-2-甲 醯胺	(bs, 4H), 3.68-3.80 (m, 2H), 3.26-3.36 (m, 1H), 3.06-3.18 (m, 3H), 1.74-1.82 (m, 2H), 1.38-1.68 (m, 2H), 1.15-1.30 (m, 1H)	
421	N-{4-[(四氫-2H-哌 喃-4-基甲基)胺甲 醯基]苯基}-1,3-二 氫-2H-異吲哚-2-甲 醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.56 (s, 1H), 8.28 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.64-7.68 (m, 2H), 7.25-7.43 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.81-3.88 (m, 2H), 3.21-3.31 (m, 2H), 3.14 (t, <i>J</i> =6.3 Hz, 2H), 1.71-1.86 (m, 1H), 1.56-1.63 (m, 2H), 1.07-1.30 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 380 (M+H) ⁺
425	N-{4-[(4-苯甲醯基 哌嗪-1-基)羰基]苯 基}-1,3-二氫-2H-異 吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.55 (s, 1H), 7.64-7.68 (m, 2H), 7.40-7.50 (m, 5H), 7.29- 7.40 (m, 6H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.33-3.86 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 455 (M+H) ⁺
434	N-(4-{[4-(四氫呋 喃-3-基甲基)哌嗪- 1-基]羰基}苯基)- 1,3-二氫-2H-異吲 哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.54 (s, 1H), 7.62-7.66 (m, 2H), 7.28-7.39 (m, 6H), 4.78- 4.79 (bs, 4H), 3.88-3.95 (m, 1H), 3.68-3.77 (m, 1H), 3.55-3.64 (m, 1H), 3.39-3.56 (m, 4H), 2.46- 2.56 (m, 2H), 2.35-2.47 (m, 4H), 1.85-1.99 (m, 1H), 1.66-1.86 (m, 2H), 1.39-1.54 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) ⁺
435	5-氟-N-[4-({[(2S)- 四氫呋喃-2-基甲 基]胺基}羰基)苯 基]-1,3-二氫-2H-異 吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.33 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.76-7.80 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.39 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.2 Hz, 1H), 7.24 (dd, <i>J</i> =9.1, 2.4 Hz, 1H), 7.15 (td, <i>J</i> =8.9, 2.5 Hz, 1H), 4.74-4.79 (m, 4H), 3.92-4.03 (m, 1H), 3.74-3.82 (m, 1H), 3.58-3.66 (m, 1H), 3.24-3.34 (m, 2H), 1.76-1.96 (m, 3H), 1.52-1.69 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 384 (M+H) ⁺
436	5-氟-N-[4-({[(2R)- 四氫呋喃-2-基甲 基]胺基}羰基)苯 基]-1,3-二氫-2H-異 吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.33 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.76-7.80 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.39 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.2 Hz, 1H), 7.24 (dd, <i>J</i> =9.1, 2.5 Hz, 1H), 7.15 (td, <i>J</i> =8.9, 2.5 Hz, 1H), 4.74-4.79 (m, 4H), 3.96 (p, <i>J</i> =6.3 Hz, 1H), 3.74-3.82 (m, 1H), 3.58-3.66 (m, 1H), 3.22- 3.34 (m, 2H), 1.74-1.96 (m, 3H), 1.53-1.64 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 384 (M+H) ⁺
438	N-(4-{[4-(2-甲氧基 乙基)哌嗪-1-基]羰 基}苯基)-1,3-二氫- 2H-異吲哚-2-甲醯 胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.53 (s, 1H), 7.62-7.66 (m, 2H), 7.24-7.43 (m, 6H), 4.78 (s, 4H), 3.44 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 6H), 3.23 (s, 3H), 2.43 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺
439	N-(4-{[(2S)-2-(2-羥 基乙基)哌啶-1-基] 羰基}苯基)-1,3-二 氫-2H-異吲哚-2-甲 醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.51 (s, 1H), 7.61-7.65 (m, 2H), 7.25-7.39 (m, 6H), 4.78- 4.79 (bs, 4H), 4.36 (t, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 3.46-4.87 (m, 2H), 3.31-3.43 (m, 2H), 2.78-3.10 (m, 1H), 1.80-1.97 (m, 1H), 1.52-1.76 (m, 6H), 1.26-1.47 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 394 (M+H) ⁺
449	N-[4-({[(1S)-2-羥 基-1-吡啶-2-基乙 基]胺基}羰基)苯 基]-1,3-二氫-2H-異	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.61 (s, 1H), 8.53 (ddd, <i>J</i> =4.8, 1.8, 0.9 Hz, 1H), 8.46 (d, <i>J</i> =7.8 Hz, 1H), 7.84-7.88 (m, 2H), 7.75 (td, <i>J</i> =7.7, 1.8 Hz, 1H), 7.67-7.73 (m, 2H), 7.29-7.44 (m, 5H), 7.26 (ddd, <i>J</i> =7.4, 4.9, 1.1 Hz, 1H),	(ESI(-)) m/e 401 (M-H) ⁻

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-(4,5,6,7-四氫-1H-吡啶-5-基胺甲鹽基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

	吡啶-2-甲酰胺	5.10-5.17 (m, 1H), 4.88-4.93 (m, 1H), 4.80 (s, 3H), 3.73-3.88 (m, 2H)	
562	N-[4-(異丁氧基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 11.42 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 7.67 (s, 4H), 7.41-7.28 (m, 4H), 4.79 (bs, 4H), 3.65 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 2H), 2.02-1.85 (m, 1H), 0.94 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 354 (M+H) ⁺
567	5-氟-N-{4-[(四氫-2H-吡喃-2-基甲基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.59 (s, 1H), 8.29 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.81-7.74 (m, 2H), 7.68-7.61 (m, 2H), 7.40 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.2 Hz, 1H), 7.24 (dd, <i>J</i> =9.1, 2.5 Hz, 1H), 7.15 (td, <i>J</i> =8.9, 2.5 Hz, 1H), 4.80-4.73 (m, 3H), 4.05-3.99 (m, 1H), 3.87 (dd, <i>J</i> =11.3, 3.0 Hz, 1H), 3.24 (dd, <i>J</i> =8.8, 4.0 Hz, 2H), 1.80-1.74 (m, 1H), 1.66-1.56 (m, 1H), 1.57-1.33 (m, 3H), 1.28-1.04 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 398 (M+H) ⁺
568	5-氟-N-{4-[(四氫-2H-吡喃-3-基甲基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.59 (s, 1H), 8.28 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 7.76 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 2H), 7.65 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 2H), 7.58-7.32 (m, 1H), 7.31-7.06 (m, 2H), 4.76 (d, <i>J</i> =8.0 Hz, 4H), 3.85-3.62 (m, 2H), 3.23-2.96 (m, 3H), 1.91-1.69 (m, 2H), 1.68-1.35 (m, 2H), 1.35-1.11 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 398 (M+H) ⁺
569	5-氟-N-{4-[(四氫-2H-吡喃-4-基甲基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.58 (s, 1H), 8.28 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.80-7.73 (m, 2H), 7.68-7.61 (m, 2H), 7.39 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.2 Hz, 1H), 7.24 (dd, <i>J</i> =9.1, 2.5 Hz, 1H), 7.14 (td, <i>J</i> =8.9, 2.5 Hz, 1H), 4.80-4.72 (m, 4H), 3.89-3.79 (m, 2H), 3.28-3.20 (m, 1H), 3.14 (t, <i>J</i> =6.3 Hz, 2H), 1.88-1.69 (m, 1H), 1.64-1.54 (m, 2H), 1.28-1.10 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 398 (M+H) ⁺
570	5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =8.0 Hz, 1H), 7.88-7.80 (m, 2H), 7.71-7.64 (m, 2H), 7.44-7.36 (m, 3H), 7.36-7.27 (m, 2H), 7.28-7.09 (m, 3H), 5.12-5.01 (m, 1H), 4.90 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 4.81-4.73 (m, 4H), 3.78-3.59 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) ⁺
571	5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.62 (s, 1H), 8.53 (ddd, <i>J</i> =4.8, 1.8, 0.9 Hz, 1H), 8.46 (d, <i>J</i> =7.8 Hz, 1H), 7.90-7.82 (m, 2H), 7.78-7.71 (m, 1H), 7.69 (t, <i>J</i> =5.5 Hz, 2H), 7.44-7.36 (m, 2H), 7.30-7.09 (m, 3H), 5.19-5.08 (m, 1H), 4.90 (t, <i>J</i> =5.9 Hz, 1H), 4.87-4.72 (m, 4H), 3.89-3.72 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
572	5-氟-N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.59 (s, 1H), 7.84-7.75 (m, 3H), 7.68-7.61 (m, 2H), 7.40 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.2 Hz, 1H), 7.24 (dd, <i>J</i> =9.1, 2.5 Hz, 1H), 7.15 (td, <i>J</i> =8.9, 2.5 Hz, 1H), 4.80-4.73 (m, 4H), 4.65 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 4.10-3.97 (m, 1H), 3.49-3.35 (m, 1H), 1.74-1.54 (m, 1H), 1.52-1.31 (m, 2H), 0.88 (t, <i>J</i> =6.8 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 400 (M+H) ⁺
585	N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-(甲基硫基)丁-2-基]胺甲酰基}苯基)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.58 (s, 1H), 7.90 (d, <i>J</i> =8.3 Hz, 1H), 7.79 (m, 2H), 7.67 (m, 2H), 7.40-7.29 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.73	(ESI(+)) m/e 400 (M+H) ⁺

	基)-1,3-二氫-2H-異 吲哚-2-甲醯胺	(m, 1H), 4.03 (m, 1H), 3.47 (m, 1H), 3.58 (m, 1H), 2.60-2.40 (m, 2H), 2.04 (s, 3H), 1.90 (m, 1H), 1.74 (m, 1H)	
586	N-(4-{[(2S,3S)-1-羥 基-3-甲基戊-2-基] 胺甲醯基}苯基)- 1,3-二氫-2H-異吲 哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 7.80 (m, 3H), 7.66 (m, 2H), 7.34 (m, 4H), 4.79 (bs, 4H), 4.52 (t, <i>J</i> =5.5 Hz, 1H), 3.84 (m, 1H), 3.53 (m, 2H), 1.69 (m, 1H), 1.49 (m, 1H), 1.10 (m, 1H), 0.91-0.81 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) ⁺
587	N-(4-{[(2S)-1-羥基 丙-2-基]胺甲醯基} 苯基)-1,3-二氫-2H- 異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 7.89 (d, <i>J</i> =8.0 Hz, 1H), 7.78 (m, 2H), 7.66 (m, 2H), 7.40-7.29 (m, 4H), 4.79 (bs, 4H), 4.70 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.46 (dt, <i>J</i> =10.8, 3.33 (m, 1H), 5.4 Hz, 1H), 1.13 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 340 (M+H) ⁺
588	N-(4-{[(2S,3R)-1,3- 二羥基丁-2-基]胺 甲醯基}苯基)-1,3- 二氫-2H-異吲哚-2- 甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.57 (bs, 1H), 7.78 (m, 3H), 7.67 (m, 2H), 7.40-7.29 (m, 4H), 4.79 (bs, 4H), 4.67 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 4.52 (m, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.63 (m, 2H), 1.08 (d, <i>J</i> =6.12 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 370 (M+H) ⁺
589	N-(4-{[(2S)-1-羥基 己-2-基]胺甲醯基} 苯基)-1,3-二氫-2H- 異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 7.80 (m, 3H), 7.66 (m, 2H), 7.40-7.29 (m, 4H), 4.79 (bs, 4H), 4.65 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 3.93 (m, 1H), 3.44 (dt, <i>J</i> =10.8, 5.4 Hz, 1H), 3.32 (m, 1H), 1.63 (m, 1H), 1.44 (m, 1H), 1.28 (m, 4H), 0.86 (t, <i>J</i> =6.3 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) ⁺
590	N-(4-{[(2S)-1-羥基 戊-2-基]胺甲醯基} 苯基)-1,3-二氫-2H- 異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 7.80 (m, 3H), 7.66 (m, 2H), 7.40-7.29 (m, 4H), 4.79 (bs, 4H), 4.64 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 3.95 (m, 1H), 3.44 (dt, <i>J</i> =10.8, 5.4 Hz, 1H), 3.32 (m, 1H), 1.58 (m, 1H), 1.50-1.22 (m, 3H), 0.88 (t, <i>J</i> =7.3 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) ⁺
591	N-(4-{[(1S,2S)-2-羥 基環戊基]胺甲醯 基}苯基)-1,3-二氫- 2H-異吲哚-2-甲醯 胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 8.03 (m, 1H), 7.78 (m, 2H), 7.66 (m, 2H), 7.40-7.29 (m, 4H), 4.81 (bs, 4H), 4.75 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 4.98 (m, 2H), 1.99 (m, 1H), 1.86 (m, 1H), 1.65 (m, 2H), 1.47 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
592	N-(4-{[(1S,2R)-2-羥 基環戊基]胺甲醯 基}苯基)-1,3-二氫- 2H-異吲哚-2-甲醯 胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 7.80 (m, 2H), 7.65 (m, 3H), 7.40-7.28 (m, 4H), 4.79 (bs, 4H), 4.71 (d, <i>J</i> =3.6 Hz, 1H), 4.04 (m, 2H), 1.88-1.44 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
593	N-(4-{[(2S)-1-環己 基-3-羥基丙-2-基] 胺甲醯基}苯基)- 1,3-二氫-2H-異吲 哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 7.81 (m, 3H), 7.67 (m, 2H), 7.43-7.26 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.64 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 4.06 (m, 1H), 3.42 (m, 1H), 3.30 (m, 1H), 1.80 (d, <i>J</i> =12.6 Hz, 1H), 1.62 (m, 4H), 1.43 (m, 2H), 1.32 (m, 1H), 1.14 (m, 3H), 0.95 (m, 1H), 0.83 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 422 (M+H) ⁺

594	N-[4-({(2R)-1-羥基-3-[(4-甲基苯基)硫基]丙-2-基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.59 (s, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> =8.2 Hz, 1H), 7.79 (m, 2H), 7.68 (m, 2H), 7.40-7.28 (m, 4H), 7.20 (m, 2H), 7.10 (m, 2H), 4.80 (m, 5H), 4.13 (m, 1H), 3.71 (s, 2H), 3.55 (m, 1H), 3.44 (m, 1H), 2.70 (dd, <i>J</i> =13.3, 5.7 Hz, 1H), 2.55 (m, 1H), 2.27 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 476 (M+H) ⁺
595	N-(4-{{(1S)-1-(4-第三丁基苯基)-2-羥基乙基}胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.45 (d, <i>J</i> =8.0 Hz, 1H), 7.83 (m, 2H), 7.68 (m, 2H), 7.40-7.27 (m, 8H), 5.03 (m, 1H), 4.87 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 4.79 (bs, 4H), 3.67 (m, 2H), 1.26 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 458 (M+H) ⁺
597	5-甲氧基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.53 (s, 1H), 8.24 (m, 1H), 7.80-7.72 (m, 2H), 7.67-7.61 (m, 2H), 7.26 (d, <i>J</i> =8.3 Hz, 1H), 6.98-6.91 (m, 1H), 6.88 (dd, <i>J</i> =8.3, 2.4 Hz, 1H), 4.72 (m, 4H), 3.77 (s, 3H), 3.25-3.14 (m, 2H), 1.60-1.44 (m, 2H), 0.89 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 354 (M+H) ⁺
598	5-甲基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.54 (s, 1H), 8.24 (m, 1H), 7.80-7.72 (m, 2H), 7.69-7.61 (m, 2H), 7.24 (d, <i>J</i> =7.7 Hz, 1H), 7.17 (bs, 1H), 7.16-7.09 (m, 1H), 4.73 (bs, 4H), 3.23-3.14 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.60-1.44 (m, 2H), 0.89 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 338 (M+H) ⁺
716	N-(4-{{(1-甲基吡咯啉-3-基)甲基}胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.40 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 7.81-7.73 (m, 2H), 7.71-7.63 (m, 2H), 7.41-7.28 (m, 6H), 5.83 (dd, <i>J</i> =19.3, 15.2 Hz, 1H), 4.79 (bs, 4H), 3.30-3.21 (m, 1H), 3.06-2.93 (m, 1H), 2.89-2.69 (m, 1H), 2.60 (dd, <i>J</i> =17.2, 7.4 Hz, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.04-1.85 (m, 1H), 1.58 (tt, <i>J</i> =13.9, 6.9 Hz, 1H)	(ESI(+)) m/e 379 (M+H) ⁺
719	N-(4-{{(1-甲基哌啶-4-基)甲基}胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 8.27 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.80-7.73 (m, 2H), 7.69-7.62 (m, 2H), 7.41-7.28 (m, 4H), 3.35-3.27 (m, 2H), 3.13 (t, <i>J</i> =6.2 Hz, 2H), 3.03-2.93 (m, 1H), 2.86-2.77 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 2.17 (s, 1H), 2.00-1.82 (m, 2H), 1.70-1.45 (m, 3H), 1.28-1.11 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 393 (M+H) ⁺
781	N-(4-{{(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基}胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.44 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.81-7.74 (m, 2H), 7.71-7.64 (m, 2H), 7.41-7.28 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.41-3.31 (m, 2H), 3.30 (s, 2H), 3.11-2.81 (m, 2H), 2.74-2.59 (m, 1H), 2.30-2.15 (m, 1H), 1.94-1.76 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 414 (M+H) ⁺
782	N-(4-{{(2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基)甲基}胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.38 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 8.01-7.89 (m, 1H), 7.78 (d, <i>J</i> =8.9 Hz, 2H), 7.67 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 2H), 7.44-7.24 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.20 (p, <i>J</i> =5.9 Hz, 1H), 3.98 (dd, <i>J</i> =8.3, 6.2 Hz, 1H), 3.71 (dd, <i>J</i> =8.3, 5.8 Hz, 1H), 3.50-3.20 (m, 1H), 1.35 (s, 3H), 1.26 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) ⁺

783	N-(4-{{[(1S)-2-甲氧基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.61 (d, <i>J</i> =8.2 Hz, 2H), 7.87-7.79 (m, 2H), 7.70 (s, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.46-7.20 (m, 9H), 5.27 (td, <i>J</i> =8.4, 5.4 Hz, 1H), 4.79 (s, 4H), 3.70 (dd, <i>J</i> =10.0, 8.6 Hz, 1H), 3.55 (dd, <i>J</i> =10.0, 5.5 Hz, 1H), 3.30 (d, <i>J</i> =2.9 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 416 (M+H) ⁺
784	N-[4-({[(4S)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.58 (s, 1H), 8.39 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.81-7.74 (m, 2H), 7.70-7.63 (m, 2H), 7.41-7.28 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.20 (p, <i>J</i> =5.9 Hz, 1H), 3.98 (dd, <i>J</i> =8.3, 6.2 Hz, 1H), 3.71 (dd, <i>J</i> =8.3, 5.8 Hz, 1H), 3.30 (s, 1H), 1.35 (s, 3H), 1.26 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) ⁺
785	N-[4-({[(4R)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.58 (s, 1H), 8.39 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.81-7.74 (m, 2H), 7.70-7.63 (m, 2H), 7.43-7.27 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.20 (p, <i>J</i> =5.9 Hz, 1H), 3.98 (dd, <i>J</i> =8.3, 6.2 Hz, 1H), 3.71 (dd, <i>J</i> =8.3, 5.8 Hz, 1H), 3.38 (ddd, <i>J</i> =14.9, 12.8, 5.8 Hz, 1H), 1.35 (s, 3H), 1.26 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) ⁺
786	N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.43 (t, <i>J</i> =6.1 Hz, 1H), 7.83-7.76 (m, 2H), 7.72-7.65 (m, 2H), 7.41-7.28 (m, 4H), 4.89 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.40 (d, <i>J</i> =5.9 Hz, 2H), 4.29 (d, <i>J</i> =5.8 Hz, 2H), 3.58 (d, <i>J</i> =5.6 Hz, 2H), 3.51 (d, <i>J</i> =6.0 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) ⁺
790	N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆ , 溫度=90°C) δ 7.81-7.71 (m, 2H), 7.71-7.48 (m, 2H), 7.44-7.23 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.92 (h, <i>J</i> =6.7 Hz, 1H), 1.62-1.44 (m, 2H), 1.15 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 3H), 0.88 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 338 (M+H) ⁺
802	N-(4-{{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.59 (s, 1H), 8.43 (t, <i>J</i> =6.1 Hz, 1H), 7.83-7.76 (m, 2H), 7.71-7.65 (m, 2H), 7.41-7.28 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.48 (d, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 4.20 (d, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.44 (d, <i>J</i> =6.0 Hz, 2H), 1.25 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
809	5-氟基-N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 7.79 (s, 1 H) 7.70-7.77 (m, 3 H) 7.60-7.63 (m, 1 H) 7.58-7.60 (m, 1 H) 7.56 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 1 H) 4.85 (d, <i>J</i> =8.24 Hz, 4 H) 3.21 (d, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H) 2.08-2.25 (m, 1 H) 1.43-1.76 (m, 6 H) 1.19-1.35 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 389 (M+H) ⁺
810	5-氟基-N-{4-[(1,3-噻唑-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 7.74-7.81 (m, 4 H) 7.72 (dd, <i>J</i> =7.93, 1.53 Hz, 1 H) 7.61-7.65 (m, 2 H) 7.56 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 2 H) 4.85 (d, <i>J</i> =9.77 Hz, 4 H) 4.68 (s, 2 H)	(ESI(+)) m/e 404 (M+H) ⁺
811	5-氟基-N-(4-{{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 7.75-7.81 (m, 3 H) 7.70-7.73 (m, 1 H)	(ESI(+)) m/e 441 (M+H) ⁺

	胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	7.60-7.64 (m, 2 H) 7.56 (d, $J=7.93$ Hz, 1 H) 7.37-7.43 (m, 2 H) 7.28-7.35 (m, 2 H) 7.17-7.25 (m, 1 H) 5.11-5.22 (m, 1 H) 4.85 (d, $J=8.24$ Hz, 4 H) 3.44-3.52 (m, 2 H) 1.91-2.12 (m, 2 H)	
812	5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(4-甲基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.77-7.82 (m, 3 H) 7.72 (dd, $J=7.93$, 1.53 Hz, 1 H) 7.59-7.65 (m, 2 H) 7.56 (d, $J=7.93$ Hz, 1 H) 7.27 (d, $J=8.24$ Hz, 2 H) 7.12 (d, $J=7.93$ Hz, 2 H) 5.00-5.07 (m, 1 H) 4.85 (d, $J=8.24$ Hz, 4 H) 3.67-3.78 (m, 2 H) 2.27 (s, 3 H)	(ESI(+)) m/e 441 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
813	5-氟基-N-{4-[(1,3-二羥基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.86-8.00 (m, 1 H) 7.67-7.81 (m, 4 H) 7.53-7.65 (m, 2 H) 4.85 (d, $J=7.02$ Hz, 4 H) 4.33-4.52 (m, 1 H) 3.93-4.02 (m, 1 H) 3.59-3.84 (m, 1 H) 3.58 (d, $J=5.80$ Hz, 2 H)	(ESI(+)) m/e 381 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
814	5-氟基-N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.68-7.84 (m, 4 H) 7.54-7.64 (m, 3 H) 4.85 (d, $J=8.24$ Hz, 4 H) 3.77-3.88 (m, 1 H) 3.15-3.26 (m, 2 H) 1.10 (d, $J=6.10$ Hz, 3 H)	(ESI(+)) m/e 365 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
815	5-氟基-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.69-7.81 (m, 4 H) 7.54-7.65 (m, 3 H) 4.85 (d, $J=8.24$ Hz, 4 H) 3.28 (s, 2H) 1.14 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 379 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
816	5-氟基-N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.69-7.81 (m, 4 H) 7.55-7.64 (m, 3 H) 4.85 (d, $J=8.24$ Hz, 4 H) 3.76-3.84 (m, 1 H) 3.56 (d, $J=5.19$ Hz, 2 H) 1.87-2.00 (m, 1 H) 0.92 (dd, $J=11.75$, 6.87 Hz, 6 H)	(ESI(+)) m/e 393 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
817	5-氟基-N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.69-7.81 (m, 4 H) 7.54-7.63 (m, 3 H) 4.85 (d, $J=8.24$ Hz, 4 H) 3.95-4.05 (m, 1 H) 3.75-3.84 (m, 1 H) 3.60-3.68 (m, 1 H) 3.34 (d, $J=5.80$ Hz, 2 H) 1.75-1.98 (m, 3 H) 1.54-1.66 (m, 1 H)	(ESI(+)) m/e 391 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
818	5-氟基-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.70-7.81 (m, 4 H) 7.60-7.66 (m, 2 H) 7.57 (d, $J=7.93$ Hz, 1 H) 4.85 (d, $J=8.85$ Hz, 4 H) 3.50 (t, $J=6.41$ Hz, 2 H) 3.22-3.26 (m, 4 H) 3.04 (d, $J=4.88$ Hz, 4 H) 2.90 (t, $J=6.41$ Hz, 2 H) 2.78 (s, 3 H)	(ESI(+)) m/e 433 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
819	5-氟基-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.78-7.85 (m, 3 H) 7.70-7.74 (m, 1 H) 7.60-7.66 (m, 2 H) 7.56 (d, $J=8.24$ Hz, 1 H) 7.38-7.43 (m, 2 H) 7.28-7.34 (m, 2 H) 7.19-7.26 (m, 1 H) 5.03-5.13 (m, 1 H) 4.85 (d, $J=8.24$ Hz, 4 H) 3.68-3.79 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 427 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$

820	5-氟基-N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.79 (s, 1 H) 7.70-7.76 (m, 3 H) 7.58-7.64 (m, 2 H) 7.56 (d, $J=8.24$ Hz, 1 H) 4.85 (d, $J=8.24$ Hz, 4 H) 4.44 (t, $J=6.41$ Hz, 1 H) 3.45 (t, $J=6.41$ Hz, 1 H) 3.27-3.34 (m, 2 H) 1.46-1.81 (m, 4 H)	(ESI(+)) m/e 377 (M+H) $^+$
821	5-氟基-N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.69-7.82 (m, 4 H) 7.53-7.64 (m, 3 H) 4.85 (d, $J=8.24$ Hz, 4 H) 3.79-3.87 (m, 1 H) 3.17-3.26 (m, 2 H) 1.10 (d, $J=6.10$ Hz, 3 H)	(ESI(+)) m/e 365 (M+H) $^+$
822	5-氟基-N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.79 (s, 1 H) 7.74-7.78 (m, 2 H) 7.72 (d, $J=7.93$ Hz, 1 H) 7.59-7.65 (m, 2 H) 7.54-7.58 (m, 1 H) 7.50-7.53 (m, 1 H) 7.25 (d, $J=8.54$ Hz, 1 H) 6.46 (s, 1 H) 4.85 (d, $J=8.85$ Hz, 4 H) 4.31 (s, 2 H)	(ESI(+)) m/e 387 (M+H) $^+$
823	5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.70-7.81 (m, 4 H) 7.55-7.64 (m, 3 H) 4.85 (d, $J=8.24$ Hz, 4 H) 3.95-4.04 (m, 1 H) 3.75-3.83 (m, 1 H) 3.61-3.68 (m, 1 H) 3.34 (d, $J=5.80$ Hz, 2 H) 1.75-1.98 (m, 3 H) 1.54-1.65 (m, 1 H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) $^+$
824	5-氟基-N-(4-{[4-(2-呋喃甲鹽基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.79 (s, 1 H) 7.73-7.75 (m, 1 H) 7.71 (d, $J=1.53$ Hz, 1 H) 7.60-7.65 (m, 2 H) 7.57 (d, $J=8.54$ Hz, 1 H) 7.34-7.40 (m, 2 H) 7.00 (d, $J=2.75$ Hz, 1 H) 6.59 (dd, $J=3.51, 1.68$ Hz, 1 H) 4.85 (d, $J=8.54$ Hz, 4 H) 3.71-3.77 (m, 4 H) 3.54-3.65 (m, 4 H)	(ESI(+)) m/e 470 (M+H) $^+$
825	5-氟基-N-(4-{[4-(四氫呋喃-2-基羰基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.79 (s, 1 H) 7.72 (dd, $J=7.93, 1.53$ Hz, 1 H) 7.59-7.64 (m, 2 H) 7.57 (d, $J=7.93$ Hz, 1 H) 7.33-7.37 (m, 2 H) 4.85 (d, $J=8.24$ Hz, 4 H) 4.64 (dd, $J=7.48, 5.95$ Hz, 1 H) 3.71-3.86 (m, 2 H) 3.48-3.61 (m, 8 H) 1.96-2.14 (m, 2 H) 1.75-1.94 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 474 (M+H) $^+$
826	5-氟基-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.70-7.81 (m, 4 H) 7.61-7.66 (m, 2 H) 7.57 (d, $J=7.93$ Hz, 1 H) 4.85 (d, $J=8.24$ Hz, 4 H) 3.36 (t, $J=6.71$ Hz, 4 H) 3.02-3.13 (m, 2 H) 2.90 (s, 2 H) 1.90-2.18 (m, 2 H) 1.81 (d, $J=84.53$ Hz, 6 H)	(ESI(+)) m/e 432 (M+H) $^+$
827	5-氟基-N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.70-7.81 (m, 4 H) 7.55-7.64 (m, 3 H) 4.85 (d, $J=8.54$ Hz, 4 H) 3.96-4.04 (m, 1 H) 3.76-3.85 (m, 1 H) 3.61-3.68 (m, 1 H) 3.34 (d, $J=5.80$ Hz, 2 H) 1.75-1.98 (m, 3 H) 1.54-1.67 (m, 1 H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) $^+$

828	5-氟基-N-(4-{[4-(乙基磺基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90℃) δ ppm 7.79 (s, 1 H) 7.72 (dd, J=7.93, 1.53 Hz, 1 H) 7.59-7.64 (m, 2 H) 7.57 (d, J=7.63 Hz, 1 H) 7.32-7.37 (m, 2 H) 4.85 (d, J=8.24 Hz, 4 H) 3.56-3.61 (m, 4 H) 3.27 (s, 4 H) 3.07 (q, J=7.32 Hz, 2 H) 1.24 (t, J=7.32 Hz, 3 H)	(ESI(+)) m/e 468 (M+H) ⁺
829	5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90℃) δ ppm 7.79 (s, 1 H) 7.72-7.77 (m, 2 H) 7.71 (d, J=1.22 Hz, 1 H) 7.59-7.64 (m, 2 H) 7.57 (d, J=7.93 Hz, 1 H) 4.85 (d, J=8.24 Hz, 4 H) 3.69-3.80 (m, 2 H) 3.60-3.67 (m, 1 H) 3.47 (dd, J=8.54, 5.49 Hz, 1 H) 3.28-3.30 (m, J=3.36 Hz, 2 H) 2.45-2.50 (m, 1 H) 1.90-2.01 (m, 1 H) 1.58-1.68 (m, 1 H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) ⁺
830	5-氟基-N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲磺基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90℃) δ ppm 7.81-7.83 (m, 1 H) 7.78-7.80 (m, 2 H) 7.72 (dd, J=7.93, 1.53 Hz, 1 H) 7.61-7.64 (m, 2 H) 7.57 (d, J=8.54 Hz, 1 H) 7.39 (d, J=7.63 Hz, 2 H) 7.28-7.34 (m, 2 H) 7.20-7.25 (m, 1 H) 5.05-5.11 (m, 1 H) 4.83-4.88 (m, 4 H) 3.69-3.79 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 427 (M+H) ⁺
831	5-氟基-N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲磺基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90℃) δ ppm 7.67-7.90 (m, 4 H) 7.52-7.65 (m, 3 H) 4.85 (d, J=8.24 Hz, 4 H) 3.79-3.93 (m, 1 H) 3.41-3.55 (m, 2 H) 1.41-1.85 (m, 2 H) 0.90 (t, J=7.48 Hz, 3 H)	(ESI(+)) m/e 379 (M+H) ⁺
832	5-氟基-N-{4-[(2,3-二羥基丙基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90℃) δ ppm 7.70-7.81 (m, 4 H) 7.54-7.65 (m, 3 H) 4.85 (d, J=8.24 Hz, 4 H) 3.62-3.73 (m, 1 H) 3.38-3.45 (m, 3 H) 3.29 (d, J=6.41 Hz, 1 H)	(ESI(+)) m/e 381 (M+H) ⁺
833	5-氟基-N-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90℃) δ ppm 7.69-7.84 (m, 4 H) 7.52-7.64 (m, 3 H) 4.85 (d, J=8.24 Hz, 4 H) 3.80-3.89 (m, 2 H) 3.28-3.35 (m, 2 H) 3.19 (d, J=7.02 Hz, 2 H) 1.76-1.91 (m, 1 H) 1.61 (dd, J=12.82, 1.83 Hz, 2 H) 1.17-1.32 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 405 (M+H) ⁺
834	5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲磺基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90℃) δ ppm 8.60 (d, J=4.27 Hz, 1 H) 7.96-8.04 (m, 1 H) 7.77-7.86 (m, 3 H) 7.73 (d, J=7.93 Hz, 1 H) 7.61-7.68 (m, 3 H) 7.57 (d, J=7.93 Hz, 1 H) 7.45-7.51 (m, 1 H) 5.21 (t, J=5.95 Hz, 1 H) 4.86 (d, J=8.24 Hz, 4 H) 3.89 (d, J=5.80 Hz, 2 H)	(ESI(+)) m/e 428 (M+H) ⁺
835	5-氟基-N-{4-[(1-羥基-4-甲基戊-2-基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90℃) δ ppm 7.68-7.82 (m, 4 H) 7.52-7.64 (m, 3 H) 4.85 (d, J=8.24 Hz, 4 H) 4.01-4.09 (m, 1 H) 3.38-3.52 (m, 2 H) 1.59-1.75 (m, 1 H) 1.37-1.55 (m, 2 H) 0.86-0.93 (m, 6 H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) ⁺

836	5-氟基-N-(4-[(1-甲基吡咯啉-3-基)甲基]胺甲磺基)苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲磺胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.70-7.82 (m, 4 H) 7.59-7.67 (m, 2 H) 7.57 (d, J =7.63 Hz, 1 H) 4.82-4.89 (m, 4 H) 3.41-3.82 (m, 2 H) 3.35-3.41 (m, 2 H) 2.94-3.21 (m, 2 H) 2.85 (s, 3 H) 2.60-2.75 (m, 1 H) 1.61-2.34 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 404 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
837	5-氟基-N-(4-[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲磺基)苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲磺胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.67-7.83 (m, 4 H) 7.54-7.65 (m, 3 H) 4.85 (d, J =8.24 Hz, 4 H) 3.36-3.52 (m, 2 H) 3.18-3.25 (m, 2 H) 2.92 (s, 2 H) 2.76 (s, 3 H) 1.89 (m, 3 H) 1.29-1.54 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 418 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
838	5-氟基-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基)甲基]胺甲磺基)苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲磺胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.68-7.82 (m, 4 H) 7.52-7.65 (m, 3 H) 4.85 (d, J =8.54 Hz, 4 H) 3.65-3.82 (m, 2 H) 3.29-3.40 (m, 1 H) 3.09-3.20 (m, 3 H) 1.73-1.92 (m, 2 H) 1.40-1.69 (m, 2 H) 1.20-1.35 (m, 1 H)	(ESI(+)) m/e 405 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
717	N-{4-[(吡咯啉-3-基)甲基]胺甲磺基)苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲磺胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 9.07 (bs, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.51 (t, J =5.8 Hz, 1H), 7.83-7.75 (m, 1H), 7.73-7.65 (m, 2H), 7.42-7.28 (m, 3H), 4.86 (bs, 2H), 4.79 (s, 4H), 3.75-3.64 (m, 1H), 3.53-3.43 (m, 1H), 3.40-3.16 (m, 3H), 3.10 (dt, J =13.6, 7.7 Hz, 1H), 2.98-2.83 (m, 1H), 2.07-1.92 (m, 1H), 1.84-1.46 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 340 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
840	N-[4-(2,6-二氫雜螺[3,3]庚-2-基)羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲磺胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.67-7.61 (m, 2H), 7.57-7.51 (m, 2H), 7.40-7.26 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.36 (bs, 4H), 4.20 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 363 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
841	N-[4-(2,6-二氫雜螺[3,4]辛-6-基)羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲磺胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.70-7.56 (m, 2H), 7.48-7.42 (m, 2H), 7.38-7.29 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.99 (q, J =10.6 Hz, 4H), 3.74 (s, 2H), 3.52 (t, J =7.0 Hz, 2H), 2.18 (t, J =7.1 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 377 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
842	N-[4-(2,7-二氫雜螺[3,5]壬-7-基)羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲磺胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.73-7.53 (m, 2H), 7.42-7.31 (m, 4H), 7.31-7.25 (m, 2H), 4.79 (s, 4H), 3.81 (d, J =5.0 Hz, 4H), 3.44 (dd, J =12.2, 6.6 Hz, 4H), 1.92-1.53 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 391 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
843	N-[4-(2,6-二氫雜螺[3,5]壬-2-基)羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲磺胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.67-7.61 (m, 2H), 7.58-7.54 (m, 2H), 7.39-7.29 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.07 (d, J =7.8 Hz, 2H), 3.95 (d, J =22.6 Hz, 2H), 2.99 (t, J =11.8, 6.0 Hz, 2H), 2.55 (s, 2H), 1.97-1.82 (m, 2H), 1.82-1.59 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 391 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
844	N-[4-(1,7-二氫雜螺[4,4]壬-1-基)羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲磺胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.72-7.57 (m, 2H), 7.50-7.40 (m, 2H), 7.40-7.22 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.83 (d, J =12.2 Hz, 1H), 3.75-3.63 (m, 1H), 3.57-3.42 (m, 2H), 3.17 (t, J =13.0 Hz, 1H), 2.61 (m, J =13.5, 9.0 Hz, 1H), 2.27-1.99 (m, 3H), 1.92-1.61 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 391 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$

845	N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.77-7.56 (m, 2H), 7.54-7.42 (m, 2H), 7.41-7.22 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.88 (d, <i>J</i> =12.7 Hz, 1H), 3.75-3.56 (m, 3H), 2.39-2.25 (m, 1H), 2.26-2.11 (m, 1H), 2.10-1.87 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) ⁺
846	N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.4]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.70-7.54 (m, 2H), 7.50-7.40 (m, 2H), 7.39-7.22 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.72-3.42 (m, 4H), 3.17 (t, <i>J</i> =10.1 Hz, 2H), 2.14-1.81 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) ⁺
847	N-[4-(2,8-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.70-7.55 (m, 2H), 7.52-7.40 (m, 2H), 7.38-7.16 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.57 (t, <i>J</i> =7.2 Hz, 2H), 3.41 (s, 2H), 3.15-2.98 (m, 4H), 2.53-2.50 (m, 2H), 1.82 (t, 2H), 1.76-1.60 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 405 (M+H) ⁺
848	N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.71-7.54 (m, 2H), 7.53-7.39 (m, 2H), 7.39-7.20 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.63-3.55 (m, 2H), 3.55-3.47 (m, 1H), 3.46-3.39 (m, 1H), 3.07-2.98 (m, 4H), 1.98-1.87 (m, 1H), 1.86-1.77 (m, 1H), 1.77-1.71 (m, 1H), 1.71-1.56 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 405 (M+H) ⁺
849	N-[4-(2,6-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.76-7.55 (m, 2H), 7.55-7.41 (m, 2H), 7.41-7.20 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.82 (d, <i>J</i> =12.8 Hz, 1H), 3.77-3.66 (m, 1H), 3.66-3.53 (m, 2H), 3.17-2.98 (m, 2H), 2.36-2.21 (m, 1H), 2.19-2.06 (m, 1H), 1.87-1.77 (m, 2H), 1.76-1.55 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 405 (M+H) ⁺
850	N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.76-7.55 (m, 2H), 7.45-7.32 (m, 3H), 7.34-7.19 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.66-3.49 (m, 2H), 3.47-3.36 (m, 1H), 3.27-3.12 (m, 1H), 3.10-2.90 (m, 2H), 2.00-1.83 (m, 1H), 1.84-1.62 (m, 3H), 1.62-1.46 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 405 (M+H) ⁺
851	N-[4-(3,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-3-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺		(ESI(+)) m/e XXX (M+H) ⁺
852	N-[4-(2,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.78-7.54 (m, 2H), 7.46-7.21 (m, 6H), 4.79 (s, 4H), 3.66 (d, <i>J</i> =13.3 Hz, 1H), 3.54 (d, <i>J</i> =14.2 Hz, 1H), 3.35 (dd, <i>J</i> =14.9, 8.0 Hz, 2H), 3.09-3.00 (m, 1H), 3.00-2.94 (m, 1H), 2.94-2.85 (m, 2H), 2.54-2.48 (m, 2H), 1.70 (dd, <i>J</i> =11.6, 5.7 Hz, 2H), 1.63 (dd, <i>J</i> =16.4, 6.3 Hz, 2H), 1.61-1.50 (m, 4H), 1.50-1.39 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺
853	N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.79-7.49 (m, 2H), 7.44-7.13 (m, 6H), 4.79 (s, 4H), 3.45 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 4H), 3.17-2.85 (m, 4H), 1.59 (dd, <i>J</i> =12.8, 6.9 Hz, 8H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺

	胺		
854	N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.74-7.52 (m, 2H), 7.41-7.24 (m, 6H), 4.79 (s, 4H), 3.82 (t, <i>J</i> =14.5 Hz, 1H), 3.70 (d, <i>J</i> =13.7 Hz, 1H), 3.55-3.40 (m, 2H), 3.16-2.88 (m, 2H), 2.01-1.81 (m, 2H), 1.75-1.53 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺
855	N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.73-7.51 (m, 2H), 7.45-7.15 (m, 6H), 4.79 (s, 4H), 3.77-3.59 (m, 1H), 3.62-3.36 (m, 3H), 3.29-3.20 (m, 2H), 2.12-1.95 (m, 4H), 1.91-1.66 (m, 5H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺
856	N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.78-7.72 (m, 2H), 7.66-7.61 (m, 2H), 7.39-7.28 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.15 (dd, <i>J</i> =12.2, 6.0 Hz, 1H), 3.38 (qd, <i>J</i> =13.4, 5.8 Hz, 2H), 3.20-3.00 (m, 4H), 2.53-2.50 (m, 3H), 2.18-1.96 (m, 1H), 1.94-1.56 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) ⁺
857	N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.84-7.70 (m, 2H), 7.70-7.54 (m, 2H), 7.46-7.21 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.64-4.44 (m, 1H), 4.15-3.95 (m, 1H), 3.73 (dd, <i>J</i> =9.1, 6.1 Hz, 1H), 3.19-2.97 (m, 4H), 2.21 (dd, <i>J</i> =13.1, 8.3 Hz, 1H), 1.99-1.84 (m, 3H), 1.84-1.70 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
858	N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.87-7.69 (m, 2H), 7.71-7.53 (m, 2H), 7.45-7.12 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.75 (dd, <i>J</i> =11.5, 2.6 Hz, 1H), 3.55-3.41 (m, 1H), 3.38-3.31 (m, 2H), 3.22-3.12 (m, 1H), 3.11-2.94 (m, 4H), 1.92-1.66 (m, 3H), 1.62-1.49 (m, 1H), 1.49-1.24 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 449 (M+H) ⁺
859	N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.75-7.53 (m, 2H), 7.44-7.15 (m, 6H), 4.79 (s, 4H), 3.82-3.66 (m, 2H), 3.63-3.46 (m, 4H), 3.40-3.32 (m, 1H), 3.25-3.14 (m, 1H), 2.96-2.77 (m, 2H), 2.08-1.92 (m, 1H), 1.92-1.74 (m, 1H), 1.73-1.58 (m, 1H), 1.59-1.38 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
860	N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.71-7.48 (m, 2H), 7.45-7.18 (m, 6H), 4.79 (s, 4H), 3.44 (t, <i>J</i> =6.7 Hz, 2H), 3.36 (dd, <i>J</i> =7.3, 5.1 Hz, 1H), 3.24-3.06 (m, 2H), 3.05-2.85 (m, 2H), 2.05 (t, <i>J</i> =7.0 Hz, 2H), 1.88-1.72 (m, 2H), 1.65 (dd, <i>J</i> =12.7, 1.4 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 405 (M+H) ⁺
861	N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.75-7.51 (m, 2H), 7.42-7.10 (m, 6H), 4.79 (s, 4H), 3.92-3.68 (m, 2H), 3.36 (dd, <i>J</i> =8.1, 5.4 Hz, 1H), 3.31-3.21 (m, 2H), 2.14-1.91 (m, 4H), 1.91-1.68 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 405 (M+H) ⁺
862	N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.72-7.60 (m, 2H), 7.60-7.49 (m, 2H), 7.42-7.21 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.20 (dd, <i>J</i> =29.4, 9.1 Hz, 4H), 3.42	(ESI(+)) m/e 377 (M+H) ⁺

5-氟-N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-氰基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

	吡啶-2-甲酰胺	(s, 2H), 3.27 (d, $J=3.7$ Hz, 1H), 3.24 (s, 1H), 2.24 (t, $J=7.4$ Hz, 2H)	
863	N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.72-7.52 (m, 2H), 7.43-7.10 (m, 6H), 5.54 (s, 1H), 4.79 (s, 4H), 3.99 (d, $J=11.5$ Hz, 2H), 3.68-3.49 (m, 2H), 2.95 (t, $J=7.4$ Hz, 2H), 2.53-2.51 (m, 1H), 2.41-2.25 (m, 2H), 2.07 (t, $J=31.9$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 390 (M+H) $^+$
864	N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.75-7.61 (m, 2H), 7.60-7.48 (m, 2H), 7.42-7.12 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.54-4.29 (m, 1H), 4.14-3.91 (m, 1H), 3.86-3.55 (m, 1H), 3.26-3.18 (m, 1H), 3.12-2.79 (m, 1H), 2.50 (dd, $J=9.4, 1.3$ Hz, 1H), 2.43-2.20 (m, 1H), 2.17-2.01 (m, 1H), 2.01-1.85 (m, 2H), 1.87-1.52 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) $^+$
865	N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.75-7.62 (m, 2H), 7.62-7.52 (m, 2H), 7.44-7.18 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 4.28 (d, $J=10.2$ Hz, 2H), 4.19 (s, 2H), 3.10 (t, $J=5.3$ Hz, 2H), 2.01 (t, $J=5.4$ Hz, 2H), 1.77-1.35 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) $^+$
866	N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.65-7.60 (m, 2H), 7.57-7.53 (m, 2H), 7.40-6.97 (m, 5H), 4.79 (s, 5H), 4.16 (dd, $J=23.4, 9.6$ Hz, 4H), 3.77 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 3.35 (q, $J=7.1$ Hz, 1H), 2.07 (dd, $J=8.1, 6.6$ Hz, 2H), 1.98-1.74 (m, 2H), 1.11 (t, $J=7.1$ Hz, 1H)	(ESI(+)) m/e 378 (M+H) $^+$
867	N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.65-7.60 (m, 2H), 7.58-7.54 (m, 2H), 7.38-7.28 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.95-3.67 (m, 4H), 3.59 (s, 2H), 3.55-3.44 (m, 2H), 1.90-1.72 (m, 2H), 1.61-1.39 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 392 (M+H) $^+$
868	N-[4-(六氮-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.75-7.52 (m, 2H), 7.46-7.20 (m, 6H), 4.79 (s, 4H), 4.49-4.27 (m, 1H), 3.95-3.78 (m, 1H), 3.77-3.55 (m, 4H), 3.43 (dd, $J=11.8, 5.4$ Hz, 1H), 2.98-2.70 (m, 1H), 2.06 (ddd, $J=15.0, 12.5, 7.7$ Hz, 1H), 1.82-1.49 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 378 (M+H) $^+$
869	N-[4-(四氮-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.69-7.61 (m, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.47-7.07 (m, 6H), 4.79 (s, 4H), 3.83-3.59 (m, 4H), 3.58-3.33 (m, 4H), 3.05-2.82 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 378 (M+H) $^+$
870	N-[4-(六氮呋喃并[3,4-e]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.71-7.52 (m, 2H), 7.41-7.12 (m, 6H), 4.79 (s, 4H), 3.89-3.65 (m, 2H), 3.67-3.40 (m, 5H), 3.39-3.26 (m, 1H), 2.46-2.25 (m, 2H), 1.88-1.63 (m, 1H), 1.67-1.24 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 392 (M+H) $^+$
885	N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-6-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.68-7.51 (m, 2H), 7.51-7.28 (m, 3H), 7.24-7.00 (m, 1H), 4.77 (d, $J=12.1$ Hz, 4H), 3.61 (d, $J=17.1$ Hz,	(ESI(+)) m/e 393 (M+H) $^+$

	2H-異吲哚-2-甲醯胺	2H), 3.54 (d, $J=8.2$ Hz, 3H), 3.48 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 2.06 (dd, $J=23.6, 16.6$ Hz, 2H), 1.89 (s, 1H)	
886	N-[4-(2,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.65-7.53 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.3, 5.2$ Hz, 1H), 7.31-7.22 (m, 2H), 7.17 (d, $J=9.0$ Hz, 1H), 7.15-6.92 (m, 1H), 4.77 (d, $J=12.3$ Hz, 4H), 3.41 (t, $J=5.5$ Hz, 8H), 1.78-1.63 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) $^+$
887	N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.65-7.49 (m, 2H), 7.43-7.32 (m, 3H), 7.22-7.03 (m, 2H), 4.76 (d, $J=12.6$ Hz, 4H), 3.54-3.37 (m, 2H), 2.86 (dt, $J=11.3, 7.9$ Hz, 1H), 2.70 (d, $J=11.7$ Hz, 1H), 2.10-1.96 (m, 1H), 1.90 (d, $J=29.4$ Hz, 1H), 1.84-1.67 (m, 2H), 1.25 (s, 1H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) $^+$
888	N-[4-(2,8-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.70-7.49 (m, 2H), 7.45-7.32 (m, 3H), 7.22-7.03 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.4$ Hz, 4H), 3.53 (t, $J=7.2$ Hz, 2H), 3.33 (s, 2H), 2.79 (dd, $J=20.6, 14.7$ Hz, 3H), 1.88 (s, 1H), 1.78 (t, $J=7.1$ Hz, 2H), 1.50 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) $^+$
889	N-[4-(2,6-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.70-7.54 (m, 2H), 7.50-7.30 (m, 3H), 7.24-7.00 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.5$ Hz, 4H), 3.75-3.54 (m, 1H), 3.57-3.47 (m, 2H), 3.40 (d, $J=11.8$ Hz, 1H), 3.20 (d, $J=0.5$ Hz, 1H), 2.76 (d, $J=21.5$ Hz, 2H), 2.07-1.77 (m, 3H), 1.64-1.40 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) $^+$
890	N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.69-7.54 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.4, 5.2$ Hz, 1H), 7.33-7.22 (m, 2H), 7.23-7.02 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.2$ Hz, 4H), 3.53-3.31 (m, 4H), 3.20 (s, 2H), 2.94-2.79 (m, 2H), 2.64 (dd, $J=42.4, 11.2$ Hz, 2H), 1.87 (s, 2H), 1.74-1.32 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) $^+$
891	N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.59 (dd, $J=6.4, 4.5$ Hz, 2H), 7.37 (dd, $J=8.4, 5.1$ Hz, 1H), 7.33-7.20 (m, 2H), 7.17 (d, $J=9.0$ Hz, 1H), 7.13-7.02 (m, 1H), 4.77 (d, $J=12.4$ Hz, 4H), 3.51-3.36 (m, 4H), 3.20 (s, 2H), 2.80-2.65 (m, 2H), 2.64 (s, 2H), 1.85 (s, 2H), 1.52 (s, 4H), 1.37 (t, $J=5.7$ Hz, 4H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) $^+$
892	N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.65-7.51 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.4, 5.1$ Hz, 1H), 7.34-7.24 (m, 2H), 7.23-7.05 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.5$ Hz, 4H), 3.58-3.36 (m, 4H), 3.20 (s, 2H), 2.72-2.54 (m, 2H), 1.62-1.36 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) $^+$
893	N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.65-7.51 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.3, 5.2$ Hz, 1H), 7.32-7.23 (m, 2H), 7.19-7.01 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.9$ Hz, 4H), 3.49 (d, $J=14.0$ Hz, 3H), 3.03-2.76 (m, 2H), 1.84-1.59 (m, 8H), 1.25 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) $^+$

894	5-氟-N-{4-[(1-氧杂-8-氮杂螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲酯基]苯基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.83-7.68 (m, 2H), 7.68-7.49 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.1 Hz, 1H), 7.21-6.93 (m, 2H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.2 Hz, 4H), 4.10 (t, <i>J</i> =6.0 Hz, 1H), 3.44-3.31 (m, 2H), 3.06-2.83 (m, 2H), 2.83-2.70 (m, 2H), 2.12-1.92 (m, 1H), 1.81-1.66 (m, 3H), 1.62-1.32 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 453 (M+H) ⁺
895	5-氟-N-[4-(1-氧杂-8-氮杂螺[4.5]癸-3-基胺甲酯基)苯基]-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.80-7.69 (m, 2H), 7.66-7.50 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.2, 5.1 Hz, 1H), 7.27-6.90 (m, 2H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.7 Hz, 4H), 4.61-4.39 (m, 1H), 4.02 (dd, <i>J</i> =8.9, 6.8 Hz, 1H), 3.66 (dd, <i>J</i> =8.9, 6.3 Hz, 1H), 3.01-2.81 (m, 2H), 2.80-2.61 (m, 2H), 2.15 (dd, <i>J</i> =12.9, 8.3 Hz, 1H), 1.87-1.73 (m, 1H), 1.70 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 1.65-1.49 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 439 (M+H) ⁺
896	5-氟-N-[4-(1-氧杂-4,8-二氮杂螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.69-7.54 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.3, 5.1 Hz, 1H), 7.35-7.28 (m, 2H), 7.17 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 1H), 7.14-6.96 (m, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.4 Hz, 4H), 3.77-3.57 (m, 2H), 3.57-3.36 (m, 4H), 2.71 (dd, <i>J</i> =25.6, 8.7 Hz, 1H), 2.62 (d, <i>J</i> =13.1 Hz, 3H), 1.90 (s, 1H), 1.81-1.43 (m, 3H), 1.31 (s, 1H)	(ESI(+)) m/e 439 (M+H) ⁺
897	N-[4-(1,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.61-7.51 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.3, 5.2 Hz, 1H), 7.33-7.25 (m, 2H), 7.16 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 1H), 7.10 (dd, <i>J</i> =12.4, 5.4 Hz, 1H), 4.76 (d, <i>J</i> =13.0 Hz, 4H), 3.39 (t, <i>J</i> =6.7 Hz, 2H), 3.06 (d, <i>J</i> =12.4 Hz, 2H), 3.00-2.82 (m, 2H), 2.79-2.61 (m, 2H), 1.99 (t, <i>J</i> =6.9 Hz, 2H), 1.88 (s, 1H), 1.73 (dd, <i>J</i> =13.6, 6.9 Hz, 2H), 1.44 (d, <i>J</i> =13.3 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺
898	N-[4-(1,8-二氮杂螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.71-7.51 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.2 Hz, 1H), 7.33-7.23 (m, 2H), 7.22-7.12 (m, 1H), 7.09 (dd, <i>J</i> =13.2, 4.7 Hz, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.6 Hz, 4H), 3.62-3.39 (m, 4H), 3.00-2.75 (m, 2H), 1.86-1.67 (m, 2H), 1.67-1.43 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺
899	N-[4-(2,6-二氮杂螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.68-7.49 (m, 4H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.5, 5.2 Hz, 1H), 7.23-7.04 (m, 2H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.3 Hz, 4H), 4.10 (s, 4H), 3.00 (s, 2H), 2.83 (dd, <i>J</i> =46.1, 39.1 Hz, 2H), 1.98 (t, <i>J</i> =7.1 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 395 (M+H) ⁺
900	N-[4-(1,7-二氮杂螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.70-7.53 (m, 2H), 7.48-7.23 (m, 3H), 7.23-7.03 (m, 2H), 5.45 (s, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.2 Hz, 4H), 3.98 (s, 2H), 3.56 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 2.71 (t, <i>J</i> =7.1 Hz, 2H), 2.32-2.05 (m, 4H), 1.86 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺
901	N-[4-(1,6-二氮杂螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O) δ 7.69-7.52 (m, 2H), 7.47 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.1 Hz, 1H), 7.22-7.01 (m, 2H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.9 Hz, 4H), 4.24-3.92 (m, 2H), 3.20 (s, 3H), 2.97 (t, <i>J</i> =18.2 Hz, 1H), 2.75 (t, <i>J</i> =21.1 Hz, 1H),	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺

	胺	2.29-2.11 (m, 1H), 2.10-1.96 (m, 1H), 1.62 (s, 1H), 1.49 (d, $J=11.0$ Hz, 1H)	
902	N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.69-7.50 (m, 4H), 7.37 (dd, $J=8.6, 5.2$ Hz, 1H), 7.22-7.03 (m, 2H), 4.77 (d, $J=13.2$ Hz, 4H), 3.92 (s, 4H), 2.66 (dd, $J=10.8, 5.5$ Hz, 2H), 1.70-1.59 (m, 2H), 1.51 (s, 2H), 1.40 (d, $J=4.6$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) $^+$
903	5-氟-N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.71-7.47 (m, 4H), 7.37 (dd, $J=8.4, 5.2$ Hz, 1H), 7.22-6.96 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.5$ Hz, 4H), 4.16 (dd, $J=23.5, 9.7$ Hz, 4H), 3.77 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 2.07 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 1.94-1.70 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) $^+$
904	5-氟-N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.68-7.51 (m, 2H), 7.51-7.33 (m, 1H), 7.36-7.20 (m, 2H), 7.21-6.92 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.5$ Hz, 4H), 4.24 (dd, $J=26.5, 6.0$ Hz, 4H), 3.48-3.36 (m, 2H), 1.97-1.75 (m, 2H), 1.66-1.25 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 410 (M+H) $^+$
905	5-氟-N-[4-(2-氧雜-7-氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.65-7.54 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.3, 5.2$ Hz, 1H), 7.35-7.23 (m, 2H), 7.22-7.03 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.4$ Hz, 4H), 4.35 (s, 4H), 3.47-3.36 (m, 4H), 1.87-1.75 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 410 (M+H) $^+$
906	5-氟-N-[4-(六氮-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.67-7.54 (m, 2H), 7.48-7.28 (m, 3H), 7.24-6.92 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.4$ Hz, 4H), 4.52-4.31 (m, 1H), 3.86 (dd, $J=15.5, 7.0$ Hz, 1H), 3.79-3.53 (m, 4H), 3.43 (dd, $J=11.7, 5.3$ Hz, 1H), 2.97-2.81 (m, 1H), 2.17-1.88 (m, 1H), 1.88-1.59 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) $^+$
907	5-氟-N-[4-(四氮-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.65-7.54 (m, 2H), 7.54-7.31 (m, 3H), 7.26-7.03 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.2$ Hz, 4H), 3.74 (ddd, $J=19.7, 10.5, 7.2$ Hz, 4H), 3.56-3.34 (m, 4H), 3.01-2.84 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) $^+$
908	5-氟-N-[4-(六氮呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 7.59 (d, $J=8.7$ Hz, 2H), 7.43-7.35 (m, 1H), 7.35-7.24 (m, 2H), 7.22-7.05 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.5$ Hz, 4H), 3.81-3.67 (m, 2H), 3.62-3.40 (m, 4H), 1.76 (s, 1H), 1.62-1.36 (m, 1H), 1.28-1.08 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 410 (M+H) $^+$
976	N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.59 (s, 1H), 8.49 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 7.87-7.79 (m, 2H), 7.72-7.65 (m, 2H), 7.47-7.28 (m, 6H), 7.19-7.09 (m, 2H), 5.06 (d, $J=6.7$ Hz, 1H), 4.95-4.87 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 3.77-3.57 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) $^+$
977	N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.58 (d, $J=3.8$ Hz, 1H), 8.42 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 7.86-7.76 (m, 3H), 7.69 (s, 1H), 7.69-7.61 (m, 2H), 7.41-7.27	(ESI(+)) m/e 432 (M+H) $^+$

	基)-1,3-二氫-2H-異 吡啶-2-甲醯胺	(m, 6H), 6.91-6.84 (m, 2H), 5.07-4.96 (m, 1H), 3.77-3.59 (m, 4H), 3.31 (s, 4H)	
978	N-(4-{[(1S)-1-(1,3- 苯并間二氧雜環戊 烯-5-基)-2-羥基乙 基]胺甲醯基}苯 基)-1,3-二氫-2H-異 吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.59 (s, 1H), 8.39 (d, <i>J</i> =8.1 Hz, 1H), 7.86-7.78 (m, 2H), 7.72- 7.64 (m, 2H), 7.41-7.28 (m, 4H), 6.99 (s, 1H), 6.87-6.82 (m, 2H), 5.97 (d, <i>J</i> =2.3 Hz, 2H), 5.05- 4.93 (m, 1H), 4.92-4.82 (m, 1H), 4.81 (d, <i>J</i> =14.1 Hz, 4H), 3.73-3.53 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 446 (M+H) ⁺
1089	5-氟-N-(4-{[1-(1,3- 噻唑-2-基)丙-2-基] 胺甲醯基}苯基)- 1,3-二氫-2H-異吡 啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.78-7.64 (m, 2H), 7.64-7.53 (m, 2H), 7.52-7.34 (m, 1H), 7.28-7.16 (m, 1H), 7.17-7.03 (m, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.4 Hz, 4H), 4.38 (h, <i>J</i> =6.6 Hz, 1H), 3.41-3.27 (m, 2H), 3.24-3.15 (m, 1H), 2.51 (dt, <i>J</i> =3.7, 1.9 Hz, 2H), 1.25 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 3H), 1.11 (t, <i>J</i> =7.1 Hz, 1H)	(ESI(+)) m/e 425 (M+H) ⁺
1090	N-{4-[(4,4-二氟環 己基)胺甲醯基]苯 基}-5-氟-1,3-二氫- 2H-異吡啶-2-甲醯 胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.86-7.70 (m, 2H), 7.67-7.53 (m, 2H), 7.44-7.29 (m, 1H), 7.24-7.03 (m, 2H), 4.76 (t, <i>J</i> =10.2 Hz, 4H), 4.08-3.87 (m, 1H), 2.16-1.83 (m, 5H), 1.79- 1.54 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 418 (M+H) ⁺
1091	N-(4-{[1-(3,5-二甲 基-1H-吡唑-1-基) 丙-2-基]胺甲醯基} 苯基)-5-氟-1,3-二 氫-2H-異吡啶-2-甲 醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.81-7.65 (m, 2H), 7.65-7.55 (m, 2H), 7.41-7.31 (m, 1H), 7.23-6.98 (m, 2H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.4 Hz, 4H), 4.35 (h, <i>J</i> =6.5 Hz, 1H), 4.17-4.06 (m, 1H), 4.06-3.88 (m, 1H), 3.20 (s, 1H), 2.22 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.26-1.01 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 436 (M+H) ⁺
1092	5-氟-N-(4-{[2-甲基- 2-(嗎啶-4-基)丁基] 胺甲醯基}苯基)- 1,3-二氫-2H-異吡 啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.87-7.71 (m, 2H), 7.69-7.58 (m, 2H), 7.46-7.29 (m, 1H), 7.25-7.02 (m, 2H), 4.89-4.69 (m, 4H), 3.90-3.67 (m, 4H), 3.61-3.41 (m, 2H), 3.15-2.96 (m, 2H), 1.84-1.50 (m, 2H), 1.32-1.06 (m, 3H), 1.07-0.72 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 455 (M+H) ⁺
1093	5-氟-N-(4-{[2-(2-甲 基-1,3-噻唑-4-基)乙 基]胺甲醯基}苯 基)-1,3-二氫-2H-異 吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ 8.59-8.46 (m, 2H), 7.90 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 2H), 7.68-7.58 (m, 2H), 7.10 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 4.87 (dd, <i>J</i> =16.8, 9.9 Hz, 4H), 3.86-3.64 (m, 4H), 3.64-3.40 (m, 5H), 2.86-2.58 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 425 (M+H) ⁺
1094	5-氟-N-(4-{[2-甲基- 1-(嗎啶-4-基)丙-2- 基]胺甲醯基}苯 基)-1,3-二氫-2H-異 吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.70 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 2H), 7.66-7.54 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.1 Hz, 1H), 7.21-7.05 (m, 2H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 3.65 (s, 4H), 2.80 (d, <i>J</i> =54.6 Hz, 5H), 1.41 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 425 (M+H) ⁺
1095	5-氟-N-{4-[(4-甲氧 基苯基)胺甲醯 基]苯基}-1,3-二氫- 2H-異吡啶-2-甲醯	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.89-7.70 (m, 2H), 7.70-7.52 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.3, 5.2 Hz, 1H), 7.26 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 2H), 7.20-7.04 (m, 2H), 6.93-6.76 (m, 2H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 4.41 (s, 2H), 3.74 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) ⁺

	胺		
1096	5-氟-N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.83-7.70 (m, 2H), 7.69-7.55 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.1 Hz, 1H), 7.27-7.03 (m, 2H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.4 Hz, 4H), 3.86 (s, 4H), 3.36 (dd, <i>J</i> =17.9, 11.2 Hz, 3H), 3.22-3.09 (m, 3H), 2.09-1.81 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 427 (M+H) ⁺
1097	N-α-(4-{[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲鹽基)-D-苯基丙胺鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.76-7.64 (m, 2H), 7.64-7.52 (m, 2H), 7.44-7.31 (m, 1H), 7.31-7.21 (m, 4H), 7.21-7.04 (m, 3H), 4.82-4.73 (m, 4H), 4.73-4.62 (m, 1H), 3.23-3.12 (m, 2H), 3.07-2.93 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 447 (M+H) ⁺
1098	N-(4-{[2-(乙鹽基胺基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.96-7.78 (m, 2H), 7.77-7.64 (m, 3H), 7.51-7.42 (m, 1H), 7.42-7.31 (m, 1H), 7.28-7.15 (m, 3H), 7.15-7.03 (m, 1H), 4.86-4.70 (m, 4H), 2.09 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) ⁺
1099	5-氟-N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.71-7.57 (m, 2H), 7.50-7.33 (m, 3H), 7.25-7.01 (m, 2H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 3.65-3.47 (m, 4H), 3.35 (dd, <i>J</i> =12.2, 7.3 Hz, 6H), 2.52 (dt, <i>J</i> =3.8, 1.9 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 457 (M+H) ⁺
1100	5-氟-N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啶-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.76-7.67 (m, 3H), 7.66-7.53 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.2 Hz, 1H), 7.25-7.02 (m, 2H), 6.78 (d, <i>J</i> =3.3 Hz, 1H), 6.55 (dd, <i>J</i> =3.3, 1.9 Hz, 1H), 4.89-4.68 (m, 6H), 4.08-3.94 (m, 1H), 3.87 (dd, <i>J</i> =14.0, 7.4 Hz, 1H), 3.43 (s, 1H), 2.00-1.78 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 463 (M+H) ⁺
1101	N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.58 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.3, 5.1 Hz, 1H), 7.31-7.22 (m, 2H), 7.17 (d, <i>J</i> =8.9 Hz, 1H), 7.13-7.03 (m, 1H), 4.76 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 3.60-3.41 (m, 8H), 3.24 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 416 (M+H) ⁺
1102	N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.87-7.71 (m, 2H), 7.64 (t, <i>J</i> =10.2 Hz, 2H), 7.46-7.31 (m, 1H), 7.23-7.03 (m, 2H), 4.78 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 4.40 (dd, <i>J</i> =8.6, 5.6 Hz, 1H), 1.90-1.62 (m, 2H), 1.45-1.18 (m, 4H), 0.87 (t, <i>J</i> =6.9 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 413 (M+H) ⁺
1103	N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.72 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 2H), 7.60 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 2H), 7.43-7.28 (m, 1H), 7.21-7.04 (m, 2H), 6.91-6.81 (m, 2H), 6.81-6.69 (m, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 3.73 (d, <i>J</i> =2.5 Hz, 6H), 3.58-3.39 (m, 2H), 2.93-2.68 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 464 (M+H) ⁺
1104	N-(4-{[(2S)-3,3-二	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ	(ESI(+)) m/e 427

	甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.88-7.70 (m, 2H), 7.70-7.57 (m, 2H), 7.45-7.30 (m, 1H), 7.26-7.01 (m, 2H), 4.78 (d, J =12.6 Hz, 4H), 4.41 (d, J =6.3 Hz, 1H), 2.64 (s, 3H), 1.03 (s, 9H)	(M+H) $^+$
1105	N- α -(4-[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲鹽基)-L-苯基丙胺鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.76-7.64 (m, 2H), 7.64-7.54 (m, 2H), 7.44-7.33 (m, 1H), 7.32-7.22 (m, 4H), 7.25-7.13 (m, 3H), 7.12-6.99 (m, 1H), 4.81-4.71 (m, 4H), 4.71-4.61 (m, 1H), 3.20-3.11 (m, 1H), 3.08-2.93 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 447 (M+H) $^+$
1106	N-(4-[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.87-7.72 (m, 2H), 7.70-7.52 (m, 2H), 7.45-7.26 (m, 1H), 7.24-7.03 (m, 2H), 4.78 (d, J =12.6 Hz, 4H), 4.57-4.38 (m, 1H), 1.90-1.47 (m, 3H), 1.07-0.71 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 413 (M+H) $^+$
1107	N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基}苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.76-7.57 (m, 2H), 7.51-7.32 (m, 3H), 7.23-7.03 (m, 2H), 4.77 (d, J =12.4 Hz, 4H), 3.88 (d, J =76.9 Hz, 4H), 3.22-3.10 (m, 2H), 2.08 (d, J =11.3 Hz, 2H), 1.86 (d, J =13.1 Hz, 2H), 1.64 (d, J =12.9 Hz, 1H), 1.54-1.17 (m, 6H), 1.17-1.04 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 451 (M+H) $^+$
1108	5-氟-N-(4-{[3-(甲基胺甲鹽基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.16 (t, J =1.8 Hz, 1H), 7.98-7.80 (m, 3H), 7.74-7.59 (m, 2H), 7.59-7.47 (m, 1H), 7.49-7.33 (m, 2H), 7.24-7.05 (m, 2H), 4.79 (d, J =12.5 Hz, 4H), 2.83 (d, J =3.6 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) $^+$
1109	N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲鹽基}苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.90-7.72 (m, 2H), 7.64 (d, J =8.7 Hz, 2H), 7.50 (d, J =7.5 Hz, 2H), 7.43-7.26 (m, 4H), 7.20-7.02 (m, 2H), 5.62 (s, 1H), 4.77 (d, J =12.5 Hz, 4H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) $^+$
1110	N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲鹽基}苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.79-7.66 (m, 2H), 7.66-7.53 (m, 2H), 7.37 (dd, J =8.4, 5.1 Hz, 1H), 7.27-7.02 (m, 2H), 4.77 (d, J =12.4 Hz, 4H), 3.44-3.35 (m, 2H), 3.31 (dd, J =16.4, 9.5 Hz, 2H), 1.73 (p, J =6.6 Hz, 2H), 1.15 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 414 (M+H) $^+$
1111	N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.86-7.72 (m, 2H), 7.69-7.55 (m, 2H), 7.47-7.32 (m, 1H), 7.24-6.96 (m, 2H), 4.78 (d, J =12.5 Hz, 4H), 3.92-3.76 (m, 2H), 3.67 (t, J =6.2 Hz, 2H), 3.52 (d, J =12.0 Hz, 2H), 3.31 (dd, J =13.3, 7.0 Hz, 3H), 2.71 (t, J =11.7 Hz, 2H), 1.17 (d, J =6.3 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 441 (M+H) $^+$
1112	N-(4-[(1R)-2-胺基-	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ	(ESI(+))

	2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.87-7.70 (m, 2H), 7.70-7.56 (m, 2H), 7.51 (dd, $J=11.1, 9.7$ Hz, 2H), 7.44-7.25 (m, 4H), 7.22-7.00 (m, 2H), 5.62 (s, 1H), 4.77 (d, $J=12.5$ Hz, 4H)	m/e 433 (M+H) $^+$
1113	5-氟-N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基}苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.89-7.71 (m, 2H), 7.70-7.53 (m, 2H), 7.43-7.30 (m, 1H), 7.27-7.16 (m, 2H), 7.16-6.97 (m, 1H), 6.97-6.85 (m, 2H), 6.86-6.68 (m, 1H), 4.87-4.65 (m, 4H), 4.54-4.25 (m, 2H), 3.75 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) $^+$
1114	N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.78-7.67 (m, 2H), 7.65-7.52 (m, 2H), 7.45-7.29 (m, 1H), 7.25-7.03 (m, 2H), 4.79 (dd, $J=15.9, 8.4$ Hz, 4H), 4.16 (t, $J=6.4$ Hz, 2H), 3.59 (t, $J=6.4$ Hz, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.14 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 422 (M+H) $^+$
1115	5-氟-N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.90-7.74 (m, 2H), 7.74-7.56 (m, 2H), 7.48-7.31 (m, 1H), 7.28-7.03 (m, 2H), 4.78 (d, $J=12.4$ Hz, 4H), 4.02-3.80 (m, 4H), 3.63 (s, 2H), 3.46-3.32 (m, 4H), 1.38 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 441 (M+H) $^+$
1116	5-氟-N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.83-7.70 (m, 2H), 7.68-7.58 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.3, 5.2$ Hz, 1H), 7.24-7.03 (m, 2H), 4.82-4.69 (m, 5H), 3.65 (dd, $J=15.6, 11.3$ Hz, 1H), 3.03-2.83 (m, 3H), 2.03-1.80 (m, 2H), 1.81-1.66 (m, 2H), 1.62-1.33 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 425 (M+H) $^+$
1117	5-氟-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.81-7.69 (m, 2H), 7.69-7.56 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.3, 5.2$ Hz, 1H), 7.21-6.98 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.3$ Hz, 4H), 3.50 (t, $J=6.5$ Hz, 2H), 3.25-3.16 (m, 4H), 3.08-2.98 (m, 4H), 2.89 (t, $J=6.5$ Hz, 2H), 2.58-2.46 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 426 (M+H) $^+$
1118	5-氟-N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.87-7.71 (m, 2H), 7.71-7.52 (m, 2H), 7.45-7.29 (m, 1H), 7.19 (dq, $J=9.0, 2.5$ Hz, 3H), 7.14-7.02 (m, 1H), 6.92-6.79 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.6$ Hz, 4H), 4.38 (s, 2H), 3.83-3.59 (m, 4H), 3.12-2.95 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 474 (M+H) $^+$
1119	5-氟-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.84-7.71 (m, 2H), 7.70-7.61 (m, 2H), 7.48-7.32 (m, 1H), 7.27-7.01 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.4$ Hz, 4H), 3.37 (dd, $J=12.4, 5.8$ Hz, 5H), 3.16-3.01 (m, 3H), 3.01-2.70 (m, 2H), 2.07-1.90 (m, 3H), 1.77 (d, $J=46.1$ Hz, 6H), 1.46 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 425 (M+H) $^+$
1144	5-氟-N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.76-7.70 (m, 2H), 7.65-7.59 (m, 2H), 7.37 (dd,	(ESI(+)) m/e 400

	胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	$J=8.4, 5.1 \text{ Hz, 1H}$), 7.17 (dd, $J=9.1, 2.5 \text{ Hz, 1H}$), 7.14-7.05 (m, 1H), 4.79 (bs, 2H), 4.76 (bs, 2H), 3.15 (s, 2H), 2.99-2.78 (m, 1H), 0.90 (s, 6H)	(M+H) ⁺
1145	N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.73 (d, $J=8.6 \text{ Hz, 2H}$), 7.68-7.53 (m, 2H), 7.48-7.23 (m, 1H), 7.22-7.05 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.7 \text{ Hz, 4H}$), 3.29 (dd, $J=8.6, 6.6 \text{ Hz, 2H}$), 1.66-1.19 (m, 2H), 0.94 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 384 (M+H) ⁺
1146	5-氟-N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.79-7.66 (m, 2H), 7.62-7.49 (m, 2H), 7.45-7.31 (m, 1H), 7.24-6.96 (m, 2H), 6.51-6.25 (m, 1H), 6.13 (d, $J=3.2 \text{ Hz, 1H}$), 4.77 (d, $J=12.5 \text{ Hz, 4H}$), 4.27 (h, $J=6.7 \text{ Hz, 1H}$), 2.94 (dd, $J=15.0, 6.8 \text{ Hz, 2H}$), 2.87-2.69 (m, 1H), 1.19 (d, $J=6.7 \text{ Hz, 3H}$)	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) ⁺
1147	5-氟-N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.86-7.71 (m, 2H), 7.71-7.56 (m, 2H), 7.47-7.24 (m, 1H), 7.22-6.98 (m, 2H), 6.16 (s, 1H), 4.88-4.69 (m, 4H), 4.54 (s, 2H), 2.20 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 395 (M+H) ⁺
1148	N-(4-{[(2R)-1-氟基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.86-7.72 (m, 2H), 7.72-7.54 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.4, 5.2 \text{ Hz, 1H}$), 7.27-7.02 (m, 2H), 4.78 (d, $J=12.4 \text{ Hz, 4H}$), 4.24-4.01 (m, 1H), 2.90-2.65 (m, 2H), 1.76-1.53 (m, 2H), 0.92 (t, $J=7.4 \text{ Hz, 3H}$)	(ESI(+)) m/e 381 (M+H) ⁺
1149	N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.82-7.68 (m, 2H), 7.68-7.52 (m, 2H), 7.44-7.27 (m, 1H), 7.26-7.04 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.4 \text{ Hz, 4H}$), 4.05-3.76 (m, 1H), 1.82-1.38 (m, 2H), 1.16 (t, $J=5.3 \text{ Hz, 3H}$), 0.88 (t, $J=7.4 \text{ Hz, 3H}$)	(ESI(+)) m/e 356 (M+H) ⁺
1150	5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.78-7.66 (m, 2H), 7.66-7.54 (m, 3H), 7.48-7.27 (m, 2H), 7.24-7.02 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.5 \text{ Hz, 4H}$), 4.31 (t, $J=6.4 \text{ Hz, 2H}$), 3.66 (t, $J=6.4 \text{ Hz, 2H}$), 3.04-2.82 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 394 (M+H) ⁺
1151	5-氟-N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.65-7.50 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.4, 5.2 \text{ Hz, 1H}$), 7.32-7.21 (m, 2H), 7.21-7.02 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.6 \text{ Hz, 4H}$), 3.44-3.28 (m, 2H), 2.92 (s, 4H), 1.62-1.19 (m, 3H), 0.84 (d, $J=6.3 \text{ Hz, 6H}$)	(ESI(+)) m/e 384 (M+H) ⁺
1152	N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.87-7.71 (m, 2H), 7.71-7.53 (m, 2H), 7.49-7.24 (m, 1H), 7.25-6.98 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.4 \text{ Hz, 4H}$), 4.55-4.28 (m, 1H), 3.19-3.02 (m, 2H), 3.01-2.74 (m, 3H), 1.96 (s, 1H), 1.34 (d, $J=7.1 \text{ Hz, 3H}$), 1.04 (t, $J=7.2 \text{ Hz, 2H}$)	(ESI(+)) m/e 399 (M+H) ⁺

	胺		
1153	5-氟-N-(4-[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)胺甲酰基]苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.89-7.69 (m, 2H), 7.69-7.57 (m, 3H), 7.50 (d, $J=2.1$ Hz, 1H), 7.42-7.22 (m, 2H), 7.25-7.00 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.4$ Hz, 4H), 4.41 (s, 2H), 3.78 (s, 3H), 2.97 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 394 (M+H) $^+$
1154	5-氟-N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.78-7.72 (m, 2H), 7.64-7.58 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.4, 5.1$ Hz, 1H), 7.17 (dd, $J=9.1, 2.4$ Hz, 1H), 7.10 (td, $J=8.9, 2.5$ Hz, 1H), 4.79 (bs, 3H), 4.76 (bs, 3H), 3.38-3.32 (m, 5H), 3.32 (s, 4H), 1.61-1.39 (m, 2H), 0.90 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 386 (M+H) $^+$
1155	N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲酰基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.86-7.69 (m, 2H), 7.70-7.54 (m, 2H), 7.44-7.27 (m, 1H), 7.23-7.00 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.5$ Hz, 4H), 3.31 (dd, $J=13.0, 6.3$ Hz, 2H), 3.19-2.99 (m, 3H), 2.79 (s, 7H), 1.71-1.50 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 399 (M+H) $^+$
1156	5-氟-N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.82-7.70 (m, 2H), 7.70-7.54 (m, 2H), 7.44-7.28 (m, 1H), 7.23-7.03 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.5$ Hz, 4H), 4.53-4.35 (m, 1H), 3.98-3.81 (m, 2H), 3.77-3.66 (m, 1H), 3.70-3.53 (m, 1H), 3.01-2.87 (m, 1H), 2.32-2.10 (m, 1H), 2.07-1.81 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 370 (M+H) $^+$
1157	5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.78-7.72 (m, 2H), 7.63-7.57 (m, 2H), 7.40-7.31 (m, 1H), 7.21-7.04 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.4$ Hz, 4H), 4.11-3.94 (m, 1H), 3.55-3.32 (m, 2H), 3.28 (s, 3H), 1.72-1.39 (m, 2H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 386 (M+H) $^+$
1158	N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲酰基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.83-7.70 (m, 2H), 7.69-7.51 (m, 2H), 7.48-7.29 (m, 1H), 7.25-7.00 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.5$ Hz, 4H), 3.71-3.55 (m, 1H), 3.58-3.40 (m, 2H), 3.40-3.29 (m, 1H), 1.26-0.98 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 386 (M+H) $^+$
1159	N-{4-[苯甲基(甲基)胺甲酰基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.69-7.53 (m, 2H), 7.42-7.29 (m, 6H), 7.28 (dd, $J=13.0, 7.2$ Hz, 3H), 7.19-7.01 (m, 2H), 4.76 (d, $J=12.4$ Hz, 4H), 4.58 (d, $J=21.5$ Hz, 3H), 2.89 (d, $J=3.2$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 404 (M+H) $^+$
1160	N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲酰基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO D_2O) δ 7.83-7.68 (m, 2H), 7.66-7.54 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.4, 5.2$ Hz, 1H), 7.20-7.12 (m, 1H), 7.12-7.01 (m, 1H), 4.77 (d, $J=12.5$ Hz, 4H), 3.92 (h, $J=6.6$ Hz, 1H), 1.70-1.41 (m, 2H), 1.15 (d, $J=6.6$ Hz, 3H), 0.88 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 356 (M+H) $^+$
1161	5-氟-N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲酰基}苯基)	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.83-7.68 (m, 2H), 7.66-7.54 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.4, 5.2$ Hz, 1H), 7.20-7.12 (m, 1H), 7.12-7.01	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) $^+$

N-{4-[苯甲基(甲基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

	基)-1,3-二氫-2H-異 吡啶-2-甲醯胺	(m, 1H), 4.77 (d, $J=12.5$ Hz, 4H), 3.92 (h, $J=6.6$ Hz, 4H), 0.88 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	
1162	5-氟-N-(4-{[2-(3-甲 基-1H-吡啶-1-基)乙 基]胺甲醯基}苯 基)-1,3-二氫-2H-異 吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.77-7.66 (m, 2H), 7.66-7.56 (m, 2H), 7.50 (d, $J=2.1$ Hz, 1H), 7.44-7.29 (m, 1H), 7.17 (dd, $J=9.0, 2.2$ Hz, 1H), 7.14-7.00 (m, 1H), 6.00 (d, $J=2.2$ Hz, 1H), 4.77 (d, $J=12.5$ Hz, 4H), 4.21 (t, $J=6.4$ Hz, 2H), 3.63 (t, $J=6.4$ Hz, 2H), 2.89 (d, $J=62.0$ Hz, 1H), 2.21 (d, $J=32.8$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) $^+$
1163	5-氟-N-{4-[(2-甲基 丙基)胺甲醯基]苯 基}-1,3-二氫-2H-異 吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.82-7.69 (m, 2H), 7.69-7.54 (m, 2H), 7.46-7.26 (m, 1H), 7.29-7.01 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.4$ Hz, 4H), 3.15-3.05 (m, 2H), 2.98-2.75 (m, 3H), 2.06- 1.89 (m, 2H), 1.92-1.78 (m, 1H), 0.90 (d, $J=6.7$ Hz, 7H)	(ESI(+)) m/e 356 (M+H) $^+$
1164	5-氟-N-{4-[(吡啶-3- 基甲基)胺甲醯基] 苯基}-1,3-二氫-2H- 異吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.79-8.58 (m, 2H), 8.19 (t, $J=7.0$ Hz, 1H), 7.84- 7.73 (m, 2H), 7.73-7.66 (m, 1H), 7.70-7.55 (m, 2H), 7.50-7.27 (m, 1H), 7.27-7.06 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.4$ Hz, 4H), 4.59 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) $^+$
1165	5-氟-N-{4-[(四氫呋 喃-2-基甲基)胺甲 醯基]苯基}-1,3-二 氫-2H-異吡啶-2-甲 醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.85-7.72 (m, 2H), 7.66-7.53 (m, 2H), 7.46-7.32 (m, 1H), 7.24-7.14 (m, 1H), 7.14-7.04 (m, 1H), 4.93-4.61 (m, 4H), 4.11-3.90 (m, 1H), 3.87-3.72 (m, 1H), 3.72-3.53 (m, 1H), 3.35 (t, $J=7.5$ Hz, 2H), 2.06-1.73 (m, 3H), 1.66-1.52 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 384 (M+H) $^+$
1166	N-(4-{[(1R)-1-環丙 基乙基]胺甲醯基} 苯基)-5-氟-1,3-二 氫-2H-異吡啶-2-甲 醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.83-7.72 (m, 2H), 7.68-7.57 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.3, 5.1$ Hz, 1H), 7.23-7.02 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.5$ Hz, 4H), 3.63-3.42 (m, 1H), 1.22 (d, $J=6.7$ Hz, 3H), 1.15-0.79 (m, 1H), 0.51-0.24 (m, 3H), 0.24-0.11 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) $^+$
1167	5-氟-N-(4-{[1-(1-甲 基環丙基)乙基]胺 甲醯基}苯基)-1,3- 二氫-2H-異吡啶-2- 甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.83-7.68 (m, 2H), 7.68-7.54 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.4, 5.1$ Hz, 1H), 7.24-7.12 (m, 1H), 7.12-7.01 (m, 1H), 4.77 (d, $J=12.5$ Hz, 4H), 3.72 (q, $J=6.8$ Hz, 1H), 1.17 (d, $J=6.9$ Hz, 3H), 1.07 (s, 3H), 0.68-0.51 (m, 1H), 0.49-0.27 (m, 1H), 0.32-0.12 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) $^+$
1168	5-氟-N-{4-[(噻吩-2- 基甲基)胺甲醯基] 苯基}-1,3-二氫-2H- 異吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.89-7.70 (m, 2H), 7.70-7.56 (m, 2H), 7.48-7.26 (m, 2H), 7.24-7.14 (m, 1H), 7.14-7.05 (m, 1H), 7.05-6.95 (m, 1H), 6.98-6.86 (m, 1H), 4.90-4.67 (m, 4H), 4.63 (d, $J=4.2$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 395 (M+H) $^+$
1169	N-(4-{[(1S)-1-環丙 基乙基]胺甲醯基} 苯基)-5-氟-1,3-二 氫-2H-異吡啶-2-甲 醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.85-7.70 (m, 2H), 7.68-7.51 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=8.4, 5.2$ Hz, 1H), 7.21-7.05 (m, 2H), 4.77 (d, $J=12.4$ Hz, 4H), 3.64-3.41 (m, 1H), 1.22(d, $J=6.7$ Hz, 3H), 1.17-0.94 (m, 1H), 0.51-0.41 (m, 1H), 0.41-0.34 (m, 1H), 0.34-0.27 (m, 1H), 0.23-	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) $^+$

		0.11 (m, 1H)	
1170	5-氟-N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲磺基]苯基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.81-7.67 (m, 2H), 7.67-7.52 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.3, 5.2 Hz, 1H), 7.17 (d, <i>J</i> =9.1 Hz, 1H), 7.14-7.03 (m, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 3.42-3.30 (m, 2H), 3.24 (s, 3H), 1.96 (s, 1H), 1.70-1.29 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 386 (M+H) ⁺
1171	5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲磺基}苯基)-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.93-7.72 (m, 2H), 7.69-7.55 (m, 2H), 7.45-7.29 (m, 1H), 7.17 (dt, <i>J</i> =5.5, 2.7 Hz, 1H), 7.13-7.04 (m, 1H), 6.72 (dd, <i>J</i> =6.4, 1.6 Hz, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.6 Hz, 4H), 4.51 (s, 2H), 2.26 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 395 (M+H) ⁺
1172	5-氟-N-(4-{[2-(四氢-2H-吡喃-3-基)乙基]胺甲磺基}苯基)-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.74 (dd, <i>J</i> =9.0, 2.2 Hz, 2H), 7.61 (dd, <i>J</i> =9.0, 2.1 Hz, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.3, 5.2 Hz, 1H), 7.17 (dd, <i>J</i> =9.0, 2.0 Hz, 1H), 7.14-6.99 (m, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 3.86-3.57 (m, 2H), 3.38-3.28 (m, 2H), 3.17-2.91 (m, 1H), 1.97-1.73 (m, 1H), 1.74-1.52 (m, 2H), 1.52-1.34 (m, 3H), 1.33-1.06 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 412 (M+H) ⁺
1173	5-氟-N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲磺基}苯基)-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.81-7.72 (m, 2H), 7.69-7.51 (m, 2H), 7.51-7.28 (m, 1H), 7.23-7.14 (m, 1H), 7.14-6.98 (m, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 4.31-4.10 (m, 1H), 3.44 (dd, <i>J</i> =9.8, 6.2 Hz, 1H), 3.35-3.32 (m, 1H), 3.29 (s, 3H), 1.16 (d, <i>J</i> =6.8 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 372 (M+H) ⁺
1174	N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲磺基]苯基}-5-氟-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.89-7.70 (m, 2H), 7.70-7.54 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.1 Hz, 1H), 7.17 (dd, <i>J</i> =9.1, 2.2 Hz, 1H), 7.14-6.96 (m, 1H), 4.78 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 4.30 (d, <i>J</i> =4.1 Hz, 2H), 1.18 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 398 (M+H) ⁺
1175	5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲磺基}苯基)-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.89-7.70 (m, 2H), 7.70-7.54 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.1 Hz, 2H), 7.17 (dd, <i>J</i> =9.1, 2.2 Hz, 1H), 7.14-6.96 (m, 1H), 4.78 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 4.30 (d, <i>J</i> =4.1 Hz, 2H), 3.5 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 393 (M+H) ⁺
1176	5-氟-N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲磺基}苯基)-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.87-7.68 (m, 2H), 7.68-7.50 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.2 Hz, 1H), 7.24-7.15 (m, 1H), 7.15-7.05 (m, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 3.83 (p, <i>J</i> =6.7 Hz, 1H), 1.88-1.63 (m, 1H), 1.12 (d, <i>J</i> =6.8 Hz, 3H), 0.90 (dd, <i>J</i> =6.8, 1.4 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 386 (M+H) ⁺
1177	N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲磺基}苯基)-5-氟-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲磺胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.82-7.70 (m, 2H), 7.70-7.55 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.1 Hz, 1H), 7.17 (dd, <i>J</i> =9.0, 2.2 Hz, 1H), 7.15-7.02 (m, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.4 Hz, 4H), 3.39-3.30 (m, 2H), 3.23-3.02 (m, 2H), 2.81 (d, <i>J</i> =4.3 Hz, 6H), 2.02-1.84 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 385 (M+H) ⁺

1178	N-(4-{[(2S)-1-胺基-1-側氧基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.90-7.73 (m, 2H), 7.73-7.50 (m, 2H), 7.50-7.30 (m, 1H), 7.29-7.13 (m, 1H), 7.13-7.02 (m, 1H), 4.78 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 4.46-4.31 (m, 1H), 1.96 (s, 1H), 1.91-1.78 (m, 1H), 1.78-1.66 (m, 1H), 1.04-0.82 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 385 (M+H) ⁺
1179	5-氟-N-[4-(四氫-2H-吡喃-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.83-7.69 (m, 2H), 7.68-7.54 (m, 2H), 7.42-7.28 (m, 1H), 7.22-7.14 (m, 1H), 7.14-7.01 (m, 1H), 4.78 (t, <i>J</i> =10.5 Hz, 4H), 3.96-3.86 (m, 1H), 3.85-3.70 (m, 2H), 3.41-3.32 (m, 1H), 2.00-1.88 (m, 1H), 1.77-1.65 (m, 1H), 1.65-1.50 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 384 (M+H) ⁺
1180	5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.76-7.66 (m, 2H), 7.66-7.53 (m, 2H), 7.46-7.29 (m, 1H), 7.22-7.13 (m, 1H), 7.13-6.99 (m, 1H), 6.72 (t, <i>J</i> =1.9 Hz, 1H), 5.99 (t, <i>J</i> =2.0 Hz, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 4.07 (t, <i>J</i> =6.5 Hz, 2H), 3.57 (t, <i>J</i> =6.5 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 393 (M+H) ⁺
1181	5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.78-7.72 (m, 2H), 7.64-7.58 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.1 Hz, 1H), 7.17 (dd, <i>J</i> =9.1, 2.4 Hz, 1H), 7.14-7.05 (m, 1H), 4.79 (bs, 2H), 4.76 (bs, 2H), 4.18 (h, <i>J</i> =6.5 Hz, 1H), 3.44 (dd, <i>J</i> =9.8, 6.2 Hz, 1H), 2.99-2.78 (m, 1H), 1.16 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 372 (M+H) ⁺
1182	5-氟-N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.78-7.72 (m, 1H), 7.64-7.56 (m, 1H), 7.41-7.28 (m, 1H), 7.20-7.05 (m, 1H), 4.78 (bs, 1H), 4.75 (bs, 1H), 3.49 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 3.48-3.39 (m, 1H), 2.97 (s, 2H), 2.88-2.76 (m, 1H), 1.96 (s, 1H)	(ESI(+)) m/e 358 (M+H) ⁺
1183	N-[4-(環戊基胺甲鹽基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.83-7.68 (m, 2H), 7.68-7.53 (m, 2H), 7.51-7.28 (m, 1H), 7.20-7.13 (m, 1H), 7.12-7.03 (m, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.4 Hz, 4H), 4.33-4.12 (m, 1H), 2.00-1.84 (m, 2H), 1.82-1.66 (m, 2H), 1.66-1.45 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) ⁺
1184	5-氟-N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.85-7.69 (m, 2H), 7.66-7.53 (m, 2H), 7.46-7.31 (m, 1H), 7.23-7.16 (m, 1H), 7.16-7.05 (m, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 3.85-3.79 (m, 1H), 1.89-1.72 (m, 1H), 1.11 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 3H), 0.90 (dd, <i>J</i> =6.8, 1.1 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 370 (M+H) ⁺
1185	5-氟-N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.87-7.68 (m, 2H), 7.68-7.50 (m, 2H), 7.37 (dd, <i>J</i> =8.4, 5.2 Hz, 1H), 7.24-7.15 (m, 1H), 7.15-7.05 (m, 1H), 4.77 (d, <i>J</i> =12.5 Hz, 4H), 3.83 (p, <i>J</i> =6.7 Hz, 1H), 1.88-1.63 (m, 1H), 1.12 (d, <i>J</i> =6.8 Hz, 3H), 0.90 (dd, <i>J</i> =6.8, 1.4 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 370 (M+H) ⁺
1186	5-氟-N-(4-{[(2S)-2-	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ	(ESI(+))

	甲基丁基]胺甲醯基}苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.84-7.70 (m, 2H), 7.70-7.56 (m, 2H), 7.46-7.27 (m, 1H), 7.25-7.03 (m, 2H), 4.77 (d, J =12.5 Hz, 4H), 3.21 (dd, J =13.1, 6.4 Hz, 1H), 3.15-2.97 (m, 1H), 1.80-1.61 (m, 1H), 1.53-1.30 (m, 1H), 1.28-1.06 (m, 1H), 0.98-0.79 (m, 6H)	m/e 370 (M+H) $^+$
1187	5-氟-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基}苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.81-7.71 (m, 2H), 7.67-7.57 (m, 2H), 7.45-7.27 (m, 1H), 7.21-7.13 (m, 1H), 7.13-7.00 (m, 1H), 4.83-4.70 (m, 4H), 1.96 (s, 2H), 1.14 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 372 (M+H) $^+$
1188	5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-吡喃-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.82-7.67 (m, 2H), 7.69-7.51 (m, 2H), 7.43-7.32 (m, 1H), 7.21-7.01 (m, 2H), 4.78 (t, J =10.2 Hz, 4H), 3.95-3.70 (m, 2H), 3.38-3.30 (m, 2H), 1.96 (s, 1H), 1.65-1.55 (m, 2H), 1.57-1.43 (m, 2H), 1.29-1.09 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 412 (M+H) $^+$
1189	N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.81-7.69 (m, 2H), 7.68-7.53 (m, 2H), 7.47-7.30 (m, 1H), 7.26-7.13 (m, 1H), 7.13-7.01 (m, 1H), 4.87-4.67 (m, 4H), 3.27 (d, J =7.1 Hz, 2H), 1.61-1.45 (m, 2H), 1.44-1.26 (m, 2H), 0.91 (t, J =7.3 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 356 (M+H) $^+$
1190	5-氟-N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基}苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.69-7.52 (m, 2H), 7.42-7.31 (m, 1H), 7.32-7.24 (m, 2H), 7.20-7.14 (m, 1H), 7.14-7.02 (m, 1H), 4.89-4.63 (m, 4H), 4.12-3.96 (m, 1H), 3.82-3.58 (m, 2H), 3.59-3.34 (m, 2H), 2.00-1.86 (m, 2H), 1.86-1.72 (m, 2H), 1.61-1.33 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 398 (M+H) $^+$
1191	5-氟-N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基}苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.69-7.53 (m, 2H), 7.43-7.32 (m, 1H), 7.32-7.24 (m, 2H), 7.19-7.13 (m, 1H), 7.13-7.03 (m, 1H), 4.77 (d, J =12.4 Hz, 4H), 3.52 (s, 3H), 3.03-2.92 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 372 (M+H) $^+$
1192	N-{4-[(1-氟基乙基)胺甲醯基}苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.89-7.74 (m, 2H), 7.74-7.57 (m, 2H), 7.37 (dd, J =8.4, 5.1 Hz, 1H), 7.17 (dd, J =9.0, 2.2 Hz, 1H), 7.13-7.04 (m, 1H), 4.93 (q, J =7.2 Hz, 1H), 4.78 (d, J =12.4 Hz, 4H), 1.57 (d, J =7.2 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 353 (M+H) $^+$
1193	5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.85-7.72 (m, 2H), 7.68-7.56 (m, 2H), 7.42-7.28 (m, 1H), 7.21-7.12 (m, 1H), 7.12-7.01 (m, 1H), 6.24-6.00 (m, 1H), 4.90-4.68 (m, 4H), 4.55-4.37 (m, 2H), 2.42-2.27 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 395 (M+H) $^+$
1194	5-氟-N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基}苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.87-7.72 (m, 2H), 7.66-7.55 (m, 2H), 7.45-7.32 (m, 1H), 7.17 (dd, J =9.0, 2.1 Hz, 1H), 7.14-7.01 (m, 1H), 4.77 (d, J =12.4 Hz, 4H), 4.50-4.38 (m, 1H), 3.93-3.80 (m, 2H), 3.80-3.66 (m, 1H), 3.59	(ESI(+)) m/e 370 (M+H) $^+$

		(dd, $J=8.9, 4.6$ Hz, 1H), 2.27-2.09 (m, 1H), 1.99-1.77 (m, 1H)	
1260	N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.80-7.70 (m, 2H), 7.68-7.52 (m, 2H), 7.44-7.23 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.29 (d, $J=7.7$ Hz, 3H), 3.22-3.19 (m, 2H), 3.15 (s, 2H), 0.90 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) $^+$
1261	N-{4-[(4,4-二氟環己基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.86-7.69 (m, 2H), 7.69-7.50 (m, 2H), 7.38-7.22 (m, 4H), 4.99-4.62 (m, 4H), 3.96 (s, 1H), 2.20-1.82 (m, 6H), 1.70 (t, $J=11.7$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) $^+$
1262	N-(4-{[(2R)-1-氟基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.87-7.70 (m, 2H), 7.73-7.49 (m, 2H), 7.45-7.17 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 4.23-3.99 (m, 1H), 2.97-2.63 (m, 2H), 1.78-1.56 (m, 2H), 0.91 (q, $J=7.2$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 362 (M+H) $^+$
1263	N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.77-7.70 (m, 2H), 7.69-7.52 (m, 2H), 7.42-7.22 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.41-3.31 (m, 5H), 1.65-1.30 (m, 2H), 0.90 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) $^+$
1264	N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.88-7.73 (m, 2H), 7.69-7.55 (m, 2H), 7.48-7.16 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 4.58-4.35 (m, 1H), 3.13 (q, $J=7.2$ Hz, 2H), 1.35 (d, $J=7.2$ Hz, 3H), 1.05 (t, $J=7.2$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 381 (M+H) $^+$
1265	N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啶-4-基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.95-7.77 (m, 2H), 7.70 (t, $J=10.6$ Hz, 2H), 7.48-7.20 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 3.95 (d, $J=20.8$ Hz, 4H), 3.75-3.55 (m, 2H), 3.40 (s, 2H), 1.95-1.63 (m, 2H), 1.34 (s, 3H), 1.02 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) $^+$
1266	N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.86-7.69 (m, 2H), 7.69-7.53 (m, 2H), 7.49-7.13 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.63-3.44 (m, 1H), 1.22 (d, $J=6.7$ Hz, 3H), 1.09-0.90 (m, 1H), 0.57-0.12 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 350 (M+H) $^+$
1267	N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.84-7.71 (m, 2H), 7.66-7.55 (m, 2H), 7.40-7.19 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.52 (p, $J=6.9$ Hz, 1H), 1.22 (d, $J=6.7$ Hz, 3H), 1.13-0.90 (m, 1H), 0.54-0.14 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 350 (M+H) $^+$
1269	N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.84-7.73 (m, 2H), 7.67-7.53 (m, 2H), 7.42-7.19 (m, 4H), 4.80 (d, $J=5.5$ Hz, 4H), 4.52-4.35 (m, 1H), 3.93-3.78 (m, 2H), 3.78-3.67 (m, 1H), 3.63-3.52 (m, 1H), 2.29-2.08 (m, 1H), 2.07-1.79 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 351 (M+H) $^+$
1270	N-(4-{[2-(四氫-2H-	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ	(ESI(+))

	哌喃-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	7.82-7.69 (m, 2H), 7.65-7.48 (m, 2H), 7.50-7.14 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.93-3.60 (m, 2H), 3.41-3.29 (m, 2H), 3.14-2.93 (m, 1H), 2.02-1.79 (m, 1H), 1.69-1.43 (m, 4H), 1.29-1.09 (m, 1H)	m/e 394 (M+H) ⁺
1271	N-(4-[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.92-7.71 (m, 2H), 7.72-7.56 (m, 2H), 7.46-7.24 (m, 4H), 4.80 (d, <i>J</i> =1.4 Hz, 4H), 4.63-4.41 (m, 2H), 2.26 (t, <i>J</i> =2.3 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 377 (M+H) ⁺
1272	N-[4-({2-[(二甲基胺基)甲基]苯甲基}胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.85-7.75 (m, 2H), 7.72-7.63 (m, 2H), 7.59-7.50 (m, 1H), 7.50-7.42 (m, 2H), 7.42-7.24 (m, 5H), 4.79 (s, 4H), 4.52 (d, <i>J</i> =16.7 Hz, 4H), 2.88 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 429 (M+H) ⁺
1273	N-(4-[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.86-7.76 (m, 2H), 7.70-7.62 (m, 2H), 7.51 (t, <i>J</i> =6.8 Hz, 2H), 7.40-7.25 (m, 7H), 5.63 (s, 1H), 4.79 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 415 (M+H) ⁺
1274	N-[4-(1,3-噁唑-2-基胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.03-7.85 (m, 2H), 7.85-7.76 (m, 1H), 7.76-7.61 (m, 2H), 7.47-7.25 (m, 4H), 7.18-7.03 (m, 1H), 4.92-4.62 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 329 (M+H) ⁺
1275	N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.88-7.65 (m, 2H), 7.69-7.53 (m, 2H), 7.46-7.18 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.99-3.66 (m, 3H), 3.44-3.32 (m, 1H), 2.04-1.86 (m, 1H), 1.84-1.50 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
1276	N-(4-({2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.85-7.70 (m, 2H), 7.70-7.57 (m, 2H), 7.45-7.22 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 3.94-3.77 (m, 2H), 3.67 (t, <i>J</i> =6.2 Hz, 2H), 3.53 (d, <i>J</i> =12.0 Hz, 2H), 3.32 (dd, <i>J</i> =12.8, 6.6 Hz, 3H), 2.72 (t, <i>J</i> =11.7 Hz, 2H), 1.18 (d, <i>J</i> =6.3 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺
1277	N-(4-([1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.85-7.69 (m, 2H), 7.69-7.53 (m, 2H), 7.47-6.99 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.82-3.62 (m, 1H), 1.17 (d, <i>J</i> =6.9 Hz, 3H), 1.07 (s, 3H), 0.69-0.53 (m, 1H), 0.47-0.35 (m, 1H), 0.29-0.13 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 364 (M+H) ⁺
1278	N-(4-({2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.79-7.65 (m, 3H), 7.68-7.54 (m, 2H), 7.43-7.17 (m, 4H), 6.78 (d, <i>J</i> =3.3 Hz, 1H), 6.64-6.46 (m, 1H), 4.91-4.72 (m, 5H), 4.11-3.93 (m, 1H), 3.93-3.77 (m, 1H), 2.01-1.76 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 445 (M+H) ⁺
1310	N-(4-([3-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.80-7.69 (m, 2H), 7.69-7.51 (m, 2H), 7.44-7.25	(ESI(+)) m/e 418

	基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	(m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.03-3.87 (m, 2H), 2.23-2.15 (m, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.05-1.88 (m, 2H)	(M+H) ⁺
1311	N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.92-7.83 (m, 1H), 7.79-7.70 (m, 2H), 7.70-7.57 (m, 2H), 7.46-7.13 (m, 5H), 6.63-6.61 (m, 1H), 4.90-4.73 (m, 6H), 3.76-3.57 (m, 1H), 2.95 (s, 3H), 2.02-1.68 (m, 4H), 1.64-1.32 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) ⁺
1312	N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.74-7.67 (m, 2H), 7.66-7.59 (m, 3H), 7.39-7.28 (m, 4H), 6.23 (t, <i>J</i> =2.0 Hz, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.31 (t, <i>J</i> =6.4 Hz, 2H), 3.66 (t, <i>J</i> =6.4 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 376 (M+H) ⁺
1313	N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.91-7.75 (m, 2H), 7.74-7.62 (m, 3H), 7.53 (d, <i>J</i> =3.3 Hz, 1H), 7.47-7.23 (m, 4H), 5.56-5.34 (m, 1H), 4.80 (s, 4H), 1.65 (d, <i>J</i> =7.0 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 393 (M+H) ⁺
1314	N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.77-7.66 (m, 2H), 7.66-7.55 (m, 2H), 7.50-7.39 (m, 1H), 7.41-7.19 (m, 4H), 6.45-6.23 (m, 1H), 6.13 (d, <i>J</i> =3.1 Hz, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.39-4.14 (m, 1H), 3.03-2.87 (m, 1H), 2.87-2.70 (m, 1H), 1.19 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 390 (M+H) ⁺
1315	N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.81-7.68 (m, 2H), 7.70-7.57 (m, 2H), 7.54 (s, 1H), 7.47-7.20 (m, 4H), 5.14 (q, <i>J</i> =6.9 Hz, 1H), 4.79 (s, 4H), 3.78 (s, 3H), 1.47 (d, <i>J</i> =6.9 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 390 (M+H) ⁺
1316	N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.93-7.76 (m, 2H), 7.76-7.52 (m, 2H), 7.46-7.19 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 4.62-4.39 (m, 1H), 1.78-1.50 (m, 3H), 0.92 (dd, <i>J</i> =11.0, 6.1 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 395 (M+H) ⁺
1317	N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.80-7.67 (m, 2H), 7.66-7.56 (m, 2H), 7.48-7.09 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.38 (h, <i>J</i> =6.6 Hz, 1H), 4.22-4.00 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 1.16 (d, <i>J</i> =6.8 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 418 (M+H) ⁺
1318	N-{4-[(2,2-二氟乙基)胺甲鹽基}苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.93-7.72 (m, 2H), 7.73-7.57 (m, 2H), 7.44-7.22 (m, 4H), 6.28-5.80 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 3.78-3.55 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 346 (M+H) ⁺
1319	N-(4-{[2-(四氫-2H-吡喃-4-基)乙基]胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.81-7.68 (m, 2H), 7.68-7.53 (m, 2H), 7.44-7.25 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.93-3.74 (m, 2H), 3.34-	(ESI(+)) m/e 394 (M+H) ⁺

	甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	3.30 (m, 2H), 1.73-1.43 (m, 4H), 1.35-1.06 (m, 2H)	
1320	N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基}苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.83-7.72 (m, 2H), 7.67-7.47 (m, 2H), 7.43-7.17 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.00 (p, <i>J</i> =6.2 Hz, 1H), 3.88-3.72 (m, 1H), 3.73-3.55 (m, 1H), 3.34 (d, <i>J</i> =5.9 Hz, 2H), 2.01-1.76 (m, 3H), 1.71-1.49 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
1321	N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲醯基}苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.86-7.71 (m, 2H), 7.71-7.58 (m, 2H), 7.46-7.22 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.35 (s, 2H), 3.18 (s, 3H), 1.14 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) ⁺
1322	N-(4-[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.81-7.75 (m, 2H), 7.67-7.61 (m, 2H), 7.39-7.28 (m, 4H), 4.83-4.76 (m, 5H), 4.46 (s, 2H), 2.36 (d, <i>J</i> =0.9 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 377 (M+H) ⁺
1323	N-(4-[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.75 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 2H), 7.62 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 2H), 7.54 (s, 1H), 7.39-7.20 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.30 (s, 2H), 3.78 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 376 (M+H) ⁺
1324	N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.83-7.64 (m, 2H), 7.68-7.53 (m, 2H), 7.46-7.13 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.13 (t, <i>J</i> =6.5 Hz, 2H), 3.58 (t, <i>J</i> =6.5 Hz, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.12 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 404 (M+H) ⁺
1325	N-α-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羧基)胺基}苯甲醯基}-L-苯基丙胺醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.70-7.66 (m, 2H), 7.66-7.56 (m, 2H), 7.39-7.22 (m, 8H), 7.22-7.12 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.72-4.62 (m, 1H), 3.20-3.11 (m, 1H), 3.08-2.91 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 429 (M+H) ⁺
1326	N-(4-{[2-(2-甲基-1,3-噁唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.74 (dd, <i>J</i> =6.8, 1.8 Hz, 2H), 7.70-7.57 (m, 2H), 7.43-7.23 (m, 4H), 7.19-6.98 (m, 1H), 4.80 (s, 4H), 3.66-3.41 (m, 2H), 3.05-2.85 (m, 2H), 2.65 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 477 (M+H) ⁺
1327	N-(4-[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.87-7.69 (m, 2H), 7.69-7.49 (m, 2H), 7.49-7.24 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 4.45-4.33 (m, 1H), 2.66 (d, <i>J</i> =20.0 Hz, 3H), 1.02 (d, <i>J</i> =18.5 Hz, 9H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺

1328	N-[4-(噻吩-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.97-7.82 (m, 2H), 7.75-7.61 (m, 3H), 7.46-7.24 (m, 5H), 4.81 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 364 (M+H) $^+$
1329	N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.80-7.67 (m, 2H), 7.67-7.55 (m, 2H), 7.45-7.20 (m, 5H), 6.00 (dd, $J=5.0, 0.7$ Hz, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.21 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 3.61 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 2.25 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 390 (M+H) $^+$
1330	N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.76-7.68 (m, 2H), 7.68-7.52 (m, 2H), 7.56-7.42 (m, 1H), 7.44-7.24 (m, 4H), 5.99 (d, $J=2.1$ Hz, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.21 (t, $J=6.4$ Hz, 2H), 3.63 (t, $J=6.4$ Hz, 2H), 2.21 (d, $J=33.1$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 390 (M+H) $^+$
1331	N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.88-7.68 (m, 2H), 7.66-7.49 (m, 2H), 7.44-7.19 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.01-3.80 (m, 1H), 1.70-1.33 (m, 2H), 1.16 (d, $J=6.6$ Hz, 3H), 0.88 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 338 (M+H) $^+$
1332	N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.88-7.69 (m, 2H), 7.72-7.54 (m, 2H), 7.47-7.19 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 4.30 (s, 2H), 1.18 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 380 (M+H) $^+$
1333	N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.83-7.73 (m, 2H), 7.70-7.59 (m, 2H), 7.55-7.46 (m, 1H), 7.41-7.22 (m, 4H), 6.15 (d, $J=2.2$ Hz, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.42 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 376 (M+H) $^+$
1334	N-(4-{[2-(乙醯基胺基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.90-7.79 (m, 2H), 7.76-7.66 (m, 3H), 7.51-7.42 (m, 1H), 7.41-7.26 (m, 4H), 7.26-7.13 (m, 2H), 4.85-4.77 (m, 4H), 2.14-2.05 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 415 (M+H) $^+$
1335	N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.83-7.70 (m, 2H), 7.70-7.55 (m, 2H), 7.45-7.23 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.16-3.89 (m, 1H), 3.52-3.33 (m, 2H), 1.75-1.42 (m, 2H), 0.90 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) $^+$
1336	N-[4-(四氫-2H-哌喃-4-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.85-7.71 (m, 2H), 7.66-7.53 (m, 2H), 7.48-7.20 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.05-3.82 (m, 3H), 3.48-3.31 (m, 2H), 1.93-1.70 (m, 2H), 1.70-1.48 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) $^+$
1337	N-[4-(嘧啶-4-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.93-8.85 (m, 1H), 8.72-8.62 (m, 1H), 8.21-8.11 (m, 1H), 8.03-7.91 (m, 2H), 7.77-7.66 (m, 2H), 7.42-7.26 (m, 4H), 4.81 (d, $J=5.2$ Hz, 4H)	(ESI(+)) m/e 359 (M+H) $^+$

	甲醯胺		
1338	N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.78-7.66 (m, 2H), 7.66-7.57 (m, 2H), 7.37-7.26 (m, 4H), 6.87-6.56 (m, 1H), 6.10-5.80 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.08 (t, <i>J</i> =6.5 Hz, 2H), 3.70-3.48 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 375 (M+H) ⁺
1339	N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.83-7.70 (m, 2H), 7.70-7.52 (m, 2H), 7.45-7.17 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.24-3.16 (m, 1H), 3.16-2.98 (m, 1H), 1.77-1.55 (m, 1H), 1.51-1.31 (m, 1H), 1.31-1.01 (m, 1H), 0.90 (dd, <i>J</i> =13.5, 6.4 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 352 (M+H) ⁺
1340	N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.86-7.70 (m, 3H), 7.68-7.47 (m, 3H), 7.47-6.53 (m, 6H), 4.84-4.32 (m, 7H), 3.27 (s, 7H), 2.61-2.29 (m, 11H), 2.04-1.61 (m, 3H), 1.56-0.69 (m, 10H), 0.18-0.03 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 395 (M+H) ⁺
1341	N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.86-7.73 (m, 2H), 7.84-7.78 (m, 2H), 7.70-7.57 (m, 2H), 7.68-7.62 (m, 2H), 7.53-7.49 (m, 1H), 7.51 (dd, <i>J</i> =6.8, 5.5 Hz, 2H), 7.40-7.26 (m, 7H), 7.36-7.22 (m, 5H), 5.63 (s, 1H), 5.63 (s, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.79 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 315 (M+H) ⁺
1342	N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.80-7.68 (m, 2H), 7.68-7.53 (m, 2H), 7.37-7.18 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.44-3.29 (m, 4H), 1.81-1.62 (m, 2H), 1.15 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) ⁺
1343	N-(4-{[3-(甲基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.97-7.85 (m, 3H), 7.76-7.65 (m, 2H), 7.45-7.26 (m, 6H), 4.85-4.77 (m, 4H), 2.86-2.78 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 415 (M+H) ⁺
1344	N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.90-7.68 (m, 2H), 7.66-7.56 (m, 2H), 7.40-7.17 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.02-3.72 (m, 1H), 1.94-1.65 (m, 1H), 1.12 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 3H), 0.90 (d, <i>J</i> =6.8 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 352 (M+H) ⁺
1345	N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.85-7.68 (m, 2H), 7.67-7.51 (m, 2H), 7.48-7.11 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.95-3.74 (m, 1H), 1.92-1.64 (m, 1H), 1.12 (d, <i>J</i> =6.8 Hz, 3H), 1.00-0.79 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 352 (M+H) ⁺
1346	N-(4-{[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.83-7.70 (m, 2H), 7.70-7.52 (m, 2H), 7.45-7.17 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.24-3.16 (m, 1H), 3.16-2.98 (m, 1H), 1.77-1.55 (m, 1H), 1.51-1.31 (m, 1H), 1.31-1.01 (m, 1H), 0.90 (dd, <i>J</i> =13.5, 6.4	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺

5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-胺基-1-側氧基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

		Hz, 6H)	
1348	N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.91-7.75 (m, 2H), 7.75-7.60 (m, 2H), 7.44-7.23 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 4.01-3.86 (m, 4H), 3.63 (s, 2H), 3.50-3.35 (m, 4H), 1.38 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺
1349	N-{4-[2-乙氧基丙基]胺甲鹽基}苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.84-7.70 (m, 2H), 7.70-7.55 (m, 2H), 7.43-7.24 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 3.72-3.55 (m, 1H), 3.58-3.44 (m, 2H), 3.38-3.31 (m, 1H), 1.20-1.01 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) ⁺

實例 132

N²-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺

5-氟基-N-(4-(丙基胺甲鹽基)苯基)異吲哚啉-2-甲鹽胺(30 mg, 0.9 mmol)於硫酸(0.1 mL)及三氟乙酸(0.3 mL)中之溶液在室溫下攪拌16小時。反應物用冰處理且懸浮液攪拌10分鐘並過濾。收集之固體用水洗滌且真空乾燥；固體藉由逆相HPLC純化，得到標題化合物。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.61 (s, 1H), 8.26 (t, J=5.7 Hz, 1H), 7.97-8.00 (bs, 1H), 7.81-7.86 (m, 2H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.63-7.68 (m, 2H), 7.44 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.34-7.39 (bs, 1H), 4.81-4.82 (bs, 4H), 3.16-3.24 (m, 2H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, J=7.4 Hz, 3H)；MS (ESI(+)) m/e 367 (M+H)⁺。

實例 272

2-{[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]胺甲鹽基}異吲哚啉-5-甲酸甲酯

實例 272A

4-胺基-N-丙基苯甲鹽胺

在室溫下在耐壓瓶中4-硝基-N-丙基苯甲醯胺(800 mg, 0.1 mmol)於40 ml四氫呋喃中之溶液在160 mg 20% Pd/碳存在下用30 psi氫氣處理30分鐘。懸浮液經由耐綸膜過濾且濃縮，得到標題化合物。

實例 272B

2-{[4-(丙基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}異吲哚啉-5-甲酸甲酯
4-胺基-N-丙基苯甲醯胺(390 mg, 2.19 mmol)、碳酸雙(2,5-二側氧基吡咯啉-1-基)酯(700 mg, 2.74 mmol)及吡啶(0.18 mL, 2.19 mmol)於乙腈(5 mL)中之溶液在周圍溫度下攪拌30分鐘。添加二異丙基乙胺(0.85 mL, 6.6 mmol)，接著經約5分鐘經由注射器逐滴添加異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽(538 mg, 2.52 mmol)及二異丙基乙胺(0.46 mL, 4.4 mmol)於1-甲基-2-吡咯啉酮(8 mL)中之懸浮液。反應物變成懸浮液且攪拌3小時。反應物用水(30 mL)處理且所得懸浮液攪拌5分鐘並過濾。收集之固體用水洗滌且真空乾燥，得到標題化合物。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.63 (s, 1H), 8.26 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 7.94-7.97 (m, 1H), 7.90-7.96 (m, 1H), 7.75-7.78 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.52 (d, *J*=7.9 Hz, 1H), 4.83-4.86 (m, 4H), 3.87 (s, 3H), 3.16-3.22 (m, 2H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, *J*=7.4 Hz, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 382 (M+H)⁺。

實例 273

2-{[4-(丙基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}異吲哚啉-5-甲酸
標題化合物如實例1B中所述，用2-{[4-(丙基胺甲醯基)

苯基]胺甲鹽基}異吲哚啉-5-甲酸甲酯代替4-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)苯甲酸甲酯製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 12.90-13.07 (bs, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.26 (t, *J*=5.7 Hz, 1H), 7.88-7.93 (m, 2H), 7.75-7.78 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.49 (d, *J*=7.9 Hz, 1H), 4.83-4.85 (bs, 4H), 3.16-3.24 (m, 2H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, *J*=7.4 Hz, 3H); (ESI(+)) *m/e* 368 (M+H)⁺。

實例 274

5-胺基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺

在室溫下5-硝基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺(37 mg, 0.1 mmol)於1 ml二甲基甲鹽胺中之溶液在11 mg 10% Pd/碳存在下用氫氣球處理隔夜。懸浮液經由矽藻土過濾且藉由逆相HPLC純化，得到標題化合物。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.51 (s, 1H), 8.24 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.62-7.66 (m, 2H), 7.19 (d, *J*=7.9 Hz, 1H), 6.78-6.89 (m, 2H), 4.67-4.71 (m, 4H), 3.15-3.26 (m, 2H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, *J*=7.4 Hz, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 339 (M+H)⁺。

實例 275

5-(羥基甲基)-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺

氯化鈣(0.031 g, 0.277 mmol)於乙醇(0.8 mL)中之溶液添加至2-(4-(丙基胺甲鹽基)苯基胺甲鹽基)異吲哚啉-5-甲

酸甲酯(0.04 g, 0.105 mmol)於四氫呋喃(1 mL)中之懸浮液中。接著硼氫化鈉(0.02 g, 0.524 mmol)一次性添加且懸浮液在室溫下攪拌。18小時後，濃縮混合物以移除四氫呋喃，接著添加飽和碳酸氫鈉水溶液及水。過濾懸浮液且固體進行急驟層析，得到標題化合物。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.55 (s, 1H), 8.25 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.64-7.67 (m, 2H), 7.31 (d, *J*=4.0 Hz, 1H), 7.30 (d, *J*=2.3 Hz, 1H), 7.26 (d, *J*=8.0 Hz, 1H), 5.19 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 4.71-4.78 (m, 4H), 4.52 (d, *J*=5.4 Hz, 2H), 3.15-3.25 (m, 2H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, *J*=7.4 Hz, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 354 (M+H)⁺。

實例 276

5-(胺基甲基)-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺

5-氟基-N-(4-(丙基胺甲鹽基)苯基)異吲哚啉-2-甲鹽胺(0.04 g, 0.115 mmol)及7 M氫-甲醇/四氫呋喃/甲醇(4 mL)添加至50 ml耐壓瓶中Ra-Ni 2800之水漿狀物(0.080 g, 1.363 mmol)中且在30 psi及室溫下攪拌16小時。混合物經由耐綸膜過濾，濃縮且藉由逆相HPLC純化，得到標題化合物。¹H NMR (300 MHz, 甲醇-*d*₄) δ ppm 7.76-7.79 (m, 2H), 7.60-7.63 (m, 2H), 7.31-7.35 (m, 3H), 4.82 (s, 4H), 3.86 (s, 2H), 3.30-3.33 (m, 2H), 1.53-1.75 (m, 2H), 0.98 (t, *J*=7.4 Hz, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 425 (M+H)⁺。

實例 277

5-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及2-羥基-2-甲基丙酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 9.59 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.25 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.62-7.68 (m, 2H), 7.59-7.64 (m, 1H), 7.28 (d, $J=8.3$ Hz, 1H), 5.71-5.75 (m, 1H), 4.72-4.80 (m, 4H), 3.16-3.23 (m, 2H), 1.42-1.59 (m, 2H), 1.36 (s, 6H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz, 3H); MS (ESI(+)) m/e 425 ($M+H$) $^+$ 。

實例 278

5-乙醯胺基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺 (0.035 g, 0.103 mmol)於二甲基甲醯胺(0.7 mL)中之溶液先後用N,N-二異丙基乙胺(0.018 mL, 0.103 mmol)及乙醯氯(0.011 g, 0.134 mmol)處理且反應溶液在室溫下攪拌16小時。濃縮反應物且藉由逆相HPLC純化，得到標題化合物。 ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 9.97 (s, 1H), 8.52 (s, 1H), 8.25 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.65-7.67 (m, 1H), 7.62-7.67 (m, 2H), 7.43 (dd, $J=8.2, 1.9$ Hz, 1H), 7.27 (d, $J=8.2$ Hz, 1H), 4.71-4.76 (m, 4H), 3.16-3.21 (m, 2H), 2.04 (s, 3H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz,

3H) ; MS (ESI(+)) m/e 381 (M+H)⁺。

實例 279

5-[(N,N-二甲基甘胺鹽基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲鹽基)苯基)異吲哚啉-2-甲鹽胺代替 3-苯基丙-1-胺及 2-(二甲基胺基)乙酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)苯甲酸製備。

¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.76 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.25 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.73 (d, *J*=1.8 Hz, 1H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.54 (dd, *J*=8.2, 1.9 Hz, 1H), 7.28 (d, *J*=8.2 Hz, 1H), 4.72-4.76 (m, 4H), 3.16-3.24 (m, 2H), 3.07 (s, 2H), 2.28 (s, 6H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, *J*=7.4 Hz, 3H) ; MS (ESI(-)) m/e 422 (M-H)⁻。

實例 280

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-5-(1H-吡唑-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺

在 4 mL 小瓶中，5-溴-N-(4-(丙基胺甲鹽基)苯基)異吲哚啉-2-甲鹽胺 (50 mg, 0.12 mmol) 及 1H-吡唑-3-基酮酸 (17 mg, 0.15 mmol) 於二甲基甲鹽胺中之溶液先後用飽和碳酸氫鈉水溶液及氯化雙(三苯膦)鉀(II) (7 mg) 處理。小瓶在氮氣下蓋上蓋子且反應物在 85°C 下加熱 6 小時。反應物冷卻至周圍溫度且添加水。所得懸浮液攪拌 5 分鐘且過濾。收集之固體用水洗滌且真空乾燥；固體藉由逆相 HPLC 純化，得到標題化合物。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ

ppm 12.39-13.18 (bs, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.24-8.28 (m, 1H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.70-7.80 (m, 3H), 7.62-7.69 (m, 2H), 7.40 (d, $J=7.9$ Hz, 1H), 6.73 (d, $J=2.2$ Hz, 1H), 4.79-4.83 (m, 4H), 3.15-3.25 (m, 2H), 1.46-1.57 (m, 2H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz, 3H); MS (ESI(+)) m/e 390 ($M+H$)⁺。

實例 281

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-5-(1H-吡啶-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-1H-吡啶代替 1H-吡啶-3-基酮酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 10.91-13.69 (bs, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.26 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 8.07-8.08 (bs, 2H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.67 (s, 1H), 7.54-7.65 (m, 2H), 7.57 (d, $J=7.8$ Hz, 1H), 7.34 (d, $J=7.8$ Hz, 1H), 4.76-4.79 (m, 4H), 3.15-3.25 (m, 2H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz, 3H); MS (ESI(+)) m/e 390 ($M+H$)⁺。

實例 282

5-[(甲氧基乙鹽基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 278 中所述，用 2-甲氧基乙鹽基氯代替乙鹽基製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.80 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.25 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 7.74-7.79 (m, 2H), 7.72-7.74 (m, 1H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.55 (dd, $J=8.2$, 1.9 Hz, 1H), 7.30 (d, $J=8.2$ Hz, 1H), 4.72-4.77 (m, 4H),

4.00 (s, 2H), 3.38 (s, 3H), 3.17-3.19 (m, 2H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz, 3H); MS (ESI(+)) m/e 411 ($M+H$)⁺。

實例 283

5-[(甲基磺醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺 (0.035 g, 0.103 mmol)、吡啶 (0.017 mL, 0.207 mmol) 及催化量之N,N-二甲基胺基吡啶於二甲基甲醯胺 (0.7 mL) 中之溶液冷卻至 0°C。添加甲烷磺醯氯 (0.014 g, 0.126 mmol) 且反應溶液在室溫下攪拌 2 小時。濃縮反應混合物且藉由逆相 HPLC 純化，得到標題化合物。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.74 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.26 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.63-7.66 (m, 2H), 7.32 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 7.14-7.20 (m, 2H), 4.73-4.76 (m, 4H), 3.15-3.25 (m, 2H), 2.98 (s, 3H), 1.45-1.62 (m, 2H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz, 3H); MS (ESI(+)) m/e 417 ($M+H$)⁺。

表 4.

以下實例基本上如實例 1 中所述，在實例 1A 中用 1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶、5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-*b*]吡啶或 6,7-二氫-5H-吡咯并[3,4-*d*]嘧啶代替異吲哚啉且如實例 1C 中所述使用適當胺製備。一些產物藉由急驟層析純化，而其他產物藉由逆相 HPLC 純化；一些化合物如實例 2D 中所述，在醯胺偶合後亦需要脫除 Boc 保護基。因此，一些

實例呈三氟乙酸鹽形式分離。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
285	N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.80 (t, <i>J</i> =6.0 Hz, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.80-7.84 (m, 2H), 7.65-7.69 (m, 2H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 6.48 (d, <i>J</i> =2.3 Hz, 2H), 6.37 (t, <i>J</i> =2.3 Hz, 1H), 4.81-4.85 (m, 4H), 4.39 (d, <i>J</i> =5.9 Hz, 2H), 3.31 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) ⁺
286	N-{4-[(4-氯苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.88 (t, <i>J</i> =6.0 Hz, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.80-7.84 (m, 2H), 7.65-7.69 (m, 2H), 7.32-7.45 (m, 5H), 4.78-4.88 (m, 4H), 4.44 (d, <i>J</i> =5.9 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) ⁺
287	N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.61-8.64 (m, 2H), 8.51 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.13 (ddd, <i>J</i> =4.9, 2.0, 0.8 Hz, 1H), 7.64-7.68 (m, 2H), 7.56 (ddd, <i>J</i> =8.7, 7.0, 1.9 Hz, 1H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.36-7.40 (m, 2H), 6.85 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 1H), 6.65-6.69 (m, 1H), 4.81-4.85 (m, 4H), 3.53-3.63 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 429 (M+H) ⁺
288	N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.61-8.64 (m, 2H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.27-8.31 (m, 1H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.15-7.31 (m, 5H), 4.76-4.89 (m, 4H), 3.20-3.32 (m, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> =7.6 Hz, 2H), 1.77-1.88 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 401 (M+H) ⁺
289	N-{4-[(四氫呋喃-3-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.65 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.39 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.63-7.68 (m, 2H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 4.81-4.84 (m, 4H), 3.57-3.78 (m, 3H), 3.48 (dd, <i>J</i> =8.5, 5.3 Hz, 1H), 3.14-3.30 (m, 2H), 2.41-2.51 (m, 1H), 1.87-2.12 (m, 1H), 1.54-1.66 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) ⁺
290	N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.61-8.64 (m, 2H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.21 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.74-1.78 (m, 2H), 7.62-7.66 (m, 2H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 4.81-4.84 (m, 4H), 3.20-3.33 (m, 2H), 1.53-1.69 (m, 1H), 1.37-1.45 (m, 2H), 0.91 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 353 (M+H) ⁺
426	N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.65 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.33 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.76-7.81 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 4.76-4.89 (m, 4H), 3.96 (p, <i>J</i> =6.3 Hz, 1H), 3.73-3.82 (m, 1H), 3.58-3.67 (m, 1H), 3.26-3.35 (m, 2H), 1.73-1.98 (m, 3H), 1.52-1.66 (m, 1H)	(ESI(-)) m/e 367 (M+H) ⁻
427	N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.63-8.65 (bs, 1H), 8.61-8.62 (bs, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0	(ESI(-)) m/e 411

	基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.32 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.76-7.81 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 4.81-4.88 (m, 4H), 3.97 (p, <i>J</i> =6.2 Hz, 1H), 3.74-3.82 (m, 1H), 3.58-3.66 (m, 1H), 3.26-3.32 (m, 2H), 1.74-1.96 (m, 3H), 1.53-1.64 (m, 1H)	(M-H) ⁺
430	N-(4-{(3-甲基丁基)氨基}羰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 9.10-9.12 (bs, 1H), 8.83 (s, 1H), 8.67 (s, 1H), 8.22 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 4.81-4.84 (m, 4H), 3.20-3.34 (m, 2H), 1.53-1.69 (m, 1H), 1.37-1.45 (m, 2H), 0.91 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 6H)	(APCI(+)) m/e 354 (M+H) ⁺
431	N-(4-{(3-苯基丙基)氨基}羰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 9.11 (s, 1H), 8.83 (s, 1H), 8.68 (s, 1H), 8.30 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.76-7.80 (m, 2H), 7.64-7.68 (m, 2H), 7.15-7.32 (m, 5H), 4.77-4.89 (m, 4H), 3.21-3.34 (m, 2H), 2.60-2.74 (m, 2H), 2.29-1.90 (m, 2H)	(APCI(+)) m/e 402 (M+H) ⁺
437	N-[4-({[(1S)-2-羟基-1-苯基乙基]氨基}羰基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.66 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.51 (d, <i>J</i> =2.0 Hz, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 7.82-7.87 (m, 2H), 7.66-7.70 (m, 2H), 7.38-7.45 (m, 3H), 7.29-7.34 (m, 2H), 7.19-7.26 (m, 1H), 5.03-5.10 (m, 1H), 4.90 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 4.79-4.87 (m, 4H), 3.61-3.76 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 403 (M+H) ⁺
445	N-[4-({[(1S)-2-羟基-1-吡啶-2-基乙基]氨基}羰基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.68 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.44-8.54 (m, 3H), 7.84-7.89 (m, 2H), 7.75 (td, <i>J</i> =7.7, 1.8 Hz, 1H), 7.66-7.72 (m, 2H), 7.39-7.45 (m, 2H), 7.26 (ddd, <i>J</i> =7.5, 4.8, 1.2 Hz, 1H), 5.10-5.17 (m, 1H), 4.90 (t, <i>J</i> =6.0 Hz, 1H), 4.79-4.87 (m, 4H), 3.73-3.88 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 404 (M+H) ⁺
446	N-(4-{(3-甲基丁基)氨基}羰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.62 (s, 1H), 8.48 (dd, <i>J</i> =4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.22 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.81 (dd, <i>J</i> =7.7, 1.5 Hz, 1H), 7.73-7.79 (m, 2H), 7.64-7.68 (m, 2H), 7.33 (dd, <i>J</i> =7.7, 4.9 Hz, 1H), 4.78-4.80 (bs, 4H), 3.21-3.33 (m, 2H), 1.61 (dp, <i>J</i> =13.3, 6.6 Hz, 1H), 1.41 (q, <i>J</i> =7.1 Hz, 2H), 0.90 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 353 (M+H) ⁺
447	N-(4-{(四氢呋喃-3-基甲基)氨基}羰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.63 (s, 1H), 8.48 (dd, <i>J</i> =4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.39 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 7.76-7.83 (m, 3H), 7.65-7.69 (m, 2H), 7.33 (dd, <i>J</i> =7.7, 4.9 Hz, 1H), 4.78-4.81 (bs, 4H), 3.57-3.82 (m, 3H), 3.44-3.51 (m, 1H), 3.17-3.28 (m, 2H), 2.42-2.50 (m, 1H), 1.85-2.02 (m, 1H), 1.54-1.68 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) ⁺
448	N-{4-[(4-吡啶-2-基哌嗪-1-基)羰基}苯基}-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.61 (s, 1H), 8.49 (dd, <i>J</i> =4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.13 (dd, <i>J</i> =5.0, 1.9 Hz, 1H), 7.81 (dd, <i>J</i> =7.7, 1.5 Hz, 1H), 7.66-7.70 (m, 2H), 7.56 (ddd, <i>J</i> =8.7, 7.0, 1.8 Hz, 1H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.34 (dd, <i>J</i> =7.7, 5.0 Hz, 1H), 6.85 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 1H), 6.67 (dd,	(ESI(+)) m/e 429 (M+H) ⁺

N-[4-(環戊基胺甲鹽基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○

5-氟-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-氟基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

		$J=6.9, 4.8 \text{ Hz, 1H}$), 4.79-4.81 (bs, 4H), 3.43-3.75 (m, 8H)	
553	N-{4-[(四氢-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.64 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0 \text{ Hz, 1H}$), 8.29 (t, $J=5.8 \text{ Hz, 1H}$), 7.82-7.75 (m, 2H), 7.68-7.61 (m, 2H), 7.44 (d, $J=5.1 \text{ Hz, 1H}$), 4.86-4.79 (m, 4H), 3.87 (dd, $J=11.3, 3.0 \text{ Hz, 1H}$), 3.48-3.34 (m, 2H), 3.28-3.17 (m, 2H), 1.82-1.72 (m, 1H), 1.66-1.56 (m, 1H), 1.56-1.33 (m, 3H), 1.28-1.07 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 381 (M+H) $^+$
554	N-{4-[(四氢-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.63 (d, $J=8.3 \text{ Hz, 2H}$), 8.50 (d, $J=5.0 \text{ Hz, 1H}$), 8.28 (t, $J=5.7 \text{ Hz, 1H}$), 7.77 (d, $J=8.8 \text{ Hz, 2H}$), 7.65 (d, $J=8.8 \text{ Hz, 2H}$), 7.44 (d, $J=5.0 \text{ Hz, 1H}$), 4.83 (d, $J=4.3 \text{ Hz, 4H}$), 3.82-3.64 (m, 2H), 3.18-3.04 (m, 3H), 1.78 (dd, $J=6.9, 3.6 \text{ Hz, 2H}$), 1.58 (dd, $J=10.2, 6.6 \text{ Hz, 1H}$), 1.53-1.36 (m, 1H), 1.31-1.17 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 381 (M+H) $^+$
555	N-{4-[(四氢-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.66-8.59 (m, 2H), 8.50 (d, $J=5.0 \text{ Hz, 1H}$), 8.33-8.25 (m, 1H), 7.81-7.74 (m, 2H), 7.69-7.61 (m, 2H), 7.44 (d, $J=5.0 \text{ Hz, 1H}$), 4.82 (bs, 4H), 3.89-3.79 (m, 2H), 3.24 (d, $J=11.6 \text{ Hz, 1H}$), 3.14 (t, $J=6.1 \text{ Hz, 2H}$), 1.86-1.69 (m, 1H), 1.64-1.54 (m, 2H), 1.27-1.06 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 381 (M+H) $^+$
556	N-(4-{[(2S)-1-羟基-4-甲基戊-2-基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.66-8.59 (m, 2H), 8.50 (d, $J=5.0 \text{ Hz, 1H}$), 7.83-7.75 (m, 3H), 7.69-7.61 (m, 2H), 7.44 (d, $J=5.1 \text{ Hz, 1H}$), 4.91-4.80 (m, 4H), 4.64 (t, $J=5.7 \text{ Hz, 1H}$), 4.12-3.99 (m, 1H), 3.41 (d, $J=5.3 \text{ Hz, 1H}$), 1.69-1.54 (m, 1H), 1.53-1.31 (m, 2H), 0.88 (t, $J=6.7 \text{ Hz, 6H}$)	(ESI(+)) m/e 383 (M+H) $^+$
599	N-[4-(丙基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.62 (d, $J=4.9 \text{ Hz, 2H}$), 8.50 (d, $J=5.0 \text{ Hz, 1H}$), 8.30-8.20 (m, 1H), 7.83-7.72 (m, 2H), 7.68-7.59 (m, 2H), 7.44 (d, $J=5.1 \text{ Hz, 1H}$), 4.87-4.77 (m, 4H), 3.22-3.13 (m, 2H), 1.61-1.45 (m, 2H), 0.89 (t, $J=7.4 \text{ Hz, 3H}$)	(ESI(+)) m/e 325 (M+H) $^+$
600	N-(4-{[(2S)-四氢呋喃-2-基甲基]胺甲酰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.63 (s, 1H), 8.48 (dd, $J=4.9, 1.5 \text{ Hz, 1H}$), 8.34 (t, $J=5.8 \text{ Hz, 1H}$), 7.85-7.75 (m, 3H), 7.70-7.63 (m, 2H), 7.33 (dd, $J=7.7, 4.9 \text{ Hz, 1H}$), 4.80 (bs, 4H), 3.97 (p, $J=6.2 \text{ Hz, 1H}$), 3.83-3.72 (m, 1H), 3.68-3.57 (m, 1H), 3.28 (dd, $J=5.9, 1.7 \text{ Hz, 1H}$), 1.98-1.72 (m, 3H), 1.66-1.51 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) $^+$
601	N-(4-{[(2R)-四氢呋喃-2-基甲基]胺甲酰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.62 (s, 1H), 8.48 (dd, $J=4.9, 1.5 \text{ Hz, 1H}$), 8.32 (t, $J=5.8 \text{ Hz, 1H}$), 7.85-7.75 (m, 3H), 7.70-7.63 (m, 2H), 7.33 (dd, $J=7.7, 4.9 \text{ Hz, 1H}$), 4.80 (bs, 4H), 3.97 (p, $J=6.2 \text{ Hz, 1H}$), 3.83-3.72 (m, 1H), 3.68-3.57 (m, 1H), 1.98-1.72 (m, 3H), 1.69-1.51 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) $^+$
602	N-(4-{[(2S)-1-羟基-	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.61 (s, 1H),	(ESI(+))

	4-甲基戊-2-基]胺甲 醯基}苯基}-5,7-二 氮-6H-吡咯并[3,4-b] 吡啶-6-甲醯胺	8.48 (dd, $J=4.9, 1.5$ Hz, 1H), 7.87-7.71 (m, 4H), 7.70-7.63 (m, 2H), 7.33 (dd, $J=7.7, 4.9$ Hz, 1H), 4.79 (bs, 4H), 4.13-3.95 (m, 1H), 3.42 (dd, $J=10.6, 5.4$ Hz, 2H), 1.72-1.54 (m, 1H), 1.53-1.31 (m, 2H), 0.88 (t, $J=6.7$ Hz, 6H)	m/e 383 (M+H) ⁺
603	N-(4-{[(1S)-2-羥基- 1-苯基乙基]胺甲醯 基}苯基}-5,7-二氮- 6H-吡咯并[3,4-b]吡 啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.64 (s, 1H), 8.53-8.45 (m, 2H), 7.88-7.78 (m, 3H), 7.73-7.66 (m, 2H), 7.47-7.27 (m, 5H), 7.27-7.18 (m, 1H), 5.12-5.01 (m, 1H), 4.90 (t, $J=5.8$ Hz, 1H), 4.80 (bs, 4H), 3.78-3.59 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 403 (M+H) ⁺
604	N-{4-[(四氮-2H-哌 喃-4-基甲基)胺甲醯 基}苯基}-5,7-二氮- 6H-吡咯并[3,4-b]吡 啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.62 (s, 1H), 8.48 (dd, $J=4.9, 1.5$ Hz, 1H), 8.30 (t, $J=5.8$ Hz, 1H), 7.85-7.74 (m, 3H), 7.70-7.63 (m, 2H), 7.33 (dd, $J=7.7, 4.9$ Hz, 1H), 4.79 (bs, 4H), 3.89-3.79 (m, 2H), 3.28-3.19 (m, 2H), 3.14 (t, $J=6.3$ Hz, 2H), 1.87-1.70 (m, 1H), 1.64-1.54 (m, 2H), 1.29-1.01 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 381 (M+H) ⁺
613	N-(4-{[(1S)-2-羥基- 1-(吡啶-2-基)乙基] 胺甲醯基}苯基}-5,7- 二氮-6H-吡咯并[3,4- b]吡啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.65 (s, 1H), 8.55-8.51 (m, 1H), 8.47 (t, $J=6.7$ Hz, 2H), 7.87 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.84-7.79 (m, 1H), 7.76 (dd, $J=7.7, 1.8$ Hz, 1H), 7.71 (t, $J=5.4$ Hz, 2H), 7.41 (d, $J=7.8$ Hz, 1H), 7.33 (dd, $J=7.7, 4.9$ Hz, 1H), 7.29-7.22 (m, 1H), 5.19-5.09 (m, 1H), 4.90 (t, $J=5.9$ Hz, 1H), 4.80 (bs, 4H), 3.90-3.72 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 404 (M+H) ⁺
627	N-{4-[(4-羥基哌啶- 1-基)羧基}苯基}- 1,3-二氮-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (d, $J=5.9$ Hz, 2H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.62 (d, 2H), 7.44 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.30 (d, 2H), 4.82 (d, $J=4.3$ Hz, 4H), 4.76 (d, $J=4.0$ Hz, 1H), 3.73 (td, $J=8.3, 4.2$ Hz, 2H), 3.22-3.08 (m, 2H), 1.82-1.65 (m, 2H), 1.43-1.26 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) ⁺
628	N-{4-[(2-羥基-2-甲 基丙基)胺甲醯基}苯 基}-1,3-二氮-2H-吡 咯并[3,4-c]吡啶-2-甲 醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.64 (d, $J=12.5$ Hz, 2H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.06 (t, $J=6.0$ Hz, 1H), 7.80 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.66 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.44 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 4.83 (d, $J=4.3$ Hz, 4H), 4.56 (s, 1H), 3.24 (d, $J=6.0$ Hz, 2H), 2.89 (s, 1H), 1.10 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 355 (M+H) ⁺
629	N-{4-[(4-羥基丁基) 胺甲醯基}苯基}-1,3- 二氮-2H-吡咯并[3,4- c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.62 (d, $J=6.4$ Hz, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.26 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.76 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.64 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 4.82 (d, $J=4.3$ Hz, 1H), 4.39 (t, $J=5.1$ Hz, 1H), 3.41 (q, $J=6.1$ Hz, 1H), 3.25-3.15 (m, 2H), 1.59-1.38 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 355 (M+H) ⁺
630	N-(4-{[(2S)-1-羥基- 3-甲基丁-2-基]胺甲 醯基}苯基)-1,3-二 氮-2H-吡咯并[3,4-c] 吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.62 (d, $J=6.0$ Hz, 2H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.83-7.77 (m, 2H), 7.74 (d, $J=8.9$ Hz, 1H), 7.64 (d, $J=1.8$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 4.83 (d, $J=4.3$ Hz, 4H), 4.53 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 1H), 3.51 (t, $J=5.8$ Hz, 2H), 1.92 (dq, $J=13.6, 6.8$ Hz, 1H), 0.89 (dd, $J=7.9, 6.9$ Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 369 (M+H) ⁺
631	N-{4-[(1-羥基-2-甲	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.62 (d, $J=4.0$	(ESI(+))

	基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.73 (d, <i>J</i> =8.9 Hz, 1H), 7.64 (d, <i>J</i> =8.9 Hz, 1H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.35 (s, 1H), 4.94 (t, <i>J</i> =5.9 Hz, 1H), 4.82 (d, <i>J</i> =4.3 Hz, 1H), 3.49 (d, <i>J</i> =6.0 Hz, 2H), 1.31 (s, 6H)	m/e 355 (M+H) ⁺
632	N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.63 (d, <i>J</i> =9.3 Hz, 2H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.21 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 7.79 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 2H), 7.65 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 2H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 4.83 (d, <i>J</i> =4.2 Hz, 4H), 4.72 (d, <i>J</i> =4.7 Hz, 1H), 3.77 (dt, <i>J</i> =11.9, 6.1 Hz, 1H), 3.24-3.09 (m, 2H), 3.05 (s, 1H), 1.06 (d, <i>J</i> =6.2 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 341 (M+H) ⁺
633	N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.63 (d, <i>J</i> =8.5 Hz, 2H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.20 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 7.79 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 1H), 7.65 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 1H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 4.83 (d, <i>J</i> =4.3 Hz, 4H), 4.72 (d, <i>J</i> =4.7 Hz, 1H), 3.87-3.68 (m, 1H), 3.17 (ddd, <i>J</i> =15.1, 9.4, 3.6 Hz, 2H), 1.06 (d, <i>J</i> =6.3 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 341 (M+H) ⁺
634	N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.63 (d, <i>J</i> =11.4 Hz, 2H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.35 (t, <i>J</i> =5.4 Hz, 1H), 7.76 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 2H), 7.65 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 2H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 4.82 (d, <i>J</i> =4.3 Hz, 4H), 2.37-2.22 (m, 6H), 1.72-1.59 (m, 10H), 1.54-1.43 (m, 20H), 1.38 (d, <i>J</i> =4.8 Hz, 10H)	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) ⁺
635	N-[4-(5,6-二氫咪唑并[1,5-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.64 (d, <i>J</i> =11.8 Hz, 2H), 8.51 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.68 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.43 (t, <i>J</i> =6.9 Hz, 3H), 4.83 (d, <i>J</i> =4.3 Hz, 4H), 4.74 (s, 2H), 4.12 (t, <i>J</i> =5.4 Hz, 2H), 3.84 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 389 (M+H) ⁺
686	N-[4-(嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.69 (s, 1H), 8.55 (d, <i>J</i> =3.7, 2H), 7.72 (d, <i>J</i> =5.6, 1H), 7.48-7.39 (m, 2H), 7.21-7.11 (m, 2H), 4.76 (d, <i>J</i> =23.4, 4H), 3.40 (s, 8H)	(ESI(+)) m/e 353 (M+H) ⁺
687	N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.88 (s, 1H), 8.76 (d, <i>J</i> =5.7, 2H), 8.29 (t, <i>J</i> =5.7, 1H), 7.91 (d, <i>J</i> =5.7, 1H), 7.78 (m, 2H), 7.65 (m, 2H), 4.98 (bs, 2H), 4.94 (bs, 2H), 3.35 (t, <i>J</i> =7.0, 2H), 3.22 (m, 4H), 2.22 (t, <i>J</i> =8.0, 2H), 1.92 (m, 2H), 1.70 (p, <i>J</i> =7.0, 2H)	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) ⁺
723	N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-D ₂ O) δ ppm 8.89 (s, 1 H) 8.78 (d, <i>J</i> =6.10 Hz, 1 H) 8.02 (d, <i>J</i> =5.80 Hz, 1 H) 7.76-7.81 (m, 2 H) 7.62-7.66 (m, 2 H) 5.01 (d, <i>J</i> =30.82 Hz, 4 H) 3.54-3.63 (m, 1 H) 3.49 (t, <i>J</i> =6.10 Hz, 2 H) 3.38 (t, <i>J</i> =6.10 Hz, 2 H) 1.09 (d, <i>J</i> =6.10 Hz, 6 H)	(ESI(+)) m/e 369 (M+H) ⁺
724	N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-D ₂ O) δ ppm 8.89 (s, 1 H) 8.79 (d, <i>J</i> =6.10 Hz, 1 H) 8.04 (d, <i>J</i> =5.80 Hz, 1 H) 7.60 (d, <i>J</i> =8.54 Hz, 2 H) 7.32 (d,	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) ⁺

	1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$J=7.63$ Hz, 2 H) 4.95-5.07 (m, 4 H) 3.44 (s, 2 H) 2.89-2.96 (m, 3 H) 1.44 (s, 3 H) 0.83 (d, $J=107.41$ Hz, 6 H)	
725	N-[4-(氮雜環丁烷-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.84 (s, 1 H) 8.74 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.94 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.60-7.64 (m, 2 H) 7.56-7.59 (m, 2 H) 4.98 (d, $J=24.72$ Hz, 4 H) 4.34 (s, 2 H) 4.05 (d, $J=6.71$ Hz, 2 H) 2.22-2.33 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 323 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
726	N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺		
727	N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺		
728	N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.90 (s, 1 H) 8.80 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 8.05 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.80-7.85 (m, 2 H) 7.61-7.68 (m, 2 H) 7.27 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 7.05 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 5.02 (d, $J=33.26$ Hz, 4 H) 4.40 (s, 2 H) 3.76-3.81 (m, 4 H) 3.16-3.19 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 458 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
729	N-{4-[(環丙基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.90 (s, 1 H) 8.79 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 8.04 (d, $J=6.10$ Hz, 1 H) 7.78-7.82 (m, 2 H) 7.62-7.67 (m, 2 H) 5.02 (d, $J=31.73$ Hz, 4 H) 3.14 (d, $J=7.02$ Hz, 2 H) 0.99-1.08 (m, 1 H) 0.40-0.48 (m, 2 H) 0.21-0.26 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 337 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
730	N-{4-[甲基(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.89 (s, 1 H) 8.79 (d, $J=6.10$ Hz, 1 H) 8.04 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.57-7.64 (m, 2 H) 7.25-7.38 (m, 2 H) 5.01 (d, $J=32.04$ Hz, 4 H) 3.17-3.45 (m, 2 H) 2.93 (s, 3 H) 1.53 (d, $J=7.32$ Hz, 2 H) 0.64-0.97 (m, 3 H)	(ESI(+)) m/e 339 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
731	N-[4-(異丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.90 (s, 1 H) 8.79 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 8.04 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.77-7.81 (m, 2 H) 7.60-7.65 (m, 2 H) 5.02 (d, $J=31.73$ Hz, 4 H) 3.08 (d, $J=7.02$ Hz, 2 H) 1.79-1.89 (m, 1 H) 0.89 (d, $J=6.71$ Hz, 6 H)	(ESI(+)) m/e 339 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
732	N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.84 (s, 1 H) 8.74 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.94 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.76-7.79 (m, 2 H) 7.61-7.65 (m, 2 H) 4.98 (d, $J=24.41$ Hz, 4 H) 3.25 (t, $J=7.02$ Hz, 2 H) 1.46-1.55 (m, 2 H) 1.28-1.38 (m, 2 H) 0.90 (t, $J=7.32$ Hz, 3 H)	(ESI(+)) m/e 339 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
733	N-{4-[(2-甲氧基乙	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.88 (s, 1 H) 8.78 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 8.02 (d, $J=5.80$	(ESI(+)) m/e 341

	基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-D ₂ O) δ ppm 7.77-7.81 (m, 2 H) 7.60-7.65 (m, 2 H) 5.01 (d, <i>J</i> =29.90 Hz, 4 H) 3.40-3.50 (m, 4 H) 3.27 (s, 3 H)	(M+H) ⁺
734	N-[4-(環戊基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-D ₂ O) δ ppm 8.89 (s, 1 H) 8.79 (d, <i>J</i> =5.80 Hz, 1 H) 8.03 (d, <i>J</i> =6.10 Hz, 1 H) 7.77-7.81 (m, 2 H) 7.60-7.65 (m, 2 H) 5.01 (d, <i>J</i> =31.43 Hz, 4 H) 4.14-4.25 (m, 1 H) 1.82-1.99 (m, 2 H) 1.64-1.78 (m, 2 H) 1.47-1.58 (m, 4 H)	(ESI(+)) m/e 351 (M+H) ⁺
735	N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-D ₂ O) δ ppm 8.90 (s, 1 H) 8.80 (d, <i>J</i> =6.10 Hz, 1 H) 8.05 (d, <i>J</i> =6.10 Hz, 1 H) 7.79-7.83 (m, 2 H) 7.61-7.67 (m, 2 H) 5.02 (d, <i>J</i> =32.65 Hz, 4 H) 4.39-4.50 (m, 1 H) 3.85-3.90 (m, 2 H) 3.70-3.76 (m, 1 H) 3.58 (dd, <i>J</i> =8.85, 4.27 Hz, 1 H) 2.11-2.23 (m, 1 H) 1.89-1.97 (m, 1 H)	(ESI(+)) m/e 353 (M+H) ⁺
736	N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-D ₂ O) δ ppm 8.90 (s, 1 H) 8.79 (d, <i>J</i> =6.10 Hz, 1 H) 8.04 (d, <i>J</i> =5.80 Hz, 1 H) 7.60 (d, <i>J</i> =8.54 Hz, 2 H) 7.34 (d, <i>J</i> =8.54 Hz, 2 H) 5.01 (d, <i>J</i> =31.73 Hz, 4 H) 3.51 (d, <i>J</i> =66.52 Hz, 4 H) 3.15-3.34 (m, 3 H) 2.94-3.02 (m, 3 H)	(ESI(+)) m/e 355 (M+H) ⁺
737	N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-D ₂ O) δ ppm 8.89 (s, 1 H) 8.79 (d, <i>J</i> =5.49 Hz, 1 H) 8.03 (d, <i>J</i> =6.10 Hz, 1 H) 7.77-7.81 (m, 2 H) 7.61-7.65 (m, 2 H) 5.02 (d, <i>J</i> =31.12 Hz, 4 H) 4.15-4.23 (m, 1 H) 3.42 (dd, <i>J</i> =9.61, 6.56 Hz, 1 H) 3.30 (dd, <i>J</i> =9.61, 5.95 Hz, 1 H) 3.27 (s, 3 H) 1.14 (d, <i>J</i> =6.71 Hz, 3 H)	(ESI(+)) m/e 355 (M+H) ⁺
738	N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-D ₂ O) δ ppm 8.88 (s, 1 H) 8.78 (d, <i>J</i> =5.80 Hz, 1 H) 8.01 (d, <i>J</i> =5.80 Hz, 1 H) 7.74-7.80 (m, 2 H) 7.60-7.66 (m, 2 H) 5.01 (d, <i>J</i> =29.29 Hz, 4 H) 3.18 (d, <i>J</i> =7.32 Hz, 2 H) 2.08-2.21 (m, 1 H) 1.45-1.72 (m, 6 H) 1.21-1.29 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 365 (M+H) ⁺
739	N-{4-[(2-噻吩基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-D ₂ O) δ ppm 8.86 (s, 1 H) 8.76 (d, <i>J</i> =5.80 Hz, 1 H) 7.98 (d, <i>J</i> =5.80 Hz, 1 H) 7.79-7.85 (m, 2 H) 7.63-7.68 (m, 2 H) 7.37 (dd, <i>J</i> =5.19, 1.22 Hz, 1 H) 7.03 (dd, <i>J</i> =3.36, 1.22 Hz, 1 H) 6.97 (dd, <i>J</i> =5.19, 3.36 Hz, 1 H) 5.00 (d, <i>J</i> =27.16 Hz, 4 H) 4.62 (s, 2 H)	(ESI(+)) m/e 379 (M+H) ⁺
740	N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-D ₂ O) δ ppm 8.89 (s, 1 H) 8.78 (d, <i>J</i> =5.80 Hz, 1 H) 8.02 (d, <i>J</i> =5.80 Hz, 1 H) 7.60 (d, <i>J</i> =8.54 Hz, 2 H) 7.34 (d, <i>J</i> =4.58 Hz, 2 H) 5.01 (d, <i>J</i> =30.21 Hz, 4 H) 3.93-4.23 (m, 2 H) 3.17-3.72 (m, 3 H) 3.00 (s, 3 H) 1.18-2.07 (m, 4 H)	(ESI(+)) m/e 381 (M+H) ⁺
741	N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并	¹ H NMR (500 MHz, DMSO-D ₂ O) δ ppm 8.89 (s, 1 H) 8.79 (d, <i>J</i> =6.10 Hz, 1 H) 8.03 (d, <i>J</i> =5.80 Hz, 1 H) 7.75-7.79 (m, 2 H) 7.61-7.67 (m, 2 H) 5.01 (d, <i>J</i> =31.43 Hz, 4 H) 3.50-3.57 (m, 1 H)	(ESI(+)) m/e 383 (M+H) ⁺

	[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	3.42 (t, $J=6.26$ Hz, 2 H) 3.31 (t, $J=7.02$ Hz, 2 H) 1.69-1.78 (m, 2 H) 1.09 (d, $J=6.10$ Hz, 6H)	
742	N-{4-[苯甲基(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.89 (s, 1 H) 8.78 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 8.03 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.61 (s, 2 H) 7.12-7.47 (m, 7 H) 5.00 (d, $J=31.12$ Hz, 4 H) 4.49-4.74 (m, 2 H) 2.89 (s, 3 H)	(ESI(+)) m/e 387 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
743	N-{4-[(3-胺基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.84 (s, 1 H) 8.73 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.92 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.83-7.86 (m, 2 H) 7.64-7.68 (m, 2 H) 7.43 (t, $J=7.78$ Hz, 1 H) 7.30 (d, $J=7.93$ Hz, 1 H) 7.21 (s, 1 H) 7.13-7.16 (m, 1 H) 4.98 (d, $J=23.19$ Hz, 4 H) 4.49 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 386 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
744	N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.88 (s, 1 H) 8.77 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 8.48 (d, $J=2.44$ Hz, 1 H) 7.98-8.07 (m, 2 H) 7.89-7.95 (m, 2 H) 7.69-7.74 (m, 2 H) 6.87 (d, $J=8.85$ Hz, 1 H) 5.02 (d, $J=29.29$ Hz, 4 H) 3.83-3.88 (m, 3 H)	(ESI(+)) m/e 390 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
745	N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.87 (s, 1 H) 8.76 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.99 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.74-7.80 (m, 2 H) 7.61-7.66 (m, 2 H) 5.00 (d, $J=28.07$ Hz, 4 H) 3.43 (t, $J=6.26$ Hz, 2 H) 3.31 (t, $J=7.02$ Hz, 2 H) 3.15 (d, $J=6.71$ Hz, 2 H) 1.71-1.81 (m, 3 H) 0.86 (d, $J=6.71$ Hz, 6 H)	(ESI(+)) m/e 397 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
746	N-{4-[(雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.87 (s, 1 H) 8.78 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 8.02 (d, $J=6.10$ Hz, 1 H) 7.57-7.61 (m, 2 H) 7.29-7.33 (m, 2 H) 5.00 (d, $J=30.82$ Hz, 4 H) 3.34-3.58 (m, 8 H) 3.12-3.32 (m, 6 H)	(ESI(+)) m/e 399 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
747	N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.84 (s, 1 H) 8.74 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.93 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.79-7.83 (m, 2 H) 7.62-7.66 (m, 2 H) 7.23-7.30 (m, 2 H) 6.86-6.93 (m, 2 H) 4.98 (d, $J=24.11$ Hz, 4 H) 4.40 (s, 2 H) 3.73 (s, 3 H)	(ESI(+)) m/e 403 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
748	N-{4-[(3-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.87 (s, 1 H) 8.77 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 8.00 (d, $J=6.10$ Hz, 1 H) 7.81-7.86 (m, 2 H) 7.63-7.68 (m, 2 H) 7.26 (t, $J=7.93$ Hz, 1 H) 6.80-6.92 (m, 3 H) 5.01 (d, $J=28.99$ Hz, 4 H) 4.44 (s, 2 H) 3.74 (s, 3 H)	(ESI(+)) m/e 403 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
749	N-(4-{[4-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.88 (s, 1 H) 8.78 (d, $J=6.10$ Hz, 1 H) 8.02 (d, $J=6.10$ Hz, 1 H) 7.59-7.65 (m, 2 H) 7.32-7.38 (m, 2 H) 5.01 (d, $J=30.51$ Hz, 4 H) 4.55 (d, $J=47.91$ Hz, 2 H) 2.75-3.24 (m, 2 H) 2.59-2.68 (m, 1 H) 1.87 (s, 2 H) 1.34-1.49 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 419 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
750	N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.90 (s, 1 H) 8.79 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 8.32 (d, $J=1.22$ Hz, 1 H) 8.13 (dd, $J=2.59, 1.37$ Hz, 1 H) 8.05 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 7.88 (d, $J=2.75$ Hz, 1 H) 7.61-7.68 (m, 2 H) 7.38-7.45 (m, 2 H) 5.02 (d,	(ESI(+)) m/e 430 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$

		$J=32.34$ Hz, 4 H) 3.44-3.76 (m, 8 H)	
751	N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.88 (s, 1 H) 8.78 (d, $J=6.10$ Hz, 1 H) 8.01 (d, $J=6.10$ Hz, 1 H) 7.57-7.69 (m, 2 H) 7.36-7.49 (m, 2 H) 5.01 (d, $J=29.29$ Hz, 4 H) 3.96 (s, 1 H) 3.23-3.67 (m, 4 H) 2.98-3.27 (m, 4 H) 1.04-2.15 (m, 10 H)	(ESI(+)) m/e 434 (M+H) $^+$
752	N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- D_2O) δ ppm 8.88 (s, 1 H) 8.77 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 8.01 (d, $J=6.10$ Hz, 1 H) 7.73-7.80 (m, 2 H) 7.58-7.68 (m, 2 H) 6.84-6.89 (m, 2 H) 6.77 (dd, $J=8.09$, 1.98 Hz, 1 H) 5.01 (d, $J=29.90$ Hz, 4 H) 3.96 (s, 1 H) 3.70-3.73 (m, 6 H) 3.46 (t, $J=7.32$ Hz, 2 H) 2.78 (t, $J=7.32$ Hz, 2 H)	(ESI(+)) m/e 447 (M+H) $^+$
770	N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.70-7.78 (m, 2 H) 7.57-7.65 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 4.80-4.87 (m, 4 H) 3.30-3.34 (m, 2 H) 2.28-2.40 (m, 2 H) 2.17-2.21 (m, 6 H) 1.61-1.75 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) $^+$
771	N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.69-7.79 (m, 2 H) 7.57-7.64 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 4.80-4.87 (m, 4 H) 3.54-3.62 (m, 4 H) 3.31-3.34 (m, 2 H) 2.34-2.42 (m, 6 H) 1.65-1.76 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 410 (M+H) $^+$
772	N-(4-{[4-(2-胺基乙基)-1H-咪唑-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.71-7.76 (m, 2 H) 7.57-7.66 (m, 2 H) 7.52 (s, 1 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 6.82 (s, 1 H) 4.78-4.86 (m, 4 H) 3.51 (t, $J=7.32$ Hz, 2 H) 2.80 (t, $J=7.02$ Hz, 2 H)	(ESI(+)) m/e 377 (M+H) $^+$
773	N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.56-7.62 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.27-7.33 (m, 2 H) 4.79-4.87 (m, 4 H) 3.40-3.60 (m, 10 H) 2.53-2.57 (m, 2 H) 2.43-2.50 (m, 4 H)	(ESI(+)) m/e 440 (M+H) $^+$
774	N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.71-7.78 (m, 2 H) 7.58-7.63 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 4.78-4.89 (m, 4 H) 3.51 (t, $J=6.26$ Hz, 2 H) 3.34 (t, $J=6.87$ Hz, 2 H) 1.65-1.79 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 341 (M+H) $^+$
775	N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.71-7.77 (m, 2 H) 7.58-7.64 (m, 2 H) 7.42 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 4.79-4.88 (m, 4 H) 3.27 (t, $J=6.87$ Hz, 2 H) 2.26-2.33 (m, 2 H) 2.16 (s, 6 H) 1.41-1.61 (m, 4 H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) $^+$

776	N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1 H) 8.46-8.50 (m, 3 H) 7.79-7.84 (m, 2 H) 7.62-7.67 (m, 2 H) 7.42 (d, J=4.88 Hz, 1 H) 7.31 (d, J=6.10 Hz, 2 H) 4.84 (d, J=7.02 Hz, 4 H) 4.49 (s, 2 H)	(ESI(+)) m/e 374 (M+H) ⁺
777	N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.54 (d, J=1.83 Hz, 1 H) 8.48 (d, J=5.19 Hz, 1 H) 8.43 (dd, J=4.88, 1.53 Hz, 1 H) 7.77-7.82 (m, 2 H) 7.71-7.75 (m, 1 H) 7.60-7.66 (m, 2 H) 7.41 (d, J=5.19 Hz, 1 H) 7.34 (dd, J=7.93, 5.49 Hz, 1 H) 4.79-4.88 (m, 4 H) 4.44-4.53 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 374 (M+H) ⁺
778	N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 9.07 (d, J=1.22 Hz, 1 H) 8.70 (d, J=5.19 Hz, 1 H) 8.59 (s, 1 H) 8.49 (d, J=4.88 Hz, 1 H) 7.79-7.86 (m, 2 H) 7.63-7.68 (m, 2 H) 7.39-7.45 (m, 2 H) 4.81-4.87 (m, 4H) 4.56 (s, 2 H)	(ESI(+)) m/e 375 (M+H) ⁺
779	N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, J=4.88 Hz, 1 H) 8.45 (d, J=2.14 Hz, 1 H) 8.39 (dd, J=4.73, 1.68 Hz, 1 H) 7.69-7.73 (m, 2 H) 7.64-7.68 (m, 1 H) 7.58-7.62 (m, 2 H) 7.42 (d, J=4.88 Hz, 1 H) 7.30 (dd, J=7.93, 4.88 Hz, 1 H) 4.81-4.85 (m, 4 H) 3.52-3.57 (m, 2 H) 2.87-2.92 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 388 (M+H) ⁺
780	N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, J=5.19 Hz, 1 H) 7.71-7.75 (m, 2 H) 7.58-7.63 (m, 2 H) 7.41 (d, J=4.88 Hz, 1H) 4.81-4.86 (m, 4 H) 3.38 (t, J=6.87 Hz, 2 H) 2.44-2.50 (m, 6 H) 2.33-2.37 (m, 4 H) 2.16 (s, 3 H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺
803	N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.66 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.51 (d, J=5.0 Hz, 1H), 8.44 (t, J=6.1 Hz, 1H), 7.84-7.76 (m, 2H), 7.71-7.63 (m, 2H), 7.44 (d, J=5.1 Hz, 1H), 4.87-4.80 (m, 4H), 4.48 (d, J=5.7 Hz, 2H), 4.20 (d, J=5.7 Hz, 2H), 3.49-3.39 (m, 2H), 1.25 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) ⁺
875	N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.72-8.56 (m, 2H), 8.55-8.37 (m, 2H), 7.78 (d, J=8.8 Hz, 2H), 7.67 (d, J=8.8 Hz, 2H), 7.43 (t, J=5.6 Hz, 1H), 4.83 (d, J=4.3 Hz, 4H), 3.50-3.29 (m, 1H), 3.27-2.99 (m, 3H), 2.88 (dt, J=13.1, 7.2 Hz, 1H), 2.78-2.58 (m, 1H), 2.33-2.11 (m, 1H), 1.97-1.72 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 415 (M+H) ⁺
880	N-{4-[(吡咯啉-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.08 (s, 2H), 8.93 (d, J=15.5 Hz, 2H), 8.82 (d, J=5.8 Hz, 1H), 8.54 (t, J=5.8 Hz, 1H), 8.02 (d, J=5.8 Hz, 1H), 7.81 (d, J=8.6 Hz, 2H), 7.68 (d, J=8.6 Hz, 2H), 5.06-4.95 (m, 4H), 3.73-3.63 (m, 1H), 3.47-3.05 (m, 4H), 3.02-2.80 (m, 1H), 2.07-1.92 (m, 1H), 1.67 (dq, J=12.8, 8.1 Hz, 1H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺

881	N-(4-[(3S)-吡咯啉-3-基甲基]胺甲磺基)苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲磺胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.09 (s, 1H), 8.93 (d, <i>J</i> =15.5 Hz, 1H), 8.82 (d, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 8.54 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 8.03 (d, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.81 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 2H), 7.67 (d, <i>J</i> =8.9 Hz, 2H), 5.00 (d, <i>J</i> =19.2 Hz, 4H), 3.69 (dq, <i>J</i> =5.9, 4.4 Hz, 1H), 3.52-3.44 (m, 1H), 3.35-3.07 (m, 4H), 2.90 (td, <i>J</i> =13.7, 6.2 Hz, 1H), 2.27 (s, 1H), 2.00 (td, <i>J</i> =12.8, 7.4 Hz, 1H), 1.66 (dq, <i>J</i> =16.3, 8.2 Hz, 1H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
882	N-(4-[(1-甲基吡咯啉-3-基)甲基]胺甲磺基)苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲磺胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.59 (s, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.56-7.49 (m, 2H), 7.41-7.23 (m, 5H), 7.13 (s, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.92 (dd, <i>J</i> =8.3, 2.6 Hz, 1H), 6.89-6.79 (m, 2H), 4.76 (s, 4H), 4.36 (s, 2H), 3.73 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 380 (M+H) ⁺
884	N-(4-[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲磺基)苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲磺胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.66-8.59 (m, 2H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.26 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.81-7.73 (m, 2H), 7.68-7.61 (m, 2H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 4.86-4.75 (m, 4H), 3.12 (t, <i>J</i> =6.2 Hz, 2H), 2.77-2.69 (m, 2H), 2.12 (s, 3H), 1.78 (td, <i>J</i> =11.5, 2.4 Hz, 2H), 1.63 (dd, <i>J</i> =12.5, 2.9 Hz, 2H), 1.54-1.40 (m, 1H), 1.25-1.08 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 394 (M+H) ⁺
922	N-[4-([(3R)-1-异丁基]胺甲磺基)苯基]-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲磺胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.66 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.41 (t, <i>J</i> =5.3 Hz, 1H), 7.82-7.74 (m, 2H), 7.70-7.62 (m, 2H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 4.84-4.74 (m, 4H), 3.58 (dd, <i>J</i> =17.0, 9.7 Hz, 1H), 3.44 (dt, <i>J</i> =22.7, 9.2 Hz, 1H), 3.28-2.93 (m, 2H), 2.64 (pd, <i>J</i> =6.7, 3.2 Hz, 1H), 2.08-1.83 (m, 1H), 1.78-1.45 (m, 1H), 1.29-1.24 (m, 3H), 1.08-0.91 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 436 (M+H) ⁺
923	N-[4-([(3R)-1-苯基]胺甲磺基)苯基]-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲磺胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.68-8.59 (m, 2H), 8.49 (t, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 8.47-8.41 (m, 1H), 8.40-8.28 (m, 1H), 7.85-7.76 (m, 1H), 7.76-7.58 (m, 3H), 7.54-7.46 (m, 2H), 7.42 (t, <i>J</i> =7.6 Hz, 3H), 4.80 (d, <i>J</i> =15.4 Hz, 4H), 3.68-3.55 (m, 1H), 3.53-3.36 (m, 1H), 3.20 (ddd, <i>J</i> =9.8, 7.1, 5.7 Hz, 1H), 2.06-1.87 (m, 2H), 1.76-1.58 (m, 2H), 1.31-1.18 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 470 (M+H) ⁺
924	N-[4-([1-(四氢呋喃-3-基)吡咯啉-3-基]胺甲磺基)苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲磺胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.63 (d, <i>J</i> =12.1 Hz, 2H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 7.78 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 2H), 7.66 (d, <i>J</i> =8.1 Hz, 2H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 4.83 (d, <i>J</i> =4.3 Hz, 4H), 3.88 (t, <i>J</i> =8.1 Hz, 1H), 3.77-3.59 (m, 4H), 3.52-3.40 (m, 1H), 3.27-3.06 (m, 2H), 2.40 (dd, <i>J</i> =13.9, 6.8 Hz, 1H), 2.07-1.90 (m, 3H), 1.78-1.55 (m, 1H), 1.23 (dd, <i>J</i> =9.7, 6.6 Hz, 1H)	(ESI(+)) m/e 464 (M+H) ⁺
925	N-[4-([1-(甲基磺基)吡咯啉-3-基]胺甲磺基)苯基]-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲磺胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.66 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.51 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.42 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 7.82-7.74 (m, 2H), 7.70-7.63 (m, 2H), 7.44 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 4.86-4.79 (m, 4H),	(ESI(+)) m/e 444 (M+H) ⁺

	[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	3.25-3.11 (m, 2H), 3.02 (dd, $J=10.0, 6.7$ Hz, 1H), 2.90 (s, 3H), 2.06-1.89 (m, 2H), 1.75-1.59 (m, 2H), 1.28-1.20 (m, 2H)	
939	N-[4-({[1-(嗎啉-4-基)環戊基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 9.35 (s, 1H), 8.77 (s, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.60 (d, $J=5.3$ Hz, 2H), 7.84 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.71 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.61 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 4.88 (s, 4H), 4.03 (d, $J=11.7$ Hz, 3H), 3.79-3.57 (m, 5H), 3.51 (d, $J=11.5$ Hz, 2H), 3.38 (d, $J=9.6$ Hz, 2H), 1.95 (d, $J=6.9$ Hz, 4H), 1.74 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 451 (M+H) $^+$
969	N-(4-({[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.66 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.50 (d, $J=9.6$ Hz, 2H), 7.87-7.80 (m, 2H), 7.71-7.64 (m, 2H), 7.47-7.38 (m, 3H), 7.14 (t, $J=8.7$ Hz, 2H), 5.12-5.00 (m, 1H), 4.91 (t, $J=5.8$ Hz, 1H), 4.83 (d, $J=4.4$ Hz, 4H), 3.76-3.57 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) $^+$
970	N-(4-({[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.63 (d, $J=10.4$ Hz, 2H), 8.49 (t, $J=7.8$ Hz, 1H), 8.41 (d, $J=8.2$ Hz, 1H), 7.83 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.67 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.44 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.36-7.25 (m, 2H), 6.92-6.82 (m, 2H), 5.01 (dd, $J=13.7, 7.9$ Hz, 1H), 4.84 (t, $J=5.7$ Hz, 4H), 3.72 (s, 3H), 3.70-3.57 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) $^+$
971	N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.67 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.51 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 8.49-8.41 (m, 1H), 7.83-7.76 (m, 2H), 7.71-7.64 (m, 2H), 7.44 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 4.93-4.86 (m, 1H), 4.84 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 4.40 (d, $J=5.9$ Hz, 2H), 4.29 (d, $J=5.8$ Hz, 2H), 3.58 (d, $J=5.6$ Hz, 2H), 3.51 (d, $J=6.0$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 383 (M+H) $^+$
972	N-(4-({[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.70-8.57 (m, 2H), 8.54-8.46 (m, 1H), 8.43-8.27 (m, 1H), 7.87-7.77 (m, 2H), 7.67 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.49-7.38 (m, 1H), 6.99 (s, 1H), 6.84 (d, $J=0.8$ Hz, 2H), 5.96 (dd, $J=2.5, 0.8$ Hz, 2H), 5.04-4.94 (m, 1H), 4.89-4.75 (m, 4H), 3.73-3.53 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 447 (M+H) $^+$
1055	N-[4-(1,7-二氫雜螺[4.4]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5) δ ppm 8.44 (d, $J=20.6$ Hz, 1H), 7.88 (t, $J=10.7$ Hz, 3H), 7.69-7.57 (m, 3H), 4.22 (d, $J=12.3$ Hz, 1H), 3.93 (dt, $J=11.3, 8.0$ Hz, 2H), 3.83-3.64 (m, 3H), 3.59-3.46 (m, 3H), 3.45-3.31 (m, 1H), 2.71-2.46 (m, 1H), 2.12-1.80 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 392 (M+H) $^+$
1056	N-[4-(2,7-二氫雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5) δ ppm 8.55 (dd, $J=10.2, 5.1$ Hz, 2H), 7.99-7.83 (m, 2H), 7.70-7.61 (m, 2H), 7.10 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 4.99-4.79 (m, 4H), 3.74-3.59 (m, 4H), 3.28-3.10 (m, 4H), 2.13-1.91 (m, 1H), 1.91-1.72 (m, 2H), 1.71-1.60 (m, 1H), 1.64-1.45 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 406 (M+H) $^+$
1057	N-[4-(2,6-二氫雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5) δ ppm 8.58-8.47 (m, 2H), 7.85 (t, $J=24.8$ Hz, 2H), 7.67-7.57 (m, 2H), 7.49-7.38 (m, 2H), 7.25-7.15 (m, 2H), 7.05-6.95 (m, 2H), 6.85-6.75 (m, 2H), 6.65-6.55 (m, 2H), 6.45-6.35 (m, 2H), 6.25-6.15 (m, 2H), 6.05-5.95 (m, 2H), 5.85-5.75 (m, 2H), 5.65-5.55 (m, 2H), 5.45-5.35 (m, 2H), 5.25-5.15 (m, 2H), 5.05-4.95 (m, 2H), 4.85-4.75 (m, 2H), 4.65-4.55 (m, 2H), 4.45-4.35 (m, 2H), 4.25-4.15 (m, 2H), 4.05-3.95 (m, 2H), 3.85-3.75 (m, 2H), 3.65-3.55 (m, 2H), 3.45-3.35 (m, 2H), 3.25-3.15 (m, 2H), 3.05-2.95 (m, 2H), 2.85-2.75 (m, 2H), 2.65-2.55 (m, 2H), 2.45-2.35 (m, 2H), 2.25-2.15 (m, 2H), 2.05-1.95 (m, 2H), 1.85-1.75 (m, 2H), 1.65-1.55 (m, 2H), 1.45-1.35 (m, 2H), 1.25-1.15 (m, 2H), 1.05-0.95 (m, 2H), 0.85-0.75 (m, 2H), 0.65-0.55 (m, 2H), 0.45-0.35 (m, 2H), 0.25-0.15 (m, 2H), 0.05 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 406

N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-氰基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

	基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	2H), 7.10 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 4.91-4.74 (m, 4H), 4.30 (d, $J=12.6$ Hz, 1H), 3.98-3.72 (m, 2H), 3.68-3.58 (m, 1H), 3.27-3.05 (m, 2H), 2.61-2.45 (m, 1H), 2.16-1.92 (m, 1H), 1.92-1.77 (m, 2H), 1.72-1.19 (m, 4H)	(M+H) ⁺
1058	N-[4-(2,7-二氫雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.60-8.49 (m, 2H), 8.09-7.83 (m, 2H), 7.53-7.42 (m, 3H), 5.06-4.76 (m, 4H), 3.78-3.57 (m, 3H), 3.48-3.23 (m, 4H), 2.08-1.91 (m, 1H), 1.91-1.76 (m, 1H), 1.76-1.65 (m, 1H), 1.61 (dt, $J=23.9, 13.1$ Hz, 1H), 1.56-1.34 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 406 (M+H) ⁺
1059	N-[4-(2,9-二氫雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.62-8.46 (m, 2H), 7.85 (dd, $J=43.4, 8.8$ Hz, 2H), 7.52-7.43 (m, 2H), 7.10 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 1H), 3.60-3.43 (m, 3H), 3.41-3.25 (m, 1H), 3.24-3.03 (m, 4H), 1.89-1.56 (m, 4H), 1.54-1.31 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) ⁺
1060	N-[4-(2,8-二氫雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.56 (dd, $J=9.9, 4.6$ Hz, 2H), 8.12-7.80 (m, 2H), 7.52-7.43 (m, 3H), 4.90-4.83 (m, 6H), 3.67-3.55 (m, 2H), 3.49-3.37 (m, 2H), 3.41-3.23 (m, 4H), 1.99-1.61 (m, 4H), 1.47 (d, $J=10.4$ Hz, 4H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) ⁺
1061	N-[4-(1,8-二氫雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.60-8.44 (m, 2H), 7.86 (t, $J=25.2$ Hz, 2H), 7.54 (t, $J=6.9$ Hz, 2H), 7.10 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 4.14 (d, $J=13.5$ Hz, 1H), 4.02 (d, $J=13.5$ Hz, 1H), 3.59 (dd, $J=11.5, 6.5$ Hz, 1H), 3.48-3.33 (m, 1H), 3.36-3.13 (m, 2H), 2.23 (ddd, $J=13.3, 8.9, 4.3$ Hz, 1H), 1.96-1.82 (m, 2H), 1.83-1.65 (m, 4H), 1.69-1.44 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) ⁺
1062	N-[4-(1,8-二氫雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.50 (dd, $J=43.2, 14.6$ Hz, 2H), 7.98-7.82 (m, 2H), 7.52-7.41 (m, 2H), 7.10 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 3.95-3.75 (m, 1H), 3.67 (d, $J=9.3$ Hz, 2H), 3.51-3.37 (m, 6H), 2.52-2.33 (m, 1H), 2.25-2.11 (m, 2H), 2.12-1.99 (m, 1H), 2.03-1.83 (m, 6H), 1.66 (d, $J=41.1$ Hz, 1H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) ⁺
1063	N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.61-8.44 (m, 2H), 8.18-8.03 (m, 2H), 7.98-7.81 (m, 2H), 7.10 (d, $J=4.9$ Hz, 1H) 4.89-4.79 (m, 6H), 4.28 (dt, $J=12.4, 6.2$ Hz, 1H), 3.80-3.64 (m, 2H), 3.51 (s, 1H), 3.45-3.25 (m, 4H), 2.12-1.89 (m, 2H), 1.87-1.48 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 436 (M+H) ⁺
1064	N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.44 (d, $J=20.6$ Hz, 1H), 7.88 (t, $J=10.7$ Hz, 3H), 7.69-7.57 (m, 3H), 4.22 (d, $J=12.3$ Hz, 1H), 3.93 (dt, $J=11.3, 8.0$ Hz, 2H), 3.83-3.64 (m, 3H), 3.59-3.46 (m, 3H), 3.45-3.31 (m, 1H), 2.71-2.46 (m, 1H), 2.12-1.80 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 422 (M+H) ⁺

1065	N-{4-[(2-氧杂-9-氮杂螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲酯基]苯基}-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.56-8.44 (m, 2H), 8.26-8.00 (m, 3H), 7.87 (dd, <i>J</i> =40.3, 8.7 Hz, 2H), 3.99-3.70 (m, 2H), 3.66-3.56 (m, 2H), 3.51 (s, 1H), 3.35-3.16 (m, 4H), 3.10 (d, <i>J</i> =11.5 Hz, 1H), 2.09-1.82 (m, 2H), 1.83-1.68 (m, 1H), 1.61-1.36 (m, 4H), 1.33-1.05 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 450 (M+H) ⁺
1066	N-[4-(1-氧杂-4,8-二氮杂螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.62-8.46 (m, 2H), 7.86 (dd, <i>J</i> =52.3, 8.6 Hz, 3H), 7.56 (d, <i>J</i> =15.9 Hz, 2H), 4.94-4.73 (m, 5H), 3.81-3.52 (m, 6H), 3.37 (d, <i>J</i> =12.4 Hz, 1H), 3.17-2.87 (m, 2H), 2.13-1.83 (m, 2H), 1.63-1.24 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 422 (M+H) ⁺
1067	N-[4-(1,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.59-8.45 (m, 2H), 7.96-7.80 (m, 2H), 7.59-7.52 (m, 2H), 7.10 (d, <i>J</i> =4.9 Hz, 1H), 4.87 (d, <i>J</i> =6.5 Hz, 6H), 3.54 (dt, <i>J</i> =13.2, 4.8 Hz, 4H), 3.41 (dd, <i>J</i> =9.0, 4.4 Hz, 2H), 3.28-3.12 (m, 2H), 2.03-1.86 (m, 2H), 1.74-1.46 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 406 (M+H) ⁺
1068	N-[4-(1,8-二氮杂螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.50 (dd, <i>J</i> =44.5, 13.2 Hz, 2H), 7.88 (d, <i>J</i> =8.5 Hz, 2H), 7.50 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 2H), 7.10 (d, <i>J</i> =4.9 Hz, 1H), 4.14-3.91 (m, 2H), 3.66-3.34 (m, 6H), 2.43 (s, 1H), 2.23-2.05 (m, 2H), 2.05-1.66 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 406 (M+H) ⁺
1069	N-[4-(1,7-二氮杂螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.59-8.43 (m, 2H), 7.90 (d, <i>J</i> =8.5 Hz, 2H), 7.48 (t, <i>J</i> =13.3 Hz, 3H), 4.90 (dd, <i>J</i> =29.4, 12.8 Hz, 4H), 4.01 (d, <i>J</i> =47.2 Hz, 2H), 3.61 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.51 (s, 2H), 3.37 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 2H), 2.61 (t, <i>J</i> =7.3 Hz, 2H), 2.10 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 392 (M+H) ⁺
1070	N-[4-(1,6-二氮杂螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.56 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 2H), 8.05-7.86 (m, 2H), 7.82-7.62 (m, 2H), 7.10 (d, <i>J</i> =4.9 Hz, 1H), 4.98-4.75 (m, 4H), 4.27 (td, <i>J</i> =8.9, 6.8 Hz, 1H), 3.96 (ddd, <i>J</i> =25.0, 14.5, 9.4 Hz, 3H), 3.51 (d, <i>J</i> =6.5 Hz, 1H), 3.44 (t, <i>J</i> =9.6 Hz, 1H), 3.23 (tdd, <i>J</i> =12.8, 11.1, 4.3 Hz, 2H), 2.58-2.45 (m, 1H), 2.39-2.19 (m, 1H), 1.97 (ddd, <i>J</i> =11.3, 9.0, 5.2 Hz, 2H), 1.89-1.63 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 392 (M+H) ⁺
1071	N-[4-(2,5-二氮杂螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.59-8.44 (m, 2H), 7.90 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 2H), 7.84-7.67 (m, 2H), 7.10 (d, <i>J</i> =4.9 Hz, 1H), 4.89 (dd, <i>J</i> =31.4, 12.8 Hz, 4H), 4.38 (d, <i>J</i> =9.7 Hz, 2H), 4.29-4.03 (m, 2H), 3.51 (s, 1H), 3.12-2.82 (m, 2H), 2.01-1.69 (m, 2H), 1.62-1.22 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 392 (M+H) ⁺
1072	N-[4-(5-氧杂-2-氮杂螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.60-8.44 (m, 3H), 7.99-7.85 (m, 2H), 7.85-7.74 (m, 2H), 7.10 (d, <i>J</i> =4.9 Hz, 1H), 4.98-4.74 (m, 4H), 4.41-4.24 (m, 3H), 4.19 (dd, <i>J</i> =9.6, 1.2 Hz, 2H), 3.85-3.61 (m, 2H), 1.92 (t, <i>J</i> =7.3 Hz, 2H), 1.80-	(ESI(+)) m/e 379 (M+H) ⁺

		1.54 (m, 2H)	
1073	N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.58-8.43 (m, 2H), 7.91 (dd, <i>J</i> =21.0, 8.7 Hz, 2H), 7.85 (t, <i>J</i> =7.0 Hz, 2H), 7.11 (d, <i>J</i> =4.9 Hz, 1H), 4.88 (t, <i>J</i> =13.2 Hz, 4H), 4.04-3.91 (m, 2H), 3.91-3.76 (m, 2H), 3.62-3.54 (m, 2H), 3.54-3.36 (m, 3H), 1.77-1.52 (m, 2H), 1.52-1.27 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 393 (M+H) ⁺
1074	N-[4-(六氫-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.57-8.46 (m, 2H), 7.98-7.76 (m, 2H), 7.69-7.57 (m, 2H), 7.10 (s, 1H), 4.86 (dd, <i>J</i> =17.1, 10.2 Hz, 4H), 4.39 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 3.98-3.81 (m, 2H), 3.74-3.54 (m, 4H), 3.56-3.41 (m, 1H), 2.78-2.51 (m, 1H), 2.07-1.72 (m, 1H), 1.73-1.36 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 379 (M+H) ⁺
1075	N-[4-(四氫-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.59-8.46 (m, 2H), 7.90 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 2H), 7.68-7.58 (m, 2H), 7.10 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 4.87 (dd, <i>J</i> =16.8, 9.9 Hz, 4H), 3.86-3.64 (m, 4H), 3.64-3.40 (m, 5H), 2.86-2.58 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 379 (M+H) ⁺
1076	N-[4-(六氫呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅) δ ppm 8.62-8.45 (m, 2H), 8.01-7.80 (m, 2H), 7.57-7.52 (m, 2H), 7.10 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 4.91-4.78 (m, 4H), 3.83-3.69 (m, 2H), 3.74-3.55 (m, 6H), 3.45-3.26 (m, 1H), 2.37-2.17 (m, 2H), 1.72-1.35 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 393 (M+H) ⁺
1120	N-(4-{[3-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.47 (d, <i>J</i> =4.9 Hz, 1H), 7.80 (d, <i>J</i> =7.7 Hz, 1H), 7.78-7.70 (m, 2H), 7.70-7.54 (m, 2H), 7.42-7.09 (m, 2H), 6.01 (d, <i>J</i> =0.8 Hz, 1H), 4.81 (d, <i>J</i> =11.5 Hz, 4H), 4.08 (t, <i>J</i> =7.0 Hz, 2H), 3.32-3.27 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.12-1.94 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 405 (M+H) ⁺
1121	N-(4-{[2-(4-氯-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.52-8.38 (m, 1H), 7.87-7.76 (m, 2H), 7.73-7.66 (m, 2H), 7.66-7.55 (m, 2H), 7.54-7.39 (m, 1H), 7.38-7.22 (m, 1H), 4.95-4.64 (m, 4H), 4.28 (dd, <i>J</i> =8.0, 4.5 Hz, 2H), 3.79-3.50 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 411 (M+H) ⁺
1122	N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.47 (t, <i>J</i> =9.6 Hz, 1H), 7.91-7.78 (m, 1H), 7.79-7.68 (m, 2H), 7.68-7.57 (m, 2H), 7.38-7.31 (m, 1H), 4.82 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 4H), 4.37 (h, <i>J</i> =6.7 Hz, 1H), 4.24-3.93 (m, 2H), 2.89-2.68 (m, 1H), 2.63-2.42 (m, 2H), 2.13 (s, 3H), 1.96 (s, 1H), 1.27-1.02 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺
1123	N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啶-4-基)丁基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.47 (d, <i>J</i> =4.8 Hz, 1H), 7.81 (dd, <i>J</i> =10.0, 8.1 Hz, 3H), 7.75-7.60 (m, 2H), 7.46-7.25 (m, 1H), 4.81 (d, <i>J</i> =12.8 Hz, 4H), 3.92 (s, 4H), 3.40 (s, 3H), 2.85 (dd, <i>J</i> =84.9, 29.4 Hz, 2H), 2.57-2.38 (m, 3H), 1.92 (d, <i>J</i> =35.3 Hz, 1H), 1.87-1.66 (m, 2H), 1.02 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 438 (M+H) ⁺

1124	N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.55-8.39 (m, 1H), 7.98-7.71 (m, 3H), 7.67-7.52 (m, 2H), 7.36-7.29 (m, 1H), 7.29-7.17 (m, 2H), 6.98-6.73 (m, 2H), 4.90-4.60 (m, 4H), 4.38 (d, $J=17.5$ Hz, 2H), 3.74 (d, $J=3.2$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 403 (M+H) $^+$
1125	N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.57-8.35 (m, 1H), 7.89-7.72 (m, 3H), 7.72-7.54 (m, 2H), 7.33 (dd, $J=7.7, 5.0$ Hz, 1H), 4.81 (d, $J=11.8$ Hz, 4H), 3.86 (s, 4H), 3.47-3.34 (m, 2H), 3.24-3.04 (m, 2H), 2.12-1.78 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 410 (M+H) $^+$
1126	N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.46 (dd, $J=12.7, 2.9$ Hz, 1H), 7.80 (d, $J=7.7$ Hz, 1H), 7.73-7.55 (m, 2H), 7.49-7.35 (m, 2H), 7.35-7.25 (m, 1H), 4.81 (d, $J=11.4$ Hz, 4H), 3.90-3.71 (m, 6H), 3.66-3.48 (m, 5H), 3.37 (d, $J=5.2$ Hz, 5H), 2.88 (d, $J=53.2$ Hz, 4H), 1.96 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 440 (M+H) $^+$
1127	N-{4-[(2-胺甲醯基苯基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.46 (d, $J=4.3$ Hz, 1H), 7.84-7.73 (m, 3H), 7.73-7.59 (m, 2H), 7.48 (d, $J=7.4$ Hz, 1H), 7.44-7.37 (m, 2H), 7.37-7.20 (m, 2H), 4.81 (d, $J=12.6$ Hz, 4H), 4.63 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 416 (M+H) $^+$
1128	N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.65-8.37 (m, 1H), 7.78 (dd, $J=40.2, 6.3$ Hz, 1H), 7.68-7.53 (m, 2H), 7.42-7.31 (m, 1H), 7.32-7.20 (m, 2H), 4.85 (t, $J=26.3$ Hz, 4H), 3.67-3.41 (m, 9H), 3.28 (t, $J=8.4$ Hz, 6H), 3.06-2.71 (m, 2H), 2.01 (d, $J=38.9$ Hz, 1H)	(ESI(+)) m/e 399 (M+H) $^+$
1129	N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.59-8.22 (m, 1H), 7.89-7.75 (m, 3H), 7.70-7.54 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=7.7, 5.0$ Hz, 1H), 4.83 (d, $J=8.7$ Hz, 4H), 4.41 (dd, $J=8.6, 5.5$ Hz, 1H), 3.11-2.72 (m, 1H), 2.53-2.31 (m, 1H), 1.90-1.56 (m, 2H), 1.48-1.22 (m, 4H), 1.11-0.77 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 394 (M+H) $^+$
1130	N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.55-8.34 (m, 1H), 7.87-7.75 (m, 1H), 7.76-7.67 (m, 2H), 7.67-7.52 (m, 2H), 7.45-7.26 (m, 1H), 6.94-6.79 (m, 2H), 6.77 (dd, $J=8.1, 2.0$ Hz, 1H), 4.90-4.61 (m, 4H), 3.73 (d, $J=2.9$ Hz, 6H), 3.63-3.35 (m, 2H), 2.87-2.66 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 447 (M+H) $^+$
1131	N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.31-8.22 (m, 1H), 8.12-8.04 (m, 1H), 7.90-7.59 (m, 4H), 7.43-7.30 (m, 3H), 4.87-4.75 (m, 4H), 3.69-3.60 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 430 (M+H) $^+$
1132	Na-{4-[(5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯基)]}	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.57-8.27 (m, 1H), 7.83-7.74 (m, 1H), 7.74-7.64 (m, 2H), 7.64-7.54 (m, 2H), 7.39-7.20 (m, 5H),	(ESI(+)) m/e 430 (M+H) $^+$

	啉-6-基羰基)胺基]苯甲醯基}-L-苯基丙胺醯胺	7.20-7.09 (m, 1H), 4.88-4.73 (m, 4H), 4.73-4.58 (m, 1H), 3.22-3.11 (m, 1H), 3.11-2.92 (m, 1H)	
1133	N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.61-8.35 (m, 1H), 7.96-7.73 (m, 3H), 7.71-7.53 (m, 2H), 7.47-7.28 (m, 1H), 4.94-4.67 (m, 4H), 4.61-4.34 (m, 1H), 3.08-2.71 (m, 1H), 1.93-1.49 (m, 2H), 1.00-0.70 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) $^+$
1134	N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.48 (d, $J=4.6$ Hz, 1H), 7.91-7.76 (m, 1H), 7.75-7.57 (m, 2H), 7.50-7.27 (m, 3H), 4.86 (t, $J=26.6$ Hz, 4H), 3.80 (s, 3H), 3.28-3.13 (m, 2H), 3.05-2.73 (m, 3H), 2.70-2.43 (m, 1H), 2.09 (d, $J=11.0$ Hz, 2H), 1.84 (t, $J=13.9$ Hz, 2H), 1.64 (d, $J=12.9$ Hz, 1H), 1.48-1.22 (m, 4H), 1.22-1.04 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 434 (M+H) $^+$
1135	N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.48 (d, $J=4.4$ Hz, 1H), 7.80 (t, $J=17.2$ Hz, 1H), 7.76-7.65 (m, 2H), 7.68-7.52 (m, 2H), 7.36 (dd, $J=7.7, 5.0$ Hz, 1H), 4.82 (d, $J=9.6$ Hz, 4H), 3.48-3.33 (m, 3H), 1.73 (p, $J=6.5$ Hz, 2H), 1.15 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 394 (M+H) $^+$
1136	N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.47 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.89-7.72 (m, 3H), 7.70-7.53 (m, 2H), 7.48-7.18 (m, 1H), 4.87 (dd, $J=42.6, 12.8$ Hz, 4H), 3.97-3.75 (m, 2H), 3.75-3.58 (m, 2H), 3.53 (d, $J=12.0$ Hz, 2H), 3.00-2.80 (m, 1H), 2.73 (t, $J=11.7$ Hz, 2H), 2.51 (dt, $J=3.7, 1.8$ Hz, 2H), 1.18 (d, $J=6.3$ Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 424 (M+H) $^+$
1137	N-{4-[(3-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.52-8.30 (m, 1H), 7.89-7.70 (m, 3H), 7.70-7.48 (m, 2H), 7.34 (dd, $J=7.7, 5.0$ Hz, 1H), 7.23 (t, $J=8.0$ Hz, 1H), 6.99-6.84 (m, 2H), 6.86-6.69 (m, 1H), 4.82 (d, $J=10.4$ Hz, 4H), 4.45 (s, 2H), 3.75 (s, 3H), 1.96 (s, 1H)	(ESI(+)) m/e 403 (M+H) $^+$
1138	N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.45 (t, $J=21.3$ Hz, 1H), 7.89-7.74 (m, 3H), 7.80-7.58 (m, 2H), 7.34 (dd, $J=7.7, 5.0$ Hz, 1H), 4.82 (d, $J=11.1$ Hz, 4H), 3.92 (s, 4H), 3.64 (s, 2H), 3.39 (s, 3H), 1.39 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 424 (M+H) $^+$
1139	N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.64-8.35 (m, 1H), 7.87-7.78 (m, 1H), 7.78-7.71 (m, 1H), 7.71-7.59 (m, 2H), 7.47-7.28 (m, 1H), 4.99-4.68 (m, 4H), 3.74-3.58 (m, 1H), 3.06-2.86 (m, 3H), 2.90-2.71 (m, 1H), 2.03-1.74 (m, 4H), 1.59-1.28 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) $^+$
1140	N-(4-{[2-(4-甲基哌	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ	(ESI(+))

	噻-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.48 (d, $J=4.4$ Hz, 1H), 7.86-7.72 (m, 3H), 7.72-7.58 (m, 2H), 7.35 (dd, $J=7.7$, 5.0 Hz, 1H), 4.82 (d, $J=10.5$ Hz, 4H), 3.53 (t, $J=6.4$ Hz, 2H), 3.32-3.22 (m, 4H), 3.20-3.02 (m, 4H), 2.97 (t, $J=6.4$ Hz, 3H), 2.80 (s, 4H)	m/e 409 (M+H) $^+$
1141	N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.60-8.40 (m, 1H), 7.93-7.71 (m, 3H), 7.73-7.49 (m, 2H), 7.42-7.26 (m, 1H), 7.29-7.02 (m, 2H), 6.98-6.81 (m, 2H), 4.81 (d, $J=11.8$ Hz, 4H), 4.37 (d, $J=16.6$ Hz, 2H), 3.89-3.61 (m, 4H), 3.18-2.93 (m, 4H), 2.98-2.74 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 457 (M+H) $^+$
1142	N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.47 (d, $J=4.2$ Hz, 1H), 7.89-7.70 (m, 3H), 7.73-7.51 (m, 2H), 7.33 (dd, $J=7.7$, 5.0 Hz, 1H), 4.81 (d, $J=11.5$ Hz, 4H), 3.38 (dd, $J=18.6$, 12.0 Hz, 4H), 3.21-3.00 (m, 2H), 2.92 (d, $J=19.7$ Hz, 2H), 1.95 (tt, $J=33.3$, 15.0 Hz, 3H), 1.77 (d, $J=48.7$ Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) $^+$
1143	N-[4-(4,5,6,7-四氫-1H-吡唑-5-基)胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.45 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 7.84-7.74 (m, 2H), 7.65 (dd, $J=18.3$, 8.7 Hz, 2H), 7.56 (d, $J=8.7$ Hz, 1H), 7.41-7.19 (m, 2H), 4.90 (s, 1H), 4.81 (d, $J=14.4$ Hz, 4H), 2.87 (dd, $J=33.4$, 22.8 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 403 (M+H) $^+$
1195	N-{4-[3-(甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.47 (t, $J=12.9$ Hz, 1H), 7.85 (d, $J=7.7$ Hz, 1H), 7.79-7.69 (m, 2H), 7.69-7.57 (m, 2H), 7.38 (dd, $J=7.7$, 5.0 Hz, 1H), 4.83 (d, $J=8.0$ Hz, 4H), 3.30 (s, 3H), 3.21 (s, 2H), 3.15 (s, 2H), 0.90 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 388 (M+H) $^+$
1196	N-{4-[3,3-二甲基丁基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.48 (d, $J=4.4$ Hz, 1H), 7.82 (d, $J=7.7$ Hz, 1H), 7.78-7.69 (m, 2H), 7.69-7.57 (m, 2H), 7.35 (dd, $J=7.7$, 5.0 Hz, 1H), 4.82 (d, $J=10.1$ Hz, 4H), 3.31 (d, $J=4.0$ Hz, 1H), 3.28 (s, 1H), 1.60-1.24 (m, 2H), 0.94 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) $^+$
1197	N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.63-8.39 (m, 1H), 7.89-7.79 (m, 1H), 7.79-7.67 (m, 2H), 7.67-7.51 (m, 2H), 7.51-7.27 (m, 1H), 6.32 (dd, $J=3.1$, 1.9 Hz, 1H), 6.13 (dd, $J=3.2$, 0.7 Hz, 1H), 4.86 (t, $J=25.1$ Hz, 4H), 4.28 (h, $J=6.7$ Hz, 1H), 3.06-2.73 (m, 4H), 1.96 (s, 1H), 1.19 (t, $J=5.9$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) $^+$
1198	N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.59-8.37 (m, 1H), 7.87-7.70 (m, 3H), 7.71-7.52 (m, 2H), 7.42-7.20 (m, 1H), 6.24-6.02 (m, 1H), 4.93-4.69 (m, 4H), 4.64-4.44 (m, 2H), 2.20 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 378 (M+H) $^+$
1199	N-(4-{[(2R)-1-氟基丁-2-基]胺甲醯基}	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.49 (t, $J=7.9$ Hz, 1H), 7.96-7.83 (m, 1H), 7.83-	(ESI(+)) m/e 364

	苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 7.73 (m, 2H), 7.71-7.54 (m, 2H), 7.39 (dd, $J=7.7$, 5.1 Hz, 1H), 4.83 (d, $J=7.3$ Hz, 4H), 4.27-3.97 (m, 1H), 2.89-2.62 (m, 3H), 1.97 (s, 1H), 1.68 (p, $J=7.3$ Hz, 2H), 0.93 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(M+H) $^+$
1200	N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.48 (dd, $J=5.4$, 4.9 Hz, 1H), 7.84 (dd, $J=7.7$, 0.7 Hz, 1H), 7.72-7.50 (m, 2H), 7.47-7.32 (m, 1H), 7.34-7.16 (m, 2H), 4.86 (t, $J=25.0$ Hz, 4H), 3.37 (dd, $J=14.4$, 6.9 Hz, 2H), 2.97-2.84 (m, 4H), 1.97 (s, 2H), 1.66-1.33 (m, 3H), 1.06-0.63 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) $^+$
1201	N-(4-[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲醯基)苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.47 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 7.84-7.70 (m, 3H), 7.70-7.55 (m, 2H), 7.51 (t, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.32 (dd, $J=7.7$, 4.9 Hz, 1H), 6.15 (d, $J=2.2$ Hz, 1H), 4.85 (t, $J=28.9$ Hz, 4H), 4.59-4.31 (m, 2H), 3.78 (d, $J=4.5$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 377 (M+H) $^+$
1202	N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.49 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 7.85 (t, $J=10.7$ Hz, 1H), 7.78-7.69 (m, 2H), 7.68-7.49 (m, 2H), 7.43-7.30 (m, 1H), 4.86 (t, $J=25.0$ Hz, 4H), 3.35 (d, $J=4.6$ Hz, 2H), 3.32 (d, $J=2.7$ Hz, 3H), 1.71-1.34 (m, 2H), 0.90 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 369 (M+H) $^+$
1203	N-(4-[[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基]苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.57-8.41 (m, 1H), 7.88-7.73 (m, 3H), 7.68-7.55 (m, 2H), 7.46-7.02 (m, 1H), 4.81 (d, $J=11.6$ Hz, 4H), 3.17-3.00 (m, 2H), 2.87-2.67 (m, 8H), 1.96 (s, 1H), 1.78-1.55 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) $^+$
1204	N-(4-[[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲醯基]苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.49 (t, $J=5.3$ Hz, 1H), 7.83 (d, $J=8.7$ Hz, 3H), 7.67 (dt, $J=17.6$, 9.5 Hz, 3H), 7.61-7.47 (m, 1H), 7.34 (dt, $J=35.5$, 17.8 Hz, 1H), 5.46 (q, $J=7.0$ Hz, 1H), 4.83 (d, $J=9.3$ Hz, 4H), 1.65 (d, $J=7.0$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 394 (M+H) $^+$
1205	N-(4-[[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲醯基]苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.58-8.41 (m, 1H), 7.91-7.81 (m, 1H), 7.79-7.66 (m, 2H), 7.70-7.58 (m, 2H), 7.58-7.51 (m, 1H), 7.37 (dd, $J=7.5$, 5.2 Hz, 2H), 5.15 (q, $J=6.9$ Hz, 1H), 4.82 (d, $J=8.4$ Hz, 4H), 3.78 (s, 3H), 1.47 (t, $J=5.5$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) $^+$
1206	N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.46 (t, $J=11.6$ Hz, 1H), 7.87-7.70 (m, 3H), 7.70-7.52 (m, 2H), 7.35 (dt, $J=14.6$, 7.3 Hz, 1H), 4.82 (d, $J=9.9$ Hz, 4H), 4.58-4.37 (m, 1H), 3.92-3.81 (m, 2H), 3.81-3.67 (m, 1H), 3.59 (dd, $J=8.9$, 4.6 Hz, 1H), 2.31-2.11 (m, 1H), 2.02-1.76 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 353 (M+H) $^+$
1207	N-{4-[(1-甲氧基丁-	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ	(ESI(+))

	2-基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	8.47 (dd, $J=15.1, 10.9$ Hz, 1H), 7.84 (dd, $J=7.7, 1.0$ Hz, 1H), 7.82-7.70 (m, 2H), 7.70-7.56 (m, 2H), 7.36 (dd, $J=7.7, 5.0$ Hz, 1H), 4.82 (d, $J=9.1$ Hz, 4H), 4.18-3.96 (m, 1H), 3.50-3.36 (m, 2H), 1.75-1.57 (m, 1H), 1.57-1.39 (m, 1H), 0.90 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	m/e 369 (M+H) ⁺
1208	N-{4-[(4-氨基苯基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.47 (d, $J=4.2$ Hz, 1H), 7.87-7.73 (m, 3H), 7.70-7.53 (m, 2H), 7.33 (dd, $J=8.0, 6.1$ Hz, 3H), 7.09 (d, $J=8.3$ Hz, 2H), 4.81 (d, $J=11.4$ Hz, 4H), 4.44 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 388 (M+H) ⁺
1209	N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.47 (t, $J=11.3$ Hz, 1H), 7.87-7.81 (m, 1H), 7.80-7.71 (m, 2H), 7.73-7.53 (m, 2H), 7.45-7.08 (m, 1H), 4.82 (d, $J=9.2$ Hz, 4H), 3.70-3.56 (m, 1H), 3.56-3.41 (m, 2H), 3.27 (dd, $J=13.4, 5.7$ Hz, 1H), 1.18-0.88 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 369 (M+H) ⁺
1210	N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.58-8.32 (m, 2H), 8.10-7.96 (m, 1H), 7.96-7.85 (m, 2H), 7.85-7.74 (m, 1H), 7.74-7.60 (m, 2H), 7.40-7.14 (m, 1H), 6.97-6.64 (m, 1H), 5.01-4.62 (m, 4H), 3.87 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 390 (M+H) ⁺
1211	N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.49 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 7.83 (t, $J=12.3$ Hz, 1H), 7.84-7.69 (m, 2H), 7.73-7.51 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=7.7, 5.0$ Hz, 1H), 4.82 (d, $J=8.6$ Hz, 4H), 3.92 (h, $J=6.7$ Hz, 1H), 1.69-1.44 (m, 2H), 1.16 (d, $J=6.7$ Hz, 3H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 339 (M+H) ⁺
1212	N-{4-[(1-氟基環丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.47 (d, $J=4.7$ Hz, 1H), 7.85-7.72 (m, 3H), 7.69-7.52 (m, 2H), 7.43-7.15 (m, 1H), 4.81 (d, $J=11.4$ Hz, 4H), 1.61-1.41 (m, 2H), 1.40-1.17 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 348 (M+H) ⁺
1213	N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.55-8.36 (m, 1H), 7.87-7.75 (m, 1H), 7.75-7.67 (m, 2H), 7.68-7.52 (m, 2H), 7.43-7.22 (m, 2H), 6.09-5.92 (m, 1H), 4.91-4.64 (m, 4H), 4.36-4.10 (m, 2H), 3.74-3.47 (m, 2H), 2.30-2.13 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) ⁺
1214	N-(4-{[(4-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.59-8.31 (m, 1H), 7.92-7.72 (m, 3H), 7.71-7.58 (m, 2H), 7.48-7.22 (m, 1H), 7.14-6.93 (m, 1H), 4.82 (d, $J=11.0$ Hz, 4H), 4.74-4.63 (m, 2H), 2.35 (d, $J=0.6$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 394 (M+H) ⁺
1215	N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.56-8.38 (m, 1H), 7.88-7.79 (m, 1H), 7.79-7.68 (m, 2H), 7.70-7.55 (m, 2H), 7.46-7.23 (m, 1H), 4.82 (d, $J=9.5$ Hz, 4H), 3.51 (t, $J=6.3$ Hz, 2H),	(ESI(+)) m/e 341 (M+H) ⁺

		3.3 (t, $J=6.3$ Hz, 2H) 1.83-1.60 (m, 2H)	
1216	N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.62-8.39 (m, 1H), 7.86-7.81 (m, 1H), 7.81-7.70 (m, 2H), 7.70-7.54 (m, 2H), 7.43-7.17 (m, 1H), 4.84 (dd, $J=30.5, 23.8$ Hz, 4H), 3.17-3.01 (m, 2H), 2.03-1.72 (m, 2H), 0.89 (t, $J=7.9$ Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 339 (M+H) $^+$
1217	N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.57-8.39 (m, 1H), 7.86-7.80 (m, 1H), 7.80-7.69 (m, 2H), 7.69-7.54 (m, 2H), 7.42-7.26 (m, 1H), 4.82 (d, $J=10.1$ Hz, 4H), 4.12-3.93 (m, 1H), 3.88-3.75 (m, 1H), 3.74-3.54 (m, 1H), 3.33 (t, $J=5.9$ Hz, 2H), 1.98-1.78 (m, 4H), 1.71-1.51 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) $^+$
1218	N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.49 (t, $J=5.8$ Hz, 1H), 7.90-7.80 (m, 1H), 7.80-7.69 (m, 2H), 7.68-7.54 (m, 2H), 7.36 (dd, $J=7.7, 5.0$ Hz, 1H), 4.82 (d, $J=9.6$ Hz, 4H), 3.64-3.41 (m, 1H), 1.23 (d, $J=6.7$ Hz, 3H), 1.10-0.86 (m, 1H), 0.53-0.28 (m, 3H), 0.28-0.11 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 351 (M+H) $^+$
1219	N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.60-8.35 (m, 1H), 7.93-7.79 (m, 1H), 7.79-7.68 (m, 2H), 7.68-7.53 (m, 2H), 7.49-7.22 (m, 1H), 4.82 (d, $J=9.2$ Hz, 4H), 3.72 (q, $J=6.8$ Hz, 1H), 1.17 (d, $J=6.8$ Hz, 3H), 1.08 (s, 3H), 0.67-0.48 (m, 1H), 0.47-0.34 (m, 1H), 0.32-0.12 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 365 (M+H) $^+$
1220	N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.45 (t, $J=8.3$ Hz, 1H), 7.83-7.71 (m, 3H), 7.68-7.55 (m, 2H), 7.39-7.21 (m, 1H), 7.08-6.98 (m, 1H), 6.99-6.90 (m, 1H), 4.80 (d, $J=12.9$ Hz, 4H), 4.63 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 379 (M+H) $^+$
1221	N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.49 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 7.85 (d, $J=7.7$ Hz, 1H), 7.78-7.69 (m, 2H), 7.72-7.54 (m, 2H), 7.37 (dd, $J=7.7, 5.0$ Hz, 1H), 4.96-4.68 (m, 4H), 3.70-3.42 (m, 1H), 1.23 (d, $J=6.7$ Hz, 3H), 1.15-0.90 (m, 1H), 0.58-0.16 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 350 (M+H) $^+$
1222	N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.60-8.35 (m, 1H), 7.90-7.79 (m, 1H), 7.79-7.70 (m, 2H), 7.69-7.52 (m, 2H), 7.43-7.29 (m, 1H), 4.86 (t, $J=24.4$ Hz, 4H), 3.31-3.25 (m, 2H), 2.68-2.34 (m, 2H), 1.65-1.48 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 369 (M+H) $^+$
1223	N-(4-{[2-(四氫-2H-呋喃-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.55-8.37 (m, 1H), 7.89-7.78 (m, 1H), 7.78-7.68 (m, 2H), 7.68-7.52 (m, 2H), 7.43-7.02 (m, 1H), 4.86 (t, $J=25.4$ Hz, 4H), 3.96-3.57 (m, 2H), 3.12-2.98 (m, 1H), 2.95-2.78 (m, 2H), 1.91-1.76 (m, 1H), 1.63-1.40 (m, 4H), 1.28-1.09 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 395 (M+H) $^+$
1224	N-(4-{[(2S)-1-甲氧	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ	(ESI(+))

	基丙-2-基]胺甲醯基}苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.58-8.40 (m, 1H), 7.87-7.81 (m, 1H), 7.80-7.72 (m, 2H), 7.69-7.51 (m, 2H), 7.34 (dd, $J=7.7$, 5.0 Hz, 1H), 4.81 (d, $J=11.0$ Hz, 4H), 4.30-4.08 (m, 1H), 3.49-3.42 (m, 1H), 3.40-3.33 (m, 1H), 3.29 (s, 3H), 1.16 (t, $J=5.4$ Hz, 3H)	m/e 355 (M+H) $^+$
1225	N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲醯基}苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.49 (d, $J=4.3$ Hz, 1H), 7.89-7.81 (m, 1H), 7.84-7.73 (m, 2H), 7.74-7.56 (m, 2H), 7.44-7.18 (m, 1H), 4.83 (d, $J=9.2$ Hz, 4H), 4.30 (s, 2H), 1.18 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) $^+$
1226	N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.58-8.35 (m, 1H), 7.92-7.71 (m, 3H), 7.70-7.49 (m, 2H), 7.44-7.19 (m, 1H), 4.82 (d, $J=9.5$ Hz, 4H), 4.44 (s, 2H), 3.59 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 376 (M+H) $^+$
1227	N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.60-8.37 (m, 1H), 7.86-7.72 (m, 3H), 7.71-7.56 (m, 3H), 7.47-7.19 (m, 1H), 4.87-4.66 (m, 4H), 3.67-3.48 (m, 3H), 3.42-3.36 (m, 2H), 1.16-1.02 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 369 (M+H) $^+$
1228	N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.59-8.13 (m, 1H), 7.91-7.72 (m, 3H), 7.73-7.58 (m, 2H), 7.43-7.26 (m, 1H), 4.83 (t, $J=9.4$ Hz, 4H), 3.37 (d, $J=6.7$ Hz, 2H), 3.27-3.07 (m, 2H), 2.81 (d, $J=4.7$ Hz, 6H), 1.95 (d, $J=9.3$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) $^+$
1229	N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲醯基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.56-8.35 (m, 1H), 7.90-7.68 (m, 3H), 7.69-7.56 (m, 2H), 7.36 (td, $J=7.9$, 4.0 Hz, 1H), 4.82 (d, $J=10.2$ Hz, 4H), 3.99-3.86 (m, 1H), 3.86-3.68 (m, 1H), 3.41-3.32 (m, 1H), 3.29-3.17 (m, 1H), 2.07-1.84 (m, 1H), 1.83-1.50 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) $^+$
1230	N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.56-8.30 (m, 1H), 7.87-7.76 (m, 1H), 7.76-7.65 (m, 2H), 7.67-7.50 (m, 2H), 7.41-7.20 (m, 1H), 6.73 (t, $J=2.0$ Hz, 1H), 6.17-5.79 (m, 1H), 4.86-4.72 (m, 4H), 4.08 (t, $J=6.5$ Hz, 2H), 3.57 (t, $J=6.5$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 376 (M+H) $^+$
1231	N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基}苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.49 (d, $J=4.8$ Hz, 1H), 7.85 (t, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.81-7.70 (m, 2H), 7.70-7.52 (m, 2H), 7.51-7.22 (m, 1H), 4.82 (d, $J=9.0$ Hz, 4H), 4.19 (h, $J=6.6$ Hz, 1H), 3.59-3.43 (m, 1H), 3.30 (s, 3H), 2.88 (d, $J=50.6$ Hz, 1H), 1.15 (dd, $J=10.7$, 6.7 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 355 (M+H) $^+$
1232	N-{4-[(3-胺基苯基)胺甲醯基}苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.48 (d, $J=4.7$ Hz, 1H), 7.92-7.76 (m, 3H), 7.74-7.51 (m, 2H), 7.32 (ddd, $J=15.4$, 7.7, 4.6 Hz, 2H), 7.18-7.08 (m, 2H), 7.00 (d, $J=7.9$ Hz, 1H),	(ESI(+)) m/e 388 (M+H) $^+$

N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-胺基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

○ N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氟基環丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(4-甲基-1,3-噻唑-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

○ N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

	[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	4.82 (d, $J=11.2$ Hz, 4H), 4.47 (s, 2H)	
1233	N-(4-[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基)苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O) δ 8.56-8.39 (m, 1H), 7.92-7.80 (m, 1H), 7.80-7.68 (m, 2H), 7.68-7.53 (m, 2H), 7.53-6.97 (m, 1H), 4.83 (d, $J=7.2$ Hz, 4H), 3.99-3.74 (m, 1H), 1.91-1.66 (m, 1H), 1.12 (d, $J=6.8$ Hz, 3H), 0.99-0.82 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 353 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
1234	N-{4-[(四氫-2H-吡喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.62-8.38 (m, 1H), 7.91-7.80 (m, 1H), 7.80-7.70 (m, 2H), 7.69-7.45 (m, 2H), 7.48-7.24 (m, 1H), 4.83 (d, $J=8.0$ Hz, 4H), 3.87-3.61 (m, 2H), 3.19-3.12 (m, 3H), 1.92 (d, $J=34.0$ Hz, 1H), 1.87-1.73 (m, 2H), 1.67-1.55 (m, 1H), 1.55-1.37 (m, 1H), 1.39-1.14 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 381 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
1235	N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.61-8.43 (m, 1H), 7.90-7.71 (m, 3H), 7.71-7.50 (m, 2H), 7.42-7.14 (m, 1H), 4.98-4.68 (m, 4H), 3.04-2.66 (m, 2H), 1.29-1.01 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 355 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
1236	N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.55-8.42 (m, 1H), 7.85-7.77 (m, 1H), 7.79-7.68 (m, 2H), 7.68-7.54 (m, 2H), 7.47-6.86 (m, 1H), 4.80 (t, $J=9.0$ Hz, 4H), 3.26-3.17 (m, 2H), 1.63-1.49 (m, 2H), 1.46-1.27 (m, 2H), 0.92 (dd, $J=9.2, 5.5$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 339 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
1237	N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.57-8.37 (m, 1H), 7.90-7.72 (m, 1H), 7.66-7.52 (m, 2H), 7.45-7.34 (m, 1H), 7.33-7.16 (m, 2H), 4.86 (t, $J=24.4$ Hz, 4H), 4.21-3.97 (m, 1H), 3.86-3.55 (m, 2H), 3.57-3.39 (m, 2H), 3.08-2.97 (m, 3H), 1.98-1.88 (m, 2H), 1.85-1.68 (m, 2H), 1.60-1.37 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 381 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
1238	N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.49 (t, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.95-7.76 (m, 1H), 7.71-7.52 (m, 2H), 7.38-7.33 (m, 1H), 7.33-7.22 (m, 2H), 4.82 (d, $J=9.0$ Hz, 4H), 3.61-3.44 (m, 4H), 3.29-3.19 (m, 3H), 2.98 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 355 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
1239	N-{4-[(1-氰基乙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.59-8.32 (m, 1H), 7.91-7.72 (m, 3H), 7.72-7.59 (m, 2H), 7.40-7.20 (m, 1H), 5.03-4.86 (m, 1H), 4.88-4.68 (m, 4H), 1.72-1.43 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 336 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$
1240	N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.48 (d, $J=4.4$ Hz, 1H), 7.89-7.74 (m, 3H), 7.68-7.48 (m, 2H), 7.45-7.24 (m, 1H), 4.82 (d, $J=9.2$ Hz, 4H), 4.59-4.28 (m, 1H), 3.94-3.83 (m, 2H), 3.80-3.64 (m, 1H), 3.65-3.51 (m, 1H), 2.37-2.00 (m, 1H), 2.05-1.80 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 353 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$

1241	N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.49 (d, $J=4.8$ Hz, 1H), 7.90-7.80 (m, 1H), 7.80-7.68 (m, 2H), 7.68-7.49 (m, 2H), 7.47-7.11 (m, 1H), 4.82 (d, $J=9.0$ Hz, 4H), 3.26-3.10 (m, 2H), 2.36-2.07 (m, 1H), 1.75-1.45 (m, 6H), 1.39-1.18 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 365 (M+H) $^+$
1242	N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.61-8.36 (m, 1H), 7.88-7.71 (m, 3H), 7.71-7.55 (m, 2H), 7.46-7.15 (m, 1H), 4.99-4.66 (m, 4H), 3.35 (d, $J=4.5$ Hz, 2H), 3.19-3.16 (m, 3H), 1.46-0.84 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 369 (M+H) $^+$
1243	N-{4-[(環丙基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.60-8.40 (m, 1H), 7.85 (d, $J=7.7$ Hz, 1H), 7.82-7.71 (m, 2H), 7.71-7.53 (m, 2H), 7.38 (dd, $J=7.7, 5.0$ Hz, 1H), 7.30-7.14 (m, 1H), 5.07-4.65 (m, 4H), 3.16 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 1.20-0.87 (m, 1H), 0.52-0.37 (m, 2H), 0.32-0.06 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 337 (M+H) $^+$
1244	N-{4-[甲基(丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.61-8.38 (m, 1H), 7.93-7.76 (m, 1H), 7.68-7.54 (m, 2H), 7.46-7.33 (m, 1H), 7.31-7.17 (m, 2H), 4.97-4.59 (m, 4H), 2.92 (d, $J=8.0$ Hz, 4H), 1.67-1.47 (m, 2H), 0.96-0.59 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 339 (M+H) $^+$
1245	N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ 8.83-8.62 (m, 2H), 8.52-8.39 (m, 1H), 7.96-7.77 (m, 3H), 7.77-7.70 (m, 2H), 7.70-7.59 (m, 2H), 7.43-7.14 (m, 1H), 4.90-4.72 (m, 4H), 4.74-4.48 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 374 (M+H) $^+$

實例 293

N-{4-[(4-苯基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 293A

N-(4-硝基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺

N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺 (100 mg, 0.395 mmol)、4-苯基丁酸 (78 mg, 0.474 mmol)、1-羥基苯并三唑水合物 (66.5 mg, 0.434 mmol) 及 N-甲基嗎啉 (0.109 ml, 0.987 mmol) 於 N,N-二甲基甲醯胺 (1.771 ml) 中之溶液在室

溫下用 N-(3-二甲基胺基丙基)-N'-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽 (136 mg, 0.711 mmol) 處理。混合物攪拌隔夜且用水 (10 ml) 稀釋；所得懸浮液藉由水洗過濾，乾燥後得到含有雜質之產物。此固體懸浮於 2% 甲醇/二氯甲烷中且過濾，得到標題化合物。

實例 293B

N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 274 中所述，用 N-(4-硝基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-硝基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺製備。

實例 293C

N-{4-[(4-苯基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺 (100 mg, 0.395 mmol)、4-苯基丁酸 (78 mg, 0.474 mmol)、1-羥基苯并三唑水合物 (66.5 mg, 0.434 mmol) 及 N-甲基嗎啉 (0.109 ml, 0.987 mmol) 於二甲基甲醯胺 (1.771 ml) 中之溶液在室溫下用 N-(3-二甲基胺基丙基)-N'-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽 (136 mg, 0.711 mmol) 處理。混合物攪拌隔夜且用水 (10 ml) 稀釋；所得懸浮液藉由水洗過濾，得到含有雜質之產物。此固體懸浮於 2% 甲醇/二氯甲烷中且過濾，得到標題化合物。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 1.78-2.00 (m, 2 H), 2.30 (t, *J*=7.3 Hz, 2 H), 2.62 (t, *J*=7.5 Hz, 2 H), 4.75 (s, 4 H), 7.08-7.41 (m, 9 H), 7.46 (s, 4 H), 8.26 (s, 1H), 9.73

(s, 1H); (ESI(+)) m/e 400 (M+H)⁺。

表 5.

以下實例基本上如實例 293 中所述，在實例 293A 中使用適當胺且在實例 293C 中用適當羧酸代替 4-苯基丁酸製備。一些產物藉由急驟層析純化，而其他產物藉由逆相 HPLC 純化；因此，一些實例呈三氟乙酸鹽形式分離。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
291	N-{4-[(4,4,4-三氟丁基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 2.52-2.69 (m, 4 H), 4.75 (s, 4 H), 7.23-7.40 (m, 4 H), 7.41-7.56 (m, 4 H), 8.28 (s, 1 H), 9.93 (s, 1 H)	(ESI(+)) m/e 378 (M+H) ⁺
292	N-{4-[(3-乙氧基丙基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬，溫度=90°C) δ ppm 7.44 (s, 4H), 7.32-7.37 (m, 2H), 7.28-7.32 (m, 2H), 4.76 (s, 4H), 3.68 (t, <i>J</i> =6.3 Hz, 2H), 3.47 (q, <i>J</i> =6.9 Hz, 2H), 2.50-2.55 (m, 2H), 1.11 (t, <i>J</i> =6.9 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 354 (M+H) ⁺
294	N-{4-[(4-甲基戊基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 0.90 (d, <i>J</i> =6.4 Hz, 6 H), 1.40-1.63 (m, 3 H), 2.18-2.39 (m, 2 H), 4.75 (s, 4 H), 7.20-7.41 (m, 4 H), 7.45 (s, 4 H), 8.26 (s, 1 H), 9.72 (s, 1 H)	(ESI(+)) m/e 352 (M+H) ⁺
295	N-(4-{[(苯甲氧基)乙基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬，溫度=90°C) δ ppm 7.47 (s, 4H), 7.28-7.43 (m, 9H), 4.76 (s, 4H), 4.64 (s, 2H), 4.07 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 402 (M+H) ⁺
296	N-{4-[(3-苯基丙基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬，溫度=90°C) δ ppm 7.42 (s, 4H), 7.22-7.37 (m, 8H), 7.15-7.20 (m, 1H), 4.76 (s, 4H), 2.93 (t, <i>J</i> =7.6 Hz, 2H), 2.59-2.63 (m, 2H)	(ESI(-)) m/e 384 (M-H) ⁻
297	N-{4-[(3-苯氧基丙基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬，溫度=90°C) δ ppm 7.45 (s, 4H), 7.26-7.36 (m, 6H), 6.92-6.96 (m, 2H), 6.91-6.95 (m, 1H), 4.76 (s, 4H), 4.29 (t, <i>J</i> =6.2 Hz, 2H), 2.76 (t, <i>J</i> =6.2 Hz, 2H)	(APCI(+)) m/e 402 (M+H) ⁺
298	N-(4-{[N-(2-呋喃甲基)甘胺基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬，溫度=90°C) δ ppm 7.76 (dd, <i>J</i> =1.8, 0.8 Hz, 1H), 7.42-7.48 (m, 4H), 7.29-7.36 (m, 4H), 7.12 (dd, <i>J</i> =3.5, 0.9 Hz, 1H), 6.62 (dd, <i>J</i> =3.4, 1.7 Hz, 1H), 4.76 (s, 4H), 4.04 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 405 (M+H) ⁺
299	N-(4-{[4-(2-噻吩基)丁基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬，溫度=90°C) δ ppm 7.43 (s, 4H), 7.32-7.38 (m, 2H), 7.28-7.32 (m, 2H), 7.25 (dd, <i>J</i> =5.2, 1.2 Hz,	(APCI(+)) m/e 406

	醯胺	1H), 6.94 (dd, $J=5.0, 3.4$ Hz, 1H), 6.86 (dq, $J=3.3, 1.1$ Hz, 1H), 4.76 (s, 4H), 2.87 (ddd, $J=8.1, 7.1, 1.0$ Hz, 2H), 2.37 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 1.96 (p, $J=7.4$ Hz, 2H)	(M+H) ⁺
300	N-{4-[(4-側氧基-4-苯基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.96-7.99 (m, 2H), 7.60-7.65 (m, 1H), 7.50-7.56 (m, 2H), 7.43 (s, 4H), 7.32-7.37 (m, 2H), 7.28-7.32 (m, 2H), 4.76 (s, 4H), 3.32 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 2.72 (t, $J=6.6$ Hz, 2H)	(ESI(-)) m/e 412 (M-H) ⁻
301	N-{4-[(N-苯甲醯基甘胺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.84-7.94 (m, 2H), 7.52-7.57 (m, 1H), 7.48-7.51 (m, 2H), 7.46 (s, 4H), 7.32-7.37 (m, 2H), 7.28-7.32 (m, 2H), 4.76 (s, 4H), 4.08 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 415 (M+H) ⁺
302	N-{4-[(4-苯氧基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.44 (s, 4H), 7.33-7.37 (m, 2H), 7.29-7.32 (m, 2H), 7.24-7.29 (m, 2H), 6.90-6.94 (m, 3H), 4.76 (s, 4H), 4.04 (t, $J=6.4$ Hz, 2H), 2.47 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 2.01-2.08 (m, 2H)	(ESI(-)) m/e 414 (M-H) ⁻
303	N-[4-(丙醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.43 (s, 4H), 7.29-7.36 (m, 4H), 4.76 (s, 4H), 2.30 (q, $J=7.6$ Hz, 2H), 1.11 (t, $J=7.5$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 310 (M+H) ⁺
304	N-[4-(戊醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.43 (s, 4H), 7.32-7.37 (m, 2H), 7.28-7.32 (m, 2H), 4.76 (s, 4H), 2.28 (t, $J=7.4$ Hz, 2H), 1.56-1.64 (m, 2H), 1.30-1.40 (m, 2H), 0.91 (t, $J=7.3$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 338 (M+H) ⁺
305	N-[4-(己醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.43 (s, 4H), 7.29-7.36 (m, 4H), 4.76 (s, 4H), 2.27 (t, $J=7.4$ Hz, 2H), 1.57-1.65 (m, 2H), 1.27-1.37 (m, 4H), 0.86-0.90 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 352 (M+H) ⁺
306	N-[4-(庚醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.43 (s, 4H), 7.29-7.36 (m, 4H), 4.76 (s, 4H), 2.28 (t, $J=7.4$ Hz, 2H), 1.60 (p, $J=7.1$ Hz, 2H), 1.25-1.39 (m, 6H), 0.83-0.91 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
307	N-[4-(戊-4-烯醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 2.24-2.44 (m, 4H), 4.75 (s, 4H), 4.91-5.14 (m, 2H), 5.72-5.97 (m, 1H), 7.25-7.40 (m, 4H), 7.46 (s, 4H), 8.26 (s, 1H), 9.76 (s, 1H)	(ESI(+)) m/e 336 (M+H) ⁺
308	N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.47-7.50 (m, 4H), 7.29-7.36 (m, 4H), 4.76 (s, 4H), 3.99 (s, 2H), 3.60 (q, $J=7.0$ Hz, 2H), 1.21 (t, $J=6.9$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 340 (M+H) ⁺
309	N-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.47 (s, 4H), 7.29-7.36 (m, 4H), 4.76 (s, 4H), 4.04 (s, 2H), 3.68-3.71 (m, 2H), 3.55-3.58 (m, 2H), 3.32 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 370 (M+H) ⁺

310	N-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.44 (s, 4H), 7.29-7.36 (m, 4H), 4.76 (s, 4H), 2.21 (d, <i>J</i> =6.9 Hz, 2H), 1.00-1.14 (m, 1H), 0.47-0.52 (m, 2H), 0.18-0.23 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 336 (M+H) ⁺
311	N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.43 (s, 4H), 7.29-7.36 (m, 4H), 4.76 (s, 4H), 2.25-2.30 (m, 3H), 1.73-1.81 (m, 2H), 1.49-1.64 (m, 4H), 1.18-1.27 (m, 2H)	(ESI(-)) m/e 362(M-H) ⁻
312	N-(4-{[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 7.42-7.48 (m, 4H), 7.29-7.36 (m, 4H), 4.76 (s, 4H), 3.22-3.25 (m, 4H), 3.03 (t, <i>J</i> =6.9 Hz, 2H), 2.97-3.01 (m, 4H), 2.77 (s, 3H), 2.62 (t, <i>J</i> =6.9 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) ⁺
564	5-氟基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 9.70 (s, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.78 (dd, <i>J</i> =7.9, 1.5 Hz, 1H), 7.58 (d, <i>J</i> =7.9 Hz, 1H), 7.51-7.40 (m, 4H), 4.84-4.76 (m, 4H), 2.31-2.15 (m, 3H), 1.81-1.67 (m, 2H), 1.67-1.45 (m, 4H), 1.29-1.11 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 389 (M+H) ⁺
596	N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-甲氧基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 9.68 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.50-7.38 (m, 4H), 7.25 (d, <i>J</i> =8.4 Hz, 1H), 6.95-6.91 (m, 1H), 6.90-6.83 (m, 1H), 4.68 (m, 4H), 3.76 (s, 3H), 2.31-2.15 (m, 3H), 1.83-1.68 (m, 2H), 1.67-1.40 (m, 4H), 1.29-1.11 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 394 (M+H) ⁺
649	5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 9.80 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.46 (s, 4H), 7.33-7.28 (m, 2H), 7.27-7.21 (m, 1H), 5.21 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 4.73 (bs, 4H), 4.51 (d, <i>J</i> =5.6 Hz, 2H), 3.85-3.70 (m, 2H), 3.64 (q, <i>J</i> =7.6 Hz, 1H), 2.61-2.52 (m, 2H), 2.42-2.32 (m, 2H), 2.12-1.94 (m, 1H), 1.62-1.47 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) ⁺
650	5-(羥基甲基)-N-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 9.19 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.48 (m, 4H), 7.31-7.19 (m, 3H), 4.86 (bs, 1H), 4.74 (bs, 4H), 4.53 (bs, 2H), 4.04 (s, 2H), 3.74-3.66 (m, 2H), 3.60-3.52 (m, 2H), 3.32 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 400 (M+H) ⁺
682	5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫呋喃-2-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 9.41 (bs, 1H), 8.01 (bs, 1H), 7.45-7.41 (m, 4H), 7.30-7.22 (m, 3H), 4.87 (bs, 1H), 4.73 (bs, 4H), 4.52 (bs, 2H), 4.22-4.14 (m, 1H), 3.82-3.75 (m, 1H), 3.66-3.59 (m, 1H), 2.53 (dd, <i>J</i> =14.1, 7.0 Hz, 1H), 2.40 (dd, <i>J</i> =14.0, 6.1 Hz, 1H), 2.05-1.94 (m, 1H), 1.92-1.76 (m, 2H), 1.64-1.51 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) ⁺
683	N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 9.52 (s, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.56-7.44 (m, 4H), 7.33-7.20 (m, 3H), 5.20 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 4.73 (bs, 4H), 4.51 (d, <i>J</i> =5.6 Hz, 2H), 4.00 (s, 2H), 3.56 (q, <i>J</i> =7.0 Hz, 2H), 1.19 (t, <i>J</i> =7.0 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 370 (M+H) ⁺

684	5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫-2H-吡喃-4-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 9.43 (bs, 1H), 8.00 (bs, 1H), 7.44-7.41 (m, 4H), 7.30-7.20 (m, 3H), 4.87 (bs, 1H), 4.73 (bs, 4H), 4.52 (bs, 2H), 3.86-3.78 (m, 2H), 3.38-3.26 (m, 2H), 2.23 (d, $J=7.0$ Hz, 2H), 2.07-1.94 (m, 1H), 1.66-1.58 (m, 2H), 1.35-1.20 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 410 (M+H) $^+$
685	5-(羥基甲基)-N-{4-[(嗎啉-4-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 9.32 (bs, 1H), 8.04 (bs, 1H), 7.49-7.45 (m, 4H), 7.32-7.22 (m, 3H), 4.89-4.83 (m, 1H), 4.74 (bs, 4H), 4.53 (bs, 2H), 3.68-3.62 (m, 4H), 3.10 (s, 2H), 2.57-2.51 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 411 (M+H) $^+$
789	N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-氯-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /D $_2$ O, 溫度=90°C) δ ppm 7.39 (m, 4H), 7.16 (dd, $J=9.1$, 2.6, 1H), 7.09 (m, 1H), 4.75 (bs, 2H), 4.72 (bs, 2H), 2.27 (m, 4H), 1.76 (m, 2H), 1.57 (m, 4H), 1.24 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) $^+$
791	N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(三氯甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /D $_2$ O, 溫度=90°C) δ 7.70 (s, 1H), 7.64 (dd, $J=8.0$, 1.6, 1H), 7.58 (d, $J=8.0$, 1H), 7.48-7.41 (m, 3H), 4.83 (s, 3H), 2.32-2.25 (m, 3H), 1.81-1.71 (m, 2H), 1.66-1.47 (m, 4H), 1.28-1.16 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 432 (M+H) $^+$
792	4-氯基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /D $_2$ O, 溫度=90°C) δ 7.70 (ddd, $J=12.2$, 7.7, 0.8, 2H), 7.52 (d, $J=7.7$, 1H), 7.45 (m, 5H), 4.93 (d, $J=1.3$, 2H), 4.83 (d, $J=0.7$, 2H), 2.28 (m, 4H), 1.77 (m, 2H), 1.57 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 389 (M+H) $^+$
793	N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-甲基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /D $_2$ O, 溫度=90°C) δ 7.42 (s, 4H), 7.22 (d, $J=7.8$, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.15-7.08 (m, 1H), 4.70 (bs, 4H), 2.35-2.23 (m, 4H), 1.82-1.71 (m, 2H), 1.66-1.47 (m, 4H), 1.30-1.16 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 378 (M+H) $^+$
794	4-氯-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /D $_2$ O, 溫度=90°C) δ 7.43 (m, 4H), 7.33 (m, 3H), 4.83 (m, 2H), 4.78 (m, 2H), 2.28 (m, 3H), 1.77 (m, 2H), 1.57 (m, 4H), 1.22 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 398 (M+H) $^+$
796	5-氯-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /D $_2$ O, 溫度=90°C) δ 7.35 (m, 7H), 4.74 (d, $J=6.7$, 4H), 2.27 (m, 3H), 1.78 (m, 2H), 1.57 (m, 4H), 1.21 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 398 (M+H) $^+$
874	5-乙醯基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 9.70 (s, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.96-7.88 (m, 2H), 7.54-7.40 (m, 5H), 4.81 (bs, 4H), 2.60 (s, 3H), 2.31-2.18 (m, 3H), 1.81-1.68 (m, 2H), 1.68-1.43 (m, 4H), 1.25-1.10 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 406 (M+H) $^+$
878	N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(1-羥基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 9.68 (s, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.47-7.44 (m, 4H), 7.32 (s, 1H), 7.27 (s, 2H), 5.15 (d, $J=4.0$ Hz, 1H), 4.78-4.67 (m, 5H), 2.30-2.15 (m, 3H), 1.82-1.68 (m, 2H), 1.67-1.45 (m, 4H), 1.33 (d, $J=6.4$ Hz, 3H),	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) $^+$

		1.26-1.13 (m, 2H)	
879	N-[4-(丁醯基胺基)苯基]-5-氯基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 9.72 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.79-7.73 (m, 1H), 7.59-7.53 (d, <i>J</i> =7.9 Hz, 1H), 7.48-7.40 (m, 4H), 4.83-4.75 (m, 4H), 2.24 (t, <i>J</i> =7.3 Hz, 2H), 1.65-1.53 (m, 2H), 0.90 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 349 (M+H) ⁺
919	5-(乙醯胺基甲基)-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 9.36 (bs, 1H), 8.04-7.95 (m, 2H), 7.48-7.39 (m, 4H), 7.30-7.17 (m, 3H), 4.73 (bs, 4H), 4.27 (d, <i>J</i> =5.9 Hz, 2H), 2.33-2.21 (m, 3H), 1.88 (s, 3H), 1.83-1.71 (m, 2H), 1.69-1.47 (m, 4H), 1.29-1.17 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) ⁺
932	N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(2-羥基丙-2-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 9.70 (s, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.50-7.41 (m, 5H), 7.42-7.36 (m, 1H), 7.29-7.23 (m, 1H), 5.03 (s, 1H), 4.72 (bs, 4H), 2.31-2.16 (m, 3H), 1.85-1.68 (m, 2H), 1.68-1.46 (m, 4H), 1.43 (s, 6H), 1.26-1.09 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 422 (M+H) ⁺
935	N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(甲氧基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 9.69 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.51-7.40 (m, 4H), 7.36-7.22 (m, 3H), 4.74 (bs, 4H), 4.42 (s, 2H), 3.29 (s, 3H), 2.35-2.15 (m, 3H), 1.81-1.68 (m, 2H), 1.68-1.43 (m, 4H), 1.26-1.10 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) ⁺

實例 313

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸甲酯

實例 313A

2-(4-硝基苯基胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸甲酯

標題化合物如實例 1A 中所述，用異氰酸 4-硝基苯酯代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯及異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽代替異吲哚啉製備。

實例 313B

2-(4-胺基苯基胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸甲酯

標題化合物如實例 274 中所述，用 2-(4-硝基苯基胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸甲酯代替 5-硝基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺製備。

實例 313C

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸甲酯

標題化合物如實例 278 中所述，用 2-(4-胺基苯基胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸甲酯代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及 2-環戊基乙醯氯代替乙醯氯製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.69 (s, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.94-7.94 (m, 1H), 7.89-7.96 (m, 1H), 7.51 (d, *J*=8.1 Hz, 1H), 7.41-7.49 (m, 4H), 4.75-4.82 (m, 4H), 3.87 (s, 3H), 2.24-2.29 (m, 2H), 2.15-2.28 (m, 1H), 1.68-1.81 (m, 2H), 1.44-1.67 (m, 4H), 1.13-1.24 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 422 (M+H)⁺。

實例 314

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸

標題化合物如實例 1B 中所述，用 2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸甲酯代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 12.97 (dd, *J*=4.1, 2.1 Hz, 1H), 9.70 (s, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.88-7.92 (m, 2H), 7.46-7.50 (m, 1H), 7.43-7.48 (m, 4H), 4.79-4.81 (bs, 4H), 2.24-2.30 (m, 2H), 2.16-2.29 (m, 1H), 1.68-1.81 (m, 2H), 1.44-1.67 (m, 4H), 1.10-1.27 (m, 2H); MS (ESI(-)) *m/e* 406 (M-H)⁻。

實例 315

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺

向 2-(4-(2-環戊基乙醯胺基)苯基胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸 (18 mg, 0.044 mmol) 於四氫呋喃中之攪拌懸浮液中逐滴添加 1 M 硼烷之四氫呋喃溶液 (0.18 mL, 0.18 mol)。混合物在 60°C 下加熱 1 小時。反應物冷卻至室溫且用若干滴 4 M HCl-二噁烷及甲醇處理，接著澄清溶液在室溫下攪拌 2 小時。濃縮反應物且藉由逆相 HPLC 純化，得到標題化合物。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.69 (s, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.45 (s, 4H), 7.28-7.32 (m, 2H), 7.22-7.26 (m, 1H), 5.18-5.22 (m, 1H), 4.72-4.73 (bs, 4H), 4.50-4.53 (bs, 2H), 2.17-2.32 (m, 3H), 1.70-1.80 (m, 2H), 1.44-1.67 (m, 4H), 1.13-1.24 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 394 (M+H)⁺。

實例 316

N-{4-[(2-環戊基乙基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺

向 2-(4-(2-環戊基乙醯胺基)苯基胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸 (18 mg, 0.044 mmol) 於四氫呋喃中之攪拌懸浮液中逐滴添加 1 M 硼烷之四氫呋喃溶液 (0.18 mL, 0.18 mol)。混合物在 60°C 下加熱 1 小時。反應物冷卻至室溫且用若干滴 4 M HCl-二噁烷及甲醇處理，接著澄清溶液在室溫下攪拌 2 小時。濃縮反應物且藉由逆相 HPLC 純化，得到標題化合物。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 7.92 (s, 1H), 7.27-7.31 (m, 2H), 7.24 (d, *J*=8.1 Hz, 1H), 7.15-7.20 (m, 2H), 6.45-6.51 (m, 2H), 5.17-5.21 (m, 2H), 4.68-4.69 (bs,

N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲鹽基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

4H), 4.51 (d, $J=5.4$ Hz, 2H), 2.97 (q, $J=6.7$ Hz, 2H), 1.70-1.95 (m, 3H), 1.42-1.66 (m, 6H), 1.04-1.20 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 380 ($M+H$)⁺。

實例 317

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}-3,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯

實例 317A

N-(4-溴苯基)異吡啶啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用異氰酸 4-溴苯酯代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。

實例 317B

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}-3,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 280 中所述，用 4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯代替 1H-吡啶-3-基醯胺及 N-(4-溴苯基)異吡啶啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吡啶啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.38 (s, 1H), 7.55-7.57 (m, 2H), 7.26-7.42 (m, 6H), 6.06-6.09 (bs, 1H), 4.76-4.77 (bs, 4H), 3.97-4.00 (m, 2H), 3.51-3.55 (m, 2H), 2.42-2.46 (m, 2H), 1.43 (s, 9H); MS (ESI(-)) m/e 418 ($M-H$)⁻。

實例 318

N-[4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-

甲 醯 胺

標題化合物如實例2D中所述，用4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羧基)胺基]苯基}-3,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯代替4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.44 (s, 1H), 7.58-7.61 (m, 2H), 7.30-7.41 (m, 6H), 6.12-6.14 (bs, 1H), 4.77-4.78 (bs, 4H), 3.70-3.72 (m, 2H), 3.27-3.31 (m, 2H), 2.60-2.64 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 320 (M+H)⁺。

實 例 319

N-{4-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例280中所述，用1-異戊基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-1H-吡唑代替1H-吡唑-3-基酮酸及N-(4-溴苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 0.91 (d, *J*=6.4 Hz, 6H), 1.40-1.60 (m, 1H), 1.70 (q, *J*=6.8 Hz, 2 H), 4.11 (t, *J*=7.1 Hz, 2 H), 4.77 (s, 4 H), 7.13-7.40 (m, 4 H), 7.42-7.50 (m, 2 H), 7.50-7.61 (m, 2 H), 7.78 (s, 1H), 8.08 (s, 1H), 8.32 (s, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 375 (M+H)⁺。

實 例 320

N-[4-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 1-甲基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-1H-吡唑代替 1H-吡唑-3-基酮酸及 N-(4-溴苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 3.84 (s, 3 H), 4.77 (s, 4 H), 7.24-7.40 (m, 4 H), 7.40-7.49 (m, 2 H), 7.50-7.60 (m, 2 H), 7.77 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 8.33 (s, 1H); MS (ESI(+)) m/e 319 (M+H)⁺。

實例 321

N-{4-[(1E)-5-苯基戊-1-烯-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 (E)-4,4,5,5-四甲基-2-(5-苯基戊-1-烯基)-1,3,2-二氧硼啉代替 1H-吡唑-3-基酮酸及 N-(4-溴苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 1.60-1.84 (m, 2 H), 2.19 (q, *J*=7.0 Hz, 2 H), 2.55-2.71 (m, 2 H), 4.76 (s, 4 H), 6.12-6.27 (m, 1 H), 6.26-6.43 (m, 1 H), 7.09-7.44 (m, 11 H), 7.52 (d, *J*=8.5 Hz, 2 H), 8.33 (s, 1 H); MS (ESI(+)) m/e 383 (M+H)⁺。

實例 322

N-[4-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 1-丙基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-1H-吡唑代替 1H-吡唑-3-基酮酸及 N-(4-溴苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺

甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 0.85 (t, *J*=7.3 Hz, 3 H), 1.69-1.93 (m, 2 H), 4.05 (t, *J*=6.9 Hz, 2 H), 4.77 (s, 4 H), 7.26-7.40 (m, 4 H), 7.42-7.49 (m, 2 H), 7.52-7.61 (m, 2 H), 7.79 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 8.33 (s, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 347 (M+H)⁺。

實例 323

N-[4-(1-苯甲基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 1-苯甲基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-1H-吡唑代替 1H-吡唑-3-基酮酸及 N-(4-溴苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 4.77 (s, 4 H), 5.33 (s, 2 H), 7.21-7.42 (m, 9 H), 7.41-7.51 (m, 2 H), 7.51-7.61 (m, 2 H), 7.84 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.33 (s, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 395 (M+H)⁺。

實例 324

N-{4-[1-(2-羥基乙基)-1H-吡唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-1H-吡唑-1-基)乙醇代替 1H-吡唑-3-基酮酸及 N-(4-溴苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 3.76 (q, *J*=5.8 Hz, 2 H), 4.14 (t,

$J=5.6$ Hz, 2 H), 4.77 (s, 4 H), 4.90 (t, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.25-7.41 (m, 4 H), 7.41-7.51 (m, 2 H), 7.51-7.60 (m, 2 H), 7.80 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.32 (s, 1H); MS (ESI(+)) m/e 349 (M+H)⁺。

實例 325

N-[6-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)吡啶-3-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 325A

N-(6-氯吡啶-3-基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用 2-氯-5-異氰酸酯基吡啶代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。

實例 325B

N-[6-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)吡啶-3-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 1-丙基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-1H-吡唑代替 1H-吡唑-3-基酮酸及 N-(6-氯吡啶-3-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.90-8.92 (bs, 1H), 8.84 (d, $J=2.5$ Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.25 (dd, $J=8.8, 2.5$ Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.87 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.31-7.41 (m, 4H), 4.79-4.83 (bs, 4H), 4.13 (t, $J=6.9$ Hz, 2H), 1.77-1.89 (m, 2H), 0.86 (t, $J=7.3$ Hz, 3H); MS (ESI(+)) m/e 348 (M+H)⁺。

實例 326

N-{6-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例280中所述，用1-異戊基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-1H-吡唑代替1H-吡唑-3-基醯酸及N-(6-氯吡啶-3-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.85-8.87 (bs, 1H), 8.81 (d, *J*=2.5 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.21 (dd, *J*=8.8, 2.5 Hz, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.82 (d, *J*=8.8 Hz, 1H), 7.31-7.41 (m, 4H), 4.78-4.83 (bs, 4H), 4.19 (t, *J*=7.1 Hz, 2H), 1.71 (q, *J*=7.0 Hz, 2H), 1.40-1.59 (m, 1H), 0.92 (d, *J*=6.6 Hz, 6H); MS (ESI(-)) *m/e* 374 (M-H)⁻。

實例327

N-[4-(5-苯基戊基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例274中所述，用N-{4-[(1E)-5-苯基戊-1-烯-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替5-硝基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 1.21-1.40 (m, 4 H), 1.49-1.67 (m, 4 H), 2.45-2.62 (m, 2 H), 4.75 (s, 4 H), 7.05 (d, *J*=8.7 Hz, 2 H), 7.14-7.40 (m, 9 H), 7.44 (d, *J*=8.3 Hz, 2 H), 8.23 (s, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 385 (M+H)⁺。

實例328

N-[2-氯-4-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲

哌-2-甲醯胺

實例 328A

N-(4-溴-2-氟苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用 4-溴-2-氟-1-異氰酸酯基苯代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。

實例 328B

N-[2-氟-4-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 1-丙基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-1H-吡唑代替 1H-吡唑-3-基酮酸及 N-(4-溴-2-氟苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.19 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.57 (t, *J*=8.4 Hz, 1H), 7.46 (dd, *J*=12.1, 1.9 Hz, 1H), 7.24-7.39 (m, 5H), 4.76-4.78 (bs, 4H), 4.06 (t, *J*=6.9 Hz, 2H), 1.75-1.88 (m, 2H), 0.86 (t, *J*=7.3 Hz, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 365 (M+H)⁺。

實例 329

N-{2-氟-4-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 1-異戊基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-1H-吡唑代替 1H-吡唑-3-基酮酸及 N-(4-溴-2-氟苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR

(300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.21 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.56 (t, $J=8.4$ Hz, 1H), 7.46 (dd, $J=12.1, 1.9$ Hz, 1H), 7.25-7.41 (m, 5H), 4.76-4.81 (m, 4H), 4.12 (t, $J=7.2$ Hz, 2H), 1.70 (q, $J=7.1$ Hz, 2H), 1.40-1.59 (m, 1H), 0.91 (d, $J=6.6$ Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 393 ($M+H$)⁺。

實例 330

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用丁醯氯代替乙醯氯及 N-[4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.38 (s, 1H), 7.55-7.58 (m, 2H), 7.27-7.38 (m, 6H), 6.09-6.11 (m, 1H), 4.77 (s, 4H), 4.08-4.14 (m, 2H), 3.58-3.68 (m, 2H), 2.39-2.51 (m, 2H), 2.34 (dt, $J=19.8, 7.3$ Hz, 2H), 1.46-1.62 (m, 2H), 0.88-0.93 (m, 3H); MS (ESI(+)) m/e 390 ($M+H$)⁺。

實例 331

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用異丁醯氯代替乙醯氯及 N-[4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.40

(s, 1H), 7.55-7.58 (m, 2H), 7.30-7.38 (m, 6H), 6.11-6.13 (bs, 1H), 4.76-4.77 (bs, 4H), 4.19-4.21 (m, 1H), 4.08-4.09 (m, 1H), 3.65-3.72 (m, 2H), 2.85-3.00 (m, 1H), 2.40-2.56 (m, 2H), 1.00-1.07 (m, 6H); MS (ESI(+)) m/e 390 (M+H)⁺。

實例 332

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用苯甲醯氯代替乙醯氯及 N-[4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.39 (s, 1H), 7.56-7.59 (m, 2H), 7.44-7.49 (m, 5H), 7.34-7.40 (m, 4H), 7.29-7.34 (m, 2H), 5.91-6.27 (m, 1H), 4.76-4.77 (bs, 4H), 4.02-4.26 (m, 2H), 3.36-3.59 (m, 2H), 2.51-2.61 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 424 (M+H)⁺。

實例 333

N-{4-[1-(異丙基磺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 283 中所述，用丙烷-2-磺醯氯代替甲烷磺醯氯及 N-[4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.38-8.40 (m, 1H), 7.56-7.59 (m, 2H), 7.29-7.38

(m, 6H), 6.11-6.14 (m, 1H), 4.76-4.80 (m, 4H), 3.93-3.96 (m, 2H), 3.49 (t, $J=5.5$ Hz, 2H), 3.35-3.45 (m, 1H), 2.47-2.51 (m, 2H), 1.24 (d, $J=6.9$ Hz, 6H); MS (ESI(-)) m/e 424 (M-H)⁻。

實例 334

N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 334A

4-(5-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)吡啶-2-基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 280 中所述，用 4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯代替 1H-吡啶-3-基硼酸及 N-(6-氯吡啶-3-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。

實例 334B

N-(6-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)吡啶-3-基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 2D 中所述，用 4-(5-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)吡啶-2-基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 334C

4-(5-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)吡啶-2-基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氟基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

標題化合物如實例278中所述，用異丁醯氯代替乙醯氯及N-(6-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)吡啶-3-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆, 溫度=90°C) δ ppm 8.70 (d, *J*=2.6 Hz, 1H), 8.33-8.37 (m, 1H), 7.95 (dd, *J*=8.6, 2.6 Hz, 1H), 7.44 (d, *J*=8.6 Hz, 1H), 7.28-7.36 (m, 4H), 6.54-6.56 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.16-4.18 (m, 2H), 3.68 (t, *J*=5.7 Hz, 2H), 2.86-2.97 (m, 1H), 2.54-2.63 (m, 2H), 1.04 (d, *J*=6.7 Hz, 6H); MS (ESI(-)) *m/e* 389 (M-H)⁻。

實例335

N-(1'-苯甲醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例278中所述，用苯甲醯氯代替乙醯氯及N-(6-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)吡啶-3-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.71 (d, *J*=2.5 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.01 (dd, *J*=8.6, 2.2 Hz, 1H), 7.42-7.54 (m, 6H), 7.35-7.39 (m, 2H), 7.29-7.35 (m, 2H), 6.46-6.67 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.05-4.32 (m, 2H), 3.77-3.94 (m, 1H), 3.47-3.58 (m, 1H), 2.61-2.65 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 425 (M+H)⁺。

實例336

N-[4-(4-苯甲醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

實例 336A

N-(4-(哌嗪-1-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 2D 中所述，用 4-(4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯基)哌嗪-1-甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 336B

N-[4-(4-苯甲醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用苯甲醯氯代替乙醯氯及 N-(4-(哌嗪-1-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.14 (s, 1H), 7.38-7.50 (m, 7H), 7.28-7.38 (m, 4H), 6.87-6.91 (m, 2H), 4.74 (s, 4H), 3.39-3.90 (m, 4H), 3.01-3.17 (m, 4H); MS (ESI(+)) *m/e* 427 (M+H)⁺。

實例 337

N-{4-[4-(異丙基磺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 283 中所述，用異丙基磺醯氯代替甲烷磺醯氯及 N-(4-(哌嗪-1-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.16 (s, 1H), 7.39-7.45 (m, 2H), 7.27-7.38 (m, 4H), 6.88-6.92 (m, 2H),

4.74 (s, 4H), 3.07-3.12 (m, 4H), 1.25 (d, $J=6.8$ Hz, 6H);
MS (ESI(+)) m/e 429 ($M+H$)⁺。

實例 338

N-{4-[4-(苯基磺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 283 中所述，用苯磺醯氯代替甲烷磺醯氯及 N-(4-(哌嗪-1-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.14 (s, 1H), 7.65-7.80 (m, 5H), 7.35-7.41 (m, 2H), 7.27-7.37 (m, 4H), 6.81-6.85 (m, 2H), 4.72 (s, 4H), 3.09-3.15 (m, 4H), 2.99-3.04 (m, 4H); MS (ESI(-)) m/e 461 ($M-H$)⁻。

實例 339

N-{4-[3-(苯甲醯基胺基)吡咯啉-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 339A

1-(4-硝基苯基)吡咯啉-3-基胺基甲酸第三丁酯

1-氟-4-硝基苯(508 mg, 3.6 mmol)及吡咯啉-3-基胺基甲酸第三丁酯(671 mg, 3.6 mmol)於 N,N-二甲基甲醯胺(7 mL)中之溶液在 55°C 下加熱 1.5 小時，接著在室溫下攪拌隔夜。反應混合物傾倒至水中且懸浮液藉由水洗過濾，乾燥後得到標題化合物。

實例 339B

1-(4-胺基苯基)吡咯啉-3-基胺基甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 274 中所述，用 (+/-)-1-(4-硝基苯基)吡咯啉-3-基胺基甲酸第三丁酯代替 5-硝基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺製備。

實例 339C

1-(4-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)苯基)吡咯啉-3-基胺基甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 272 中所述，在實例 272B 中用 (+/-)-1-(4-胺基苯基)吡咯啉-3-基胺基甲酸第三丁酯代替 4-胺基-N-丙基苯甲鹽胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。

實例 339D

N-[4-(3-胺基吡咯啉-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 2 中所述，在實例 2D 中用 (+/-)-1-(4-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)苯基)吡咯啉-3-基胺基甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲鹽胺基)苯甲鹽胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 339E

N-{4-[(3R)-3-(苯甲鹽基胺基)吡咯啉-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺及 N-{4-[(3S)-3-(苯甲鹽基胺基)吡咯啉-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 278 中所述，用苯甲鹽氯代替乙鹽氯及 (+/-)-N-(4-(3-胺基吡咯啉-1-基)苯基)異吲哚啉-2-甲鹽胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲鹽基)苯基)異吲哚啉-2-甲鹽胺

製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.61 (d, *J*=6.8 Hz, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.85-7.89 (m, 2H), 7.42-7.56 (m, 3H), 7.28-7.37 (m, 6H), 6.50 (d, *J*=8.7 Hz, 2H), 4.72 (s, 4H), 4.56-4.67 (m, 1H), 3.53-3.59 (m, 1H), 3.36-3.45 (m, 1H), 3.16-3.24 (m, 1H), 2.22-2.31 (m, 1H), 2.03-2.13 (m, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 427 (M+H)⁺。

實例 340

N-{4-[(3R)-3-(丁醯基胺基)吡咯啉-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺及 N-{4-[(3S)-3-(丁醯基胺基)吡咯啉-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用丁醯氯代替乙醯氯製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.06 (d, *J*=6.9 Hz, 1H), 7.28-7.37 (m, 6H), 6.47 (d, *J*=8.7 Hz, 2H), 4.72 (s, 4H), 4.36 (h, *J*=5.7 Hz, 1H), 3.41-3.47 (m, 1H), 3.17-3.23 (m, 1H), 2.89-3.05 (m, 1H), 2.10-2.28 (m, 1H), 2.05 (t, *J*=7.3 Hz, 2H), 1.81-1.96 (m, 1H), 1.45-1.58 (m, 2H), 0.85 (t, *J*=7.4 Hz, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 393 (M+H)⁺。

實例 341

4-(4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基)哌嗪-1-甲酸第三丁酯

實例 341A

4-(4-硝基苯基)哌嗪-1-甲酸第三丁酯

1-氟-4-硝基苯 (500 mg, 3.54 mmol) 及哌嗪-1-甲酸第三丁酯 (726 mg, 3.9 mmol) 於二甲基甲醯胺中之溶液用碳酸

鉀 (735 mg, 5.32 mmol) 處理且懸浮液在 55°C 下加熱 4 小時，接著在室溫下攪拌隔夜。反應物傾倒至水中且懸浮液藉由水洗過濾，真空乾燥後得到標題化合物。

實例 341B

4-(4-胺基苯基)哌嗪-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 274 中所述，用 4-(4-硝基苯基)哌嗪-1-甲酸第三丁酯代替 5-硝基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺製備。

實例 341C

4-(4-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)苯基)哌嗪-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-(4-胺基苯基)哌嗪-1-甲酸第三丁酯代替 4-胺基-N-丙基苯甲鹽胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.14 (s, 1H), 7.38-7.44 (m, 2H), 7.27-7.39 (m, 4H), 6.88-6.90 (m, 1H), 6.86 (s, 1H), 4.73 (s, 4H), 3.40-3.51 (m, 4H), 2.98-3.02 (m, 4H), 1.42 (s, 9H); MS (ESI(-)) m/e 421 (M-H)⁻。

實例 342

N-[4-(4-丙鹽基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 278 中所述，用丙鹽氯代替乙鹽氯及 N-(4-(哌嗪-1-基)苯基)異吲哚啉-2-甲鹽胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲鹽基)苯基)異吲哚啉-2-甲鹽胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.14 (s, 1H), 7.38-7.44 (m,

2H), 7.28-7.39 (m, 4H), 6.87-6.90 (m, 2H), 4.74 (s, 4H), 3.54-3.60 (m, 4H), 2.95-3.10 (m, 4H), 2.36 (q, $J=7.4$ Hz, 2H), 1.03 (s, 1H), 1.00 (d, $J=7.4$ Hz, 2H); MS (ESI(+)) m/e 379 (M+H)⁺。

實例 343

N-{4-[4-(環丙基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用環丙烷羰基氯代替乙醯氯及 N-(4-(哌嗪-1-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.15 (s, 1H), 7.38-7.45 (m, 2H), 7.28-7.39 (m, 4H), 6.87-6.93 (m, 2H), 4.74 (s, 4H), 3.73-3.90 (m, 2H), 3.50-3.70 (m, 2H), 3.02-3.18 (m, 4H), 1.98-2.07 (m, 1H), 0.68-0.77 (m, 4H); MS (ESI(-)) m/e 389 (M-H)⁻。

實例 344

N-(2-丁醯基-2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 344A

5-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)異吲哚啉-2-甲酸第三丁酯

在 250 mL 圓底燒瓶中在室溫下三光氣 (234 mg, 0.790 mmol) 混合於無水二氯甲烷 (25 mL) 中。向此溶液中經 15 分鐘逐滴添加 5-胺基異吲哚啉-2-甲酸第三丁酯 (500 mg, 2.134 mmol) 及二異丙基乙胺 (0.410 mL, 2.347 mmol) 於無

水二氯甲烷(20 mL)中之漿狀物。混合物在室溫下攪拌隔夜。異吲哚啉(0.242 ml, 2.134 mmol)及二異丙基乙胺(0.410 ml, 2.347 mmol)於無水二氯甲烷(20 mL)中之溶液一次性添加。反應物在室溫下攪拌隔夜。移除溶劑且殘餘物藉由正相急驟層析純化，得到標題化合物。

實例 344B

N-(異吲哚啉-5-基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 2D 中所述，用 5-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)異吲哚啉-2-甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 344C

N-(2-丁醯基-2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用丁醯氯代替乙醯氯及 N-(異吲哚啉-5-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.39 (s, 1H), 7.59-7.61 (bs, 1H), 7.43-7.48 (m, 1H), 7.30-7.41 (m, 4H), 7.22 (t, *J*=7.7 Hz, 1H), 4.77 (d, *J*=13.9 Hz, 2H), 4.77 (s, 4H), 4.55-4.60 (m, 2H), 2.33 (td, *J*=7.3, 3.7 Hz, 2H), 1.54-1.63 (m, 2H), 0.93 (td, *J*=7.3, 1.4 Hz, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 350 (M+H)⁺。

實例 345

N-(2-異丁醯基-2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基)-1,3-二氫-2H-異

吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用異丁醯氯代替乙醯氯及 N-(異吲哚啉-5-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.40 (s, 1H), 7.59-7.61 (bs, 1H), 7.46 (ddd, *J*=10.8, 8.5, 2.1 Hz, 1H), 7.30-7.38 (m, 4H), 7.20-7.24 (m, 1H), 4.82-4.87 (m, 2H), 4.76-4.77 (bs, 4H), 4.55-4.60 (m, 2H), 2.78 (h, *J*=6.9 Hz, 1H), 1.07 (d, *J*=6.7 Hz, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 350 (M+H)⁺。

實例 346

N-(2-苯甲醯基-2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基)-1,3-二氫-2H-異

吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用苯甲醯氯代替乙醯氯及 N-(異吲哚啉-5-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.40 (d, *J*=8.8 Hz, 1H), 7.59-7.67 (m, 3H), 7.11-7.52 (m, 9H), 4.68-4.84 (m, 8H); MS (ESI(+)) *m/e* 384 (M+H)⁺。

實例 347

N-[2-(3-甲基丁基)-2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基]-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 429 中所述，用 3-甲基丁醛代替異丁醛及 N-(異吲哚啉-5-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H

NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.28 (s, 1H), 7.47 (s, 1H), 7.29-7.37 (m, 5H), 7.09 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 4.75 (s, 4H), 3.77-3.79 (m, 2H), 3.74-3.76 (m, 2H), 2.64 (t, $J=7.5$ Hz, 2H), 1.60-1.71 (m, 1H), 1.37-1.43 (m, 2H), 0.91 (d, $J=6.6$ Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 350 ($M+H$)⁺。

實例 348

N-[4-(己氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用 1-(己氧基)-4-異氰酸酯基苯代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.17 (s, 1H), 7.39-7.45 (m, 2H), 7.27-7.39 (m, 4H), 6.81-6.85 (m, 2H), 4.74 (s, 4H), 3.91 (t, $J=6.5$ Hz, 2H), 1.64-1.73 (m, 2H), 1.35-1.47 (m, 2H), 1.23-1.38 (m, 4H), 0.85-0.91 (m, 3H); MS (ESI(+)) m/e 339 ($M+H$)⁺。

實例 349

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-

甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用苯甲醯氯代替乙醯氯及 N-[4-(哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 7.39-7.47 (m, 3 H) 7.22-7.40 (m, 6 H) 6.27 (t, $J=5.43$ Hz, 1H) 4.56 (s, 4 H) 4.36-4.52 (br s, 1H) 3.52 (br s, 1H) 3.00-3.15 (m, 2 H) 2.93 (br s, 1H) 0.93-1.86 (一系列 br m, 12 H); MS (ESI(+)) m/e

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

1-{4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}氮雜環丁烷-3-甲酸甲酯；

N-(4-{3-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(苯甲基胺甲醯基)氮雜環丁烷-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(環戊基胺甲醯基)氮雜環丁烷-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(環戊基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

406 (M+H)⁺。

實例 350

N-{4-[1-(吡啶-3-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用菸鹼醯氯鹽酸鹽代替
 乙醯氯及 N-[4-(哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲
 醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲
 醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 8.58-8.71
 (m, 2 H) 7.87 (d, J=7.5 Hz, 1H) 7.52 (dd, J=7.5, 4.8 Hz,
 1H) 7.22-7.36 (m, 4 H) 6.28 (br m, 1H) 4.56 (s, 4 H) 4.44
 (br m, 1H) 3.38-3.57 (br m, 1H) 2.95-3.15 (br m, 2 H) 2.68-
 2.84 (br m, 1H) 0.95-1.84 (一系列 br m, 12 H) ; MS
 (ESI(+)) m/e 407 (M+H)⁺。

實例 351

N-[6-(4-氯苯氧基)己基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 344A 中所述，用 6-(4-氯苯氧基)己-1-
 胺代替 5-胺基異吲哚啉-2-甲酸第三丁酯製備。¹H NMR
 (300 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 1.40 (q, 6 H), 1.70 (q, 2 H),
 3.08 (q, J=6.8 Hz, 2 H), 3.95 (t, J=6.4 Hz, 2 H), 4.57 (s, 4
 H), 6.27 (t, J=5.4 Hz, 1H), 6.85-7.01 (m, 2 H), 7.21-7.39
 (m, 6 H) ; MS (ESI(+)) m/e 373 (M+H)⁺。

實例 352

N-[4-(哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 352A

4-(4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)丁基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例344中所述，在實例344A中用4-(4-胺基丁基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替5-胺基異吲哚啉-2-甲酸第三丁酯製備。

實例352B

N-[4-(哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例2D中所述，用4-(4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)丁基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 1.14-1.34 (m, 6 H), 1.35-1.57 (m, 3 H), 1.76 (d, J=12.30 Hz, 2 H), 2.69-2.89 (m, 2 H), 3.07 (q, J=6.74 Hz, 2 H), 3.21 (d, J=12.70 Hz, 2 H), 4.57 (s, 4 H), 6.29 (t, J=5.55 Hz, 1H), 7.11-7.41 (m, 4 H), 8.31 (s, 1H); MS (ESI(+)) m/e 299 (M+H)⁺。

實例353

N,N'-己-1,6-二基雙(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺)

標題化合物如實例1A中所述，用1,6-二異氰酸酯基己烷代替4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 7.19-7.37 (m, 8 H) 6.28 (t, J=5.59 Hz, 2 H) 4.57 (s, 8 H) 3.07 (q, J=6.8 Hz, 4 H) 1.37-1.55 (m, 4 H) 1.21-1.37 (m, 4 H); MS (ESI(+)) m/e 407 (M+H)⁺。

實例354

N-(4-苯基丁基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例1A中所述，用(4-異氰酸酯基丁基)苯

代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。 ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 7.24-7.33 (m, 6H), 7.13-7.22 (m, 3H), 6.30 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 4.56 (s, 4H), 3.06-3.13 (m, 2H), 2.59 (t, $J=7.4$ Hz, 2H), 1.51-1.65 (m, 2H), 1.40-1.53 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 295 ($M+H$) $^+$ 。

實例 355

6-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]己酸乙酯

標題化合物如實例 1A 中所述，用 6-異氰酸酯基己酸乙酯代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。 ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 7.25-7.33 (m, 4H), 6.29 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 4.57 (s, 4H), 4.04 (q, $J=7.1$ Hz, 2H), 3.02-3.09 (m, 2H), 2.28 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 1.48-1.60 (m, 2H), 1.39-1.50 (m, 2H), 1.23-1.34 (m, 2H), 1.16 (t, $J=7.1$ Hz, 3H); MS (ESI(+)) m/e 305 ($M+H$) $^+$ 。

實例 356

N-己基-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用 1-異氰酸酯基己烷代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。 ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 7.25-7.33 (m, 4H), 6.27 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 4.57 (s, 4H), 3.02-3.10 (m, 2H), 1.36-1.51 (m, 2H), 1.25-1.30 (m, 6H), 0.81-0.92 (m, 3H); MS (ESI(-)) m/e 245 ($M-H$) $^-$ 。

實例 357

N-(3-苯基丙基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1A中所述，用(3-異氰酸酯基丙基)苯代替4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。 ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 7.11-7.37 (m, 9H), 6.31 (t, $J=5.5$ Hz, 1H), 4.57 (s, 4H), 3.07-3.14 (m, 2H), 2.60 (t, $J=7.6$ Hz, 2H), 1.71-1.81 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 281 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ 。

實例358

N-辛基-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1A中所述，用1-異氰酸酯基辛烷代替4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。 ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 7.24-7.35 (m, 4H), 6.27 (t, $J=5.5$ Hz, 1H), 4.57 (s, 4H), 3.02-3.09 (m, 2H), 1.40-1.47 (m, 2H), 1.25-1.27 (m, 10H), 0.81-0.89 (m, 3H); MS (ESI(+)) m/e 275 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ 。

實例359

N-{6-[(1-甲基-1H-吡啶-4-基)胺基]-6-側氧基己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺

實例359A

6-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]己酸

標題化合物如實例1B中所述，用6-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]己酸乙酯代替4-(異吡啶啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯製備。

實例359B

N-{6-[(1-甲基-1H-吡啶-4-基)胺基]-6-側氧基己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用1-甲基-1H-吡唑-4-胺代替3-苯基丙-1-胺及6-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]己酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.81 (s, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.34-7.36 (m, 1H), 7.24-7.34 (m, 4H), 6.28 (t, *J*=5.5 Hz, 1H), 4.56 (s, 4H), 3.75 (s, 3H), 3.03-3.10 (m, 2H), 2.22 (t, *J*=7.3 Hz, 2H), 1.51-1.64 (m, 2H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.23-1.34 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 356 (M+H)⁺。

實例360

N-[6-(甲基胺基)-6-側氧基己基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用甲胺代替3-苯基丙-1-胺及6-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]己酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 7.60-7.72 (m, 1H), 7.25-7.33 (m, 4H), 6.24-6.29 (m, 1H), 4.57 (s, 4H), 2.94-3.09 (m, 2H), 2.54 (d, *J*=4.6 Hz, 3H), 2.30 (t, *J*=7.3 Hz, 1H), 2.04 (t, *J*=7.4 Hz, 1H), 1.37-1.58 (m, 4H), 1.18-1.35 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 290 (M+H)⁺。

實例361

N-{6-側氧基-6-[(3-苯基丙基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用6-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]己酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲

酸製備。 ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 7.75-7.80 (m, 1H), 7.24-7.34 (m, 6H), 7.12-7.22 (m, 3H), 6.27 (t, $J=5.5$ Hz, 1H), 4.56 (s, 4H), 2.98-3.11 (m, 4H), 2.52-2.58 (m, 2H), 2.06 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 1.62-1.72 (m, 2H), 1.37-1.58 (m, 4H), 1.12-1.33 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 394 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ 。

實例 362

N-{6-[(3-甲基丁基)胺基]-6-側氧基己基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 3-甲基丁-1-胺代替 3-苯基丙-1-胺及 6-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]己酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。 ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 7.64-7.69 (m, 1H), 7.24-7.34 (m, 4H), 6.26 (t, $J=5.5$ Hz, 1H), 4.57 (s, 4H), 2.99-3.10 (m, 4H), 2.03 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 1.41-1.59 (m, 5H), 1.21-1.30 (m, 4H), 0.84 (d, $J=6.6$ Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 346 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ 。

實例 363

N-{3-側氧基-3-[(3-苯基丙基)胺基]丙基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺

實例 363A

3-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)丙酸乙酯

標題化合物如實例 1A 中所述，用 3-異氰酸酯基丙酸乙酯代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。

實例 363B

3-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)丙酸

標題化合物如實例 1B 中所述，用 3-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)丙酸乙酯代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯製備。

實例 363C

N-{3-側氧基-3-[(3-苯基丙基)胺基]丙基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 3-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)丙酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 7.87-7.92 (m, 1H), 7.22-7.32 (m, 6H), 7.12-7.19 (m, 3H), 6.36 (t, *J*=5.5 Hz, 1H), 4.56 (s, 4H), 3.24-3.32 (m, 2H), 3.03-3.10 (m, 2H), 2.52-2.60 (m, 2H), 2.30 (t, *J*=7.0 Hz, 2H), 1.63-1.74 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 352 (M+H)⁺。

實例 364

N-{3-側氧基-3-[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]丙基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 1-(吡啶-2-基)哌嗪代替 3-苯基丙-1-胺及 3-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)丙酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.11 (ddd, *J*=4.9, 2.0, 0.8 Hz, 1H), 7.53 (ddd, *J*=8.7, 7.0, 1.9 Hz, 1H), 7.25-7.34 (m, 4H), 6.83 (d, *J*=8.6 Hz, 1H), 6.65 (ddd, *J*=7.1, 4.9, 0.8 Hz, 1H), 6.37 (t, *J*=5.6

Hz, 1H), 4.57 (s, 4H), 3.44-3.61 (m, 8H), 3.28-3.37 (m, 2H), 2.54-2.61 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 380 (M+H)⁺。

實例 365

N-{3-[(3-甲基丁基)胺基]-3-側氧基丙基}-1,3-二氫-2H-異
 吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 3-甲基丁-1-胺代替 3-苯基丙-1-胺及 3-(異吡啶啉-2-甲醯胺基)丙酸代替 4-(異吡啶啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 7.76-7.81 (m, 1H), 7.25-7.34 (m, 4H), 6.31-6.36 (m, 1H), 4.56 (s, 4H), 3.23-3.31 (m, 2H), 3.02-3.09 (m, 2H), 2.27 (t, *J*=7.0 Hz, 2H), 1.46-1.62 (m, 1H), 1.27 (q, *J*=7.1 Hz, 2H), 0.84 (d, *J*=6.6 Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 304 (M+H)⁺。

實例 366

N-[4-(1-丙基-1H-吡啶-4-基)苯甲基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-
 2-甲醯胺

實例 366A

N-(4-溴苯甲基)異吡啶啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用 1-溴-4-(異氰酸酯基甲基)苯代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。

實例 366B

N-[4-(1-丙基-1H-吡啶-4-基)苯甲基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-
 2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 1-丙基-4-(4,4,5,5-四

甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-1H-吡啶代替1H-吡啶-3-基酮酸及N-(4-溴苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 0.85 (t, *J*=7.5 Hz, 3 H), 1.70-1.92 (m, 2 H), 4.06 (t, *J*=6.9 Hz, 2 H), 4.29 (d, *J*=6.1 Hz, 2 H), 4.63 (s, 4 H), 6.91 (t, *J*=5.9 Hz, 1H), 7.18-7.40 (m, 6 H), 7.49 (d, *J*=8.5 Hz, 2 H), 7.82 (s, 1H), 8.12 (s, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 361 (M+H)⁺。

實例 367

N-[4-(1-異丁基-1H-吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 1-異丁基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-1H-吡啶代替 1H-吡啶-3-基酮酸及 N-(4-溴苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 0.86 (d, *J*=6.4 Hz, 6 H), 2.03-2.21 (m, 1H), 3.91 (d, *J*=7.1 Hz, 2 H), 4.28 (d, *J*=5.9 Hz, 2 H), 4.63 (s, 4 H), 6.92 (t, *J*=5.9 Hz, 1H), 7.25-7.37 (m, 6 H), 7.50 (d, *J*=8.3 Hz, 2 H), 7.83 (s, 1H), 8.10 (s, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 375 (M+H)⁺。

實例 368

N-(5-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}吡啶-2-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(2-吡啶基)哌嗪代替

3-苯基丙-1-胺及6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)菸鹼酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 9.21 (s, 1H), 8.39 (dd, *J*=2.3, 0.8 Hz, 1H), 8.13 (dd, *J*=4.9, 1.9 Hz, 1H), 8.00 (dd, *J*=8.6, 0.8 Hz, 1H), 7.84 (dd, *J*=8.6, 2.4 Hz, 1H), 7.56 (ddd, *J*=8.7, 6.9, 1.9 Hz, 1H), 7.34-7.39 (m, 2H), 7.29-7.34 (m, 2H), 6.85 (d, *J*=8.5 Hz, 1H), 6.67 (dd, *J*=6.7, 4.9 Hz, 1H), 4.75-4.92 (bs, 4H), 3.47-3.81 (m, 8H); MS (ESI(+)) *m/e* 429 (M+H)⁺。

實例 369

N-{5-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 369A

6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)菸鹼酸甲酯

標題化合物如實例 344A 中所述，用 6-胺基菸鹼酸甲酯代替 5-胺基異吲哚啉-2-甲酸第三丁酯製備。

實例 369B

6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)菸鹼酸

標題化合物如實例 1B 中所述，用 6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)菸鹼酸甲酯代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯製備。

實例 369C

N-{5-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)菸鹼酸甲酯代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯製備。

N-{4-[1-(環戊基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-2-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡咯啶-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4,4-二氟環己基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-氰基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

基)菸鹼酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 9.25 (s, 1H), 8.74 (d, *J*=2.4 Hz, 1H), 8.47-8.51 (m, 1H), 8.14 (dd, *J*=8.8, 2.4 Hz, 1H), 8.00 (d, *J*=8.7 Hz, 1H), 7.33-7.38 (m, 2H), 7.29-7.33 (m, 2H), 7.26-7.30 (m, 2H), 7.21-7.26 (m, 2H), 7.15-7.21 (m, 1H), 4.74-4.92 (bs, 4H), 3.25-3.32 (m, 2H), 2.64 (t, *J*=7.6 Hz, 2H), 1.84 (p, *J*=7.4 Hz, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 401 (M+H)⁺。

實例 370

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用3-甲基丁-1-胺代替3-苯基丙-1-胺及6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)菸鹼酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 9.24 (s, 1H), 8.73 (d, *J*=2.4 Hz, 1H), 8.42 (t, *J*=5.5 Hz, 1H), 8.13 (dd, *J*=8.8, 2.4 Hz, 1H), 7.99 (d, *J*=8.7 Hz, 1H), 7.25-7.37 (m, 4H), 4.71-4.95 (bs, 4H), 3.24-3.32 (m, 2H), 1.57-1.68 (m, 1H), 1.43 (q, *J*=7.1 Hz, 2H), 0.91 (d, *J*=6.6 Hz, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 353 (M+H)⁺。

實例 371

N-{5-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]-1,3-噻唑-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

實例 371A

2-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)噻唑-5-甲酸甲酯

標題化合物如實例 272B 中所述，用 2-胺基噻唑-5-甲酸甲酯代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。

實例 371B

2-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)噻唑-5-甲酸

標題化合物如實例 1B 中所述，用 2-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)噻唑-5-甲酸甲酯代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯製備。

實例 371C

N-{5-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]-1,3-噻唑-2-基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 2-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)噻唑-5-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 11.00-11.19 (bs, 1H), 8.34 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.15-7.37 (m, 9H), 4.70-4.83 (m, 4H), 3.17-3.28 (m, 2H), 2.63 (t, *J*=7.6 Hz, 2H), 1.81 (p, *J*=7.4 Hz, 2H); MS (ESI(-)) *m/e* 405 (M-H)⁻。

實例 372

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]-1,3-噻唑-2-基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 3-甲基丁-1-胺代替 3-苯基丙-1-胺及 2-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)噻唑-5-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz,

DMSO- d_6) δ ppm 11.01-11.16 (bs, 1H), 8.27 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.29-7.36 (m, 4H), 4.73-4.88 (bs, 4H), 3.18-3.28 (m, 2H), 1.52-1.69 (m, 1H), 1.34-1.44 (m, 2H), 0.90 (d, $J=6.6$ Hz, 6H); MS (ESI(-)) m/e 357 (M-H) $^-$ 。

實例 374

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲醯胺

實例 374A

N-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)苯基)異吲哚啉-
2-甲醯胺

500 mg (4-異氰酸酯基苯基)酞酸頻哪醇酯(1.979 mmol)及 365 mg 異吲哚啉(2.97 mmol)溶於 10 ml 二氯甲烷中且所得混合物在室溫下攪拌隔夜。添加水後，混合物用二氯甲烷萃取若干次，以鹽水洗滌合併之有機相，經硫酸鎂乾燥且過濾。溶劑在減壓下蒸發。使用二氯甲烷，對殘餘物進行管柱層析，得到標題化合物。

實例 374B

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲醯胺

105 mg N-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺(0.288 mmol)及 53 mg 4-氯-1,2-二氫酞嗪-1-酮(0.288 mmol)溶於 2.5 ml 二噁烷中。碳酸銫(474 mg, 1.44 mmol)溶於 0.25 ml 水中且所得溶液添加至反應混合物中。添加 27.8 mg [1,1'-雙(二苯基膦基)-二茂鐵]二氯

鈹(II)(0.038 mmol)後，反應混合物用氮氣沖洗且在微波(Biotage Initiator 2.5)中於110°C下攪拌30分鐘。在減壓下移除二噁烷，水及二氯甲烷添加至殘餘物中且過濾形成之沈澱。固體物質溶解於更大量8:2二氯甲烷/甲醇後，添加矽膠，隨後在減壓下移除溶劑。此殘餘物藉由管柱層析，使用95:5二氯甲烷/甲醇純化。¹H NMR (DMSO-d₆, 400 MHz): δ ppm 12.73 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.33 (dd, 1H), 7.85-7.92 (m, 2 H), 7.73-7.78 (m, 3 H), 7.48 (d, 2 H), 7.35-7.38 (m, 2 H), 7.30-7.33 (m, 2 H), 4.81 (s, 4H)。MS (ESI (-)) m/e 383.2 (M+H)⁺。

實例 375

N-[4-(異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺
標題化合物如實例 374B 中所述，用 4-溴異喹啉代替 4-氯-1,2-二氫酞嗪-1-酮製備。ESI-MS [M+H⁺]=366.1。

實例 376

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 377C 中所述，用 4-(4-胺基苯基)異喹啉-1(2H)-酮代替 4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮製備。ESI-MS [M+H⁺]=382.1。

實例 377

N-[4-(4-側氧基-3,4,5,6,7,8-六氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 377A

2-(4-胺基-苯甲醯基)-環己-1-烯甲酸

向 2.2 g 鎂屑 (83.5 mmol) 於 15 mL 四氫呋喃中之懸浮液中添加 0.1 mL 1,2-二溴甲烷以開始格林納反應 (Grignard reaction)，接著在室溫下經 20 分鐘之時間緩慢添加含 13.0 g 2-(4-溴苯基)-1,1,1,3,3,3-六甲基二矽氮 (41 mmol) 之 70 mL 四氫呋喃，隨後再攪拌 30 分鐘。所得混合物在 -78°C 下逐滴添加至 4,5,6,7-四氫-異苯并呋喃-1,3-二酮 (5.6 g) 於 70 mL 四氫呋喃中之溶液中。反應混合物緩慢升溫至室溫。添加硫酸 (2 mL, 1 M) 且在減壓下移除溶劑。殘餘物小心添加至 20 mL 0.5 M 硫酸溶液中且所需產物開始沈澱並用乙酸乙酯萃取。繼續酸化水相且用乙酸乙酯萃取，直至約 pH 4-5 (至少三次)。合併之有機相用鹽水洗滌，經硫酸鎂乾燥，過濾，隨後溶劑在減壓下蒸發。藉由管柱層析，使用 1:1 乙酸乙酯/己烷，隨後 100% 乙酸乙酯純化粗物質，得到所需產物。

實例 377B

4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮

10.3 g 2-(4-胺基-苯甲醯基)-環己-1-烯甲酸 (42 mmol) 溶於 45 mL 乙醇中，添加 2.7 g (54 mmol) 水合肼且混合物在回流下加熱 30 小時。產物在加熱後若干小時開始沈澱。在冰箱中冷卻隔夜後，過濾沈澱產物且用冷乙醇洗滌。

實例 377C

1,3-二氫-異吲哚-2-甲酸 [4-(4-側氧基-3,4,5,6,7,8-六氫-酞嗪-1-基)-苯基]-醯胺

向 200 mg 4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮 (0.829 mmol) 於 5 ml N,N-二甲基甲醯胺中之溶液中添加 245 mg 碳酸雙-(2,5-二側氧基-吡咯啉-1-基)酯 (0.912 mmol) 且反應混合物攪拌隔夜。添加 255 mg 異吲哚啉，藉由添加 0.8 ml N,N-二甲基甲醯胺溶解形成之沈澱且反應混合物攪拌隔夜。添加水且形成之沈澱用水/甲醇洗滌，隨後真空乾燥，得到粗物質。粗物質在 20 ml 乙醇中回流 2 小時，冷卻至室溫，過濾且乾燥，得到所需產物。ESI-MS $[M+H]^+$ = 387.2。

實例 378

N-[4-(8-氟-4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 377C 中所述，用 4-(4-胺基-苯基)-5-氟-2H-酞嗪-1-酮代替 4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮製備。ESI-MS $[M+H]^+$ = 401.1。

實例 379

5-氟-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 377C 中所述，用 4-(4-胺基-苯基)-2H-酞嗪-1-酮代替 4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用 5-氟-2,3-二氫-1H-異吲哚代替異吲哚啉製備。ESI-MS $[M+H]^+$ = 401.1。

實例 380

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基

甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例377C中所述，用4-(4-胺基-苯基)-2H-酞嗪-1-酮代替4-(4-胺基-苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用5-吡咯啉-1-基-甲基-2,3-二氫-1H-異吲哚代替異吲哚啉製備。ESI-MS $[M+H]^+$ =466.2。

實例381

5-(嗎啉-4-基-甲基)-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例377C中所述，用4-(4-胺基-苯基)異喹啉-1(2H)-酮代替4-(4-胺基-苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用5-嗎啉-4-基-甲基-2,3-二氫-1H-異吲哚代替異吲哚啉製備。ESI-MS $[M+H]^+$ =481.3。

實例382

5-甲氧基-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例377C中所述，用4-(4-胺基-苯基)異喹啉-1(2H)-酮代替4-(4-胺基-苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用5-甲氧基-2,3-二氫-1H-異吲哚代替異吲哚啉製備。ESI-MS $[M+H]^+$ =412.2。

實例383

5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例377C中所述，用4-(4-胺基-苯基)-2H-酞嗪-1-酮代替4-(4-胺基-苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮

及用 5-(4-甲基-哌嗪-1-基甲基)-2,3-二氫-1H-異吲哚代替異吲哚啉製備。ESI-MS $[M+H^+]=495.2$ 。

實例 384

5-氯基-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 377C 中所述，用 4-(4-胺基苯基)異喹啉-1(2H)-酮代替 4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用 2,3-二氫-1H-異吲哚-5-甲腈代替異吲哚啉製備。ESI-MS $[M+H^+]=407.1$ 。

實例 385

5-氯-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 377C 中所述，用 4-(4-胺基苯基)異喹啉-1(2H)-酮代替 4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用 5-氯-2,3-二氫-1H-異吲哚代替異吲哚啉製備。ESI-MS $[M+H^+]=416.1$ 。

實例 386

N-[4-(4-側氧基-4,5-二氫-3H-2,3-苯并二氮呋-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 377C 中所述，用 1-(4-胺基-苯基)-3,5-二氫-苯并[d][1,2]二氮呋-4-酮代替 4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮製備。ESI-MS $[M+H^+]=397.2$ 。

實例 387

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-

基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例377C中所述，用4-(4-胺基苯基)異喹啉-1(2H)-酮代替4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用5-吡咯啉-1-基甲基-2,3-二氫-1H-異吲哚代替異吲哚啉製備。ESI-MS [M+H⁺]=465.2。

實例388

N-{4-[4-側氧基-8-(三氟甲基)-3,4-二氫酞嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例377C中所述，用4-(4-胺基-苯基)-5-三氟甲基-2H-酞嗪-1-酮代替4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮製備。ESI-MS [M+H⁺]=451.1。

實例389

5-[(二甲基胺基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例377C中所述，用4-(4-胺基苯基)異喹啉-1(2H)-酮代替4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用(2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基甲基)-二甲基-胺代替異吲哚啉製備。ESI-MS [M+H⁺]=439.3。

實例390

5-[(二乙基胺基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例377C中所述，用4-(4-胺基苯基)異喹啉-1(2H)-酮代替4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用(2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基甲基)-二乙基-胺代替異

吡啶啉製備。ESI-MS $[M+H]^+=467.3$ 。

實例 391

5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 377C 中所述，用 4-(4-胺基苯基)異喹啉-1(2H)-酮代替 4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用 5-(4-甲基-哌嗪-1-基甲基)-2,3-二氫-1H-異吡啶啉代替異吡啶啉製備。ESI-MS $[M+H]^+=494.3$ 。

實例 392

5-[(二甲基胺基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 377C 中所述，用 4-(4-胺基-苯基)-2H-酞嗪-1-酮代替 4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用 (2,3-二氫-1H-異吡啶啉-5-基甲基)-二甲基-胺代替異吡啶啉製備。ESI-MS $[M+H]^+=440.2$ 。

實例 393

5-[(二乙基胺基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 377C 中所述，用 4-(4-胺基-苯基)-2H-酞嗪-1-酮代替 4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用 (2,3-二氫-1H-異吡啶啉-5-基甲基)-二乙基-胺代替異吡啶啉製備。ESI-MS $[M+H]^+=468.2$ 。

實例 394

N-{4-[4-側氧基-8-(三氟甲基)-3,4-二氫酞嗪-1-基]苯基}-5-

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(6-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-呋喃-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({2-[(二甲基胺基)甲基]苯甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(1,3-噁唑-2-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(四氫-2H-呋喃-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例377C中所述，用4-(4-胺基-苯基)-5-三氟甲基-2H-酞嗪-1-酮代替4-(4-胺基-苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用5-吡咯啉-1-基甲基-2,3-二氫-1H-異吲哚代替異吲哚啉製備。ESI-MS [M+H⁺]=534.2。

實例395

5-[(1-甲基哌啶-4-基)氧基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例377C中所述，用4-(4-胺基-苯基)-2H-酞嗪-1-酮代替4-(4-胺基-苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用5-(1-甲基-哌啶-4-基氧基)-2,3-二氫-1H-異吲哚代替異吲哚啉製備。ESI-MS [M+H⁺]=496.2。

實例396

5-{[(3R)-3-氟吡咯啉-1-基]甲基}-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例377C中所述，用4-(4-胺基-苯基)-2H-酞嗪-1-酮代替4-(4-胺基-苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用5-((R)-3-氟-吡咯啉-1-基甲基)-2,3-二氫-1H-異吲哚代替異吲哚啉製備。ESI-MS [M+H⁺]=484.2。

實例397

5-{[(3S)-3-氟吡咯啉-1-基]甲基}-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例377C中所述，用4-(4-胺基-苯基)-2H-酞嗪-1-酮代替4-(4-胺基-苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮

及用 5-((S)-3-氟-吡咯啉-1-基甲基)-2,3-二氫-1H-異吲哚代替異吲哚啉製備。ESI-MS $[M+H]^+$ =484.2。

實例 398

5-(氮雜環丁烷-1-基甲基)-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 377C 中所述，用 4-(4-胺基-苯基)-2H-酞嗪-1-酮代替 4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用 5-氮雜環丁烷-1-基甲基-2,3-二氫-1H-異吲哚代替異吲哚啉製備。ESI-MS $[M+H]^+$ =452.2。

實例 399

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 399A

N'-(4-溴苯甲醯基)-1H-吡咯-2-甲醯肼

在室溫下在氮氣下向含 0.750 g 1H-吡咯-2-甲醯肼 (5.99 mmol) 之 50 ml 四氫呋喃中添加 1.315 g 4-溴苯甲醯氯 (5.99 mmol) 及 1 ml 吡啶 (11.99 mmol)。在室溫下攪拌 1 小時後，所需產物沈澱。沈澱過濾，用最少二氯甲烷及甲醇洗滌且乾燥，得到標題化合物。 ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 11.63 (s, 1H), 10.47 (s, 1H), 10.04 (s, 1H), 7.84-7.88 (m, 2H), 7.75 (d, $J=8.8$, 1H), 7.75 (q, $J=4.2$, 1H), 6.91-6.95 (m, 2H), 6.33-6.15 (m, 1H)。

實例 399B

2-(4-溴苯基)-5-(1H-吡咯-2-基)-1,3,4-噁二唑

向 1.2 g N'-(4-溴苯甲酰基)-1H-吡咯-2-甲酰肼 (3.89 mmol) 中添加 5 ml 三氯氧磷 (1.65 mmol)。反應物在 120°C 下攪拌 25 分鐘。反應物冷卻至 0°C 且添加冰。過濾所得固體且用水、NH₄OH、二氯甲烷及乙酸乙酯洗滌。藉由矽膠層析 (二氯甲烷: 甲醇 = 9:1) 純化，得到所需產物。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 12.32 (s, 1H), 8.05-8.00 (m, 2H), 7.89-7.83 (m, 2H), 7.18 (td, J=1.5, 2.6, 1H), 6.97 (ddd, J=1.5, 2.4, 3.7, 1H), 6.33 (dt, J=2.4, 3.6, 1H)。¹³C NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 110.16, 112.49, 115.12, 122.71, 123.96, 125.23, 128.26, 132.49, 159.37, 161.57。

實例 399C

4-(4-溴苯基)吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮

在室溫下在氮氣下向溶於 20 ml 乙醇中之 0.469 g 乙醇鈉 (6.89 mmol) 中添加 1.0 g 2-(4-溴苯基)-5-(1H-吡咯-2-基)-1,3,4-噁二唑 (3.45 mmol) 且混合物在室溫下攪拌 5 分鐘。反應物在微波 (Biotage Initiator 2.5) 中於 160°C 下加熱 2 小時。反應藉由 TLC 二氯甲烷/甲醇 = 9/1 監測。添加額外當量之乙醇鈉且再進行加熱，直至根據 TLC，反應結束。反應混合物在減壓下濃縮且吸附於矽膠上。產物藉由矽膠層析 (梯度: 環己烷/乙酸乙酯 = 0-100%) 純化，得到標題化合物。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 12.09 (s, 1H), 7.85-7.78 (m, 2H), 7.76-7.69 (m, 2H), 7.39 (dd, J=1.3, 2.9, 1H), 7.16 (dd, J=1.4, 3.8, 1H), 6.77 (dd, J=2.9, 3.8, 1H)。¹³C NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 154.22, 136.46, 131.98, 130.90,

129.52, 124.07, 124.00, 118.80, 114.42, 111.01。

實例 399D

4-(4-胺基苯基)吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮

在室溫下在氮氣下向含 1.181 g 4-(4-溴苯基)吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮 (4.07 mmol) 之甲苯 (10 ml) 中添加 0.080 g 2-二環己基膦基-2'-(N,N-二甲基胺基)聯苯 (0.2004 mmol)、0.063 g 參(二亞苄基丙酮)二鈹(0)氯仿加合物 (0.061 mmol) 及 10.58 ml 1 M 雙(三甲基矽烷基)胺基鋰之甲苯溶液 (10.58 mmol)，隨後反應物藉由微波 (Biotage Initiator 2.5) 在 150°C 下加熱 5 分鐘。環己烷/乙酸乙酯 = 1/1 中薄層層析顯示無起始物質。反應混合物冷卻後，添加 7 ml 2 N HCl 水溶液，混合物攪拌 30 分鐘且混合物藉由添加 NaOH 水溶液 (2 N) 鹼化，直至 pH=10。形成沈澱。過濾固體且用乙醚洗滌並乾燥隔夜，得到標題化合物。LCMS: m/z 227.0 (M+H)。濾液用乙酸乙酯萃取。有機相與來自洗滌之乙醚合併，經 Na₂SO₄ 乾燥，過濾且溶劑在減壓下蒸發。粗物質吸附於二氧化矽 (溶於乙酸乙酯中) 上，接著藉由矽膠層析 (環己烷:乙酸乙酯之梯度，產物用 80% 乙酸乙酯溶離) 純化，得到額外標題化合物。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 11.85 (br. s., 1H), 7.32-7.44 (m, 3 H), 7.09 (dd, J=3.8, 1.3 Hz, 1H), 6.66-6.77 (m, 3 H), 5.67 (s, 2 H)。¹³C NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 154.15, 150.86, 137.98, 129.55, 123.98, 118.70, 116.65, 113.95, 113.32, 110.58。

實例 399E

[4-(1-側氧基-1,2-二氫-吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)-苯基]-胺基甲酸苯酯

在室溫下向 50 mg 4-(4-胺基苯基)吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮(0.22 mmol)於 1 ml 四氫呋喃中之懸浮液中經 5 分鐘添加 0.03 ml 吡啶(0.3 mmol)於 0.5 ml 四氫呋喃中之溶液。隨後，溶於 3 ml 四氫呋喃中之 0.03 ml 氯甲酸苯酯(0.23 mmol)經 30 分鐘添加且反應物在室溫下攪拌隔夜。溶劑真空乾燥且混合物藉由二氯甲烷直接併入二氧化矽上。混合物藉由矽膠層析(4 g，環己烷:乙酸乙酯之梯度)純化，得到粗物質，其藉由管柱層析(環己烷:乙酸乙酯之梯度)純化，得到標題化合物。

實例 399F

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

40 mg [4-(1-側氧基-1,2-二氫-吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)-苯基]-胺基甲酸苯酯(0.115 mmol)溶於 0.3 ml DMSO 中。在室溫下添加 15 mg 異吲哚啉(0.121 mmol)於 0.2 ml DMSO 中之混合物且反應物在室溫下攪拌隔夜。反應混合物在乙酸乙酯中稀釋且用水、HCl 水溶液、水、NaOH 水溶液及水洗滌。溶劑在減壓下蒸發，得到標題化合物。

實例 400

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 400A

5-吡咯啉-1-基甲基-1,3-二氫-異吲哚-2-甲酸第三丁酯

在室溫下向 1.25 g 5-羥基甲基-1,3-二氫-異吲哚-2-甲酸第三丁酯 (5.01 mmol) 於 14 ml 二氯甲烷中之溶液中緩慢添加 0.781 ml 甲烷磺醯氯 (10.03 mmol)。隨後混合物在回流下加熱 4 小時。LCMS 控制指示相應甲磺酸酯幾乎完全形成，其未分離。冷卻至室溫後，添加 1.244 ml 吡咯啉 (15.04 mmol) 且混合物在室溫下攪拌隔夜。根據 LCMS，反應結束。水添加至反應混合物中，酸性水相用二氯甲烷萃取兩次且水相鹼化並用乙酸乙酯萃取三次。合併之乙酸乙酯溶液用鹽水萃取，經 Na_2SO_4 乾燥，過濾且在減壓下移除有機溶劑，得到標題化合物。二氯甲烷相用稀 NaOH 萃取兩次，用鹽水萃取一次，接著經 Na_2SO_4 乾燥。過濾且在減壓下移除有機溶劑，得到額外標題化合物。兩種溶離份合併且未經進一步純化即用於下一步。LCMS: m/z 303.2 ($\text{M}+\text{H}$)。

實例 400B

5-吡咯啉-1-基甲基-2,3-二氫-1H-異吲哚

向 1.90 g 5-吡咯啉-1-基甲基-1,3-二氫-異吲哚-2-甲酸第三丁酯 (粗物質; 4.96 mmol) 於 5 ml 二氯甲烷中之溶液中添加 3.82 ml 三氟乙酸 (49.6 mmol) 且反應混合物在室溫下攪拌隔夜。三氟乙酸及二氯甲烷在減壓下蒸發，水添加至殘餘物中，酸性水相用乙酸乙酯萃取兩次，水相用稀 NaOH 鹼化，隨後用二氯甲烷萃取三次。二氯甲烷相用鹽水洗滌一次，經 Na_2SO_4 乾燥，過濾且真空移除溶劑。標題化合物未

經進一步純化即用於下一步。LCMS: m/z 203.2 (M+H)。

實例 400C

5-吡咯啉-1-基甲基-1,3-二氫-異吲哚-2-甲酸[4-(1-側氧基-1,2-二氫-吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)-苯基]-醯胺

標題化合物如實例 399E 及實例 399F 中所述，用 5-吡咯啉-1-基甲基-2,3-二氫-1H-異吲哚代替異吲哚啉製備。LCMS: m/z 455.2 (M+H)。

實例 401

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}哌啶-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 272A 中所述，用 4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}-3,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯代替 4-硝基-N-丙基苯甲醯胺製備。 ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 8.26 (s, 1H), 7.46-7.48 (m, 2H), 7.34-7.39 (m, 2H), 7.28-7.33 (m, 2H), 7.10-7.13 (m, 2H), 4.75 (s, 4H), 4.02-4.08 (m, 2H), 2.71-2.90 (m, 2H), 2.57-2.68 (m, 1H), 1.71-1.76 (m, 2H), 1.40-1.51 (m, 2H), 1.42 (s, 9H); MS (ESI(-)) m/e 420 (M-H) $^-$ 。

實例 402

N-[4-(5-丙基-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 402A

N-(4-氰基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用 4-異氰酸酯基苯甲腈代

替4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。

實例 402B

(Z)-N-(4-(N'-羥基甲脒基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺

在 25 mL 耐壓管中 N-(4-氰基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺 (500 mg, 1.899 mmol)、羥基胺鹽酸鹽 (264 mg, 3.80 mmol) 及三乙胺 (1.323 ml, 9.50 mmol) 混合於乙醇 (6 ml)/水 (0.5 ml) 中。反應容器密封且在 80°C 下加熱 4 小時。反應混合物用水稀釋且固體藉由水洗濾出。HPLC 純化得到標題化合物。

實例 402C

N-[4-(5-丙基-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

在 4 mL 小瓶中 (Z)-N-(4-(N'-羥基甲脒基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺 (50 mg, 0.169 mmol)、丁酸 (0.017 ml, 0.186 mmol)、1-羥基苯并三唑水合物 (12.92 mg, 0.084 mmol) 及 N-甲基嗎啉 (0.056 ml, 0.506 mmol) 混合於無水二甲基甲醯胺 (2 ml) 中。向此溶液中添加 N-(3-二甲基胺基丙基)-N'-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽 (48.5 mg, 0.253 mmol) 且混合物在周圍溫度下攪拌隔夜。溶液用乙酸乙酯稀釋且用水、飽和碳酸氫鈉水溶液及鹽水洗滌。有機層經硫酸鈉乾燥，傾析且濃縮。殘餘物溶解於無水甲苯 (1 ml) 中且混合物在 110°C 下加熱 2 天。反應物用水稀釋；且過濾形成之固體並用水及乙醚洗滌，得到標題化合物。¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.68 (s, 1H), 7.89-7.91 (m, 2H), 7.78-7.80

(m, 2H), 7.36-7.40 (m, 2H), 7.30-7.34 (m, 2H), 4.76-4.85 (m, 4H), 2.96 (t, $J=7.4$ Hz, 2H), 1.81 (hex, $J=7.4$ Hz, 2H), 0.99 (t, $J=7.4$ Hz, 3H); MS (ESI(-)) m/e 347 (M-H)⁻。

實例 403

N-[4-(哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 2D 中所述，用 4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}哌啶-1-甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.28 (s, 1H), 7.46-7.48 (m, 2H), 7.34-7.37 (m, 2H), 7.30-7.33 (m, 2H), 7.09-7.12 (m, 2H), 4.75-4.76 (bs, 4H), 3.09-3.17 (m, 2H), 2.68 (td, $J=12.3, 2.6$ Hz, 2H), 2.57 (tt, $J=12.0, 3.4$ Hz, 1H), 1.71-1.75 (m, 2H), 1.56 (qd, $J=12.5, 3.9$ Hz, 2H); MS (ESI(+)) m/e 322 (M+H)⁺。

實例 404

N-{5-[((3R)-四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺及 N-{5-[((3S)-四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用(四氫呋喃-3-基)甲胺代替 3-苯基丙-1-胺及 6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)菸鹼酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.26 (s, 1H), 8.74 (d, $J=2.4$ Hz, 1H), 8.56-8.60 (m, 1H), 8.14 (dd, $J=8.8, 2.5$ Hz, 1H), 8.00 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.26-7.40 (m, 4H), 4.59-5.02 (m, 4H), 3.75

(td, $J=8.0, 5.7$ Hz, 1H), 3.69 (dd, $J=8.5, 6.9$ Hz, 1H), 3.59-3.66 (m, 1H), 3.48 (dd, $J=8.5, 5.2$ Hz, 1H), 3.18-3.31 (m, 2H), 2.43-2.51 (m, 1H), 1.90-1.99 (m, 1H), 1.56-1.65 (m, 1H); MS (ESI(-)) m/e 365 (M-H)⁻。

實例 405

N-[4-(1-丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用丁醯氯代替乙醯氯及 N-[4-(哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.27 (s, 1H), 7.46-7.49 (m, 2H), 7.34-7.39 (m, 2H), 7.28-7.33 (m, 2H), 7.11-7.14 (m, 2H), 4.75-4.76 (bs, 4H), 4.52-4.57 (m, 1H), 3.94-4.00 (m, 1H), 3.03-3.11 (m, 1H), 2.64-2.75 (m, 1H), 2.51-2.63 (m, 1H), 2.31 (t, $J=7.4$ Hz, 2H), 1.73-1.81 (m, 2H), 1.47-1.59 (m, 3H), 1.32-1.47 (m, 1H), 0.85-0.95 (m, 3H); MS (ESI(+)) m/e 392 (M+H)⁺。

實例 406

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用異丁醯氯代替乙醯氯及 N-[4-(哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.28 (s, 1H),

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氟苯甲基)(3-甲基丁醯基)胺基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(9-氟-5-側氧基-2,3,3a,4,4a,5-六氫-6H-呋喃并[2',3':2,3]環丁并[1,2-c]喹啉-6-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[7-氟-1-(2-羥基乙基)-3-側氧基-1,3-二氫環丁并[c]喹啉-4(2H)-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-2-基羰基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

7.46-7.48 (m, 2H), 7.34-7.39 (m, 2H), 7.29-7.33 (m, 2H), 7.12-7.14 (m, 2H), 4.75-4.76 (bs, 4H), 4.53-4.58 (m, 1H), 4.03-4.07 (m, 1H), 3.06-3.14 (m, 1H), 2.86-2.93 (m, 1H), 2.67-2.74 (m, 1H), 2.53-2.61 (m, 1H), 1.75-1.84 (m, 2H), 1.45-1.56 (m, 1H), 1.33-1.45 (m, 1H), 1.03 (d, $J=6.7$ Hz, 3H), 1.00 (d, $J=6.6$ Hz, 3H); MS (ESI(-)) m/e 390 (M-H)⁻。

實例 407

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用苯甲醯氯代替乙醯氯及 N-[4-(哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.29 (s, 1H), 7.47-7.50 (m, 2H), 7.41-7.47 (m, 5H), 7.34-7.38 (m, 2H), 7.29-7.33 (m, 2H), 7.16-7.18 (m, 2H), 4.75-4.76 (bs, 4H), 4.54-4.64 (m, 1H), 3.57-3.74 (m, 1H), 3.02-3.21 (m, 1H), 2.79-2.93 (m, 1H), 2.75 (tt, $J=11.9, 3.4$ Hz, 1H), 1.68-1.88 (m, 2H), 1.54-1.63 (m, 2H); MS (ESI(-)) m/e 424 (M-H)⁻。

實例 408

N-{4-[5-(3-甲基丁基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 402C 中所述，用 4-甲基戊酸代替丁酸製備。¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.69 (s, 1H), 7.89-7.91 (m, 2H), 7.77-7.79 (m, 2H), 7.36-7.39 (m, 2H),

7.31-7.34 (m, 2H), 4.80-4.81 (bs, 4H), 2.96-3.00 (m, 2H), 1.66-1.72 (m, 2H), 1.59-1.67 (m, 1H), 0.93 (d, $J=6.4$ Hz, 6H); MS (ESI(-)) m/e 375 (M-H)⁻。

實例 409

N-[4-(5-苯甲基-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例402C中所述，用苯基乙酸代替丁酸製備。¹H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.69 (s, 1H), 7.87-7.90 (m, 2H), 7.77-7.79 (m, 2H), 7.35-7.42 (m, 6H), 7.29-7.34 (m, 3H), 4.75-4.84 (m, 4H), 4.42 (s, 2H); MS (ESI(+)) m/e 397 (M+H)⁺。

實例 410

N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

N-(4-{[四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺(250 mg)之外消旋混合物溶於甲醇中且使用 SCF-LC，用 ChiralPak AD-H 21×250 mm管柱分離，得到 N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺。¹H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.38 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.64-7.69 (m, 2H), 7.30-7.41 (m, 4H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.57-3.78 (m, 3H), 3.48 (dd, $J=8.5, 5.2$ Hz, 1H), 3.17-3.28 (m, 2H), 2.41-2.50 (m, 1H), 1.87-2.04 (m, 1H), 1.54-1.66 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 366 (M+H)⁺。

實例 411

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺

N-(4-{[四氫呋喃-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺 (250 mg) 之外消旋混合物溶於甲醇中且使用 SCF-LC，用 ChiralPak AD-H 21×250 mm 管柱分離，得到 N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 8.38 (t, *J*=5.7 Hz, 1H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.64-7.69 (m, 2H), 7.30-7.39 (m, 4H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.57-3.78 (m, 3H), 3.48 (dd, *J*=8.5, 5.3 Hz, 1H), 3.13-3.29 (m, 2H), 2.40-2.50 (m, 1H), 1.87-2.07 (m, 1H), 1.54-1.66 (m, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 366 (M+H)⁺。

實例 422

4-{6-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羧基)胺基]-1H-苯并咪唑-2-基}哌嗪-1-甲酸第三丁酯

實例 422A

4-(5-硝基-1H-苯并[d]咪唑-2-基)哌嗪-1-甲酸第三丁酯

在 20 mL 密封管中在氮氣下，哌嗪-1-甲酸第三丁酯 (0.943 g, 5.06 mmol)、2-氯-5-硝基-1H-苯并[d]咪唑 (0.5 g, 2.53 mmol) 及乙醇 (9.5 mL) 之混合物在 135°C 下加熱 2 小時。濃縮反應物且殘餘物藉由逆相層析純化，得到標題化合物。

實例 422B

4-(5-胺基-1H-苯并[d]咪唑-2-基)哌嗪-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例274中所述，用4-(5-硝基-1H-苯并[d]咪唑-2-基)哌嗪-1-甲酸第三丁酯代替5-硝基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺製備。

實例422C

4-{6-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]-1H-苯并咪唑-2-基}哌嗪-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例272B中所述，用4-(5-胺基-1H-苯并[d]咪唑-2-基)哌嗪-1-甲酸第三丁酯代替4-胺基-N-丙基苯甲鹽胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。

^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 10.90-11.08 (bs, 1H), 7.84-7.85 (m, 1H), 7.46-7.48 (m, 1H), 7.27-7.35 (m, 4H), 7.04-7.06 (m, 2H), 4.76 (s, 4H), 3.46 (s, 8H), 1.44 (s, 9H); MS (ESI(+)) m/e 463 ($M+H$) $^+$ 。

實例423

N-[2-(哌嗪-1-基)-1H-苯并咪唑-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺

標題化合物如實例2D中所述，用4-{6-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]-1H-苯并咪唑-2-基}哌嗪-1-甲酸第三丁酯代替4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲鹽胺基)苯甲鹽胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。 ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 11.04-11.29 (m, 1H), 8.08-8.12 (bs, 1H), 7.41-7.58 (m, 1H), 7.24-7.39 (m, 4H), 7.04-7.06 (m, 2H), 4.76 (s, 4H), 3.37-3.44 (m, 4H), 2.85-2.89 (m, 4H); MS

(ESI(+)) m/e 363 ($M+H$)⁺。

實例 424

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-5-乙烯基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺

在密封小瓶中在氮氣下，乙烯基三氟硼酸鉀(100 mg，0.75 mmol)、5-溴-N-(4-(丙基胺甲鹽基)苯基)異吲哚啉-2-甲鹽胺(150 mg，0.37 mmol)、氯化雙(三苯膦)鉀(II)及飽和碳酸氫鈉水溶液(0.62 ml)於二甲基甲鹽胺中之混合物在85℃下加熱5小時。反應物傾倒至水中，過濾，乾燥且藉由逆相層析純化，得到標題化合物。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 8.25 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 7.75-7.78 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.47 (s, 1H), 7.42 (dd, $J=7.9, 1.5$ Hz, 1H), 7.34 (d, $J=7.8$ Hz, 1H), 6.77 (dd, $J=17.6, 10.9$ Hz, 1H), 5.85 (dd, $J=17.6, 1.0$ Hz, 1H), 5.27 (d, $J=11.0$ Hz, 1H), 4.77-4.78 (bs, 4H), 3.16-3.22 (m, 2H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz, 3H); MS (ESI(+)) m/e 350 ($M+H$)⁺。

實例 428

N-{4-[5-(四氫呋喃-3-基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 402C 中所述，用四氫呋喃-3-甲酸代替丁酸製備。¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.69 (s, 1H), 7.89-7.92 (m, 2H), 7.78-7.81 (m, 2H), 7.36-7.40 (m, 2H), 7.30-7.34 (m, 2H), 4.80-4.81 (bs, 4H), 4.08 (dd,

$J=8.6, 7.6$ Hz, 1H), 3.97 (dd, $J=8.6, 5.4$ Hz, 1H), 3.86-3.95 (m, 2H), 3.79-3.85 (m, 1H), 2.40 (dddd, $J=12.5, 9.0, 7.6, 5.9$ Hz, 1H), 2.26 (ddt, $J=7.7, 12.4, 6.2$ Hz, 1H); MS (ESI(-)) m/e 375 (M-H)⁻。

實例 429

N-[4-(1-異丁基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

在 4 mL 容器中在室溫下 N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺 (50 mg, 0.157 mmol) 及異丁醛 (0.014 ml, 0.157 mmol) 混合於無水二氯乙烷 (2 ml) 中。添加三乙醯氧基硼氫化鈉 (46.4 mg, 0.219 mmol) 且反應物攪拌隔夜。反應混合物用水、乙酸乙酯及飽和碳酸氫鈉水溶液稀釋。分離各層且有機層用鹽水洗滌。有機層用甲醇稀釋，經硫酸鈉乾燥，過濾且濃縮。殘餘物藉由急驟層析純化，得到標題化合物。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.35 (s, 1H), 7.53-7.55 (m, 2H), 7.30-7.38 (m, 6H), 6.06-6.08 (m, 1H), 4.77 (s, 4H), 3.01-3.03 (m, 2H), 2.57 (t, $J=5.6$ Hz, 2H), 2.41-2.47 (m, 2H), 2.14 (d, $J=7.3$ Hz, 2H), 1.77-1.88 (m, 1H), 0.88 (d, $J=6.5$ Hz, 6H); MS (ESI(-)) m/e 374 (M-H)⁻。

實例 432

N-{4-[1-(4-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用 4-甲基苯甲醯氯代替

乙醯氯及N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.38 (s, 1H), 7.55-7.58 (m, 2H), 7.20-7.39 (m, 10H), 6.01-6.21 (m, 1H), 4.77 (s, 4H), 3.93-4.36 (m, 2H), 3.43-3.90 (m, 2H), 2.48-2.57 (m, 2H), 2.36 (s, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 438 (M+H)⁺。

實例 433

N-[4-(1-苯甲基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例429中所述，用苯甲醛代替異丁醛製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.36 (s, 1H), 7.52-7.55 (m, 2H), 7.20-7.42 (m, 11H), 6.06-6.08 (m, 1H), 4.76-4.77 (bs, 4H), 3.58 (s, 2H), 3.04-3.06 (m, 2H), 2.63 (t, *J*=5.6 Hz, 2H), 2.42-2.49 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 410 (M+H)⁺。

實例 440

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-3-基-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例280中所述，用吡啶-3-基醯胺代替1H-吡啶-3-基醯胺及5-溴-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺代替5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.91 (dd, *J*=2.4, 0.9 Hz, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.58 (dd,

$J=4.7, 1.6$ Hz, 1H), 8.27 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 8.10 (ddd, $J=7.9, 2.4, 1.6$ Hz, 1H), 7.73-7.79 (m, 3H), 7.65-7.70 (m, 3H), 7.48-7.53 (m, 2H), 4.79-4.91 (m, 4H), 3.15-3.23 (m, 2H), 1.54 (s, 2H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz, 3H); MS (ESI(+)) m/e 401 ($M+H$)⁺。

實例 441

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-4-基-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用吡啶-4-基醯酸代替 1H-吡啶-3-基醯酸及 5-溴-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.62-8.66 (m, 3H), 8.25 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.70-7.81 (m, 6H), 7.64-7.69 (m, 2H), 7.52 (d, $J=8.0$ Hz, 1H), 4.85-4.92 (m, 4H), 3.16-3.22 (m, 2H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)。MS (ESI(+)) m/e 401 ($M+H$)⁺。

實例 442

N⁵-(2-甲氧基乙基)-N²-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 2-甲氧基乙胺代替 3-苯基丙-1-胺及 2-{[4-(丙基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}異吲哚啉-5-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.61 (s, 1H), 8.54 (d, $J=5.3$ Hz, 1H), 8.26 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 7.79-7.85 (m, 2H),

7.73-7.80 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.45 (d, $J=7.8$ Hz, 1H), 4.81-4.83 (bs, 4H), 3.39-3.51 (m, 4H), 3.27 (s, 3H), 3.03-3.22 (m, 2H), 1.46-1.59 (m, 2H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz, 3H); MS (ESI(+)) m/e 425 ($M+H$)⁺。

實例 443

N-(4-氟基苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用 4-異氰酸酯基苯甲腈代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.83 (s, 1H), 7.78-7.82 (m, 2H), 7.69-7.73 (m, 2H), 7.31-7.39 (m, 4H), 4.79-4.81 (bs, 4H); MS (ESI(+)) m/e 264 ($M+H$)⁺。

實例 444

N-[4-(三氟甲基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用 1-異氰酸酯基-4-(三氟甲基)苯代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.74 (s, 1H), 7.80-7.83 (m, 2H), 7.60-7.63 (m, 2H), 7.30-7.39 (m, 4H), 4.79-4.80 (bs, 4H); MS (ESI(+)) m/e 307 ($M+H$)⁺。

實例 450

5-(1,2-二羥基乙基)-N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-乙烯基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺 (0.03 g, 0.086 mmol) 於四氫呋喃 (1 ml) 及 2-丙醇 (0.3 ml) 中之懸浮液用四氧化鐵 (於 2-甲基-2-丙醇中 2.5

wt.%溶液)(0.108 ml, 8.59 μmol)處理。反應混合物用N-甲基嗎啉-N-氧化物(0.030 g, 0.258 mmol)處理。反應混合物在室溫下攪拌隔夜，用亞硫酸鈉水溶液淬滅且用乙酸乙酯萃取。合併之有機層用鹽水洗滌，經無水硫酸鈉乾燥且真空濃縮。進行急驟層析，得到標題化合物。 ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 8.55 (s, 1H), 8.25 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.63-7.68 (m, 2H), 7.27-7.33 (m, 3H), 5.24 (d, $J=4.2$ Hz, 1H), 4.75-4.77 (bs, 4H), 4.70 (t, $J=5.8$ Hz, 1H), 4.53-4.59 (m, 1H), 3.43 (t, $J=5.8$ Hz, 2H), 3.16-3.23 (m, 2H), 1.42-1.63 (m, 2H), 0.89 (t, $J=7.4$ Hz, 3H); MS (ESI(+)) m/e 384 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ 。

實例 451

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-5-氟基-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲醯胺

實例 451A

4-(4-(5-氟基異吲哚啉-2-甲醯胺基)丁基)哌啶-1-甲酸第三
丁酯

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-(4-胺基丁基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉-5-甲腈代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。

實例 451B

5-氟基-N-(4-(哌啶-4-基)丁基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 2D 中所述，用 4-(4-(5-氟基異吲哚啉-2-甲醯胺基)丁基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟基

N-(6-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基哌啶-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丁醯基哌啶-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

吡啶-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 451C

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-5-氟基-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用苯甲醯氯代替乙醯氯及 5-氟基-N-(4-(哌啶-4-基)丁基)異吡啶-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吡啶-2-甲醯胺製備。

^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 7.83 (s, 1H), 7.75 (dd, $J=7.9, 1.5$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J=7.9$ Hz, 1H), 7.41-7.44 (m, 3H), 7.31-7.38 (m, 2H), 6.36 (t, $J=5.5$ Hz, 1H), 4.60-4.64 (m, 4H), 4.30-4.53 (m, 1H), 3.42-3.71 (m, 1H), 3.02-3.10 (m, 2H), 2.64-3.00 (m, 2H), 1.56-1.84 (m, 2H), 1.37-1.54 (m, 3H), 1.24-1.31 (m, 4H), 0.93-1.16 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 431 ($M+H$) $^+$ 。

實例 452

N-(1'-丁醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺

實例 452A

N-(5-溴吡啶-2-基)異吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 344A 中所述，用 5-溴吡啶-2-胺代替 5-胺基異吡啶-2-甲酸第三丁酯製備。

實例 452B

4-(6-(異吡啶-2-甲醯胺基)吡啶-3-基)-5,6-二氫吡啶-

1(2H)-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 280 中所述，用 4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯代替 1H-吡啶-3-基酮酸及 N-(5-溴吡啶-2-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。

實例 452C

N-(5-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)吡啶-2-基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 2D 中所述，用 4-(6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)吡啶-3-基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 452D

N-(1'-丁醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用丁醯氯代替乙醯氯及 N-(5-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)吡啶-2-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.92-8.95 (bs, 1H), 8.32-8.35 (m, 1H), 7.64-7.97 (m, 2H), 6.94-7.38 (m, 4H), 6.16-6.22 (bs, 1H), 4.45-5.02 (m, 4H), 4.08-4.15 (m, 2H), 3.62-3.68 (m, 2H), 2.23-2.65 (m, 4H), 1.46-1.64 (m, 2H), 0.87-0.93 (m, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 391 (M+H)⁺。

表 6.

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(5-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)吡啶-2-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及適當羧酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
453	N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.91-8.95 (bs, 1H), 8.33-8.38 (m, 1H), 7.79-7.92 (m, 2H), 7.27-7.36 (m, 3H), 6.17-6.22 (bs, 1H), 4.76-4.83 (bs, 4H), 4.07-4.22 (m, 2H), 3.64-3.73 (m, 1H), 2.84-2.98 (m, 1H), 2.37-2.63 (m, 3H), 0.77-1.20 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) ⁺
454	N-[1'-((3R)-四氫呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.92-8.95 (bs, 1H), 8.32-8.36 (bs, 1H), 7.79-7.92 (m, 2H), 7.11-7.51 (m, 4H), 6.17-6.21 (bs, 1H), 4.59-5.04 (m, 4H), 4.10-4.22 (m, 2H), 3.82-4.01 (m, 1H), 3.59-3.81 (m, 5H), 2.33-2.62 (m, 2H), 1.94-2.15 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺
495	N-(1'-苯甲醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.51 (bs, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> =2.5 Hz, 1H), 7.90 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 1H), 7.77 (dd, <i>J</i> =8.7, 2.5 Hz, 1H), 7.48-7.39 (m, 5H), 7.36-7.25 (m, 4H), 6.16 (bs, 1H), 4.81 (s, 4H), 4.18 (m, 2H), 3.68 (m, 2H), 2.55 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 425 (M+H) ⁺
764	N-[1'-(四氫呋喃-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.52 (bs, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> =2.5 Hz, 1H), 7.91 (m, 1H), 7.76 (dd, <i>J</i> =8.7, 2.5 Hz, 1H), 7.37-7.26 (m, 4H), 6.16 (m, 1H), 4.82 (s, 4H), 4.68 (dd, <i>J</i> =7.6, 5.6 Hz, 1H), 4.17 (m, 2H), 3.86-3.70 (m, 4H), 2.52 (m, 2H), 2.12 (m, 1H), 2.01 (m, 1H), 1.87 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺
765	N-[1'-(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.52 (s, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> =2.5 Hz, 1H), 7.91 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 1H), 7.77 (dd, <i>J</i> =8.7, 2.5 Hz, 1H), 7.37-7.26 (m, 4H), 6.16 (m, 1H), 4.82 (s, 4H), 4.17 (m, 2H), 3.87 (m, 2H), 3.72 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.43 (td, <i>J</i> =11.4, 2.6 Hz, 2H), 2.92 (m, 1H), 2.52 (m, 2H), 1.74-1.60 (m, 2H), 1.62-1.53 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) ⁺
766	N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.52 (s, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> =2.2 Hz, 1H), 7.91 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 1H), 7.76 (dd, <i>J</i> =8.8, 2.5 Hz, 1H), 7.40-7.23 (m, 4H), 6.15 (m, 1H), 4.82 (s, 4H), 4.38 (dd, <i>J</i> =9.2, 2.9 Hz, 1H), 4.16 (m, 2H), 3.83-3.61 (m, 7H), 3.53 (m, 1H), 2.53 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) ⁺

767	N-{1'-[(1-甲基吡咯啉-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.54 (m, 1H), 8.31 (dd, <i>J</i> =2.5, 0.8 Hz, 1H), 7.90 (dd, <i>J</i> =8.7, 0.8 Hz, 1H), 7.75 (dd, <i>J</i> =8.7, 2.5 Hz, 1H), 7.36-7.25 (m, 4H), 6.15 (m, 1H), 4.81 (s, 4H), 4.13 (m, 2H), 3.69 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.26 (m, 1H), 2.77 (t, <i>J</i> =8.6 Hz, 1H), 2.68-2.53 (m, 4H), 2.38 (m, 1H), 2.24 (s, 3H), 2.13-1.92 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 432 (M+H) ⁺
768	N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.53 (bs, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> =2.5 Hz, 1H), 7.91 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 1H), 7.77 (dd, <i>J</i> =8.7, 2.5 Hz, 1H), 7.37-7.26 (m, 4H), 6.16 (m, 1H), 4.82 (s, 4H), 4.19 (m, 2H), 3.74 (m, 3H), 3.33-3.05 (m, 4H), 2.55 (m, 2H), 2.37 (m, 1H), 2.15 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 467 (M+H) ⁺
769	N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.51 (bs, 1H), 8.31 (d, <i>J</i> =2.5 Hz, 1H), 7.90 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 1H), 7.76 (dd, <i>J</i> =8.7, 2.5 Hz, 1H), 7.36-7.25 (m, 4H), 6.17 (m, 1H), 5.11 (bs, 1H), 4.81 (s, 4H), 4.30 (m, 2H), 3.94 (m, 2H), 2.51 (m, 2H), 1.37 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) ⁺
801	N-[1'-(嗎啉-4-基乙醯基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.51 (s, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> =2.5 Hz, 1H), 7.90 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 1H), 7.76 (dd, <i>J</i> =8.7, 2.5 Hz, 1H), 7.36-7.26 (m, 4H), 6.15 (m, 1H), 4.81 (s, 4H), 4.13 (m, 2H), 3.73 (m, 2H), 3.58 (m, 4H), 3.21 (s, 2H), 2.48 (m, 2H), 2.45 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 448 (M+H) ⁺

實例 455

N-[2-(4-乙醯基哌嗪-1-基)-1H-苯并咪唑-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用 N-[2-(哌嗪-1-基)-1H-苯并咪唑-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆, 溫度=90°C) δ ppm 11.01-11.10 (bs, 1H), 7.89-7.91 (bs, 1H), 7.44-7.52 (m, 1H), 7.32-7.35 (m, 2H), 7.27-7.31 (m, 2H), 7.03-7.06 (m, 2H), 4.76 (s, 4H), 3.55-3.62 (m, 4H), 3.46-3.51 (m, 4H), 2.04 (s, 3H); MS (ESI(+)) m/e 405 (M+H)⁺。

表 7.

以下實例基本上如實例 1C 中所述，用適當四氫吡啶代替 3-苯基丙-1-胺及適當羧酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
456	N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.15-8.17 (bs, 1H), 7.85-7.88 (m, 3H), 7.36-7.38 (m, 2H), 7.16-7.25 (m, 4H), 5.97-5.99 (m, 1H), 4.85-4.88 (m, 4H), 4.60-4.64 (m, 1H), 4.09-4.26 (m, 2H), 3.57-3.81 (m, 2H), 2.40-2.50 (m, 3H), 2.25-2.38 (m, 2H), 2.08-2.15 (m, 1H)	(ESI(-)) m/e 429 (M-H) ⁻
457	N-{4-[1-(5-側氧基-D-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.14-8.16 (bs, 1H), 7.85-7.88 (m, 2H), 7.75-7.82 (m, 1H), 7.36-7.38 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 5.97-5.99 (m, 1H), 4.83-4.89 (m, 4H), 4.60-4.63 (m, 1H), 3.59-3.79 (m, 2H), 2.40-2.51 (m, 3H), 2.24-2.38 (m, 2H), 2.08-2.15 (m, 1H)	(ESI(-)) m/e 429 (M-H) ⁻
458	N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.08-8.15 (m, 1H), 7.84-7.87 (m, 2H), 7.37-7.39 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 5.99 (t, <i>J</i> =3.2 Hz, 1H), 4.84-4.87 (m, 4H), 4.08-4.22 (m, 2H), 3.55-3.75 (m, 2H), 2.42-2.49 (m, 2H), 2.31 (q, <i>J</i> =7.4 Hz, 2H), 1.17 (t, <i>J</i> =7.5 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 376 (M+H) ⁺
459	N-{4-[1-(2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.11-8.12 (bs, 1H), 7.84-7.86 (m, 2H), 7.38-7.40 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.18 (d, <i>J</i> =4.1 Hz, 1H), 7.15-7.18 (m, 1H), 6.00-6.03 (m, 1H), 4.83-4.89 (m, 4H), 4.18-4.27 (m, 2H), 3.67-3.79 (m, 2H), 2.69 (h, <i>J</i> =6.7 Hz, 1H), 2.48-2.51 (m, 2H), 1.75-1.89 (m, 1H), 1.40-1.53 (m, 1H), 1.15 (d, <i>J</i> =6.9 Hz, 3H), 0.90 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 404 (M+H) ⁺
460	N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.12 (d, <i>J</i> =-1.9 Hz, 1H), 7.84-7.87 (m, 2H), 7.38-7.41 (m, 2H), 7.21-7.24 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 6.01-6.04 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.21-4.32 (m, 2H), 3.73-3.84 (m, 2H), 2.57-2.67 (m, 1H), 2.48-2.55 (m, 2H), 1.74-1.88 (m, 2H), 1.45-1.57 (m, 2H), 0.90 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 418 (M+H) ⁺
461	N-{4-[1-(甲氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 2.48-2.54 (m, 2 H), 3.32 (s, 3 H), 3.64 (t, <i>J</i> =5.80 Hz, 2 H), 4.06-4.13 (m, 4 H), 4.77 (s, 4 H), 6.02-6.09 (m, 1 H), 7.27-7.37 (m, 6 H), 7.51-	(ESI(+)) m/e 392 (M+H) ⁺

	醯胺	7.56 (m, 2 H), 8.12 (s, 1 H)	
462	N-{4-[1-(乙氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.11-8.12 (bs, 1H), 7.84-7.86 (m, 2H), 7.36-7.39 (m, 2H), 7.20-7.25 (m, 2H), 7.13-7.20 (m, 2H), 5.97-6.00 (m, 1H), 4.84-4.88 (m, 4H), 4.24 (s, 2H), 4.18-4.23 (m, 2H), 3.69-3.74 (m, 2H), 3.57 (q, <i>J</i> =6.9 Hz, 2H), 2.46-2.53 (m, 2H), 1.17 (t, <i>J</i> =6.9 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 406 (M+H) ⁺
463	N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.10-8.13 (bs, 1H), 7.82-7.87 (m, 2H), 7.35-7.40 (m, 2H), 7.19-7.25 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 5.96-6.00 (m, 1H), 4.84-4.88 (m, 4H), 4.30-4.34 (m, 2H), 4.17-4.25 (m, 2H), 3.73-3.77 (m, 2H), 3.67-3.76 (m, 2H), 3.54-3.58 (m, 2H), 3.28 (s, 3H), 2.46-2.53 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 436 (M+H) ⁺
464	N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.08-8.14 (bs, 1H), 7.82-7.87 (m, 2H), 7.34-7.40 (m, 2H), 7.20-7.25 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 5.97-6.01 (m, 1H), 4.83-4.89 (m, 4H), 4.69 (dd, <i>J</i> =7.2, 5.3 Hz, 1H), 4.24-4.31 (m, 2H), 3.87-3.96 (m, 1H), 3.69-3.88 (m, 3H), 2.39-2.60 (m, 3H), 1.84-2.01 (m, 2H), 1.69-1.83 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 418 (M+H) ⁺
465	N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.12-8.14 (bs, 1H), 7.83-7.89 (m, 2H), 7.38-7.40 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 5.99-6.02 (m, 1H), 4.83-4.89 (m, 4H), 4.16-4.24 (m, 2H), 4.04-4.13 (m, 2H), 3.91 (td, <i>J</i> =7.9, 5.9 Hz, 1H), 3.77-3.83 (m, 1H), 3.60-3.79 (m, 2H), 3.23-3.35 (m, 1H), 2.42-2.49 (m, 2H), 2.29 (ddd, <i>J</i> =7.6, 12.1, 6.1 Hz, 1H), 1.97-2.06 (m, 1H)	(ESI(-)) m/e 416 (M-H) ⁻
466	N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.11-8.12 (bs, 1H), 7.84-7.87 (m, 2H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 5.99-6.01 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.10-4.28 (m, 2H), 3.55-3.77 (m, 2H), 2.43-2.52 (m, 2H), 2.36 (d, <i>J</i> =6.5 Hz, 2H), 1.13-1.24 (m, 1H), 0.48-0.54 (m, 2H), 0.19-0.27 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 402 (M+H) ⁺
467	N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.10-8.13 (bs, 1H), 7.83-7.88 (m, 2H), 7.38-7.41 (m, 2H), 7.21-7.24 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 6.00-6.03 (m, 1H), 4.83-4.87 (m, 4H), 4.16-4.26 (m, 2H), 3.63-3.83 (m, 2H), 2.96 (s, 1H), 2.44-2.52 (m, 2H), 1.92-2.04 (m, 2H), 1.75-1.87 (m, 2H), 1.65-1.75 (m, 2H), 1.46-1.60 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 416 (M+H) ⁺
468	N-{4-[1-(2-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.12-8.13 (bs, 1H), 7.84-7.87 (m, 3H), 7.37-7.40 (m, 3H), 7.21-7.30 (m, 5H), 5.94-6.05 (bs, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.86 (s, 1H), 4.19-4.48	(ESI(+)) m/e 438 (M+H) ⁺

	鹽胺	(m, 2H), 3.35-3.61 (m, 2H), 2.39-2.59 (m, 2H), 2.32 (s, 3H)	
469	N-{4-[1-(3-甲基苯甲鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.11-8.13 (bs, 1H), 7.84-7.87 (m, 2H), 7.34-7.41 (m, 4H), 7.28 (t, <i>J</i> =7.5 Hz, 1H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.17-7.19 (m, 3H), 5.98-6.01 (bs, 1H), 4.83-4.90 (m, 4H), 4.26-4.29 (m, 2H), 3.70-3.79 (m, 2H), 2.50-2.54 (m, 2H), 2.26 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 438 (M+H) ⁺
470	N-{4-[1-(2-甲氧基苯甲鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.11-8.12 (bs, 1H), 7.83-7.86 (m, 2H), 7.37-7.45 (m, 3H), 7.30-7.35 (m, 1H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 7.00 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 1H), 6.96 (d, <i>J</i> =8.3 Hz, 1H), 5.89-6.08 (m, 1H), 4.85 (s, 4H), 4.31-4.68 (m, 2H), 3.69 (s, 3H), 3.28-3.62 (m, 2H), 2.34-2.68 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 454 (M+H) ⁺
471	N-{4-[1-(3-甲氧基苯甲鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.11-8.13 (bs, 1H), 7.84-7.87 (m, 2H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.30-7.34 (m, 1H), 7.20-7.24 (m, 3H), 7.16-7.19 (m, 2H), 7.12-7.15 (m, 1H), 7.01 (ddd, <i>J</i> =8.2, 2.6, 1.0 Hz, 1H), 5.98-6.00 (bs, 1H), 4.84-4.89 (m, 4H), 4.26-4.29 (m, 2H), 3.71-3.78 (m, 2H), 3.69 (s, 3H), 2.49-2.54 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 454 (M+H) ⁺
472	N-{4-[1-(4-甲氧基苯甲鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.11-8.12 (bs, 1H), 7.84-7.87 (m, 2H), 7.55-7.58 (m, 2H), 7.38-7.41 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.97-6.99 (m, 2H), 5.99-6.02 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.29 (q, <i>J</i> =2.9 Hz, 2H), 3.77 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.71 (s, 3H), 2.49-2.59 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 454 (M+H) ⁺
473	N-{4-[1-(2-氟苯甲鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.11-8.13 (bs, 1H), 7.84-7.87 (m, 2H), 7.48 (td, <i>J</i> =7.1, 1.8 Hz, 1H), 7.35-7.38 (m, 2H), 7.29-7.34 (m, 1H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 7.14-7.17 (m, 1H), 7.10-7.12 (m, 1H), 5.89-6.09 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.12-4.67 (m, 2H), 3.28-3.76 (m, 2H), 2.39-2.56 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 442 (M+H) ⁺
474	N-{4-[1-(3-氟苯甲鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.12-8.14 (bs, 1H), 7.85-7.87 (m, 2H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.29-7.36 (m, 3H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 7.09-7.13 (m, 1H), 5.97-6.00 (bs, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.22-4.26 (m, 2H), 3.68-3.73 (m, 2H), 2.49-2.53 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 442 (M+H) ⁺
475	N-{4-[1-(4-氟苯甲鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.12-8.14 (bs, 1H), 7.85-7.87 (m, 2H), 7.53-7.58 (m, 2H), 7.38-7.41 (m, 2H), 7.20-7.25 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 7.09-7.14 (m, 2H), 5.98-6.01 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.24-4.26 (m, 2H), 3.70-3.74 (m, 2H), 2.50-2.55 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 442 (M+H) ⁺
476	N-{4-[1-(4-氯苯甲鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.12-8.14 (bs, 1H), 7.85-7.87 (m, 2H),	(ESI(+)) m/e 458

	啉-4-基]苯基}-1,3-二 氫-2H-異吲哚-2-甲 醯胺	7.46-7.50 (m, 2H), 7.38-7.40 (m, 4H), 7.20-7.25 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 5.98-6.01 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.22-4.25 (m, 2H), 3.68-3.72 (m, 2H), 2.50-2.54 (m, 2H)	(M+H) ⁺
477	N-(4-{1-[3-(二甲基 胺基)苯甲醯基]- 1,2,3,6-四氫吡啶-4- 基}苯基)-1,3-二氫- 2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.08-8.15 (m, 1H), 7.84-7.86 (m, 2H), 7.38- 7.40 (m, 2H), 7.28 (dd, <i>J</i> =8.2, 7.5 Hz, 1H), 7.20- 7.24 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 6.98-6.99 (m, 1H), 6.90-6.94 (m, 1H), 6.77-6.80 (m, 1H), 5.99- 6.02 (bs, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.29-4.34 (m, 2H), 3.71-3.83 (m, 2H), 2.79 (s, 6H), 2.51-2.54 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 467 (M+H) ⁺
478	N-(4-{1-[4-(二甲基 胺基)苯甲醯基]- 1,2,3,6-四氫吡啶-4- 基}苯基)-1,3-二氫- 2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.11 (d, <i>J</i> =2.1 Hz, 1H), 7.84-7.87 (m, 2H), 7.56-7.59 (m, 2H), 7.39-7.41 (m, 2H), 7.20-7.25 (m, 2H), 7.15-7.18 (m, 2H), 6.70-6.73 (m, 2H), 6.00-6.03 (m, 1H), 4.82-4.91 (m, 4H), 4.34 (q, <i>J</i> =2.9 Hz, 2H), 3.82 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 2.82 (s, 6H), 2.53-2.60 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 467 (M+H) ⁺
479	N-{4-[1-(3-呋喃甲醯 基)-1,2,3,6-四氫吡 啶-4-基]苯基}-1,3-二 氫-2H-異吲哚-2-甲 醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 2.55 (d, <i>J</i> =1.83 Hz, 2 H), 3.77 (t, <i>J</i> =5.80 Hz, 2 H) 4.23 (q, <i>J</i> =2.64 Hz, 2 H), 4.77 (s, 4 H), 6.08 (t, <i>J</i> =3.51 Hz, 1 H), 6.68 (d, <i>J</i> =1.22 Hz, 1 H), 7.27-7.37 (m, 6 H), 7.54 (d, <i>J</i> =8.54 Hz, 2 H), 7.67 (t, <i>J</i> =1.68 Hz, 1 H), 7.99 (s, 1 H), 8.13 (s, 1 H)	(ESI(+)) m/e 414 (M+H) ⁺
480	N-{4-[1-(3-噻吩基羰 基)-1,2,3,6-四氫吡 啶-4-基]苯基}-1,3-二 氫-2H-異吲哚-2-甲 醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.11-8.12 (bs, 1H), 7.84-7.87 (m, 2H), 7.72- 7.73 (m, 1H), 7.35-7.42 (m, 4H), 7.21-7.24 (m, 2H), 7.17-7.19 (m, 2H), 5.97-5.99 (bs, 1H), 4.82-4.89 (m, 4H), 4.29-4.31 (m, 2H), 3.78 (t, <i>J</i> =5.6 Hz, 2H), 2.49-2.53 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 430 (M+H) ⁺
481	N-{4-[1-(1H-吡咯-2- 基羰基)-1,2,3,6-四氫 吡啶-4-基]苯基}-1,3- 二氫-2H-異吲哚-2- 甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 11.78-11.92 (m, 1H), 8.09-8.11 (m, 1H), 7.83-7.86 (m, 2H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 7.08-7.10 (m, 1H), 6.72-6.74 (m, 1H), 6.35 (dt, <i>J</i> =3.6, 2.5 Hz, 1H), 5.99-6.02 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.46 (q, <i>J</i> =2.9 Hz, 2H), 3.98 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 2.50-2.60 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 413 (M+H) ⁺
482	N-(4-{1-[(2,5-二甲 基-1H-吡咯-3-基)羰 基]-1,2,3,6-四氫吡 啶-4-基}苯基)-1,3-二 氫-2H-異吲哚-2-甲 醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 10.78-10.83 (m, 1H), 8.06-8.14 (m, 1H), 7.81-7.89 (m, 2H), 7.37-7.44 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.11 (dd, <i>J</i> =2.7, 1.2 Hz, 1H), 6.04-6.06 (m, 1H), 4.82-4.91 (m, 4H), 4.41-4.45 (m, 2H), 3.94 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 2.54- 2.61 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.24 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 441 (M+H) ⁺
483	N-{4-[1-(1,3-噻唑-4- 基羰基)-1,2,3,6-四氫 吡啶-4-基]苯基}-1,3-	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.97 (d, <i>J</i> =2.1 Hz, 1H), 8.16 (d, <i>J</i> =2.1 Hz, 1H), 8.09-8.14 (m, 1H), 7.83-7.86 (m, 2H), 7.37-	(ESI(+)) m/e 431 (M+H) ⁺

	二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	7.40 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.01 (t, $J=3.2$ Hz, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.48-4.51 (m, 2H), 3.98-4.01 (m, 2H), 2.56-2.62 (m, 2H)	
484	N-{4-[1-(1H-吡啶-4-基羧基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.19-8.23 (m, 2H), 8.06-8.15 (m, 1H), 7.82-7.90 (m, 2H), 7.36-7.42 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.00-6.05 (m, 1H), 4.83-4.89 (m, 4H), 4.40-4.44 (m, 2H), 3.92 (t, $J=5.7$ Hz, 2H), 2.52-2.59 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 414 (M+H) ⁺
485	N-(4-{1-[1-(3,5-二甲基-1,2-噁唑-4-基)羧基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.14-8.16 (bs, 1H), 7.85-7.88 (m, 2H), 7.38-7.42 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.00-6.02 (m, 1H), 4.84-4.88 (m, 4H), 4.19-4.23 (m, 2H), 3.69-3.75 (m, 2H), 2.49-2.58 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.29 (s, 3H)	(ESI(-)) m/e 441 (M-H) ⁻
486	N-{4-[1-(吡啶-2-基羧基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.61 (ddd, $J=4.8, 1.7, 0.9$ Hz, 1H), 8.10-8.11 (bs, 1H), 7.83-7.86 (m, 2H), 7.76 (dt, $J=7.7, 1.1$ Hz, 1H), 7.68 (td, $J=7.6, 1.8$ Hz, 1H), 7.36-7.39 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 3H), 7.16-7.19 (m, 2H), 5.89-6.10 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.40-4.42 (m, 2H), 3.56-4.22 (m, 2H), 2.52-2.64 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 425 (M+H) ⁺
487	N-{4-[1-(吡啶-3-基羧基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.93 (d, $J=2.2$ Hz, 1H), 8.70 (dd, $J=4.8, 1.7$ Hz, 1H), 8.13-8.15 (bs, 1H), 7.85-7.88 (m, 2H), 7.80-7.85 (m, 1H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.25-7.29 (m, 1H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 5.97-5.99 (bs, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.22-4.29 (m, 2H), 3.64-3.78 (m, 2H), 2.47-2.56 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 425 (M+H) ⁺
488	N-[4-(1-異菸鹼醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.74-8.76 (m, 2H), 8.14-8.15 (bs, 1H), 7.85-7.88 (m, 2H), 7.36-7.42 (m, 4H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 5.97-6.00 (bs, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.13-4.32 (m, 2H), 3.57-3.79 (m, 2H), 2.46-2.55 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 425 (M+H) ⁺
489	N-{4-[1-(噻吩-3-基羧基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 9.22 (dd, $J=5.0, 1.8$ Hz, 1H), 8.10-8.12 (bs, 1H), 7.90 (dd, $J=8.3, 1.7$ Hz, 1H), 7.83-7.86 (m, 2H), 7.47-7.50 (m, 1H), 7.34-7.38 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 5.92-6.05 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.36-4.51 (m, 2H), 3.67-3.94 (m, 2H), 2.53-2.64 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 426 (M+H) ⁺
490	N-{4-[1-(吡啶-2-基羧基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 9.34 (d, $J=1.2$ Hz, 1H), 8.86 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 8.12-8.14 (bs, 1H), 7.84-7.87 (m, 2H), 7.69 (dd, $J=5.0, 1.5$ Hz, 1H), 7.37-7.39 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 5.92-6.05	(ESI(+)) m/e 426 (M+H) ⁺

		(m, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.29-4.45 (m, 2H), 3.62-4.00 (m, 2H), 2.53-2.61 (m, 2H)	
491	N-{4-[1-(嘧啶-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 9.13 (d, <i>J</i> =1.5 Hz, 1H), 8.59 (d, <i>J</i> =2.5 Hz, 1H), 8.51 (dd, <i>J</i> =2.5, 1.3 Hz, 1H), 8.11-8.13 (bs, 1H), 7.84-7.87 (m, 2H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 5.95-6.05 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.32-4.47 (m, 2H), 3.60-3.91 (m, 2H), 2.55-2.61 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 426 (M+H) ⁺
492	N-(4-{1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.12-8.13 (bs, 1H), 7.84-7.86 (m, 2H), 7.35-7.38 (m, 2H), 7.21-7.25 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 5.94-5.98 (m, 1H), 4.84-4.89 (m, 4H), 4.06-4.29 (m, 2H), 3.53-3.89 (m, 2H), 3.30 (t, <i>J</i> =7.2 Hz, 2H), 2.95-3.05 (m, 2H), 2.89-2.92 (m, 4H), 2.42-2.48 (m, 2H), 1.65-1.73 (m, 4H), 1.30-1.40 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 459 (M+H) ⁺
493	N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.13-8.14 (bs, 1H), 7.85-7.88 (m, 2H), 7.39-7.41 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 6.01-6.04 (m, 1H), 4.86-4.87 (m, 4H), 4.27 (q, <i>J</i> =2.9 Hz, 2H), 3.75-3.80 (m, 2H), 3.64-3.72 (m, 4H), 3.29 (s, 2H), 2.54-2.57 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 447 (M+H) ⁺
494	N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.13-8.15 (bs, 1H), 7.85-7.87 (m, 2H), 7.38-7.41 (m, 2H), 7.20-7.25 (m, 2H), 7.19 (d, <i>J</i> =7.0 Hz, 1H), 7.17-7.19 (m, 1H), 6.00-6.02 (m, 1H), 4.83-4.89 (m, 4H), 4.24-4.26 (m, 2H), 3.74-3.77 (m, 2H), 3.33 (s, 2H), 2.73-2.76 (m, 4H), 2.66-2.69 (m, 4H), 2.49-2.54 (m, 2H), 2.36 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 460 (M+H) ⁺
759	N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.13 (s, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.38-7.23 (m, 6H), 6.08 (m, 1H), 4.79 (d, <i>J</i> =13.1 Hz, 4H), 4.15 (m, 2H), 3.86 (m, 2H), 3.70 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.43 (td, <i>J</i> =11.4, 2.4 Hz, 2H), 2.90 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 1.76-1.51 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 432 (M+H) ⁺
760	N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.13 (s, 1H), 7.55 (m, 2H), 7.38-7.26 (m, 6H), 6.07 (m, 1H), 4.79 (m, 4H), 4.37 (dd, <i>J</i> =9.2, 3.0 Hz, 1H), 4.15 (m, 2H), 3.82-3.62 (m, 7H), 3.53 (m, 1H), 2.50 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 434 (M+H) ⁺
761	N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.13 (s, 1H), 7.54 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 2H), 7.40-7.20 (m, 6H), 6.07 (s, 1H), 4.78 (s, 4H), 4.12 (m, 2H), 3.68 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.27 (m, 1H), 2.77 (m, 1H), 2.63-2.45 (m, 4H), 2.38 (m, 1H), 2.25 (s, 3H), 98 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 431 (M+H) ⁺
762	N-(4-{1-[(1,1-二氧離	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ	(ESI(+))

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-3-基}氧基)苯
基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-3-基}氧基)苯
基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯
基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-2-基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯
基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯
基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯
基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯
基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

	子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	ppm 8.14 (s, 1H), 7.55 (m, 2H), 7.38-7.27 (m, 6H), 6.08 (m, 1H), 4.81 (m, 4H), 4.17 (m, 2H), 3.74 (m, 3H), 3.33-3.10 (m, 3H), 3.07 (m, 1H), 2.53 (m, 2H), 2.37 (m, 1H), 2.14 (m, 1H)	m/e 466 (M+H) ⁺
763	N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.13 (s, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.38-7.27 (m, 6H), 6.09 (m, 1H), 5.10 (s, 1H), 4.78 (s, 4H), 4.28 (m, 2H), 3.94 (m, 2H), 2.50 (m, 2H), 1.37 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 406 (M+H) ⁺
1019	5-氟基-N-{4-[1-(2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.20 (m, 1H), 7.80 (m, 1H), 7.70 (m, 1H), 7.54 (m, 3H), 7.37 (m, 2H), 6.08 (bs, 1H), 4.90 (m, 4H), 4.13 (m, 2H), 3.69 (m, 2H), 2.90 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 1.02 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 415 (M+H) ⁺
1281	5-氟基-N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.21 (s, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.71 (d, <i>J</i> =7.9 Hz, 1H), 7.54 (m, 3H), 7.33 (m, 2H), 6.07 (bs, 1H), 4.83 (m, 4H), 4.14 (m, 2H), 3.91 (t, <i>J</i> =8.1 Hz, 1H), 3.71 (m, 5H), 3.38 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 2.07 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 443 (M+H) ⁺
1282	5-氟基-N-{4-[1-(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.22 (bs, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.72 (d, <i>J</i> =7.8 Hz, 1H), 7.54 (m, 3H), 7.33 (m, 2H), 6.08 (bs, 1H), 4.82 (m, 4H), 4.14 (m, 2H), 3.86 (m, 2H), 3.70 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.42 (td, <i>J</i> =11.4, 2.5 Hz, 2H), 2.90 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 1.77-1.53 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 457 (M+H) ⁺
1283	5-氟基-N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.21 (s, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.71 (d, <i>J</i> =7.7 Hz, 1H), 7.53 (m, 3H), 7.33 (m, 2H), 6.08 (m, 1H), 5.10 (s, 1H), 4.83 (m, 4H), 4.28 (m, 2H), 3.93 (m, 2H), 2.50 (m, 2H), 1.37 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 431 (M+H) ⁺
1284	5-氟基-N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.21 (s, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.72 (d, <i>J</i> =7.9 Hz, 1H), 7.51 (m, 3H), 7.33 (m, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.83 (m, 4H), 4.15 (m, 2H), 3.71 (m, 2H), 3.58 (m, 4H), 3.21 (s, 2H), 2.50 (m, 2H), 2.45 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 472 (M+H) ⁺

實例 495

N-(1'-苯甲醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(5-(1,2,3,6-四氫吡

啉-4-基)吡啉-2-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及苯甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆, 溫度=90℃) δ ppm 8.51 (bs, 1H), 8.32 (d, *J*=2.5 Hz, 1H), 7.90 (d, *J*=8.7 Hz, 1H), 7.77 (dd, *J*=8.7, 2.5 Hz, 1H), 7.48-7.39 (m, 5H), 7.36-7.25 (m, 4H), 6.16 (bs, 1H), 4.81 (s, 4H), 4.18 (m, 2H), 3.68 (m, 2H), 2.55 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 425 (M+H)⁺。

實例 496

N-(4-{[6-(苯甲醯基胺基)己基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用苯甲醯氯代替乙醯氯及 N-{4-[(6-胺基己基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.57 (s, 1H), 8.43 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 8.25 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 7.81-7.86 (m, 2H), 7.74-7.78 (m, 2H), 7.63-7.67 (m, 2H), 7.41-7.54 (m, 3H), 7.29-7.39 (m, 4H), 4.78-4.79 (bs, 4H), 3.15-3.27 (m, 4H), 1.44-1.64 (m, 4H), 1.19-1.39 (m, 4H); MS (ESI(+)) *m/e* 485 (M+H)⁺。

實例 497

N-[4-({4-[(苯甲醯基胺基)甲基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用苯甲醯氯代替乙醯氯及 N-(4-{[4-(胺基甲基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.01 (t, *J*=6.0 Hz, 1H), 8.83 (t, *J*=5.9 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 7.85-7.91 (m, 2H), 7.78-7.83 (m, 2H), 7.63-7.68 (m, 2H), 7.36-7.56 (m, 4H), 7.27 (s, 4H), 7.21-7.26 (m, 1H), 7.10-7.19 (m, 1H), 4.72-4.81 (m, 4H), 4.40-4.48 (m, 4H); MS (ESI(+)) *m/e* 523 (M+H)⁺。

表 8.

以下實例基本上如實例 1C 中所述，用 N-(4-(哌嗪-1-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及適當羧酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
498	N-{4-[4-(5-側氧基-L-脯胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.95-7.98 (bs, 1H), 7.81-7.90 (m, 1H), 7.74-7.77 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 6.92-6.95 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 4.60-4.64 (m, 1H), 3.55-3.76 (m, 4H), 3.03-3.06 (m, 4H), 2.38-2.47 (m, 1H), 2.25-2.37 (m, 2H), 2.08-2.15 (m, 1H)	(ESI(+)) <i>m/e</i> 434 (M+H) ⁺
499	N-{4-[4-(5-側氧基-D-脯胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.95-7.98 (bs, 1H), 7.80-7.84 (bs, 1H), 7.75-7.77 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 6.92-6.95 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 4.60-4.64 (m, 1H), 3.57-3.76 (m, 4H), 3.02-3.08 (m, 4H), 2.38-2.46 (m, 1H), 2.24-2.37 (m, 2H), 2.08-2.15 (m, 1H)	(ESI(+)) <i>m/e</i> 434 (M+H) ⁺
500	N-(4-{4-[(1-乙醯基哌啶-4-基)羧基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.93-7.95 (bs, 1H), 7.75-7.77 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.19 (d, <i>J</i> =4.2 Hz, 1H), 7.16 (d, <i>J</i> =8.2 Hz, 1H), 6.94-6.97 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.66-3.76 (m, 4H), 3.05-3.08 (m, 4H), 2.78-3.03 (m, 3H), 2.01 (s, 3H), 1.81-1.92 (m, 2H), 1.68-1.79 (m, 2H)	(ESI(+)) <i>m/e</i> 476 (M+H) ⁺
501	N-{4-[4-(2-乙醯基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 9.65 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 8.26 (d, <i>J</i> =8.1 Hz, 1H), 7.92-7.93 (bs, 1H), 7.73-7.76 (m, 2H), 7.34-7.39 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 7.12 (dd, <i>J</i> =7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.92-6.94 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.68-3.83 (m, 4H), 3.07-3.10 (m, 4H), 2.09 (s, 3H)	(ESI(+)) <i>m/e</i> 484 (M+H) ⁺

502	N-(4-{4-[4-(甲基磺醯基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.10-8.13 (m, 2H), 7.94-7.96 (bs, 1H), 7.75-7.78 (m, 2H), 7.68-7.71 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 6.94-6.98 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.55-3.78 (m, 4H), 3.17 (s, 3H), 3.08-3.11 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 505 (M+H) $^+$
503	N-[4-(4-丁醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 7.91-7.93 (m, 1H), 7.73-7.77 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.19 (d, $J=7.3$ Hz, 1H), 7.17-7.18 (m, 1H), 6.93-6.96 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.48-3.70 (m, 3H), 3.02-3.06 (m, 4H), 2.43 (d, $J=0.6$ Hz, 1H), 2.31 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 1.65-1.81 (m, 2H), 0.95 (t, $J=7.3$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 393 (M+H) $^+$
504	N-[4-(4-異丁醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 7.92-7.94 (bs, 1H), 7.74-7.76 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 6.93-6.96 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.65-3.69 (m, 4H), 3.03-3.06 (m, 4H), 2.76-2.87 (m, 1H), 1.15 (d, $J=6.7$ Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 393 (M+H) $^+$
505	N-{4-[4-(2-甲基丁醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 7.92-7.94 (bs, 1H), 7.74-7.77 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 6.94-6.97 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.68-3.73 (m, 4H), 3.04-3.07 (m, 4H), 2.68 (h, $J=6.7$ Hz, 1H), 1.76-1.87 (m, 1H), 1.40-1.51 (m, 1H), 1.15 (d, $J=6.7$ Hz, 3H), 0.91 (t, $J=7.4$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) $^+$
506	N-{4-[4-(3,3,3-三氟丙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 7.93-7.95 (bs, 1H), 7.74-7.76 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.92-6.95 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.58-3.78 (m, 4H), 3.57 (q, $J=10.5$ Hz, 2H), 3.02-3.09 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) $^+$
507	N-{4-[4-(甲氧基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 7.92-7.96 (bs, 1H), 7.73-7.76 (m, 2H), 7.16-7.24 (m, 4H), 6.92-6.95 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 4.18 (s, 2H), 3.55-3.78 (m, 4H), 3.39 (s, 3H), 3.03-3.06 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 395 (M+H) $^+$
508	N-{4-[4-(四氫呋喃-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 7.90-7.95 (m, 1H), 7.73-7.75 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 6.92-6.95 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 4.66 (dd, $J=7.2, 5.4$ Hz, 1H), 3.88-3.94 (m, 1H), 3.67-3.83 (m, 5H), 2.93-3.15 (m, 4H), 2.37-2.48 (m, 1H), 1.84-2.05 (m, 2H), 1.70-1.81 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) $^+$
509	N-{4-[4-(四氫呋喃-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 7.93 (d, $J=2.6$ Hz, 1H), 7.74-7.77 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 6.94-6.97 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 4.08 (dd, $J=8.3, 6.5$ Hz, 1H), 4.04 (t, $J=8.0$ Hz, 1H), 3.91 (td, $J=7.9, 5.9$ Hz, 1H), 3.74-3.82 (m, 1H), 3.58-3.76 (m, 4H), 3.26-3.34 (m, 1H), 3.00-3.10 (m, 4H), 2.24-2.33 (m,	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) $^+$

		1H), 1.97-2.07 (m, 1H)	
510	N-{4-[4-(環戊基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.90-7.92 (bs, 1H), 7.73-7.76 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 6.94-6.97 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.46-3.83 (m, 4H), 3.04-3.07 (m, 4H), 2.28-2.49 (m, 3H), 1.81-1.96 (m, 2H), 1.41-1.67 (m, 4H), 1.17-1.32 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) ⁺
511	N-{4-[4-(環己基羧基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.90-7.92 (bs, 1H), 7.73-7.76 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 6.94-6.97 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.64-3.77 (m, 4H), 3.04-3.07 (m, 4H), 2.60 (tt, <i>J</i> =11.0, 3.5 Hz, 1H), 1.55-1.85 (m, 7H), 1.14-1.40 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) ⁺
512	N-{4-[4-(2-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.90-7.92 (bs, 1H), 7.73-7.76 (m, 2H), 7.41 (dd, <i>J</i> =7.4, 1.8 Hz, 1H), 7.30-7.35 (m, 1H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 7.01 (td, <i>J</i> =7.4, 1.0 Hz, 1H), 6.92-6.98 (m, 3H), 4.85 (s, 4H), 3.77-4.30 (m, 2H), 3.70 (s, 3H), 3.51 (s, 2H), 2.79-3.24 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 457 (M+H) ⁺
513	N-{4-[4-(3-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.92 (d, <i>J</i> =2.1 Hz, 1H), 7.74-7.76 (m, 2H), 7.30-7.34 (m, 1H), 7.19-7.24 (m, 3H), 7.15-7.19 (m, 2H), 7.11-7.14 (m, 1H), 7.01 (ddd, <i>J</i> =8.2, 2.6, 1.0 Hz, 1H), 6.93-6.96 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.67-3.79 (m, 7H), 3.06-3.09 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 457 (M+H) ⁺
514	N-{4-[4-(4-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.89-7.92 (m, 1H), 7.74-7.76 (m, 2H), 7.53-7.56 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.15-7.20 (m, 2H), 6.90-7.01 (m, 4H), 4.86 (s, 4H), 3.73-3.78 (m, 4H), 3.71 (s, 3H), 3.08-3.11 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 457 (M+H) ⁺
515	N-{4-[4-(3-氯苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.91-7.93 (bs, 1H), 7.74-7.77 (m, 2H), 7.29-7.41 (m, 3H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 7.09-7.14 (m, 1H), 6.94-6.97 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.65-3.83 (m, 4H), 3.06-3.09 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 445 (M+H) ⁺
516	N-{4-[4-(2-氯苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.91-7.94 (bs, 1H), 7.74-7.76 (m, 2H), 7.34-7.45 (m, 2H), 7.25-7.29 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.94-6.96 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.72-4.17 (m, 2H), 3.26-3.50 (m, 2H), 2.84-3.25 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 461 (M+H) ⁺
517	N-{4-[4-(4-氯苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.91-7.93 (bs, 1H), 7.74-7.77 (m, 2H), 7.47-7.49 (m, 2H), 7.38-7.41 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.94-6.97 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.68-3.71 (m, 4H), 3.07-3.10 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 461 (M+H) ⁺
518	N-{4-[4-(3-氯基苯	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm	(ESI(-))

	甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	7.92-7.94 (bs, 1H), 7.88-7.89 (m, 1H), 7.75-7.77 (m, 2H), 7.71 (dt, $J=7.7$, 1.4 Hz, 1H), 7.65 (dt, $J=7.7$, 1.4 Hz, 1H), 7.44 (t, $J=7.7$ Hz, 1H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 6.94-6.97 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.57-3.83 (m, 4H), 3.08-3.11 (m, 4H)	m/e 450 (M-H) ⁻
519	N-{4-[4-(4-氯基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.93-7.94 (bs, 1H), 7.74-7.77 (m, 2H), 7.65-7.71 (m, 2H), 7.56-7.61 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.94-6.97 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.58-3.77 (m, 4H), 3.08-3.11 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 452 (M+H) ⁺
520	N-(4-{4-[3-(二甲基胺基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.91 (d, $J=2.6$ Hz, 1H), 7.73-7.76 (m, 2H), 7.26-7.31 (m, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.96-6.99 (m, 1H), 6.93-6.97 (m, 2H), 6.90 (dt, $J=7.3$, 1.1 Hz, 1H), 6.78 (ddd, $J=8.4$, 2.7, 0.8 Hz, 1H), 4.85 (s, 4H), 3.71-3.83 (m, 4H), 3.07-3.10 (m, 4H), 2.80 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 470 (M+H) ⁺
521	N-(4-{4-[4-(二甲基胺基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.89-7.91 (bs, 1H), 7.73-7.76 (m, 2H), 7.55-7.57 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.94-6.97 (m, 2H), 6.71-6.73 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.78-3.81 (m, 4H), 3.09-3.12 (m, 4H), 2.81-2.84 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 470 (M+H) ⁺
522	N-{4-[4-(3,4-二甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.91-7.93 (bs, 1H), 7.74-7.77 (m, 2H), 7.26 (d, $J=2.0$ Hz, 1H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 3H), 6.93-7.00 (m, 3H), 4.86 (s, 4H), 3.77-3.80 (m, 4H), 3.77 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 3.07-3.15 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 487 (M+H) ⁺
523	N-{4-[4-(3,5-二甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.91-7.93 (bs, 1H), 7.74-7.76 (m, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.94-6.96 (m, 2H), 6.81-6.82 (m, 2H), 6.67 (t, $J=2.3$ Hz, 1H), 4.86 (s, 4H), 3.70-3.77 (m, 4H), 3.71 (s, 6H), 3.07-3.10 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 487 (M+H) ⁺
524	N-(4-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)乙醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.88-7.90 (bs, 1H), 7.71-7.74 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 7.09 (d, $J=2.0$ Hz, 1H), 6.97 (dd, $J=8.1$, 2.0 Hz, 1H), 6.88-6.93 (m, 3H), 4.85 (s, 4H), 3.81 (s, 2H), 3.74 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 3.67-3.78 (m, 4H), 3.00-3.03 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 501 (M+H) ⁺
525	N-{4-[4-(2-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.89-7.91 (bs, 1H), 7.73-7.76 (m, 2H), 7.57 (dd, $J=1.8$, 0.9 Hz, 1H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 7.08 (dd, $J=3.4$, 0.8 Hz, 1H), 6.93-6.96 (m, 2H), 6.45 (dd, $J=3.4$, 1.7 Hz, 1H), 4.85 (s, 4H), 3.86-3.89 (m, 4H), 3.09-3.12 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 417 (M+H) ⁺
526	N-{4-[4-(3-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.93 (dd, $J=1.6$, 0.8 Hz, 1H), 7.90-7.92 (bs, 1H),	(ESI(+)) m/e 417

	苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	7.73-7.76 (m, 2H), 7.52-7.53 (m, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.93-6.96 (m, 2H), 6.72 (dd, $J=1.8, 0.9$ Hz, 1H), 4.85 (s, 4H), 3.77-3.80 (m, 4H), 3.06-3.10 (m, 4H)	(M+H) ⁺
527	N-{4-[4-(1H-吡咯-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 11.87-11.96 (bs, 1H), 7.88-7.89 (bs, 1H), 7.72-7.75 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 7.10 (td, $J=2.7, 1.3$ Hz, 1H), 6.92-6.95 (m, 2H), 6.68-6.70 (m, 1H), 6.33-6.36 (m, 1H), 4.85 (s, 4H), 3.94-3.97 (m, 4H), 3.09-3.12 (m, 4H)	(ESI(-)) m/e 414 (M-H) ⁻
528	N-{4-[4-(1H-吡啶-5-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.88 (d, $J=2.5$ Hz, 1H), 7.77 (d, $J=2.2$ Hz, 1H), 7.71-7.74 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 6.91-6.95 (m, 3H), 4.85 (s, 4H), 4.06-4.14 (m, 4H), 3.07-3.18 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 417 (M+H) ⁺
529	N-{4-[4-(吡啶-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.60 (ddd, $J=4.8, 1.8, 0.9$ Hz, 1H), 7.84-7.97 (m, 1H), 7.76 (dt, $J=7.7, 1.1$ Hz, 1H), 7.72-7.75 (m, 2H), 7.69 (td, $J=7.6, 1.8$ Hz, 1H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.17-7.19 (m, 2H), 6.93-6.96 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.73-3.99 (m, 4H), 3.08-3.19 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 428 (M+H) ⁺
530	N-{4-[4-(吡啶-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.92 (dd, $J=2.2, 0.9$ Hz, 1H), 8.70 (dd, $J=4.8, 1.7$ Hz, 1H), 7.90-8.02 (m, 1H), 7.82 (dt, $J=7.8, 2.0$ Hz, 1H), 7.74-7.77 (m, 2H), 7.27 (ddd, $J=7.7, 4.8, 0.9$ Hz, 1H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.93-6.96 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.68-3.72 (m, 4H), 3.06-3.09 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 428 (M+H) ⁺
531	N-[4-(4-異菸鹼基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.74-8.76 (m, 2H), 7.95 (d, $J=2.8$ Hz, 1H), 7.75-7.78 (m, 2H), 7.38-7.40 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 6.94-6.97 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.56-3.76 (m, 4H), 3.06-3.09 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 428 (M+H) ⁺
532	N-{4-[4-(噻吩-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 9.22 (dd, $J=5.0, 1.7$ Hz, 1H), 7.91 (dd, $J=8.3, 1.8$ Hz, 1H), 7.89-7.92 (bs, 1H), 7.72-7.75 (m, 2H), 7.51 (dd, $J=8.5, 5.1$ Hz, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.92-6.95 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.60-4.20 (m, 4H), 2.94-3.32 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 429 (M+H) ⁺
533	N-{4-[4-(吡嗪-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 9.33 (d, $J=1.4$ Hz, 1H), 8.87 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.91-7.93 (bs, 1H), 7.73-7.76 (m, 2H), 7.70 (dd, $J=5.0, 1.4$ Hz, 1H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.18 (t, $J=3.4$ Hz, 2H), 6.94-6.96 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.48-4.06 (m, 4H), 3.12-3.15 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 429 (M+H) ⁺
534	N-{4-[4-(嘧啶-4-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 9.13 (d, $J=1.5$ Hz, 1H), 8.59 (d, $J=2.5$ Hz, 1H), 8.50 (dd, $J=2.5, 1.5$ Hz, 1H), 7.91 (d, $J=0.8$ Hz, 1H), 7.73-7.76 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-	(ESI(+)) m/e 429 (M+H) ⁺

	甲醯胺	7.18 (m, 2H), 6.94-6.97 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.73-3.96 (m, 4H), 3.07-3.22 (m, 4H)	
535	N-{4-[4-(N,N-二甲基-β-丙胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.90-7.93 (bs, 1H), 7.72-7.75 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.90-6.93 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.55-3.72 (m, 4H), 3.33 (t, <i>J</i> =7.2 Hz, 2H), 3.00-3.05 (m, 4H), 2.96 (t, <i>J</i> =7.2 Hz, 2H), 2.64 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 422 (M+H) ⁺
536	N-[4-(4-乙醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.89-7.92 (bs, 1H), 7.73-7.75 (m, 2H), 7.20-7.23 (m, 2H), 7.15-7.19 (m, 2H), 6.92-6.95 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.48-3.81 (m, 4H), 2.97-3.03 (m, 4H), 2.04 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 365 (M+H) ⁺
537	N-{4-[4-(2-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.90-7.92 (bs, 1H), 7.73-7.76 (m, 2H), 7.46-7.51 (m, 1H), 7.29-7.36 (m, 1H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.18 (m, 3H), 7.09-7.12 (m, 1H), 6.93-6.95 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.38-4.02 (m, 4H), 2.90-3.23 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 445 (M+H) ⁺
538	N-{4-[4-(4-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.91-7.93 (bs, 1H), 7.74-7.77 (m, 2H), 7.52-7.58 (m, 2H), 7.20-7.25 (m, 2H), 7.16-7.20 (m, 2H), 7.09-7.15 (m, 2H), 6.94-6.97 (m, 2H), 4.86 (s, 4H), 3.69-3.72 (m, 4H), 3.07-3.10 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 445 (M+H) ⁺
539	N-{4-[4-(苯基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ -D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 2.95-3.04 (m, 4 H), 3.68 (s, 4 H), 3.83 (s, 2 H), 4.85 (s, 4 H), 6.87-6.93 (m, 2 H), 7.15-7.24 (m, 4 H), 7.27-7.33 (m, 2 H), 7.40 (d, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 7.68-7.75 (m, 2 H), 7.89 (s, 1H)	(ESI(+)) m/e 441 (M+H) ⁺
540	N-{4-[4-(1,3-噻唑-4-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 8.97 (d, <i>J</i> =2.1 Hz, 1H), 8.17 (d, <i>J</i> =2.1 Hz, 1H), 7.88-7.89 (bs, 1H), 7.72-7.75 (m, 2H), 7.19-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.93-6.96 (m, 2H), 4.85 (s, 4H), 3.98-4.01 (m, 4H), 3.13-3.16 (m, 4H)	(ESI(-)) m/e 432 (M-H) ⁻
541	N-{4-[4-(嗎啉-4-基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 吡啶- <i>d</i> ₅ , 溫度=90°C) δ ppm 7.85-8.03 (m, 1H), 7.74-7.77 (m, 2H), 7.21-7.23 (m, 2H), 7.16-7.19 (m, 2H), 6.97 (d, <i>J</i> =7.0 Hz, 1H), 6.95-6.95 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 3.73-3.76 (m, 4H), 3.64-3.71 (m, 4H), 3.29 (s, 2H), 3.07-3.10 (m, 4H), 2.54-2.57 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 450 (M+H) ⁺

實例 542

5-氟基-N-(4-苯基丁基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用異氰酸 4-苯基丁酯代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯及 5-氟基異吲哚啉代替異吲哚啉

製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 7.82 (s, 1H), 7.74 (dd, *J*=7.9, 1.5 Hz, 1H), 7.53 (d, *J*=7.9 Hz, 1H), 7.24-7.31 (m, 2H), 7.08-7.22 (m, 3H), 6.38 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 4.59-4.64 (m, 4H), 3.06-3.13 (m, 2H), 2.58 (t, *J*=7.5 Hz, 2H), 1.53-1.68 (m, 2H), 1.36-1.51 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 319 (M+H)⁺。

實例 543

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-2-甲醯胺

實例 543A

N-(4-溴苯基)-1H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-2(3H)-甲醯胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用異氰酸 4-溴苯酯代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯及 2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶代替異吲哚啉製備。

實例 543B

4-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 280 中所述，用 4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯代替 1H-吡啶-3-基酮酸及 N-(4-溴苯基)-1H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。

實例 543C

N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-

2(3H)-甲醯胺

標題化合物如實例2D中所述，用4-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯代替4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例543D

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例278中所述，用丁醯氯代替乙醯氯及N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.46 (s, 1H), 7.54-7.57 (m, 2H), 7.43 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 7.32-7.39 (m, 2H), 6.09-6.11 (m, 1H), 4.79-4.82 (m, 4H), 4.08-4.14 (m, 2H), 3.58-3.68 (m, 2H), 2.39-2.55 (m, 2H), 2.34 (dt, *J*=19.9, 7.4 Hz, 2H), 1.47-1.62 (m, 2H), 0.88-0.93 (m, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 391 (M+H)⁺。

實例544

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例278中所述，用異丁醯氯代替乙醯氯及N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異

N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,2-二氟乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N α -(4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲鹽基)-L-苯基丙胺鹽胺；

吡啶-2-甲醯胺製備。 ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.46 (s, 1H), 7.54-7.57 (m, 2H), 7.43 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.34-7.38 (m, 2H), 6.10-6.13 (bs, 1H), 4.79-4.82 (m, 4H), 4.07-4.21 (m, 2H), 3.67-3.70 (m, 2H), 2.85-3.01 (m, 1H), 2.39-2.55 (m, 2H), 0.97-1.08 (m, 6H); MS (ESI(+)) m/e 391 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ 。

實例 545

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用苯甲醯氯代替乙醯氯及 N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吡啶-2-甲醯胺製備。 ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.46 (s, 1H), 7.55-7.58 (m, 2H), 7.42-7.49 (m, 6H), 7.35-7.41 (m, 2H), 5.98-6.21 (m, 1H), 4.79-4.82 (m, 4H), 3.95-4.39 (m, 2H), 3.79-3.93 (m, 1H), 3.51-3.61 (m, 1H), 2.46-2.60 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 425 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ 。

表 9.

以下實例基本上如實例 1C 中所述，用 N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及相應羧酸代替 4-(異吡啶-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
546	N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.46 (s, 1H), 7.54-7.57 (m, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.36 (dd, <i>J</i> =8.4, 4.2 Hz, 2H), 6.09-6.12 (m, 1H), 4.75-4.87 (m, 4H), 4.10-4.21 (m, 2H), 3.90 (dt, <i>J</i> =11.3, 8.1 Hz, 1H), 3.66-3.75 (m, 5H), 3.32-3.50 (m, 1H), 2.41-2.57 (m, 2H), 1.95-2.10 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺
620	N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.32 (m, 2H), 6.06 (m, 1H), 4.80 (d, <i>J</i> =8.9 Hz, 4H), 4.18 (s, 2H), 4.10 (m, 2H), 3.65 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.49 (m, 2H), 3.27 (s, 3H), 2.50 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) ⁺
705	N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (d, <i>J</i> =5.5 Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.79 (m, 4H), 4.67 (dd, <i>J</i> =7.6, 5.6 Hz, 1H), 4.14 (bs, 2H), 3.85-3.64 (m, 4H), 2.50 (m, 2H), 2.11 (m, 1H), 2.00 (m, 1H), 1.85 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺
706	N-{4-[1-(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.80 (m, 4H), 4.14 (bs, 2H), 3.86 (m, 2H), 3.70 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 2H), 3.42 (td, <i>J</i> =11.4, 2.5 Hz, 2H), 2.92 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 1.72-1.52 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) ⁺
707	N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (d, <i>J</i> =4.9 Hz, 1H), 7.32 (m, 2H), 6.06 (m, 1H), 4.80 (m, 4H), 4.36 (dd, <i>J</i> =9.2, 2.9 Hz, 1H), 4.14 (s, 2H), 3.83-3.60 (m, 7H), 3.52 (m, 1H), 2.50 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) ⁺
708	N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (dd, <i>J</i> =5.0, 1.1 Hz, 1H), 7.32 (m, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.79 (m, 4H), 4.12 (m, 2H), 3.68 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.27 (m, 1H), 2.77 (t, <i>J</i> =8.6 Hz, 1H), 2.62-2.45 (m, 2H), 2.50 (m, 2H), 2.38 (m, 1H), 2.24 (s, 3H), 1.97 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 432 (M+H) ⁺
709	N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.80 (m, 4H), 4.17 (bs, 2H), 3.72 (m, 3H), 3.31-3.13 (m, 3H), 3.07 (m, 1H), 2.51 (bs, 2H), 2.35 (m, 1H), 2.13 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 467 (M+H) ⁺

710	N-{4-[1-(2-羥基-2-甲 基丙醯基)-1,2,3,6-四 氫吡啶-4-基]苯基}- 1,3-二氫-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.20 (bs, 1H), 7.52 (m, 2H), 7.38 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 6.08 (bs, 1H), 5.09 (s, 1H), 4.82 (m, 4H), 4.28 (m, 2H), 3.93 (m, 2H), 2.51 (m, 2H), 1.36 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) $^+$
799	N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙 醯基)-1,2,3,6-四氫吡 啶-4-基]苯基}-1,3-二 氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡 啶-2-甲醯胺	^1H NMR (501 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.49 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.25 (bs, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.39 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.33 (s, 1H), 6.08 (m, 1H), 4.82 (bs, 2H), 4.80 (bs, 2H), 4.18 (m, 2H), 3.71 (m, 2H), 3.58 (m, 4H), 3.21 (bs, 2H), 2.52 (m, 2H), 2.45 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e XXX (M+H) $^+$
967	N-(4-{1-[(2R)-四氫呋 喃-2-基羧基]-1,2,3,6- 四氫吡啶-4-基}苯基)- 1,3-二氫-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.21 (bs, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.80 (m, 4H), 4.67 (t, $J=6.5$ Hz, 1H), 4.14 (m, 2H), 3.86-3.64 (m, 4H), 2.50 (m, 2H), 2.11 (m, 1H), 2.00 (m, 1H), 1.86 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) $^+$
968	N-(4-{1-[(2S)-四氫呋 喃-2-基羧基]-1,2,3,6- 四氫吡啶-4-基}苯基)- 1,3-二氫-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.32 (m, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.79 (m, 4H), 4.67 (dd, $J=7.5, 5.6$ Hz, 1H), 4.14 (m, 2H), 3.85-3.66 (m, 4H), 2.50 (m, 2H), 2.11 (m, 1H), 2.00 (m, 1H), 1.86 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) $^+$
1014	N-(4-{1-[(1-甲基哌啶- 4-基)羧基]-1,2,3,6-四 氫吡啶-4-基}苯基)- 1,3-二氫-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.20 (bs, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.32 (m, 2H), 6.07 (bs, 1H), 4.82 (m, 4H), 4.12 (m, 2H), 3.67 (t, $J=5.7$ Hz, 2H), 2.76 (m, 2H), 2.55 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 2.16 (s, 3H), 1.95 (td, $J=11.2, 3.6$ Hz, 2H), 1.62 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 446 (M+H) $^+$
1015	N-(4-{1-[(1,1-二氧離 子基四氫-2H-硫哌喃- 4-基)羧基]-1,2,3,6-四 氫吡啶-4-基}苯基)- 1,3-二氫-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 6.08 (m, 1H), 4.82 (m, 4H), 4.15 (m, 2H), 3.71 (t, $J=5.7$ Hz, 2H), 3.24-3.04 (m, 5H), 2.50 (m, 2H), 2.06 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 481 (M+H) $^+$
1016	N-(4-{1-[(3R)-四氫呋 喃-3-基羧基]-1,2,3,6- 四氫吡啶-4-基}苯基)- 1,3-二氫-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.79 (m, 4H), 4.14 (m, 2H), 3.91 (t, $J=8.1$ Hz, 1H), 3.77-3.67 (m, 5H), 3.38 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 2.05 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) $^+$
1017	N-(4-{1-[(3S)-四氫呋 喃-3-基羧基]-1,2,3,6- 四氫吡啶-4-基}苯基)-	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.33	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) $^+$

	1,3-二氫-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	(m, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.79 (m, 4H), 4.14 (m, 2H), 3.91 (t, $J=8.1$ Hz, 1H), 3.78-3.64 (m, 5H), 3.38 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 2.05 (m, 2H)	
1077	N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (bs, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.37 (m, 1H), 7.32 (m, 2H), 6.06 (m, 1H), 4.81 (m, 4H), 4.11 (d, $J=2.8$ Hz, 2H), 3.82 (dd, $J=8.4, 6.8$ Hz, 1H), 3.76-3.59 (m, 4H), 3.29 (dd, $J=8.4, 6.1$ Hz, 1H), 2.58-2.40 (m, 5H), 2.02 (m, 1H), 1.53 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) $^+$
1078	N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.52 (m, 2H), 7.38 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.32 (m, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.80 (m, 4H), 4.11 (m, 2H), 3.81 (m, 2H), 3.67 (t, $J=5.7$ Hz, 2H), 3.30 (td, $J=11.5, 2.2$ Hz, 2H), 2.50 (m, 2H), 2.31 (d, $J=6.8$ Hz, 2H), 2.98 (m, 1H), 1.62 (m, 2H), 1.25 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 447 (M+H) $^+$
1079	N-{4-[1-(N,N-二甲基甘胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.80 (m, 4H), 4.15 (m, 2H), 3.70 (t, $J=5.7$ Hz, 2H), 3.15 (s, 2H), 2.50 (m, 2H), 2.23 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 406 (M+H) $^+$
1080	N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.32 (m, 2H), 6.06 (m, 1H), 4.80 (m, 4H), 4.15 (m, 2H), 3.71 (m, 2H), 3.19 (m, 4H), 2.44 (m, 4H), 2.33 (m, 4H), 2.15 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 461 (M+H) $^+$
1254	N-{4-[1-(3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.39 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.81 (m, 4H), 4.12 (m, 2H), 3.67 (t, $J=5.7$ Hz, 2H), 2.50 (m, 2H), 2.25 (d, $J=6.9$ Hz, 2H), 2.05 (m, 1H), 0.94 (d, $J=6.6$ Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 405 (M+H) $^+$
1255	N-{4-[1-(環戊基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.39 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.82 (m, 4H), 4.11 (m, 2H), 3.67 (t, $J=5.7$ Hz, 2H), 2.50 (m, 2H), 2.38 (d, $J=7.1$ Hz, 2H), 2.21 (m, 1H), 1.77 (m, 2H), 1.66-1.46 (m, 4H), 1.18 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 431 (M+H) $^+$
1256	N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.39 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.80 (m, 4H), 4.16 (m, 3H), 3.77 (m, 1H), 3.68 (m, 2H), 3.60 (m, 1H), 2.69 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 2.45 (m, 1H), 2.02	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) $^+$

		(m, 1H), 1.83 (m, 2H), 1.54 (m, 1H)	
1257	N-{4-[1-(四氫-2H-嘧喃-2-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.39 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 6.06 (m, 1H), 4.83 (m, 4H), 4.12 (m, 2H), 3.83 (m, 1H), 3.69 (m, 3H), 3.35 (m, 1H), 2.61 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 2.37 (m, 1H), 1.82-1.63 (m, 2H), 1.48 (m, 3H), 1.26 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 447 (M+H) ⁺
1258	N-{4-[1-(吡咯啉-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.21 (bs, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.39 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 6.07 (bs, 1H), 4.81 (m, 4H), 4.15 (m, 2H), 3.71 (m, 2H), 3.32 (bs, 2H), 2.55 (m, 4H), 2.50 (m, 2H), 1.70 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 432 (M+H) ⁺
1259	N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.85 (d, <i>J</i> =1.5 Hz, 1H), 8.72 (d, <i>J</i> =2.5 Hz, 1H), 8.66 (m, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.34 (m, 2H), 6.09 (m, 1H), 4.82 (m, 4H), 4.22 (m, 2H), 3.69 (m, 2H), 2.57 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 427 (M+H) ⁺
1479	N-(4-{1-[(2-甲基-1,3-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 8.25 (s, 1 H) 7.49-7.54 (m, 2 H) 7.41 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 7.33-7.37 (m, 2 H) 6.11 (t, <i>J</i> =3.51 Hz, 1 H) 4.82 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 4 H) 4.36 (s, 2 H) 3.95 (s, 2 H) 2.53-2.59 (m, 2 H) 2.45-2.47 (m, 3 H)	(ESI(+)) m/e 430 (M+H) ⁺
1480	N-{4-[1-(呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1 H) 8.49 (d, <i>J</i> =5.19 Hz, 1 H) 7.98 (s, 1 H) 7.67 (t, <i>J</i> =1.68 Hz, 1 H) 7.52 (d, <i>J</i> =8.54 Hz, 2 H) 7.43 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 7.35 (d, <i>J</i> =8.54 Hz, 2 H) 6.69 (s, 1 H) 6.05-6.13 (m, 1 H) 4.82 (d, 4 H) 4.23-4.28 (m, 2 H) 3.79 (t, <i>J</i> =5.80 Hz, 2 H) 2.53-2.59 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 415 (M+H) ⁺
1481	N-(4-{1-[(2E)-3-(呋喃-2-基)丙-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 7.70 (d, <i>J</i> =1.53 Hz, 1 H) 7.49-7.55 (m, 2 H) 7.30-7.44 (m, 4 H) 6.91 (d, <i>J</i> =15.26 Hz, 1 H) 6.81 (d, <i>J</i> =3.36 Hz, 1 H) 6.57 (dd, <i>J</i> =3.36, 1.83 Hz, 1 H) 6.12 (t, <i>J</i> =3.51 Hz, 1 H) 4.81 (d, 4 H) 4.24-4.28 (m, 2 H) 3.81 (t, <i>J</i> =5.65 Hz, 2 H) 2.55 (s, 2 H)	(ESI(+)) m/e 441 (M+H) ⁺
1482	N-{4-[1-(1,3-噁唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1 H) 8.49 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 8.41 (s, 1 H) 7.67 (s, 1 H) 7.52 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 7.44 (d, <i>J</i> =5.19 Hz, 1 H) 7.36 (d, <i>J</i> =8.54 Hz, 2 H) 6.09-6.14 (m, 1 H) 4.83 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 4 H) 4.32 (d, <i>J</i> =2.75 Hz, 2 H) 3.87 (t, <i>J</i> =5.80 Hz, 2 H) 2.60 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 416 (M+H) ⁺
1483	N-{4-[1-(3,3,3-三氟丙	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ	(ESI(+))

	噻基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, 1 H) 7.52 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.42 (d, 1 H) 7.35 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 6.08 (s, 1 H) 4.81 (d, $J=9.16$ Hz, 4 H) 4.12-4.16 (m, 2 H) 3.65-3.73 (m, 2 H) 3.51-3.63 (m, 2 H) 2.52-2.58 (m, 2 H)	m/e 431 (M+H) ⁺
1484	N-(4-{1-[(1,5-二甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.35 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 6.33 (s, 1 H) 6.07-6.12 (m, 1 H) 4.81 (d, $J=7.32$ Hz, 4 H) 4.36 (s, 2 H) 3.94 (s, 2 H) 3.75-3.78 (m, 3 H) 2.52-2.57 (m, 2 H) 2.26-2.29 (m, 3 H)	(ESI(+)) m/e 443 (M+H) ⁺
1485	N-(4-{1-[(4-甲氧基環己基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.34 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 6.09 (t $J=3.51$ Hz, 1 H) 4.81 (d, $J=7.63$ Hz, 4 H) 4.12 (s, 2 H) 3.68 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 3.37-3.43 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 2.61-2.74 (m, 1 H) 2.44-2.50 (m, 2 H) 1.82-1.91 (m, $J=12.97, 3.81$ Hz, 2 H) 1.62-1.75 (m, 2 H) 1.37-1.55 (m, 4 H)	(ESI(+)) m/e 461 (M+H) ⁺
1486	N-{4-[1-(2,3-二甲基丁噻基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.34 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 6.07-6.13 (m, 1 H) 4.81 (d, $J=7.63$ Hz, 4 H) 4.15 (s, 2 H) 3.66-3.76 (m, 2 H) 2.56-2.65 (m, 1 H) 2.42-2.50 (m, 2 H) 1.74-1.89 (m, 1 H) 1.00 (d, $J=6.71$ Hz, 3 H) 0.87 (dd, $J=13.58, 6.87$ Hz, 6 H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺
1487	N-(4-{1-[(2,2-二氟環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.52 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.35 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 6.10 (s, 1 H) 4.82 (d, $J=7.32$ Hz, 4 H) 4.19 (s, 2 H) 3.65-3.94 (m, 2 H) 2.94-3.16 (m, $J=7.32$ Hz, 1 H) 2.52-2.66 (m, 2 H) 1.91-2.00 (m, 1 H) 1.76-1.88 (m, 1 H)	(ESI(+)) m/e 425 (M+H) ⁺
1488	N-{4-[1-(1H-吡唑-5-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.71 (d, $J=2.14$ Hz, 1 H) 7.33-7.55 (m, 5 H) 6.59 (d, $J=2.44$ Hz, 1 H) 6.11 (s, 1 H) 4.82 (d, $J=6.41$ Hz, 4 H) 4.37 (s, 2 H) 3.95 (s, 2 H) 2.53-2.59 (m, $J=3.05$ Hz, 2 H)	(ESI(+)) m/e 415 (M+H) ⁺
1489	N-{4-[1-(第三丁氧基乙噻基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.34 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 6.08 (t, $J=3.36$ Hz, 1 H) 4.82 (d, $J=7.93$ Hz, 4 H) 4.12 (s, 2 H) 4.05 (s, 2 H) 3.69 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 1.19 (s, 9 H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) ⁺
1490	N-(4-{1-[3-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙噻基]-	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 8.39	(ESI(+)) m/e 444

	1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	(s, 1 H) 7.88 (s, 1 H) 7.48-7.53 (m, 2 H) 7.42 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.33 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 6.05 (s, 1 H) 4.82 (d, $J=6.41$ Hz, 4 H) 4.46 (t, $J=6.71$ Hz, 2 H) 4.07-4.12 (m, 2 H) 3.60-3.67 (m, 2 H) 2.98 (t, $J=6.26$ Hz, 2 H) 2.42-2.49 (m, 2 H)	(M+H) ⁺
1491	N-{4-[1-(3-乙氧基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 7.42 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.34 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 6.06-6.10 (m, 1 H) 4.82 (d, $J=7.63$ Hz, 4 H) 4.13 (s, 2 H) 3.62-3.72 (m, 4 H) 3.44 (q, $J=7.22$ Hz, 2 H) 2.57-2.65 (m, 2 H) 1.09 (t, $J=6.87$ Hz, 3 H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
1492	N-{4-[1-(3-羥基-3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, 溶劑) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.49-7.54 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.34 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 6.08 (s, 1 H) 4.81 (d, $J=7.63$ Hz, 4 H) 4.16 (s, 2 H) 3.72 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 2.31-2.50 (m, $J=14.04$ Hz, 2 H) 1.12-1.33 (m, 8 H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
1493	N-(4-{1-[3-(1H-吡咯-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.32 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 6.72 (t, $J=1.98$ Hz, 2 H) 6.04 (t, 1 H) 5.96 (t, $J=2.14$ Hz, 2 H) 4.81 (d, $J=7.93$ Hz, 4 H) 4.16 (t, $J=6.87$ Hz, 2 H) 4.06 (t, 2 H) 3.63 (s, 2 H) 2.82 (s, 2 H) 2.45 (s, 2 H)	(ESI(+)) m/e 442 (M+H) ⁺
1494	N-(4-{1-[(1-甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.48-7.54 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.32-7.37 (m, 2 H) 6.11 (t, $J=3.51$ Hz, 1 H) 4.79-4.85 (m, 4 H) 4.12-4.20 (m, 2 H) 3.78 (t, $J=5.65$ Hz, 2 H) 2.47-2.51 (m, 2 H) 1.26-1.30 (m, 3 H) 0.81-0.86 (m, 2 H) 0.55-0.62 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 403 (M+H) ⁺
1495	N-(4-{1-[(2-甲基丙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.48-7.53 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.31-7.35 (m, 2 H) 6.05-6.09 (m, 1 H) 4.82 (d, $J=7.93$ Hz, 4 H) 4.07-4.20 (m, 4 H) 3.67 (t, $J=5.65$ Hz, 2 H) 3.18-3.24 (m, 2 H) 2.47-2.51 (m, 2 H) 1.76-1.89 (m, 1 H) 0.85-0.91 (m, 6 H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) ⁺
1496	N-{4-[1-(1-甲基脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.49-7.54 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.34 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 6.09 (t, $J=3.36$ Hz, 1 H) 4.78-4.84 (m, 4 H) 4.19 (s, 2 H) 3.66-3.89 (m, 2 H) 3.30-3.35 (m, 1 H) 2.98-3.06 (m, 1 H) 2.43-2.50 (m, 2 H) 2.29-2.37 (m, 1 H) 2.27 (s, 3 H) 2.05-2.14 (m, 1 H) 1.71-1.86 (m, 3 H)	(ESI(+)) m/e 432 (M+H) ⁺
1497	N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基}-	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.49-7.53 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.34 (d,	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺

	1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$J=8.85$ Hz, 2 H) 6.09 (t, $J=3.66$ Hz, 1 H) 4.81 (d, $J=7.02$ Hz, 4 H) 4.29 (s, 2 H) 3.85-3.98 (m, 2 H) 2.46-2.51 (m, 2 H) 1.59-1.86 (m, 2 H) 1.32-1.35 (m, 3 H) 0.82 (t, 3 H)	
1498	N-(4-{1-[(1-羥基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 7.42 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.33-7.37 (m, 2 H) 6.11 (t, $J=3.36$ Hz, 1 H) 4.82 (d, $J=6.41$ Hz, 4 H) 4.24 (s, 2 H) 3.87 (t, $J=5.65$ Hz, 2 H) 2.52-2.57 (m, 2 H) 0.93-0.99 (m, 2 H) 0.80-0.85 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 405 (M+H) $^+$
1499	N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.42 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.31-7.37 (m, 2 H) 6.05-6.11 (m, 1 H) 4.82 (d, $J=6.41$ Hz, 4 H) 4.09-4.13 (m, $J=3.05$ Hz, 2 H) 3.67 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 2.46-2.50 (m, 2 H) 2.33 (d, $J=6.71$ Hz, 2 H) 1.00 (s, 1 H) 0.44-0.51 (m, 2 H) 0.16 (q, $J=4.98$ Hz, 2 H)	(ESI(+)) m/e 403 (M+H) $^+$
1500	N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.49-7.53 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.31-7.36 (m, 2 H) 6.04-6.12 (m, 1 H) 4.79-4.84 (m, 4 H) 4.14 (s, 2 H) 3.70 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 3.02 (m, $J=7.63$ Hz, 1 H) 2.43-2.49 (m, 2 H) 1.48-1.86 (m, 8 H)	(ESI(+)) m/e 417 (M+H) $^+$
1501	N-[4-(1-{[1-(甲氧基甲基)環丙基]羰基}-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.48-7.55 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.34 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 6.06-6.12 (m, $J=3.51$, 3.51 Hz, 1 H) 4.79-4.85 (m, 4 H) 4.17 (d, $J=3.05$ Hz, 2 H) 3.79 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 3.44 (s, 2 H) 3.25 (s, 3 H) 2.46-2.50 (m, 2 H) 0.85-0.90 (m, 2 H) 0.73-0.80 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) $^+$
1502	N-(4-{1-[(甲基磺醯基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1 H) 8.49 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.52 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.42 (d, $J=5.49$ Hz, 1 H) 7.32-7.38 (m, $J=8.85$ Hz, 2 H) 6.08 (s, 1 H) 4.82 (d, $J=6.10$ Hz, 4 H) 4.35-4.46 (m, 2 H) 4.11-4.26 (m, 2 H) 3.74 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 3.08-3.12 (m, 3 H) 2.53-2.69 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 441 (M+H) $^+$
1503	N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1 H) 8.49 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 8.00 (s, 1 H) 7.69 (s, 1 H) 7.49-7.54 (m, 2 H) 7.42 (d, $J=5.49$ Hz, 1 H) 7.33-7.38 (m, 2 H) 6.07-6.12 (m, $J=3.51$, 3.51 Hz, 1 H) 4.79-4.85 (m, 4 H) 4.27 (d, $J=3.05$ Hz, 2 H) 3.87 (s, 3 H) 3.81 (t, $J=5.65$ Hz, 2 H) 2.54-2.61 (m, $J=3.36$ Hz, 2 H)	(ESI(+)) m/e 429 (M+H) $^+$
1504	N-[4-(1-乙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.51	(ESI(+)) m/e 363

	苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	(d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.34 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 6.08 (t, $J=3.51$ Hz, 1 H) 4.82 (d, $J=7.32$ Hz, 4 H) 4.10 (s, 2 H) 3.65 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 2.41-2.51 (m, 2 H) 2.06 (s, 3 H)	(M+H) ⁺
1505	N-{4-[1-(環丙基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.52 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=4.58$ Hz, 1 H) 7.35 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 6.10 (s, 1 H) 4.81 (d, $J=8.54$ Hz, 4 H) 4.22 (s, 2 H) 3.71-3.84 (m, 2 H) 2.37-2.49 (m, 2 H) 1.90-2.01 (m, $J=13.73$ Hz, 1 H) 0.71-0.84 (m, 4 H)	(ESI(+)) m/e 389 (M+H) ⁺
1506	N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.34 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 6.08-6.12 (m, 1 H) 4.81 (d, $J=7.93$ Hz, 4 H) 4.14-4.20 (m, $J=1.83$ Hz, 2 H) 3.74 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 2.60-2.71 (m, 1 H) 2.43-2.50 (m, 2 H) 1.37-1.62 (m, 4 H) 0.82 (t, $J=7.32$ Hz, 6 H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺
1507	N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯氨酸醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1 H) 8.49 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.52 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.43 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.35 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 6.09 (s, 1 H) 4.82 (d, $J=6.71$ Hz, 4 H) 4.58 (s, 1 H) 4.14 (s, 2 H) 3.70 (t, 2 H) 2.55-2.64 (m, 1 H) 2.29-2.46 (m, 2 H) 2.14-2.22 (m, 2 H) 1.92 (s, 1 H)	(ESI(+)) m/e 432 (M+H) ⁺
1508	N-(4-{1-[(2E)-4-甲基戊-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.34 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 6.66 (dd, $J=15.26, 6.71$ Hz, 1 H) 6.34 (d, $J=15.26$ Hz, 1 H) 6.06-6.11 (m, 1 H) 4.81 (d, $J=7.32$ Hz, 4 H) 4.18 (d, $J=2.75$ Hz, 2 H) 3.74 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 2.38-2.50 (m, 3 H) 1.05 (d, $J=6.71$ Hz, 6 H)	(ESI(+)) m/e 417 (M+H) ⁺
1509	N-{4-[1-(2-甲氧基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=4.58$ Hz, 1 H) 7.35 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 6.07-6.14 (m, 1 H) 4.78-4.84 (m, 4 H) 4.31 (s, 2 H) 3.92 (s, 2 H) 3.16 (s, 3 H) 2.47-2.50 (m, 2 H) 1.35-1.39 (m, 6 H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
1510	N-{4-[1-(環戊-1-烯-1-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.32-7.37 (m, 2 H) 6.06-6.11 (m, 1 H) 5.92-5.95 (m, 1 H) 4.81 (d, $J=7.63$ Hz, 4 H) 4.15 (q, $J=2.64$ Hz, 2 H) 3.71 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 2.53-2.57 (m, 2 H) 2.41-2.50 (m, 4 H) 1.85-1.95 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 415 (M+H) ⁺
1511	N-{4-[1-(噻吩-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.50 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 7.39-7.43 (m, $J=4.12, 4.12$	(ESI(+)) m/e 445 (M+H) ⁺

	氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 7.31 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.23 (s, 1 H) 7.02 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 6.06 (s, 1 H) 4.81 (d, $J=7.32$ Hz, 4 H) 4.15 (s, 2 H) 3.77 (s, 2 H) 3.70 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 2.38-2.48 (m, 2 H)	
1512	N-{4-[1-(環己基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.49-7.53 (m, 2 H) 7.41 (d, 1 H) 7.34 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 6.09 (s, 1 H) 4.81 (d, 4 H) 4.12 (s, 2 H) 3.68 (t, $J=5.95$ Hz, 2 H) 2.38-2.50 (m, 2 H) 1.61-1.78 (m, 5H) 1.20-1.45 (m, 6 H)	(ESI(+)) m/e 431 ($\text{M}+\text{H}$) ⁺
1513	N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.32-7.37 (m, 2 H) 6.05-6.11 (m, 1 H) 4.81 (d, $J=7.02$ Hz, 4 H) 4.11 (d, $J=3.05$ Hz, 2 H) 3.66 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 2.45-2.50 (m, 2 H) 2.33-2.41 (m, 2 H) 1.05 (t, $J=7.32$ Hz, 3 H)	(ESI(+)) m/e 377 ($\text{M}+\text{H}$) ⁺
1514	N-{4-[1-(2,2-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.48-7.54 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.31-7.37 (m, 2 H) 6.07-6.13 (m, 1 H) 4.81 (d, $J=7.02$ Hz, 4 H) 4.14-4.18 (m, 2 H) 3.75 (t, $J=5.65$ Hz, 2 H) 2.45-2.50 (m, $J=1.83$ Hz, 2 H) 1.64 (q, $J=7.43$ Hz, 2 H) 1.18-1.23 (m, 6 H) 0.81 (t, $J=7.48$ Hz, 3 H)	(ESI(+)) m/e 419 ($\text{M}+\text{H}$) ⁺
1515	N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.52 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.36 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 6.83-6.86 (m, 1 H) 6.37 (dd, $J=3.66, 1.53$ Hz, 1 H) 6.04-6.12 (m, 2 H) 4.82 (d, $J=7.32$ Hz, 4 H) 4.24-4.28 (m, 2 H) 3.82 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 3.67 (s, 3 H) 2.53-2.59 (m, $J=1.83$ Hz, 2 H)	(ESI(+)) m/e 428 ($\text{M}+\text{H}$) ⁺
1516	N-{4-[1-(甲氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.30-7.37 (m, 2 H) 6.03-6.12 (m, 1 H) 4.81 (d, $J=7.63$ Hz, 4 H) 4.00-4.17 (m, 4 H) 3.57-3.70 (m, $J=5.65, 5.65$ Hz, 2 H) 3.31-3.37 (m, 3 H) 2.41-2.50 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 393 ($\text{M}+\text{H}$) ⁺
1517	N-{4-[1-(2,2-二甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.34 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 6.10 (t, $J=3.51$ Hz, 1 H) 4.81 (d, $J=7.32$ Hz, 4 H) 4.16 (d, $J=3.05$ Hz, 2 H) 3.76 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 2.46-2.50 (m, $J=1.83$ Hz, 2 H) 1.25 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 405 ($\text{M}+\text{H}$) ⁺
1518	N-{4-[1-(4-甲基己醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.34	(ESI(+)) m/e 433 ($\text{M}+\text{H}$) ⁺

N-(4-{[2-(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(噻吩-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(乙鹽基胺基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-4-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(嘧啶-4-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

	2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	(d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 6.05-6.11 (m, 1 H) 4.82 (d, $J=7.93$ Hz, 4 H) 4.08-4.16 (m, $J=1.53$ Hz, 2 H) 3.67 (t, $J=5.80$ Hz, 2 H) 2.43-2.50 (m, 2 H) 2.30-2.40 (m, 2 H) 1.50-1.68 (m, 1 H) 1.27-1.45 (m, 3 H) 1.10-1.22 (m, 1 H) 0.80-0.91 (m, 6 H)	
1519	N-(4-{1-[(2,2-二甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.47-7.53 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.32-7.37 (m, 2 H) 6.08-6.14 (m, 1 H) 4.81 (d, 4 H) 4.18 (s, 2 H) 3.85-3.94 (m, 1 H) 3.60 (s, 1 H) 2.39-2.50 (m, 2 H) 1.73 (t, $J=7.32$ Hz, 1 H) 1.18-1.23 (m, 3 H) 0.96-1.01 (m, 1 H) 0.96 (s, 3 H) 0.68 (dd, $J=7.93, 3.97$ Hz, 1 H)	(ESI(+)) m/e 417 (M+H) $^+$
1520	N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.49-7.56 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.33-7.38 (m, 2 H) 6.25 (s, 1 H) 6.07-6.12 (m, 1 H) 4.81 (d, $J=7.02$ Hz, 4 H) 4.18-4.24 (m, $J=2.75$ Hz, 2 H) 3.72-3.79 (m, 5 H) 2.53-2.60 (m, 2 H) 2.18 (s, 3 H)	(ESI(+)) m/e 443 (M+H) $^+$
1521	N-{4-[1-(環丁基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.51 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.34 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 6.08 (t, $J=3.51$ Hz, 1 H) 4.81 (d, $J=7.63$ Hz, 4 H) 4.10 (s, 2 H) 3.62-3.69 (m, 2 H) 2.55-2.72 (m, 2 H) 2.45-2.50 (m, 2 H) 2.30-2.42 (m, 1 H) 2.01-2.13 (m, 2 H) 1.77-1.88 (m, 2 H) 1.61-1.74 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 417 (M+H) $^+$
1522	N-{4-[1-(哌啶-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.48-7.55 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=4.58$ Hz, 1 H) 7.31-7.36 (m, 2 H) 6.08 (t, $J=3.36$ Hz, 1 H) 4.81 (d, 4 H) 4.14 (s, 2 H) 3.66-3.78 (m, 2 H) 3.16 (s, 2 H) 2.46-2.51 (m, 2 H) 2.36-2.43 (m, 4 H) 1.45-1.59 (m, 4 H) 1.32-1.43 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 446 (M+H) $^+$
1523	N-(4-{1-[2-(吡咯啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.48-7.53 (m, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.31-7.36 (m, 2 H) 6.09 (t, $J=3.51$ Hz, 1 H) 4.81 (d, $J=7.02$ Hz, 4 H) 4.21 (s, 2 H) 3.69-3.88 (m, 2 H) 3.61-3.70 (m, 1 H) 2.53-2.66 (m, 4 H) 2.43-2.50 (m, 2 H) 1.63-1.73 (m, 4 H) 1.19 (d, $J=6.71$ Hz, 3 H)	(ESI(+)) m/e 446 (M+H) $^+$
1524	N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.78 (s, 1 H) 7.52 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 7.41 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.35 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 6.07-6.11 (m, 1 H) 4.81 (d, $J=7.32$ Hz, 4 H) 4.19 (d, $J=3.05$ Hz, 2 H) 3.77-3.79 (m, 3 H) 3.72-3.77 (m, 2 H) 2.52-2.57 (m, 2 H) 2.16-2.22 (m, 3 H)	(ESI(+)) m/e 443 (M+H) $^+$

實例 547

N-[4-(1-側氧基-2,3-二氫-1H-異吲哚-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 377C 中所述，用 4-(4-胺基-苯基)-2,3-二氫-異吲哚-1-酮代替 4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮製備。ESI-MS $[M+H^+]=370.1$ 。

實例 548

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 377C 中所述，用 2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶代替異吲哚啉製備。ESI-MS $[M+H^+]=384.1$ 。

實例 549

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺

標題化合物如實例 377C 中所述，用 6,7-二氫-5H-吡咯并[3,4-b]吡啶代替異吲哚啉製備。ESI-MS $[M+H^+]=384.1$ 。

實例 550

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)環己-3-烯-1-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 377C 中所述，用 4-(4-胺基-環己-1-烯基)-2H-異喹啉-1-酮代替 4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮製備。ESI-MS $[M+H^+]=386.2$ 。

實例 551

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)環己-3-烯-1-基]-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例377C中所述，用4-(4-胺基-環己-1-烯基)-2H-酞嗪-1-酮代替4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮製備。ESI-MS $[M+H]^+$ = 387.2。

實例552

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)環己-3-烯-1-基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例377C中所述，用4-(4-胺基-環己-1-烯基)-2H-酞嗪-1-酮代替4-(4-胺基苯基)-5,6,7,8-四氫-2H-酞嗪-1-酮及用5-吡咯啉-1-基甲基-2,3-二氫-1H-異吲哚代替異吲哚啉製備。ESI-MS $[M+H]^+$ = 470.2。

實例557

N-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例272B中所述，在實例272B中用1-異戊基-1H-吡唑-4-胺二鹽酸鹽代替4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。 ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.39 (s, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.38-7.26 (m, 4H), 4.69 (s, 4H), 4.04 (t, J = 7.1 Hz, 2H), 1.81-1.57 (m, 2H), 1.52-1.37 (m, 1H), 0.89 (d, J = 6.6 Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 299 ($M+H$) $^+$ 。

實例558

N-[1-(2-苯基乙基)-1H-吡唑-4-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例272B中所述，在實例272B中用1-苯乙基-1H-吡唑-4-胺二鹽酸鹽代替4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.39 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.39-7.23 (m, 6H), 7.24-7.15 (m, 3H), 4.68 (bs, 4H), 4.27 (t, *J*=7.3 Hz, 2H), 3.07 (t, *J*=7.3 Hz, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 333 (M+H)⁺。

實例559

N⁵-[2-(二甲基胺基)乙基]-N²-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N1,N1-二甲基乙-1,2-二胺代替3-苯基丙-1-胺及2-{[4-(丙基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}異吲哚啉-5-甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.28 (s, 1H), 8.70 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.26 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 7.86-7.74 (m, 4H), 7.68-7.61 (m, 2H), 7.49 (d, *J*=7.8 Hz, 1H), 4.84 (bs, 4H), 3.66-3.55 (m, 2H), 3.29-3.12 (m, 4H), 2.90-2.80 (m, 6H), 2.28-1.46 (m, 2H), 0.89 (t, *J*=7.4 Hz, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 438 (M+H)⁺。

實例560

5-(嗎啉-4-基羰基)-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用嗎啉代替3-苯基丙-1-胺及2-{[4-(丙基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}異吲哚啉-5-甲

酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.61 (s, 1H), 8.26 (t, *J*=5.7 Hz, 1H), 7.80-7.73 (m, 2H), 7.69-7.62 (m, 2H), 7.47-7.41 (m, 2H), 7.35 (dd, *J*=7.7, 1.6 Hz, 1H), 4.82 (bs, 4H), 3.73-3.43 (m, 6H), 3.28-3.12 (m, 4H), 1.60-1.44 (m, 2H), 0.89 (t, *J*=7.4 Hz, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 437 (M+H)⁺。

實例 561

N-(4-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-苯甲基-3-嗎啉基丙-1-胺代替 3-苯基丙-1-胺製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆, 溫度=90°C) δ ppm 8.28 (s, 1H), 7.65-7.59 (m, 2H), 7.39-7.25 (m, 11H), 4.79 (bs, 4H), 4.63 (s, 2H), 3.52-3.45 (m, 4H), 3.35-3.27 (m, 2H), 2.27-2.20 (m, 4H), 2.17 (t, 2H), 1.69-1.60 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 499 (M+H)⁺。

實例 563

5-溴-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚啉-2-甲醯胺

實例 563A

2-環戊基-N-(4-硝基苯基)乙醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用 2-環戊基乙醯氯代替乙醯氯及 4-硝基苯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。

實例 563B

N-(4-胺基苯基)-2-環戊基乙醯胺

標題化合物如實例274中所述，用2-環戊基-N-(4-硝基苯基)乙醯胺代替5-硝基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺製備。

實例563C

5-溴-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例272B中所述，用N-(4-胺基苯基)-2-環戊基乙醯胺代替4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及5-溴異吡啶啉代替異吡啶啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.68 (s, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.65-7.55 (m, 1H), 7.53-7.36 (m, 5H), 7.36-7.26 (m, 1H), 4.79-4.65 (m, 4H), 2.33-2.16 (m, 3H), 1.85-1.68 (m, 2H), 1.68-1.41 (m, 4H), 1.29-1.09 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 442 (M+H)⁺。

實例565

4-{[(5-氟基-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基)羰基]胺基}苯甲酸甲酯

標題化合物如實例1A中所述，用5-氟基異吡啶啉代替異吡啶啉製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.81 (s, 1H), 7.91-7.82 (m, 3H), 7.82-7.77 (m, 1H), 7.76-7.69 (m, 2H), 7.59 (d, *J*=7.9 Hz, 1H), 4.89-4.81 (m, 4H), 3.81 (s, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 322 (M+H)⁺。

實例566

N-(4-{(E)-[(苯甲氧基)亞胺基]甲基}苯基)-1,3-二氫-2H-異

吲哚-2-甲醯胺

實例 566A

N-(4-甲醯基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-胺基苯甲醛代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。

實例 566B

N-(4-{(E)-[(苯甲氧基)亞胺基]甲基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

在 8 mL 密封小瓶中，N-(4-甲醯基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺 (50 mg, 0.188 mmol) 混合於甲醇 (1 ml) 中。接著添加 O-苯甲基羥基胺鹽酸鹽 (45.0 mg, 0.282 mmol) 及乙酸鈉 (46.0 mg, 0.338 mmol) 於水 (1.000 ml) 中之溶液且反應物在室溫下攪拌隔夜。反應物用水稀釋且產物用二氯甲烷萃取。有機層用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，傾析且濃縮。藉由層析純化，得到標題化合物。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.55 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.65 (m, 2H), 7.50 (m, 2H), 7.44-7.28 (m, 9H), 5.14 (s, 2H), 4.78 (bs, 4H); MS (ESI(+)) *m/e* 372 (M+H)⁺。

實例 573

N-[4-(3-胺基吡咯啉-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 339D 中所述製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆, 溫度 = 90°C) δ ppm 7.76 (bs, 1H), 7.36-

7.31 (m, 2H), 7.31-7.25 (m, 4H), 6.46-6.42 (m, 2H), 4.73 (bs, 4H), 3.56 (p, $J=5.8$ Hz, 1H), 3.41-3.36 (m, 1H), 3.35-3.28 (m, 1H), 3.24-3.15 (m, 3H), 2.85 (dd, $J=9.1, 4.9$ Hz, 1H), 2.13-2.05 (m, 1H), 1.73-1.64 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 323 ($M+H$)⁺。

實例 574

N-{6-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺

實例 574A

5-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)吡啶甲酸甲酯

標題化合物如實例 272B 中所述，用 5-胺基吡啶甲酸甲酯代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。

實例 574B

5-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)吡啶甲酸

標題化合物如實例 1B 中所述，用 5-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)吡啶甲酸甲酯代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯製備。

實例 574C

N-{6-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 3-甲基丁-1-胺代替 3-苯基丙-1-胺及 5-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)吡啶甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (400 MHz,

DMSO- d_6) δ ppm 8.85 (m, 2H), 8.57 (t, $J=6.1$ Hz, 1H), 8.17 (dd, $J=8.5, 2.4$ Hz, 1H), 7.94 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 7.41-7.29 (m, 4H), 4.79 (m, 4H), 3.35 (m, 2H), 1.59 (m, 1H), 1.42 (q, $J=7.1$ Hz, 2H), 0.90 (d, $J=6.6$ Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 353 (M+H)⁺。

實例 575

N-{6-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 5-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)吡啶甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.86 (m, 2H), 8.68 (t, $J=6.0$ Hz, 1H), 8.18 (dd, $J=8.6, 2.5$ Hz, 1H), 7.95 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 7.41-7.14 (m, 9H), 4.81 (bs, 4H), 3.35 (m, 2H), 2.61 (t, $J=7.6$ Hz, 2H), 1.84 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 401 (M+H)⁺。

實例 576

N-{6-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用(四氫呋喃-3-基)甲胺代替 3-苯基丙-1-胺及 5-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)吡啶甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.87 (m, 2H), 8.78 (t, $J=6.1$ Hz, 1H), 8.18 (dd, $J=8.5, 2.5$ Hz, 1H), 7.95 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 7.42-7.26 (m, 4H), 4.81 (m, 4H), 3.75 (m, 1H), 3.70-3.56 (m, 2H),

3.47 (dd, $J=8.5, 5.3$ Hz, 1H), 3.27 (m, 2H), 2.53 (m, 1H), 1.91 (m, 1H), 1.61 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 368 (M+H)⁺。

實例 577

N²-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺

標題化合物如實例 132 中所述，用 5-氟基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 5-氟基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。

¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.69 (s, 1H), 8.31 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.87-7.78 (m, 2H), 7.53-7.38 (m, 5H), 7.36 (brs, 1H), 4.78 (bs, 4H), 2.32-2.13 (m, 3H), 1.82-1.67 (m, 2H), 1.67-1.42 (m, 4H), 1.27-1.10 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 407 (M+H)⁺。

實例 578

N-[4-({苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}甲基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

向 N-(4-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺 (0.028 g, 0.056 mmol) 於 THF (1.1 ml) 中之攪拌懸浮液中逐滴添加 1 M 硼烷四氫吡喃複合物 (0.225 ml, 0.225 mmol)。混合物在 60°C 下加熱 5 小時。添加另外硼烷複合物 (0.084 mL) 且反應物在 60°C 下加熱 1 小時。反應物冷卻至周圍溫度且添加 0.3 mL 1.25 M HCl 之甲醇溶液。經淬滅之反應物攪拌 30 分鐘且濃縮。急

N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(甲基胺甲鹽基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(5-側氧基-L-脯胺鹽基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

驟層析後分離標題化合物。 ^1H NMR (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.05 (s, 1H), 7.88-7.82 (m, 2H), 7.47-7.38 (m, 4H), 7.36-7.29 (m, 2H), 7.26-7.15 (m, 5H), 4.85 (bs, 4H), 3.68-3.59 (m, 8H), 3.48-3.35 (m, 1H), 2.59 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 2.38-2.29 (m, 6H), 1.79-1.65 (m, 3H); MS (ESI(+)) m/e 485 ($M+H$) $^+$ 。

實例 579

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(1H-吡唑-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 5-溴-N-(4-(2-環戊基乙醯胺基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。 ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 13.30 (bs, 0.25H), 12.87 (bs, 0.75H), 9.69 (s, 1H), 8.34-8.23 (m, 1H), 7.83-7.63 (m, 3H), 7.56-7.32 (m, 5H), 6.76-6.68 (m, 1H), 4.81-4.72 (m, 4H), 2.31-2.12 (m, 3H), 1.85-1.67 (m, 2H), 1.67-1.42 (m, 4H), 1.29-1.10 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 430 ($M+H$) $^+$ 。

實例 580

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用吡啶-3-基醯胺代替 1H-吡唑-3-基醯胺及 5-溴-N-(4-(2-環戊基乙醯胺基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。 ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm

9.70 (bs, 1H), 8.93-8.89 (m, 1H), 8.58 (dd, $J=4.7, 1.6$ Hz, 1H), 8.33 (s, 1H), 8.13-8.05 (m, 1H), 7.72 (bs, 1H), 7.71-7.64 (m, 1H), 7.54-7.44 (m, 6H), 4.81 (bs, 4H), 2.31-2.18 (m, 3H), 1.82-1.68 (m, 2H), 1.68-1.43 (m, 4H), 1.26-1.11 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 441 ($M+H$)⁺。

實例 581

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 1-甲基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)-1H-吡唑代替 1H-吡唑-3-基醯胺及 5-溴-N-(4-(2-環戊基乙醯胺基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 9.69 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.88-7.85 (m, 1H), 7.55-7.40 (m, 6H), 7.36-7.30 (m, 1H), 4.77-4.69 (m, 4H), 3.86 (s, 3H), 2.31-2.16 (m, 3H), 1.81-1.68 (m, 2H), 1.68-1.42 (m, 4H), 1.28-1.12 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 444 ($M+H$)⁺。

實例 582

N²-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-N⁵-(2-甲氧基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 2-甲氧基乙胺代替 3-苯基丙-1-胺及 2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

¹H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 9.69 (s, 1H), 8.56-

8.49 (m, 1H), 8.31 (s, 1H), 7.84-7.77 (m, 2H), 7.50-7.40 (m, 5H), 4.78 (bs, 4H), 3.50-3.39 (m, 4H), 3.27 (s, 3H), 2.31-2.18 (m, 3H), 1.81-1.68 (m, 2H), 1.66-1.43 (m, 4H), 1.26-1.12 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 465 (M+H)⁺。

實例 583

N²-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-N⁵-(2-羥基乙基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 2-胺基乙醇代替 3-苯基丙-1-胺及 2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.70 (s, 1H), 8.51-8.40 (m, 1H), 8.31 (s, 1H), 7.86-7.75 (m, 2H), 7.51-7.36 (m, 5H), 4.78 (bs, 4H), 4.71 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 3.58-3.46 (m, 2H), 3.39-3.28 (m, 2H), 2.32-2.13 (m, 3H), 1.82-1.68 (m, 2H), 1.67-1.44 (m, 4H), 1.27-1.10 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 451 (M+H)⁺。

實例 584

5-(胺基甲基)-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 276 中所述，用 5-氰基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 5-氰基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.35 (bs, 1H), 7.99 (bs, 1H), 7.44-7.41 (m, 4H), 7.31-7.20 (m, 3H), 4.72 (bs,

4H), 3.81-3.68 (m, 2H), 2.29-2.25 (m, 3H), 1.80-1.68 (m, 2H), 1.66-1.48 (m, 6H), 1.29-1.14 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 393 (M+H)⁺。

實例 605

N-[6-(苯甲醯基胺基)己基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 605A

6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)己基胺基甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 344A 中所述，用 6-胺基己基胺基甲酸第三丁酯代替 5-胺基異吲哚啉-2-甲酸第三丁酯製備。

實例 605B

N-(6-胺基己基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 2D 中所述，用 Boc-6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)己基胺基甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 605C

N-[6-(苯甲醯基胺基)己基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(6-胺基己基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及苯甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.42 (t, $J=5.35$ Hz, 1H) 7.76-7.90 (m, 2 H) 7.36-7.58 (m, 3 H) 7.20-7.36 (m, 4 H) 6.28 (t, $J=5.55$ Hz, 1H) 4.57 (s, 4 H) 3.21-3.30 (m, 2 H) 3.07 (q, $J=6.74$ Hz, 2 H) 1.24-1.66

(m, 8 H); (ESI(+)) m/e 366 (M+H)⁺。

表 10.

以下實例如實例 1C 中所述，用 N-(6-胺基己基)異吡啶啉-2-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及適當羧酸代替 4-(異吡啶啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
606	N-{6-[(吡啶-3-基羧基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.98 (d, <i>J</i> =1.36 Hz, 1 H) 8.68 (dd, <i>J</i> =4.75, 1.70 Hz, 1 H) 8.62 (t, <i>J</i> =5.43 Hz, 1 H) 8.12-8.21 (m, 1 H) 7.48 (dd, <i>J</i> =8.31, 5.26 Hz, 1 H) 7.20-7.36 (m, 4 H) 6.27 (t, <i>J</i> =5.43 Hz, 1 H) 4.57 (s, 4 H) 3.23-3.29 (m, 2 H) 2.99-3.13 (m, 2 H) 1.25-1.60 (m, 9 H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) ⁺
619	N-(6-乙醯胺基己基)-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 7.77 (s, 1 H) 7.22-7.38 (m, 4 H) 6.28 (t, <i>J</i> =5.55 Hz, 1 H) 4.57 (s, 4 H) 2.93-3.14 (m, 4 H) 1.77 (s, 3 H) 1.31-1.61 (m, 4 H) 1.20-1.31 (m, 4 H)	(ESI(+)) m/e 304 (M+H) ⁺
655	N-(6-{[4-(甲基磺醯基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬，溫度=90°C) δ ppm 1.33-1.40 (m, 4 H), 1.45-1.63 (m, 4 H), 3.11 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 3.19 (s, 3 H), 3.30 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 4.59 (s, 4 H), 7.24-7.33 (m, 4 H), 7.95-8.04 (m, 4 H)	(ESI(+)) m/e 444 (M+H) ⁺
656	N-{6-[(乙氧基乙醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬，溫度=90°C) δ ppm 1.15 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 3 H), 1.25-1.36 (m, 4 H), 1.42-1.51 (m, 4 H), 3.11 (q, <i>J</i> =7.43 Hz, 4 H), 3.50 (q, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 3.80 (s, 2 H), 4.59 (s, 4 H), 7.24-7.33 (m, 4 H)	(ESI(+)) m/e 348 (M+H) ⁺
657	N-{6-[(環戊基羧基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬，溫度=90°C) δ ppm 1.25-1.35 (m, 5 H), 1.38-1.55 (m, 6 H), 1.56-1.67 (m, 4 H), 1.68-1.81 (m, 2 H), 3.00-3.13 (m, 4 H), 4.59 (s, 4 H), 7.20-7.37 (m, 4 H)	(ESI(+)) m/e 358 (M+H) ⁺
658	N-{6-[(2-羥基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬，溫度=90°C) δ ppm 1.32-1.42 (m, 4 H), 1.45-1.53 (m, 2 H), 1.53-1.63 (m, 2 H), 3.11 (t, 2 H), 3.31 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 4.58 (s, 4 H), 6.83-6.90 (m, 2 H), 7.23-7.32 (m, 4 H), 7.34-7.40 (m, 1 H), 7.78 (dd, <i>J</i> =7.78, 1.68 Hz, 1 H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) ⁺
659	N-{6-[(3-羥基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬，溫度=90°C) δ ppm 1.28-1.41 (m, 4 H), 1.42-1.61 (m, 4 H), 3.08-3.15 (m, 2 H), 3.22-3.25 (m, 2 H), 4.59 (s, 4 H), 6.86-6.93 (m, 1 H), 7.17-7.34 (m, 7 H)	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) ⁺
660	N-{6-[(4-羥基苯甲醯基)胺基]己基}-	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬，溫度=90°C) δ ppm 1.30-1.38 (m, 4 H), 1.44-1.60 (m, 4	(ESI(+)) m/e 382 (M+H) ⁺

	1,3-二氫-2H-異吲 哚-2-甲醯胺	H), 3.09-3.13 (m, 2 H), 3.20-3.25 (m, 2 H), 4.59 (s, 4 H), 6.75-6.83 (m, 2 H), 7.23-7.32 (m, 4 H), 7.65-7.71 (m, 2 H)	
661	N-{6-[(2-甲氧基苯 甲醯基)胺基]己基}- 1,3-二氫-2H-異吲 哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度 =90°C) δ ppm 1.29-1.43 (m, 4 H), 1.45-1.61 (m, 4 H), 3.08-3.15 (m, 2 H), 3.30 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 3.89 (s, 3 H), 4.58 (s, 4 H), 6.99-7.04 (m, 1 H), 7.10 (d, <i>J</i> =8.24 Hz, 1 H), 7.24-7.32 (m, 4 H), 7.41-7.47 (m, 1 H), 7.74 (dd, <i>J</i> =7.63, 1.83 Hz, 1 H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) ⁺
662	N-{6-[(3-甲氧基苯 甲醯基)胺基]己基}- 1,3-二氫-2H-異吲 哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度 =90°C) δ ppm 1.30-1.41 (m, 4 H), 1.44-1.62 (m, 4 H), 3.09-3.14 (m, 2 H), 3.26-3.31 (m, 2 H), 3.80 (s, 3 H), 4.58 (s, 4 H), 7.03-7.07 (m, 1 H), 7.24-7.41 (m, 7 H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) ⁺
663	N-{6-[(4-甲氧基苯 甲醯基)胺基]己基}- 1,3-二氫-2H-異吲 哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度 =90°C) δ ppm 1.31-1.39 (m, 4 H), 1.49 (s, 4 H), 3.11 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 3.26-3.28 (m, 2 H), 3.80 (s, 3 H), 4.58 (s, 4 H), 6.92-6.97 (m, 2 H), 7.24-7.32 (m, 4 H), 7.75-7.80 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 396 (M+H) ⁺
664	N-{6-[(2-氟苯甲醯 基)胺基]己基}-1,3- 二氫-2H-異吲哚-2- 甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度 =90°C) δ ppm 1.27-1.42 (m, 4 H), 1.43-1.64 (m, 4 H), 3.11 (t, 2 H), 3.28 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 4.58 (s, 4 H), 7.17-7.33 (m, 6 H), 7.45-7.52 (m, 1 H), 7.57-7.63 (m, 1 H)	(ESI(+)) m/e 384 (M+H) ⁺
665	N-{6-[(3-氟苯甲醯 基)胺基]己基}-1,3- 二氫-2H-異吲哚-2- 甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度 =90°C) δ ppm 1.32-1.41 (m, 4 H), 1.44-1.61 (m, 4 H), 3.11 (t, 2 H), 3.28 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 4.58 (s, 4 H), 7.24-7.33 (m, 5 H), 7.44-7.51 (m, 1 H), 7.55-7.60 (m, 1 H), 7.65 (d, <i>J</i> =8.24 Hz, 1 H)	(ESI(+)) m/e 384 (M+H) ⁺
666	N-{6-[(4-氟苯甲醯 基)胺基]己基}-1,3- 二氫-2H-異吲哚-2- 甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度 =90°C) δ ppm 1.31-1.38 (m, 4 H), 1.44-1.61 (m, 4 H), 3.11 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 3.26 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 4.58 (s, 4 H), 7.16-7.31 (m, 6 H), 7.84-7.89 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 384 (M+H) ⁺
667	N-{6-[(2-氟苯甲醯 基)胺基]己基}-1,3- 二氫-2H-異吲哚-2- 甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度 =90°C) δ ppm 1.30-1.42 (m, 4 H), 1.45-1.63 (m, 4 H), 3.12 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 3.26-3.29 (m, 2 H), 4.59 (s, 4 H), 7.24-7.32 (m, 4 H), 7.33-7.45 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 400 (M+H) ⁺
668	N-{6-[(3-氟苯甲醯 基)胺基]己基}-1,3- 二氫-2H-異吲哚-2- 甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度 =90°C) δ ppm 1.29-1.40 (m, 4 H), 1.44-1.62 (m, 4 H), 3.11 (t, 2 H), 3.27 (t, 2 H), 4.58 (s, 4 H), 7.24-7.33 (m, 4 H), 7.46 (t, <i>J</i> =7.78 Hz, 1 H), 7.51-7.55 (m, 1 H), 7.75 (dd, <i>J</i> =7.63, 1.53 Hz, 1 H), 7.82 (t, <i>J</i> =1.68 Hz, 1 H)	(ESI(+)) m/e 400 (M+H) ⁺
669	N-{6-[(4-氟苯甲醯 基)胺基]己基}-1,3- 二氫-2H-異吲哚-2- 甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度 =90°C) δ ppm 1.28-1.40 (m, 4 H), 1.44-1.62 (m, 4 H), 3.11 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 3.27 (t, 2 H), 4.58 (s, 4 H), 7.24-7.32 (m, 4 H), 7.43-7.49 (m, 2 H),	(ESI(+)) m/e 400 (M+H) ⁺

	甲醯胺	7.78-7.85 (m, 2 H)	
670	N-{6-[(3-氯基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90℃) δ ppm 1.28-1.41 (m, 4 H), 1.45-1.63 (m, 4 H), 3.11 (t, 2 H), 3.29 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 4.58 (s, 4 H), 7.24-7.32 (m, 4 H), 7.65 (t, <i>J</i> =7.78 Hz, 1 H), 7.88-7.92 (m, 1 H), 8.09-8.12 (m, 1 H), 8.18 (t, 1 H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) ⁺
671	N-{6-[(4-氯基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90℃) δ ppm 1.32-1.39 (m, 4 H), 1.44-1.63 (m, 4 H), 3.11 (t, 2 H), 3.29 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 4.58 (s, 4 H), 7.22-7.33 (m, 4 H), 7.82-7.87 (m, 2 H), 7.92-7.96 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 391 (M+H) ⁺
672	N-(6-{[3-(二甲基胺基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90℃) δ ppm 1.30-1.38 (m, 4 H), 1.45-1.60 (m, 4 H), 2.96 (s, 6 H), 3.11 (t, 2 H), 3.27 (t, 2 H), 4.59 (s, 4 H), 6.93-7.00 (m, 1 H), 7.17-7.21 (m, 1 H), 7.24-7.33 (m, 6 H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺
673	N-(6-{[4-(二甲基胺基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90℃) δ ppm 1.31-1.37 (m, 4 H), 1.43-1.58 (m, 4 H), 2.95 (s, 6 H), 3.11 (t, 2 H), 3.24 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 4.59 (s, 4 H), 6.68-6.74 (m, 2 H), 7.22-7.33 (m, 4 H), 7.66-7.70 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺
674	N-(6-{[3-(三氟甲基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90℃) δ ppm 1.32-1.41 (m, 4 H), 1.46-1.62 (m, 4 H), 3.09-3.14 (m, 2 H), 3.30 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 4.58 (s, 4 H), 7.24-7.33 (m, 4 H), 7.68 (t, <i>J</i> =7.78 Hz, 1 H), 7.83 (d, <i>J</i> =7.63 Hz, 1 H), 8.06-8.14 (m, 2 H)	(ESI(+)) m/e 434 (M+H) ⁺
675	N-(6-{[4-(三氟甲基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90℃) δ ppm 1.32-1.41 (m, 4 H), 1.45-1.62 (m, 4 H), 3.11 (t, 2 H), 3.30 (t, <i>J</i> =7.17 Hz, 2 H), 4.58 (s, 4 H), 7.24-7.33 (m, 4 H), 7.77 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 2 H), 7.98 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 2 H)	(ESI(+)) m/e 434 (M+H) ⁺
676	N-(6-{[3-(三氟甲氧基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90℃) δ ppm 1.30-1.41 (m, 4 H), 1.45-1.61 (m, 4 H), 3.12 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 3.29 (t, <i>J</i> =7.17 Hz, 2 H), 4.59 (s, 4 H), 7.23-7.32 (m, 4 H), 7.41-7.49 (m, 1 H), 7.58 (t, <i>J</i> =7.93 Hz, 1 H), 7.73 (s, 1 H), 7.84 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 1 H)	(ESI(+)) m/e 450 (M+H) ⁺
677	N-{6-[(2,3-二甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90℃) δ ppm 1.33-1.42 (m, 4 H), 1.45-1.61 (m, 4 H), 3.12 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 3.28 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 3.79 (s, 3 H), 3.83 (s, 3 H), 4.58 (s, 4 H), 7.06-7.20 (m, 3 H), 7.24-7.32 (m, 4 H)	(ESI(+)) m/e 426 (M+H) ⁺
678	N-{6-[(2,4-二甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90℃) δ ppm 1.30-1.41 (m, 4 H), 1.45-1.62 (m, 4 H), 3.11 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 3.29 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 2 H), 3.81 (s, 3 H), 3.90 (s, 3 H), 4.58 (s, 4 H), 6.56-6.63 (m, 2 H), 7.22-7.33 (m, 4 H), 7.78 (d, <i>J</i> =8.54 Hz, 1 H)	(ESI(+)) m/e 426 (M+H) ⁺

679	N-{6-[(2,5-二甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 1.31-1.40 (m, 4 H), 1.44-1.59 (m, 4 H), 3.12 (t, 2 H), 3.30 (t, <i>J</i> =6.87 Hz, 2 H), 3.73 (s, 3 H), 3.82-3.86 (m, 3 H), 4.58 (s, 4 H), 6.99-7.08 (m, 2 H), 7.23-7.34 (m, 5 H)	(ESI(+)) m/e 426 (M+H) ⁺
680	N-{6-[(苯基乙醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.00 (m, 1H), 7.28 (m, 8H), 7.20 (m, 1H), 6.27 (t, <i>J</i> =5.5, 1H), 4.57 (s, 4H), 3.04 (m, 4H), 1.40 (m, 4H), 1.27 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 380 (M+H) ⁺
681	N-(6-{[(3-氟苯基)乙醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 1.22-1.33 (m, 4 H), 1.36-1.53 (m, 4 H), 3.02-3.13 (m, 4 H), 3.43 (s, 2 H), 4.59 (s, 4 H), 6.93-7.12 (m, 3 H), 7.23-7.34 (m, 5 H)	(ESI(+)) m/e 398 (M+H) ⁺
688	N-[6-(苯甲醯基胺基)己基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4- <i>c</i>]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.55 (s, 1 H) 8.46 (d, <i>J</i> =4.75 Hz, 1 H) 8.41 (t, <i>J</i> =5.43 Hz, 1 H) 7.78-7.86 (m, 2 H) 7.40-7.55 (m, 3 H) 7.38 (d, <i>J</i> =5.09 Hz, 1 H) 6.36 (t, <i>J</i> =5.43 Hz, 1 H) 4.60 (d, <i>J</i> =2.03 Hz, 4 H) 3.21-3.29 (m, 2 H) 3.00-3.13 (m, 2 H) 1.25-1.60 (m, 8 H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) ⁺
689	4-氟-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 9.02 (d, <i>J</i> =2.2, 1H), 8.71 (m, 2H), 8.26 (dt, <i>J</i> =7.9, 1.9, 1H), 7.58 (ddd, <i>J</i> =7.9, 4.8, 0.8, 1H), 7.34 (td, <i>J</i> =7.8, 5.1, 1H), 7.16 (d, <i>J</i> =7.5, 1H), 7.10 (t, <i>J</i> =8.8, 1H), 6.39 (bs, 1H), 4.62 (s, 4H), 3.28 (m, 2H), 3.07 (m, 2H), 1.54 (m, 2H), 1.46 (m, 2H), 1.34 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 385 (M+H) ⁺
690	5-氟-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ -D ₂ O, 溫度=90°C) δ 8.99 (dd, <i>J</i> =2.2, 0.9, 1H), 8.71 (m, 1H), 8.26 (m, 1H), 7.58 (m, 1H), 7.32 (m, 1H), 7.08 (m, 2H), 4.58 (d, <i>J</i> =2.5, 2H), 4.55 (m, 2H), 3.11 (t, <i>J</i> =7.0, 2H), 1.47 (m, 11H)	(ESI(+)) m/e 385 (M+H) ⁺
691	5-甲氧基-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ -D ₂ O, 溫度=90°C) δ 9.01 (dd, <i>J</i> =2.2, 0.9, 1H), 8.73 (dd, <i>J</i> =5.0, 1.6, 1H), 8.33 (ddd, <i>J</i> =7.9, 2.2, 1.6, 1H), 7.63 (ddd, <i>J</i> =7.9, 5.0, 0.9, 1H), 7.20 (m, 1H), 6.85 (m, 2H), 4.55 (m, 2H), 4.50 (d, <i>J</i> =2.4, 2H), 3.76 (s, 3H), 3.11 (t, <i>J</i> =7.0, 2H), 1.58 (t, <i>J</i> =7.0, 3H), 1.50 (t, <i>J</i> =6.8, 2H), 1.36 (m, 5H)	(ESI(+)) m/e 397 (M+H) ⁺
692	N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ -D ₂ O, 溫度=90°C) δ 8.99 (dd, <i>J</i> =2.2, 0.9, 1H), 8.71 (dd, <i>J</i> =4.9, 1.6, 1H), 8.27 (m, 1H), 7.58 (m, 4H), 4.66 (s, 4H), 3.12 (t, <i>J</i> =7.0, 2H), 1.54 (m, 5H), 1.37 (m, 5H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) ⁺
693	4-氟基-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ -D ₂ O, 溫度=90°C) δ 8.99 (m, 1H), 8.71 (dd, <i>J</i> =5.0, 1.6, 1H), 8.28 (ddd, <i>J</i> =8.0, 2.3, 1.6, 1H), 7.67 (m, 2H), 7.59 (ddd, <i>J</i> =7.9, 5.0, 0.9, 1H), 7.48 (t, <i>J</i> =7.7, 1H), 4.75 (d, <i>J</i> =2.2, 2H), 4.67 (m, 2H), 3.12 (t, <i>J</i> =7.0, 2H), 1.56 (m, 5H), 1.37 (m, 5H)	(ESI(+)) m/e 392 (M+H) ⁺

694	5-甲基-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$ $_{\text{D}_2\text{O}}$, 溫度 = 90°C) δ 9.01 (m, 1H), 8.73 (dd, $J=5.0, 1.6$, 1H), 8.32 (ddd, $J=7.9, 2.2, 1.6$, 1H), 7.62 (ddd, $J=8.0, 5.0, 0.9$, 1H), 7.17 (d, $J=7.7$, 1H), 7.08 (d, $J=7.8$, 2H), 4.54 (bs, 4H), 3.11 (t, $J=7.0$, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.56 (m, 5H), 1.37 (m, 5H)	(ESI(+)) m/e 381 (M+H) $^+$
695	4-氯-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$ $_{\text{D}_2\text{O}}$, 溫度 = 90°C) δ 9.00 (dd, $J=2.2, 0.8$, 1H), 8.71 (dd, $J=5.0, 1.6$, 1H), 8.29 (ddd, $J=8.0, 2.2, 1.7$, 1H), 7.60 (m, 1H), 7.30 (m, 3H), 4.63 (m, 4H), 3.32 (m, 2H), 3.12 (m, 2H), 1.54 (m, 5H), 1.36 (m, 5H)	(ESI(+)) m/e 401 (M+H) $^+$
696	5-氯基-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$ $_{\text{D}_2\text{O}}$, 溫度 = 90°C) δ 8.98 (d, $J=1.7$, 1H), 8.70 (dd, $J=4.9, 1.6$, 1H), 8.24 (m, 1H), 7.68 (m, 2H), 7.54 (m, 2H), 4.65 (m, 4H), 3.11 (m, 2H), 1.54 (m, 5H), 1.36 (m, 5H)	(ESI(+)) m/e 392 (M+H) $^+$
697	5-氯-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$ $_{\text{D}_2\text{O}}$, 溫度 = 90°C) δ 8.99 (dd, $J=2.2, 0.7$, 1H), 8.71 (dd, $J=5.0, 1.6$, 1H), 8.27 (ddd, $J=8.0, 2.2, 1.7$, 1H), 7.58 (m, 1H), 7.32 (m, 3H), 4.57 (dd, $J=8.2, 1.9$, 4H), 3.11 (m, 2H), 1.54 (m, 5H), 1.37 (m, 5H)	(ESI(+)) m/e 401 (M+H) $^+$
698	N-{6-[(吡啶-2-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 8.74 (t, $J=5.76$ Hz, 1 H) 8.63 (d, $J=4.75$ Hz, 1 H) 7.89-8.12 (m, 2 H) 7.50-7.65 (m, 1 H) 7.19-7.39 (m, 4 H) 6.26 (t, $J=5.43$ Hz, 1 H) 4.57 (s, 4 H) 3.23-3.35 (m, 2 H) 3.06 (q, $J=6.67$ Hz, 2 H) 1.22-1.61 (m, 8 H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) $^+$

實例 607

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(吡啶-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用吡啶-4-基醯胺代替 1H-吡啶-3-基醯胺及 5-溴-N-(4-(2-環戊基乙醯胺基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。 $^1\text{H NMR}$ (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 9.70 (s, 1H), 8.69-8.61 (m, 2H), 8.33 (s, 1H), 7.82-7.69 (m, 4H), 7.54-7.41 (m, 5H), 4.81 (bs, 4H), 2.31-2.15 (m, 3H), 1.82-1.68 (m, 2H), 1.68-1.43 (m, 4H), 1.26-1.11 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 441 (M+H) $^+$ 。

實例 608

5-(羥基甲基)-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-胺基-N-異戊基苯
 甲醯胺代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉-5-基甲醇
 鹽酸鹽代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR
 (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.55 (s, 1H), 8.24-8.17 (m,
 1H), 7.79-7.72 (m, 2H), 7.68-7.61 (m, 2H), 7.37-7.21 (m,
 3H), 5.19 (t, *J*=5.7 Hz, 1H), 4.76 (bs, 4H), 4.52 (d, *J*=5.7
 Hz, 2H), 3.30-3.21 (m, 2H), 1.70-1.54 (m, 1H), 1.47-1.36
 (m, 2H), 0.90 (d, *J*=6.6 Hz, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 382
 (M+H)⁺。

實例 609

N-{3-[(1-苯甲醯基哌啶-4-基)氧基]丙基}-1,3-二氫-2H-
 異吲哚-2-甲醯胺

實例 609A

4-(3-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)丙氧基)哌啶-1-甲酸第三
 丁酯

標題化合物如實例 344A 中所述，用 4-(3-胺基丙氧基)哌
 啶-1-甲酸第三丁酯代替 5-胺基異吲哚啉-2-甲酸第三丁酯
 製備。

實例 609B

N-(3-(哌啶-4-基氧基)丙基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 2D 中所述，用 4-(3-(異吲哚啉-2-甲醯

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4,4-二氟環己基)羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(丙-2-基氧基)乙醯基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

胺基)丙氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 609C

N-{3-[(1-苯甲醯基哌啶-4-基)氧基]丙基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用苯甲醯氯代替乙醯氯及 N-(3-(哌啶-4-基氧基)丙基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 7.21-7.50 (m, 9 H) 6.27 (t, *J*=5.43 Hz, 1 H) 4.57 (s, 4 H) 3.40-3.58 (m, 6 H) 3.07-3.21 (m, 2 H) 1.74-1.93 (br m, 2 H) 1.62-1.75 (m, 2 H) 1.44 (br m, 2 H); MS (ESI(+)) *m/e* 408 (M+H)⁺。

實例 610

N-(3-{[1-(吡啶-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}丙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用菸鹼醯氯代替乙醯氯及 N-(3-(哌啶-4-基氧基)丙基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.51-8.70 (m, 2 H) 7.75-7.88 (m, 1 H) 7.46 (dd, *J*=7.73, 4.96 Hz, 1 H) 7.20-7.38 (m, 3 H) 6.28 (t, *J*=5.35 Hz, 1 H) 4.57 (s, 4 H) 3.83-4.01 (m, 1 H) 3.40-3.63 (m, 6 H) 3.16 (q, *J*=6.35 Hz, 2 H) 1.35-1.95 (m, 7 H); MS (ESI(+)) *m/e* 409 (M+H)⁺。

表 11.

以下實例基本上如實例 1C 中所述，用 N-(6-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)吡啶-3-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及相應羧酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
614	N-[1'-(四氫呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.70 (d, <i>J</i> =2.6 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.95 (dd, <i>J</i> =8.7, 2.6 Hz, 1H), 7.44 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 1H), 7.40-7.24 (m, 4H), 6.54 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.19 (s, 2H), 3.91 (t, <i>J</i> =8.1 Hz, 1H), 3.72 (m, 5H), 3.40 (m, 1H), 2.60 (s, 2H), 2.05 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺
615	N-{1'-(2-甲氧基乙氧基)乙醯基}-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.69 (d, <i>J</i> =2.6 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.95 (dd, <i>J</i> =8.6, 2.6 Hz, 1H), 7.44 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 1H), 7.38-7.27 (m, 4H), 6.54 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.19 (s, 2H), 4.15 (m, 2H), 3.65 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.48 (m, 2H), 3.27 (s, 3H), 2.61 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) ⁺
711	N-[1'-(四氫呋喃-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.69 (d, <i>J</i> =2.6 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.95 (dd, <i>J</i> =8.7, 2.6 Hz, 1H), 7.43 (d, <i>J</i> =8.9 Hz, 1H), 7.39-7.23 (m, 4H), 6.54 (m, 1H), 4.79 (bs, 4H), 4.68 (dd, <i>J</i> =7.4, 5.8 Hz, 1H), 4.19 (bs, 2H), 3.88-3.62 (m, 4H), 2.63 (m, 2H), 2.11 (m, 1H), 2.01 (m, 1H), 1.86 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺
712	N-[1'-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.69 (dd, <i>J</i> =2.6, 0.7 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.95 (dd, <i>J</i> =8.6, 2.6 Hz, 1H), 7.43 (d, <i>J</i> =8.9 Hz, 1H), 7.38-7.26 (m, 4H), 6.55 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.19 (m, 2H), 3.86 (m, 2H), 3.70 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.42 (td, <i>J</i> =11.4, 2.5 Hz, 2H), 2.92 (m, 1H), 2.60 (m, 2H), 1.73-1.60 (m, 2H), 1.56 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) ⁺
713	N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.70 (d, <i>J</i> =2.6 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.96 (dd, <i>J</i> =8.6, 2.6 Hz, 1H), 7.43 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 1H), 7.38-7.26 (m, 4H), 6.54 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.37 (dd, <i>J</i> =9.1, 3.0 Hz, 1H), 4.20 (m, 2H), 3.83-3.61 (m, 7H), 3.52 (m, 1H), 2.61 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) ⁺
714	N-{1'-(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基}-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.69 (dd, <i>J</i> =2.6, 0.7 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.95 (dd, <i>J</i> =8.6, 2.6 Hz, 1H), 7.43 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 1H), 7.38-7.26 (m, 4H), 6.54 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.16 (m, 2H), 3.68 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 2H), 3.28	(ESI(+)) m/e 432 (M+H) ⁺

	醯胺	(m, 1H), 2.78 (t, $J=8.6$ Hz, 1H), 2.58 (m, 2H), 2.52 (m, 2H), 2.38 (q, $J=7.7$ Hz, 1H), 2.24 (s, 3H), 2.98 (m, 2H)	
715	N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.70 (d, $J=2.6$ Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.96 (dd, $J=8.6, 2.6$ Hz, 1H), 7.45 (d, $J=8.6$ Hz, 1H), 7.38-7.27 (m, 4H), 6.55 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.21 (m, 2H), 3.79-3.65 (m, 3H), 3.36-3.13 (m, 3H), 3.08 (m, 1H), 2.63 (m, 2H), 2.37 (m, 1H), 2.14 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 467 (M+H) $^+$
758	N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.69 (d, $J=2.6$ Hz, 1H), 8.34 (bs, 1H), 7.95 (dd, $J=8.6, 2.6$ Hz, 1H), 7.43 (d, $J=8.6$ Hz, 1H), 7.38-7.26 (m, 4H), 6.55 (m, 1H), 5.09 (s, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.32 (m, 2H), 3.93 (t, $J=5.7$ Hz, 2H), 2.60 (m, 2H), 1.37 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) $^+$
800	N-[1'-(嗎啉-4-基乙醯基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.70 (d, $J=2.6$ Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.95 (dd, $J=8.6, 2.6$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J=8.6$ Hz, 1H), 7.38-7.27 (m, 4H), 6.54 (m, 1H), 4.79 (s, 4H), 4.20 (m, 2H), 3.71 (t, $J=5.2$ Hz, 2H), 3.58 (m, 4H), 3.21 (s, 2H), 2.48 (m, 2H), 2.45 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 448 (M+H) $^+$
1466	N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.13 (s, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.31 (m, 6H), 6.07 (m, 1H), 4.77 (s, 4H), 4.14 (m, 2H), 3.91 (t, $J=8.1$ Hz, 1H), 3.77-3.67 (m, 5H), 3.38 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 2.02 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 418 (M+H) $^+$
1467	N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.12 (s, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.31 (m, 6H), 6.07 (m, 1H), 4.77 (s, 4H), 4.14 (m, 2H), 3.91 (t, $J=8.1$ Hz, 1H), 3.77-3.67 (m, 5H), 3.38 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 2.05 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 418 (M+H) $^+$
1468	N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.13 (s, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.31 (m, 6H), 6.07 (m, 1H), 4.77 (s, 4H), 4.15 (m, 2H), 3.71 (t, $J=5.7$ Hz, 2H), 3.25-3.02 (m, 5H), 2.50 (m, 2H), 2.07 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 480 (M+H) $^+$

實例 611

N-(6-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 611A

6-胺基噻嗪-3-甲酸甲酯

向6-氯嘧啶-3-胺(32 g, 248 mmol)、Et₃N(75 mL, 744 mmol)於MeOH(500 mL)中之溶液中添加Pd(dppf)Cl₂(12 g, 16.4 mmol), 且混合物在CO氛圍下在50 psi下於60°C下加熱隔夜。冷卻至室溫後, 過濾反應混合物且在減壓下濃縮濾液。殘餘物用MeOH洗滌且沈澱藉由高真空乾燥, 得到呈固體狀之標題化合物。

實例611B

6-異氰酸酯基嘧啶-3-甲酸甲酯

向6-胺基嘧啶-3-甲酸甲酯(14 g, 91.5 mmol)於無水甲苯(700 mL)中之溶液中添加Et₃N(11.1 g, 109.8 mmol)。在0°C下緩慢添加三光氣(27.2 g, 91.5 mmol)於無水甲苯中之溶液。反應混合物在室溫下攪拌2小時, 接著在90°C下加熱5小時。冷卻至室溫後, 甲苯及水添加至混合物中, 分離混合物且有機層經無水Na₂SO₄乾燥, 在減壓下濃縮, 得到呈固體狀之標題化合物。

實例611C

6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)嘧啶-3-甲酸甲酯

在0°C下向6-異氰酸酯基嘧啶-3-甲酸甲酯(5.26 g, 29.4 mmol)於THF(100 mL)中之溶液中添加異吲哚啉(5.24 g, 4.41 mmol)於THF(50 mL)中之溶液。反應混合物在室溫下攪拌隔夜。過濾反應混合物且沈澱用冷EtOAc洗滌並在高真空中乾燥, 得到呈固體狀之標題化合物。

實例611D

6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)嘧啶-3-甲酸

在室溫下向 6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)噻嗪-3-甲酸甲酯 (3.7 g, 12.4 mmol) 於 MeOH (40 mL) 及 THF (40 mL) 中之溶液中添加 LiOH (0.7 g, 29.2 mmol) 於水 (10 mL) 中之溶液。反應混合物在室溫下攪拌隔夜。反應混合物傾倒至水 (100 mL) 中，用 EtOAc (2×50 mL) 萃取且水層藉由添加 2 N HCl 酸化至 pH 3，得到沈澱。沈澱用水洗滌並在高真空中乾燥，得到標題化合物。

實例 611E

N-(6-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 (S)-(四氫呋喃-3-基)甲胺代替 3-苯基丙-1-胺及 6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)噻嗪-3-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 9.94 (s, 1H), 9.12 (t, *J*=6.1 Hz, 1H), 8.31 (d, *J*=9.3 Hz, 1H), 8.11 (d, *J*=9.3 Hz, 1H), 7.41-7.28 (m, 4H), 4.89 (s, 4H), 3.80-3.55 (m, 3H), 3.50 (dd, *J*=8.5, 5.2 Hz, 1H), 3.37-3.31 (m, 2H), 2.63-2.51 (m, 1H), 2.01-1.85 (m, 1H), 1.71-1.55 (m, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 368 (M+H)⁺。

實例 612

N-{6-[(環戊基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用環戊基甲胺代替 3-苯基丙-1-胺及 6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)噻嗪-3-甲酸代替 4-(異

吡啶-2-甲酰胺基)苯甲酸製備。 ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 9.97 (s, 1H), 9.00 (t, $J=6.1$ Hz, 1H), 8.31 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 8.11 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 7.41-7.28 (m, 4H), 5.13-4.72 (m, 4H), 3.31-3.16 (m, 2H), 2.22 (p, $J=7.3$ Hz, 1H), 1.70-1.45 (m, 6H), 1.38-1.20 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 366 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ 。

實例 616

5-(羥基甲基)-N-(4-苯基丁基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用(4-異氰酸酯基丁基)苯代替4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯及異吡啶-5-基甲醇鹽酸鹽代替異吡啶製備。 ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 7.32-7.12 (m, 8H), 6.32-6.24 (m, 1H), 5.16 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 4.54 (bs, 4H), 4.49 (d, $J=5.7$ Hz, 2H), 3.14-3.05 (m, 2H), 2.64-2.54 (m, 2H), 1.63-1.39 (m, 4H); MS (ESI(+)) m/e 325 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ 。

實例 617

5-(羥基甲基)-N-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡啶-4-基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用1-異戊基-1H-吡啶-4-胺二鹽酸鹽代替4-胺基-N-丙基苯甲酰胺及異吡啶-5-基甲醇鹽酸鹽代替異吡啶-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。 ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 8.39 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.34-7.18 (m, 3H), 5.19 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 4.67 (bs, 4H), 4.51 (d, $J=5.5$ Hz, 2H), 4.04 (t, $J=7.1$

Hz, 2H), 1.71-1.55 (m, 2H), 1.55-1.33 (m, 1H), 0.89 (d, $J=6.5$ Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 329 ($M+H$)⁺。

實例 618

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]吡嗪-2-基}-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺

實例 618A

5-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)吡嗪-2-甲酸乙酯

標題化合物如實例 344A 中所述，用 5-胺基吡嗪-2-甲酸乙酯代替 5-胺基異吲哚啉-2-甲酸第三丁酯製備。

實例 618B

5-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)吡嗪-2-甲酸

標題化合物如實例 1B 中所述，用 5-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)吡嗪-2-甲酸乙酯代替 4-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)苯甲酸甲酯製備。

實例 618C

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]吡嗪-2-基}-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 3-甲基丁-1-胺代替 3-苯基丙-1-胺及 5-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)吡嗪-2-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆, 溫度=90°C) δ ppm 9.34 (bs, 1H), 9.17 (d, $J=1.4$ Hz, 1H), 8.82 (d, $J=1.4$ Hz, 1H), 8.30-8.23 (m, 1H), 7.36-7.26 (m, 4H), 4.86 (bs, 4H), 3.37-3.30 (m, 2H), 1.69-1.58 (m, 1H), 1.50-1.44 (m, 2H), 0.92 (d, $J=6.5$ Hz, 6H); MS

(ESI(+)) m/e 354 ($M+H$)⁺。

實例 621

N-(4-{(1E)-3-[苯甲基(甲基)胺基]丙-1-烯-1-基}苯基)-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 621A

(E)-N-苯甲基-N-甲基-3-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-
基)丙-2-烯-1-胺

在 4 mL 小瓶中，(E)-2-(3-氯丙-1-烯基)-4,4,5,5-四甲基-
1,3,2-二氧硼啉(0.195 ml, 0.988 mmol)及碳酸鉀(273 mg, 1.975 mmol)混合於無水乙腈(2 ml)中。苯甲基甲胺(0.166 ml, 1.284 mmol)添加至此混合物中且反應物在室溫下用力攪拌隔夜。反應物用乙酸乙酯稀釋且用水及鹽水洗滌。有機層經硫酸鈉乾燥，傾析且濃縮，得到標題化合物。

實例 621B

N-(4-{(1E)-3-[苯甲基(甲基)胺基]丙-1-烯-1-基}苯基)-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用(E)-N-苯甲基-N-甲基-3-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)丙-2-烯-1-胺代替 1H-吡啶-3-基酮酸及 N-(4-溴苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。
¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆, 溫度=90°C) δ ppm 8.12 (s, 1H), 7.52 (m, 2H), 7.37-7.18 (m, 11H), 6.48 (d, J =15.8 Hz, 1H), 6.18 (dt, J =15.8, 6.5 Hz, 1H), 4.77 (s, 4H), 3.53 (s, 2H), 3.15 (dd, J =6.5, 1.4 Hz, 2H), 2.18 (s, 3H); MS

(ESI(+)) m/e 398 ($M+H$)⁺。

實例 622

N-[4-(4-苯氧基哌啶-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲
醯胺

實例 622A

1-(4-硝基苯基)-4-苯氧基哌啶

1-氟-4-硝基苯(0.15 g, 1.063 mmol)及4-苯氧基哌啶鹽酸鹽(0.250 g, 1.169 mmol)於二甲基甲醯胺(2.126 ml)中之溶液用碳酸鉀(0.367 g, 2.66 mmol)處理。懸浮液在周圍溫度下攪拌2小時，在55℃下攪拌4小時且在周圍溫度下攪拌16小時。反應物傾倒至水中且過濾懸浮液並真空乾燥，得到標題化合物。

實例 622B

4-(4-苯氧基哌啶-1-基)苯胺

標題化合物如實例 272A 中所述，用 1-(4-硝基苯基)-4-苯氧基哌啶代替 4-硝基-N-丙基苯甲醯胺製備。

實例 622C

N-[4-(4-苯氧基哌啶-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲
醯胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-(4-苯氧基哌啶-1-基)苯胺代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.11 (s, 1H), 7.42-7.24 (m, 8H), 7.02-6.86 (m, 5H), 4.74 (bs, 4H), 4.59-4.47 (m, 1H), 3.49-3.39 (m, 2H),

3.03-2.91 (m, 2H), 2.11-1.98 (m, 2H), 1.81-1.66 (m, 2H) ;

MS (ESI(+)) m/e 414 (M+H)⁺。

實例 623

N-[4-(3-苯氧基氮雜環丁烷-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 622 中所述，在實例 622A 中用 3-苯氧基氮雜環丁烷代替 4-苯氧基哌啶鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.06 (s, 1H), 7.44-7.25 (m, 8H), 7.03-6.93 (m, 1H), 6.92-6.85 (m, 2H), 6.47-6.40 (m, 2H), 5.19-5.08 (m, 1H), 4.73 (bs, 4H), 4.32-4.23 (m, 2H), 3.69 (dd, *J*=8.2, 4.2 Hz, 2H) ; MS (ESI(+)) m/e 386 (M+H)⁺。

實例 624

N-(4-{[苯甲基(甲基)胺基]甲基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲醯胺

異吲哚啉(0.1 g, 0.839 mmol)及N-乙基-N-異丙基丙-2-胺(0.219 ml, 1.259 mmol)於乙腈(2.80 ml)中之懸浮液用N-甲基吡咯啉(2.80 ml)處理。溶液冷卻至0℃且添加1-(氯甲基)-4-異氰酸酯基苯(0.155 g, 0.923 mmol)。在0℃下攪拌2小時後，反應物用N-甲基-1-苯基甲胺(0.102 g, 0.839 mmol)於0.5 mL乙腈中之溶液處理。反應物在0℃下攪拌5分鐘且在周圍溫度下攪拌30分鐘。反應物用水處理且混合物攪拌4小時。過濾懸浮液且收集之固體用水洗滌並真空乾燥，得到標題化合物。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ

N-{4-[1-(4,4,4-三氟丁醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-乙醯基哌啶-4-基)羰基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{7-側氧基-7-[(3-苯基丙基)胺基]庚基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(雙環[2.2.1]庚-2-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-噻唑-5-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-側氧基-4,5,6,7-四氫-1-苯并呋喃-3-基)羰基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(3-甲基丁醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

ppm 8.31 (s, 1H), 7.56-7.49 (m, 2H), 7.40-7.28 (m, 8H), 7.27-7.19 (m, 3H), 4.76 (bs, 4H), 3.47 (s, 2H), 3.43 (s, 2H), 2.06 (s, 3H); MS (ESI(+)) m/e 372 (M+H)⁺。

實例 625

5-氟-N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 410 中所述，用 5-氟-N-(4-{[四氫呋喃-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺代替 N-(4-{[四氫呋喃-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.39 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 7.81-7.73 (m, 2H), 7.69-7.62 (m, 2H), 7.40 (dd, $J=8.4, 5.2$ Hz, 1H), 7.24 (dd, $J=9.1, 2.5$ Hz, 1H), 7.15 (td, $J=8.9, 2.5$ Hz, 1H), 4.80-4.72 (m, 4H), 3.80-3.68 (m, 1H), 3.68-3.56 (m, 2H), 3.47 (dd, $J=8.5, 5.2$ Hz, 2H), 3.21 (dt, $J=13.3, 5.9$ Hz, 2H), 2.01-1.86 (m, 1H), 1.67-1.53 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 384 (M+H)⁺。

實例 626

5-氟-N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 411 中所述，用 5-氟-N-(4-{[四氫呋喃-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺代替 N-(4-{[四氫呋喃-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆)

δ 8.60 (s, 1H), 8.39 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 7.80-7.73 (m, 2H), 7.69-7.62 (m, 2H), 7.40 (dd, $J=8.4, 5.2$ Hz, 1H), 7.24 (dd, $J=9.1, 2.5$ Hz, 1H), 7.15 (td, $J=8.9, 2.5$ Hz, 1H), 4.80-4.73 (m, 4H), 3.80-3.56 (m, 3H), 3.47 (dd, $J=8.5, 5.2$ Hz, 1H), 3.24-3.13 (m, 2H), 2.01-1.86 (m, 1H), 1.67-1.53 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 384 ($M+H$)⁺。

實例 636

N-[4-(1-苯甲基-1H-1,2,3-三唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺

實例 636A

N-(4-乙炔基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用 1-乙炔基-4-異氰酸酯基苯代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯製備。

實例 636B

N-[4-(1-苯甲基-1H-1,2,3-三唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺

N-(4-乙炔基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺 (100 mg, 0.381 mmol)、苯甲胺 (33.2 mg, 0.381 mmol) 及抗壞血酸鈉 (15 mg, 0.076 mmol) 於甲醇 (1.9 ml) 中之混合物用 1H-咪唑-1-磺醯疊氮鹽酸鹽 (66.0 mg, 0.381 mmol)、五水合硫酸銅 (II) (9.52 mg, 0.038 mmol) 及三乙胺 (63.8 μ l, 0.457 mmol) 處理。添加另外甲醇 (2 mL) 且小瓶用氮氣沖洗並攪拌 2 天。混合物用水稀釋且所得懸浮液藉由水洗過濾，得到呈白色固體狀之標題化合物。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆)

δ 8.51 (s, 1H), 8.45 (s, 1H), 7.73 (d, $J=8.7$ Hz, 2H), 7.65 (d, $J=8.9$ Hz, 2H), 7.49-7.24 (m, 9H), 5.63 (s, 2H), 4.78 (s, 4H), 1.11-1.00 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 396 ($M+H$)⁺.

表 12.

以下實例基本上如實例 636B 中所述，用適當胺代替苯甲胺製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
637	N-{4-[1-(3-甲基丁基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.47 (s, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.73 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.65 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.41-7.27 (m, 6H), 4.79 (s, 5H), 4.40 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 1.77 (dd, $J=14.5, 7.0$ Hz, 2H), 1.52 (dt, $J=13.4, 6.7$ Hz, 1H), 0.93 (d, $J=6.6$ Hz, 7H)	(ESI(+)) m/e 376 ($M+H$) ⁺
638	N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.50 (s, 1H), 8.45 (s, 1H), 7.73 (d, $J=8.9$ Hz, 2H), 7.66 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.34 (ddd, $J=8.9, 4.2, 2.5$ Hz, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.39 (d, $J=7.5$ Hz, 2H), 3.84-3.59 (m, 3H), 3.51 (dd, $J=8.8, 5.4$ Hz, 1H), 2.88-2.69 (m, 1H), 2.04-1.86 (m, 1H), 1.73-1.55 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 390 ($M+H$) ⁺
639	N-(4-{1-[2-(2-側氧基吡咯啶-1-基)乙基]-1H-1,2,3-三唑-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.46 (s, 2H), 7.72 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.66 (d, $J=8.9$ Hz, 2H), 7.37 (d, $J=5.5$ Hz, 2H), 7.32 (dd, $J=5.6, 3.1$ Hz, 2H), 4.79 (s, 4H), 4.53 (t, $J=5.9$ Hz, 2H), 3.66 (t, $J=5.9$ Hz, 2H), 3.23 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 2.15 (t, $J=8.0$ Hz, 2H), 1.94-1.76 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 417 ($M+H$) ⁺
640	N-{4-[1-(1-苯甲基哌啶-4-基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.57 (s, 1H), 8.43 (s, 1H), 7.73 (d, $J=8.7$ Hz, 1H), 7.65 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.41-7.24 (m, 9H), 4.79 (s, 3H), 4.53 (td, $J=10.6, 5.1$ Hz, 1H), 3.54 (s, 2H), 2.98-2.88 (m, 2H), 2.33-1.93 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 479 ($M+H$) ⁺
641	N-{4-[1-(3-苯基丙基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.50 (s, 1H), 8.45 (s, 1H), 7.74 (d, $J=8.7$ Hz, 1H), 7.66 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.50-7.26 (m, 6H), 7.27-7.16 (m, 3H), 4.79 (s, 2H), 4.40 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 2.62 (t, $J=7.7$ Hz, 2H), 2.29-2.07 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 424 ($M+H$) ⁺
642	N-(4-{1-[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]-1H-1,2,3-三唑-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.44 (s, 2H), 7.72 (d, $J=8.7$ Hz, 2H), 7.64 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.42-7.19 (m, 6H), 6.94 (d, $J=8.7$ Hz, 2H), 5.49 (s, 2H), 4.78 (s, 4H), 3.79-3.65 (m, 4H), 3.23-2.97 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 481 ($M+H$) ⁺

643	N-[4-(1-異丁基-1H-1,2,3-三唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.44 (s, 2H), 7.74 (d, $J=8.7$ Hz, 2H), 7.66 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.41-7.27 (m, 5H), 4.79 (s, 4H), 4.21 (d, $J=7.2$ Hz, 2H), 2.29-2.06 (m, 1H), 0.90 (d, $J=6.7$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 362 (M+H) $^+$
644	N-{4-[1-(環戊基甲基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.46 (s, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.73 (d, $J=8.7$ Hz, 1H), 7.66 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.41-7.28 (m, 4H), 4.79 (s, 2H), 4.31 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 3.31 (s, 2H), 2.40 (dt, $J=15.1, 7.4$ Hz, 1H), 1.73-1.47 (m, 6H), 1.36-1.21 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 388 (M+H) $^+$
645	N-{4-[1-(3-甲氧基丙基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.46 (s, 1H), 8.45 (s, 1H), 7.73 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.66 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.42-7.26 (m, 4H), 4.79 (s, 4H), 4.43 (t, $J=7.1$ Hz, 2H), 3.38-3.32 (m, 1H), 3.25 (s, 3H), 2.10 (p, $J=6.4$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 378 (M+H) $^+$

實例 646

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺(50 mg, 0.128 mmol)及
甲醇(10 ml)添加至 50 ml 耐壓瓶中 5% 濕 Pd-C(10.00 mg,
0.094 mmol)中且在 30 psi 及室溫下攪拌 16 小時。混合物經
由耐綸膜過濾且濃縮。層析得到標題化合物。 ^1H NMR
(500 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$
Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.49-7.40 (m, 3H), 7.13 (m, 2H),
4.79 (m, 4H), 4.56 (m, 1H), 4.05 (m, 1H), 3.12 (m, 1H),
2.90 (m, 1H), 2.71 (m, 1H), 2.57 (m, 1H), 1.79 (m, 2H),
1.55-1.30 (m, 2H), 1.02 (m, 6H); MS (ESI(+)) m/e 393
(M+H) $^+$ 。

實例 647

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 646 中所述，用 N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺製備。¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.27 (s, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.39-7.28 (m, 4H), 7.12 (m, 2H), 4.75 (bs, 4H), 4.47 (m, 1H), 4.24-4.09 (m, 2H), 3.90 (m, 1H), 3.57 (m, 2H), 3.47 (t, *J*=4.7 Hz, 2H), 3.26 (s, 3H), 3.06 (m, 1H), 2.70 (m, 1H), 2.62 (m, 1H), 1.77 (m, 2H), 1.57 (m, 1H), 1.42 (m, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 438 (M+H)⁺。

實例 648

N-{5-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]吡啶-2-基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 646 中所述，用 N-[1'-(四氫呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺製備。¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.81 (s, 1H), 8.16 (d, *J*=2.4 Hz, 1H), 7.85 (d, *J*=8.6 Hz, 1H), 7.63 (dd, *J*=8.7, 2.4 Hz, 1H), 7.39-7.25 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 4.56 (d, *J*=13.1 Hz, 1H), 4.08 (d, *J*=12.3 Hz, 1H), 3.88 (m, 1H), 3.72 (m, 3H), 3.38 (m, 1H), 3.11 (m, 1H), 2.78 (dd, *J*=11.9, 9.2 Hz, 1H), 2.63 (m, 1H), 2.03 (m, 2H), 1.80 (t, *J*=15.4 Hz, 2H),

1.51 (m, 2H) ; MS (ESI(+)) m/e 421 (M+H)⁺。

實例 651

N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

實例 651A

N-(6-氯吡啶-3-基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用 2-氯-5-異氰酸酯基吡
啶代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯及 2,3-二氫-1H-吡咯并
[3,4-c]吡啶代替異吲哚啉製備。

實例 651B

4-(5-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)吡啶-2-
基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 280 中所述，用 4-(4,4,5,5-四甲基-
1,3,2-二氧硼啉-2-基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯代
替 1H-吡啶-3-基酮酸及 N-(6-氯吡啶-3-基)-1H-吡咯并[3,4-
c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)
異吲哚啉-2-甲醯胺製備。

實例 651C

N-(6-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)吡啶-3-基)-1H-吡咯并[3,4-c]
吡啶-2(3H)-甲醯胺

標題化合物如實例 2D 中所述，用 4-(5-(2,3-二氫-1H-吡咯
并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)吡啶-2-基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-
甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲
醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 651D

N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(6-(1,2,3,6-四氫吡
啶-4-基)吡啶-3-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺
及異丁酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H
NMR (501 MHz, DMSO-*d*₆, 溫度=90°C) δ ppm 8.73 (d,
J=2.6 Hz, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.52 (m, 2H), 7.99 (dd, *J*=8.6,
2.6 Hz, 1H), 7.49 (d, *J*=8.7 Hz, 1H), 7.44 (d, *J*=5.0 Hz,
1H), 6.60 (m, 1H), 4.88 (bs, 2H), 4.85 (d, *J*=2.3 Hz, 2H),
4.22 (m, 2H), 3.73 (t, *J*=5.7 Hz, 2H), 2.96 (m, 1H), 2.63
(m, 2H), 1.08 (d, *J*=6.7 Hz, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 392
(*M*+H)⁺。

表 13.

以下實例基本上如實例 1C 中所述，用 N-(6-(1,2,3,6-四氫
吡啶-4-基)吡啶-3-基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺
代替 3-苯基丙-1-胺及相應羧酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺
基)苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
652	N-(1'- 苯 甲 醯 基 - 1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯 吡啶-5-基)-1,3-二氫- 2H-吡咯并[3,4-c]吡 啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.70 (d, <i>J</i> =2.6 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.96 (dd, <i>J</i> =8.6, 2.6 Hz, 1H), 7.49-7.37 (m, 7H), 6.56 (bs, 1H), 4.83 (m, 4H), 4.22 (m, 2H), 3.64 (m, 2H), 2.64 (m, 2H)	(ESI(+)) <i>m/e</i> 426 (<i>M</i> +H) ⁺
653	N-[1'-(四氫呋喃-3-基 羧基)-1',2',3',6'-四氫- 2,4'-聯吡啶-5-基]- 1,3-二氫-2H-吡咯并	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.70 (s, 1H), 8.60 (bs, 1H), 8.49 (dd, <i>J</i> =8.6, 2.7 Hz, 1H), 8.43 (s, 1H), 7.95 (d, <i>J</i> =2.7 Hz, 1H), 7.45 (d, <i>J</i> =8.6, 1H), 7.40 (d, <i>J</i> =2.7 Hz,	(ESI(+)) <i>m/e</i> 420 (<i>M</i> +H) ⁺

	[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (501 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 6.56 (bs, 1H), 4.78 (m, 4H), 4.20 (m, 2H), 3.92 (m, 1H), 3.72 (m, 4H), 3.40 (m, 1H), 2.60 (m, 2H), 2.05 (m, 3H)	
654	N-{1'-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (501 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.69 (d, <i>J</i> =2.6 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.47 (m, 1H), 7.95 (dd, <i>J</i> =8.6, 2.6 Hz, 1H), 7.45 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 1H), 7.40 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 6.55 (bs, 1H), 4.84 (bs, 2H), 4.81 (bs, 2H), 4.19 (s, 2H), 4.14 (m, 2H), 3.65 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.48 (m, 2H), 3.26 (s, 3H), 2.60 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 438 (M+H) ⁺
700	N-[1'-(四氫呋喃-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.69 (dd, <i>J</i> =8.7, 2.6 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> =8.7, 1H), 8.42 (bs, 1H), 7.94 (dd, <i>J</i> =8.7, 2.6 Hz, 1H), 7.44 (m, 1H), 7.39 (d, <i>J</i> =5.1, 1H), 6.55 (m, 1H), 4.82 (m, 4H), 4.68 (dd, <i>J</i> =7.5, 5.8 Hz, 1H), 4.19 (bs, 2H), 3.88-3.62 (m, 4H), 2.60 (m, 2H), 2.10 (m, 1H), 2.01 (m, 1H), 1.87 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) ⁺
701	N-[1'-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.69 (d, <i>J</i> =2.5 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.94 (dd, <i>J</i> =8.7, 2.6 Hz, 1H), 7.44 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 1H), 7.39 (d, <i>J</i> =4.9 Hz, 1H), 6.55 (m, 1H), 4.82 (m, 4H), 4.18 (bs, 2H), 3.85 (m, 2H), 3.70 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 2H), 3.42 (td, <i>J</i> =11.4, 2.5 Hz, 2H), 2.92 (m, 1H), 2.60 (bs, 2H), 1.66 (m, 2H), 1.57 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 434 (M+H) ⁺
702	N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.69 (dd, <i>J</i> =2.7, 0.5 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.43 (bs, 1H), 7.94 (dd, <i>J</i> =8.7, 2.6 Hz, 1H), 7.43 (m, 1H), 7.39 (m, 1H), 6.54 (m, 1H), 4.82 (m, 4H), 4.37 (dd, <i>J</i> =9.2, 2.9 Hz, 1H), 4.18 (bs, 2H), 3.82-3.61 (m, 7H), 3.52 (m, 1H), 2.61 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 436 (M+H) ⁺
703	N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.69 (d, <i>J</i> =2.4 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.43 (s, 1H), 7.95 (dd, <i>J</i> =8.7, 2.6 Hz, 1H), 7.45 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 1H), 7.39 (d, <i>J</i> =4.9 Hz, 1H), 6.55 (m, 1H), 4.82 (m, 4H), 4.21 (s, 2H), 3.85-3.65 (m, 3H), 3.35-3.13 (m, 3H), 3.06 (m, 1H), 2.63 (bs, 2H), 2.37 (m, 1H), 2.13 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 468 (M+H) ⁺
704	N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.68 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> =4.8 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 7.94 (m, 1H), 7.43 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 1H), 7.39 (d, <i>J</i> =4.7 Hz, 1H), 6.55 (m, 1H), 5.09 (s, 1H), 4.82 (m, 4H), 4.32 (bs, 2H), 3.92 (bs, 2H), 2.59 (bs, 2H), 1.37 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) ⁺

實例 699

N-{4-[1-(吡啶-2-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用吡啶甲醯氯代替乙醯
 氯及 N-[4-(哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺
 代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺
 製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.56 (d, *J*=4.76
 Hz, 1 H) 7.83-7.97 (m, 1 H) 7.38-7.57 (m, 2 H) 7.18-7.40
 (m, 4 H) 6.27 (t, *J*=5.55 Hz, 1 H) 4.56 (s, 4 H) 4.47 (d,
J=13.09 Hz, 1 H) 3.59 (d, *J*=13.88 Hz, 1 H) 3.00-3.16 (m, 3
 H) 2.92-3.01 (m, 1 H) 2.68-2.81 (m, 1 H) 1.77 (d, *J*=12.69
 Hz, 1 H) 0.97-1.64 (m, 11 H); MS (ESI(+)) *m/e* 407
 (M+H)⁺。

實例 718

N-(4-{[(3*S*)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-
 2H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-2-甲醯胺

實例 718A

(四氫呋喃-3-基)甲基胺基甲酸苯甲酯

外消旋(四氫呋喃-3-基)甲胺(3.84 g, 38.0 mmol)及二異
 丙基乙胺(13.26 ml, 76 mmol)溶於二氯甲烷(100 ml)中且
 冷卻至 0°C。混合物經由加料漏斗用溶於 30 ml 二氯甲烷中
 之氯甲酸苯甲酯(6.19 ml, 41.8 mmol)逐滴處理。添加後，
 移除冷卻浴且均質溶液在周圍溫度下攪拌隔夜。反應混合
 物分配於水與乙酸乙酯之間且分離之水層用乙酸乙酯萃

取。合併之有機層用鹽水洗滌，經硫酸鎂乾燥，過濾且濃縮。層析得到標題化合物。

實例 718B

(S)-(四氫呋喃-3-基)甲基胺基甲酸苯甲酯

(四氫呋喃-3-基)甲基胺基甲酸苯甲酯之外消旋混合物溶於四氫呋喃中且藉由液相層析，使用 Chiralpak IC 2.5 cm ID×25 cm 之 20 微米管柱，用己烷/四氫呋喃/異丙醇 (85/10/5) 溶離來分離，得到 (R)-(四氫呋喃-3-基)甲基胺基甲酸苯甲酯及 (S)-(四氫呋喃-3-基)甲基胺基甲酸苯甲酯。

實例 718C

(S)-(四氫呋喃-3-基)甲胺

(R)-(四氫呋喃-3-基)甲基胺基甲酸苯甲酯 (8.9 g, 37.8 mmol) 及乙醇 (160 ml) 添加至 250 mL 不鏽鋼耐壓瓶中 20% 濕氫氧化鈣 (II) (0.890 g, 6.34 mmol) 中且在 30 psi 及室溫下攪拌 40 分鐘。混合物經由耐綸濾紙過濾且用 4N HCl 之二噁烷溶液 (5 當量) 酸化。濃縮且乾燥，得到標題化合物。

實例 718D

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 (S)-(四氫呋喃-3-基)甲胺代替 3-苯基丙-1-胺及 4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.64 (s, 2H), 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.38 (t, *J*=5.7 Hz, 1H), 7.81-

N-(4-{2-[(4-甲基戊醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(乙氧基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(環戊基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(環戊基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[2-(苯甲醯基胺基)乙基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫-2H-呋喃-4-基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

7.74 (m, 2H), 7.69-7.62 (m, 2H), 7.44 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 4.86-4.79 (m, 4H), 3.80-3.66 (m, 2H), 3.67-3.56 (m, 1H), 3.47 (dd, $J=8.5, 5.3$ Hz, 1H), 3.21 (dt, $J=13.2, 5.8$ Hz, 1H), 2.01-1.86 (m, 1H), 1.67-1.53 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 367 ($M+H$)⁺。

實例 720

N-(7-側氧基-7-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺基}庚基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 720A

7-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)庚酸甲酯

標題化合物如實例 344A 中所述，用 7-胺基庚酸甲酯代替 5-胺基異吲哚啉-2-甲酸第三丁酯製備。

實例 720B

7-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)庚酸

標題化合物如實例 1B 中所述，用 7-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)庚酸甲酯代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯製備。

實例 720C

N-(7-側氧基-7-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺基}庚基)-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 (R)-(四氫呋喃-3-基)甲胺代替 3-苯基丙-1-胺及 7-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)庚酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 7.85 (t, $J=5.76$ Hz, 1 H) 7.20-7.37 (m, 4

H) 6.26 (t, $J=5.59$ Hz, 1 H) 4.57 (s, 4 H) 3.49-3.79 (m, 3 H) 3.35 (dd, $J=8.48, 5.43$ Hz, 1 H) 2.94-3.15 (m, 4 H) 2.18-2.38 (m, 1 H) 2.05 (t, $J=7.29$ Hz, 2 H) 1.79-1.98 (m, 1 H) 1.35-1.60 (m, 7 H) 1.17-1.35 (m, 2 H); MS (ESI(+)) m/e 374 ($M+H$)⁺。

實例 721

N-{7-側氧基-7-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺基]庚基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用(四氫-2H-哌喃-4-基)甲胺代替 3-苯基丙-1-胺及 7-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)庚酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 7.76 (t, $J=5.75$ Hz, 1 H) 7.20-7.40 (m, 4 H) 6.26 (t, $J=5.55$ Hz, 1 H) 4.57 (s, 4 H) 3.82 (dd, $J=11.10, 2.78$ Hz, 2 H) 3.14-3.29 (m, 2 H) 3.05 (q, $J=6.74$ Hz, 2 H) 2.92 (t, $J=6.15$ Hz, 2 H) 2.06 (t, $J=7.54$ Hz, 2 H) 1.33-1.65 (m, 9 H) 1.19-1.34 (m, 2 H) 0.98-1.22 (m, 2 H); MS (ESI(+)) m/e 388 ($M+H$)⁺。

實例 722

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-2-甲醯胺

實例 722A

4-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-2-甲醯胺基)丁基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 344 中所述，在實例 344A 中用 4-(4-胺

基丁基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替5-氨基異吡啶啉-2-甲酸第三丁酯及用1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶代替異吡啶啉製備。

實例 722B

N-(4-(哌啶-4-基)丁基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺

標題化合物如實例2D中所述，用4-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)丁基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替4-((4-(5-氟異吡啶啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 722C

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并

[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(4-(哌啶-4-基)丁基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及苯甲酸代替4-(異吡啶啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆, 溫度=90°C) δ ppm 8.54 (s, 1 H) 8.45 (d, *J*=5.04 Hz, 1 H) 7.38-7.46 (m, 3 H) 7.28-7.37 (m, 3 H) 6.09 (s, 1 H) 4.62 (dd, *J*=9.08, 1.60 Hz, 4 H) 3.07-3.15 (m, 2 H) 2.79-2.94 (m, 2 H) 1.61-1.75 (m, 2 H) 1.41-1.58 (m, 3 H) 1.20-1.40 (m, 4 H) 0.99-1.17 (m, 2 H); MS (ESI(+)) *m/e* 407 (M+H)⁺。

表 14.

以下實例基本上如實例722C中所述，用適當羧酸代替苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
757	N-{4-[1-(2-氯苯甲醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.55 (s, 1 H) 8.46 (d, <i>J</i> =5.16 Hz, 1 H) 7.25-7.57 (m, 5 H) 6.36 (t, <i>J</i> =5.55 Hz, 1 H) 4.60 (s, 2 H) 4.60 (s, 2 H) 4.43-4.54 (m, 1 H) 3.13-3.28 (m, 1 H) 2.85-3.12 (m, 3 H) 2.74 (t, <i>J</i> =12.10 Hz, 1 H) 1.76(d, <i>J</i> =13.09 Hz, 1 H) 0.86-1.67(m, 10H)	(ESI(+)) m/e 441 (M+H) ⁺
1350	N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90℃) δ 8.63 (s, 1H), 8.53 (d, <i>J</i> =5.3 Hz, 1H), 7.52 (d, <i>J</i> =5.3 Hz, 1H), 6.13-5.96 (m, 1H), 4.67 (s, 1H), 4.09 (p, <i>J</i> =6.6 Hz, 2H), 3.73 (q, <i>J</i> =7.2 Hz, 5H), 3.10 (t, <i>J</i> =7.0 Hz, 2H), 2.82-2.55 (m, 3H), 2.35 (dd, <i>J</i> =14.8, 6.5 Hz, 2H), 2.04-1.92 (m, 2H), 1.79 (tt, <i>J</i> =12.8, 6.3 Hz, 2H), 1.66 (d, <i>J</i> =12.9 Hz, 2H), 1.54-1.42 (m, 3H), 1.39-1.29 (m, 2H), 1.24 (dd, <i>J</i> =14.3, 5.9 Hz, 2H), 1.06-0.90 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 415 (M+H) ⁺
1351	N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90℃) δ 8.64 (s, 1H), 8.55 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 7.55 (d, <i>J</i> =5.3 Hz, 1H), 6.08 (s, 1H), 4.68 (s, 5H), 3.70-3.58 (m, 2H), 3.22-3.15 (m, 3H), 3.15-3.00 (m, 3H), 2.29 (td, <i>J</i> =12.8, 7.0 Hz, 2H), 2.08 (ddd, <i>J</i> =17.0, 13.4, 8.8 Hz, 2H), 1.69 (d, <i>J</i> =12.9 Hz, 2H), 1.50 (ddt, <i>J</i> =21.4, 14.3, 7.3 Hz, 3H), 1.40-1.21 (m, 4H), 1.03 (d, <i>J</i> =11.6 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 449 (M+H) ⁺
1352	N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90℃) δ 8.62 (s, 1H), 8.52 (d, <i>J</i> =5.3 Hz, 1H), 7.51 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 6.13-5.95 (m, 1H), 4.65 (d, <i>J</i> =7.1 Hz, 4H), 3.83-3.75 (m, 1H), 3.70 (td, <i>J</i> =8.0, 5.3 Hz, 1H), 3.57 (dd, <i>J</i> =24.8, 17.4 Hz, 2H), 3.28-3.14 (m, 3H), 3.10 (t, <i>J</i> =7.0 Hz, 2H), 2.40-2.26 (m, 3H), 1.99 (dt, <i>J</i> =12.8, 7.6 Hz, 2H), 1.66 (d, <i>J</i> =10.4 Hz, 3H), 1.55-1.40 (m, 3H), 1.36-1.16 (m, 3H), 0.99 (d, <i>J</i> =9.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 415 (M+H) ⁺
1353	N-{4-[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90℃) δ 8.64 (s, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 7.54 (d, <i>J</i> =5.3 Hz, 1H), 6.08 (s, 1H), 4.68 (s, 4H), 4.17-3.95 (m, 4H), 3.10 (t, <i>J</i> =7.0 Hz, 2H), 2.78-2.53 (m, 3H), 1.72-1.62 (m, 5H), 1.57 (d, <i>J</i> =14.8 Hz, 3H), 1.46 (dd, <i>J</i> =14.3, 7.3 Hz, 3H), 1.39-1.13 (m, 6H), 1.03-0.91 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 413 (M+H) ⁺
1354	N-(4-{1-[(4,4-二氯環己基)羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90℃) δ 8.61 (s, 1H), 8.52 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 7.49 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 6.17-5.91 (m, 1H), 4.66 (s, 4H), 4.17-3.95 (m, 3H), 3.10 (t, <i>J</i> =7.0 Hz, 2H), 2.84-2.68 (m, 3H), 2.09-1.96 (m, 2H), 1.93-1.77 (m, 2H), 1.65 (dd, <i>J</i> =27.2, 12.8 Hz, 6H), 1.56-1.40 (m, 2H), 1.41-1.20 (m, 4H), 1.06-0.92 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 449 (M+H) ⁺
1355	N-{4-[1-(2-羥基-	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90℃) δ 8.62 (s,	(ESI(+)) m/e 389

	2-甲基丙醯基)哌啶-4-基}丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.53 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.51 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 6.18-5.92 (m, 1H), 4.67 (s, 4H), 4.52-4.43 (m, 2H), 3.10 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 2.82-2.70 (m, 2H), 1.70-1.62 (m, 2H), 1.56-1.42 (m, 4H), 1.32 (s, 8H), 1.28 (d, $J=13.3$ Hz, 2H), 1.08-1.02 (m, 2H)	(M+H) ⁺
1356	N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.63 (s, 1H), 8.53 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 6.08 (s, 1H), 4.67 (s, 4H), 4.58 (dd, $J=7.5$, 5.6 Hz, 2H), 4.20-4.05 (m, 3H), 3.83-3.62 (m, 3H), 3.10 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 2.76 (bs, 2H), 2.11-1.99 (m, 1H), 2.00-1.75 (m, 3H), 1.71-1.63 (m, 2H), 1.46 (dd, $J=14.2$, 7.2 Hz, 2H), 1.37-1.19 (m, 2H), 1.10-0.92 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 401 (M+H) ⁺
1357	N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.62 (s, 1H), 8.53 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.51 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 6.07 (s, 1H), 4.67 (s, 4H), 4.58 (dd, $J=7.5$, 5.6 Hz, 1H), 3.77 (q, $J=7.2$ Hz, 2H), 3.82-3.67 (m, 3H), 3.10 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 2.75 (bs, 1H), 2.11-1.99 (m, 1H), 2.00-1.75 (m, 3H), 1.71-1.62 (m, 2H), 1.53-1.21 (m, 7H), 1.08-0.92 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 401 (M+H) ⁺
1358	N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.62 (s, 1H), 8.53 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.51 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 6.15-5.99 (m, 1H), 4.67 (s, 4H), 4.58 (dd, $J=7.5$, 5.6 Hz, 2H), 3.77 (q, $J=7.2$ Hz, 2H), 3.82-3.67 (m, 3H), 3.10 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 2.75 (bs, 1H), 2.11-1.99 (m, 1H), 1.95 (ddd, $J=17.4$, 9.9, 6.6 Hz, 1H), 1.88-1.77 (m, 1H), 1.71-1.62 (m, 2H), 1.46 (dd, $J=14.4$, 7.4 Hz, 3H), 1.37-1.19 (m, 4H), 1.08-0.92 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺
1359	N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.64 (s, 4H), 8.54 (d, $J=5.3$ Hz, 1H), 7.55 (d, $J=5.3$ Hz, 1H), 6.08 (s, 1H), 4.68 (s, 4H), 3.85 (t, $J=8.1$ Hz, 1H), 3.73-3.58 (m, 2H), 3.33-3.22 (m, 2H), 3.10 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 1.99 (dd, $J=14.3$, 7.1 Hz, 3H), 1.68 (d, $J=12.7$ Hz, 2H), 1.55-1.41 (m, 3H), 1.33 (dt, $J=13.8$, 6.4 Hz, 2H), 1.24 (dd, $J=13.4$, 6.3 Hz, 2H), 0.99 (dd, $J=24.0$, 12.4 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 401 (M+H) ⁺
1360	N-(4-{1-[(丙-2-基氧基)乙醯基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.63 (s, 4H), 8.53 (d, $J=5.3$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 6.09 (s, 1H), 4.66 (d, $J=7.5$ Hz, 5H), 3.60 (dt, $J=12.2$, 6.1 Hz, 2H), 3.10 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 1.67 (d, $J=13.1$ Hz, 2H), 1.54-1.41 (m, 3H), 1.33 (dd, $J=15.9$, 7.1 Hz, 2H), 1.24 (dd, $J=14.3$, 5.7 Hz, 3H), 1.10 (d, $J=6.1$ Hz, 6H), 1.02 (d, $J=11.2$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 403 (M+H) ⁺
1361	N-{4-[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲	^1H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.63 (s, 4H), 8.54 (d, $J=5.3$ Hz, 1H), 7.54 (d, $J=5.3$ Hz, 1H), 6.13-6.00 (m, 1H), 4.67 (s, 4H), 3.10 (t, $J=7.0$ Hz, 2H), 2.22 (d, $J=6.6$ Hz, 2H), 1.63 (t, $J=21.9$ Hz, 2H), 1.47 (dt, $J=14.1$, 7.0 Hz, 3H), 1.38-1.28 (m, 2H), 1.24 (dd, $J=14.3$, 5.8 Hz, 2H), 1.07-0.85	(ESI(+)) m/e 385 (M+H) ⁺

	醯胺	(m, 4H), 0.47-0.39 (m, 2H), 0.15-0.05 (m, 2H)	
1362	N-{4-[1-(4,4,4-三 氟丁醯基)哌啶- 4-基]丁基}-1,3- 二氫-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲 醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.63 (s, 4H), 8.53 (d, <i>J</i> =5.3 Hz, 1H), 7.52 (d, <i>J</i> =5.3 Hz, 1H), 6.07 (s, 1H), 4.67 (s, 4H), 3.10 (t, <i>J</i> =7.0 Hz, 2H), 1.67 (d, <i>J</i> =13.3 Hz, 2H), 1.47 (dt, <i>J</i> =14.3, 7.1 Hz, 3H), 1.38-1.29 (m, 4H), 1.25 (dt, <i>J</i> =13.6, 6.8 Hz, 3H), 1.03 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 427 (M+H) ⁺

實例 753

N-{4-[5-(嗎啉-4-基甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 753A

N-(4-(5-(氯甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基)異吲哚啉-2-甲
醯胺

向含有 (Z)-N-(4-(N'-羥基甲脒基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯
胺 (1.5 g, 5.06 mmol) 於丙酮 (5 ml) 中之 25 mL 圓底燒瓶中
一次性添加碳酸鉀 (7.00 g, 50.6 mmol)。反應混合物冷卻
至 0°C 且緩慢添加 2-氯乙醯氯 (3.22 ml, 40.5 mmol)。所得
混合物升溫至室溫且攪拌 2 小時。移除溶劑且固體用水濕
磨，接著藉由水洗過濾。乾燥之固體溶於 DMF 中，加熱至
100°C 且攪拌 2 小時。用水及二氯甲烷處理，接著層析，得
到標題化合物。

實例 753B

N-{4-[5-(嗎啉-4-基甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

向 20 mL 小瓶中添加含 N-(4-(5-(氯甲基)-1,2,4-噁二唑-3-
基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺 (50 mg, 0.141 mmol) 及嗎啉
(36.8 mg, 0.423 mmol) 之 DMF (470 μl)。混合物加熱至

50°C，保持30分鐘，冷卻且用2 mL甲醇稀釋。層析得到標題化合物。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.69 (s, 1H), 7.92 (d, *J*=8.8 Hz, 2H), 7.80 (d, *J*=8.9 Hz, 2H), 7.35 (ddd, *J*=8.8, 3.9, 2.4 Hz, 4H), 4.80 (s, 4H), 3.95 (s, 2H), 3.68-3.48 (m, 4H), 2.62-2.51 (m, 5H); MS (ESI(+)) *m/e* 406 (M+H)⁺。

實例 754

N-(4-{5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 753B 中所述，用 1-甲基哌嗪代替嗎啉製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.69 (s, 1H), 7.91 (d, *J*=8.8 Hz, 3H), 7.80 (d, *J*=8.8 Hz, 3H), 7.45-7.23 (m, 5H), 4.80 (s, 5H), 3.93 (s, 2H), 2.65-2.51 (m, 7.5H), 2.34 (s, 5H), 2.15 (s, 4H); MS (ESI(+)) *m/e* 419 (M+H)⁺。

實例 755

N-[4-(5-{[(3-甲基丁基)胺基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 753B 中所述，用 3-甲基丁-1-胺代替嗎啉製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.68 (s, 1H), 7.91 (d, *J*=8.8 Hz, 2H), 7.79 (d, *J*=8.8 Hz, 2H), 7.35 (tdd, *J*=8.9, 5.4, 3.4 Hz, 4H), 4.80 (s, 4H), 4.02 (s, 2H), 2.66-2.53 (m, 1H), 2.43-2.30 (m, 1H), 1.63 (dt, *J*=13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.32 (dd, *J*=14.4, 7.0 Hz, 2H), 0.86 (d, *J*=6.5 Hz, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 406 (M+H)⁺。

實例 756

N-(4-{5-[(4-羥基哌啶-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 753B 中所述，用哌啶-4-醇代替嗎啉製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.68 (s, 1H), 7.91 (d, *J*=8.8 Hz, 2H), 7.79 (d, *J*=8.8 Hz, 2H), 7.45-7.25 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 4.56 (d, *J*=4.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 2H), 3.45 (dd, *J*=8.7, 4.3 Hz, 1H), 3.17 (d, *J*=5.2 Hz, 1H), 2.76 (dd, *J*=10.6, 5.0 Hz, 2H), 2.42-2.18 (m, 3H), 1.72 (d, *J*=8.9 Hz, 2H), 1.43 (dt, *J*=18.5, 6.4 Hz, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 420 (M+H)⁺。

實例 787

N-[4-(2-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-2-側氧基乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 787A

N-苯甲基-N-(3-嗎啉基丙基)-2-(4-硝基苯基)乙醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-苯甲基-3-嗎啉基丙-1-胺代替 3-苯基丙-1-胺及 2-(4-硝基苯基)乙酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例 787B

2-(4-胺基苯基)-N-苯甲基-N-(3-嗎啉基丙基)乙醯胺

標題化合物如實例 272A 中所述，用 N-苯甲基-N-(3-嗎啉基丙基)-2-(4-硝基苯基)乙醯胺代替 4-硝基-N-丙基苯甲醯胺製備。

實例 787C

N-[4-(2-{ 苯 甲 基 [3-(嗎 啉 -4-基)丙 基]胺 基 }-2-側 氧 基 乙 基) 苯 基]-1,3-二 氫 -2H-異 吲 哚 -2-甲 醯 胺

標 題 化 合 物 如 實 例 272B 中 所 述， 用 2-(4-胺 基 苯 基)-N-苯 甲 基 -N-(3-嗎 啉 基 丙 基)乙 醯 胺 代 替 4-胺 基 -N-丙 基 苯 甲 醯 胺 及 異 吲 哚 啉 代 替 異 吲 哚 啉 -5-甲 酸 甲 酯 鹽 酸 鹽 製 備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆, 溫 度 =90°C) δ ppm 8.05 (bs, 1H), 7.47 (d, *J*=8.5 Hz, 2H), 7.37-7.17 (m, 9H), 7.15-7.08 (m, 2H), 4.76 (s, 4H), 4.56 (bs, 2H), 3.77-3.55 (m, 2H), 3.56-3.50 (m, 4H), 3.30 (t, *J*=7.3 Hz, 2H), 2.33-2.24 (m, 4H), 2.21 (t, *J*=6.8 Hz, 2H), 1.60 (p, *J*=7.1 Hz, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 513 (M+H)⁺。

實例 788

N-[4-(3-{ 苯 甲 基 [3-(嗎 啉 -4-基)丙 基]胺 基 }-3-側 氧 基 丙 基) 苯 基]-1,3-二 氫 -2H-異 吲 哚 -2-甲 醯 胺

標 題 化 合 物 如 實 例 787 中 所 述， 在 實 例 787A 中 用 3-(4-硝 基 苯 基)丙 酸 代 替 2-(4-硝 基 苯 基)乙 酸 製 備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆, 溫 度 =90°C) δ ppm 7.99 (bs, 1H), 7.48-7.39 (m, 2H), 7.37-7.19 (m, 7H), 7.19-7.13 (m, 2H), 7.13-7.00 (m, 2H), 4.76 (s, 4H), 4.53 (s, 2H), 3.56-3.45 (m, 4H), 3.31-3.23 (m, 2H), 2.87-2.78 (m, 2H), 2.72-2.57 (m, 2H), 2.29-2.22 (m, 4H), 2.20 (t, *J*=6.8 Hz, 2H), 1.63-1.54 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 527 (M+H)⁺。

實例 795

N-{6-[(四氫-2H-嘧喃-4-基甲基)胺甲鹽基]噻嗪-3-基}-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用四氫-2H-嘧喃-4-基甲
胺代替 3-苯基丙-1-胺及 6-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)噻嗪-3-甲
酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)苯甲酸製備。¹H NMR
(300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 9.98 (s, 1H), 9.03 (t, *J*=6.2 Hz,
1H), 8.31 (d, *J*=9.3 Hz, 1H), 8.10 (d, *J*=9.3 Hz, 1H), 7.41-
7.28 (m, 4H), 5.03-4.67 (m, 4H), 3.89-3.79 (m, 2H), 3.29-
3.11 (m, 4H), 2.01-1.78 (m, 1H), 1.63-1.53 (m, 2H), 1.30-
1.12 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 382 (M+H)⁺。

實例 797

N-[4-(6-溴-2-側氧基喹啉-1(2H)-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺

實例 797A

4-(6-溴-2-側氧基喹啉-1(2H)-基)丁基胺基甲酸第三丁酯

向 6-溴喹啉-2(1H)-酮 (430 mg, 1.91 mmol) 於四氫呋喃 (8
ml) 中之溶液中添加雙(三甲基矽烷基)胺基鈉 (2.1 ml, 2.08
mmol)。15 分鐘後，添加 4-(*boc*-胺基)丁基溴 (403 mg, 1.6
mmol)。溶液攪拌 15 小時，濃縮且藉由急驟層析純化，得
到標題化合物。

實例 797B

1-(4-胺基丁基)-6-溴喹啉-2(1H)-酮

標題化合物如實例 2D 中所述，用 4-(6-溴-2-側氧基喹啉-
1(2H)-基)丁基胺基甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟異吲哚啉-

N-(4-{[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丙醯基氮雜環丁烷-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-乙基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(戊-4-炔醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-3-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(噻吩-3-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1H-吡咯-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嘧啶-4-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(5-甲基吡嗪-2-基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(N,N-二甲基甘胺醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 797C

N-[4-(6-溴-2-側氧基喹啉-1(2H)-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用 1-(4-胺基丁基)-6-溴喹啉-2(1H)-酮代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7.67 (d, *J*=2.2 Hz, 2 H), 7.61 (d, *J*=2.3 Hz, 1 H), 7.60 (d, *J*=2.3 Hz, 1 H), 7.57 (d, *J*=9.6 Hz, 2 H), 7.28 (s, 1 H), 7.24 (s, 1 H), 6.70 (d, *J*=9.5 Hz, 2 H), 4.76 (t, *J*=5.7 Hz, 2 H), 4.70 (s, 4 H), 4.29 (m, 2 H), 3.42 (m, 2 H), 1.79 (m, 2H), 1.69 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 440.1 (M+H)。

實例 798

N-{4-[6-(3-乙醯基苯基)-2-側氧基喹啉-1(2H)-基]丁基}-
 1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 3-乙醯基苯基醯酸代替 1H-吡啶-3-基醯酸及 N-[4-(6-溴-2-側氧基喹啉-1(2H)-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.20 (t, *J*=1.5 Hz, 1 H), 7.94 (d, *J*=7.7 Hz, 1 H), 7.80 (m, 3 H), 7.75 (d, *J*=9.5 Hz, 2 H), 7.56 (t, *J*=7.7 Hz, 1 H), 7.49 (d, *J*=9.4 Hz, 2 H), 7.24 (s, 1H), 6.75

(t, $J=9.4$ Hz, 2 H), 4.82 (t, $J=5.4$ Hz, 1 H), 4.72 (s, 4H), 4.37 (m, 2H), 3.45 (m, 2H), 2.66 (s, 3H), 1.88 (m, 2H), 1.74 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 480.3 (M+H)。

實例 804

5-(羥基甲基)-N-(3-苯基丙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用 3-苯基丙-1-胺代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉-5-基甲醇鹽酸鹽代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。 ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 7.30-7.14 (m, 8H), 6.30 (t, $J=5.5$ Hz, 1H), 5.16 (t, $J=5.5$ Hz, 1H), 4.55 (bs, 4H), 4.49 (d, $J=4.9$ Hz, 2H), 3.16-3.05 (m, 2H), 2.64-2.56 (m, 2H), 1.76 (p, $J=7.4$ Hz, 2H); MS (ESI(+)) m/e 311 (M+H) $^+$ 。

實例 805

N-(2-((4-氟苯基)[4-(吡啶-3-基)苯基]胺基)-1,3-噻唑-5-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

實例 805A

2-(4-(吡啶-3-基)苯基胺基)噻唑-5-甲酸甲酯

向 250 mL 圓底燒瓶中添加含 4-(吡啶-3-基)苯甲醛 (4 g, 21.83 mmol)、2-胺基噻唑-5-甲酸甲酯 (3.45 g, 21.83 mmol) 及乙酸 (0.375 mL, 6.55 mmol) 之甲苯 (109 mL)。混合物在迪恩-斯托克條件 (Dean-Stark condition) 下回流加熱 3 小時，冷卻，濃縮及再溶於甲醇中。混合物冷卻至 0°C 且小心添加硼氫化鈉 (1.322 g, 34.9 mmol)。混合物升溫至室溫且所得懸浮液藉由水洗過濾，乾燥後得到標題化合物。

實例 805B

2-((4-氟苯基)(4-(吡啶-3-基)苯基)胺基)噻唑-5-甲酸

向 250 mL 圓底燒瓶中添加含 2-(4-(吡啶-3-基)苯基胺基)噻唑-5-甲酸甲酯 (3 g, 9.22 mmol) 及 1-(溴甲基)-4-氟苯 (1.264 ml, 10.14 mmol) 之二甲基甲醯胺 (46.1 ml)。混合物冷卻至 0°C，小心添加氫化鈉 (0.738 g, 18.44 mmol)；且混合物升溫至室溫。混合物攪拌約 30 分鐘後，發現其主要為甲酸。添加 1 N NaOH，以完成轉化；且進行水處理，接著層析，得到標題化合物。

實例 805C

N-(4-氟苯基)-5-異氰酸酯基-N-(4-(吡啶-3-基)苯基)噻唑-2-胺

向 50 mL 圓底燒瓶中添加含 2-((4-氟苯基)(4-(吡啶-3-基)苯基)胺基)噻唑-5-甲酸 (850 mg, 2.026 mmol) 之二氯甲烷 (10.100 ml) 且溶液冷卻至 0°C。添加乙二醯氯 (0.266 ml, 3.04 mmol) 及二甲基甲醯胺 (0.016 ml, 0.203 mmol) 且有一些起泡。溶液升溫至室溫且攪拌 1 小時。混合物冷卻至 0°C 且添加疊氮三甲基矽烷 (0.538 ml, 4.05 mmol)。混合物升溫至室溫，攪拌 30 分鐘且真空濃縮。添加甲苯 (5 ml) 且混合物加熱至 95°C，保持 2.5 小時。移除甲苯且所得固體用乙醚濕磨/音波處理且藉由乙醚洗滌過濾，得到標題化合物。

實例 805D

N-(2-((4-氟苯基)[4-(吡啶-3-基)苯基]胺基)-1,3-噻唑-

5-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1A中所述，用N-(4-氟苯基)-5-異氰酸酯基-N-(4-(吡啶-3-基)苯基)噻唑-2-胺代替4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯及1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶代替異吲哚啉製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.27 (s, 1H), 8.99 (d, *J*=2.1 Hz, 1H), 8.76 (s, 1H), 8.71-8.56 (m, 2H), 8.29 (d, *J*=7.8 Hz, 1H), 7.81-7.56 (m, 5H), 7.51-7.27 (m, 5H), 7.27-7.06 (m, 2H), 6.86 (s, 1H), 4.80 (d, *J*=3.6 Hz, 4H), 4.72 (d, *J*=7.7 Hz, 4H); MS (ESI(+)) *m/e* 537 (M+H)⁺。

實例 806

N-[4-(2-苯基-1,3-噻唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 806A

4-(2-苯基噻唑-4-基)苯胺

2-溴-1-(4-硝基苯基)乙酮(0.5 g, 2.049 mmol)及2-苯基硫代乙醯胺(0.310 g, 2.049 mmol)組合於20 mL微波反應容器中乙醇(10 mL)中且在140°C下加熱15分鐘。溶液轉移至250 mL圓底燒瓶中，在其中立即固化。物質用另外乙醇(10 mL)稀釋且在攪拌下回流加熱，直至固體溶解。添加水(5.0 mL, 278 mmol)及鹽酸(1 mL, 12.00 mmol)。添加鐵(0.625 g, 11.19 mmol)且混合物在回流下加熱2小時。混合物冷卻且添加5 mL NH₄OH。物質經由矽藻土墊過濾且墊用50 mL乙酸乙酯洗滌。濾液用100 mL水洗滌且水相用另

外 50 mL 乙酸乙酯萃取。合併之有機溶離份經硫酸鈉乾燥，過濾且溶劑在減壓下移除。物質再溶於 50 mL 乙酸乙酯中且經由 1/4 吋矽膠墊過濾。墊用另外 50 mL 乙酸乙酯洗滌且濃縮合併之濾液，得到標題化合物。

實例 806B

N-[4-(2-苯甲基-1,3-噻唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-(2-苯甲基噻唑-4-基)苯胺代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7.79 (d, *J*=8.7 Hz, 2 H), 7.48 (d, *J*=8.7 Hz, 2 H), 7.30 (s, 1H), 7.29 (d, *J*=3.8 Hz, 2 H), 7.26 (m, 5H), 7.20 (d, *J*=3.7 Hz, 2 H), 6.29 (s, 1H), 4.80 (s, 4 H), 4.32 (s, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 412 (M+H)。

實例 807

N-(7-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-7-側氧基庚基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-苯甲基-3-嗎啉基丙-1-胺代替 3-苯基丙-1-胺及 7-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)庚酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 7.41-7.13 (m, 9H), 6.32-6.22 (m, 1H), 4.59-4.48 (m, 6H), 3.58-3.47 (m, 4H), 3.27-3.20 (m, 2H), 3.11-2.98 (m, 2H), 2.44-2.36 (m, 1H), 2.31-2.23 (m, 5H), 2.23-2.12 (m, 2H), 1.70-1.17 (m, 10H); MS (ESI(+))

m/e 507 ($M+H$)⁺。

實例 808

N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 808A

N-異戊基-4-硝基苯磺醯胺

4-硝基苯-1-磺醯氯 (1.5 g, 6.57 mmol) 溶於二氯甲烷 (30 ml) 中且冷卻至 0°C，接著添加二異丙基乙胺 (2.293 ml, 13.13 mmol)。3-甲基丁-1-胺 (0.926 ml, 7.88 mmol) 溶於 5 ml 二氯甲烷中且經由注射器添加。添加後，混合物升溫至室溫，保持 3 小時。溶液用碳酸氫鈉水溶液稀釋且用二氯甲烷萃取兩次。有機物合併，經硫酸鎂乾燥，過濾且濃縮。層析得到標題化合物。

實例 808B

4-胺基-N-異戊基苯磺醯胺

標題化合物如實例 272A 中所述，用 N-異戊基-4-硝基苯磺醯胺代替 4-硝基-N-丙基苯甲醯胺製備。

實例 808C

N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-胺基-N-異戊基苯磺醯胺代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.75 (s, 1H), 7.82-7.74 (m, 2H), 7.70-7.64 (m,

2H), 7.41-7.27 (m, 5H), 4.80 (s, 4H), 2.77-2.67 (m, 2H), 1.64-1.47 (m, 1H), 1.30-1.19 (m, 2H), 0.79 (d, $J=6.6$ Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 388 ($M+H$)⁺。

實例 839

N-(5-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}吡啶-2-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 (S)-(四氫呋喃-3-基)甲基胺基甲酸苯甲酯代替 3-苯基丙-1-胺及 6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)菸鹼酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, $J=2.1$ Hz, 1H), 8.60 (t, $J=5.7$ Hz, 1H), 8.14 (dd, $J=8.8, 2.4$ Hz, 1H), 8.00 (d, $J=8.7$ Hz, 1H), 7.41-7.27 (m, 4H), 4.89 (m, 4H), 3.75 (m, 1H), 3.69 (m, 1H), 3.62 (m, 1H), 3.48 (dd, $J=8.5, 5.3$ Hz, 1H), 3.25 (m, 2H), 2.48 (m, 1H), 1.95 (m, 1H), 1.61 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 367 ($M+H$)。

實例 871

N-[4-(4-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-4-側氧基丁基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 787 中所述，在實例 787A 中用 3-(4-硝基苯基)丁酸代替 2-(4-硝基苯基)乙酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.29-8.21 (m, 1H), 7.51-7.41 (m, 2H), 7.40-7.13 (m, 9H), 7.11-6.98 (m, 2H), 4.75 (s, 4H), 4.57-4.47 (m, 2H), 3.60-3.44 (m, 4H), 3.27-3.13 (m, 2H), 2.60-2.53 (m, 1H), 2.48-2.34 (m, 2H), 2.33-2.11 (m, 7H),

1.90-1.71 (m, 2H), 1.66-1.51 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 541 (M+H)⁺。

實例 872

N-(4-苯基丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺
標題化合物如實例 1A 中所述，用(4-異氰酸酯基丁基)苯代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯及 1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶代替異吲哚啉製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.55 (s, 1H), 8.46 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 7.38 (d, *J*=5.1 Hz, 1H), 7.32-7.22 (m, 2H), 7.23-7.11 (m, 3H), 6.38 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 4.63-4.57 (m, 4H), 3.10-3.07 (m, 2H), 2.59 (t, *J*=7.5 Hz, 2H), 1.66-1.39 (m, 4H); MS (ESI(+)) m/e 296 (M+H)⁺。

實例 873

N-[4-(2-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 873A

N-苯甲基-3-嗎啉基-N-(4-硝基苯乙基)丙-1-胺

1-(2-溴乙基)-4-硝基苯(0.314 g, 1.366 mmol)、N-苯甲基-3-嗎啉基丙-1-胺(0.128 g, 0.546 mmol)及碳酸鉀(0.189 g, 1.366 mmol)於二甲基甲醯胺(1.821 ml)中之懸浮液在 65°C 下加熱 20 小時。反應物分配於乙酸乙酯與水中。有機層用鹽水洗滌，經無水硫酸鈉乾燥，過濾且濃縮。濃縮物藉由急驟層析純化，得到標題化合物。

實例 873B

4-(2-(苯甲基(3-嗎啉基丙基)胺基)乙基)苯胺

標題化合物如實例272A中所述，用N-苯甲基-3-嗎啉基-N-(4-硝基苯乙基)丙-1-胺代替4-硝基-N-丙基苯甲醯胺製備。

實例873C

N-[4-(2-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例272B中所述，用4-(2-(苯甲基(3-嗎啉基丙基)胺基)乙基)苯胺代替4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.24 (s, 1H), 7.43 (d, *J*=8.5 Hz, 2H), 7.38-7.18 (m, 9H), 7.04 (d, *J*=8.5 Hz, 2H), 4.75 (s, 4H), 3.60 (s, 2H), 3.54-3.47 (m, 4H), 2.70-2.54 (m, 4H), 2.48-2.41 (m, 2H), 2.29-2.16 (m, 6H), 1.62-1.46 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 499 (M+H)⁺。

實例876

5-氟基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例272B中所述，用4-胺基-N-異戊基苯磺醯胺代替4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉-5-甲腈代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.82 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.83-7.74 (m, 3H), 7.71-7.64 (m, 2H), 7.59 (d, *J*=7.9 Hz, 1H), 7.31 (t, *J*=5.8 Hz, 1H), 4.89-4.81 (m, 4H), 2.78-2.67 (m, 2H), 1.56

(dp, $J=13.3, 6.7$ Hz, 1H), 1.30-1.19 (m, 2H), 0.78 (d, $J=6.6$ Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 413 ($M+H$)⁺。

實例 877

N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-胺基-N-異戊基苯磺醯胺代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及 1,3-二氫-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.82 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.51 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.81-7.74 (m, 2H), 7.71-7.64 (m, 2H), 7.44 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.32 (t, $J=5.8$ Hz, 1H), 4.87-4.80 (m, 4H), 2.78-2.67 (m, 2H), 1.56 (dp, $J=13.3, 6.7$ Hz, 1H), 1.30-1.13 (m, 2H), 0.78 (d, $J=6.6$ Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 389 ($M+H$)⁺。

實例 883

N-(4-{[(3-甲氧基苯基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺 (0.0585 g, 0.231 mmol) 懸浮於二氯甲烷 (2 ml) 中，接著添加三異丙基乙胺 (0.081 ml, 0.462 mmol)。(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯 (0.061 g, 0.277 mmol) 溶於 1 ml 二氯甲烷中且經由注射器緩慢添加至混合物中。混合物用水淬滅且分離之水層用二氯甲烷萃取。合併之有機層經硫酸鎂乾燥，過濾且濃縮。進行逆相 HPLC，得到標題化合物。¹H NMR (300 MHz,

N-(4-{[1-(N,N-二甲基-β-丙胺鹽基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(吡咯啉-1-基乙鹽基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({1-[3-(吡咯啉-1-基)丙鹽基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({1-[3-(哌啶-1-基)丙鹽基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙鹽基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({1-[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙鹽基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(2-環丙基乙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(2-環戊基乙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(3,3-二甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(環己基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

DMSO- d_6) δ ppm 8.65 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.34 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.80-7.73 (m, 2H), 7.69-7.61 (m, 2H), 7.44 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 4.86-4.79 (m, 4H), 3.20 (t, $J=6.2$ Hz, 2H), 2.46-2.25 (m, 3H), 2.20 (d, $J=7.9$ Hz, 3H), 2.06-1.78 (m, 1H), 1.52-1.37 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 438 ($M+H$)⁺。

實例 909

N-{4-[6-(3-乙醯基苯基)-4-(3-羥基丙基)-2-側氧基喹啉-1(2H)-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 909A

6-溴-4-(3-(第三丁基二苯基矽烷基氧基)丙基)喹啉-2(1H)-酮

在室溫下 6-溴-4-(3-羥基丙基)喹啉-2(1H)-酮 (4.7 g, 16.67 毫莫耳)、咪唑 (2.84 g, 41.7 毫莫耳) 及氯化第三丁基二苯基矽烷 (5.14 mL, 20 毫莫耳) 於二甲基甲醯胺 (60 mL) 中攪拌隔夜。反應混合物傾倒至水中且用乙酸乙酯萃取兩次。有機層合併，經硫酸鎂乾燥，過濾且濃縮。粗產物藉由正相層析純化，得到標題化合物。

實例 909B

4-(6-溴-4-(3-(第三丁基二苯基矽烷基氧基)丙基)-2-側氧基喹啉-1(2H)-基)丁基胺基甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 797A 中所述，用 6-溴-4-(3-(第三丁基二苯基矽烷基氧基)丙基)喹啉-2(1H)-酮 代替 6-溴喹啉-2(1H)-酮 製備。

實例 909C

1-(4-胺基丁基)-6-溴-4-(3-(第三丁基二苯基矽烷基氧基)丙基)喹啉-2(1H)-酮

標題化合物如實例 2D 中所述，用 4-(6-溴-4-(3-(第三丁基二苯基矽烷基氧基)丙基)-2-側氧基喹啉-1(2H)-基)丁基胺基甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 909D

N-(4-(6-溴-4-(3-羥基丙基)-2-側氧基喹啉-1(2H)-基)丁基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用 1-(4-胺基丁基)-6-溴-4-(3-(第三丁基二苯基矽烷基氧基)丙基)喹啉-2(1H)-酮代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽，接著用 TBAF 脫除保護基及處理來製備。

實例 909E

N-{4-[6-(3-乙醯基苯基)-4-(3-羥基丙基)-2-側氧基喹啉-1(2H)-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 280 中所述，用 3-乙醯基苯基醯酸代替 1H-吡啶-3-基醯酸及 N-(4-(6-溴-4-(3-羥基丙基)-2-側氧基喹啉-1(2H)-基)丁基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 5-溴-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.24 (s, 1H), 8.08 (d, *J*=2.0 Hz, 1H), 7.96 (d, *J*=7.9 Hz, 1H), 7.87-7.79 (m, 2H), 7.58 (t, *J*=7.7 Hz, 1H), 7.54 (d, *J*=8.8 Hz, 1H), 7.28 (s, 4H), 6.71 (s, 1H),

4.74 (s, 4H), 4.41 (t, $J=7.4$ Hz, 2H), 3.82 (t, $J=6.0$ Hz, 2H), 3.46 (t, $J=6.7$ Hz, 2H), 3.12-2.99 (m, 2H), 2.68 (s, 3H), 2.10-1.96 (m, 2H), 1.96-1.83 (m, 2H), 1.79-1.72 (m, 2H); MS (APCI(+)) m/e 538 (M+H)。

實例 910

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

實例 910A

N-(4-(哌啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺
含 N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺 (2.0 g, 6.24 mmol) 之 80 mL 1:1 THF: 甲醇添加至 250 mL 不鏽鋼耐壓瓶中 5% Pd/碳(濕)(0.500 g) 中且混合物在 30 atm 及 25°C 下攪拌 38 小時。混合物經由耐綸膜過濾，濃縮且懸浮於乙醚中。藉由乙醚洗滌過濾，得到標題化合物。

實例 910B

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(哌啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及四氫呋喃-3-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.46 (m, 2H), 7.43 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.14 (m, 2H), 4.79 (m, 4H), 4.54 (m, 1H),

4.07 (m, 1H), 3.88 (dt, $J=10.4$, 8.1 Hz, 1H), 3.71 (m, 3H), 3.37 (m, 1H), 3.13 (m, 1H), 2.64-2.59 (m, 2H), 2.01 (m, 2H), 1.79 (m, 2H), 1.46 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 421 (M+H)。

表 15.

以下實例基本上如實例 1C 中所述，用 N-(4-(哌啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及適當羧酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例	名稱	^1H NMR	MS
911	N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.62 (m, 1H), 8.51 (d, $J=7.4$ Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.45 (m, 3H), 7.13 (d, $J=8.6$ Hz, 2H), 4.83 (m, 4H), 4.48 (m, 1H), 4.17 (m, 2H), 3.89 (m, 1H), 3.60 (m, 2H), 3.46 (m, 2H), 3.26 (s, 3H), 3.07 (m, 1H), 2.78-2.56 (m, 2H), 1.74 (m, 2H), 1.57 (m, 1H), 1.42 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 439 (M+H) $^+$
912	N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.48 (s, 2H), 7.43 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.13 (m, 2H), 4.79 (m, 4H), 4.68 (dd, $J=7.6$, 5.7 Hz, 1H), 4.49 (m, 1H), 4.11 (m, 1H), 3.78 (m, 2H), 3.10 (m, 1H), 2.79-2.57 (m, 2H), 2.03 (m, 2H), 1.84 (m, 4H), 1.61-1.36 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) $^+$
913	N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.46 (m, 2H), 7.43 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.13 (m, 2H), 4.79 (m, 4H), 4.55 (m, 1H), 4.09 (m, 1H), 3.85 (m, 2H), 3.41 (m, 2H), 3.10 (m, 1H), 2.91 (m, 1H), 2.71 (m, 1H), 2.58 (m, 1H), 1.79 (m, 2H), 1.68-1.33 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) $^+$
914	N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.45 (m, 3H), 7.13 (s, 2H), 4.79 (d, $J=7.1$ Hz, 4H), 4.45 (m, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.07 (m, 1H), 3.80-3.55 (m, 5H), 3.50 (m, 1H), 3.09 (m, 1H), 2.65 (m, 2H), 1.79 (m, 2H), 1.67-1.29 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) $^+$
915	N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]哌	^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.43 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.12 (m, 2H),	(ESI(+)) m/e 434 (M+H) $^+$

	啉-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	4.79 (m, 4H), 4.49 (m, 1H), 4.16 (m, 1H), 3.58 (m, 4H), 3.26 (m, 1H), 3.06 (m, 2H), 2.71 (m, 1H), 2.61 (m, 1H), 2.39 (m, 4H), 1.78 (m, 2H), 1.57 (m, 1H), 1.40 (m, 1H)	
916	N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.14 (m, 2H), 4.79 (m, 4H), 4.53 (m, 1H), 4.08 (m, 1H), 3.73 (m, 1H), 3.26-3.04 (m, 5H), 2.69 (m, 2H), 2.35 (m, 1H), 2.07 (m, 1H), 1.81 (m, 2H), 1.51 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 469 (M+H) ⁺
917	N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.45 (m, 3H), 7.13 (m, 2H), 5.38 (s, 1H), 4.75 (m, 4H), 4.60 (m, 2H), 2.95 (m, 1H), 2.80 (m, 2H), 1.77 (m, 2H), 1.48 (m, 2H), 1.34 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺
918	N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.12 (m, 2H), 4.79 (m, 4H), 4.49 (m, 1H), 4.16 (m, 1H), 3.58 (m, 4H), 3.26 (m, 1H), 3.06 (m, 2H), 2.71 (m, 1H), 2.61 (m, 1H), 2.39 (m, 4H), 1.78 (m, 2H), 1.57 (m, 1H), 1.40 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 450 (M+H) ⁺
1279	N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.46 (m, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.13 (m, 2H), 4.79 (m, 4H), 4.68 (dd, <i>J</i> =7.4, 5.8 Hz, 1H), 4.49 (d, <i>J</i> =12.8 Hz, 1H), 4.10 (m, 1H), 3.78 (m, 2H), 3.08 (m, 1H), 2.78-2.57 (m, 2H), 2.04 (m, 2H), 1.90-1.71 (m, 4H), 1.61-1.32 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
1280	N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.49-7.40 (m, 3H), 7.14 (m, 2H), 4.79 (m, 4H), 4.54 (m, 1H), 4.06 (m, 1H), 3.88 (dt, <i>J</i> =10.4, 8.1 Hz, 1H), 3.78-3.54 (m, 3H), 3.38 (m, 1H), 3.15 (m, 1H), 2.77-2.56 (m, 2H), 2.04 (m, 2H), 1.79 (m, 2H), 1.59-1.29 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
1384	N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.45 (m, 3H), 7.13 (m, 2H), 4.79 (m, 4H), 4.68 (dd, <i>J</i> =7.4, 5.8 Hz, 1H), 4.48 (d, <i>J</i> =12.7 Hz, 1H), 4.10 (d, <i>J</i> =12.8 Hz, 1H), 3.78 (m, 2H), 3.08 (dd, <i>J</i> =26.0, 12.3 Hz, 1H), 2.77-2.55 (m, 2H), 2.04 (m, 2H), 1.83 (m, 4H), 1.62-1.32 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
1385	N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.45 (m, 3H), 7.14 (m, 2H), 4.79 (m, 4H), 4.54 (m, 1H), 4.07 (m, 1H), 3.88 (dt, <i>J</i> =10.4, 8.1 Hz, 1H), 3.71 (m, 3H), 3.37 (m, 1H), 3.10 (m, 1H), 2.80-2.55 (m, 2H), 2.00 (m, 2H), 1.79 (m, 2H), 1.59-1.33 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺

實例 920

N-{5-[2-(2-氯苯基)-1,3-噻唑-4-基]-2-噻吩基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 920A

5-(2-(2-氯苯基)噻唑-4-基)噻吩-2-胺

標題化合物如實例 806A 中所述，用 2-溴-1-(5-硝基噻吩-2-基)乙酮代替 2-溴-1-(4-硝基苯基)乙酮及 2-(2-氯苯基)硫代乙醯胺代替 2-苯基硫代乙醯胺製備。

實例 920B

N-{5-[2-(2-氯苯基)-1,3-噻唑-4-基]-2-噻吩基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用 5-(2-(2-氯苯基)噻唑-4-基)噻吩-2-胺代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.73 (s, 1H), 7.46-7.55 (m, 3 H), 7.34-7.40 (m, 4 H), 7.28-7.34 (m, 2 H), 7.20 (d, *J*=3.9 Hz, 1H), 6.62 (d, *J*=3.9 Hz, 1H), 4.76 (s, 4 H), 4.45 (s, 2 H); MS (ESI(+)) *m/e* 452.0 (M+H)。

實例 921

N-[4-(4-氟苯基)丁基]-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-
2-甲醯胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-(4-氟苯基)丁胺代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉-5-基甲醇鹽酸鹽代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz,

DMSO- d_6) δ ppm 7.28-7.17 (m, 5H), 7.13-7.03 (m, 2H), 6.29 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 5.16 (t, $J=5.6$ Hz, 1H), 4.54 (bs, 4H), 4.49 (d, $J=5.5$ Hz, 2H), 3.15-3.04 (m, 2H), 2.58 (t, $J=7.4$ Hz, 2H), 1.63-1.37 (m, 4H); MS (ESI(+)) m/e 343 (M+H)⁺。

實例 926

N-[4-(1-異丁基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

在 20 mL 閃爍小瓶中，N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺(100 mg, 0.312 mmol)、異丁醛(0.343 mmol)及三乙醯氧基硼氫化鈉(0.43 mmol)混合於無水二氯乙烷(4 ml)中。反應混合物在室溫下攪拌隔夜。此混合物用水稀釋且所得懸浮液在室溫下再攪拌隔夜。固體經由 30 mL 塑膠拋棄式布氏漏斗(Buchner funnel)過濾且收集之固體用水洗滌，乾燥 2 小時，用乙醚洗滌並再次乾燥，得到標題化合物。¹H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 , 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.47 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.18 (m, 1H), 7.50 (m, 2H), 7.38 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.30 (m, 2H), 6.03 (m, 1H), 4.80 (m, 4H), 3.06 (m, 2H), 2.61 (t, $J=5.6$ Hz, 2H), 2.44 (m, 2H), 2.17 (d, $J=7.2$ Hz, 2H), 1.82 (m, 1H), 0.89 (d, $J=6.6$ Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 377 (M+H)。

實例 927

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯

基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 926 中所述，用四氫呋喃-3-甲醛代替異丁醛製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.17 (bs, 1H), 7.60 (m, 2H), 7.38 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 7.30 (m, 2H), 6.05 (m, 1H), 4.83 (m, 4H), 3.77 (m, 2H), 3.62 (q, *J*=7.6 Hz, 1H), 3.39 (m, 1H), 3.10 (t, *J*=3.1 Hz, 2H), 2.95 (m, 1H), 2.65 (m, 2H), 2.43 (m, 2H), 2.38 (m, 2H), 1.95 (m, 1H), 1.54 (m, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 405 (M+H)。

實例 928

N-{4-[1-(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]

苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 926 中所述，用四氫-2H-呋喃-4-甲醛代替異丁醛製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.17 (bs, 1H), 7.50 (m, 2H), 7.38 (d, *J*=5.1 Hz, 1H), 7.30 (m, 2H), 6.03 (m, 1H), 4.79 (m, 4H), 3.83 (m, 2H), 3.31 (td, *J*=11.5, 2.2 Hz, 2H), 3.07 (m, 2H), 2.63 (t, *J*=5.6 Hz, 2H), 2.43 (m, 2H), 2.27 (d, *J*=7.1 Hz, 2H), 1.80 (m, 1H), 1.64 (m, 2H), 1.17 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 419 (M+H)。

實例 929

N-[4-(1-異丁基吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 926 中所述，用 N-(4-(吡啶-4-基)苯

基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.43 (m, 3H), 7.13 (m, 2H), 4.79 (m, 4H), 2.41 (m, 1H), 2.92 (m, 2H), 2.15-1.85 (m, 4H), 1.85-1.50 (m, 5H), 0.87 (d, *J*=6.5 Hz, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 379 (M+H)。

實例 930

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 926 中所述，用 N-(4-(哌啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺及四氫呋喃-3-甲醛代替異丁醛製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.44 (m, 3H), 7.13 (m, 2H), 4.78 (m, 4H), 3.71 (m, 2H), 3.61 (q, *J*=7.6 Hz, 1H), 3.36 (m, 2H), 2.96 (m, 2H), 2.40 (m, 1H), 2.27 (m, 2H), 96 (m, 3H), 1.72 (m, 2H), 1.66-1.46 (m, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 407 (M+H)。

實例 931

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 926 中所述，用 N-(4-(哌啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-(1,2,3,6-

四氫吡啶-4-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺及四氫-2H-哌喃-4-甲醛代替異丁醛製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.44 (m, 3H), 7.12 (m, 2H), 4.79 (m, 4H), 3.83 (m, 2H), 3.27 (m, 2H), 2.92 (m, 2H), 2.40 (m, 1H), 2.14 (d, *J*=7.2 Hz, 2H), 1.95 (m, 2H), 1.74 (m, 3H), 1.61 (m, 4H), 1.12 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 421 (M+H)。

實例 933

{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲基}胺基甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-胺基苯甲基胺基甲酸第三丁酯代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.29 (s, 1H), 7.52-7.45 (m, 2H), 7.40-7.24 (m, 5H), 7.15-7.08 (m, 2H), 4.76 (bs, 4H), 4.09-3.99 (m, 2H), 1.39 (s, 9H); MS (ESI(+)) *m/e* 368 (M+H)⁺。

實例 934

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

實例 934A

N-(4-硝基苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺

標題化合物如實例 1A 中所述，用 1-異氰酸酯基-4-硝基苯代替 4-異氰酸酯基苯甲酸甲酯及 1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶代替異吲哚啉製備。

N-(4-{[1-(3-甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丁基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(苯基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-氟苯基)磺醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丙-2-基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(苯甲基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

實例 934B

N-(4-胺基苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺

標題化合物如實例 272A 中所述，用 N-(4-硝基苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 4-硝基-N-丙基苯甲醯胺製備。

實例 934C

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-胺基苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及環戊基乙酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9.70 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.51-7.40 (m, 5H), 4.82-4.75 (m, 4H), 2.33-2.17 (m, 3H), 1.81-1.68 (m, 2H), 1.68-1.43 (m, 4H), 1.27-1.13 (m, 2H); (ESI(+)) *m/e* 365 (M+H)⁺。

實例 936

N-[4-(5-{[(四氫呋喃-2-基甲基)胺基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 753B 中所述，用(四氫呋喃-2-基)甲胺代替嗎啉製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.68 (s, 1H), 7.91 (d, *J*=8.7 Hz, 2H), 7.79 (d, *J*=8.8 Hz, 2H), 7.45-7.20 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 4.08 (s, 2H), 3.95-3.78 (m, 1H), 3.79-3.66 (m, 1H), 3.66-3.49 (m, 1H), 2.66 (d, *J*=5.6

Hz, 2H), 2.00-1.67 (m, 4H), 1.67-1.41 (m, 2H), 1.40-1.16 (m, 2H), 0.87 (dd, $J=9.3, 5.4$ Hz, 1H); MS (ESI(+)) m/e 420 ($M+H$)⁺。

實例 937

N-(4-{5-[(4-甲氧基哌啶-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 753B 中所述，用 4-甲氧基哌啶代替嗎啉製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.69 (s, 1H), 7.92 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.80 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.45-7.20 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 3.93 (s, 2H), 3.21 (s, 3H), 3.20-3.10 (m, 1H), 2.82-2.68 (m, 2H), 2.50 (dt, $J=3.6, 1.8$ Hz, 2H), 2.41-2.24 (m, 2H), 1.92-1.75 (m, 2H), 1.56-1.37 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 434 ($M+H$)⁺。

實例 938

N-[4-(5-{[4-(2-甲氧基乙基)哌嗪-1-基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 753B 中所述，用 N-(2-甲氧基乙基)哌嗪代替嗎啉製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.69 (s, 1H), 7.92 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.86-7.70 (m, 2H), 7.46-7.23 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 3.93 (s, 2H), 3.40 (t, $J=5.8$ Hz, 3H), 3.21 (s, 3H), 2.55 (s, 4H), 2.45 (t, $J=5.8$ Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 463 ($M+H$)⁺。

實例 940

N-{4-[(1-戊醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯

并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

實例 940A

4-(4-硝基苯氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

4-羥基-1-哌啶-1-甲酸第三丁酯(6.04 g, 30 mmol)溶於1-氟-4-硝基苯(7.83 g, 55.5 mmol)中。添加氫氧化鉀水溶液(25 wt%, 44 mL), 接著添加溴化四丁銨(1.26 g)。反應混合物在35°C下攪拌17小時。固體藉由過濾收集且用水(4×50 mL)洗滌, 真空乾燥後得到標題化合物。

實例 940B

4-(4-胺基苯氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 274 中所述, 用4-(4-硝基苯氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替5-硝基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺製備。

實例 940C

4-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 272B 中所述, 用4-(4-胺基苯氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。

實例 940D

N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺

標題化合物如實例 2D 中所述, 用4-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯

并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 940E

N-{4-[(1-戊醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及戊酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.80 (s, 1H), 8.68 (d, *J*=5.5 Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 7.77 (d, *J*=5.5 Hz, 1H), 7.42 (d, *J*=9.0 Hz, 1H), 6.95-6.87 (m, 2H), 4.87 (d, *J*=6.4 Hz, 4H), 4.64-4.45 (m, 1H), 3.92-3.79 (m, 1H), 3.76-3.63 (m, 1H), 3.38-3.15 (m, 2H), 2.31 (t, *J*=7.4 Hz, 2H), 1.96-1.81 (m, 2H), 1.61-1.41 (m, 4H), 1.38-1.22 (m, 2H), 0.88 (t, *J*=7.2 Hz, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 423 (M+H)⁺。

表 16.

以下實例基本上如實例 940 中所述，在實例 940A 中用適當醇代替 4-羥基-1-哌啶-1-甲酸第三丁酯及在實例 940E 中用適當羧酸代替來製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
941	N-{4-[(1-乙醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.83 (s, 1H), 8.71 (d, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.83 (d, <i>J</i> =5.6 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> =8.9 Hz, 2H), 6.91 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 4.89 (d, <i>J</i> =9.8 Hz, 4H), 4.57-4.44 (m, 1H), 3.91-3.76 (m, 1H), 3.76-3.57 (m, 1H), 3.43-3.12 (m, 2H), 2.02 (s, 3H), 1.97-1.77	(ESI(+)) <i>m/e</i> 381 (M+H) ⁺

		(m, 2H), 1.68-1.33 (m, 2H)	
942	N-{4-[(1-丁醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.43 (dd, <i>J</i> =7.0, 1.8 Hz, 3H), 6.90 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 4.78 (d, <i>J</i> =4.0 Hz, 4H), 4.57-4.39 (m, 1H), 3.95-3.76 (m, 1H), 3.70 (d, <i>J</i> =14.0 Hz, 1H), 3.23 (dd, <i>J</i> =15.9, 6.4 Hz, 1H), 2.30 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 2H), 1.90 (s, 2H), 1.51 (dq, <i>J</i> =14.6, 7.3 Hz, 4H), 0.89 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺
943	N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.79 (s, 1H), 8.67 (d, <i>J</i> =5.5 Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 7.76 (d, <i>J</i> =5.5 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 1H), 6.91 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 1H), 4.87 (d, <i>J</i> =5.8 Hz, 2H), 4.66-4.47 (m, 1H), 3.98-3.74 (m, 2H), 3.43-3.14 (m, 2H), 2.81-2.63 (m, 1H), 1.99-1.82 (m, 2H), 1.55 (dt, <i>J</i> =20.8, 7.2 Hz, 1H), 1.31 (td, <i>J</i> =13.9, 7.1 Hz, 1H), 0.98 (d, <i>J</i> =6.1 Hz, 3H), 0.81 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 1H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺
944	N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.80 (s, 1H), 8.68 (d, <i>J</i> =5.5 Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.78 (d, <i>J</i> =5.5 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> =8.9 Hz, 2H), 6.91 (d, <i>J</i> =8.9 Hz, 2H), 4.88 (d, <i>J</i> =7.3 Hz, 5H), 4.60-4.44 (m, 1H), 3.85 (dd, <i>J</i> =14.1, 5.4 Hz, 1H), 3.67 (q, <i>J</i> =11.0 Hz, 3H), 3.41-3.21 (m, 2H), 1.92 (dd, <i>J</i> =16.5, 13.5 Hz, 2H), 1.73-1.35 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 449 (M+H) ⁺
945	N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.43 (dd, <i>J</i> =6.9, 1.9 Hz, 3H), 6.90 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 4.78 (d, <i>J</i> =3.9 Hz, 5H), 4.51 (dd, <i>J</i> =7.8, 3.9 Hz, 1H), 4.09 (s, 2H), 3.89-3.74 (m, 1H), 3.62 (ddd, <i>J</i> =8.2, 4.1, 1.1 Hz, 1H), 3.29 (s, 3H), 1.91 (d, <i>J</i> =1.3 Hz, 2H), 1.69-1.39 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 411 (M+H) ⁺
946	N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.80 (s, 1H), 8.69 (d, <i>J</i> =5.5 Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 7.78 (d, <i>J</i> =5.5 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 6.91 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 4.88 (d, <i>J</i> =8.2 Hz, 4H), 4.76-4.62 (m, 1H), 4.52 (s, 1H), 3.75 (dd, <i>J</i> =12.0, 6.6 Hz, 5H), 3.48-3.14 (m, 2H), 1.91 (dddd, <i>J</i> =19.4, 15.1, 7.6, 5.2 Hz, 6H), 1.51 (dd, <i>J</i> =20.6, 12.0 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) ⁺
947	N-(4-{[1-(環丙基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.43 (d, <i>J</i> =8.9 Hz, 3H), 6.91 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 4.78 (d, <i>J</i> =4.0 Hz, 4H), 4.53 (dt, <i>J</i> =7.9, 4.0 Hz, 1H), 4.06-3.66 (m, 2H), 3.64-3.39 (m, 1H), 2.08-1.73 (m, 3H), 1.73-1.37 (m, 2H), 0.84-0.52 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) ⁺
948	N-(4-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.42 (dd, <i>J</i> =7.0, 1.8 Hz, 2H), 6.90 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 1H), 4.81-4.74 (m, 4H), 4.57-4.45 (m, 1H), 3.93-3.81	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺

	2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	(m, 1H), 3.73-3.62 (m, 1H), 2.27 (d, $J=6.7$ Hz, 2H), 1.99-1.82 (m, 2H), 1.68-1.35 (m, 2H), 1.04-0.87 (m, 1H), 0.50-0.40 (m, 2H), 0.16-0.07 (m, 2H)	
949	N-(4-{[1-(環丁基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.83 (s, 1H), 8.71 (d, $J=5.6$ Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.82 (d, $J=5.6$ Hz, 1H), 7.41 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 6.90 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.89 (d, $J=9.7$ Hz, 4H), 4.61-4.38 (m, 1H), 3.90-3.75 (m, 1H), 3.64-3.46 (m, 1H), 3.27-3.06 (m, 2H), 2.12 (ddd, $J=13.8$, 12.3, 7.5 Hz, 4H), 2.00-1.77 (m, 3H), 1.74 (dd, $J=9.1$, 4.8 Hz, 1H), 1.59-1.28 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) $^+$
950	N-(4-{[1-(環戊基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.78 (s, 1H), 8.66 (d, $J=5.5$ Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.74 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 6.91 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.87 (d, $J=4.5$ Hz, 4H), 4.51 (dd, $J=7.7$, 3.9 Hz, 1H), 3.92-3.70 (m, 2H), 3.45-3.30 (m, 1H), 3.21 (dd, $J=18.3$, 8.9 Hz, 1H), 2.98 (dd, $J=15.4$, 7.5 Hz, 1H), 2.01-1.38 (m, 12H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) $^+$
951	N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.78 (s, 1H), 8.67 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.75 (d, $J=5.5$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 6.91 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.87 (d, $J=5.1$ Hz, 5H), 4.55-4.45 (m, 1H), 3.86 (d, $J=12.3$ Hz, 1H), 3.71 (d, $J=14.1$ Hz, 1H), 3.39-3.08 (m, 2H), 2.34 (d, $J=7.1$ Hz, 2H), 2.13 (dt, $J=15.3$, 7.6 Hz, 1H), 1.90 (s, 2H), 1.74 (dt, $J=11.2$, 6.5 Hz, 2H), 1.65-1.36 (m, 6H), 1.23-1.02 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 449 (M+H) $^+$
952	N-(4-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.78 (s, 1H), 8.66 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.74 (d, $J=5.3$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 6.91 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.87 (d, $J=4.5$ Hz, 4H), 4.54-4.44 (m, 1H), 3.83 (s, 2H), 3.17 (d, $J=0.9$ Hz, 2H), 2.63-2.52 (m, 1H), 1.91 (s, 3H), 1.61 (dd, $J=38.7$, 30.1 Hz, 7H), 1.43-1.02 (m, 7H)	(ESI(+)) m/e 449 (M+H) $^+$
987	N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.77 (s, 1H), 8.65 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.72 (d, $J=5.5$ Hz, 2H), 7.45 (d, $J=9.1$ Hz, 2H), 6.78 (d, $J=9.1$ Hz, 2H), 5.06-4.93 (m, 1H), 4.87 (d, $J=3.6$ Hz, 4H), 4.60 (dd, $J=8.6$, 6.5 Hz, 1H), 4.34 (dd, $J=11.0$, 6.1 Hz, 1H), 4.15 (dd, $J=9.6$, 2.9 Hz, 1H), 3.81 (dd, $J=10.7$, 3.8 Hz, 1H), 3.40 (q, $J=11.2$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) $^+$
988	N-(4-{[1-(4,4,4-三氟丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.69 (s, 1H), 8.58 (d, $J=5.3$ Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.58 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.45 (d, $J=9.1$ Hz, 2H), 6.78 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.98 (dd, $J=8.4$, 4.4 Hz, 1H), 4.82 (s, 4H), 4.66-4.49 (m, 1H), 4.31 (dd, $J=10.6$, 6.5 Hz, 1H), 4.13 (dd, $J=9.4$, 3.5 Hz, 1H), 3.78 (dd, $J=10.5$, 3.7 Hz, 2H), 2.40-2.29	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) $^+$

		(m, 4H)	
989	N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.57 (s, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.50-7.39 (m, 2H), 7.37 (d, <i>J</i> =4.9 Hz, 1H), 6.82-6.70 (m, 2H), 4.98 (tt, <i>J</i> =6.5, 4.1 Hz, 1H), 4.83-4.73 (m, 5H), 4.34 (dd, <i>J</i> =7.6, 6.2 Hz, 2H), 3.85-3.61 (m, 4H), 2.10-1.90 (m, 2H), 1.90-1.70 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺
990	N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.57 (s, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.50-7.41 (m, 2H), 7.37 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 6.92-6.66 (m, 2H), 5.03-4.91 (m, 1H), 4.83-4.73 (m, 5H), 3.78 (dd, <i>J</i> =8.3, 7.1 Hz, 1H), 3.71 (td, <i>J</i> =8.1, 5.4 Hz, 1H), 3.62 (dd, <i>J</i> =15.4, 7.4 Hz, 1H), 3.27 (dd, <i>J</i> =8.4, 6.5 Hz, 1H), 2.24-2.09 (m, 3H), 2.05-1.89 (m, 1H), 1.50 (dt, <i>J</i> =14.7, 7.0 Hz, 1H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺
991	N-(4-{[1-(環丁基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.76 (s, 1H), 8.64 (d, <i>J</i> =5.4 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.70 (d, <i>J</i> =5.4 Hz, 1H), 7.44 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 6.77 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 5.05-4.90 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.52-4.40 (m, 1H), 4.30-4.20 (m, 1H), 3.97 (dd, <i>J</i> =9.5, 3.8 Hz, 1H), 3.74 (dd, <i>J</i> =10.4, 3.8 Hz, 1H), 3.12 (p, <i>J</i> =8.4 Hz, 1H), 2.19-1.96 (m, 4H), 1.96-1.79 (m, 1H), 1.79-1.62 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 393 (M+H) ⁺
992	N-(4-{[1-(環戊基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.77 (s, 1H), 8.66 (d, <i>J</i> =5.4 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.73 (d, <i>J</i> =5.3 Hz, 1H), 7.45 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 6.78 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 4.97 (t, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 4.87 (d, <i>J</i> =3.9 Hz, 4H), 4.64-4.47 (m, 1H), 4.27 (dd, <i>J</i> =10.3, 6.6 Hz, 1H), 4.14-4.02 (m, 1H), 3.82-3.65 (m, 1H), 2.76-2.55 (m, 1H), 1.89-1.39 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) ⁺
993	N-(4-{[1-(3-苯基丙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.80 (s, 1H), 8.68 (d, <i>J</i> =5.4 Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.77 (d, <i>J</i> =5.3 Hz, 1H), 7.49-7.37 (m, 2H), 7.33-7.11 (m, 5H), 6.87 (dd, <i>J</i> =9.1, 2.3 Hz, 2H), 4.91 (dd, <i>J</i> =22.6, 11.0 Hz, 5H), 3.51 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 4H), 2.81 (dd, <i>J</i> =13.6, 7.3 Hz, 2H), 2.63-2.51 (m, 2H), 2.07 (dd, <i>J</i> =17.7, 8.2 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 457 (M+H) ⁺
994	N-(4-{[1-(苯基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.43 (dd, <i>J</i> =6.8, 4.6 Hz, 3H), 7.38-7.10 (m, 5H), 6.86 (dd, <i>J</i> =8.9, 1.9 Hz, 2H), 4.98 (d, <i>J</i> =21.6 Hz, 1H), 4.78 (d, <i>J</i> =4.4 Hz, 4H), 3.59 (dd, <i>J</i> =29.8, 8.4 Hz, 6H), 2.24-1.94 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 443 (M+H) ⁺
995	N-[4-(1-[(4-甲氧基苯基)乙醯基]吡咯啉-3-基)氧基]苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.52-7.34 (m, 3H), 7.14 (t, <i>J</i> =8.1 Hz, 2H), 6.95-6.73 (m, 4H), 4.97 (d, <i>J</i> =21.7 Hz, 1H), 4.78 (d, <i>J</i> =4.4 Hz, 4H), 3.70 (t, <i>J</i> =10.2 Hz, 5H), 3.63-3.47 (m,	(ESI(+)) m/e 473 (M+H) ⁺

	[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	4H), 2.31-1.91 (m, 2H)	
996	N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.82 (s, 1H), 8.70 (d, <i>J</i> =5.5 Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.81 (d, <i>J</i> =5.3 Hz, 1H), 7.44 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 6.96-6.81 (m, 2H), 4.91 (t, <i>J</i> =9.8 Hz, 5H), 4.05 (s, 1H), 3.99 (s, 1H), 3.76-3.32 (m, 4H), 3.30 (s, 1.5H), 3.28 (s, 1.5H), 2.13 (dd, <i>J</i> =7.4, 3.7 Hz, 1H), 2.07-1.96 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 397 (M+H) ⁺
997	N-(4-{[1-(環丙基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.53-7.32 (m, 3H), 6.89 (dd, <i>J</i> =9.0, 7.4 Hz, 2H), 5.03 (dd, <i>J</i> =18.0, 16.5 Hz, 1H), 4.78 (d, <i>J</i> =3.8 Hz, 4H), 3.98-3.61 (m, 2H), 3.51 (m, 2H), 2.31-1.91 (m, 2H), 1.76 (d, <i>J</i> =20.7 Hz, 1H), 0.83-0.59 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 393 (M+H) ⁺
998	N-(4-{[1-(環己基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.80 (s, 1H), 8.68 (d, <i>J</i> =5.5 Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.77 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.43 (dd, <i>J</i> =9.0, 1.8 Hz, 2H), 6.88 (dd, <i>J</i> =9.0, 7.5 Hz, 2H), 5.01 (s, 1H), 4.89 (t, <i>J</i> =8.6 Hz, 4H), 3.82-3.25 (m, 4H), 2.43-1.93 (m, 3H), 1.67 (d, <i>J</i> =10.0 Hz, 5H), 1.47-1.03 (m, 5H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) ⁺
999	N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.76 (s, 1H), 8.65 (d, <i>J</i> =5.4 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.71 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 7.44 (d, <i>J</i> =8.6 Hz, 2H), 7.02-6.78 (m, 2H), 4.96 (d, <i>J</i> =21.3 Hz, 1H), 4.86 (d, <i>J</i> =2.2 Hz, 4H), 3.67-3.44 (m, 4H), 2.31-2.01 (m, 5H), 1.75 (s, 2H), 1.62-1.38 (m, 4H), 1.10 (dd, <i>J</i> =13.0, 5.9 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) ⁺
1000	N-(4-{[1-(環戊基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.76 (s, 1H), 8.64 (d, <i>J</i> =5.4 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.70 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.54-7.34 (m, 2H), 6.97-6.77 (m, 2H), 4.97 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 3.69-3.36 (m, 4H), 2.95-2.68 (m, 1H), 2.11 (ddd, <i>J</i> =17.8, 8.5, 4.2 Hz, 2H), 1.86-1.41 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
1001	N-{4-[(1-苯甲醯基吡咯啉-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.78 (d, <i>J</i> =2.9 Hz, 1H), 8.67 (d, <i>J</i> =4.0 Hz, 1H), 8.36 (d, <i>J</i> =14.5 Hz, 1H), 7.75 (d, <i>J</i> =4.4 Hz, 1H), 7.61-7.33 (m, 7H), 6.88 (dd, <i>J</i> =27.8, 8.9 Hz, 2H), 4.98 (m, 1H), 4.87 (m, 4H), 3.90-3.75 (m, 1H), 3.71-3.57 (m, 2H), 3.46 (d, <i>J</i> =24.5 Hz, 1H), 2.11 (d, <i>J</i> =13.7 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 429 (M+H) ⁺
1002	N-(4-{[1-(3-乙氧基丙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.73 (s, 1H), 8.61 (d, <i>J</i> =5.3 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.65 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.44 (dd, <i>J</i> =9.0, 1.1 Hz, 2H), 6.88 (dd, <i>J</i> =9.0, 5.3 Hz, 2H), 4.97 (d, <i>J</i> =19.1 Hz, 1H), 4.84 (s, 4H), 3.62-3.47 (m, 6H), 3.47-3.32 (m, 4H), 2.19-2.09 (m, 1H), 2.09-2.00 (m, 1H), 1.07 (dt, <i>J</i> =9.8, 7.0 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 425 (M+H) ⁺
1003	N-[4-({1-[(2-甲基環丙基)羰基]吡咯啉-3-	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.78 (s, 1H), 8.66 (d, <i>J</i> =5.4 Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 7.74 (d,	(ESI(+)) m/e 407

	基}氧基)苯基]-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	$J=5.3$ Hz, 1H), 7.54-7.35 (m, 2H), 6.88 (td, $J=9.9, 5.3$ Hz, 2H), 4.99 (d, $J=30.6$ Hz, 1H), 4.87 (d, $J=4.1$ Hz, 4H), 3.94-3.58 (m, 2H), 3.52 (t, $J=5.2$ Hz, 2H), 2.29-2.01 (m, 2H), 1.57-1.42 (m, 1H), 1.12-1.01 (m, 4H), 0.94 (ddd, $J=9.5, 7.6, 4.7$ Hz, 1H), 0.62-0.50 (m, 1H)	(M+H) ⁺
1004	N-[4-({1-[(1-甲基环丙基)羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.77 (s, 1H), 8.65 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 7.72 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.57-7.37 (m, 2H), 6.88 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.97 (s, 1H), 4.87 (d, $J=3.5$ Hz, 4H), 4.26 (s, 2H), 3.77 (s, 2H), 2.10 (s, 2H), 1.26-1.17 (m, 3H), 0.92-0.80 (m, 1H), 0.66 (s, 1H), 0.48 (s, 2H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) ⁺
1005	N-(4-{[1-(环丁基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.75 (s, 1H), 8.63 (d, $J=5.3$ Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.68 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.49-7.34 (m, 2H), 6.94-6.76 (m, 2H), 4.95 (d, $J=17.9$ Hz, 1H), 4.85 (s, 4H), 3.67-3.10 (m, 5H), 2.10 (dtd, $J=19.7, 15.3, 8.2$ Hz, 6H), 1.96-1.64 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) ⁺
1006	N-(4-{[1-(3-甲基丁酰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.79 (s, 1H), 8.67 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.75 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 6.96-6.76 (m, 2H), 4.97 (d, $J=21.3$ Hz, 1H), 4.87 (d, $J=5.4$ Hz, 4H), 3.83-3.24 (m, 4H), 2.25-1.98 (m, 5H), 0.98-0.81 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺
1007	N-(4-{[1-(2-甲基丙酰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.76 (s, 1H), 8.65 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 7.71 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 6.88 (dd, $J=9.0, 6.9$ Hz, 2H), 4.97 (d, $J=25.9$ Hz, 1H), 4.86 (d, $J=2.6$ Hz, 4H), 3.80-3.26 (m, 4H), 2.64 (ddt, $J=27.4, 13.9, 7.1$ Hz, 1H), 2.31-2.00 (m, 2H), 0.99 (ddd, $J=16.0, 9.0, 4.2$ Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 395 (M+H) ⁺
1008	N-{4-[(1-乙酰基吡咯啉-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.79 (s, 1H), 8.67 (d, $J=5.5$ Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.75 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J=8.9$ Hz, 2H), 6.95-6.79 (m, 2H), 5.07-4.90 (m, 1H), 4.87 (d, $J=5.3$ Hz, 4H), 3.83-3.22 (m, 4H), 2.26-2.00 (m, 2H), 1.97 (s, 1.5H), 1.93 (s, 1.5H)	(ESI(+)) m/e 367 (M+H) ⁺
1009	N-(4-{[1-(4,4,4-三氟丁酰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.76 (s, 1H), 8.64 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 7.71 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.44 (dd, $J=9.0, 1.7$ Hz, 2H), 6.88 (dd, $J=8.9, 6.4$ Hz, 2H), 4.99 (d, $J=21.2$ Hz, 1H), 4.86 (d, $J=2.1$ Hz, 4H), 3.85-3.29 (m, 4H), 2.56 (d, $J=5.1$ Hz, 4H), 2.11 (dd, $J=24.1, 8.1$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 449 (M+H) ⁺
1010	N-(4-{[1-(四氢呋喃-3-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.77 (s, 1H), 8.66 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.73 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.44 (dd, $J=8.9, 1.6$ Hz, 2H), 6.89 (dd, $J=8.8, 6.9$ Hz, 2H), 4.98 (d, $J=21.7$ Hz, 1H), 4.86 (d, $J=3.8$ Hz, 4H), 3.95-3.46 (m, 8H), 3.20 (dd, $J=14.8, 7.8$ Hz, 1H), 1.97 (d,	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺

		$J=7.5$ Hz, 4H)	
1011	N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.80 (s, 1H), 8.68 (d, $J=5.5$ Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.78 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 6.88 (dd, $J=8.2$, 4.6 Hz, 2H), 4.98 (d, $J=23.0$ Hz, 1H), 4.88 (d, $J=7.4$ Hz, 4H), 4.51 (dt, $J=13.2$, 6.2 Hz, 2H), 3.89-3.46 (m, 5H), 2.33-1.67 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺
1012	N-(4-{[1-(乙氧基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.79 (s, 1H), 8.67 (d, $J=5.5$ Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.76 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 6.94-6.76 (m, 2H), 4.98 (d, $J=22.7$ Hz, 2H), 4.87 (d, $J=5.8$ Hz, 5H), 4.07 (s, 1H), 4.01 (s, 1H), 3.75-3.27 (m, 7H), 2.24-1.98 (m, 2H), 1.11 (dt, $J=10.8$, 6.9 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 411 (M+H) ⁺
1026	N-(4-{[1-(環己基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.77 (s, 1H), 8.65 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.72 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.50-7.34 (m, 2H), 6.99-6.82 (m, 2H), 4.86 (d, $J=3.5$ Hz, 4H), 4.56-4.45 (m, 1H), 3.60-3.89 (m, 2H), 3.39-3.14 (m, 2H), 2.20 (d, $J=6.7$ Hz, 2H), 1.90 (s, 2H), 1.72-1.39 (m, 8H), 1.29-1.06 (m, 3H), 0.94 (t, $J=11.6$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 463 (M+H) ⁺
1027	N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.79 (s, 1H), 8.67 (d, $J=5.5$ Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 7.76 (d, $J=5.5$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 6.91 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.87 (d, $J=6.1$ Hz, 5H), 4.50 (dd, $J=7.7$, 3.9 Hz, 2H), 3.81 (ddd, $J=27.5$, 21.4, 10.7 Hz, 4H), 3.39-3.14 (m, 4H), 2.27 (d, $J=6.5$ Hz, 2H), 2.01-1.77 (m, 3H), 1.65-1.35 (m, 4H), 1.19 (tdd, $J=13.5$, 9.2, 4.4 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 465 (M+H) ⁺
1037	N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.75 (s, 1H), 8.63 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.68 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.45 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 6.78 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.97 (dd, $J=10.3$, 6.6 Hz, 1H), 4.85 (s, 4H), 4.63-4.48 (m, 1H), 4.27 (s, 2H), 4.05 (dd, $J=13.5$, 6.8 Hz, 2H), 3.62-3.45 (m, 2H), 2.28 (dddd, $J=20.3$, 14.5, 10.4, 7.5 Hz, 3H), 2.06-1.90 (m, 1H), 1.81 (dd, $J=13.8$, 6.4 Hz, 2H), 1.47 (ddd, $J=15.7$, 11.8, 7.2 Hz, 1H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺
1038	N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.77 (s, 1H), 8.65 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.71 (d, $J=5.5$ Hz, 1H), 7.45 (d, $J=9.1$ Hz, 2H), 6.78 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.96 (s, 1H), 4.86 (d, $J=3.0$ Hz, 4H), 4.62-4.47 (m, 1H), 4.27 (dd, $J=10.7$, 6.3 Hz, 1H), 4.03 (dd, $J=14.3$, 7.2 Hz, 1H), 3.76 (dd, $J=18.7$, 8.0 Hz, 3H), 3.25 (dd, $J=27.4$, 15.8 Hz, 2H), 2.01 (t, $J=7.5$ Hz, 2H), 1.89 (s, 1H), 1.56 (d, $J=11.3$ Hz, 2H), 1.34-1.03 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) ⁺
1039	N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.70 (s, 1H), 8.59 (d, $J=5.3$ Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.59 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.47 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 6.80 (d,	(ESI(+)) m/e 438 (M+H) ⁺

N-(4-{[1-(噻吩-2-基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-2-甲基丁醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4,4-二氟環己基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(5-側氧基-D-脯胺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基戊醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-乙基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1H-吡咯-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1,2-噁唑-5-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(吡啶-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

	1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$J=9.0$ Hz, 2H), 5.06 (s, 1H), 4.83 (s, 4H), 4.65-4.53 (m, 1H), 4.44 (dd, $J=10.8$, 6.2 Hz, 1H), 4.21-4.12 (m, 2H), 4.07 (s, 5H), 3.23 (s, 4H)	
1040	N-(4-{[1-(環己基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.77 (s, 1H), 8.66 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.73 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.45 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 6.78 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 5.05-4.91 (m, 1H), 4.87 (d, $J=3.9$ Hz, 4H), 4.62-4.45 (m, 1H), 4.27 (dd, $J=10.4$, 6.5 Hz, 1H), 4.04 (dd, $J=9.1$, 3.5 Hz, 1H), 3.74 (dd, $J=10.6$, 3.7 Hz, 1H), 2.05-1.88 (m, 2H), 1.64 (d, $J=12.0$ Hz, 6H), 1.16 (m, 3H), 0.94 (t, $J=11.8$ Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) $^+$
1041	N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.76 (s, 1H), 8.65 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.71 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.51-7.37 (m, 2H), 6.79 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.98 (d, $J=2.5$ Hz, 1H), 4.86 (d, $J=2.9$ Hz, 4H), 4.64-4.48 (m, 1H), 4.33-4.21 (m, 1H), 4.12-4.02 (m, 1H), 3.76 (dd, $J=10.5$, 3.8 Hz, 1H), 2.29 (dd, $J=13.8$, 6.9 Hz, 1H), 1.58-1.39 (m, 1H), 1.39-1.20 (m, 1H), 0.97 (dd, $J=6.8$, 4.1 Hz, 3H), 0.82 (q, $J=7.3$ Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 395 (M+H) $^+$
1042	N-(4-{[1-(2,2-二甲基丙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.78 (s, 1H), 8.67 (d, $J=5.5$ Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.74 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.54-7.33 (m, 2H), 6.82-6.64 (m, 2H), 4.94 (td, $J=6.3$, 3.2 Hz, 1H), 4.87 (d, $J=4.8$ Hz, 4H), 4.55-4.12 (m, 4H), 1.12 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 395 (M+H) $^+$
1043	N-(4-{[1-(3,3-二甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.80 (s, 1H), 8.68 (d, $J=5.5$ Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.77 (d, $J=5.5$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 6.78 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 5.01-4.90 (m, 1H), 4.88 (d, $J=6.5$ Hz, 4H), 4.60-4.45 (m, 1H), 4.27 (dd, $J=10.4$, 6.5 Hz, 1H), 4.04 (dd, $J=8.9$, 5.2 Hz, 1H), 3.74 (dd, $J=10.6$, 3.8 Hz, 1H), 1.96 (s, 2H), 0.98 (s, 9H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) $^+$
1044	N-(4-{[1-(三環[3.3.1.1~3,7~]癸-1-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.76 (s, 1H), 8.64 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.70 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.52-7.36 (m, 2H), 6.82-6.69 (m, 2H), 4.97-4.90 (m, 1H), 4.86 (s, 4H), 4.61-4.47 (m, 1H), 4.26 (dd, $J=10.3$, 6.4 Hz, 1H), 4.08-3.99 (m, 1H), 3.74 (dd, $J=10.6$, 3.9 Hz, 1H), 1.92 (s, 2H), 1.83 (s, 2H), 1.70-1.52 (m, 13H)	(ESI(+)) m/e 487 (M+H) $^+$
1045	N-[4-({1-[(4-甲氧基環己基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.76 (s, 1H), 8.65 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.71 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.45 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 6.78 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.96 (s, 1H), 4.86 (d, $J=2.7$ Hz, 4H), 4.58 (s, 1H), 4.31-4.19 (m, 1H), 4.05 (dd, $J=14.5$, 7.4 Hz, 1H), 3.74 (d, $J=10.3$ Hz, 1H), 3.36 (s, 1H), 3.19 (s, 3H), 2.27 (s, 1H), 1.81 (s, 2H), 1.57 (t, $J=12.2$ Hz, 2H), 1.38 (s, 4H)	(ESI(+)) m/e 451 (M+H) $^+$

1288	N-(4-{[1-(四氫-2H- 哌喃-2-基羰基)氮雜 環丁烷-3-基]氧基} 苯基)-1,3-二氫-2H- 吡咯并[3,4-c]吡啶-2- 甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90℃) δ 8.57 (s, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.50-7.40 (m, 2H), 7.37 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 6.82-6.70 (m, 2H), 4.97 (tt, <i>J</i> =6.4, 4.0 Hz, 1H), 4.83-4.73 (m, 4H), 4.69-4.44 (m, 1H), 4.44-4.19 (m, 1H), 4.21-3.98 (m, 1H), 3.89 (ddd, <i>J</i> =14.6, 10.3, 2.3 Hz, 3H), 3.48-3.33 (m, 1H), 1.79 (dt, <i>J</i> =6.0, 4.3 Hz, 1H), 1.70 (dt, <i>J</i> =6.7, 2.5 Hz, 1H), 1.61-1.39 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺
1289	N-(4-{[1-(四氫-2H- 哌喃-2-基羰基)吡咯 啶-3-基]氧基}苯基)- 1,3-二氫-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90℃) δ 8.57 (s, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.08-7.96 (m, 1H), 7.46-7.39 (m, 2H), 7.37 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 6.84 (t, <i>J</i> =5.9 Hz, 2H), 5.00-4.86 (m, 1H), 4.86-4.72 (m, 4H), 4.08-3.92 (m, 1H), 3.92-3.36 (m, 6H), 2.21-1.95 (m, 2H), 1.69-1.40 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) ⁺
1292	N-{4-[(1-乙醯基哌 啶-3-基)氧基]苯基}- 1,3-二氫-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.83 (s, 1H), 8.71 (d, <i>J</i> =5.4 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.83 (dd, <i>J</i> =5.2, 3.0 Hz, 1H), 7.42 (dd, <i>J</i> =8.9, 6.6 Hz, 2H), 6.89 (t, <i>J</i> =8.5 Hz, 2H), 4.89 (d, <i>J</i> =9.6 Hz, 4H), 4.43 (s, 1H), 4.22-3.94 (m, 1H), 3.67-3.47 (m, 2H), 3.36-3.02 (m, 1H), 2.02 (s, 1.5H), 1.87 (s, 1.5H), 1.83-1.32 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 381 (M+H) ⁺
1293	N-{4-[(1-丁醯基哌 啶-3-基)氧基]苯基}- 1,3-二氫-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90℃) δ 8.66 (s, 1H), 8.55 (d, <i>J</i> =5.3 Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.54 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.41 (d, <i>J</i> =8.9 Hz, 2H), 6.95-6.70 (m, 2H), 4.83 (s, 4H), 4.23 (bs, 2H), 3.45 (bs, 2H), 2.24 (bs, 2H), 1.96 (bs, 1H), 1.73 (bs, 2H), 1.51 (dt, <i>J</i> =14.8, 7.4 Hz, 3H), 0.87 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺
1294	N-(4-{[1-(3-甲基丁 醯基)哌啶-3-基]氧 基}苯基)-1,3-二氫- 2H-吡咯并[3,4-c]吡 啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90℃) δ 8.65 (s, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.52 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 7.41 (d, <i>J</i> =8.9 Hz, 2H), 6.92-6.79 (m, 2H), 4.82 (s, 4H), 4.25 (bs, 2H), 3.46 (bs, 2H), 2.14 (s, 2H), 2.05-1.90 (m, 2H), 1.73 (bs, 2H), 1.45 (bs, 1H), 0.90 (dd, <i>J</i> =9.3, 6.5 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺
1295	N-(4-{[1-(甲氧基乙 醯基)哌啶-3-基]氧 基}苯基)-1,3-二氫- 2H-吡咯并[3,4-c]吡 啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90℃) δ 8.64 (s, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.51 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 6.86 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 4.82 (s, 4H), 4.26 (bs, 1H), 4.05 (d, <i>J</i> =13.6 Hz, 1H), 3.96 (s, 1H), 3.42 (m, 4H), 3.27 (bs, 3H), 1.93 (d, <i>J</i> =28.0 Hz, 1H), 1.74 (bs, 2H), 1.49 (bs, 1H)	(ESI(+)) m/e 411 (M+H) ⁺
1296	N-(4-{[1-(2-甲基丁 醯基)哌啶-3-基]氧 基}苯基)-1,3-二氫- 2H-吡咯并[3,4-c]吡 啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90℃) δ 8.64 (s, 1H), 8.53 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 8.06 (d, <i>J</i> =2.1 Hz, 1H), 7.51 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 7.44- 7.38 (m, 2H), 6.85 (dd, <i>J</i> =8.7, 1.2 Hz, 2H), 4.82 (s, 4H), 4.28-4.17 (m, 1H), 3.67 (s, 2H), 3.51- 3.37 (m, 2H), 2.65 (s, 1H), 2.02-1.88 (m, 1H), 1.79-1.65 (m, 2H), 1.63-1.39 (m, 2H), 1.38-1.22	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺

		(m, 1H), 0.98 (dd, $J=6.7, 4.4$ Hz, 3H), 0.90-0.76 (m, 3H)	
1297	N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.64 (s, 1H), 8.54 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 8.08 (m, 1H), 7.52 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J=8.9$ Hz, 2H), 6.86 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.82 (m, 4H), 4.26 (s, 1H), 3.63-3.41 (m, 6H), 1.93 (d, $J=26.2$ Hz, 1H), 1.75 (m, 2H), 1.49 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 449 (M+H) ⁺
1298	N-(4-{[1-(環丙基乙基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.64 (s, 1H), 8.53 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.51 (d, $J=5.3$ Hz, 1H), 7.48-7.35 (m, 2H), 6.92-6.79 (m, 2H), 4.82 (s, 4H), 4.23 (m, 1H), 3.42-3.13 (m, 4H), 2.27 (d, $J=33.4$ Hz, 3H), 1.93 (d, $J=26.2$ Hz, 1H), 1.72 (m, 2H), 1.46 (m, 1H), 0.95 (m, 1H), 0.43 (d, $J=8.0$ Hz, 2H), 0.09 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
1299	N-(4-{[1-(環丁基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.64 (s, 1H), 8.53 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 8.07 (bs, 1H), 7.50 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.45-7.39 (m, 2H), 6.88-6.82 (m, 2H), 4.82 (s, 4H), 4.27-4.15 (m, 1H), 3.48-3.38 (m, 2H), 2.24-1.65 (m, 9H), 1.50-1.38 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
1300	N-(4-{[1-(環丁基乙基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.64 (s, 1H), 8.53 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 8.10-8.05 (m, 1H), 7.51 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J=7.7$ Hz, 1H), 6.89-6.82 (m, 2H), 4.82 (s, 4H), 4.51-3.84 (m, 1H), 2.67-2.53 (m, 1H), 2.30 (d, $J=7.4$ Hz, 1H), 2.11-1.91 (m, 3H), 1.88-1.58 (m, 7H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) ⁺
1301	N-(4-{[1-(環戊基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.64 (s, 1H), 8.53 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.51 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.42 (dd, $J=9.0, 3.7$ Hz, 2H), 6.86 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.82 (s, 4H), 4.45-3.57 (m, 5H), 2.92 (s, 2H), 1.97 (s, 1H), 1.67 (m, 12H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) ⁺
1302	N-(4-{[1-(環戊基乙基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.65 (s, 1H), 8.54 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.52 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.49-7.35 (m, 2H), 6.92-6.79 (m, 2H), 4.82 (s, 4H), 4.24 (s, 1H), 3.46 (s, 4H), 2.36-2.07 (m, 3H), 1.93 (m, 1H), 1.73 (m, 4H), 1.51 (dd, $J=22.2, 13.1$ Hz, 5H), 1.13 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 449 (M+H) ⁺
1303	N-[4-({1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.64 (bs, 1H), 8.53 (m, 1H), 8.07 (bs, 1H), 7.51 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.44-7.38 (m, 3H), 6.87 (dd, $J=9.0, 3.3$ Hz, 3H), 4.82 (s, 4H), 4.64-4.50 (m, 1H), 4.30-4.17 (m, 1H), 3.99-3.87 (m, 1H), 3.83-3.55 (m, 4H), 2.03-1.68 (m, 7H), 1.48 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) ⁺
1304	N-[4-({1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.64 (bs, 1H), 8.54 (m, 1H), 8.07 (bs, 1H), 7.52	(ESI(+)) m/e 437

	3-基}氧基}苯基]- 1,3-二氢-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	(d, $J=4.8$ Hz, 1H), 7.44-7.38 (m, 3H), 6.91-6.83 (m, 3H), 4.82 (bs, 4H), 4.64-4.49 (m, 1H), 4.30-4.16 (m, 1H), 3.93 (s, 1H), 3.43-3.20 (m, 3H), 2.05-1.75 (m, 7H), 1.48 (s, 1H)	(M+H) ⁺
1305	N-(4-{[1-(四氢-2H- 吡喃-4-基羰基)吡啶- 3-基]氧基}苯基)- 1,3-二氢-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 温度=90°C) δ 8.62 (s, 1H), 8.52 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.53-7.42 (m, 2H), 7.41 (s, 1H), 6.91-6.79 (m, 2H), 4.81 (s, 4H), 4.26 (s, 1H), 3.81 (m, 3H), 3.45 (s, 2H), 2.76 (s, 2H), 2.14 (m, 2H), 1.88-1.42 (m, 7H)	(ESI(+)) m/e 451 (M+H) ⁺
1306	N-(4-{[1-(四氢-2H- 吡喃-2-基羰基)吡啶- 3-基]氧基}苯基)- 1,3-二氢-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 温度=90°C) δ 8.62 (s, 1H), 8.52 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.47 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.42 (dd, $J=9.1$, 2.6 Hz, 2H), 6.86 (dd, $J=9.0$, 2.1 Hz, 2H), 4.81 (s, 4H), 4.08 (m, 3H), 3.93-3.54 (m, 3H), 3.28-3.13 (m, 2H), 2.00 (s, 1H), 1.85-1.36 (m, 9H)	(ESI(+)) m/e 451 (M+H) ⁺
1307	N-(4-{[1-(四氢-2H- 吡喃-4-基乙酯基)吡啶- 3-基]氧基}苯基)- 1,3-二氢-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 温度=90°C) δ 8.64 (s, 1H), 8.54 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.51 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J=8.9$ Hz, 2H), 6.85 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.24 (s, 2H), 3.32 (dd, $J=50.2$, 38.3 Hz, 6H), 2.20 (m, 2H), 1.92 (m, 2H), 1.73 (m, 2H), 1.56 (m, 2H), 1.46 (m, 1H), 1.20 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 465 (M+H) ⁺
1308	N-(4-{[1-(四氢呋喃- 2-基乙酯基)吡啶-3- 基]氧基}苯基)-1,3- 二氢-2H-吡咯并[3,4- c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 温度=90°C) δ 8.63 (s, 1H), 8.52 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.49 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 6.86 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.81 (s, 5H), 4.37-4.03 (m, 2H), 3.71 (s, 2H), 3.63-3.50 (m, 3H), 2.61 (m, 2H), 2.44-2.25 (m, 1H), 1.96 (m, 2H), 1.87-1.63 (m, 4H), 1.47 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 451 (M+H) ⁺
1309	N-(4-{[1-(四氢呋喃- 3-基乙酯基)吡啶-3- 基]氧基}苯基)-1,3- 二氢-2H-吡咯并[3,4- c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 温度=90°C) δ 8.64 (s, 1H), 8.54 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.51 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J=8.9$ Hz, 2H), 6.89-6.76 (m, 2H), 4.82 (s, 5H), 4.27 (s, 1H), 3.67-3.17 (m, 11H), 2.34 (d, $J=26.3$ Hz, 3H), 1.93 (d, $J=29.4$ Hz, 3H), 1.73 (s, 3H), 1.47 (s, 3H)	(ESI(+)) m/e 451 (M+H) ⁺
1347	N-(4-{[1-(5-侧氧基- L-脯氨酸酯基)吡啶-4- 基]氧基}苯基)-1,3- 二氢-2H-吡咯并[3,4- c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 温度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.40 (d, $J=8.54$ Hz, 3 H) 6.90 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 4.79 (d, $J=7.63$ Hz, 4 H) 4.45-4.58 (m, 2 H) 3.75 (s, 2 H) 3.34-3.42 (m, 4 H) 2.30-2.43 (m, 1 H) 2.10-2.21 (m, 2 H) 1.94 (d, $J=5.80$ Hz, 1 H) 1.54-1.69 (m, 2 H)	(APCI(+)) m/e 450 (M+H) ⁺
1386	N-(4-{[1-(5-侧氧基- L-脯氨酸酯基)氮杂环 丁烷-3-基]氧基}苯 基)-1,3-二氢-2H-吡 咯并[3,4-c]吡啶-2-甲	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 温度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.38-7.48 (m, 3 H) 6.75-6.83 (m, 2 H) 4.98-5.06 (m, 1 H) 4.79 (d, $J=7.93$ Hz, 4 H) 4.29-4.72 (m, 2 H) 4.18 (dd, $J=8.39$, 4.73 Hz, 1 H) 3.64-4.12 (m, 2 H) 2.06-2.41 (m, 3 H) 1.90-2.06 (m, 1 H)	(APCI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺

	鹽胺		
1387	N-{4-[(1-丙醯基氮雜環丁烷-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =5.19 Hz, 1 H) 7.38-7.46 (m, 3 H) 6.74-6.82 (m, 2 H) 4.94-5.03 (m, 1 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.02 Hz, 4 H) 4.35 (s, 2 H) 3.90 (s, 2 H) 2.10 (q, <i>J</i> =7.43 Hz, 2 H) 1.00 (t, <i>J</i> =7.48 Hz, 3 H)	(APCI(+)) m/e 367 (M+H) ⁺
1388	N-(4-{[1-(2,2-二甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =5.19 Hz, 1 H) 7.39-7.46 (m, 3 H) 6.78 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 4.90-5.02 (m, 1 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 4 H) 4.51 (s, 2 H) 4.01 (d, <i>J</i> =8.54 Hz, 2 H) 1.49 (q, <i>J</i> =7.32 Hz, 2 H) 1.09 (s, 6 H) 0.81 (t, <i>J</i> =7.48 Hz, 3 H)	(APCI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺
1389	N-(4-{[1-(2-乙基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =5.19 Hz, 1 H) 7.37-7.47 (m, 3 H) 6.79 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 4.95-5.03 (m, 1 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 4 H) 4.44 (s, 2 H) 3.95 (s, 2 H) 2.08-2.22 (m, 1 H) 1.32-1.55 (m, 4 H) 0.83 (t, <i>J</i> =7.32 Hz, 6 H)	(APCI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺
1390	N-(4-{[1-(戊-4-炔醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 7.34-7.49 (m, 3 H) 6.78 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 4.92-5.06 (m, 1 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 4 H) 4.42 (d, <i>J</i> =78.13 Hz, 2 H) 3.66-4.19 (m, 2 H) 2.54 (t, <i>J</i> =2.44 Hz, 1 H) 2.27-2.43 (m, 4 H)	(APCI(+)) m/e 391 (M+H) ⁺
1391	N-(4-{[1-(呋喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =5.19 Hz, 1 H) 7.77 (s, 1 H) 7.37-7.48 (m, 3 H) 7.04 (d, <i>J</i> =3.66 Hz, 1 H) 6.81 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 6.57-6.63 (m, 1 H) 5.01-5.14 (m, 1 H) 4.79 (d, <i>J</i> =8.24 Hz, 4 H) 4.67 (s, 2 H) 4.17 (s, 2 H)	(APCI(+)) m/e 405 (M+H) ⁺
1392	N-(4-{[1-(呋喃-3-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =5.19 Hz, 1 H) 8.07 (s, 1 H) 7.67 (s, 1 H) 7.38-7.47 (m, 3 H) 6.80 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 6.72 (s, 1 H) 5.03-5.11 (m, 1 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.63 Hz, 4 H) 4.60 (s, 2 H) 4.12 (s, 2 H)	(APCI(+)) m/e 405 (M+H) ⁺
1393	N-(4-{[1-(噻吩-3-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 7.97 (d, <i>J</i> =1.83 Hz, 1 H) 7.55 (dd, <i>J</i> =5.04, 2.90 Hz, 1 H) 7.35-7.46 (m, 4 H) 6.80 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 5.01-5.11 (m, 1 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 4 H) 4.62 (s, 2 H) 4.16 (s, 2 H)	(APCI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
1394	N-(4-{[1-(1H-吡咯-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =5.19 Hz, 1 H) 7.37-7.48 (m, 3 H) 6.93 (s, 1 H) 6.81 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 6.51 (d, <i>J</i> =3.36 Hz, 1 H) 6.14-6.18 (m, 1 H) 5.02-5.14 (m, 1 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 4 H) 4.57-4.66 (m, 2 H) 4.13 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 2 H)	(APCI(+)) m/e 404 (M+H) ⁺

1395	N-(4-([1-(嘧啶-4-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基)苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 9.09 (s, 1 H) 8.75 (d, $J=2.14$ Hz, 1 H) 8.66 (s, 1 H) 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.37-7.47 (m, 3 H) 6.81 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 5.06-5.13 (m, 1 H) 4.92-5.04 (m, 1 H) 4.79 (d, $J=7.63$ Hz, 4 H) 4.50 (s, 2 H) 4.09 (s, 1 H)	(APCI(+)) m/e 417 (M+H) ⁺
1396	N-[4-([1-[(5-甲基吡嗪-2-基)羰基]氮雜環丁烷-3-基]氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.96 (s, 1 H) 8.58 (s, 1 H) 8.54 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.38-7.47 (m, 3 H) 6.80 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 5.04-5.13 (m, 1 H) 4.89-5.02 (m, 1 H) 4.79 (d, $J=7.63$ Hz, 4 H) 4.48 (s, 2 H) 4.06 (s, 1 H) 2.57 (s, 3 H)	(APCI(+)) m/e 431 (M+H) ⁺
1397	N-(4-([1-(N,N-二甲基甘胺醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基)苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 8.57-8.59 (bs, 1H), 8.48 (dd, $J=4.9, 1.8$ Hz, 1H), 7.43-7.47 (m, 2H), 7.41 (d, $J=6.7$ Hz, 1H), 6.80-6.83 (m, 2H), 5.08-5.16 (m, 1H), 4.82 (s, 2H), 4.79 (s, 2H), 4.67-4.74 (m, 2H), 4.30 (dd, $J=10.1, 4.1$ Hz, 2H), 2.91 (s, 8H)	(APCI(+)) m/e 396 (M+H) ⁺
1398	N-(4-([1-(N,N-二甲基- β -丙胺醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基)苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.44-7.48 (m, 2H), 7.40 (d, $J=4.6$ Hz, 1H), 6.80-6.84 (m, 2H), 5.09-5.16 (m, 1H), 4.83 (s, 2H), 4.79 (s, 2H), 4.70 (ddd, $J=10.4, 6.6, 1.2$ Hz, 2H), 4.30 (ddd, $J=10.4, 4.1, 1.2$ Hz, 2H), 2.91 (s, 6H), 2.50 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 2.23 (t, $J=7.2$ Hz, 2H)	(APCI(+)) m/e 410 (M+H) ⁺
1399	N-(4-([1-(吡咯啶-1-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基)苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (dd, $J=5.2, 1.8$ Hz, 1H), 7.43-7.47 (m, 2H), 7.40 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 6.80-6.84 (m, 2H), 5.09-5.16 (m, 1H), 4.82 (s, 2H), 4.79 (s, 2H), 4.70 (ddd, $J=10.2, 6.4, 1.1$ Hz, 2H), 4.30 (ddd, $J=10.3, 4.2, 1.1$ Hz, 2H), 3.18 (s, 2H), 2.55-2.62 (m, 4H), 1.68-1.75 (m, 4H)	(APCI(+)) m/e 422 (M+H) ⁺
1400	N-[4-([1-3-(吡咯啶-1-基)丙醯基]氮雜環丁烷-3-基]氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6 /氧化氬, 溫度=90°C) δ ppm 8.57-8.58 (bs, 1H), 8.48 (dd, $J=5.0, 2.0$ Hz, 1H), 7.41-7.45 (m, 2H), 7.40 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 6.76-6.80 (m, 2H), 4.94-5.01 (m, 1H), 4.82 (s, 2H), 4.79 (s, 2H), 4.19-4.64 (m, 2H), 3.70-4.17 (m, 2H), 2.66 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 2.44-2.50 (m, 4H), 2.27 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 1.65-1.71 (m, 4H)	(APCI(+)) m/e 436 (M+H) ⁺
1401	N-[4-([1-3-(哌啶-1-基)丙醯基]氮雜環丁烷-3-基]氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.35-7.48 (m, 3 H) 6.74-6.83 (m, 2 H) 4.92-5.02 (m, 1 H) 4.79 (d, $J=7.93$ Hz, 4 H) 4.18-4.71 (m, 2 H) 3.94 (d, $J=92.77$ Hz, 2 H) 2.53-2.58 (m, 2 H) 2.32-2.40 (m, 4 H) 2.24 (t, $J=7.17$ Hz, 2 H)	(APCI(+)) m/e 450 (M+H) ⁺

		1.44-1.54 (m, 4 H) 1.33-1.41 (m, 2H)	
1402	N-[4-({1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ /氧化氫, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.48 (dd, <i>J</i> =5.0, 2.0 Hz, 1H), 7.41-7.45 (m, 2H), 7.40 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 6.75-6.80 (m, 2H), 5.08-5.17 (m, 1H), 4.82 (s, 2H), 4.79 (s, 2H), 4.70 (ddd, <i>J</i> =10.0, 6.3, 1.3 Hz, 2H), 4.30 (ddd, <i>J</i> =10.0, 4.0, 1.0 Hz, 2H), 3.00 (s, 2H), 2.41-2.48 (m, 4H), 2.30-2.37 (m, 4H), 2.15 (s, 3H)	(APCI(+)) m/e 451 (M+H) ⁺
1403	N-[4-({1-[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 7.38-7.48 (m, 3 H) 6.78 (d, <i>J</i> =9.16 Hz, 2 H) 4.93-5.01 (m, 1 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 4 H) 4.19-4.64 (m, 2 H) 3.94 (d, <i>J</i> =87.28 Hz, 2 H) 2.53-2.58 (m, 2 H) 2.36-2.43 (m, 4 H) 2.29-2.35 (m, 4 H) 2.24 (t, <i>J</i> =7.17 Hz, 2 H) 2.15 (s, 3 H)	(APCI(+)) m/e 456 (M+H) ⁺
1423	N-[4-({1-[(2S)-2-甲基丁醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.51-7.34 (m, 3H), 6.90 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 4.78 (d, <i>J</i> =4.0 Hz, 4H), 4.60-4.44 (m, 1H), 3.84 (d, <i>J</i> =39.0 Hz, 2H), 3.46-3.12 (m, 2H), 2.73 (dd, <i>J</i> =13.4, 6.8 Hz, 1H), 1.99 (s, 2H), 1.55 (dt, <i>J</i> =21.7, 7.3 Hz, 3H), 1.42-1.21 (m, 1H), 0.97 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 3H), 0.81 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺
1424	N-[4-({1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.46-7.39 (m, 3H), 6.94-6.87 (m, 2H), 4.86-4.74 (m, 4H), 4.67 (t, <i>J</i> =6.6 Hz, 1H), 4.57-4.46 (m, 1H), 3.93-3.67 (m, 4H), 3.31 (s, 2H), 2.12-1.77 (m, 6H), 1.65-1.39 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) ⁺
1425	N-[4-({1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.53-7.33 (m, 3H), 6.90 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 4.78 (d, <i>J</i> =4.0 Hz, 4H), 4.73-4.60 (m, 1H), 4.52 (s, 1H), 3.93-3.63 (m, 4H), 3.49-3.07 (m, 2H), 2.11-1.72 (m, 6H), 1.66-1.40 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) ⁺
1426	N-[4-({1-[(4,4-二氟環己基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO, 溫度=90°C) δ 8.57 (s, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.05 (d, <i>J</i> =8.0 Hz, 1H), 7.48-7.39 (m, 2H), 7.37 (d, <i>J</i> =4.8 Hz, 1H), 6.86-6.60 (m, 2H), 4.96 (m, 1H), 4.78 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 5H), 4.19 (m, 2H), 3.74 (m, 2H), 3.22 (d, <i>J</i> =6.2 Hz, 1H), 2.42 (t, <i>J</i> =10.6 Hz, 1H), 2.26 (t, <i>J</i> =6.9 Hz, 1H), 2.04 (d, <i>J</i> =10.0 Hz, 2H), 1.81 (ddd, <i>J</i> =26.3, 15.5, 8.4 Hz, 3H), 1.68-1.49 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 457 (M+H) ⁺
1427	N-(4-{[1-(5-側氧基-D-脯氨酸)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 7.40 (d, <i>J</i> =8.54 Hz, 3 H) 6.90 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.63 Hz, 4 H) 4.46-4.60 (m, 2 H) 3.75 (s, 2 H) 3.34-3.41 (m, 2 H) 2.30-2.41 (m, 1	(APCI(+)) m/e 450 (M+H) ⁺

		H) 2.10-2.23 (m, 2 H) 1.92-2.05 (m, 3 H) 1.56-1.74 (m, 2 H)	
1428	N-(4-{[1-(2,2-二甲基丙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 7.36-7.44 (m, 3 H) 6.89 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.32 Hz, 4 H) 4.43-4.53 (m, 1 H) 3.80-3.93 (m, 2 H) 3.34-3.42 (m, 2 H) 1.94-1.99 (m, <i>J</i> =3.36 Hz, 2 H) 1.50-1.68 (m, 2 H) 1.22 (s, 9H)	(APCI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺
1429	N-(4-{[1-(2-甲基戊基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =5.19 Hz, 1 H) 7.40 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 3 H) 6.89 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.32 Hz, 4 H) 4.45-4.54 (m, 1 H) 3.81 (dd, <i>J</i> =11.14, 5.34 Hz, 2 H) 3.35 (s, 2 H) 2.75-2.84 (m, 1 H) 1.93-1.98 (m, 2 H) 1.49-1.64 (m, 3 H) 1.19-1.35 (m, 3 H) 1.01 (d, <i>J</i> =6.71 Hz, 3 H) 0.86 (t, <i>J</i> =7.02 Hz, 3 H)	(APCI(+)) m/e 437 (M+H) ⁺
1430	N-(4-{[1-(2-乙基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =5.19 Hz, 1 H) 7.40 (d, <i>J</i> =9.16 Hz, 3 H) 6.90 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.63 Hz, 4 H) 4.46-4.56 (m, <i>J</i> =11.22, 7.40, 3.66 Hz, 1 H) 3.80-3.92 (m, 2 H) 3.35-3.43 (m, 2 H) 2.58-2.68 (m, 1 H) 1.87-1.95 (m, 2 H) 1.47-1.64 (m, 4 H) 1.34-1.46 (m, 2 H) 0.82 (t, <i>J</i> =7.48 Hz, 6 H)	(APCI(+)) m/e 437 (M+H) ⁺
1431	N-(4-{[1-(1H-吡咯-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =5.19 Hz, 1 H) 7.37-7.46 (m, 3 H) 6.85-6.95 (m, 3 H) 6.49 (d, <i>J</i> =3.05 Hz, 1 H) 6.13 (t, <i>J</i> =2.90 Hz, 1 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 4 H) 4.47-4.60 (m, 1 H) 3.93-4.09 (m, 2 H) 3.49-3.59 (m, 2 H) 1.95-2.03 (m, 2 H) 1.56-1.74 (m, 2 H)	(APCI(+)) m/e 432 (M+H) ⁺
1432	N-(4-{[1-(1,2-噁唑-5-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, 溶劑) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.47 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 7.36-7.44 (m, 3 H) 6.89 (d, <i>J</i> =8.54 Hz, 2 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 4 H) 3.44-4.62 (m, 4 H) 1.79-1.89 (m, 2 H) 1.40-1.80 (m, 3 H)	(APCI(+)) m/e 434 (M+H) ⁺
1433	N-(4-{[1-(吡啶-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.62 (d, <i>J</i> =4.58 Hz, 1 H) 8.58 (d, <i>J</i> =7.32 Hz, 2 H) 8.47 (d, <i>J</i> =5.19 Hz, 1 H) 7.82 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 1 H) 7.47 (dd, <i>J</i> =7.63, 4.88 Hz, 1 H) 7.40 (d, <i>J</i> =8.54 Hz, 3 H) 6.91 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.63 Hz, 4 H) 4.50-4.58 (m, 1 H) 3.75 (s, 2 H) 3.38-3.50 (m, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 1.93-2.05 (m, 2 H) 1.62-1.76 (m, 2 H)	(APCI(+)) m/e 444 (M+H) ⁺
1434	N-(4-{[1-(噻吩-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 9.26 (dd, <i>J</i> =4.58, 2.14 Hz, 1 H) 8.58 (s, 1 H) 8.49 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 7.76-7.85 (m, 2 H) 7.37-7.45 (m, 3 H) 6.91 (t, <i>J</i> =9.16 Hz, 2 H) 4.80 (d, <i>J</i> =6.10 Hz, 4 H) 4.48-4.63 (m, 1 H) 3.99 (s,	(APCI(+)) m/e 445 (M+H) ⁺

	啉-2-甲醯胺	2 H) 3.60 (s, 2 H) 1.95-2.14 (m, 2H) 1.72 (s, 2H)	
1435	N-(4-([1-(吡嗪-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基)苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 9.20 (s, 1 H) 8.93 (d, <i>J</i> =5.19 Hz, 1 H) 8.57 (s, 1 H) 8.47 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 7.60-7.65 (m, 1 H) 7.36-7.44 (m, 3 H) 6.87-6.94 (m, 2 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.63 Hz, 4 H) 4.47-4.62 (m, 1 H) 3.94 (s, 2 H) 3.55 (s, 2 H) 1.93-2.11 (m, 2 H) 1.61-1.78 (m, <i>J</i> =15.87 Hz, 2 H)	(APCI(+)) m/e 445 (M+H) ⁺
1436	N-(4-([1-(嘧啶-4-基羰基)哌啶-4-基]氧基)苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.40-8.87 (m, 5 H) 7.33-7.47 (m, 3 H) 6.91 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 4 H) 4.48-4.63 (m, 1 H) 3.45-4.22 (m, 4 H) 1.94-2.12 (m, 2 H) 1.56-1.79 (m, 2H)	(APCI(+)) m/e 445 (M+H) ⁺
1437	N-[4-([1-(5-甲基吡嗪-2-基)羰基]哌啶-4-基)氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.66 (s, 1 H) 8.57 (s, 1 H) 8.52 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 7.40 (d, <i>J</i> =8.54 Hz, 3 H) 6.91 (d, <i>J</i> =9.16 Hz, 2 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.63 Hz, 4 H) 4.51-4.60 (m, 1 H) 3.63-4.07 (m, 2 H) 3.39-3.62 (m, 2 H) 2.55 (s, 3 H) 1.93-2.06 (m, 2 H) 1.62-1.78 (m, <i>J</i> =10.38 Hz, 2 H)	(APCI(+)) m/e 459 (M+H) ⁺
1438	N-[4-([1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]哌啶-4-基]氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 7.33-7.45 (m, 3 H) 6.89 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 4 H) 4.43-4.52 (m, 1 H) 3.66-3.92 (m, 2 H) 3.34-3.40 (m, 2 H) 2.55-2.62 (m, <i>J</i> =7.02, 7.02 Hz, 2 H) 2.46-2.50 (m, 2 H) 2.37-2.43 (m, 4 H) 1.91-2.00 (m, 2 H) 1.55-1.68 (m, 2 H) 1.45-1.55 (m, 4 H) 1.33-1.42 (m, 2H)	(APCI(+)) m/e 478 (M+H) ⁺
1439	N-(4-([1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基)苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =5.19 Hz, 1 H) 7.34-7.48 (m, 3 H) 6.90 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.63 Hz, 4 H) 4.40-4.59 (m, 1 H) 3.72-3.91 (m, 2 H) 3.53-3.64 (m, 4 H) 3.35-3.45 (m, 2 H) 3.16 (s, 2 H) 2.39-2.47 (m, 4 H) 1.90-2.01 (m, 2 H) 1.50-1.68 (m, 2 H)	(APCI(+)) m/e 466 (M+H) ⁺
1440	N-[4-([1-[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]哌啶-4-基]氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-D ₂ O, 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, <i>J</i> =4.88 Hz, 1 H) 7.36-7.44 (m, 3 H) 6.89 (d, <i>J</i> =8.85 Hz, 2 H) 4.79 (d, <i>J</i> =7.93 Hz, 4 H) 4.40-4.60 (m, 1 H) 3.69-3.85 (m, 2 H) 3.36-3.50 (m, 2 H) 2.55-2.63 (m, 2 H) 2.46-2.50 (m, 2 H) 2.40-2.45 (m, 4 H) 2.30-2.36 (m, 4 H) 2.16 (s, 3 H) 1.91-2.00 (m, 2 H) 1.52-1.67 (m, 2 H)	(APCI(+)) m/e 493 (M+H) ⁺
1532	N-(4-([(3R)-1-(3-甲基丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基)苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.49-7.36 (m, 3H), 6.95-6.79 (m, 2H), 4.96 (d, <i>J</i> =21.2 Hz, 1H), 4.78 (d, <i>J</i> =4.0 Hz, 5H), 3.81-3.44 (m, 4H), 2.21-1.84 (m, 6H), 0.99-0.79 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺

1533	N-(4-{[(3R)-1-(環丁基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.53-7.38 (m, 3H), 6.96-6.81 (m, 2H), 5.04-4.85 (m, 1H), 4.78 (d, $J=3.9$ Hz, 4H), 3.72-3.07 (m, 5H), 2.24-1.56 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) $^+$
1534	N-[4-({(3R)-1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.48-7.43 (m, 2H), 7.45-7.39 (m, 2H), 6.92-6.83 (m, 2H), 5.05-4.90 (m, 1H), 4.82-4.75 (m, 4H), 4.59-4.42 (m, 1H), 3.89-3.42 (m, 5H), 2.25-1.68 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) $^+$
1535	N-[4-({(3R)-1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.45-7.39 (m, 2H), 6.93-6.83 (m, 2H), 5.06-4.90 (m, 1H), 4.82-4.75 (m, 4H), 4.60-4.42 (m, 1H), 3.85-3.63 (m, 3H), 3.63-3.41 (m, 2H), 2.30-1.71 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) $^+$
1536	N-(4-{[(3R)-1-(環丙基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.48-7.40 (m, 3H), 6.92-6.82 (m, 2H), 5.03-4.90 (m, 1H), 4.81-4.75 (m, 4H), 3.79-3.43 (m, 2H), 2.32-1.95 (m, 5H), 1.05-0.88 (m, 1H), 0.49-0.36 (m, 2H), 0.20-0.07 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) $^+$
1537	N-(4-{[(3S)-1-(3-甲基丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.49-7.39 (m, 3H), 6.92-6.81 (m, 2H), 5.04-4.89 (m, 1H), 4.81-4.75 (m, 4H), 3.66-3.42 (m, 4H), 2.25-1.90 (m, 5H), 0.96-0.82 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) $^+$
1538	N-(4-{[(3S)-1-(環丁基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.48-7.40 (m, 3H), 6.91-6.81 (m, 2H), 5.02-4.89 (m, 1H), 4.81-4.75 (m, 4H), 3.32 (s, 5H), 2.27-1.65 (m, 8H)	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) $^+$
1539	N-[4-({(3S)-1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.48-7.41 (m, 3H), 7.43 (d, $J=5.4$ Hz, 2H), 6.93-6.82 (m, 2H), 5.05-4.91 (m, 1H), 4.81-4.75 (m, 4H), 4.60-4.42 (m, 1H), 3.89-3.64 (m, 4H), 3.65-3.43 (m, 2H), 2.26-1.73 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) $^+$
1540	N-[4-({(3S)-1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.48-7.40 (m, 3H), 6.93-6.83 (m, 2H), 5.05-4.91 (m, 1H), 4.81-4.75 (m, 3H), 4.59-4.42 (m, 1H), 3.89-3.42 (m, 6H), 2.25-1.70 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) $^+$
1541	N-(4-{[(3S)-1-(環丙基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.60 (s, 1H),	(ESI(+))

N-(4-{[1-(噻嗪-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二
氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(吡嗪-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二
氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嘧啶-4-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二
氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(5-甲基吡嗪-2-基)羰基]哌啶-4-基}氧基)苯
基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-
1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-
二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]哌啶-4-基}氧基)
苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

反-3-[(1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]
環丁烷甲酸苯甲酯；

N-[4-(4-{[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]胺基}環己-1-烯-1-
基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氮-2H-哌喃-4-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-
基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯甲醯基胺基)環己-1-烯-1-基]苯基}-1,3-二氮-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-四氮呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-
基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.48-7.40 (m, 3H), 6.93-6.82 (m, 2H), 5.03-4.90 (m, 1H), 4.81-4.75 (m, 4H), 3.80-3.33 (m, 2H), 2.30-1.95 (m, 5H), 1.07-0.88 (m, 1H), 0.49-0.35 (m, 2H), 0.19-0.07 (m, 2H)	m/e 407 (M+H) ⁺
--	---	----------------------------

實例 953

N-{6-[(1-乙醯基哌啶-4-基)氧基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 953A

4-(5-硝基吡啶-2-基氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

預先洗滌之NaH(0.1 g, 2.48 mmol, 60%於礦物油中之分散液)於THF(2 mL)中之懸浮液添加至4-羥基-哌啶-1-甲酸第三丁酯(0.5 g, 2.48 mmol)於無水THF(3 mL)中之冰冷溶液中。混合物攪拌20分鐘且分數份添加至2-氯-5-硝基-吡啶(0.36 g, 2.26 mmol)中。添加結束後，移除冷卻浴且反應混合物在22℃下攪拌隔夜。反應混合物在冰浴中冷卻且用飽和碳酸氫鈉水溶液(5 mL)處理。反應混合物用乙酸乙酯(25 mL)及蒸餾水(25 mL)稀釋。分離之水相用乙酸乙酯(3×35 mL)萃取且合併之有機相經乾燥硫酸鈉，過濾且在減壓下濃縮。層析得到標題化合物。

實例 953B

4-(5-胺基吡啶-2-基氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例274中所述，用4-(5-硝基吡啶-2-基氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替5-硝基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺製備。

實例 953C

4-(5-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)吡啶-2-基氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例272B中所述，用4-(5-胺基吡啶-2-基氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。

實例953D

N-(6-(哌啶-4-基氧基)吡啶-3-基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例2D中所述，用4-(5-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)吡啶-2-基氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例953E

N-{6-[(1-乙醯基哌啶-4-基)氧基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(6-(哌啶-4-基氧基)吡啶-3-基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及乙酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.37 (s, 1H), 8.26 (d, *J*=2.7 Hz, 1H), 7.86 (dd, *J*=8.9, 2.7 Hz, 1H), 7.44-7.24 (m, 4H), 6.75 (d, *J*=8.8 Hz, 1H), 5.21-5.07 (m, 1H), 4.75 (s, 4H), 3.72-3.63 (m, 1H), 3.40-3.11 (m, 2H), 1.97-1.85 (m, 1H), 1.73-1.38 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 495 (M+H)⁺。

表17.

以下實例基本上如實例1C中所述，用N-(6-(哌啶-4-基氧

基)吡啶-3-基)異吡啶啉-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及適
當羧酸代替4-(異吡啶啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
954	N-{6-[(1-異丁醯基吡啶-4-基)氧基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.37 (s, 1H), 8.26 (dd, <i>J</i> =2.7, 0.7 Hz, 1H), 7.86 (dd, <i>J</i> =8.8, 2.7 Hz, 1H), 7.41-7.26 (m, 4H), 6.74 (d, <i>J</i> =8.5 Hz, 1H), 5.21-5.09 (m, 1H), 4.75 (s, 4H), 3.99-3.72 (m, 2H), 3.44-3.14 (m, 2H), 2.98-2.80 (m, 1H), 2.07-1.87 (m, 2H), 1.67-1.42 (m, 2H), 1.00 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 409 (M+H) ⁺
955	N-(6-{[1-(3-甲基丁醯基)吡啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.37 (s, 1H), 8.26 (d, <i>J</i> =2.9 Hz, 1H), 7.85 (dd, <i>J</i> =8.8, 2.7 Hz, 1H), 7.41-7.26 (m, 4H), 6.74 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 1H), 5.21-5.09 (m, 1H), 4.75 (s, 4H), 3.99-3.88 (m, 1H), 3.80-3.67 (m, 1H), 3.45-3.13 (m, 3H), 2.22 (d, <i>J</i> =1.4 Hz, 1H), 2.05-1.87 (m, 3H), 1.65-1.41 (m, 2H), 0.91 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 423 (M+H) ⁺
956	N-(6-{[1-(4,4,4-三氟丁醯基)吡啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.37 (s, 1H), 8.26 (d, <i>J</i> =2.7 Hz, 1H), 7.86 (dd, <i>J</i> =8.8, 2.7 Hz, 1H), 7.42-7.26 (m, 4H), 6.75 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 1H), 5.21-5.09 (m, 1H), 4.75 (s, 4H), 3.98-3.85 (m, 1H), 3.77-3.66 (m, 1H), 3.42-3.15 (m, 2H), 2.68-2.56 (m, 2H), 2.03-1.88 (m, 2H), 1.71-1.41 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 463 (M+H) ⁺
957	N-(6-{[1-(甲氧基乙醯基)吡啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.37 (s, 1H), 8.26 (d, <i>J</i> =2.6 Hz, 1H), 7.86 (dd, <i>J</i> =8.9, 2.7 Hz, 1H), 7.34 (tdd, <i>J</i> =9.0, 5.6, 3.5 Hz, 4H), 6.75 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 1H), 5.25-5.06 (m, 1H), 4.75 (s, 4H), 4.08 (t, <i>J</i> =6.0 Hz, 3H), 3.63 (s, 1H), 3.42-3.11 (m, 5H), 1.96 (s, 2H), 1.59 (d, <i>J</i> =25.8 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 411 (M+H) ⁺
958	N-(6-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)吡啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.38 (s, 1H), 8.26 (d, <i>J</i> =2.7 Hz, 1H), 7.86 (dd, <i>J</i> =8.8, 2.7 Hz, 1H), 7.40-7.28 (m, 4H), 6.75 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 1H), 5.15 (d, <i>J</i> =4.1 Hz, 1H), 4.75 (s, 3H), 4.73-4.63 (m, 1H), 3.92-3.63 (m, 5H), 3.62-3.12 (m, 2H), 2.09-1.89 (m, 2H), 1.89-1.69 (m, 1H), 1.70-1.32 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) ⁺
959	N-(6-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)吡啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.38 (s, 1H), 8.26 (d, <i>J</i> =2.7 Hz, 1H), 7.86 (dd, <i>J</i> =8.8, 2.8 Hz, 1H), 7.40-7.22 (m, 4H), 6.75 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 1H), 5.16 (dq, <i>J</i> =8.2, 4.1 Hz, 1H), 4.75 (bs, 4H), 3.98-3.70 (m, 4H), 3.74-3.63 (m, 2H), 3.45-3.14 (m, 3H), 2.08-1.88 (m, 4H), 1.68-1.43 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 437 (M+H) ⁺
960	N-(6-{[1-(環丙基羰基)吡啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶啉-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.39 (d, <i>J</i> =8.2 Hz, 1H), 8.31-8.20 (m, 1H), 7.91-7.78 (m, 1H), 7.44-7.24 (m, 4H), 6.82-6.68 (m, 1H), 5.27-5.07 (m, 1H), 4.75 (s, 4H), 4.07-3.86 (m, 2H), 3.61-3.46	(ESI(+)) m/e 407 (M+H) ⁺

	1,3-二氫-2H-異 吲哚-2-甲醯胺	(m, 1H), 3.26-3.13 (m, 1H), 2.10-1.86 (m, 3H), 1.70-1.42 (m, 2H), 0.79-0.62 (m, 4H)	
961	N-(6-{[1-(環丙基 乙醯基)哌啶-4- 基]氧基}吡啶-3- 基)-1,3-二氫-2H- 異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.38 (s, 1H), 8.26 (d, <i>J</i> =3.1 Hz, 1H), 7.86 (dd, <i>J</i> =8.9, 2.9 Hz, 1H), 7.43-7.22 (m, 4H), 6.74 (d, <i>J</i> =8.4 Hz, 1H), 5.21-5.09 (m, 1H), 4.75 (bs, 4H), 3.98-3.87 (m, 1H), 3.76-3.64 (m, 1H), 3.38-3.14 (m, 2H), 2.28 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 2H), 2.21-1.89 (m, 2H), 1.67-1.43 (m, 2H), 1.05-0.87 (m, 1H), 0.51-0.35 (m, 2H), 0.22-0.08 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
962	N-(6-{[1-(環丁基 羰基)哌啶-4-基] 氧基}吡啶-3-基)- 1,3-二氫-2H-異 吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.37 (s, 1H), 8.24 (t, <i>J</i> =4.4 Hz, 1H), 7.93-7.77 (m, 1H), 7.44- 7.24 (m, 4H), 6.74 (t, <i>J</i> =6.5 Hz, 1H), 5.23-5.03 (m, 1H), 4.75 (s, 4H), 3.98-3.81 (m, 1H), 3.66-3.50 (m, 1H), 3.27-3.10 (m, 2H), 2.26-1.99 (m, 4H), 1.99-1.80 (m, 3H), 1.80-1.42 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺
963	N-(6-{[1-(環戊基 羰基)哌啶-4-基] 氧基}吡啶-3-基)- 1,3-二氫-2H-異 吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.38 (s, 1H), 8.26 (d, <i>J</i> =2.7 Hz, 1H), 7.85 (dd, <i>J</i> =8.8, 2.7 Hz, 1H), 7.40-7.28 (m, 4H), 6.74 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 1H), 5.21-5.09 (m, 1H), 4.75 (s, 4H), 3.98-3.75 (m, 3H), 3.45-3.31 (m, 1H), 3.26-3.14 (m, 1H), 3.00 (p, <i>J</i> =7.6 Hz, 1H), 2.03-1.87 (m, 2H), 1.81-1.44 (m, 10H)	(ESI(+)) m/e 435 (M+H) ⁺
964	N-(6-{[1-(環戊基 乙醯基)哌啶-4- 基]氧基}吡啶-3- 基)-1,3-二氫-2H- 異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.37 (s, 1H), 8.26 (dd, <i>J</i> =2.7, 0.7 Hz, 1H), 7.85 (dd, <i>J</i> =8.8, 2.7 Hz, 1H), 7.41-7.26 (m, 4H), 6.74 (d, <i>J</i> =8.5 Hz, 1H), 5.20-5.08 (m, 1H), 4.75 (s, 3H), 3.99-3.86 (m, 1H), 3.79-3.68 (m, 1H), 3.25-3.05 (m, 1H), 2.36 (d, <i>J</i> =0.8 Hz, 1H), 2.35-2.06 (m, 3H), 2.04-1.85 (m, 2H), 1.82-1.68 (m, 2H), 1.65-1.40 (m, 6H), 1.23-0.99 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 449 (M+H) ⁺
965	N-(6-{[1-(環己基 羰基)哌啶-4-基] 氧基}吡啶-3-基)- 1,3-二氫-2H-異 吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.37 (s, 1H), 8.26 (d, <i>J</i> =2.3 Hz, 1H), 7.85 (dd, <i>J</i> =8.8, 2.7 Hz, 1H), 7.33 (s, 2H), 6.74 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 1H), 5.21- 5.09 (m, 1H), 4.75 (s, 4H), 3.99-3.72 (m, 2H), 3.25-3.11 (m, 1H), 2.56 (d, <i>J</i> =19.6 Hz, 1H), 2.06- 1.85 (m, 2H), 1.74-1.08 (m, 13H)	(ESI(+)) m/e 449 (M+H) ⁺

實例 966

(2-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}乙基)胺

基甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-胺基苯乙基胺基甲
酸第三丁酯代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替
異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz,

DMSO- d_6) δ ppm 8.26 (s, 1H), 7.50-7.43 (m, 2H), 7.40-7.26 (m, 4H), 7.11-7.03 (m, 2H), 6.87-6.79 (m, 1H), 4.75 (s, 4H), 3.18-3.02 (m, 2H), 2.66-2.58 (m, 2H), 1.37 (s, 9H); MS (ESI(+)) m/e 382 (M+H)⁺。

實例 973

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 808 中所述，在實例 808A 中用(四氫呋喃-3-基)甲胺代替 3-甲基丁-1-胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.76 (s, 1H), 7.82-7.75 (m, 2H), 7.71-7.64 (m, 2H), 7.54 (t, $J=6.1$ Hz, 1H), 7.41-7.25 (m, 4H), 4.80 (bs, 4H), 3.70-3.49 (m, 3H), 2.69 (t, $J=6.7$ Hz, 2H), 2.34-2.16 (m, 1H), 1.94-1.79 (m, 1H), 1.54-1.39 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 402 (M+H)⁺。

實例 974

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-胺基-N-((四氫呋喃-3-基)甲基)苯磺醯胺代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及 1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.83 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.51 (d, $J=$ Hz, 1H), 7.82-7.75 (m, 2H), 7.72-7.65 (m, 2H), 7.55 (t, $J=6.0$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 4.87-4.75 (m, 4H), 3.76-3.49 (m, 3H), 2.69 (t, $J=6.7$

Hz, 2H), 2.34-2.16 (m, 1H), 1.94-1.79 (m, 1H), 1.54-1.39 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 403 (M+H)⁺。

實例 975

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-胺基-N-((四氫呋喃-3-基)甲基)苯磺醯胺代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉-5-甲腈代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 8.83 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.83-7.74 (m, 3H), 7.72-7.64 (m, 2H), 7.59 (d, J=7.9 Hz, 1H), 7.54 (t, J=6.1 Hz, 1H), 4.93-4.76 (m, 4H), 3.70-3.49 (m, 3H), 2.69 (t, J=6.7 Hz, 2H), 2.31-2.05 (m, 1H), 1.94-1.78 (m, 1H), 1.54-1.39 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 427 (M+H)⁺。

實例 979

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺

實例 979A

N-(4-(哌啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺

含 4-(4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯基)-5,6-二氮吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯(1.00 g, 2.38 mmol)之 20 ml 1:1 甲醇/四氫呋喃添加至 50 ml 耐壓瓶中之 5% Pd/碳(濕)(0.200 g)中且在 30 atm 及室溫下攪拌 16 小時。混合物經由耐綸膜過濾且濃縮。殘餘物懸浮於二氯甲烷中，攪拌 1 小時且藉由二

氯甲烷洗滌過濾，得到標題化合物。

實例 979B

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(哌啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及四氫呋喃-3-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.26 (s, 1H), 7.46 (m, 2H), 7.31 (m, 4H), 7.12 (m, 2H), 4.74 (bs, 4H), 4.53 (m, 1H), 4.05 (m, 1H), 3.87 (m, 1H), 3.70 (m, 3H), 3.36 (m, 2H), 3.12 (m, 1H), 2.75-2.58 (m, 1H), 2.01 (m, 2H), 1.76 (m, 2H), 1.45 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 420 (M+H)。

表 18.

以下實例基本上如實例 1C 中所述，用適當胺代替 3-苯基丙-1-胺及適當羧酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
980	N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.26 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.33 (m, 4H), 7.14 (m, 2H), 4.75 (s, 4H), 4.68 (m, 1H), 4.45 (m, 1H), 4.09 (m, 1H), 3.75 (m, 2H), 3.10 (m, 1H), 2.76-2.56 (m, 2H), 2.04 (m, 2H), 1.80 (m, 4H), 1.61-1.33 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) ⁺
981	N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.26 (s, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.33 (m, 4H), 7.12 (m, 2H), 4.75 (bs, 4H), 4.55 (m, 1H), 4.09 (m, 1H), 3.85 (m, 2H), 3.40 (m, 2H), 3.09 (m, 1H), 2.91 (m, 1H), 2.70 (m, 1H), 2.56 (m, 1H), 1.79 (m, 2H), 1.68-1.35 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 434 (M+H) ⁺
982	N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.26 (s, 1H), 7.48 (t, <i>J</i> =10.0 Hz, 2H), 7.32 (m, 4H), 7.10 (d, <i>J</i> =7.5 Hz, 2H), 4.74 (s, 4H), 4.44 (d,	(ESI(+)) m/e 436 (M+H) ⁺

	苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$J=12.2$ Hz, 1H), 4.34 (t, $J=9.2$ Hz, 1H), 4.07 (d, $J=11.4$ Hz, 1H), 3.83-3.56 (m, 4H), 3.50 (m, 2H), 3.08 (m, 1H), 2.66 (m, 2H), 1.78 (m, 2H), 1.67-1.30 (m, 2H)	
983	N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啉-3-基)羰基]吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.26 (s, 1H), 7.46 (d, $J=8.3$ Hz, 2H), 7.31 (m, 4H), 7.11 (d, $J=8.3$ Hz, 2H), 4.74 (s, 4H), 4.52 (d, $J=12.0$ Hz, 1H), 4.01 (d, $J=13.0$ Hz, 1H), 3.25 (m, 1H), 3.06 (m, 1H), 2.71 (m, 2H), 2.63-2.43 (m, 3H), 2.32 (m, 1H), 2.21 (s, 3H), 1.94 (m, 2H), 1.75 (m, 2H), 1.59-1.30 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) $^+$
984	N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.27 (s, 1H), 7.48 (m, 2H), 7.31 (m, 4H), 7.14 (m, 2H), 4.75 (s, 4H), 4.53 (m, 1H), 4.08 (m, 1H), 3.75 (m, 1H), 3.30-3.04 (m, 5H), 2.71 (m, 2H), 2.33 (m, 1H), 2.08 (m, 1H), 1.79 (m, 2H), 1.66-1.36 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 468 (M+H) $^+$
985	N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.26 (s, 1H), 7.48 (m, 2H), 7.31 (m, 4H), 7.11 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 5.37 (s, 1H), 4.74 (s, 4H), 4.53 (m, 2H), 3.30 (m, 1H), 2.71 (m, 2H), 1.76 (d, $J=11.8$ Hz, 2H), 1.50 (m, 2H), 1.32 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) $^+$
986	N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.26 (s, 1H), 7.46 (m, 2H), 7.33 (m, 4H), 7.10 (m, 2H), 4.74 (bs, 4H), 4.46 (m, 1H), 4.13 (m, 1H), 3.57 (m, 4H), 3.06 (m, 3H), 2.71-2.50 (m, 2H), 2.40 (m, 4H), 1.77 (m, 2H), 1.56 (m, 1H), 1.40 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 449 (M+H) $^+$
1469	N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.28 (s, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.32 (m, 4H), 7.13 (m, 2H), 4.75 (s, 4H), 4.70 (m, 1H), 4.48 (m, 1H), 4.10 (m, 1H), 3.76 (m, 2H), 3.08 (m, 1H), 2.69 (m, 2H), 2.03 (m, 2H), 1.81 (m, 4H), 1.54 (m, 1H), 1.42 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) $^+$
1470	N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.28 (s, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.33 (m, 4H), 7.12 (dd, $J=8.3, 2.5$ Hz, 2H), 4.75 (s, 4H), 4.68 (dd, $J=7.5, 5.7$ Hz, 1H), 4.49 (m, 1H), 4.10 (m, 1H), 3.76 (m, 2H), 3.13 (m, 1H), 2.68 (m, 2H), 2.01 (m, 2H), 1.80 (m, 4H), 1.50 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) $^+$
1471	N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	A-1361467.0- ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.28 (s, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.34 (m, 4H), 7.13 (m, 2H), 4.75 (s, 4H), 4.54 (m, 1H), 4.08 (m, 1H), 3.88 (m, 1H), 3.71 (m, 3H), 3.39 (m, 1H), 3.14 (m, 1H), 2.66 (m, 2H), 2.01 (m, 2H), 1.79 (m, 2H), 1.46 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 420 (M+H) $^+$

實例 1013

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)吡啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-

二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺

實例 1013A

4-(4-(異吡啶-2-甲醯胺基)苯氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-(4-胺基苯氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吡啶代替異吡啶-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。

實例 1013B

N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)異吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 2D 中所述，用 4-(4-(異吡啶-2-甲醯胺基)苯氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟異吡啶-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 1013C

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-

二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)異吡啶-2-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及四氫呋喃-3-甲酸代替 4-(異吡啶-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.20 (s, 1H), 7.47-7.27 (m, 6H), 6.93-6.86 (m, 2H), 4.74 (s, 4H), 4.58-4.47 (m, 1H), 3.93-3.56 (m, 6H), 3.44-3.32 (m, 3H), 2.06-1.83 (m, 4H), 1.69-1.40 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 436 (M+H)⁺。

表 19.

以下實例基本上如實例 1C 中所述，用適當胺代替 3-苯基

丙-1-胺及適當酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
1028	N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.20 (s, 1H), 7.42 (dd, <i>J</i> =12.5, 10.6 Hz, 2H), 7.37-7.23 (m, 4H), 6.90 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 4.74 (s, 4H), 4.66-4.42 (m, 1H), 3.90 (s, 2H), 3.45-3.11 (m, 2H), 2.73 (dd, <i>J</i> =13.4, 6.8 Hz, 1H), 1.92 (s, 2H), 1.68-1.12 (m, 4H), 0.98 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 3H), 0.81 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 422 (M+H) ⁺
1029	N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.19 (s, 1H), 7.48-7.38 (m, 2H), 7.33 (tdd, <i>J</i> =8.9, 5.6, 3.5 Hz, 4H), 6.98-6.81 (m, 2H), 4.74 (s, 4H), 4.50 (dt, <i>J</i> =8.0, 4.1 Hz, 1H), 3.85 (s, 1H), 3.69 (s, 1H), 3.21 (d, <i>J</i> =9.3 Hz, 1H), 2.34-2.14 (m, 2H), 2.13-1.80 (m, 3H), 1.53 (d, <i>J</i> =21.1 Hz, 2H), 0.90 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 422 (M+H) ⁺
1030	N-(4-{[1-(2,3-二甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.20 (s, 1H), 7.47-7.27 (m, 6H), 6.94-6.86 (m, 2H), 4.74 (s, 4H), 4.72-4.47 (m, 1H), 4.02-3.76 (m, 2H), 3.50-3.12 (m, 2H), 2.00-1.63 (m, 3H), 1.63-1.39 (m, 2H), 0.95 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 3H), 0.85 (t, <i>J</i> =6.6 Hz, 6H)	(ESI(+)) m/e 436 (M+H) ⁺
1031	N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.20 (s, 1H), 7.44 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 7.34 (tdd, <i>J</i> =8.9, 5.5, 3.5 Hz, 4H), 6.90 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 4.74 (s, 4H), 4.70-4.63 (m, 1H), 4.51 (s, 1H), 3.80-3.68 (m, 4H), 3.47-3.08 (m, 2H), 2.13-1.68 (m, 6H), 1.66-1.33 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 436 (M+H) ⁺
1032	N-(4-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.18 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 1H), 7.48-7.39 (m, 2H), 7.39-7.22 (m, 4H), 6.96-6.81 (m, 2H), 4.74 (s, 4H), 4.56-4.41 (m, 1H), 3.97-3.64 (m, 2H), 3.28-3.10 (m, 2H), 2.67-2.54 (m, 1H), 2.02-1.78 (m, 2H), 1.74-1.39 (m, 7H), 1.39-1.04 (m, 5H)	(ESI(+)) m/e 448 (M+H) ⁺
1033	N-(4-{[1-(環己基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.20 (s, 1H), 7.41 (t, <i>J</i> =11.1 Hz, 2H), 7.37-7.20 (m, 4H), 6.89 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 4.74 (s, 4H), 4.57-4.38 (m, 1H), 3.77 (d, <i>J</i> =47.0 Hz, 2H), 3.21 (t, <i>J</i> =9.7 Hz, 2H), 2.20 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 2H), 1.89 (s, 2H), 1.60 (t, <i>J</i> =30.4 Hz, 8H), 1.17 (dd, <i>J</i> =28.3, 16.2 Hz, 3H), 0.94 (t, <i>J</i> =11.4 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 462 (M+H) ⁺
1034	N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.20 (s, 1H), 7.40 (dd, <i>J</i> =19.8, 6.3 Hz, 3H), 7.36-7.23 (m, 3H), 6.89 (d, <i>J</i> =9.0 Hz, 2H), 4.74 (s, 4H), 4.50 (s, 1H), 3.95-3.64 (m, 4H), 3.28-3.14 (m, 4H), 2.27 (d, <i>J</i> =6.4 Hz, 2H), 1.91 (d, <i>J</i> =3.7 Hz, 3H), 1.55 (t,	(ESI(+)) m/e 464 (M+H) ⁺

N-[4-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-2-甲基丁醯基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(3-甲基丁醯基)胺基]氧雜環丁烷-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

4-({4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}磺醯基)哌啶-1-甲酸第三丁酯；

N-{4-[4-(丙基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(1,4-二噁烷-2-基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯

	2-甲醯胺	$J=18.1$ Hz, 4H), 1.32-1.07 (m, 2H)	
1035	N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)吡啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 10.01 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.43 (t, $J=13.2$ Hz, 2H), 7.37-7.24 (m, 3H), 6.91 (d, $J=9.1$ Hz, 2H), 4.74 (s, 4H), 4.71-4.45 (m, 1H), 4.37 (s, 2H), 4.04-3.71 (m, 6H), 3.56 (d, $J=15.9$ Hz, 2H), 3.47-3.20 (m, 4H), 3.13 (s, 2H), 1.97 (s, 2H), 1.62 (dd, $J=33.2$, 8.7 Hz, 2H)	(ESI(+)) m/e 465 (M+H) $^+$
1036	N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)吡啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.20 (s, 1H), 7.51-7.35 (m, 3H), 7.35-7.23 (m, 3H), 6.89 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 4.74 (s, 4H), 4.50 (dd, $J=7.7$, 3.9 Hz, 1H), 3.92-3.71 (m, 3H), 3.71-3.52 (m, 2H), 3.22 (dd, $J=9.8$, 4.3 Hz, 3H), 2.45 (s, 3H), 2.13-1.80 (m, 3H), 1.67-1.37 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 450 (M+H) $^+$

實例 1018

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

實例 1018A

N-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺

2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶二鹽酸鹽(1.55 g, 8.03 mmol)懸浮於二甲基甲醯胺(30 ml)中且用三異丙基乙胺(4.21 ml, 24.08 mmol)處理。攪拌20分鐘後，混合物冷卻至-15℃。2-(4-異氰酸酯基苯基)-4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉(2.028 g, 8.03 mmol)溶於10 ml四氫呋喃中且經由注射器經10分鐘添加。混合物升溫至室溫且其攪拌3小時並在氮氣流下濃縮至最少體積。殘餘物用冷水稀釋，得到混濁混合物，其藉由水洗過濾，乾燥後得到標題化合物。

實例 1018B

4-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)環己-3-烯基胺基甲酸第三丁酯

N-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺(1.692 g, 4.63 mmol)、三氟甲烷磺酸4-(第三丁氧基羰基胺基)環己-1-烯基酯(1.6 g, 4.63 mmol)及碳酸鉍(3.77 g, 11.58 mmol)懸浮於四氫呋喃(30 ml)、甲醇(5.00 ml)及水(15.00 ml)中。氮氣鼓泡穿過溶液，歷時10分鐘，此時添加PdCl₂(dppf)-二氯甲烷加合物(0.189 g, 0.232 mmol)且混合物加熱至80℃，保持7小時。用乙酸乙酯及鹽水稀釋後，分離之水層用乙酸乙酯萃取若干次且合併之有機層經硫酸鎂乾燥，過濾且濃縮。進行急驟層析，得到標題化合物。

實例1018C

N-(4-(4-胺基環己-1-烯基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺

標題化合物如實例2D中所述，用4-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)環己-3-烯基胺基甲酸第三丁酯代替4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例1018D

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(4-(4-胺基環己-1-烯基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及異丁酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 8.61 (s, 1H),

8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 7.66 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.56-7.48 (m, 2H), 7.43 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.37-7.29 (m, 2H), 6.06-5.99 (m, 1H), 4.83-4.77 (m, 4H), 3.87-3.73 (m, 1H), 2.37 (t, $J=6.7$ Hz, 2H), 2.11-1.97 (m, 1H), 1.95-1.82 (m, 1H), 1.80-1.50 (m, 1H), 1.38-1.20 (m, 2H), 1.00 (dd, $J=6.8, 2.5$ Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 405 ($M+H$)⁺。

表 20.

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(4-胺基環己-1-烯基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及適當羧酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
1022	N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.91 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 7.52 (d, $J=8.6$ Hz, 2H), 7.43 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.33 (d, $J=8.6$ Hz, 2H), 6.02 (s, 1H), 4.80 (d, $J=4.1$ Hz, 4H), 3.84 (td, $J=8.1, 3.7$ Hz, 2H), 3.76-3.52 (m, 3H), 2.93 (p, $J=7.7$ Hz, 1H), 2.11-1.79 (m, 5H), 1.60 (s, 1H)	(ESI(+)) m/e 433 ($M+H$) ⁺
1023	N-(4-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.77-7.69 (m, 1H), 7.56-7.48 (m, 2H), 7.43 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.37-7.29 (m, 2H), 6.02 (bs, 1H), 4.84-4.72 (m, 4H), 3.90-3.78 (m, 4H), 2.48-2.41 (m, 2H), 2.36 (s, 2H), 2.11-1.98 (m, 1H), 1.93-1.81 (m, 1H), 1.69-1.52 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 447 ($M+H$) ⁺
1024	N-(4-{4-[(嗎啉-4-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.62 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J=8.7$ Hz, 2H), 7.43 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.33 (d, $J=8.7$ Hz, 2H), 6.02 (s, 1H), 4.80 (d, $J=4.2$ Hz, 4H), 3.91 (s, 1H), 3.64-3.49 (m, 5H), 2.92 (s, 2H), 2.41 (dd, $J=12.8, 8.2$ Hz, 5H), 2.18 (s, 1H), 1.86 (s, 1H), 1.77-1.59 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 462 ($M+H$) ⁺
1025	N-[4-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己-1-烯-1-	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.59-7.49 (m, 3H), 7.43 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.37-7.30 (m,	(ESI(+)) m/e 451 ($M+H$) ⁺

	基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 6.03 (bs, 1H), 4.83-4.77 (m, 4H), 3.88 (s, 4H), 3.60 (d, <i>J</i> =3.8 Hz, 2H), 3.48 (d, <i>J</i> =2.8 Hz, 2H), 3.25 (s, 3H), 2.36-1.97 (m, 3H), 1.93-1.82 (m, 1H), 1.77-1.57 (m, 1H)	
1081	N-(4-{4-[(四氫呋喃-2-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.79 (d, <i>J</i> =7.4 Hz, 1H), 7.52 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.33 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 2H), 6.02 (s, 1H), 4.80 (d, <i>J</i> =4.0 Hz, 4H), 4.07 (p, <i>J</i> =6.7 Hz, 1H), 3.83 (s, 1H), 3.73 (dd, <i>J</i> =14.2, 7.3 Hz, 1H), 3.58 (dd, <i>J</i> =14.5, 7.6 Hz, 1H), 2.45 (s, 2H), 2.34 (dd, <i>J</i> =13.8, 6.9 Hz, 2H), 2.28-2.16 (m, 1H), 2.11-1.96 (m, 1H), 1.96-1.71 (m, 4H), 1.68-1.39 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 447 (M+H) ⁺
1082	N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.84 (d, <i>J</i> =7.6 Hz, 1H), 7.52 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.36-7.29 (m, 2H), 6.02 (bs, 1H), 4.83-4.77 (m, 4H), 3.91-3.79 (m, 1H), 3.78-3.67 (m, 1H), 3.66-3.55 (m, 1H), 3.26 (q, <i>J</i> =3.7 Hz, 1H), 2.44 (dd, <i>J</i> =10.1, 4.1 Hz, 2H), 2.41-2.33 (m, 1H), 2.21-2.12 (m, 1H), 2.11-1.82 (m, 4H), 1.67-1.41 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 447 (M+H) ⁺
1083	N-(4-{4-[(環己基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.62 (d, <i>J</i> =7.6 Hz, 1H), 7.56-7.48 (m, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.36-7.29 (m, 2H), 6.01 (bs, 1H), 4.83-4.77 (m, 4H), 3.84-3.74 (m, 1H), 2.43-2.29 (m, 2H), 2.29-1.97 (m, 2H), 1.91-1.80 (m, 1H), 1.74-1.48 (m, 6H), 1.43-1.03 (m, 5H)	(ESI(+)) m/e 445 (M+H) ⁺
1084	N-[4-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.12 (d, <i>J</i> =7.4 Hz, 1H), 8.10-8.05 (m, 1H), 7.53 (d, <i>J</i> =8.8 Hz, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.34 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 2H), 6.02 (s, 1H), 4.80 (d, <i>J</i> =4.1 Hz, 4H), 3.85 (s, 1H), 3.21 (ddd, <i>J</i> =16.3, 11.0, 6.6 Hz, 3H), 3.14-2.96 (m, 2H), 2.31 (dd, <i>J</i> =12.3, 6.1 Hz, 2H), 2.19-1.97 (m, 2H), 1.88 (s, 1H), 1.62 (s, 1H)	(ESI(+)) m/e 481 (M+H) ⁺
1085	N-[4-(4-{[(4,4-二氟環己基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.80 (d, <i>J</i> =7.5 Hz, 1H), 7.56-7.48 (m, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.37-7.29 (m, 2H), 6.02 (bs, 1H), 4.83-4.77 (m, 4H), 3.89-3.77 (m, 1H), 2.41 (d, <i>J</i> =23.9 Hz, 1H), 2.24-2.14 (m, 1H), 2.12-1.96 (m, 4H), 1.80 (d, <i>J</i> =22.0 Hz, 4H), 1.70-1.50 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 481 (M+H) ⁺
1086	N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.56-7.49 (m, 2H), 7.42 (d, <i>J</i> =3.1 Hz, 2H), 7.37-7.30 (m, 2H), 6.03 (bs, 1H), 5.38 (s, 1H), 4.84-4.72 (m, 4H), 3.89-3.79 (m, 1H), 2.35 (s, 1H), 2.39-2.05 (m, 2H), 1.80 (d, <i>J</i> =19.6 Hz, 1H), 1.77-1.61 (m,	(ESI(+)) m/e 421 (M+H) ⁺

	甲醯胺	¹ H), 1.25 (s, 6H)	
1087	N-(4-{4-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.65-7.54 (m, 1H), 7.52 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.33 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 2H), 6.02 (s, 1H), 4.80 (d, <i>J</i> =4.0 Hz, 4H), 4.20 (dd, <i>J</i> =8.1, 5.1 Hz, 1H), 3.89 (dd, <i>J</i> =13.8, 7.1 Hz, 2H), 3.76 (dd, <i>J</i> =14.4, 6.7 Hz, 1H), 2.30 (dd, <i>J</i> =28.6, 11.2 Hz, 1H), 2.26-2.01 (m, 3H), 1.93-1.60 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) ⁺
1291	N-(4-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.67 (d, <i>J</i> =7.6 Hz, 1H), 7.56-7.49 (m, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.37-7.29 (m, 2H), 6.02 (bs, 1H), 4.84-4.77 (m, 4H), 3.92-3.75 (m, 1H), 2.42 (d, <i>J</i> =23.1 Hz, 2H), 2.10-2.03 (m, 1H), 1.99 (d, <i>J</i> =7.0 Hz, 2H), 1.94-1.84 (m, 1H), 1.83-1.51 (m, 1H), 1.05-0.88 (m, 1H), 0.43 (dd, <i>J</i> =9.8, 4.2 Hz, 2H), 0.21-0.07 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 417 (M+H) ⁺
1442	N-[4-(4-{[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.59-7.49 (m, 3H), 7.43 (d, <i>J</i> =4.6 Hz, 1H), 7.37-7.30 (m, 2H), 6.06-5.98 (m, 1H), 5.75 (s, 1H), 4.84-4.77 (m, 4H), 4.00-3.85 (m, 1H), 3.05-2.90 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.32-2.13 (m, 5H), 2.12 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.91-1.80 (m, 1H), 1.75-1.61 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 475 (M+H) ⁺
1443	N-(4-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.65-8.57 (m, 1H), 8.55-8.45 (m, 1H), 8.44-8.36 (m, 2H), 7.88-7.75 (m, 1H), 7.60-7.47 (m, 2H), 7.47-7.37 (m, 1H), 7.36-7.24 (m, 2H), 6.07-5.86 (m, 1H), 4.87-4.62 (m, 4H), 3.90-3.68 (m, 2H), 3.29-3.17 (m, 2H), 2.45-2.28 (m, 2H), 2.09-1.91 (m, 4H), 1.93-1.79 (m, 2H), 1.64-1.42 (m, 3H), 1.28-1.07 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 461 (M+H) ⁺
1444	N-{4-[4-(苯甲醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.49 (t, <i>J</i> =4.7 Hz, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> =7.7 Hz, 1H), 7.91-7.83 (m, 2H), 7.57-7.41 (m, 6H), 7.38-7.28 (m, 2H), 6.07 (d, <i>J</i> =1.8 Hz, 1H), 4.87-4.71 (m, 4H), 4.16-3.95 (m, 1H), 2.35-2.19 (m, 2H), 2.08-1.93 (m, 2H), 1.81-1.65 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 439 (M+H) ⁺
1445	N-[4-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.62 (d, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 8.54-8.45 (m, 1H), 8.44-8.35 (m, 1H), 7.63-7.54 (m, 1H), 7.56-7.46 (m, 2H), 7.46-7.38 (m, 1H), 7.33 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 2H), 6.06-5.90 (m, 1H), 4.86-4.65 (m, 4H), 4.26-4.11 (m, 1H), 3.94-3.80 (m, 2H), 3.80-3.62 (m, 1H), 2.40-2.25 (m, 2H), 2.27-2.02 (m, 2H), 1.92-1.77 (m, 4H), 1.75-1.60 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) ⁺
1446	N-[4-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.53-8.44 (m, 1H), 8.41 (d, <i>J</i> =6.7 Hz, 1H), 7.65-7.56 (m, 1H), 7.56-7.47 (m, 2H), 7.46-7.39 (m,	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) ⁺

	胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =8.7 Hz, 2H), 6.01 (t, <i>J</i> =4.3 Hz, 1H), 4.80 (d, <i>J</i> =4.0 Hz, 4H), 4.24-4.16 (m, 1H), 3.93-3.82 (m, 3H), 3.80-3.70 (m, 1H), 2.33 (dd, <i>J</i> =5.3, 3.1 Hz, 1H), 2.24-2.01 (m, 3H), 2.01-1.63 (m, 5H)	
1447	N-[4-(4-{(1-甲基哌啶-4-基)羰基}胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.68-8.56 (m, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.70 (d, <i>J</i> =7.6 Hz, 1H), 7.56-7.48 (m, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.2 Hz, 1H), 7.37-7.29 (m, 2H), 6.02 (bs, 1H), 4.83-4.77 (m, 4H), 3.86-3.76 (m, 1H), 2.81-2.70 (m, 3H), 2.38-2.25 (m, 1H), 2.13 (s, 3H), 2.10-1.97 (m, 2H), 1.90-1.74 (m, 3H), 1.68-1.49 (m, 5H)	(ESI(+)) m/e 460 (M+H) ⁺
1448	N-[4-(4-{(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基}胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.92 (d, <i>J</i> =7.5 Hz, 1H), 7.56-7.49 (m, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.37-7.29 (m, 2H), 6.02 (bs, 1H), 4.87-4.77 (m, 4H), 3.83 (d, <i>J</i> =3.0 Hz, 1H), 3.16-3.01 (m, 4H), 2.42 (d, <i>J</i> =24.4 Hz, 4H), 2.11-1.91 (m, 5H), 1.93-1.78 (m, 1H), 1.72-1.52 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 495 (M+H) ⁺
1449	N-[4-(4-{(3R)-四氫呋喃-3-基羰基}胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.92 (d, <i>J</i> =7.5 Hz, 1H), 7.56-7.49 (m, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.37-7.29 (m, 2H), 6.02 (bs, 1H), 4.88-4.72 (m, 4H), 3.84 (td, <i>J</i> =8.1, 3.8 Hz, 2H), 3.76-3.55 (m, 3H), 2.93 (p, <i>J</i> =7.6 Hz, 1H), 2.42 (d, <i>J</i> =19.4 Hz, 3H), 2.12-1.84 (m, 4H), 1.69-1.51 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) ⁺
1450	N-[4-(4-{(3S)-四氫呋喃-3-基羰基}胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 7.91 (d, <i>J</i> =7.6 Hz, 1H), 7.54 (s, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.37-7.29 (m, 2H), 6.02 (bs, 1H), 4.85-4.72 (m, 4H), 3.84 (td, <i>J</i> =8.1, 3.8 Hz, 2H), 3.78-3.55 (m, 3H), 2.93 (p, <i>J</i> =7.7 Hz, 1H), 2.43 (d, <i>J</i> =18.2 Hz, 2H), 2.11-1.79 (m, 4H), 1.60 (s, 1H)	(ESI(+)) m/e 433 (M+H) ⁺
1451	N-[4-(4-{(2S)-2-甲基丁醯基}胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.53-8.43 (m, 1H), 8.42 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 1H), 7.76-7.62 (m, 1H), 7.56-7.46 (m, 2H), 7.49-7.36 (m, 1H), 7.35-7.28 (m, 2H), 6.05-5.94 (m, 1H), 4.91-4.65 (m, 4H), 4.06-3.70 (m, 1H), 2.48-2.31 (m, 2H), 2.24-1.98 (m, 2H), 1.94-1.77 (m, 1H), 1.70-1.40 (m, 2H), 1.39-1.14 (m, 2H), 1.04-0.86 (m, 3H), 0.82 (td, <i>J</i> =7.4, 3.3 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 419 (M+H) ⁺

實例 1020

3-{[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]甲基}氮雜環丁

烷-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例272B中所述，用3-(胺基甲基)氮雜環丁烷-1-甲酸第三丁酯代替4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吡啶代替異吡啶-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 7.37-7.23 (m, 4H), 6.58-6.48 (m, 1H), 4.58 (s, 4H), 3.91-3.75 (m, 2H), 3.65-3.51 (m, 2H), 3.30-3.20 (m, 2H), 2.68-2.55 (m, 1H), 1.35 (s, 9H); MS (ESI(+)) m/e 332 (M+H)⁺。

實例 1021

[(1-{4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}氮雜環丁烷-3-基)甲基]胺基甲酸第三丁酯

實例 1021A

(1-(4-硝基苯基)氮雜環丁烷-3-基)甲基胺基甲酸第三丁酯

1-氟-4-硝基苯(0.61 g, 4.32 mmol)及氮雜環丁烷-3-基甲基胺基甲酸第三丁酯(0.886 g, 4.76 mmol)於二甲基甲醯胺(8.65 ml)中之溶液用碳酸鉀(0.896 g, 6.48 mmol)處理且懸浮液在55°C(12 pm)下加熱3小時且在周圍溫度下16小時。反應物傾倒至水中且過濾懸浮液。固體用水洗滌並乾燥，得到標題化合物。

實例 1021B

(1-(4-胺基苯基)氮雜環丁烷-3-基)甲基胺基甲酸第三丁酯

標題化合物如實例272A中所述，用(1-(4-硝基苯基)氮雜環丁烷-3-基)甲基胺基甲酸第三丁酯代替4-硝基-N-丙基苯甲醯胺製備。

實例 1021C

[(1-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}氮雜環
丁烷-3-基)甲基]胺基甲酸第三丁酯

標題化合物如實例272B中所述，用(1-(4-胺基苯基)氮雜環丁烷-3-基)甲基胺基甲酸第三丁酯代替4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。

^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 8.03 (s, 1H), 7.39-7.25 (m, 6H), 7.07-6.94 (m, 1H), 6.33 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 4.72 (s, 4H), 3.75 (t, $J=7.4$ Hz, 2H), 3.48-3.40 (m, 2H), 3.22-3.14 (m, 2H), 2.76-2.65 (m, 1H), 1.38 (s, 9H); MS (ESI(+)) m/e 423 ($M+H$) $^+$ 。

實例1046

N-[4-({[4-(乙醯基胺基)苯基]磺醯基}胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例883中所述，用N-(4-胺基苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及4-(乙醯基胺基)苯基]磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。 ^1H NMR (400 MHz, DMSO- D_2O , 溫度=90°C) δ ppm 8.72 (s, 1H) 8.62 (d, $J=4.88$ Hz, 1H) 7.73 (d, $J=5.49$ Hz, 1H) 7.61-7.69 (m, 4 H) 7.36 (d, $J=8.54$ Hz, 2 H) 6.98 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 4.88 (d, $J=7.02$ Hz, 4 H) 2.00-2.10 (m, 3 H); MS (APCI(+)) m/e 452 ($M+H$) $^+$ 。

實例1047

N-{4-[(丙基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例883中所述，用N-(4-胺基苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及丙基磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.72 (s, 1H) 8.62 (d, *J*=5.49 Hz, 1H) 7.73 (d, *J*=5.49 Hz, 1H) 7.46 (d, *J*=8.54 Hz, 2 H) 7.14 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 4.91 (d, *J*=6.10 Hz, 4 H) 2.98-3.06 (m, 2 H) 1.66-1.78 (m, 2 H) 0.96 (t, *J*=7.48 Hz, 3 H); MS (APCI(+)) *m/e* 361 (M+H)⁺。

實例1048

N-(4-{[(4-丙基苯基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例883中所述，用N-(4-胺基苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及(4-丙基苯基)磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 9.90 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.49 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.64-7.58 (m, 2H), 7.45-7.33 (m, 4H), 7.33 (s, 1H), 6.99-6.92 (m, 2H), 4.79-4.72 (m, 4H), 2.57 (dd, *J*=17.1, 9.3 Hz, 1H), 1.65-1.49 (m, 2H), 0.86 (t, *J*=7.3 Hz, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 437 (M+H)⁺。

實例1049

N-{4-[(丁基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例883中所述，用N-(4-胺基苯基)-1H-吡

咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及丁基磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.71 (s, 1H) 8.61 (d, *J*=5.19 Hz, 1H) 7.70 (d, *J*=5.49 Hz, 1H) 7.47 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 7.14 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 4.90 (d, *J*=3.66 Hz, 4 H) 2.97-3.08 (m, 2 H) 1.61-1.72 (m, 2 H) 1.30-1.44 (m, 2 H) 0.85 (t, *J*=7.32 Hz, 3 H); MS (APCI(+)) *m/e* 375 (M+H)⁺。

O

實例 1050

N-{4-[(1S,4R)-7,7-二甲基-2-側氧基雙環[2.2.1]庚-1-基]甲基}磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例883中所述，用N-(4-胺基苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及(1S,4R)-7,7-二甲基-2-側氧基雙環[2.2.1]庚-1-基]甲基}磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。

O

¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.72 (s, 1H) 8.61 (d, *J*=5.19 Hz, 1H) 7.71 (d, *J*=5.49 Hz, 1H) 7.49 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 7.18 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 4.90 (d, *J*=3.97 Hz, 4 H) 2.81 (s, 2 H) 2.27-2.41 (m, 2 H) 2.07 (t, *J*=4.43 Hz, 1H) 1.94-2.03 (m, 2 H) 1.34-1.66 (m, 2 H) 1.02 (s, 3 H) 0.79 (s, 3 H); MS (APCI(+)) *m/e* 469 (M+H)⁺。

實例 1051

N-{4-[(乙基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]

基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環戊基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫-2H-哌喃-4-基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(嗎啉-4-基羰基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環丙基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(丁-2-基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例883中所述，用N-(4-胺基苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及乙基磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.70-8.75 (m, 1H) 8.60-8.64 (m, *J*=5.65, 5.65 Hz, 1H) 7.74 (d, *J*=5.19 Hz, 1H) 7.46 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 7.15 (d, *J*=8.54 Hz, 2 H) 4.91 (d, *J*=7.02 Hz, 4 H) 3.04 (q, *J*=7.32 Hz, 2 H) 1.23 (t, *J*=7.32 Hz, 3 H); MS (APCI(+)) *m/e* 347 (M+H)⁺。

實例1052

N-{4-[(苯甲基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例883中所述，用N-(4-胺基苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及苯甲基磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.72 (s, 1H) 8.61 (d, *J*=4.88 Hz, 1H) 7.70 (d, *J*=5.19 Hz, 1H) 7.46 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 7.28-7.37 (m, 5 H) 7.11 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 4.90 (d, *J*=3.05 Hz, 4 H) 4.37 (s, 2 H); MS (APCI(+)) *m/e* 409 (M+H)⁺。

實例1053

N-(4-{[(4-氟苯基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例883中所述，用N-(4-胺基苯基)-1H-吡

咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及(4-氟苯基)磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.71 (s, 1H) 8.61 (d, $J=5.19$ Hz, 1H) 7.78 (dd, $J=8.85, 5.19$ Hz, 2 H) 7.67-7.73 (m, 1H) 7.28-7.43 (m, 4 H) 6.98 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 4.87 (d, $J=4.27$ Hz, 4 H); MS (APCI(+)) m/e 412(M+H)⁺。

實例 1054

○ N-{4-[(噻吩-2-基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例883中所述，用N-(4-胺基苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及噻吩-2-基磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.70 (s, 1H) 8.61 (d, $J=4.88$ Hz, 1H) 7.81 (d, $J=4.88$ Hz, 1H) 7.69 (d, $J=5.19$ Hz, 1H) 7.49 (d, $J=2.75$ Hz, 1H) 7.42 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.09-7.13 (m, 1H) 7.04 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 4.88 (d, $J=3.36$ Hz, 4 H); MS (APCI(+)) m/e 401 (M+H)⁺。

實例 1088

○ N-[4-(哌啶-1-基磺醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例272B中所述，用4-(哌啶-1-基磺醯基)苯胺代替4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及1,3-二氫-2H-吡咯并

[3,4-c]吡啶代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.89 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.51 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 7.86-7.79 (m, 2H), 7.66-7.59 (m, 2H), 7.44 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 4.89-4.76 (m, 4H), 3.25-3.00 (m, 1H), 2.95-2.82 (m, 4H), 1.57-1.44 (m, 4H), 1.41-1.31 (m, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 387 (M+H)⁺。

實例 1246

1-{4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}氮雜環丁烷-3-甲酸甲酯

實例 1246A

1-(4-硝基苯基)氮雜環丁烷-3-甲酸甲酯

氮雜環丁烷-3-甲酸甲酯鹽酸鹽(1.236 g, 8.15 mmol)及 N-甲基嗎啉(2.338 ml, 21.26 mmol)於二甲基甲醯胺(10 mL)中之溶液用 1-氟-4-硝基苯(1 g, 7.09 mmol)於二甲基甲醯胺(7 mL)中之溶液處理且反應物在室溫下攪拌 60 小時。添加水(50 mL)且所得懸浮液攪拌 10 分鐘並過濾。收集之固體用水洗滌且真空乾燥。對收集之固體進行急驟層析，得到標題化合物。

實例 1246B

1-(4-胺基苯基)氮雜環丁烷-3-甲酸甲酯

標題化合物如實例 272A 中所述，用 1-(4-硝基苯基)氮雜環丁烷-3-甲酸甲酯代替 4-硝基-N-丙基苯甲醯胺製備。

實例 1246C

1-{4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]苯

基}氮雜環丁烷-3-甲酸甲酯

標題化合物如實例272B中所述，用1-(4-胺基苯基)氮雜環丁烷-3-甲酸甲酯代替4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.42 (d, *J*=5.1 Hz, 1H), 7.36-7.29 (m, 2H), 6.44-6.37 (m, 2H), 4.80-4.72 (m, 4H), 4.02-3.93 (m, 2H), 3.86-3.77 (m, 2H), 3.68 (s, 3H), 3.66-3.56 (m, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 353 (M+H)⁺。

實例1247

N-(4-{3-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

實例1247A

1-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)氮
雜環丁烷-3-甲酸

標題化合物如實例1B中所述，用1-{4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羧基)胺基]苯基}氮雜環丁烷-3-甲酸甲酯代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯製備。

實例1247B

N-(4-{3-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用3-甲基丁-1-胺代替3-苯基丙-1-胺及1-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)氮雜環丁烷-3-甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺

基)苯甲酸製備。 ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.49 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.90 (t, $J=5.5$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J=4.8$ Hz, 1H), 7.34-7.27 (m, 2H), 6.41-6.34 (m, 2H), 4.79-4.73 (m, 4H), 3.94-3.85 (m, 2H), 3.76-3.69 (m, 2H), 3.47-3.36 (m, 1H), 3.13-3.04 (m, 2H), 1.65-1.48 (m, 1H), 1.35-1.24 (m, 2H), 0.87 (d, $J=6.6$ Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 408 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ 。

實例 1248

N-(4-{3-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用(四氫呋喃-2-基)甲胺代替 3-苯基丙-1-胺及 1-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)氮雜環丁烷-3-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。 ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.49 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.05 (t, $J=5.8$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.35-7.27 (m, 2H), 6.41-6.34 (m, 2H), 4.79-4.73 (m, 4H), 3.94-3.68 (m, 6H), 3.68-3.55 (m, 1H), 3.54-3.39 (m, 1H), 3.20-3.07 (m, 2H), 1.93-1.71 (m, 3H), 1.55-1.41 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 422 ($\text{M}+\text{H}$) $^+$ 。

實例 1249

N-(4-{3-[(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用(四氫-2H-呋喃-4-基)甲

胺代替3-苯基丙-1-胺及1-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)氮雜環丁烷-3-甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.49 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.97 (t, *J*=5.8 Hz, 1H), 7.42 (d, *J*=5.1 Hz, 1H), 7.34-7.27 (m, 2H), 6.41-6.34 (m, 2H), 4.79-4.73 (m, 4H), 3.95-3.86 (m, 2H), 3.86-3.78 (m, 2H), 3.77-3.69 (m, 2H), 3.51-3.40 (m, 1H), 3.31-3.19 (m, 2H), 3.02-2.94 (m, 2H), 1.69-1.48 (m, 3H), 1.22-1.04 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 436 (M+H)⁺。

實例1250

N-{4-[3-(苯甲基胺甲醯基)氮雜環丁烷-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用苯甲胺代替3-苯基丙-1-胺及1-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)氮雜環丁烷-3-甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.53-8.45 (m, 2H), 8.13 (s, 1H), 7.42 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 7.37-7.22 (m, 7H), 6.43-6.35 (m, 2H), 4.76 (m, 4H), 4.30 (d, *J*=5.9 Hz, 2H), 3.99-3.88 (m, 2H), 3.83-3.72 (m, 2H), 3.57-3.46 (m, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 428 (M+H)⁺。

實例1251

N-{4-[3-(環戊基胺甲醯基)氮雜環丁烷-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用環戊胺代替3-苯基丙-

1-胺及1-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)氮雜環丁烷-3-甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.49 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.91 (d, *J*=7.2 Hz, 1H), 7.42 (d, *J*=5.1 Hz, 1H), 7.34-7.27 (m, 2H), 6.41-6.33 (m, 2H), 4.79-4.73 (m, 4H), 4.06-3.94 (m, 1H), 3.92-3.84 (m, 2H), 3.76-3.66 (m, 2H), 3.46-3.33 (m, 1H), 1.86-1.72 (m, 2H), 1.67-1.30 (m, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 406 (M+H)⁺。

實例 1252

N-(4-{3-[(環戊基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用環戊基甲胺代替3-苯基丙-1-胺及1-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)氮雜環丁烷-3-甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.49 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.96 (t, *J*=5.7 Hz, 1H), 7.42 (d, *J*=4.7 Hz, 1H), 7.34-7.27 (m, 2H), 6.41-6.33 (m, 2H), 4.81-4.72 (m, 4H), 3.94-3.85 (m, 2H), 3.77-3.68 (m, 2H), 3.50-3.37 (m, 1H), 3.04-2.97 (m, 2H), 2.04-1.89 (m, 1H), 1.71-1.39 (m, 6H), 1.25-1.08 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 420 (M+H)⁺。

實例 1253

N-(4-{3-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯

基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用2-甲氧基乙-1-基胺代替3-苯基丙-1-胺及1-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)氮雜環丁烷-3-甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.49 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.05 (t, *J*=5.5 Hz, 1H), 7.42 (d, *J*=5.1 Hz, 1H), 7.35-7.27 (m, 2H), 6.42-6.34 (m, 2H), 4.79-4.73 (m, 4H), 3.93-3.86 (m, 2H), 3.73 (t, *J*=6.6 Hz, 2H), 3.52-3.41 (m, 1H), 3.38-3.30 (m, 2H), 3.27-3.21 (m, 5H); MS (ESI(+)) *m/e* 396 (M+H)⁺。

實例1268

N-(6-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用(S)-(四氫呋喃-2-基)甲胺代替3-苯基丙-1-胺及6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)噻嗪-3-甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 10.03 (s, 1H), 8.85 (t, *J*=6.1 Hz, 1H), 8.32 (d, *J*=9.3 Hz, 1H), 8.12 (d, *J*=9.3 Hz, 1H), 7.41-7.28 (m, 4H), 5.04-4.72 (m, 4H), 4.04 (p, *J*=6.2 Hz, 1H), 3.85-3.74 (m, 1H), 3.69-3.58 (m, 1H), 3.38 (dd, *J*=11.2, 5.0 Hz, 2H), 2.01-1.74 (m, 3H), 1.71-1.54 (m, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 368 (M+H)⁺。

實例1285

N-{4-[(4-氟苯基)(3-甲基丁醯基)胺基]丁基}-1,3-二氫-

2H-異吡啶-2-甲醯胺

實例 1285A

4-(4-氟苯甲基胺基)丁基胺基甲酸第三丁酯

4-溴丁基胺基甲酸第三丁酯(0.735 g, 2.91毫莫耳)、(4-氟苯基)甲胺(0.333 g, 2.91毫莫耳)及碳酸鉀(0.806 g, 5.83毫莫耳)在100℃下於乙腈(15 mL)中攪拌1小時。反應混合物冷卻，濃縮溶劑且殘餘物溶解於二氯甲烷中且用水洗滌兩次。有機層合併，經硫酸鎂乾燥，過濾且濃縮，得到標題化合物，其未經進一步純化即用於下一步。

實例 1285B

4-(N-(4-氟苯甲基)-3-甲基丁醯胺基)丁基胺基甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 278 中所述，用 3-甲基丁醯氯代替乙醯氯及 4-(4-氟苯甲基胺基)丁基胺基甲酸第三丁酯代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吡啶-2-甲醯胺製備。

實例 1285C

N-(4-胺基丁基)-N-(4-氟苯甲基)-3-甲基丁醯胺

標題化合物如實例 2D 中所述，用 4-(N-(4-氟苯甲基)-3-甲基丁醯胺基)丁基胺基甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟異吡啶-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 1285D

N-{4-[(4-氟苯甲基)(3-甲基丁醯基)胺基]丁基}-1,3-二氫-

2H-異吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 272B 中所述，用 N-(4-胺基丁基)-N-

(4-氯苯甲基)-3-甲基丁醯胺代替4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7.34-7.27 (m, 4H), 7.23 (dd, *J*=8.5, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (dd, *J*=8.5, 5.5 Hz, 1H), 7.06 (t, *J*=8.6 Hz, 1H), 6.99 (t, *J*=8.6 Hz, 1H), 5.49-5.17 (m, 1H), 4.72 (m, 4H), 4.56 (d, *J*=17.7 Hz, 2H), 3.34 (m, 4H), 2.29 (m, 2H), 2.23-2.12 (m, 1H), 1.68-1.50 (m, 4H), 1.01-0.93 (d, *J*=6.9 Hz, 6H); MS (APCI(+)) *m/e* 426 (M+H)⁺。

實例 1286

N-[4-(9-氯-5-側氧基-2,3,3a,4,4a,5-六氫-6H-呋喃并[2',3':2,3]環丁并[1,2-c]喹啉-6-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

實例 1286A

4-(丁-3-烯基氧基)-6-氯喹啉-2(1H)-酮

向 6-氯-4-羥基喹啉-2(1H)-酮 (800 mg, 4.09 mmol) 及 N,N-二異丙基乙胺 (1415 μl, 8.18 mmol) 於二甲基甲醯胺 (13.6 ml) 中之溶液中添加 4-溴-1-丁烯 (415 μl, 4.09 mmol)。溶液加熱至 60°C 且攪拌 18 小時。反應混合物藉由管柱層析純化，得到標題化合物。

實例 1286B

9-氯-3,3a,4,4a-四氫-2H-呋喃并[2',3':2,3]環丁并[1,2-c]喹啉-5(6H)-酮

4-(丁-3-烯基氧基)-6-氯喹啉-2(1H)-酮 (600 mg, 2.403 mmol) 於苯 (240 mL) 中之溶液置於 450 W Hg UV 燈 (裝有冷

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{(4R)-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{(4S)-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基氮雜環丁烷-3-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基氮雜環丁烷-3-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[反-3-(苯甲基胺甲醯基)環丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{反-3-[(2-苯基乙基)胺甲醯基]環丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{反-3-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]環丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲基-1,3-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

凝器供冷卻)下且攪拌4天(96小時)。接著混合物冷卻，真空濃縮且溶解於約75 mL二氯甲烷(適度加熱以儘可能多地溶解)中。作為區位異構體之混合物的樣品藉由管柱層析純化。濃縮第二次溶離之化合物，得到標題化合物。

實例 1286C

[4-(9-氯-5-側氧基-2,3,3a,4,4a,5-六氫-6*H*-呋喃并[2',3':2,3]環丁并[1,2-*c*]喹啉-6-基)丁基]胺基甲酸第三丁酯

在0°C下向9-氯-3,3a,4,4a-四氫-2*H*-呋喃并[2',3':2,3]環丁并[1,2-*c*]喹啉-5(6*H*)-酮(200 mg, 0.801 mmol)於二甲基甲醯胺(4 ml)中之溶液中經15分鐘緩慢添加氫化鈉(19 mg, 0.801 mmol)。懸浮液升溫至室溫。混合物攪拌45分鐘且添加4-(Boc-胺基)丁基溴(202 mg, 0.801 mmol)。溶液攪拌15小時，接著添加0.25 mL甲醇。進行管柱層析，得到標題化合物。

實例 1286D

6-(4-胺基丁基)-9-氯-3,3a,4,4a-四氫-2*H*-呋喃并[2',3':2,3]環丁并[1,2-*c*]喹啉-5(6*H*)-酮

標題化合物如實例 2D中所述，用[4-(9-氯-5-側氧基-2,3,3a,4,4a,5-六氫-6*H*-呋喃并[2',3':2,3]環丁并[1,2-*c*]喹啉-6-基)丁基]胺基甲酸第三丁酯代替4-((4-(5-氯異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 1286E

N-[4-(9-氯-5-側氧基-2,3,3a,4,4a,5-六氫-6*H*-呋喃并

[2',3':2,3]環丁并[1,2-*c*]喹啉-6-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例272B中所述，用6-(4-胺基丁基)-9-氯-3,3a,4,4a-四氫-2H-呋喃并[2',3':2,3]環丁并[1,2-*c*]喹啉-5(6H)-酮代替4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.54 (d, *J*=4.9 Hz, 1H), 7.29 (d, *J*=4.9 Hz, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.23 (d, *J*=2.6 Hz, 1H), 6.92 (d, *J*=8.9 Hz, 1H), 4.84 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 4.74 (bs, 4H), 4.46 (t, *J*=8.1 Hz, 1H), 4.22 (m, 1H), 4.05 (m, 1H), 3.91 (m, 1H), 3.39 (m, 3H), 2.93 (m, 1H), 2.31 (m, 1H), 2.22 (m, 1H), 1.84 (m, 1H), 1.69 (m, 5H); MS (ESI(+)) *m/e* 467 (M+H)⁺。

實例1287

N-{4-[7-氯-1-(2-羥基乙基)-3-側氧基-1,3-二氫環丁并[*c*]喹啉-4(2H)-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-2-甲醯胺

向 N-[4-(9-氯-5-側氧基-2,3,3a,4,4a,5-六氫-6H-呋喃并[2',3':2,3]環丁并[1,2-*c*]喹啉-6-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-2-甲醯胺(30 mg, 0.064 mmol)於二甲基甲醯胺(292 μL)及水(292 μL)中之溶液中添加氫氧化鈉(1.679 μl, 0.064 mmol)。溶液攪拌18小時，接著藉由逐滴添加1 M HCl達至約pH 7。對濕的粗混合物進行管柱層析，得到標題化合物。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.58 (s, 1H), 8.54 (d, *J*=5.1 Hz, 1H), 7.54 (d, *J*=2.4 Hz, 1H), 7.46

(dd, $J=9.1$, 2.4 Hz, 1H), 7.37 (d, $J=9.1$ Hz, 1H), 7.25 (m, 1H), 5.06 (t, $J=5.7$ Hz, 1H) 4.77 (bs, 2H), 4.75 (bs, 2H), 4.33 (t, $J=7.4$ Hz, 2 H), 3.87 (m, 2H), 3.74 (m, 2H), 3.46 (m, 2H), 3.37 (dd, $J=14.0$, 4.5 Hz, 1H), 2.86 (dd, $J=14.0$, 1.3 Hz, 1H), 2.27 (m, 1H), 1.97 (m, 1H), 1.82 (m, 2H), 1.71 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 467 ($M+H$)⁺。

實例 1290

N-(6-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 (R)-(四氫呋喃-2-基)甲胺代替 3-苯基丙-1-胺及 6-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)噻嗪-3-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 10.02 (s, 1H), 8.85 (t, $J=6.1$ Hz, 1H), 8.32 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 8.12 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 7.41-7.28 (m, 4H), 5.00-4.71 (m, 4H), 4.04 (p, $J=6.2$ Hz, 1H), 3.85-3.74 (m, 1H), 3.70-3.58 (m, 1H), 3.44-3.33 (m, 3H), 1.99-1.71 (m, 2H), 1.69-1.54 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 368 ($M+H$)⁺。

表 21.

以下實例基本上如實例 1C 中所述，用 N-(4-胺基苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及適當羧酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
1363	N-{4-[(3-乙氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-	¹ H NMR (400 MHz, DMSO/D ₂ O, 90°C) δ 8.71 (s, 1H), 8.61 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.70	(APCI(+)) m/e 355

	吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲 醯胺	(d, $J=5.5$ Hz, 1H), 7.44 (m, 4H), 4.89 (m, 4H), 3.68 (t, $J=4.7$ Hz, 2H), 3.47 (q, $J=7.0$ Hz, 2H), 2.52 (m, 2H), 1.11 (t, $J=7.0$ Hz, 3H)	(M+H) ⁺
1364	N-(4-{[(1-乙醯基哌啶-4-基)羰基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO/D ₂ O, 90°C) δ 8.73 (s, 1H), 8.62 (d, $J=5.46$, 1H), 7.75 (m, 1H), 7.41 (m, 4H), 4.91 (m, 4H), 4.13 (m, 2H), 2.95 (m, 2H), 2.60 (m, 1H), 1.99 (m, 3H), 1.84 (m, 2H), 1.52 (m, 2H)	(APCI(+)) m/e 408 (M+H) ⁺
1365	N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO/D ₂ O, 90°C) δ 8.69 (s, 1H), 8.59 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.66 (d, $J=5.5$ Hz, 1H), 7.48 (m, 4H), 4.89 (bs, 4H), 4.00 (s, 2H), 3.60 (q, $J=7.0$ Hz, 2H), 1.21 (t, $J=6.9$ Hz, 3H)	(APCI(+)) m/e 341 (M+H) ⁺
1366	N-{4-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO/D ₂ O, 90°C) δ 8.70 (s, 1H), 8.60 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.69 (d, $J=5.5$ Hz, 1H), 7.48 (m, 4H), 4.89 (m, 4H), 4.35 (dd, $J=8.1, 5.6$ Hz, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.83 (dt, $J=8.1, 6.7$ Hz, 1H), 2.92 (m, 1H), 2.71 (s, 1H), 2.23 (m, 1H), 2.00 (m, 1H), 1.92 (m, 2H)	(APCI(+)) m/e 353 (M+H) ⁺
1367	N-{4-[(四氫呋喃-3-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO/D ₂ O, 90°C) δ 8.73 (m, 1H), 8.61 (m, 1H), 7.70 (m, 1H), 7.43 (m, 4H), 4.90 (d, $J=8.2$ Hz, 4H), 3.93 (m, 1H), 3.76 (m, 3H), 3.13 (m, 1H), 2.10 (q, $J=7.2$ Hz, 2H)	(APCI(+)) m/e 353 (M+H) ⁺
1368	N-{4-[(環戊基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO/D ₂ O, 90°C) δ 8.67 (s, 1H), 8.57 (d, $J=5.3$ Hz, 1H), 7.62 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.44 (m, 4H), 4.87 (s, 4H), 2.77 (m, 1H), 1.70 (m, 8H)	(APCI(+)) m/e 351 (M+H) ⁺
1370	N-{4-[(雙環[2.2.1]庚-2-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO/D ₂ O, 90°C) δ 8.66 (s, 1H), 8.56 (d, $J=5.3$ Hz, 1H), 7.60 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.43 (m, 4H), 4.86 (s, 4H), 2.25 (dd, $J=14.1, 7.8$ Hz, 1H), 2.20 (s, 1H), 2.12 (dd, $J=14.0, 7.6$ Hz, 1H), 1.98 (d, $J=17.2$ Hz, 1H), 1.90 (s, 1H), 1.41 (m, 4H), 1.14 (m, 4H)	(APCI(+)) m/e 391 (M+H) ⁺
1371	N-{4-[(1,3-噻唑-5-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO/D ₂ O, 90°C) δ 9.20 (s, 1H), 8.67 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.57 (d, $J=5.3$ Hz, 1H), 7.61 (d, $J=5.3$ Hz, 4H), 7.55 (m, 4H)	(APCI(+)) m/e 366 (M+H) ⁺
1372	N-(4-{[(4-側氧基-4,5,6,7-四氫-1-苯并呋喃-3-基)羰基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO/D ₂ O, 90°C) δ 8.65 (s, 1H), 8.55 (d, $J=5.2$ Hz, 1H), 8.26 (d, $J=14.4$ Hz, 1H), 7.55 (m, 5H), 4.86 (s, 4H), 2.96 (m, 2H), 2.64 (m, 2H), 2.18 (m, 2H)	(APCI(+)) m/e 417 (M+H) ⁺

實例 1369

N-{7-側氧基-7-[(3-苯基丙基)胺基]庚基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用7-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)庚酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例 1373

N-(4-{2-[(3-甲基丁醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺

實例 1373A

N-(4-(2-胺基乙基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例2D中所述，用(2-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-基羰基)胺基]苯基}乙基)胺基甲酸第三丁酯代替4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 1373B

N-(4-{2-[(3-甲基丁醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(4-(2-胺基乙基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及3-甲基丁酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆, 溫度=90°C) δ 7.50-7.40 (m, 2H), 7.40-7.24 (m, 4H), 7.13-7.02 (m, 2H), 4.76 (s, 4H), 2.68 (t, *J*=7.3 Hz, 2H), 2.07-1.84 (m, 3H), 0.95-0.76 (m, 6H)。MS (ESI (+)) *m/e* 366 (M+H)⁺。

表 22.

以下實例基本上如實例1C中所述，用N-(4-(2-胺基乙基)苯基)異吡啶-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及適當羧酸代替4-(異吡啶-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
1374	N-(4-{2-[(4-甲基戊醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.44 (t, <i>J</i> =8.2 Hz, 2H), 7.38-7.18 (m, 4H), 7.18-6.99 (m, 2H), 4.76 (s, 4H), 2.78-2.60 (m, 2H), 2.13-1.99 (m, 2H), 1.58-1.33 (m, 3H), 0.90-0.79 (m, 6H)	(ESI(+)) m/e 380 (M+H) ⁺
1375	N-(4-{2-[(乙氧基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 8.07-7.98 (m, 1H), 7.50-7.25 (m, 7H), 7.11 (t, <i>J</i> =6.6 Hz, 2H), 4.76 (s, 4H), 3.80 (s, 2H), 3.55-3.41 (m, 2H), 3.41-3.33 (m, 2H), 2.78-2.64 (m, 2H), 1.19-1.07 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 368 (M+H) ⁺
1376	N-[4-(2-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.45 (d, <i>J</i> =8.4 Hz, 2H), 7.40-7.25 (m, 4H), 7.20-6.98 (m, 2H), 4.76 (s, 4H), 3.85 (s, 2H), 3.67-3.51 (m, 2H), 3.51-3.42 (m, 2H), 3.41-3.33 (m, 2H), 3.28 (s, 5H), 2.76-2.64 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 398 (M+H) ⁺
1377	N-(4-{2-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.52-7.37 (m, 2H), 7.37-7.21 (m, 4H), 7.10 (t, <i>J</i> =7.3 Hz, 2H), 4.76 (s, 4H), 4.28-4.03 (m, 1H), 3.89-3.78 (m, 1H), 3.80-3.65 (m, 1H), 3.53-3.31 (m, 2H), 2.75-2.60 (m, 2H), 2.20-2.02 (m, 1H), 1.94-1.64 (m, 3H)	(ESI(+)) m/e 380 (M+H) ⁺
1378	N-(4-{2-[(環戊基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.43 (d, <i>J</i> =8.5 Hz, 2H), 7.37-7.21 (m, 4H), 7.09 (d, <i>J</i> =8.4 Hz, 2H), 4.76 (s, 4H), 2.68 (t, <i>J</i> =7.3 Hz, 2H), 1.61 (t, <i>J</i> =44.5 Hz, 8H)	(ESI(+)) m/e 378 (M+H) ⁺
1379	N-(4-{2-[(環戊基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.43 (dd, <i>J</i> =6.3, 4.5 Hz, 2H), 7.37-7.24 (m, 4H), 7.09 (d, <i>J</i> =8.4 Hz, 2H), 4.76 (s, 4H), 2.67 (dd, <i>J</i> =9.4, 5.3 Hz, 2H), 2.23-1.94 (m, 4H), 1.76-1.42 (m, 6H), 1.22-1.05 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 392 (M+H) ⁺
1380	N-{4-[2-(苯甲醯基)胺基]乙基}苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.82-7.73 (m, 2H), 7.56-7.40 (m, 5H), 7.37-7.25 (m, 4H), 7.20-7.07 (m, 2H), 4.76 (s, 4H), 3.51 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 2H), 2.93-2.67 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 386 (M+H) ⁺
1381	N-(4-{2-[(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ 7.49-7.38 (m, 2H), 7.37-7.24 (m, 4H), 7.09 (d, <i>J</i> =8.4 Hz, 2H), 4.76 (s, 4H), 3.90-3.74 (m, 2H), 3.37-3.30 (m, 2H), 2.68 (t, <i>J</i> =7.3 Hz, 2H), 2.39-2.23 (m, 1H), 1.66-1.48 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 394 (M+H) ⁺

1382	N-(4-{2-[(四氫-2H-吡喃-4-基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$, 溫度=90°C) δ 7.43 (t, $J=5.4$ Hz, 2H), 7.40-7.24 (m, 4H), 7.09 (d, $J=8.4$ Hz, 2H), 4.76 (s, 4H), 3.85-3.68 (m, 2H), 3.28-3.24 (m, 4H), 2.68 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 2.01 (d, $J=7.1$ Hz, 2H), 1.94-1.76 (m, 1H), 1.59-1.42 (m, 2H), 1.29-1.03 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 408 (M+H) ⁺
1383	N-(4-{2-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$, 溫度=90°C) δ 7.53-7.35 (m, 3H), 7.42-7.22 (m, 4H), 7.09 (d, $J=8.4$ Hz, 2H), 4.76 (s, 4H), 3.82-3.55 (m, 3H), 3.35-3.30 (m, 1H), 3.26 (dd, $J=7.1, 5.3$ Hz, 2H), 2.68 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 2.48-2.36 (m, 1H), 2.22-2.07 (m, 2H), 2.04-1.81 (m, 1H), 1.62-1.29 (m, 1H)	(ESI(+)) m/e 394 (M+H) ⁺

實例 1404

N-(4-{[1-(2-環丙基乙基)吡啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 429 中所述，用 2-環丙基乙醛代替異丁醛及 N-(4-(吡啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。 $^1\text{H NMR}$ (400 MHz, 吡啶- d_5 , 溫度=90°C) δ ppm 8.54-8.58 (m, 2 H) 8.08 (s, 1H) 7.72-7.77 (m, 2 H) 7.10 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.01 (d, $J=9.16$ Hz, 2 H) 4.82-4.88 (m, 4 H) 3.71 (s, 1 H) 2.74-2.82 (m, 2 H) 2.43-2.50 (m, 2 H) 2.22-2.31 (m, 2 H) 1.97 (s, 2 H) 1.79-1.90 (m, 2 H) 1.35-1.47 (m, 2 H) 0.70 (s, 1 H) 0.36-0.45 (m, 2 H) 0.05 (q, $J=4.78$ Hz, 2 H); MS (APCI(+)) m/e 407 (M+H)⁺。

實例 1405

N-(4-{[1-(2-環戊基乙基)吡啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 429 中所述，用 2-環戊基乙醛代替異

丁醛及 N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, 吡啶-*d*₅, 溫度 = 90°C) δ ppm 8.54-8.58 (m, 2 H) 8.08 (s, 1H) 7.72-7.78 (m, 2 H) 7.10 (d, *J*=4.88 Hz, 1 H) 7.00-7.04 (m, 2 H) 4.82-4.90 (m, 4 H) 4.21-4.31 (m, 1 H) 2.73-2.83 (m, 2 H) 2.34-2.40 (m, 2 H) 2.20-2.29 (m, 2 H) 1.96-2.03 (m, 2 H) 1.67-1.93 (m, 5 H) 1.40-1.62 (m, 6 H) 1.04-1.17 (m, 2 H); MS (APCI(+)) *m/e* 435 (M+H)⁺。

實例 1406

N-(4-{[1-(2-甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 429 中所述，用 2-甲基丁醛代替異丁醛及 N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, 吡啶-*d*₅, 溫度 = 90°C) δ ppm 8.52-8.58 (m, 2 H) 8.08 (s, 1H) 7.74 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 7.10 (d, *J*=4.58 Hz, 1 H) 6.97-7.05 (m, 2 H) 4.84 (d, *J*=6.71 Hz, 4 H) 2.72 (d, *J*=10.68 Hz, 2 H) 2.13-2.26 (m, 3 H) 2.01-2.07 (m, 2 H) 1.91-2.00 (m, 2 H) 1.83 (s, 2 H) 1.54 (s, 2 H) 1.14 (s, 1 H) 0.81-0.95 (m, 6 H); MS (APCI(+)) *m/e* 409 (M+H)⁺。

實例 1407

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-

二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例429中所述，用四氫呋喃-3-甲醛代替異丁醛及N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, 吡啶-*d*₅, 溫度=90°C) δ ppm 8.53-8.58 (m, 1 H) 8.08 (s, 1 H) 7.70-7.77 (m, 2 H) 7.10 (d, *J*=5.19 Hz, 1 H) 7.01 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 4.84 (d, *J*=7.63 Hz, 4 H) 4.19-4.27 (m, 1 H) 3.75-3.90 (m, 2 H) 3.67-3.72 (m, 1 H) 3.56 (dd, *J*=8.55, 5.80 Hz, 1 H) 2.65-2.82 (m, 2 H) 2.31-2.45 (m, 1 H) 2.15-2.31 (m, 4 H) 1.71-2.00 (m, 5 H) 1.48-1.59 (m, 1H); MS (APCI(+)) *m/e* 423 (M+H)⁺。

實例1408

N-(4-{[1-(3,3-二甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例429中所述，用3,3-二甲基丁醛代替異丁醛及N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, 吡啶-*d*₅, 溫度=90°C) δ ppm 8.52-8.58 (m, 2 H) 8.09 (s, 1H) 7.71-7.78 (m, 2 H) 7.10 (d, *J*=4.88 Hz, 1 H) 6.99-7.04 (m, 2 H) 4.84 (dd, *J*=8.39, 1.68 Hz, 4 H) 3.85 (d, *J*=13.43 Hz, 1H) 2.75-2.85 (m, 2 H) 2.38-2.47 (m, 2 H) 2.21-2.34 (m, 2 H) 1.98 (d, *J*=2.14 Hz, 2 H) 1.78-1.91 (m, 2 H) 1.39-1.49 (m, 2 H)

0.84-0.92 (m, 9 H); MS (APCI(+)) m/e 423 (M+H)⁺。

實例 1409

N-(4-{[1-(環己基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 429 中所述，用環己烷甲醛代替異丁醛及 N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, 吡啶-*d*₅, 溫度 = 90°C) δ ppm 8.53-8.57 (m, 2 H) 8.08 (s, 1 H) 7.69-7.77 (m, 2 H) 7.10 (s, 1 H) 6.97-7.04 (m, 2 H) 4.82-4.87 (m, 4 H) 4.20-4.27 (m, 1 H) 2.73 (t, *J*=10.68 Hz, 2 H) 2.17-2.26 (m, 2 H) 2.13 (d, *J*=7.02 Hz, 2 H) 1.93-2.01 (m, 2 H) 1.76-1.87 (m, 4 H) 1.55-1.72 (m, 3 H) 1.44-1.54 (m, 1 H) 1.09-1.29 (m, 3 H) 0.89 (d, *J*=12.51 Hz, 2 H); MS (APCI(+)) m/e 435 (M+H)⁺。

實例 1410

N-(4-{[1-(3-甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 429 中所述，用 3-甲基丁醛代替異丁醛及 N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, 吡啶-*d*₅, 溫度 = 90°C) δ ppm 8.53-8.57 (m, 2 H) 8.09 (s, 1 H) 7.70-7.78 (m, 2 H) 7.10 (d, *J*=5.19 Hz, 1 H) 6.98-7.04 (m, 2 H) 4.79-

N-(4-{1-[(2E)-3-(呋喃-2-基)丙-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,3-噁唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3,3,3-三氟丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,5-二甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲氧基環己基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,3-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,2-二氟環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(第三丁氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-乙氧基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

4.89 (m, 4 H) 4.26 (d, $J=3.66$ Hz, 1 H) 2.72-2.83 (m, 2 H)
2.34-2.41 (m, 2 H) 2.21-2.30 (m, 2 H) 1.96-2.03 (m, 2 H)
1.79-1.91 (m, 2 H) 1.54-1.68 (m, 1 H) 1.35-1.44 (m, 2 H)
0.86-0.90 (m, 6 H); MS (APCI(+)) m/e 408 ($M+H$)⁺。

實例 1411

N-(4-{[1-(環戊基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 429 中所述，用環戊烷甲醛代替異丁醛及 N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, 吡啶-*d*₅, 溫度 = 90°C) δ ppm 8.53-8.57 (m, 2 H) 8.08 (s, 1H) 7.70-7.77 (m, 2 H) 7.10 (d, $J=4.88$ Hz, 1H) 6.97-7.05 (m, 2 H) 4.84 (dd, $J=8.54, 1.53$ Hz, 4 H) 4.23-4.27 (m, 1H) 2.75 (d, $J=10.99$ Hz, 2 H) 2.18-2.29 (m, 4 H) 2.04 (s, 1H) 1.94-2.02 (m, 2 H) 1.77-1.90 (m, 2 H) 1.65-1.76 (m, 2 H) 1.42-1.59 (m, 4 H) 1.17-1.32 (m, 2 H); MS (APCI(+)) m/e 420 ($M+H$)⁺。

實例 1412

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 429 中所述，用四氫呋喃-2-甲醛代替異丁醛及 N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, 吡啶-*d*₅, 溫度

=90°C) δ ppm 8.53-8.59 (m, 2 H) 8.07 (s, 1 H) 7.73 (d, $J=9.16$ Hz, 2 H) 7.10 (d, $J=5.49$ Hz, 1 H) 6.97-7.02 (m, 2 H) 4.80-4.87 (m, 4 H) 4.03 (d, $J=11.60$ Hz, 1H) 3.77-3.84 (m, 1H) 3.61-3.69 (m, 1H) 2.88 (d, $J=41.81$ Hz, 2 H) 2.25-2.63 (m, 4 H) 1.97 (s, 2 H) 1.77-1.91 (m, 4 H) 1.64-1.76 (m, 2 H) 1.44-1.58 (m, 1H); MS (APCI(+)) m/e 423 (M+H)⁺。

實例 1413

○ N-(4-{[1-(2-甲基丙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 429 中所述，用異丁醛代替異丁醛及 N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (400 MHz, 吡啶-*d*₅, 溫度=90°C) δ ppm 8.49-8.60 (m, 2 H) 8.09 (s, 1H) 7.68-7.80 (m, 2 H) 7.10 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 6.96-7.04 (m, 2 H) 4.85 (s, 4 H) 4.21-4.28 (m, 1H) 2.65-2.79 (m, 2 H) 2.13-2.24 (m, 2 H) 2.06 (m, 2 H) 1.98 (s, 2 H) 1.77-1.88 (m, 2 H) 1.67-1.77 (m, 1 H) 0.89 (d, $J=6.71$ Hz, 6 H); MS (APCI(+)) m/e 395 (M+H)⁺。

實例 1414

○ N-(4-{[1-(丁基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 883 中所述，用 N-(4-(哌啶-4-基氧基)

苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及1-丁基磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1 H) 8.49 (d, *J*=4.88 Hz, 1 H) 7.36-7.48 (m, 3 H) 6.90 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 4.80 (d, *J*=6.10 Hz, 4 H) 4.39-4.50 (m, 1H) 3.41-3.49 (m, 2 H) 3.13-3.20 (m, 2 H) 2.99-3.06 (m, 2 H) 1.94-2.01 (m, 2 H) 1.63-1.76 (m, 4 H) 1.37-1.49 (m, 2 H) 0.91 (t, *J*=7.48 Hz, 3 H); MS (APCI(+)) *m/e* 459 (M+H)⁺。

實例 1415

N-(4-{[1-(環丙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例883中所述，用N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及環丙基磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1 H) 8.48 (d, *J*=4.88 Hz, 1 H) 7.40 (d, *J*=8.54 Hz, 3 H) 6.90 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 4.79 (d, *J*=8.24 Hz, 4 H) 4.39-4.49 (m, 1 H) 3.44-3.51 (m, 2 H) 3.17-3.23 (m, 2 H) 2.54-2.58 (m, 1H) 1.95-2.03 (m, 2 H) 1.68-1.78 (m, 2 H) 0.91-1.07 (m, 4 H); MS (APCI(+)) *m/e* 442 (M+H)⁺。

實例 1416

N-(4-{[1-(苯基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-

吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例883中所述，用N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及苯基磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1 H) 8.49 (d, *J*=4.88 Hz, 1 H) 7.77 (d, *J*=7.32 Hz, 2 H) 7.71 (t, *J*=7.32 Hz, 1 H) 7.65 (t, *J*=7.32 Hz, 2 H) 7.44 (d, *J*=4.88 Hz, 1 H) 7.35 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 6.79 (d, *J*=9.16 Hz, 2 H) 4.79 (d, *J*=4.27 Hz, 4 H) 4.29-4.37 (m, 1 H) 3.22-3.25 (m, 2 H) 2.92-3.06 (m, 2 H) 1.87-2.04 (m, 2 H) 1.61-1.79 (m, 2 H); MS (APCI(+)) *m/e* 479 (M+H)⁺。

實例1417

N-[4-({1-[(4-氟苯基)磺醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例883中所述，用N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及(4-氟苯基)磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.49 (d, *J*=4.88 Hz, 1 H) 7.84 (dd, *J*=8.85, 5.19 Hz, 2 H) 7.40-7.49 (m, 3 H) 7.36 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 6.80 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 4.79 (d, *J*=4.88 Hz, 4 H) 4.28-4.41 (m, 1 H) 3.21-3.26 (m, 2 H) 2.94-3.05 (m, 2 H) 1.89-2.02 (m, 2 H) 1.62-1.76 (m, 2 H); MS

(APCI(+)) m/e 497 (M+H)⁺。

實例 1418

N-(4-{[1-(乙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 883 中所述，用 N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及乙基磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, *J*=5.19 Hz, 1 H) 7.40 (d, *J*=8.85 Hz, 3 H) 6.90 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 4.79 (d, *J*=7.32 Hz, 4 H) 4.39-4.48 (m, 1 H) 3.41-3.49 (m, 2 H) 3.14-3.22 (m, 2 H) 3.05 (q, *J*=7.43 Hz, 2 H) 1.94-2.03 (m, 2 H) 1.64-1.78 (m, 2 H) 1.24 (t, *J*=7.32 Hz, 3 H); MS (APCI(+)) m/e 431 (M+H)⁺。

實例 1419

N-(4-{[1-(丙-2-基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 883 中所述，用 N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及異丙基磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1 H) 8.49 (d, *J*=5.19 Hz, 1 H) 7.36-7.47 (m, 3 H) 6.89 (d, *J*=8.85 Hz, 2 H) 4.80 (d, *J*=5.49 Hz, 4 H) 4.40-4.49 (m, 1 H) 3.46-3.55 (m, 2 H) 3.33-3.36 (m, 1

H) 3.15-3.24 (m, 2 H) 1.93-2.01 (m, 2 H) 1.62-1.74 (m, 2 H) 1.25 (d, $J=6.71$ Hz, 6 H); MS (APCI(+)) m/e 445 (M+H)⁺。

實例 1420

N-(4-{[1-(苯甲基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 883 中所述，用 N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及苯甲基磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.48 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.31-7.46 (m, 8 H) 6.87 (d, $J=9.16$ Hz, 2 H) 4.79 (d, $J=7.02$ Hz, 4 H) 4.38-4.44 (m, 1H) 4.36 (s, 2 H) 3.34-3.38 (m, 2 H) 3.07-3.16 (m, 2 H) 1.82-1.90 (m, 2 H) 1.57-1.71 (m, 2 H); MS (APCI(+)) m/e 493 (M+H)⁺。

實例 1421

N-(4-{[1-(丙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 883 中所述，用 N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及 1-丙基磺醯氯代替(3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.59 (s, 1 H) 8.49 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.35-7.46 (m, 3 H) 6.90 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 4.80 (d, $J=5.80$ Hz,

4 H) 4.39-4.48 (m, 1H) 3.39-3.49 (m, 2 H) 3.12-3.22 (m, 2 H) 2.96-3.06 (m, 2 H) 1.93-2.03 (m, 2 H) 1.62-1.79 (m, 4 H) 1.01 (t, $J=7.48$ Hz, 3 H); MS (APCI(+)) m/e 445 (M+H)⁺。

實例 1422

N-(4-{[1-(噻吩-2-基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 883 中所述，用 N-(4-(哌啶-4-基氧基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 N-(4-胺基苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺及噻吩-2-磺醯氯代替 (3-甲氧基苯基)甲烷磺醯氯製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-D₂O, 溫度=90°C) δ ppm 8.58 (s, 1 H) 8.49 (d, $J=5.19$ Hz, 1 H) 7.96 (d, $J=4.27$ Hz, 1 H) 7.63 (d, $J=3.05$ Hz, 1 H) 7.44 (d, $J=4.88$ Hz, 1 H) 7.37 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 7.23-7.30 (m, 1 H) 6.81 (d, $J=8.85$ Hz, 2 H) 4.79 (d, $J=4.88$ Hz, 4 H) 4.29-4.43 (m, 1 H) 3.31-3.38 (m, 2 H) 2.97-3.09 (m, 2 H) 1.93-2.06 (m, 2 H) 1.65-1.81 (m, 2 H); MS (APCI(+)) m/e 485 (M+H)⁺。

實例 1441

反-3-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]環丁烷甲酸苯甲酯

實例 1441A

反-3-(第三丁氧基羰基胺基)環丁烷甲酸苯甲酯

反-3-(第三丁氧基羰基胺基)環丁烷甲酸 (0.5 g, 2.323

mmol)及碳酸鉀(0.321 g, 2.323 mmol)於二甲基甲醯胺(2.323 ml)中之懸浮液用經3分鐘自注射器添加之(溴甲基)苯(0.401 g, 2.346 mmol)處理。反應混合物在室溫下攪拌17小時且添加水。過濾懸浮液且收集之固體用水洗滌並真空乾燥，得到標題化合物。

實例 1441B

反-3-胺基環丁烷甲酸苯甲酯

標題化合物如實例2D中所述，用反-3-(第三丁氧基羰基胺基)環丁烷甲酸苯甲酯代替4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 1441C

反-3-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]環丁烷甲酸苯甲酯

標題化合物如實例272B中所述，用反-3-胺基環丁烷甲酸苯甲酯代替4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.56 (s, 1H), 8.47 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 7.43-7.31 (m, 6H), 6.68 (d, *J*=7.6 Hz, 1H), 5.14 (s, 2H), 4.65-4.58 (m, 4H), 4.41-4.29 (m, 1H), 3.11-2.99 (m, 1H), 2.46-2.25 (m, 4H); MS (ESI(+)) *m/e* 352 (M+H)⁺。

實例 1452

N-(4-{3-[(3-甲基丁醯基)胺基]氧雜環丁烷-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

實例 1452A

2-甲基-N-(氧雜環丁烷-3-基亞基)丙烷-2-亞磺醯胺

在室溫下向 250 mL 圓底燒瓶中添加 2-甲基丙烷-2-亞磺醯胺 (3.36 g, 27.8 mmol)，接著添加四乙氧基鈦 (11.64 ml, 55.5 mmol) 至氧雜環丁-3-酮 (2 g, 27.8 mmol) 之四氫呋喃 (69.4 ml) 溶液。混合物在 50°C 下攪拌 5 小時，冷卻且傾倒至鹽水中。懸浮液經由矽藻土墊過濾，用乙酸乙酯溶離。有機物合併，經硫酸鈉乾燥，過濾且真空濃縮。殘餘物藉由正相急驟管柱層析純化，得到標題化合物。

實例 1452B

N-(3-(4-溴苯基)氧雜環丁烷-3-基)-2-甲基丙烷-2-亞磺醯胺

向 50 mL 圓底燒瓶中添加含 1,4-二溴苯 (2.85 g, 12.07 mmol) 之四氫呋喃 (40.2 ml)。溶液冷卻至 -78°C 且逐滴添加正丁基鋰 (4.51 ml, 11.26 mmol)。混合物在 -78°C 下攪拌 1 小時。2-甲基-N-(氧雜環丁烷-3-基亞基)丙烷-2-亞磺醯胺 (1.41 g, 8.05 mmol) 呈四氫呋喃溶液 (約 1 ml) 添加且反應物攪拌 10 分鐘並升溫至室溫。添加飽和氯化銨，接著添加水及二氯甲烷。水層用二氯甲烷萃取兩次且合併之有機物經硫酸鎂乾燥，過濾且真空濃縮。殘餘物藉由正相急驟管柱層析純化，得到標題化合物。

實例 1452C

N-(4-(3-(1,1-二甲基乙基亞磺醯胺基)氧雜環丁烷-3-基)苯基)乙醯胺

向 5 mL 微波管中添加含 N-(3-(4-溴苯基)氧雜環丁烷-3-

基)-2-甲基丙烷-2-亞磺醯胺(436 mg, 1.312 mmol)、碳酸鉀(1283 mg, 3.94 mmol)及乙醯胺(116 mg, 1.968 mmol)之二噁烷(6.5 ml)。添加 Xantphos(76 mg, 0.131 mmol)及參(二亞苺基丙酮)二鉀(0)(60.1 mg, 0.066 mmol)；管用氮氣沖洗且蓋上蓋子。混合物在100℃下加熱45分鐘。藉由二氯甲烷萃取進行水性處理，得到有機層，其經硫酸鈉乾燥，過濾且真空濃縮。進行正相層析，得到標題化合物。

實例 1452D

○ N-(3-(4-胺基苺基)氧雜環丁烷-3-基)-2-甲基丙烷-2-亞磺醯胺
克萊森鹼(Claissen's alkali)(氫氧化鉀，12.7 g於9 ml水及33 ml甲醇中)添加至N-(4-(3-(1,1-二甲基乙基亞磺醯胺基)氧雜環丁烷-3-基)苺基)乙醯胺(300 mg, 0.966 mmol)中且反應物在90℃下攪拌2小時。混合物冷卻至室溫，此時添加水及乙酸乙酯。水層用乙酸乙酯萃取兩次且合併之有機物經硫酸鎂乾燥，過濾且真空濃縮。殘餘物藉由正相急驟管柱層析純化，得到標題化合物。

實例 1452E

○ N-(4-(3-(1,1-二甲基乙基亞磺醯胺基)氧雜環丁烷-3-基)苺基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺

標題化合物如實例272B中所述，用N-(3-(4-胺基苺基)氧雜環丁烷-3-基)-2-甲基丙烷-2-亞磺醯胺代替4-胺基-N-丙基苺甲醯胺及1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。

實例 1452F

N-{4-[1-(3-羥基-3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(1H-吡咯-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲基丙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1-甲基脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-羥基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-{[1-(甲氧基甲基)環丙基]羰基}-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(甲基磺醯基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-(3-胺基氧雜環丁烷-3-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺

向 20 mL 小瓶中添加 N-(4-(3-(1,1-二甲基乙基亞磺醯胺基)氧雜環丁烷-3-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺 (253 mg, 0.610 mmol) 及 甲醇 (6.1 ml)。添加 4N HCl 之二噁烷溶液 (229 μ l, 0.916 mmol) 且反應物攪拌 2 小時。混合物真空濃縮，得到標題化合物，其未經進一步純化即使用。

實例 1452G

N-(4-{3-[(3-甲基丁醯基)胺基]氧雜環丁烷-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(3-胺基氧雜環丁烷-3-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及 3-甲基丁酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.84 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.54 (d, *J*=8.7 Hz, 2H), 7.43 (d, *J*=4.8 Hz, 1H), 7.36 (d, *J*=8.8 Hz, 2H), 4.81 (d, *J*=6.5 Hz, 6H), 4.69 (d, *J*=6.5 Hz, 2H), 2.10-1.87 (m, 3H), 0.90 (d, *J*=6.4 Hz, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 395 (M+H)⁺。

實例 1453

4-({4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}磺醯基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

實例 1453A

4-(4-胺基苯基硫基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

向 100 mL 圓底燒瓶中添加含 4-胺基苯硫醇 (4.9 g, 39.1 mmol) 及碳酸鉀 (9.72 g, 70.3 mmol) 之二甲基甲醯胺 (20 ml)。添加 4-(甲磺基氧基)哌啶-1-甲酸第三丁酯 (5 g, 14.07 mmol) 且反應物在密封燒瓶中於 70°C 下攪拌 20 小時。混合物冷卻且經由含二氯甲烷之矽膠塞過濾。濾液真空濃縮且層析，得到標題化合物。

實例 1453B

4-(4-乙醯胺基苯基硫基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

向 10 mL 圓底燒瓶中添加含 4-(4-胺基苯基硫基)哌啶-1-甲酸第三丁酯 (100 mg, 0.324 mmol) 及三乙胺 (249 μ l, 1.783 mmol) 之二氯甲烷 (3242 μ l)。混合物冷卻至 -78°C 且添加乙醯氯 (115 μ l, 1.621 mmol)。溶液升溫至室溫，攪拌 1 小時，接著用水及另外二氯甲烷稀釋。水相用二氯甲烷萃取兩次且合併之有機物經硫酸鈉乾燥，過濾且濃縮，得到標題化合物。

實例 1453C

4-(4-乙醯胺基苯基磺基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

向 10 mL 圓底燒瓶中添加含 4-(4-乙醯胺基苯基硫基)哌啶-1-甲酸第三丁酯 (100 mg, 0.285 mmol) 之二氯甲烷 (2.9 ml)。溶液冷卻至 -20°C 且添加 mCPBA (192 mg, 0.856 mmol)。反應混合物升溫至室溫且用 1 N NaOH 水溶液處理。水層用二氯甲烷萃取且合併之有機物經硫酸鈉乾燥，過濾且濃縮，得到標題化合物。

實例 1453D

4-(4-胺基苯基磺醯基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 1452D 中所述，用 4-(4-乙醯胺基苯基磺醯基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替 N-(4-(3-(1,1-二甲基乙基亞磺醯胺基)氧雜環丁烷-3-基)苯基)乙醯胺製備。

實例 1453E

4-({4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}磺醯基)哌啶-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-(4-胺基苯基磺醯基)哌啶-1-甲酸第三丁酯代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及 1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.95 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.51 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 7.90-7.83 (m, 2H), 7.76-7.69 (m, 2H), 7.44 (d, *J*=5.1 Hz, 1H), 4.93-4.76 (m, 4H), 4.09-3.93 (m, 2H), 2.84-2.56 (m, 1H), 1.83 (d, *J*=10.8 Hz, 1H), 1.48-1.16 (m, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 431 (M+H)⁺。

實例 1454

N-{4-[4-(丙基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

實例 1454A

1-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)哌啶-4-甲酸

標題化合物如實例 1246 中所述，在實例 1246A 中用哌啶-4-甲酸甲酯代替氮雜環丁烷-3-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。

實例 1454B

N-{4-[4-(丙基胺甲鹽基)吡啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用丙-1-胺代替 3-苯基丙-1-胺及 1-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺基)苯基)吡啶-4-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.77 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 7.42 (d, *J*=5.1 Hz, 1H), 7.39-7.33 (m, 2H), 6.89-6.83 (m, 2H), 4.77 (d, *J*=6.2 Hz, 4H), 3.64-3.56 (m, 2H), 3.05-2.94 (m, 2H), 2.63-2.52 (m, 2H), 2.28-2.14 (m, 1H), 1.79-1.59 (m, 4H), 1.47-1.33 (m, 2H), 0.84 (t, *J*=7.4 Hz, 3H); MS (ESI(+)) *m/e* 408 (M+H)⁺。

表 23.

以下實例基本上如實例 1C 中所述，用適當胺代替 3-苯基丙-1-胺及 1-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺基)苯基)吡啶-4-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)苯甲酸製備。

實例	名稱	¹ H NMR	MS
1455	N-(4-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]吡啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.47-7.41 (m, 1H), 7.40-7.30 (m, 3H), 6.86-6.80 (m, 2H), 4.80-4.74 (m, 4H), 3.61-3.52 (m, 2H), 3.36 (t, <i>J</i> =5.9 Hz, 2H), 3.28-3.17 (m, 5H), 2.64 (td, <i>J</i> =11.7, 3.2 Hz, 2H), 2.32-2.20 (m, 1H), 1.82-1.63 (m, 4H)	(ESI(+)) <i>m/e</i> 424 (M+H) ⁺
1456	N-(4-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]吡啶-1-基}苯基)-1,3-	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.79 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.39-7.33	(ESI(+)) <i>m/e</i> 448 (M+H) ⁺

	二氫-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲醯 胺	(m, 2H), 6.89-6.83 (m, 2H), 4.80-4.74 (m, 4H), 3.64-3.56 (m, 2H), 3.01-2.94 (m, 2H), 2.64-2.53 (m, 2H), 2.30-2.16 (m, 1H), 2.04-1.91 (m, 1H), 1.74-1.43 (m, 10H), 1.29-1.06 (m, 2H)	
1457	N-(4-{4-[(1,4-二噁 烷-2-基甲基)胺甲 醯基]哌啶-1-基} 苯基)-1,3-二氫- 2H-吡咯并[3,4-c] 吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.90 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.39-7.33 (m, 2H), 6.89-6.83 (m, 2H), 4.78-4.74 (m, 4H), 3.75-3.41 (m, 8H), 3.21-3.13 (m, 1H), 3.13-3.02 (m, 2H), 2.63-2.53 (m, 2H), 2.30-2.20 (m, 1H), 1.77-1.59 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 466 (M+H) ⁺
1458	N-{4-[4-(環戊基胺 甲醯基)哌啶-1-基] 苯基}-1,3-二氫- 2H-吡咯并[3,4-c] 吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.73 (d, <i>J</i> =7.2 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.39-7.33 (m, 2H), 6.89-6.83 (m, 2H), 4.82-4.71 (m, 4H), 4.04-3.92 (m, 1H), 3.64-3.56 (m, 2H), 2.61-2.51 (m, 2H), 2.24-2.13 (m, 1H), 1.84-1.56 (m, 8H), 1.55-1.42 (m, 2H), 1.40-1.29 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 434 (M+H) ⁺
1459	N-{4-[4-(四氫-2H- 哌喃-4-基胺甲醯 基)哌啶-1-基]苯 基}-1,3-二氫-2H- 吡咯并[3,4-c]吡 啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆ , 溫度=90°C) δ ppm 8.57 (s, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.41-7.31 (m, 4H), 6.86-6.80 (m, 2H), 4.80- 4.74 (m, 4H), 3.85-3.71 (m, 3H), 3.62-3.53 (m, 2H), 3.41-3.29 (m, 2H), 2.70-2.58 (m, 2H), 2.28- 2.18 (m, 1H), 1.81-1.64 (m, 6H), 1.49-1.36 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 450 (M+H) ⁺
1460	N-{4-[4-(嗎啉-4- 基羰基)哌啶-1-基] 苯基}-1,3-二氫- 2H-吡咯并[3,4-c] 吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.39-7.33 (m, 2H), 6.89-6.83 (m, 2H), 4.81-4.72 (m, 4H), 3.65-3.42 (m, 10H), 2.79- 2.59 (m, 3H), 1.73-1.64 (m, 4H)	(ESI(+)) m/e 436 (M+H) ⁺
1461	N-(4-{4-[(四氫- 2H-哌喃-4-基甲 基)胺甲醯基]哌 啶-1-基}苯基)-1,3- 二氫-2H-吡咯并 [3,4-c]吡啶-2-甲醯 胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.81 (t, <i>J</i> =5.8 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.39-7.33 (m, 2H), 6.89-6.83 (m, 2H), 4.80-4.74 (m, 4H), 3.87-3.79 (m, 2H), 3.64-3.56 (m, 2H), 3.28-3.18 (m, 2H), 2.95 (t, <i>J</i> =6.2 Hz, 2H), 2.64-2.52 (m, 2H), 2.29-2.18 (m, 1H), 1.78-1.56 (m, 5H), 1.57- 1.47 (m, 2H), 1.20-1.06 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 464 (M+H) ⁺
1462	N-{4-[4-(環丙基胺 甲醯基)哌啶-1-基] 苯基}-1,3-二氫- 2H-吡咯并[3,4-c] 吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.84 (d, <i>J</i> =4.3 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> =5.1 Hz, 1H), 7.39-7.33 (m, 2H), 6.89-6.83 (m, 2H), 4.80-4.74 (m, 4H), 3.63-3.55 (m, 2H), 2.66-2.48 (m, 3H), 2.20-2.08 (m, 1H), 1.76-1.58 (m, 4H), 0.63-0.55 (m, 2H), 0.41-0.33 (m, 2H)	(ESI(+)) m/e 406 (M+H) ⁺
1463	N-(4-{4-[(四氫呋 喃-3-基甲基)胺甲 醯基]哌啶-1-基} 苯基)-1,3-二氫- 2H-吡咯并[3,4-c]	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.59 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.91 (t, <i>J</i> =5.7 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> =4.5 Hz, 1H), 7.39-7.33 (m, 2H), 6.89-6.83 (m, 2H), 4.80-4.74 (m, 4H), 3.73-3.54 (m, 5H), 3.40-3.34 (m, 1H), 3.09-2.98	(ESI(+)) m/e 450 (M+H) ⁺

	吡啶-2-甲醯胺	(m, 2H), 2.64-2.53 (m, 2H), 2.37-2.27 (m, 1H), 2.27-2.17 (m, 1H), 1.94-1.83 (m, 1H), 1.79-1.61 (m, 4H), 1.57-1.46 (m, 1H)	
1464	N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]吡啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.66 (t, <i>J</i> =6.0 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> =4.6 Hz, 1H), 7.39-7.33 (m, 2H), 6.90-6.83 (m, 2H), 4.83-4.71 (m, 4H), 4.44 (s, 1H), 3.65-3.57 (m, 2H), 3.03 (d, <i>J</i> =6.0 Hz, 2H), 2.64-2.53 (m, 2H), 2.39-2.27 (m, 1H), 1.79-1.61 (m, 4H), 1.04 (s, 6H)	(ESI(+)) m/e 438 (M+H) ⁺
1465	N-{4-[4-(丁-2-基胺甲醯基)吡啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ ppm 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> =5.0 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.56 (d, <i>J</i> =8.2 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> =4.5 Hz, 1H), 7.39-7.33 (m, 2H), 6.89-6.83 (m, 2H), 4.81-4.70 (m, 4H), 3.72-3.54 (m, 3H), 2.62-2.50 (m, 2H), 2.27-2.14 (m, 1H), 1.78-1.58 (m, 4H), 1.44-1.28 (m, 2H), 1.01 (d, <i>J</i> =6.6 Hz, 3H), 0.81 (t, <i>J</i> =7.4 Hz, 3H)	(ESI(+)) m/e 422 (M+H) ⁺

實例 1472

N-(4-{(4R)-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺 (250 mg) 之外消旋混合物溶於甲醇中且使用 SCF-LC，用 ChiralPak AD-H 21×250 mm 管柱分離，得到 N-(4-{(4R)-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 7.66 (d, *J*=7.6 Hz, 1H), 7.56-7.48 (m, 2H), 7.43 (d, *J*=5.1 Hz, 1H), 7.37-7.29 (m, 2H), 6.02 (bs, 1H), 4.84-4.77 (m, 4H), 3.89-3.73 (m, 1H), 2.44 (ddd, *J*=12.7, 8.7, 4.6 Hz, 2H), 2.41-2.26 (m, 2H), 2.14-1.97 (m, 1H), 1.93-1.81 (m, 1H), 1.67-1.49 (m, 1H), 1.00 (dd, *J*=6.8, 2.4 Hz, 6H); MS (ESI(+)) m/e 405 (M+H)⁺。

實例 1473

N-(4-{(4S)-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺(250 mg)之消旋
混合物溶於甲醇中且使用 SCF-LC，用 ChiralPak AD-H
21×250 mm管柱分離，得到 N-(4-{(4S)-4-[(2-甲基丙醯基)
胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡
啶-2-甲醯胺。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.61 (s,
1H), 8.50 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 7.66 (d, *J*=7.6
Hz, 1H), 7.56-7.49 (m, 2H), 7.43 (d, *J*=5.1 Hz, 1H), 7.37-
7.29 (m, 2H), 6.05-5.99 (m, 1H), 4.84-4.77 (m, 4H), 3.89-
3.73 (m, 1H), 2.47-2.39 (m, 1H), 2.41-2.30 (m, 2H), 2.11-
1.97 (m, 1H), 1.93-1.82 (m, 1H), 1.67-1.50 (m, 1H), 1.00
(dd, *J*=6.8, 2.4 Hz, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 405 (M+H)⁺。

實例 1474

N-[4-(1-苯甲醯基氮雜環丁烷-3-基)丁基]-1,3-二氫-異
吲哚-2-甲醯胺

實例 1474A

3-(2-羥基乙基)氮雜環丁烷-1-甲酸第三丁酯

2-(1-(第三丁氧基羰基)氮雜環丁烷-3-基)乙酸(1 g, 4.65
mmol)於四氫呋喃(5 ml)中之溶液冷卻至 0°C 且用硼烷四氫
呋喃複合物(7.00 ml, 7 mmol)藉由注射器逐滴處理。在
0°C 下 1 小時後，溶液升溫至室溫且攪拌隔夜，接著其用 20

ml 1 M NaOH水溶液淬滅。分離之水層用乙醚(2×15 ml)萃取，經硫酸鎂乾燥，過濾且濃縮，得到標題化合物，其未經純化即使用。

實例 1474B

3-(2-側氧基乙基)氮雜環丁烷-1-甲酸第三丁酯

在-78°C下藉由注射器向乙二醯氯(488 μ l, 5.58 mmol)於40 ml二氯甲烷中之溶液中逐滴添加二甲亞砷(792 μ l, 11.16 mmol)。混合物在-78°C下攪拌15分鐘，此時藉由注射器逐滴添加3-(2-羥基乙基)氮雜環丁烷-1-甲酸第三丁酯(936 mg, 4.65 mmol)於10 ml二氯甲烷中之溶液。在-78°C下1小時後，添加三乙胺(3241 μ l, 23.25 mmol)且懸浮液升溫至室溫並再攪拌1小時。混合物用水(25 ml)及飽和碳酸鉀水溶液(10 ml)淬滅，用力攪拌且分離。水層用二氯甲烷(2×20 ml)萃取且合併之有機層經硫酸鎂乾燥，過濾且濃縮。粗物質進行急驟層析，得到標題化合物。

實例 1474C

3-(3-氰基烯丙基)氮雜環丁烷-1-甲酸第三丁酯

藉由注射器向0°C下1 M第三丁醇鉀之四氫呋喃溶液(3694 μ l, 3.69 mmol)中逐滴添加氰基甲基膦酸二乙酯(570 μ l, 3.52 mmol)於5 ml四氫呋喃中之溶液。反應混合物升溫至室溫，接著再冷卻至0°C。此溶液用含3-(2-側氧基乙基)氮雜環丁烷-1-甲酸第三丁酯(701 mg, 3.52 mmol)之2 ml四氫呋喃藉由注射器逐滴處理，接著升溫至室溫。攪拌隔夜後，凝膠狀混合物用水(20 ml)淬滅且用乙酸乙酯

(2×20 ml)萃取；有機層用鹽水(20 ml)洗滌，經硫酸鎂乾燥，過濾且濃縮。液體殘餘物進行急驟層析，得到呈E/Z異構體之1:1混合物形式的標題化合物。

實例 1474D

3-(4-胺基丁基)氮雜環丁烷-1-甲酸第三丁酯

7 M $\text{NH}_3\text{-CH}_3\text{OH}$ (10 mL)添加至20 mL耐壓瓶中之3-(3-氯基烯丙基)氮雜環丁烷-1-甲酸第三丁酯(640 mg, 2.88 mmol)及Ra-Ni 2800之水漿狀物(881 mg, 6.75 mmol)中。混合物在30 psi氮氣下在室溫下攪拌16小時。混合物經由聚丙烯膜過濾，藉由旋轉蒸發濃縮且真空乾燥，得到標題化合物，其未經純化即使用。

實例 1474E

3-(4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)丁基)氮雜環丁烷-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例344A中所述，用3-(4-胺基丁基)氮雜環丁烷-1-甲酸第三丁酯代替5-胺基異吲哚啉-2-甲酸第三丁酯製備。

實例 1474F

N-(4-(氮雜1M環丁烷-3-基)丁基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例2D中所述，用3-(4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)丁基)氮雜環丁烷-1-甲酸第三丁酯代替4-((4-(5-氯異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 1474G

N-[4-(1-苯甲醯基氮雜環丁烷-3-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例278中所述，用苯甲醯氯代替乙醯氯及N-(4-(氮雜環丁烷-3-基)丁基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。

^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 7.67-7.57 (m, 2H), 7.57-7.39 (m, 3H), 7.39-7.23 (m, 4H), 6.28 (s, 1H), 4.56 (s, 4H), 4.34 (t, $J=8.3$ Hz, 1H), 4.11 (t, $J=9.0$ Hz, 1H), 4.01-3.82 (m, 1H), 3.65 (dd, $J=9.8, 5.8$ Hz, 1H), 3.07 (dd, $J=12.7, 6.8$ Hz, 2H), 2.66-2.53 (m, 1H), 1.59 (dd, $J=15.3, 7.7$ Hz, 2H), 1.51-1.36 (m, 2H), 1.25 (dd, $J=13.5, 6.4$ Hz, 2H); MS (ESI(+)) m/e 378 ($M+H$) $^+$ 。

實例1475

N-[4-(1-苯甲醯基氮雜環丁烷-3-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡
咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

實例1475A

3-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)丁基)氮
雜環丁烷-1-甲酸第三丁酯

標題化合物如實例344A中所述，用3-(4-胺基丁基)氮雜環丁烷-1-甲酸第三丁酯代替5-胺基異吲哚啉-2-甲酸第三丁酯及1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶代替異吲哚啉製備。

實例1475B

N-(4-(氮雜環丁烷-3-基)丁基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-

N-[4-(1-乙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2E)-4-甲基戊-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲氧基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊-1-烯-1-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(噻吩-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環己基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,2-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

2(3H)-甲醯胺

標題化合物如實例 2D 中所述，用 3-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)丁基)氮雜環丁烷-1-甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例 1475C

N-[4-(1-苯甲醯基氮雜環丁烷-3-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 278 中所述，用苯甲醯氯代替乙醯氯及 N-(4-(氮雜環丁烷-3-基)丁基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 5-胺基-N-(4-(丙基胺甲醯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.55 (s, 1H), 8.46 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 7.67-7.55 (m, 2H), 7.55-7.34 (m, 4H), 6.37 (t, *J*=5.5 Hz, 1H), 4.60 (d, *J*=2.3 Hz, 4H), 4.35 (t, *J*=8.3 Hz, 1H), 4.11 (t, *J*=9.1 Hz, 1H), 3.96-3.83 (m, 1H), 3.65 (dd, *J*=9.7, 5.7 Hz, 1H), 3.07 (dd, *J*=12.8, 6.7 Hz, 2H), 2.65-2.53 (m, 1H), 1.59 (dd, *J*=15.2, 7.6 Hz, 2H), 1.43 (dd, *J*=14.4, 7.2 Hz, 2H), 1.34-1.09 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 379 (M+H)⁺。

實例 1476

N-[反-3-(苯甲基胺甲醯基)環丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

實例 1476A

反-3-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)環丁烷

甲酸

標題化合物如實例272A中所述，用反-3-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]環丁烷甲酸苯甲酯代替4-硝基-N-丙基苯甲醯胺製備。

實例1476B

N-[反-3-(苯甲基胺甲醯基)環丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用苯甲胺代替3-苯基丙-1-胺及反-3-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)環丁烷甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.56 (s, 1H), 8.47 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.26 (t, *J*=5.9 Hz, 1H), 7.39 (d, *J*=5.1 Hz, 1H), 7.36-7.28 (m, 2H), 7.27-7.20 (m, 3H), 6.60 (d, *J*=7.6 Hz, 1H), 4.65-4.59 (m, 4H), 4.45-4.29 (m, 1H), 4.28 (d, *J*=5.9 Hz, 2H), 2.96-2.84 (m, 1H), 2.41-2.29 (m, 2H), 2.30-2.15 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 351 (M+H)⁺。

實例1477

N-{反-3-[(2-苯基乙基)胺甲醯基]環丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用2-苯基乙胺代替3-苯基丙-1-胺及反-3-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)環丁烷甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.56 (s, 1H), 8.47 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 7.80 (t, *J*=5.6 Hz, 1H), 7.39 (d, *J*=5.1 Hz,

1H), 7.33-7.24 (m, 2H), 7.23-7.16 (m, 3H), 6.57 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 4.65-4.58 (m, 4H), 4.38-4.24 (m, 1H), 3.33-3.23 (m, 2H), 2.84-2.74 (m, 1H), 2.72 (t, $J=7.3$ Hz, 2H), 2.32-2.22 (m, 2H), 2.24-2.09 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 365 (M+H)⁺。

實例 1478

N-{反-3-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]環丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 3-苯基丙胺代替 3-苯基丙-1-胺及反-3-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺基)環丁烷甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)苯甲酸製備。

¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 8.56 (s, 1H), 8.47 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 7.75 (t, $J=5.5$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.32-7.24 (m, 2H), 7.24-7.13 (m, 3H), 6.58 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 4.66-4.55 (m, 4H), 4.41-4.27 (m, 1H), 3.11-3.03 (m, 2H), 2.89-2.75 (m, 1H), 2.62-2.52 (m, 2H), 2.39-2.25 (m, 2H), 2.26-2.11 (m, 2H), 1.76-1.63 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 379 (M+H)⁺。

實例 1525

N-[4-(順-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙鹽基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺

實例 1525A

4-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺基)苯基)環己基胺基甲酸第三丁酯

標題化合物如實例979A中所述，用4-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)環己-3-烯基胺基甲酸第三丁酯代替4-(4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯基)-5,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯製備。

實例1525B

N-(4-(4-胺基環己基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺

標題化合物如實例2D中所述，用4-(4-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)苯基)環己基胺基甲酸第三丁酯代替4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸第三丁酯製備。

實例1525C

N-[4-(順-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(4-(4-胺基環己基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及2-(2-甲氧基乙氧基)乙酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸，以1:1順/反混合物形式製備。HPLC分離順/反異構體，得到N-[4-(順-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺。

^1H NMR (501 MHz, DMSO- d_6) δ 8.59 (bs, 1H), 8.51-8.45 (m, 1H), 8.32 (bs, 1H), 7.44 (dd, J = 11.5, 5.2 Hz, 3H), 7.40 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 7.17-7.11 (m, 2H), 4.81-4.74 (m, 4H), 4.03-3.96 (m, 1H), 3.90 (d, J = 2.2 Hz, 2H), 3.63-3.58 (m,

2H), 3.52-3.46 (m, 2H), 3.27-3.23 (m, 3H), 1.80-1.30 (m, 8H); MS (ESI(+)) m/e 453 ($M+H$)⁺。

實例 1526

N-[4-(反-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(4-胺基環己基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及 2-(2-甲氧基乙氧基)乙酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸，以 1:1 順/反混合物形式製備。HPLC 分離順/反異構體，得到 N-[4-(反-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺。

¹H NMR (501 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.58 (s, 1H), 8.48 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 7.50-7.39 (m, 4H), 7.15-7.09 (m, 2H), 4.81-4.74 (m, 4H), 3.85 (s, 2H), 3.74-3.58 (m, 1H), 3.58-3.55 (m, 2H), 3.49-3.46 (m, 2H), 3.28 (s, 3H), 2.45-2.37 (m, 1H), 1.89-1.82 (m, 2H), 1.83-1.75 (m, 2H), 1.58-1.42 (m, 2H), 1.44-1.29 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 453 ($M+H$)⁺。

實例 1527

N-[4-(順-4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羧基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(4-胺基環己基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及 (S)-四氫呋喃-2-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯

甲酸，以 1:1 順/反混合物形式製備。HPLC 分離順/反異構體，得到 N-[4-(順-4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺。¹H NMR (501 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.59 (s, 1H), 8.48 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.47-7.38 (m, 4H), 7.17-7.12 (m, 2H), 4.81-4.75 (m, 4H), 4.29-4.22 (m, 1H), 3.94-3.86 (m, 2H), 3.77 (t, *J*=7.1 Hz, 1H), 2.14-2.02 (m, 1H), 1.88-1.78 (m, 3H), 1.70 (dd, *J*=22.1, 8.6 Hz, 3H), 1.63 (t, *J*=17.3 Hz, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 435 (M+H)⁺。

實例 1528

N-[4-(反-4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(4-胺基環己基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及 (S)-四氫呋喃-2-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸，以 1:1 順/反混合物形式製備。HPLC 分離順/反異構體，得到 N-[4-(反-4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺。¹H NMR (501 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.58 (bs, 1H), 8.51-8.45 (m, 1H), 8.30 (bs, 1H), 7.53-7.45 (m, 1H), 7.42 (d, *J*=8.3 Hz, 2H), 7.14-7.08 (m, 2H), 4.81-4.74 (m, 4H), 4.20-4.13 (m, 1H), 3.92-3.85 (m, 1H), 3.78-3.71 (m, 1H), 3.66-3.58 (m, 1H), 2.39 (s, 1H), 2.09 (dd, *J*=10.8, 6.4 Hz, 1H), 1.79 (s, 7H), 1.62 (s, 1H), 1.45 (dd, *J*=26.5, 15.7 Hz, 4H); MS

(ESI(+)) m/e 435 ($M+H$)⁺。

實例 1529

N-[4-(順-4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(4-胺基環己基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及 (R)-四氫呋喃-2-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸，以 1:1 順/反混合物形式製備。HPLC 分離順/反異構體，得到 N-[4-(順-4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺。¹H NMR (501 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.55 (t, $J=21.5$ Hz, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.32 (d, $J=9.4$ Hz, 1H), 7.47-7.37 (m, 4H), 7.14 (bs, 2H), 4.77 (bs, 4H), 4.29-4.20 (m, 1H), 3.96-3.84 (m, 2H), 3.80-3.71 (m, 1H), 2.12-2.01 (m, 1H), 1.76 (d, $J=48.5$ Hz, 4H), 1.60 (s, 7H); MS (ESI(+)) m/e 435 ($M+H$)⁺。

實例 1530

N-[4-(反-4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(4-胺基環己基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及 (R)-四氫呋喃-2-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸，以 1:1 順/反混合物形式製備。HPLC 分離順/反異構體，得到 N-[4-(反-4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺。¹H

NMR (501 MHz, DMSO- d_6) δ 8.58 (bs, 1H), 8.50-8.45 (m, 1H), 8.31 (bs, 1H), 7.52-7.46 (m, 1H), 7.45-7.39 (m, 3H), 7.14-7.08 (m, 2H), 4.81-4.74 (m, 4H), 4.20-4.13 (m, 1H), 3.92-3.84 (m, 1H), 3.78-3.70 (m, 1H), 3.66-3.57 (m, 1H), 2.43-2.34 (m, 1H), 2.14-2.02 (m, 1H), 2.04-1.52 (m, 7H), 1.54-1.24 (m, 4H); MS (ESI(+)) m/e 435 (M+H)⁺。

實例 1531

N-(6-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

實例 1531A

6-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)噻嗪-3-甲酸甲酯

在氮氣下 6-胺基噻嗪-3-甲酸甲酯 (2 g, 13.06 mmol) 懸浮於二氯甲烷 (50 ml) 中，接著添加無水吡啶 (1.265 ml, 15.67 mmol)。在周圍溫度下經由注射器向此懸浮液中添加氯甲酸 4-硝基苯酯之二氯甲烷溶液 (2.99 g, 14.37 mmol)。混合物攪拌隔夜，得到懸浮液，其在氮氣流下濃縮至一半體積。2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶二鹽酸鹽 (2.52 g, 13.06 mmol) 溶於 30 ml 含三異丙基乙胺 (6.84 ml, 39.2 mmol) 之二甲基甲醯胺中且經由注射器添加至胺基甲酸酯混合物中。混合物攪拌隔夜且真空移除大部分溶劑後，添加水；且所得懸浮液攪拌 30 分鐘並過濾，得到固體，其用水洗滌。乾燥固體進行急驟層析，得到標題化合物。

實例 1531B

6-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)噻嗪-3-甲酸

標題化合物如實例1B中所述，用6-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)噻嗪-3-甲酸甲酯代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸甲酯製備。

實例1531C

N-(6-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用(2S)-四氫呋喃-2-基甲胺代替3-苯基丙-1-胺及6-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)噻嗪-3-甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 10.09 (s, 1H), 8.81 (t, *J*=6.1 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.51 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.31 (d, *J*=9.3 Hz, 1H), 8.12 (d, *J*=9.3 Hz, 1H), 7.44 (d, *J*=5.1 Hz, 1H), 5.05-4.76 (m, 4H), 4.04 (p, *J*=6.2 Hz, 1H), 3.85-3.74 (m, 1H), 3.70-3.59 (m, 1H), 3.45-3.31 (m, 2H), 1.99-1.72 (m, 3H), 1.69-1.54 (m, 1H); MS (ESI(+)) *m/e* 369 (M+H)⁺。

實例1542

N-(6-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用(2R)-四氫呋喃-2-基甲胺代替3-苯基丙-1-胺及6-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)噻嗪-3-甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 10.09 (bs, 1H),

8.81 (t, $J=6.1$ Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.51 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.31 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 8.12 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 5.05-4.76 (m, 4H), 4.04 (p, $J=6.2$ Hz, 1H), 3.85-3.74 (m, 1H), 3.70-3.59 (m, 1H), 3.35 (d, $J=25.7$ Hz, 2H), 1.99-1.72 (m, 3H), 1.69-1.54 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 369 ($M+H$)⁺。

實例 1543

N-{6-[(四氫-2H-嘧喃-4-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用四氫-2H-嘧喃-4-基胺代替 3-苯基丙-1-胺及 6-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)噻嗪-3-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 10.06 (s, 1H), 9.00 (t, $J=6.2$ Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.51 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.29 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 8.11 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 4.96-4.89 (m, 4H), 3.89-3.79 (m, 2H), 3.22 (d, $J=2.6$ Hz, 3H), 1.96-1.75 (m, 1H), 1.64-1.53 (m, 2H), 1.31-1.10 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 383 ($M+H$)⁺。

實例 1544

N-{6-[(環戊基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用環戊基胺代替 3-苯基丙-1-胺及 6-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺基)噻嗪-3-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H

N-{4-[1-(甲氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,2-二甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲基己醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,2-二甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丁基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(哌啶-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[2-(吡咯啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(順-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 10.03 (bs, 1H), 8.95 (t, $J=6.1$ Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.51 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.29 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 8.11 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 4.99-4.75 (m, 4H), 3.28-3.20 (m, 2H), 2.31-2.13 (m, 1H), 1.75-1.38 (m, 6H), 1.39-1.18 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 367 ($M+H$)⁺。

實例 1545

N-{6-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用四氫呋喃-3-基甲胺代替 3-苯基丙-1-胺及 6-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺基)噻嗪-3-甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲鹽胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 10.05 (s, 1H), 9.13 (t, $J=6.1$ Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.51 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.30 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 8.12 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 5.05-4.76 (m, 4H), 3.80-3.57 (m, 4H), 3.48 (dd, $J=12.1, 6.8$ Hz, 1H), 3.37-3.31 (m, 1H), 2.62-2.52 (m, 1H), 2.01-1.80 (m, 1H), 1.71-1.56 (m, 1H); MS (ESI(+)) m/e 369 ($M+H$)⁺。

實例 1546

N-{6-[(雙環[2.2.1]庚-2-基甲基)胺甲鹽基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用雙環[2.2.1]庚-2-基甲胺代替 3-苯基丙-1-胺及 6-(2,3-二氫-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-

甲醯胺基)噻嗪-3-甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 10.05 (bs, 1H), 8.92 (d, *J*=42.7 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.51 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.29 (d, *J*=9.3 Hz, 1H), 8.10 (d, *J*=9.3 Hz, 1H), 7.47-7.41 (m, 1H), 5.07-4.74 (m, 4H), 3.23-2.84 (m, 2H), 2.30-2.02 (m, 3H), 1.86-1.57 (m, 2H), 1.58-0.99 (m, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 393 (M+H)⁺。

實例 1547

○ N-(4-{反-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(4-胺基環己基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及異丁酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸，以 1:1 順/反混合物形式製備。HPLC 分離順/反異構體，得到 N-(4-{反-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-2-甲醯胺。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.58 (d, *J*=7.8 Hz, 1H), 7.48-7.40 (m, 3H), 7.17-7.09 (m, 2H), 4.82-4.76 (m, 4H), 3.65-3.47 (m, 1H), 2.41-2.23 (m, 2H), 1.93-1.69 (m, 4H), 1.62-1.38 (m, 2H), 1.39-1.12 (m, 2H), 0.99 (d, *J*=6.8 Hz, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 407 (M+H)⁺。

實例 1548

○ N-(4-{順-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-*c*]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(4-(4-胺基環己基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及異丁酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸，以1:1順/反混合物形式製備。HPLC分離順/反異構體，得到N-(4-{順-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.68-7.61 (m, 1H), 7.49-7.40 (m, 3H), 7.21-7.14 (m, 2H), 4.83-4.76 (m, 4H), 3.98-3.90 (m, 1H), 1.97-1.49 (m, 9H), 1.04-0.97 (m, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 407 (M+H)⁺。

實例1549

N-(4-{順-4-[(環己基羰基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(4-(4-胺基環己基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及環己烷甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸，以1:1順/反混合物形式製備。HPLC分離順/反異構體，得到N-(4-{順-4-[(環己基羰基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.66-7.59 (m, 1H), 7.47 (s, 1H), 7.47-7.40 (m, 2H), 7.21-7.14 (m, 2H), 4.83-4.76 (m, 4H), 3.98-3.90 (m, 1H), 2.45 (s, 1H), 2.31-2.19 (m, 1H), 1.89-1.46 (m, 12H), 1.46-1.05 (m, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 447 (M+H)⁺。

實例 1550

N-(4-{反-4-[(環己基羰基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(4-胺基環己基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及環己烷甲酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸，以 1:1 順/反混合物形式製備。HPLC 分離順/反異構體，得到 N-(4-{反-4-[(環己基羰基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.54 (d, *J*=7.9 Hz, 1H), 7.47-7.40 (m, 3H), 7.16-7.09 (m, 2H), 4.82-4.75 (m, 4H), 3.62-3.42 (m, 1H), 2.42-2.33 (m, 1H), 2.12-1.99 (m, 1H), 1.87-1.61 (m, 8H), 1.55-1.37 (m, 3H), 1.38-1.08 (m, 7H); MS (ESI(+)) *m/e* 447 (M+H)⁺。

實例 1551

N-(4-{反-4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(4-胺基環己基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及 2-環丙基乙酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸，以 1:1 順/反混合物形式製備。HPLC 分離順/反異構體，得到 N-(4-{反-4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.60 (s, 1H), 8.50 (d, *J*=5.0 Hz, 1H), 8.32 (s,

1H), 7.59 (d, $J=7.8$ Hz, 1H), 7.48-7.40 (m, 3H), 7.11 (s, 2H), 4.82-4.76 (m, 4H), 3.66-3.50 (m, 1H), 2.40 (t, $J=10.1$ Hz, 1H), 1.94 (t, $J=11.8$ Hz, 1H), 1.83 (dd, $J=23.4, 12.2$ Hz, 4H), 1.61-1.39 (m, 2H), 1.40-1.18 (m, 3H), 1.04-0.83 (m, 1H), 0.46-0.33 (m, 2H), 0.18-0.07 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 419 ($M+H$)⁺。

實例 1552

N-(4-{順-4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例 1C 中所述，用 N-(4-(4-胺基環己基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺代替 3-苯基丙-1-胺及 2-環丙基乙酸代替 4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸，以 1:1 順/反混合物形式製備。HPLC 分離順/反異構體，得到 N-(4-{順-4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.61 (s, 1H), 8.50 (d, $J=5.0$ Hz, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.67-7.60 (m, 1H), 7.49-7.40 (m, 3H), 7.21-7.13 (m, 2H), 4.83-4.76 (m, 4H), 4.02-3.92 (m, 1H), 2.06 (d, $J=7.0$ Hz, 2H), 1.84-1.65 (m, 4H), 1.65-1.47 (m, 4H), 1.25-0.90 (m, 1H), 0.47-0.34 (m, 2H), 0.23-0.11 (m, 2H); MS (ESI(+)) m/e 419 ($M+H$)⁺。

實例 1553

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

實例 1553A

4-(4-硝基苯基)環己-3-烯基胺基甲酸第三丁酯

標題物質如實例 1018B 中，用 4,4,5,5-四甲基-2-(4-硝基苯基)-1,3,2-二氧硼啉代替 N-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧硼啉-2-基)苯基)-1H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2(3H)-甲醯胺製備。

實例 1553B

4-(4-胺基苯基)環己-3-烯基胺基甲酸第三丁酯

○ 4-(4-硝基苯基)環己-3-烯基胺基甲酸第三丁酯 (2.55 g, 8.01 mmol) 懸浮於乙醇 (30 ml) 中，接著添加溶於水 (30 ml) 中之九水合硫化鈉 (10.37 ml, 80 mmol)。混合物加熱至 80°C，保持 1.5 小時且用二氯甲烷萃取；有機層合併，經硫酸鎂乾燥，過濾且濃縮，得到標題化合物。

實例 1553C

4-(4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯基)環己-3-烯基胺基甲酸第三丁酯

○ 標題化合物如實例 272B 中所述，用 4-(4-胺基苯基)環己-3-烯基胺基甲酸第三丁酯代替 4-胺基-N-丙基苯甲醯胺及異吲哚啉代替異吲哚啉-5-甲酸甲酯鹽酸鹽製備。

實例 1553D

N-(4-(4-胺基環己-1-烯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例 2D 中所述，用 4-(4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯基)環己-3-烯基胺基甲酸第三丁酯代替 4-((4-(5-氟異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲醯胺基)甲基)苯甲基胺基甲酸

第三丁酯製備。

實例1553E

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(4-(4-胺基環己-1-烯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及異丁酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.36 (s, 1H), 7.70 (d, *J*=7.6 Hz, 1H), 7.54 (d, *J*=2.1 Hz, 2H), 7.46-7.23 (m, 6H), 6.06-5.96 (m, 1H), 4.76 (s, 4H), 3.85-3.75 (m, 1H), 2.43-2.26 (m, 3H), 2.11-1.96 (m, 1H), 1.95-1.75 (m, 1H), 1.69-1.48 (m, 1H), 1.10-0.82 (m, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 404 (M+H)⁺。

實例1554

N-[4-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(4-(4-胺基環己-1-烯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及(2R)-四氫呋喃-2-甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.36 (s, 1H), 7.61 (dt, *J*=9.2, 4.6 Hz, 1H), 7.58-7.45 (m, 2H), 7.49-7.23 (m, 6H), 6.02 (bs, 1H), 4.77 (s, 4H), 4.25-4.16 (m, 1H), 3.97-3.66 (m, 3H), 2.42-2.24 (m, 1H), 2.26-1.98 (m, 3H), 1.98-1.53 (m, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 432 (M+H)⁺。

實例1555

N-[4-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(4-(4-胺基環己-1-烯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及(2S)-四氫呋喃-2-甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.37 (s, 1H), 7.63 (dd, *J*=8.2, 3.5 Hz, 1H), 7.57-7.50 (m, 2H), 7.49-7.23 (m, 6H), 6.04-5.96 (m, 1H), 4.76 (s, 4H), 4.25-4.16 (m, 1H), 3.96-3.67 (m, 4H), 2.38-2.29 (m, 1H), 2.27-1.99 (m, 3H), 1.97-1.56 (m, 5H); MS (ESI(+)) *m/e* 432 (M+H)⁺。

實例1556

N-(4-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚啉-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(4-(4-胺基環己-1-烯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及環戊基乙酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.34 (s, 1H), 7.72 (d, *J*=7.6 Hz, 1H), 7.57-7.49 (m, 2H), 7.49-7.23 (m, 6H), 6.01 (bs, 1H), 4.76 (s, 4H), 3.90-3.74 (m, 1H), 2.49-2.25 (m, 2H), 2.20-1.99 (m, 3H), 1.94-1.82 (m, 1H), 1.68 (tdd, *J*=9.4, 8.9, 4.4 Hz, 2H), 1.64-1.42 (m, 7H), 1.31-1.01 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 444 (M+H)⁺。

實例1557

N-(4-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-

二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(4-(4-胺基環己-1-烯基)苯基)異吡啶-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及環丙基乙酸代替4-(異吡啶-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.36 (s, 1H), 7.70 (d, *J*=7.6 Hz, 1H), 7.66-7.47 (m, 2H), 7.47-7.24 (m, 6H), 6.02 (bs, 1H), 4.76 (s, 4H), 3.88-3.78 (m, 1H), 2.49-2.26 (m, 3H), 2.12-1.82 (m, 4H), 1.72-1.50 (m, 1H), 1.13-0.88 (m, 1H), 0.52-0.33 (m, 2H), 0.18-0.01 (m, 2H); MS (ESI(+)) *m/e* 416 (M+H)⁺。

實例1558

N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(4-(4-胺基環己-1-烯基)苯基)異吡啶-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及2-羥基-2-甲基丙酸代替4-(異吡啶-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.36 (s, 1H), 7.52 (t, *J*=8.6 Hz, 2H), 7.46-7.39 (m, 1H), 7.35 (tdd, *J*=8.8, 7.1, 3.7 Hz, 6H), 6.07-5.96 (m, 1H), 5.40 (s, 1H), 4.77 (s, 4H), 3.92-3.76 (m, 1H), 2.46 (s, 1H), 2.39-2.25 (m, 1H), 2.24-2.09 (m, 2H), 1.93-1.78 (m, 1H), 1.70 (dt, *J*=12.4, 7.7 Hz, 1H), 1.25 (s, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 420 (M+H)⁺。

實例1559

N-(4-{4-[(四氫-2H-吡喃-4-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺

基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(4-(4-胺基環己-1-烯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及四氫-2H-吡喃-4-甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.36 (s, 1H), 7.76 (d, *J*=7.6 Hz, 1H), 7.57-7.49 (m, 2H), 7.46-7.23 (m, 6H), 6.02 (bs, 1H), 4.76 (s, 4H), 3.91-3.75 (m, 4H), 3.31-3.17 (m, 2H), 2.43-2.26 (m, 2H), 2.12-1.97 (m, 1H), 1.93-1.81 (m, 1H), 1.71-1.48 (m, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 446 (M+H)⁺。

實例1560

N-(4-{4-[(環己基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺

標題化合物如實例1C中所述，用N-(4-(4-胺基環己-1-烯基)苯基)異吲哚啉-2-甲醯胺代替3-苯基丙-1-胺及環己烷甲酸代替4-(異吲哚啉-2-甲醯胺基)苯甲酸製備。¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.35 (s, 1H), 7.64 (d, *J*=7.6 Hz, 1H), 7.57-7.49 (m, 2H), 7.47-7.23 (m, 6H), 6.01 (bs, 1H), 4.76 (s, 4H), 3.84-3.54 (m, 1H), 2.49-2.24 (m, 2H), 2.20-1.93 (m, 2H), 1.91-1.77 (m, 1H), 1.78-1.48 (m, 6H), 1.47-1.06 (m, 6H); MS (ESI(+)) *m/e* 444 (M+H)⁺。

N-[4-(順-4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(順-4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-1-(3-甲基丁醯基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-1-(環丁基羰基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3R)-1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啶-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3R)-1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啶-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-1-(環丙基乙醯基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(3-甲基丁醯基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(環丁基羰基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3S)-1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3S)-1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(環丙基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(環戊基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(雙環[2.2.1]庚-2-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(環己基羰基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(環己基羰基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二
氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二
氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-
基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-
基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯
基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}
苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環己基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

另一個實施例係關於如下式(Ic)化合物：

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

另一個實施例係關於如下式(Ic)化合物：

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

另一個實施例係關於一種用於治療如下病症、用於減少缺血-再灌注損傷、心肌梗塞面積(myocardial infarct size)及心肌纖維化、用於預防移植失敗及囊腫性纖維化之組合物，該組合物包含賦形劑及治療有效量之式(Ic)化合物或其醫藥學上可接受之鹽，該等病症為高血壓、慢性及充血性心臟衰竭、心臟肥大、再狹窄、慢性腎衰竭、蛛網膜下腔出血後腦血管痙攣、肺高血壓、動脈粥樣硬化、哮喘、男性勃起障礙、女性性功能障礙、膀胱過度活動症候群、脊髓損傷、創傷性腦損傷、中風、發炎及脫髓鞘疾病、阿茲海默氏症、疼痛、多發性硬化症、肌萎縮性側索硬化、亨廷頓氏病、帕金森氏症、發炎性疼痛、類風濕性關節炎、骨關節炎、大腸急躁症、克羅恩氏病、牛皮癬、潰瘍性結腸炎、狼瘡、發炎性腸道疾病、癌症、腫瘤轉移、病毒感染、細菌感染、胰島素抗性、糖尿病、眼高壓、早產、動脈粥樣硬化、脊髓性肌萎縮、腦脊髓炎、骨質疏鬆症、HIV-1、腦炎、缺血性CNS病症、血管型或AD型癡呆、青光眼、視網膜病、良性前列腺肥大、精神病症(尤

其抑鬱症、精神分裂症、強迫症及躁鬱症)、癲癇症及癲癇發作病症。

另一個實施例係關於一種用於治療如下病症之組合物，該組合物包含賦形劑及治療有效量之式(Ic)化合物或其醫藥學上可接受之鹽，該等病症為發炎及組織修復病症；尤其類風濕性關節炎、發炎性腸道疾病、哮喘及COPD(慢性阻塞性肺病)、骨關節炎、骨質疏鬆症及纖維化疾病；皮膚病，包括牛皮癬、異位性皮炎及紫外線誘發之皮膚損害；自體免疫疾病，包括全身性紅斑狼瘡、多發性硬化症、牛皮癬性關節炎、強直性脊柱炎、組織及器官排斥反應、阿茲海默氏症、中風、動脈粥樣硬化、再狹窄、糖尿病、腎小球性腎炎、癌症(尤其其中癌症係選自乳癌、前列腺癌、肺癌、結腸癌、子宮頸癌、卵巢癌、皮膚癌、CNS癌、膀胱癌、胰臟癌、白血病、淋巴瘤或霍奇金氏病(Hodgkin's disease))、惡病質、與感染有關之發炎及某些病毒感染，包括後天免疫缺乏症候群(AIDS)、成人呼吸窘迫症候群及共濟失調毛細管擴張症。

另一個實施例係關於一種治療患者之如下病症、用於減少患者之缺血-再灌注損傷、心肌梗塞面積及心肌纖維化、用於預防患者之移植失敗及囊腫性纖維化的方法，該方法包含向該患者投與治療有效量之式(Ic)化合物或其醫藥學上可接受之鹽，該等病症為高血壓、慢性及充血性心臟衰竭、心臟肥大、再狹窄、慢性腎衰竭、蛛網膜下腔出血後腦血管痙攣、肺高血壓、動脈粥樣硬化、哮喘、男性

勃起障礙、女性性功能障礙、膀胱過度活動症候群、脊髓損傷、創傷性腦損傷、中風、發炎及脫髓鞘疾病、阿茲海默氏症、疼痛、多發性硬化症、肌萎縮性側索硬化、亨廷頓氏病、帕金森氏症、發炎性疼痛、類風濕性關節炎、骨關節炎、大腸急躁症、克羅恩氏病、牛皮癬、潰瘍性結腸炎、狼瘡、發炎性腸道疾病、癌症、腫瘤轉移、病毒感染、細菌感染、胰島素抗性、糖尿病、眼高壓、早產、動脈粥樣硬化、脊髓性肌萎縮、腦脊髓炎、骨質疏鬆症、HIV-1、腦炎、缺血性CNS病症、血管型或AD型癡呆、青光眼、視網膜病、良性前列腺肥大、精神病症(尤其抑鬱症、精神分裂症、強迫症及躁鬱症)、癲癇症及癲癇發作病症。

另一個實施例係關於一種治療患者之如下病症之方法，該方法包含向該患者投與治療有效量之式(Ic)化合物或其醫藥學上可接受之鹽，該等病症為發炎及組織修復病症；尤其類風濕性關節炎、發炎性腸道疾病、哮喘及COPD(慢性阻塞性肺病)、骨關節炎、骨質疏鬆症及纖維化疾病；皮膚病，包括牛皮癬、異位性皮炎及紫外線誘發之皮膚損害；自體免疫疾病，包括全身性紅斑狼瘡、多發性硬化症、牛皮癬性關節炎、強直性脊柱炎、組織及器官排斥反應、阿茲海默氏症、中風、動脈粥樣硬化、再狹窄、糖尿病、腎小球性腎炎、癌症(尤其其中癌症係選自乳癌、前列腺癌、肺癌、結腸癌、子宮頸癌、卵巢癌、皮膚癌、CNS癌、膀胱癌、胰臟癌、白血病、淋巴瘤或霍奇金氏

病)、惡病質、與感染有關之發炎及某些病毒感染，包括後天免疫缺乏症候群(AIDS)、成人呼吸窘迫症候群及共濟失調毛細管擴張症。

另一個實施例係關於一種治療患者之如下病症、用於減少患者之缺血-再灌注損傷、心肌梗塞面積及心肌纖維化、用於預防患者之移植失敗及囊腫性纖維化的方法，該方法包含向該患者投與治療有效量之式(Ic)化合物或其醫藥學上可接受之鹽及治療有效量之一種其他治療劑或一種以上其他治療劑，該等病症為高血壓、慢性及充血性心臟衰竭、心臟肥大、再狹窄、慢性腎衰竭、蛛網膜下腔出血後腦血管痙攣、肺高血壓、動脈粥樣硬化、哮喘、男性勃起障礙、女性性功能障礙、膀胱過度活動症候群、脊髓損傷、創傷性腦損傷、中風、發炎及脫髓鞘疾病、阿茲海默氏症、疼痛、多發性硬化症、肌萎縮性側索硬化、亨廷頓氏病、帕金森氏症、發炎性疼痛、類風濕性關節炎、骨關節炎、大腸急躁症、克羅恩氏病、牛皮癬、潰瘍性結腸炎、狼瘡、發炎性腸道疾病、癌症、腫瘤轉移、病毒感染、細菌感染、胰島素抗性、糖尿病、眼高壓、早產、動脈粥樣硬化、脊髓性肌萎縮、腦脊髓炎、骨質疏鬆症、HIV-1、腦炎、缺血性CNS病症、血管型或AD型癡呆、青光眼、視網膜病、良性前列腺肥大、精神病症(尤其抑鬱症、精神分裂症、強迫症及躁鬱症)、癲癇症及癲癇發作病症。

另一個實施例係關於一種治療患者之如下病症之方法，

該方法包含向該患者投與治療有效量之式(Ic)化合物或其醫藥學上可接受之鹽及治療有效量之一種其他治療劑或一種以上其他治療劑，該等病症為發炎及組織修復病症；尤其類風濕性關節炎、發炎性腸道疾病、哮喘及COPD(慢性阻塞性肺病)、骨關節炎、骨質疏鬆症及纖維化疾病；皮膚病，包括牛皮癬、異位性皮炎及紫外線誘發之皮膚損害；自體免疫疾病，包括全身性紅斑狼瘡、多發性硬化症、牛皮癬性關節炎、強直性脊柱炎、組織及器官排斥反應、阿茲海默氏症、中風、動脈粥樣硬化、再狹窄、糖尿病、腎小球性腎炎、癌症(尤其其中癌症係選自乳癌、前列腺癌、肺癌、結腸癌、子宮頸癌、卵巢癌、皮膚癌、CNS癌、膀胱癌、胰臟癌、白血病、淋巴瘤或霍奇金氏病)、惡病質、與感染有關之發炎及某些病毒感染，包括後天免疫缺乏症候群(AIDS)、成人呼吸窘迫症候群及共濟失調毛細管擴張症或脾癌。

【實施方式】

實施方式僅意欲使其他熟習此項技術者熟悉申請者之發明、其原理及其實際應用，以便其他熟習此項技術者可修改本發明且以其各種形式應用，因為該等形式可能最適合於特定使用要求。實施方式及其特定實例僅意欲達成例示之目的。因此，本發明不限於本專利申請案中所描述之實施例，且可作各種修改。

縮寫及定義

除非本文中另外定義，否則結合本發明使用之科學及技

術術語應具有一般技術者通常理解之含義。術語之含義及範疇應為明確的；然而，若有任何潛在含糊性，則本文提供之定義優先於任何詞典或外來定義。在本申請案中，除非另有說明，否則使用「或」意謂「及/或」。此外，使用術語「包括(including)」以及其他形式(諸如「包括(includes)」及「包括(included)」)無限制性。關於詞語「包含(comprise)」或「包含(comprises)」或「包含(comprising)」在本專利申請案(包括申請專利範圍)中之使用，申請者注意到，除非上下文另外要求，否則彼等詞語係基於及清楚瞭解到其意謂包括性而非排他性而使用，且申請者意欲每個彼等詞在解釋本專利申請案，包括下文申請專利範圍時均為如此之含義。對於在本文中任何取代基中或本發明化合物或任何其他式中出現一次以上的變數，其在每次出現時之定義與其在所有其他出現時之定義無關。只有當取代基組合產生穩定化合物時，才允許該等組合。穩定化合物為可自反應混合物以適用純度分離之化合物。

應瞭解本文中所有組合均維持適當價數，具有一個以上原子之單價部分經由其左端連接，且二價部分自左至右描寫。

如本說明書及隨附申請專利範圍中所使用，除非相反說明，否則以下術語具有所指示之含義。

術語「烷基」(單獨或與另一術語組合)意謂通常含有1至約10個碳原子，或在另一個實施例中，1至約8個碳原

子，在另一個實施例中，1至約6個碳原子，且在另一個實施例中，1至約4個碳原子之直鏈或分支鏈飽和烴基取代基。該等取代基之實例包括甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、戊基、異戊基及己基及其類似基團。

術語「烯基」(單獨或與另一術語組合)意謂含有一或多個雙鍵且通常含有2至約10個碳原子，或在另一個實施例中，2至約8個碳原子，在另一個實施例中，2至約6個碳原子，且在另一個實施例中，2至約4個碳原子之直鏈或分支鏈烴基取代基。該等取代基之實例包括乙烯基、2-丙烯基、3-丙烯基、1,4-戊二烯基、1,4-丁二烯基、1-丁烯基、2-丁烯基及3-丁烯基及其類似基團。

術語「炔基」(單獨或與另一術語組合)意謂含有一或多個參鍵且通常含有2至約10個碳原子，或在另一個實施例中，2至約8個碳原子，在另一個實施例中，2至約6個碳原子，且在另一個實施例中，2至約4個碳原子之直鏈或分支鏈烴基取代基。該等取代基之實例包括乙炔基、2-丙炔基、3-丙炔基、2-丁炔基及3-丁炔基及其類似基團。

術語「碳環基」(單獨或與另一術語組合)意謂含有3至14個碳環原子(「環原子」為結合在一起形成環狀取代基之環的原子)之飽和環(亦即「環烷基」)、部分飽和環(亦即「環烯基」)或完全不飽和(亦即「芳基」)烴基取代基。碳環基可為單環(單一環)或多環環結構。

碳環基可為單環結構，其通常含有3至8個環原子，更通

常含有3至6個環原子，且甚至更通常含有5至6個環原子。該等單環碳環基之實例包括環丙基(環丙烷基)、環丁基(環丁烷基)、環戊基(環戊烷基)、環戊烯基、環戊二烯基、環己基(環己烷基)、環己烯基、環己二烯基及苯基。或者碳環基可為多環(亦即可含有一個以上環)。多環碳環基之實例包括橋連、稠合及螺環碳環基。在螺環碳環基中，兩個不同環共享一個原子。螺環碳環基之一實例為螺戊烷基。在橋連碳環基中，環共享至少兩個共同的不相鄰原子。橋連碳環基之實例包括雙環[2.2.1]庚基、雙環[2.2.1]庚-2-烯基及金剛烷基。在稠合環碳環基系統中，兩個或兩個以上環可稠合在一起，使得兩個環共享一個共同的鍵。二或三稠合環碳環基之實例包括萘基、四氫萘基(萘滿基)、蒽基、蒽滿基(二氫蒽基)、蔥基、菲基及十氫萘基。

術語「環烷基」(單獨或與另一術語組合)意謂含有3至14個碳環原子之飽和環狀烴基取代基。環烷基可為單環，其通常含有3至8個碳環原子且更通常含有3至6個環原子。單環環烷基之實例包括環丙基、環丁基、環戊基及環己基。或者環烷基可為多環或含有一個以上環。多環環烷基之實例包括橋連、稠合及螺環碳環基。在橋連環烷基中，環共享至少兩個共同的不相鄰原子。橋連環烷基之實例包括雙環[2.2.1]庚基及金剛烷基。

術語「芳基」(單獨或與另一術語組合)意謂含有6至14個碳環原子之芳族碳環基。芳基可為單一環或多環(亦即可含有一個以上環)。在多環芳環之情況下，僅要求多環

系統中一個環為不飽和，而剩餘環可為飽和、部分飽和或不飽和。芳基之實例包括苯基、萘基、蒽基、2,3-二氫蒽基、蒽滿基及四氫萘基。

在一些情況下，烴基取代基(例如烷基、烯基、炔基或環烷基)中碳原子數目由字首「 C_x-C_y- 」指示，其中 x 為取代基中碳原子數目最小值且 y 為取代基中碳原子數目最大值。因此，舉例而言，「 C_1-C_6 烷基」係指含有1至6個碳原子之烷基取代基。又例如， C_3-C_8 環烷基意謂含有3至8個碳環原子之飽和烴環。

術語「氫」(單獨或與另一術語組合)意謂氫基，且可描寫成-H。

術語「羥基」(單獨或與另一術語組合)意謂-OH。

術語「羧基」(單獨或與另一術語組合)意謂-C(O)-OH。

術語「胺基」(單獨或與另一術語組合)意謂-NH₂。

術語「鹵素」或「鹵基」(單獨或與另一術語組合)意謂氟基(其可描寫成-F)、氯基(其可描寫成-Cl)、溴基(其可描寫成-Br)或碘基(其可描寫成-I)。

若稱取代基「經取代」，則非氫基代替該取代基之碳或氮上之氫基。因此，舉例而言，經取代之烷基取代基為其中至少一個非氫基代替烷基取代基上之氫基的烷基取代基。舉例而言，單氟烷基為經一個氟基取代之烷基，且二氟烷基為經兩個氟基取代之烷基。應認識到，若取代基上存在一個以上取代，則各非氫基可為相同或不同的(除非另外說明)。

若稱取代基「視情況經取代」，則取代基可(1)未經取代或者(2)經取代。若稱取代基視情況經至多特定數目之非氫基取代，則取代基可(1)未經取代；或(2)經至多該特定數目之非氫基取代或者在至多取代基上最大數目可取代位置經取代(哪一者更少)。因此，舉例而言，若取代基稱為視情況經至多3個非氫基取代之雜芳基，則具有小於3個可取代位置之任何雜芳基視情況經至多僅與該雜芳基具有之可取代位置一樣多之非氫基取代。舉例而言，四唑基(其僅具有一個可取代位置)視情況經至多一個非氫基取代。又例如，若稱胺基氮視情況經至多2個非氫基取代，則一級胺基氮視情況經至多2個非氫基取代，而二級胺基氮視情況經至多僅1個非氫基取代。

本專利申請案可交換地使用術語「取代基」與「基團」。

字首「鹵基」指示該字首所連接之取代基經一或多個獨立選擇之鹵素基團取代。舉例而言，鹵烷基意謂至少一個氫基經鹵素基團置換之烷基取代基。鹵烷基之實例包括氯甲基、1-溴乙基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基及1,1,1-三氟乙基。應認識到，若取代基經一個以上鹵素基團取代，則彼等鹵素基團可為相同或不同的(除非另外說明)。

字首「全鹵」指示該字首所連接之取代基上的每個氫基均經獨立選擇之鹵素基團置換，亦即取代基上之每個氫基均經鹵素基團置換。若所有鹵素基團均相同，則字首通常確定鹵素基團。因此，舉例而言，術語「全氟」意謂該字

首所連接之取代基上的每個氫基均經氟基取代。舉例而言，術語「全氟烷基」意謂其中氟基代替每個氫基之烷基取代基。

術語「羰基」(單獨或與另一術語組合)意謂-C(O)-。

術語「胺基羰基」(單獨或與另一術語組合)意謂-C(O)-NH₂。

術語「側氧基」(單獨或與另一術語組合)意謂(=O)。

術語「氧基」(單獨或與另一術語組合)意謂醚取代基，且可描寫成-O-。

術語「烷基羥基」(單獨或與另一術語組合)意謂-烷基-OH。

術語「烷基胺基」(單獨或與另一術語組合)意謂-烷基-NH₂。

術語「烷氧基」(單獨或與另一術語組合)意謂烷基醚取代基，亦即-O-烷基。此類取代基之實例包括甲氧基(-O-CH₃)、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、異丁氧基、第二丁氧基及第三丁氧基。

術語「烷基羰基」(單獨或與另一術語組合)意謂-C(O)-烷基。

術語「胺基烷基羰基」(單獨或與另一術語組合)意謂-C(O)-烷基-NH₂。

術語「烷氧羰基」(單獨或與另一術語組合)意謂-C(O)-O-烷基。

術語「碳環基羰基」(單獨或與另一術語組合)意謂-

C(O)-碳環基。

類似地，術語「雜環基羰基」(單獨或與另一術語組合)意謂-C(O)-雜環基。

術語「碳環基烷基羰基」(單獨或與另一術語組合)意謂-C(O)-烷基-碳環基。

類似地，術語「雜環基烷基羰基」(單獨或與另一術語組合)意謂-C(O)-烷基-雜環基。

術語「碳環基氧基羰基」(單獨或與另一術語組合)意謂-C(O)-O-碳環基。

術語「碳環基烷氧基羰基」(單獨或與另一術語組合)意謂-C(O)-O-烷基-碳環基。

術語「硫基」或「硫雜」(單獨或與另一術語組合)意謂硫雜醚取代基，亦即其中二價硫原子代替醚氧原子之醚取代基。此類取代基可描寫成-S-。舉例而言，「烷基-硫基-烷基」意謂烷基-S-烷基(烷基-硫-烷基)。

術語「硫醇」或「氫硫基」(單獨或與另一術語組合)意謂氫硫基取代基，且可描寫成-SH。

術語「(硫羰基)」(單獨或與另一術語組合)意謂其中氧原子經硫置換之羰基。此類取代基可描寫成-C(S)-。

術語「磺醯基」(單獨或與另一術語組合)意謂-S(O)₂-。

術語「胺基磺醯基」(單獨或與另一術語組合)意謂-S(O)₂-NH₂。

術語「亞磺醯基」或「亞碲基」(單獨或與另一術語組合)意謂-S(O)-。

術語「雜環基」(單獨或與另一術語組合)意謂含有總共3至20個環原子之飽和(亦即「雜環烷基」)、部分飽和(亦即「雜環烯基」)或完全不飽和(亦即「雜芳基」)環結構。至少一個環原子為雜原子(亦即氧、氮或硫)，剩餘環原子獨立地選自由碳、氧、氮及硫組成之群。雜環基可為單環(單一環)或多環環結構。

雜環基可為單環結構，其通常含有3至7個環原子，更通常含有3至6個環原子，且甚至更通常含有5至6個環原子。單環雜環基之實例包括1,2,3,6-四氫吡啶、硫嗎啉基、四氫哌喃基、呋喃基、二氫呋喃基、四氫呋喃基、噻吩基(硫呋喃基)、二氫噻吩基、四氫噻吩基、吡咯基、吡咯啉基、吡咯啶基、吡咯啶-2-酮基、咪唑基、咪唑啉基、咪唑啶基、吡唑基、吡唑啉基、吡唑啶基、三唑基、四唑基、噁唑基、噁唑啶基、異噁唑啶基、異噁唑基、噻唑基、異噻唑基、噻唑啉基、異噻唑啉基、噻唑啶基、異噻唑啶基、噻二唑基、噁二唑基(包括1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基(呋咕基)或1,3,4-噁二唑基)、噁三唑基(包括1,2,3,4-噁三唑基或1,2,3,5-噁三唑基)、二噁唑基(包括1,2,3-二噁唑基、1,2,4-二噁唑基、1,3,2-二噁唑基或1,3,4-二噁唑基)、噁噻唑基、噁硫唑基、氧硫雜環戊烷基、哌喃基、二氫哌喃基、硫哌喃基、四氫硫哌喃基、吡啶基(吡嗪基)、哌啶基、二嗪基(包括噻嗪基(1,2-二嗪基)、嘧啶基(1,3-二嗪基)或吡嗪基(1,4-二嗪基))、哌嗪基、吡咯啶-2-酮基、三嗪基(包括1,3,5-三嗪基、1,2,4-三

噻基及1,2,3-三噻基)、噁噻基(包括1,2-噁噻基、1,3-噁噻基或1,4-噁噻基)、噁噻噻基(包括1,2,3-噁噻噻基、1,2,4-噁噻噻基、1,2,5-噁噻噻基或1,2,6-噁噻噻基)、噁二噻基(包括1,2,3-噁二噻基、1,2,4-噁二噻基、1,4,2-噁二噻基或1,3,5-噁二噻基)、嗎啉基、氮呋基、氧呋基、硫呋基、二氮呋基、硫嗎啉基、四氮噻吩基1,1-二氧離子基、四氮-2*H*-硫呋喃基1,1-二氧離子基、氧雜環丁烷基、氮雜環丁烷基、噻唑基、氮雜環庚烷基、氮雜環庚-2-酮基及二氧戊環基(包括1,3-二氧戊環基)。

或者雜環基可為多環(亦即可含有一個以上環)。多環雜環基之實例包括橋連、稠合及螺環雜環基。在螺環雜環基中，兩個不同環共享一個原子。在橋連雜環基中，環共享至少兩個共同的不相鄰原子。在稠合環雜環基中，兩個或兩個以上環可稠合在一起，使得兩個環共享一個共同的鍵。含有兩個、三個或四個環之稠合環雜環基之實例包括六氮-呋喃并[3,4-*c*]吡咯、六氮-呋喃并[3,4-*b*]吡咯、八氮-吡咯并[3,4-*b*]吡啶、八氮-吡咯并[3,4-*c*]吡啶、(3*aR*,6*aR*)-5-甲基-八氮-吡咯并[3,4-*b*]吡咯、(3*aR*,6*aR*)-八氮-吡咯并[3,4-*b*]吡咯、6-甲基-2,6-二氮雜-雙環[3.2.0]庚烷、(3*aS*,6*aR*)-2-甲基-八氮-吡咯并[3,4-*c*]吡咯、十氮-[1,5]噻啶、2,3-二氮苯并呋喃基、2,3,4,9-四氮-1*H*-吡啶并[3,4-*b*]吡啶基、噻吩并[3,2-*c*]吡啶基、呋喃并[3,2-*c*]吡啶基、異吡啶-1-酮基、酞噻-1(2*H*)-酮基、異喹啉基、異喹啉-1(2*H*)-酮基、5,6,7,8-四氮酞噻-1(2*H*)-酮基、氟酞噻-

1(2H)-酮基、(Z)-3H-苯并[d][1,2]二氮呋-4(5H)-酮基、(三氟甲基)酞嗪-1(2H)-酮基、吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮基、1,2,3,4-四氫異喹啉基、2,3-二氫苯并[b][1,4]二氧雜環己烯基、5,6,7,8-四氫酞嗪-1(2H)-酮基、5,6,7,8-四氫-[1,2,4]三唑并[4,3-a]吡嗪基、5,6,7,8-四氫咪唑并[1,5-a]吡嗪基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吲哚基、哌喃并吡咯基、4H-喹啉基、嘌呤基、嘧啶基、吡啶并吡啶基(包括吡啶并[3,4-b]-吡啶基、吡啶并[3,2-b]-吡啶基或吡啶并[4,3-b]-吡啶基)、喋啶基、4,5,6,7-四氫-吲哚基、5,6,7,8-四氫咪唑并[1,5-a]吡嗪基、6,7-二氫吡咯并[3,4-d]嘧啶基、6,7-二氫吡咯并[3,4-b]吡啶基、2,3-二氫吡咯并[3,4-c]吡啶基、6,7-二氫苯并呋喃-4(5H)-酮基、吲哚基、苯并[d][1,3]二氧雜環戊烯基、異喹啉基、吲哚基、喹啉-2(1H)-酮基、苯并[d]咪唑基、1,2,3,4-四氫環丁并[c]喹啉基、1,2-二氫環丁并[c]喹啉-3(4H)-酮基及3,3a,4,4a-四氫-2H-呋喃并[2',3':2,3]環丁并[1,2-c]喹啉-5(6H)-酮基。稠合環雜環基之其他實例包括苯并稠合雜環基，諸如苯并咪唑基、苯并[d][1,3]二氧雜環戊烯基、吲哚基、異吲哚基(異苯并唑基、假異吲哚基)、偽吲哚基(indoleninyl)(假吲哚基)、異吲唑基(苯并吡唑基)、苯并吡啶基(包括喹啉基(1-苯并吡啶)或異喹啉基(2-苯并吡啶))、酞嗪基、喹啉基、喹唑啉基、苯并二嗪基(包括呋啉基(1,2-苯并二嗪基)或喹唑啉基(1,3-苯并二嗪基))、苯并哌喃基(包括吡啶基或異吡啶基)、苯并噁嗪基(包括1,3,2-苯并

噁嗪基、1,4,2-苯并噁嗪基、2,3,1-苯并噁嗪基或3,1,4-苯并噁嗪基)、苯并異噁嗪基(包括1,2-苯并異噁嗪基或1,4-苯并異噁嗪基)、異吡啶-1-酮基、2,3-二氫苯并[b][1,4]二氧雜環己烯基、1,2,3,4-四氫異喹啉基、喹啉-2(1H)-酮基、苯并[d]咪唑基、2,3,4,9-四氫-吡啶并[3,4-b]吡啶基、1,2,3,4-四氫環丁并[c]喹啉基、1,2-二氫環丁并[c]喹啉-3(4H)-酮基及3,3a,4,4a-四氫-2H-呋喃并[2',3':2,3]環丁并[1,2-c]喹啉-5(6H)-酮基。螺環雜環基之實例包括1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸基、2-氧雜-6-氮雜-螺[3.3]庚基、雙環[2.2.1]庚-2-酮基、6-氧雜-1-氮雜-螺[3.3]庚基、2-氧雜-7-氮雜-螺[3.5]壬基、2-氧雜-6-氮雜-螺[3.5]壬基、2-氧雜-5-氮雜-螺[3.5]壬基、2-氧雜-6-氮雜-螺[3.4]辛基、2-氧雜-5-氮雜-螺[3.4]辛基、2,7-二氮雜螺[3.5]壬烷、1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸基、2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳基、2,9-二氮雜螺[5.5]十一碳基、2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳基、1-氧雜-8-氮雜螺[5.5]十一碳基、1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳基、3,9-二氮雜螺[5.5]十一碳基、1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳基、1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳基、1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸基、2,7-二氮雜螺[4.5]癸基、1,8-二氮雜螺[4.5]癸基、2,8-二氮雜螺[4.5]癸基、2,6-二氮雜螺[4.5]癸基、1,4-二氧雜螺[4.5]癸基、1,7-二氮雜螺[4.4]壬基、2,7-二氮雜螺[4.4]壬基、2,5-二氮雜螺[3.5]壬基、2,6-二氮雜螺[3.5]壬基、1,7-二氮雜螺[3.5]壬基、6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬基、1,6-二氮雜螺[3.5]壬基、2,6-二氮雜螺[3.4]辛基、6-

氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛基、5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛基及2,6-二氮雜螺[3.3]庚基。

術語「雜環烷基」(單獨或與另一術語組合)意謂飽和雜環基。雜環基之實例包括哌啶、四氫哌喃基、哌嗪基、嗎啉基、氮雜環庚-2-酮基、吡咯啉基、1,3-二氧戊環基、四氫呋喃基、吡咯啉-2-酮基、氧雜環丁烷基、氮雜環丁烷基、2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳基、2,9-二氮雜螺[5.5]十一碳基、2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳基、1-氧雜-8-氮雜螺[5.5]十一碳基、1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳基、3,9-二氮雜螺[5.5]十一碳基、1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳基、1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳基、1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸基、2,7-二氮雜螺[4.5]癸基、1,8-二氮雜螺[4.5]癸基、2,8-二氮雜螺[4.5]癸基、2,6-二氮雜螺[4.5]癸基、1,4-二氧雜螺[4.5]癸基、1,7-二氮雜螺[4.4]壬基、2,7-二氮雜螺[4.4]壬基、2,5-二氮雜螺[3.5]壬基、2,6-二氮雜螺[3.5]壬基、1,7-二氮雜螺[3.5]壬基、6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬基、1,6-二氮雜螺[3.5]壬基、2,6-二氮雜螺[3.4]辛基、6-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛基、5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛基、雙環[2.2.1]庚-2-酮基、1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸基、2,7-二氮雜螺[3.5]壬基及2,6-二氮雜螺[3.3]庚基。

術語「雜芳基」(單獨或與另一術語組合)意謂含有5至14個環原子之芳族雜環基。雜芳基可為單一環或多環(亦即可含有一個以上環)。在多環雜芳基之情況下，僅要求多環系統中一個雜環基環為不飽和，而剩餘環可為飽和、

部分飽和或不飽和。雜芳基取代基之實例包括：6員環取代基，諸如吡啶基、吡嗪基、吡咯基、異噁唑基、1,2,3-三唑基、嘧啶基、噻嗪基及1,3,5-、1,2,4-或1,2,3-三嗪基；5員環取代基，諸如咪唑基、呋喃基、噻吩基、吡唑基、噁唑基、異噁唑基、噻唑基、1,2,3-、1,2,4-、1,2,5-及1,3,4-噁二唑基及異噻唑基；6/5員稠合環取代基，諸如吲哚基、苯并硫呋喃基、苯并異噁唑基、苯并噁唑基、嘌呤基、4,5,6,7-四氫-吲哚基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、5,6,7,8-四氫咪唑并[1,5-a]吡嗪基、苯并[d]咪唑基、6,7-二氫-吡咯并[3,4-d]嘧啶基、6,7-二氫-吡咯并[3,4-b]吡啶基、2,3-二氫-吡咯并[3,4-c]吡啶基、5,6,7,8-四氫咪唑并[1,5-a]吡嗪基、6,7-二氫苯并呋喃-4(5H)-酮基、6,7-二氫苯并呋喃-4(5H)-酮基及吲哚基；6/6員稠合環，諸如苯并哌喃基、喹啉基、異喹啉基、吡啶基、喹啉基、苯并噁嗪基、5,6,7,8-四氫酞嗪-1(2H)-酮基、酞嗪-1(2H)-酮基、異喹啉-1(2H)-酮基及喹啉-2(1H)-酮基；6/5/6員環，諸如2,3,4,9-四氫-1H-吡啶并[3,4-b]吲哚基及1,2-二氫環丁并[c]喹啉-3(4H)-酮基；及6/6/4/5員環，諸如2,3,4,9-四氫-吡啶并[3,4-b]吲哚基。

連接於多組分取代基之字首僅應用於第一組分。舉例而言，術語「烷基環烷基」含有兩組分：烷基及環烷基。因此，C₁-C₆烷基環烷基上之C₁-C₆字首意謂烷基環烷基之烷基組分含有1至6個碳原子；C₁-C₆字首並不描述環烷基組

分。進一步說明，鹵烷氧基烷基上之字首「鹵」僅指示烷氧基烷基取代基之烷氧基組分經一或多個鹵素基團取代。若鹵素取代或者或另外出現在烷基組分上，則取代基改稱作「經鹵素取代之烷氧基烷基」而非「鹵烷氧基烷基」。且最終，若鹵素取代僅出現在烷基組分上，則取代基改稱作「烷氧基鹵烷基」。

術語「治療(treat、treating及treatment)」係指減輕或消除疾病及/或其伴隨症狀之方法。

術語「預防(prevent、preventing及prevention)」係指防止疾病及/或其伴隨症狀發作或阻止個體患上疾病之方法。如本文所用，術語「預防(prevent、preventing及prevention)」亦包括延遲疾病及/或其伴隨症狀發作及降低個體患上疾病之風險。

術語「治療有效量」係指所投與化合物足以防止所治療之病狀或病症之一或多種症狀發展或在某種程度上減輕該一或多種症狀時的用量。

術語「調節」係指化合物增強或減弱激酶功能或活性之能力。如本文所用，呈各種形式之「調節」意欲涵蓋與激酶有關之活性的拮抗作用、促效作用、部分拮抗作用及/或部分促效作用。激酶抑制劑為例如結合、部分或完全阻斷刺激、減少、防止、延遲活化、不活化、鈍化或下調信號轉導之化合物。激酶活化劑為例如結合、刺激、增加、打開、活化、促進、增強活化、敏化或上調信號轉導之化合物。

如本文所用之術語「組合物」意欲涵蓋包含指定量之指定成分的產物，以及由指定量之指定成分的組合直接或間接產生的任何產物。「醫藥學上可接受」意謂載劑、稀釋劑或賦形劑必須與調配物之其他成分相容且對其接受者無害。

「個體」在本文中之定義係包括諸如哺乳動物之動物，包括(但不限於)靈長類動物(例如人類)、牛、綿羊、山羊、馬、犬、貓、兔、大鼠、小鼠及其類似動物。在較佳實施例中，個體為人類。

經同位素增濃或標記之化合物

本發明之化合物可呈含有一或多個其原子質量或質量數不同於自然界中最大量存在之原子質量或質量數之原子的同位素標記或增濃形式存在。同位素可為放射性或非放射性同位素。諸如氫、碳、磷、硫、氟、氯及碘之原子的同位素包括(但不限於) ^2H 、 ^3H 、 ^{13}C 、 ^{14}C 、 ^{15}N 、 ^{18}O 、 ^{32}P 、 ^{35}S 、 ^{18}F 、 ^{36}Cl 及 ^{125}I 。含有此等及/或其他原子之其他同位素的化合物均在本發明之範疇內。

在另一個實施例中，同位素標記化合物含有氘(^2H)、氚(^3H)或 ^{14}C 同位素。本發明之同位素標記化合物可由一般技術者熟知之一般方法製備。該等同位素標記化合物宜藉由進行本文揭示之實例及流程中所揭示之程序，用易獲得之同位素標記試劑代替未標記試劑來製備。在一些情況下，化合物可經同位素標記試劑處理，使正常原子與其同位素交換，例如可在諸如 $\text{D}_2\text{SO}_4/\text{D}_2\text{O}$ 之含氘酸的作用下，使氫

與氬交換。除上述外，相關程序及中間物揭示於例如 Lizondo, J等人, *Drugs Fut*, 21(11), 1116 (1996); Brickner, S J等人, *J Med Chem*, 39(3), 673 (1996); Mallesham, B等人, *Org Lett*, 5(7), 963 (2003); PCT 公開案 WO 1997010223、WO 2005099353、WO 1995007271、WO 2006008754; 美國專利第 7538189號、第 7534814號、第 7531685號、第 7528131號、第 7521421號、第 7514068號、第 7511013號; 及美國專利申請公開案第 20090137457號、第 20090131485號、第 20090131363號、第 20090118238號、第 20090111840號、第 20090105338號、第 20090105307號、第 20090105147號、第 20090093422號、第 20090088416號及第 20090082471號中，該等方法以引用的方式併入本文中。

本發明之同位素標記化合物可用作結合分析法中測定 Bcl-2抑制劑之效力的標準物。含有同位素之化合物已用於醫藥研究中，藉由評估非同位素標記母體化合物之作用機制及代謝途徑來研究化合物之活體內代謝結果(Blake等人, *J. Pharm. Sci.* **64**, 3, 367-391 (1975))。該等代謝研究對安全有效之治療藥物的設計而言具有重要意義，此係因為該活體內活性化合物投與患者或因為由母體化合物產生之代謝物經證明為有毒或致癌(Foster等人, *Advances in Drug Research* 第14卷，第2-36頁，Academic press, London, 1985; Kato等人, *J. Labelled Comp. Radiopharmaceut.*, 36(10):927-932 (1995); Kushner等人, *Can. J. Physiol.*

Pharmacol, 77, 79-88 (1999))。

另外，含有非放射性同位素之藥物，諸如稱為「重藥物」之氙化藥物可用於治療與Bcl-2活性相關之疾病及病狀。化合物中同位素之含量提高至其天然豐度以上稱作增濃。增濃量之實例包括約0.5、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、12、16、21、25、29、33、37、42、46、50、54、58、63、67、71、75、79、84、88、92、96至約100 mol%。已在包括齧齒動物及犬之哺乳動物體內使用重同位素置換至多約15%之正常原子，且維持數天至數週之時間，觀測到最低程度之不良影響(Czajka D M及Finkel A J, *Ann. N.Y. Acad. Sci.* 1960 84: 770；Thomson J F, *Ann. New York Acad. Sci* 1960 84: 736；Czajka D M等人, *Am. J. Physiol.* 1961 201: 357)。發現在人類體液中以氙短期置換高達15%-23%不會引起毒性(Blagojevic N等人, 「Dosimetry & Treatment Planning for Neutron Capture Therapy」, Zamenhof R, Solares G及Harling O編, 1994. *Advanced Medical Publishing, Madison Wis.* 第125-134頁；*Diabetes Metab.* 23:251(1997))。

藥物之穩定同位素標記可改變其物理化學性質，諸如pKa及脂質溶解性。若同位素取代影響與配體-受體相互作用相關之區域，則此等影響及變化可影響藥物分子之藥效反應。雖然穩定同位素標記分子之一些物理性質與未標記分子不同，但除以下重要一點外，化學及生物性質均相同：因為重同位素之質量增加，所以任何涉及重同位素及

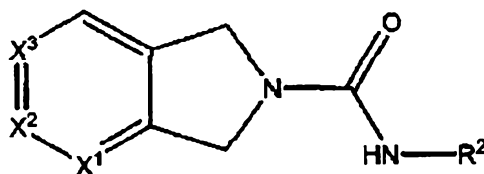
另一原子之鍵將比輕同位素與該原子之間的相同鍵要強。因此，同位素併入代謝或酶轉化位點中將減緩該等反應，相對於非同位素化合物，可能會改變藥物動力學型態或功效。

化合物

式(I)化合物中 X^1 、 X^2 、 X^3 及 R^2 之適合基團獨立選擇。本發明之所述實施例可組合。涵蓋該組合且其處於本發明之範疇內。舉例而言，預期任一 X^1 、 X^2 、 X^3 及 R^2 之實施例可與關於任何其他 X^1 、 X^2 、 X^3 及 R^2 所定義之實施例組合。

式(I)之實施例

因此，本發明之一個實施例係關於適用作NAMPT抑制劑之化合物或醫藥學上可接受之鹽，該等化合物具有式(I)，



式(I);

其中

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、OH、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$ 或 $C(O)NH_2$ ；

R^2 為烷基、烯基、炔基、苯基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^4 、 OR^4 、 SR^4 、 $S(O)R^4$ 、 SO_2R^4 、 $C(O)R^4$ 、 $CO(O)R^4$ 、 $OC(O)R^4$ 、 $OC(O)OR^4$ 、 NH_2 、 NHR^4 、 $N(R^4)_2$ 、 $NHC(O)R^4$ 、 $NR^4C(O)R^4$ 、 $NHS(O)_2R^4$ 、 $NR^4S(O)_2R^4$ 、 $NHC(O)OR^4$ 、 $NR^4C(O)OR^4$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^4$ 、 $NHC(O)N(R^4)_2$ 、 $NR^4C(O)NHR^4$ 、 $NR^4C(O)N(R^4)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^4$ 、 $C(O)N(R^4)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^4$ 、 $C(O)NHSO_2R^4$ 、 $C(O)NR^4SO_2R^4$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^4 、 $SO_2N(R^4)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、OH、(O)、CN、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、F、Cl、Br或I取代；其中各苯基視情況在對位經1個獨立選擇之 R^5 、 $OCH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 SR^5 、 $S(O)R^5$ 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 $OC(O)R^5$ 、 $OC(O)OR^5$ 、 NH_2 、 NHR^5 、 $N(R^5)_2$ 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NR^5C(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $NR^5S(O)_2R^5$ 、 $NHC(O)OR^5$ 、 $NR^5C(O)OR^5$ 、

NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^5 、 $\text{NHC(O)N(R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)NHR}^5$ 、
 $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^5 、 $\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、
 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^5 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{C(O)NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、
 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、
 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 Br 或 I 取
 代；其中各苯基視情況經1個 F 取代；其中各雜環基、環烷
 基及環烯基視情況經一或多個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、
 S(O)R^5 、 SO_2R^5 、 C(O)R^5 、 CO(O)R^5 、 OC(O)R^5 、 OC(O)OR^5 、
 NH_2 、 NHR^5 、 $\text{N(R}^5)_2$ 、 NHC(O)R^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)R}^5$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^5$ 、
 $\text{NR}^5\text{S(O)}_2\text{R}^5$ 、 NHC(O)OR^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)OR}^5$ 、 NHC(O)NH_2 、
 NHC(O)NHR^5 、 $\text{NHC(O)N(R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)NHR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、
 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^5 、 $\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^5 、
 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{C(O)NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、
 $\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 N_3 、 CF_3 、
 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中 R^2 不
 為4-甲基苯基；

R^3 為烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各烷基、
 烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、
 S(O)R^6 、 SO_2R^6 、 C(O)R^6 、 CO(O)R^6 、 OC(O)R^6 、 OC(O)OR^6 、
 NH_2 、 NHR^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 、 NHC(O)R^6 、 $\text{NR}^6\text{C(O)R}^6$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^6$ 、
 $\text{NR}^6\text{S(O)}_2\text{R}^6$ 、 NHC(O)OR^6 、 $\text{NR}^6\text{C(O)OR}^6$ 、 NHC(O)NH_2 、
 NHC(O)NHR^6 、 $\text{NHC(O)N(R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)NHR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、
 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^6 、 $\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^6 、
 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{C(O)NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、

$\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^4 為烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^7 、 OR^7 、 SR^7 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^7$ 、 SO_2R^7 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^7$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^7$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^7$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^7$ 、 NH_2 、 NHR^7 、 $\text{N}(\text{R}^7)_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^7$ 、 $\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^7$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^7$ 、 $\text{NR}^7\text{S}(\text{O})_2\text{R}^7$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^7$ 、 $\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{OR}^7$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^7$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7)_2$ 、 $\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{NHR}^7$ 、 $\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^7$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^7$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^7$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^7\text{SO}_2\text{R}^7$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^7 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^7)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各芳基及雜環基視情況經一或多個獨立選擇之 R^8 、 OR^8 、 SR^8 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^8$ 、 SO_2R^8 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^8$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^8$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^8$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^8$ 、 NH_2 、 NHR^8 、 $\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^8$ 、 $\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{R}^8$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^8$ 、 $\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_2\text{R}^8$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^8$ 、 $\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{OR}^8$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^8$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{NHR}^8$ 、 $\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^8$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^8$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^8$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{SO}_2\text{R}^8$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^8 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^8)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯

基；其中各烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $S(O)R^9$ 、 SO_2R^9 、 $C(O)R^9$ 、 $CO(O)R^9$ 、 $OC(O)R^9$ 、 $OC(O)OR^9$ 、 NH_2 、 NHR^9 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)R^9$ 、 $NHS(O)_2R^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^9$ 、 $NHC(O)OR^9$ 、 $NR^9C(O)OR^9$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^9$ 、 $NHC(O)N(R^9)_2$ 、 $NR^9C(O)NHR^9$ 、 $NR^9C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^9$ 、 $C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^9$ 、 $C(O)NHSO_2R^9$ 、 $C(O)NR^9SO_2R^9$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $SO_2N(R^9)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $S(O)R^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $N(R^{10})_2$ 、 $C(O)R^{10}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{10}$ 、 $C(O)N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)R^{10}$ 、 $NR^{10}C(O)R^{10}$ 、 $NHSO_2R^{10}$ 、 $NHC(O)OR^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{10} 、 $SO_2N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^7 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{11} 、 OR^{11} 、 SR^{11} 、 $S(O)R^{11}$ 、 SO_2R^{11} 、 NHR^{11} 、 $N(R^{11})_2$ 、 $C(O)R^{11}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{11}$ 、 $C(O)N(R^{11})_2$ 、 $NHC(O)R^{11}$ 、 $NR^{11}C(O)R^{11}$ 、 $NHSO_2R^{11}$ 、 $NHC(O)OR^{11}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{11} 、 $SO_2N(R^{11})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{11}$ 、

OH、(O)、C(O)OH、N₃、CN、NH₂、CF₃、CF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；

R⁸為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之R¹²、OR¹²、SR¹²、S(O)R¹²、SO₂R¹²、NHR¹²、N(R¹²)₂、C(O)R¹²、C(O)NH₂、C(O)NHR¹²、C(O)N(R¹²)₂、NHC(O)R¹²、NR¹²C(O)R¹²、NH₂SO₂R¹²、NHC(O)OR¹²、SO₂NH₂、SO₂NHR¹²、SO₂N(R¹²)₂、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR¹²、OH、(O)、C(O)OH、N₃、CN、NH₂、CF₃、CF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；

R⁹為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之OCH₃或芳基取代；

R¹⁰為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

R¹¹為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

R¹²為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由R³、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹及R¹²表示之環狀部分視情況經一或多個獨立選擇之R¹³、OR¹³、SR¹³、S(O)R¹³、SO₂R¹³、C(O)R¹³、CO(O)R¹³、OC(O)R¹³、OC(O)OR¹³、NH₂、NHR¹³、N(R¹³)₂、NHC(O)R¹³、NR¹³C(O)R¹³、NHS(O)₂R¹³、NR¹³S(O)₂R¹³、NHC(O)OR¹³、

$\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{13}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、
 $\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{13}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{13}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{13}\text{SO}_2\text{R}^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、
 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 為烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、環烷基或環烯基；其中各烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{14}\text{SO}_2\text{R}^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、環烷基及環烯基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 NH_2 、

NHR^{15} 、 $\text{N(R}^{15})_2$ 、 NHC(O)R^{15} 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)R}^{15}$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{15}$ 、
 $\text{NR}^{15}\text{S(O)}_2\text{R}^{15}$ 、 NHC(O)OR^{15} 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)OR}^{15}$ 、 NHC(O)NH_2 、
 NHC(O)NHR^{15} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{15})_2$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)NHR}^{15}$ 、
 $\text{NR}^{15}\text{C(O)N(R}^{15})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{15} 、 $\text{C(O)N(R}^{15})_2$ 、
 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{15} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{C(O)NR}^{15}\text{SO}_2\text{R}^{15}$ 、
 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{15})_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、
 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

O

R^{14} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 NH_2 、 SO_2NH_2 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；且

R^{15} 為烷基。

O

在式(I)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 N ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為 CH ，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為 CH ，且 X^1 及 X^3 為 N ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 N 。在式(I)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH 。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 N 。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 。在式(I)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式(I)之另一個實施例中， X^2 為 CH ；且 X^1 及 X^3 為 N 。在式(I)之另一個實施例中，

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N。

在式(I)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或

OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為F。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為Cl。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為Br。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為CN。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(I)之另一個實施例中， R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。

在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})R^3$ 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})R^3$ 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環

基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式

(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(I)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例

中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(I)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式(I)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、

NHC(O)R^3 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH 。在式(I)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(I)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、

OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式 (I) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (I) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 C(O)NH_2 。在式 (I) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (I) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (I) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (I) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (I) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (I) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (I) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (I) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 C(O)OH 。

在式 (I) 之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或

X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 N ；或

X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為 CH ；且 X^1 及 X^3 為 N ；或

X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 N ；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；

R^2 為烷基、苯基、雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^4 、 OR^4 、 $C(O)R^4$ 、 $CO(O)R^4$ 、 $NHC(O)R^4$ 、 $C(O)NHR^4$ 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；各苯基視情況在對位經 1 個獨立選擇之 R^5 、 $OCH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 $C(O)R^5$ 、 NHR^5 、 $NHC(O)R^5$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 或 CF_3 取代；其中各苯基視情況經 1 個 F 取代；其中各雜環基視情況經一或多個獨立選擇之 R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $NHC(O)R^5$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中 R^2 不為 4-甲基苯基；

R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^4 為烷基、芳基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^7 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各芳基及雜環基視情況經一或多個獨立選擇之 R^8 、 $C(O)R^8$ 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基或環烷基；其中各烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $C(O)R^9$ 、 NH_2 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 為烷基或雜環基；

R^7 為芳基；

R^8 為烷基、芳基或雜環基；

R^9 為烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 或芳基取代；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 及 R^9 表示之環狀部分視情況經一或多個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 NH_2 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 為烷基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基或吡咯啉-2-酮基，其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 NH_2 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、環烷基及環烯基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 CN 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 為烷基、芳基或環烷基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；且

R^{15} 為烷基。

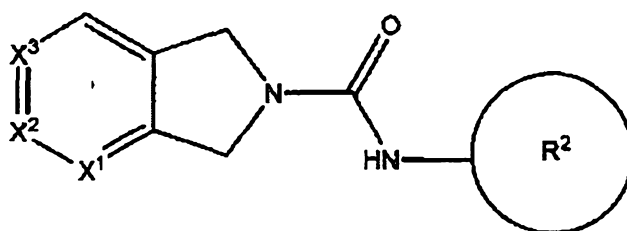
另一個實施例係關於具有式(I)之化合物，其包括實例 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、

51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、
63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、
75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、
87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、
99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、
109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、
119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、
129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、
O 139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、
149、150、151、152、153、154、155、156、157、158、
159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、
169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、
179、180、181、182、183、184、185、186、187、188、
189、190、191、192、193、194、195、196、197、198、
199、200、201、202、203、204、205、206、207、208、
O 209、210、211、212、213、214、215、216、217、218、
219、220、221、222、223、224、225、226、227、228、
229、230、231、232、233、234、235、236、237、238、
239、240、241、242、243、244、245、246、247、248、
249、250、251、252、253、254、255、256、257、258、
259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、
269、270、271、272、273、274、275、276、277、278、
279、280、281、282、283、284、285、286、287、288、
289、290、291、292、293、294、295、296、297、298、

299、300、301、302、303、304、305、306、307、308、
 309、310、311、312、313、314、315、316、317、318、
 319、320、321、322、323、324、325、326、327、328、
 329、330、331、332、333、334、335、336、337、338、
 339、340、341、342、343、344、345、346、347、348、
 349、350、351、352、353、354、355、356、357、358、
 359、360、361、362、363、364、365、366、367、368、
 369、370、371、372、373、374、375、376、377、378、
 379、380、381、382、383、384、385、386、387、388、
 389、390、391、392、393、394、395、396、397、398、
 399、400、401、402、403、404、405、406、407、408、
 409、410、411、412、413、414、415、416、417、418、
 419、420、421、422、423、424、425、426、427、428、
 429、430、431、432、433、434、435、436、437、438、
 439、440、441、442、443、444、445、446、447、448、
 449、450、451、452、453、454、455及其醫藥學上可接
 受之鹽。

式(II)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(II)化合物，



(II);

或其醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 、 X^2 、 X^3 如本文關於式(I)所述；且 R^2 為苯基、雜環基、環烷基或環烯基；其中苯基、雜環基、環烷基及環烯基視情況如本文關於式(I)所述經取代。

在式(II)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為N；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為CH，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為CH，且 X^1 及 X^3 為N；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為N。在式(II)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH。在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N。在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 。在式(II)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式(II)之另一個實施例中， X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或

雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 F 。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 Br 。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 CN 。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。

在式(II)之另一個實施例中， R^1 為

C(O)OH 。

在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH 。在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為

烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。

在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為F。

在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。

在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。

在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。

在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。

在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。

在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。

在式(II)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。

在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、

C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷

基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(II)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式(II)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(II)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經

一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(II)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(II)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(II)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式(II)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；

且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br。在式 (II) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN。在式 (II) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (II) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (II) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (II) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式 (II) 之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；

R^2 為苯基或雜環基；其中各苯基視情況在對位經 1 個獨立選擇之 R^5 、 $OCH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 $C(O)R^5$ 、 NHR^5 、 $NHC(O)R^5$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 或 CF_3 取代；其中各苯基視情況經 1 個 F 取代；其中各雜環基視情況經一或多個獨立選擇之 R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $NHC(O)R^5$ 、 $C(O)NHR^5$ 、F、Cl、Br 或 I 取代；其中 R^2 不為 4-甲基苯基；

R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基或環烷基；其中各烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $C(O)R^9$ 、 NH_2 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 為烷基或雜環基；

R^9 為烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 或芳基取代；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 及 R^9 表示之環狀部分視情況經一或多個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 NH_2 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 為烷基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基或吡咯啉-2-酮基，其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 NH_2 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、環烷基及環烯基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 CN 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 為烷基、芳基或環烷基；其中各烷基視情況經一或

多個獨立選擇之OH、F、Cl、Br或I取代；且

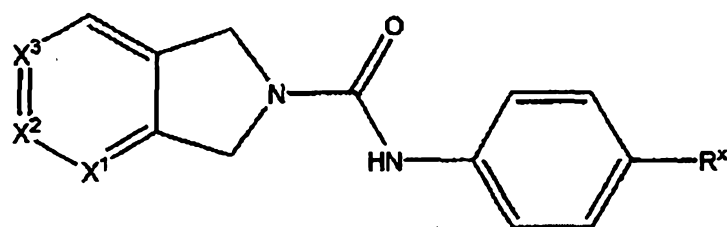
R¹⁵為烷基。

另一個實施例係關於具有式(II)之化合物，其包括實例
1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、
15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、
27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、
39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、
51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、
63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、
75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、
87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、
99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、
109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、
119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、
129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、
139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、
149、150、151、152、153、154、155、156、157、158、
159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、
169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、
179、180、181、182、183、184、185、186、187、188、
189、190、191、192、193、194、195、196、197、198、
199、200、201、202、203、204、205、206、207、208、
209、210、211、212、213、214、215、216、217、218、
219、220、221、222、223、224、225、226、227、228、

229、230、231、232、233、234、235、236、237、238、
239、240、241、242、243、244、245、246、247、248、
249、250、251、252、253、254、255、256、257、258、
259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、
269、270、271、272、273、274、275、276、277、278、
279、280、281、282、283、284、285、286、287、288、
289、290、291、292、293、294、295、296、297、298、
299、300、301、302、303、304、305、306、307、308、
309、310、311、312、313、314、315、316、317、318、
319、320、321、322、323、324、325、326、327、328、
329、330、331、332、333、334、335、336、337、338、
339、340、341、342、343、344、345、346、347、348、
368、369、370、371、372、373、374、375、376、377、
378、379、380、381、382、383、384、385、386、387、
388、389、390、391、392、393、394、395、396、397、
398、399、400、401、402、403、404、405、406、407、
408、409、410、411、412、413、414、415、416、417、
418、419、420、421、422、423、424、425、426、427、
428、429、430、431、432、433、434、435、436、437、
438、439、440、441、442、443、444、445、446、447、
448、449、450、452、453、454、455及其醫藥學上可接
受之鹽。

式(III)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(III)化合物，



(III);

或其醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 、 X^2 、 X^3 如本文關於式(I)所述；且 R^x 如本文關於式(I)在 R^2 為苯基時所述。

在式(III)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為N；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為CH，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為CH，且 X^1 及 X^3 為N；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為N。在式(III)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH。在式(III)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N。在式(III)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 。在式(III)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式(III)之另一個實施例中， X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N。在式(III)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N。

在式(III)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(III)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、

NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， R^1 為 C(O)NH_2 。在式 (III) 之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式 (III) 之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式 (III) 之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式 (III) 之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式 (III) 之另一個實施

例中， R^1 為 NH_2 。在式(III)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。
 在式(III)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(III)之另一個
 實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式(III)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為
 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、
 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、
 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(III)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為
 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、
 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、
 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環
 基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、
 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式
 (III)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為
 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經
 一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；
 其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(III)之另一個實施例中， X^1
 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基
 或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、
 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式(III)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；
 R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷
 基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或
 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(III)之另一個實施
 例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中

R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (III) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (III) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (III) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (III) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (III) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (III) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (III) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (III) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式 (III) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、

CF_3 或 C(O)OH 。在式 (III) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (III) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(III)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(III)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(III)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(III)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(III)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(III)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(III)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(III)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(III)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(III)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式

(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1

為F。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(III)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式(III)之另一個實施例中， R^x 為酞嗪-1(2H)-酮基、異喹啉基、異喹啉-1(2H)-酮基、5,6,7,8-四氫酞嗪-1(2H)-酮基、5-氟酞嗪-1(2H)-酮基、(Z)-3H-苯并[d][1,2]二氮呋-4(5H)-酮基、5-(三氟甲基)酞嗪-1(2H)-酮基或吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮。

在式(III)之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、

CF_3 或 C(O)OH ;

R^x 為 R^5 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 C(O)R^5 、 NHR^5 、 NHC(O)R^5 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^5 、 $\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 CF_3 或 F ;

R^3 為烷基、烯基或雜環基 ; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代 ;

R^5 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基或環烷基 ; 其中各烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 C(O)R^9 、 NH_2 、 $\text{N(R}^9)_2$ 、 NHC(O)R^9 、 C(O)NH_2 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代 ;

R^6 為烷基或雜環基 ;

R^9 為烷基、芳基、雜環基或環烷基 ; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 或芳基取代 ;

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 及 R^9 表示之環狀部分視情況經一或多個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SO_2R^{13} 、 C(O)R^{13} 、 CO(O)R^{13} 、 NH_2 、 $\text{N(R}^{13})_2$ 、 NHC(O)R^{13} 、 NHC(O)OR^{13} 、 C(O)NH_2 、 $\text{C(O)N(R}^{13})_2$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代 ;

R^{13} 為烷基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基或吡咯啉-2-酮基，其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 NH_2 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代 ; 其中各芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、

噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、環烷基及環烯基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 CN 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 為烷基、芳基或環烷基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；且

R^{15} 為烷基。

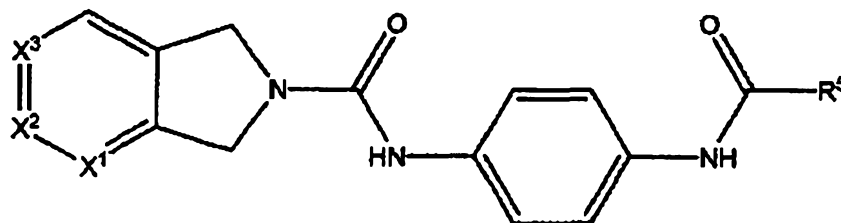
另一個實施例係關於具有式(III)之化合物，其包括實例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、149、150、151、152、153、154、155、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、179、180、181、182、183、184、185、186、187、188、

189、190、191、192、193、194、195、196、197、198、
199、200、201、202、203、204、205、206、207、208、
209、210、211、212、213、214、215、216、217、218、
219、220、221、222、223、224、225、226、227、228、
229、230、231、232、233、234、235、236、237、238、
239、240、241、242、243、244、245、246、247、248、
249、250、251、252、253、254、255、256、257、258、
259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、
269、270、271、272、273、274、275、276、277、278、
279、280、281、282、283、284、285、286、287、288、
289、290、291、292、293、294、295、296、297、298、
299、300、301、302、303、304、305、306、307、308、
309、310、311、312、313、314、315、316、317、318、
319、320、321、322、323、324、330、331、332、333、
336、337、338、339、340、341、342、343、348、373、
374、375、376、377、378、379、380、381、382、383、
384、385、386、387、388、389、390、391、392、393、
394、395、396、397、398、399、400、401、402、403、
405、406、407、408、409、410、411、412、413、414、
415、416、417、418、419、420、421、424、425、426、
427、428、429、430、431、432、433、434、435、436、
437、438、439、440、441、442、443、444、445、446、
447、448、449、450、475、476、477、478、479、480、
481、482、483、484、485、486、487、488、489、490、

491、492、493、494、495、496、497、498、499、500、547、548、549、550、551、552及其醫藥學上可接受之鹽。

式(IV)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(IV)化合物，



(IV);

或其醫藥學上可接受之鹽；其中X¹、X²、X³及R⁵如本文關於式(I)所述。

在式(IV)之一個實施例中，X¹、X²及X³為CH；或X¹及X³為CH，且X²為N；或X¹及X³為CH，且X²為CR¹；或X²及X³為CH，且X¹為CR¹；或X¹為CH，且X²及X³為CR¹；或X²為CH，且X¹及X³為N；或X²及X³為CH，且X¹為N。在式(IV)之另一個實施例中，X¹、X²及X³為CH。在式(IV)之另一個實施例中，X¹及X³為CH；且X²為N。在式(IV)之另一個實施例中，X¹及X³為CH；且X²為CR¹。在式(IV)之另一個實施例中，X²及X³為CH；且X¹為CR¹。在式(IV)之另一個實施例中，X¹為CH；且X²及X³為CR¹。在式(IV)之另一個實施例中，X²為CH；且X¹及X³為N。在式(IV)之另一個實施例中，X²及X³為CH；且X¹為N。

在式(IV)之另一個實施例中，R¹為R³、OR³、C(O)OR³、

C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH 。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、

烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(IV)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、

OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 C(O)NH_2 。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；

且 R^1 為 NO_2 。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；
 且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^1
 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。

在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為
 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、
 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、
 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為
 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、
 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環
 基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、
 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式
 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為
 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經
 一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；
 其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2
 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基
 或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、
 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；
 R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷
 基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或
 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IV) 之另一個實施
 例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ ；其中

R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (IV) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式 (IV) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、

CF_3 或 C(O)OH 。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(IV)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式(IV)之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、

NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；

R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 、OH、F、Cl、Br或I取代；

R^5 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基或環烷基；其中各烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 C(O)R^9 、 NH_2 、 $\text{N(R}^9)_2$ 、 NHC(O)R^9 、 C(O)NH_2 、 C(O)OH 、OH、CN、 CF_3 、F、Cl、Br或I取代；

R^6 為烷基或雜環基；

R^9 為烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 或芳基取代；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 及 R^9 表示之環狀部分視情況經一或多個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SO_2R^{13} 、 C(O)R^{13} 、 CO(O)R^{13} 、 NH_2 、 $\text{N(R}^{13})_2$ 、 NHC(O)R^{13} 、 NHC(O)OR^{13} 、 C(O)NH_2 、 $\text{C(O)N(R}^{13})_2$ 、OH、CN、 CF_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、F、Cl、Br或I取代；

R^{13} 為烷基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基或吡咯啉-2-酮基，其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 NH_2 、OH、F、Cl、Br或I取代；其中各芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、環烷基及環烯基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{15} 、

OR^{15} 、 C(O)R^{15} 、 CN 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

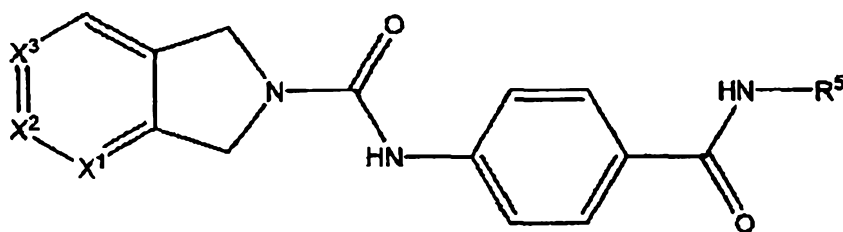
R^{14} 為烷基、芳基或環烷基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；且

R^{15} 為烷基。

另一個實施例係關於具有式(IV)之化合物，其包括實例291、292、293、294、295、296、297、298、299、300、301、302、303、304、305、306、307、308、309、310、311、312、313、314、315及其醫藥學上可接受之鹽。

式(V)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(V)化合物，



(V);

或其醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 、 X^2 、 X^3 及 R^5 如本文關於式(I)所述。

在式(V)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 N ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為 CH ，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為 CH ，且 X^1 及 X^3 為 N ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 N 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 N 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 。在式(V)之另一個實

施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式(V)之另一個實施例中， X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N。

在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6

為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 $\text{NHC(O)}R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 C(O)NH_2 。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(V)之另一個實施例中， R^1 為 C(O)OH 。

在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 $\text{NHC(O)}R^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 $\text{NHC(O)}R^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；

其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為

CR^1 ；且 R^1 為 Cl。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；

且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(V)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個

獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(V)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式(V)之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或

X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 N ；或

X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；

R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、OH、F、Cl、Br 或 I 取代；

R^5 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基或環烷基；其中各烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $C(O)R^9$ 、 NH_2 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)OH$ 、OH、CN、 CF_3 、F、Cl、Br 或 I 取代；

R^6 為烷基或雜環基；

R^9 為烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 或芳基取代；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 及 R^9 表示之環狀部分視情況經一或多個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 NH_2 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、OH、CN、 CF_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、F、Cl、Br 或 I 取代；

R^{13} 為烷基、芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶

基或吡咯啉-2-酮基，其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 NH_2 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、環烷基及環烯基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 CN 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 為烷基、芳基或環烷基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；且

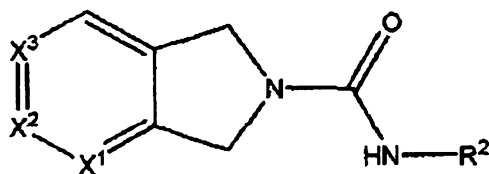
R^{15} 為烷基。

另一個實施例係關於具有式(V)之化合物，其包括實例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、149、150、151、152、153、154、155、156、157、159、

160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、
 170、171、172、173、174、176、177、178、179、180、
 181、182、184、185、186、187、188、189、190、192、
 193、194、195、196、197、198、199、200、201、202、
 203、204、205、206、207、209、210、211、213、214、
 215、216、217、218、219、220、221、223、224、225、
 226、227、228、230、231、232、234、235、236、237、
 239、240、243、245、246、248、249、250、251、252、
 253、254、256、257、258、259、260、265、268、269、
 270、271、272、273、274、275、276、277、278、279、
 280、281、282、283、284、285、286、287、288、289、
 290、373、410、411、412、413、414、415、416、417、
 418、419、420、421、424、425、426、427、430、431、
 434、435、436、437、438、439、440、441、442、445、
 449、450及其醫藥學上可接受之鹽。

式(Ia)之實施例

因此，本發明之一個實施例係關於適用作NAMPT抑制劑之化合物或醫藥學上可接受之鹽，該等化合物具有式(Ia)，



式(Ia)

其中

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、OH、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$ 或 $C(O)NH_2$ ；

R^2 為烷基、烯基、炔基、苯基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^2 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^4 、 OR^4 、 SR^4 、 $S(O)R^4$ 、 SO_2R^4 、 $C(O)R^4$ 、 $CO(O)R^4$ 、 $OC(O)R^4$ 、 $OC(O)OR^4$ 、 $NHC(O)R^4$ 、 $NR^4C(O)R^4$ 、 $NHS(O)_2R^4$ 、 $NR^4S(O)_2R^4$ 、 $NHC(O)OR^4$ 、 $NR^4C(O)OR^4$ 、

NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^4 、 $\text{NHC(O)N(R}^4)_2$ 、 $\text{NR}^4\text{C(O)NHR}^4$ 、
 $\text{NR}^4\text{C(O)N(R}^4)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^4 、 $\text{C(O)N(R}^4)_2$ 、
 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^4 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{C(O)NR}^4\text{SO}_2\text{R}^4$ 、
 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^4 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^4)_2$ 、 C(O)H 、 (O) 、 CN 、 N_3 、
 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取
 代；其中各 R^2 苯基視情況在對位經1個獨立選擇之 R^5 、
 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 SR^5 、 S(O)R^5 、 SO_2R^5 、 C(O)R^5 、
 CO(O)R^5 、 OC(O)R^5 、 OC(O)OR^5 、 NH_2 、 NHR^5 、 $\text{N(R}^5)_2$ 、
 NHC(O)R^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)R}^5$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{S(O)}_2\text{R}^5$ 、
 NHC(O)OR^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)OR}^5$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^5 、
 $\text{NHC(O)N(R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)NHR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 C(O)NH_2 、
 C(O)NHR^5 、 $\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 CHNOR^5 、 C(O)NHOH 、
 C(O)NHOR^5 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{C(O)NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 SO_2NH_2 、
 SO_2NHR^5 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 N_3 、
 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 Br 或 I 取代；其中
 各 R^2 苯基視情況另外經1個 F 取代；其中各 R^2 雜環基、環烷
 基及環烯基視情況經一或多個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、
 S(O)R^5 、 SO_2R^5 、 C(O)R^5 、 CO(O)R^5 、 OC(O)R^5 、 OC(O)OR^5 、
 NH_2 、 NHR^5 、 $\text{N(R}^5)_2$ 、 NHC(O)R^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)R}^5$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^5$ 、
 $\text{NR}^5\text{S(O)}_2\text{R}^5$ 、 NHC(O)OR^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)OR}^5$ 、 NHC(O)NH_2 、
 NHC(O)NHR^5 、 $\text{NHC(O)N(R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)NHR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、
 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^5 、 $\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 C(O)NHOH 、
 C(O)NHOR^5 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{C(O)NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 SO_2NH_2 、
 SO_2NHR^5 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 N_3 、

CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、F、Cl、Br或I取代；其中 R^2 不為4-甲基苯基；

R^3 為烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $\text{S(O)}\text{R}^6$ 、 SO_2R^6 、 $\text{C(O)}\text{R}^6$ 、 $\text{CO(O)}\text{R}^6$ 、 $\text{OC(O)}\text{R}^6$ 、 OC(O)OR^6 、 NH_2 、 NHR^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 、 $\text{NHC(O)}\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)}\text{R}^6$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{S(O)}_2\text{R}^6$ 、 NHC(O)OR^6 、 $\text{NR}^6\text{C(O)OR}^6$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^6 、 $\text{NHC(O)N(R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)NHR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^6 、 $\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^6 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{C(O)NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^6)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、F、Cl、Br或I取代；

R^4 為烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基或雜環基；其中各 R^4 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^7 、 OR^7 、 SR^7 、 $\text{S(O)}\text{R}^7$ 、 SO_2R^7 、 $\text{C(O)}\text{R}^7$ 、 $\text{OC(O)}\text{R}^7$ 、 OC(O)OR^7 、 NH_2 、 NHR^7 、 $\text{NHC(O)}\text{R}^7$ 、 $\text{NR}^7\text{C(O)}\text{R}^7$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^7$ 、 $\text{NR}^7\text{S(O)}_2\text{R}^7$ 、 NHC(O)OR^7 、 $\text{NR}^7\text{C(O)OR}^7$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^7 、 $\text{NHC(O)N(R}^7)_2$ 、 $\text{NR}^7\text{C(O)NHR}^7$ 、 $\text{NR}^7\text{C(O)N(R}^7)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^7 、 $\text{C(O)N(R}^7)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^7 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^7$ 、 $\text{C(O)NR}^7\text{SO}_2\text{R}^7$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^7 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^7)_2$ 、 C(O)H 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、F、Cl、Br或I取代；其中各 R^4 芳基及雜環基視情況經一或多個獨

立選擇之 R^8 、 OR^8 、 SR^8 、 $S(O)R^8$ 、 SO_2R^8 、 $C(O)R^8$ 、 $CO(O)R^8$ 、 $OC(O)R^8$ 、 $OC(O)OR^8$ 、 NH_2 、 NHR^8 、 $NHC(O)R^8$ 、 $NR^8C(O)R^8$ 、 $NHS(O)_2R^8$ 、 $NR^8S(O)_2R^8$ 、 $NHC(O)OR^8$ 、 $NR^8C(O)OR^8$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^8$ 、 $NHC(O)N(R^8)_2$ 、 $NR^8C(O)NHR^8$ 、 $NR^8C(O)N(R^8)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^8$ 、 $C(O)N(R^8)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^8$ 、 $C(O)NH SO_2R^8$ 、 $C(O)NR^8SO_2R^8$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^8 、 $SO_2N(R^8)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $S(O)R^9$ 、 SO_2R^9 、 $C(O)R^9$ 、 $CO(O)R^9$ 、 $OC(O)R^9$ 、 $OC(O)OR^9$ 、 NH_2 、 NHR^9 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)R^9$ 、 $NHS(O)_2R^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^9$ 、 $NHC(O)OR^9$ 、 $NR^9C(O)OR^9$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^9$ 、 $NHC(O)N(R^9)_2$ 、 $NR^9C(O)NHR^9$ 、 $NR^9C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^9$ 、 $C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^9$ 、 $C(O)NH SO_2R^9$ 、 $C(O)NR^9SO_2R^9$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $SO_2N(R^9)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $S(O)R^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $N(R^{10})_2$ 、 $C(O)R^{10}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{10}$ 、 $C(O)N(R^{10})_2$ 、

NHC(O)R^{10} 、 $\text{NR}^{10}\text{C(O)R}^{10}$ 、 $\text{NHSO}_2\text{R}^{10}$ 、 NHC(O)OR^{10} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{10} 、 OH 、 (O) 、 C(O)OH 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^7 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^7 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{11} 、 OR^{11} 、 SR^{11} 、 S(O)R^{11} 、 SO_2R^{11} 、 NHR^{11} 、 $\text{N(R}^{11})_2$ 、 C(O)R^{11} 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{11} 、 $\text{C(O)N(R}^{11})_2$ 、 NHC(O)R^{11} 、 $\text{NR}^{11}\text{C(O)R}^{11}$ 、 $\text{NHSO}_2\text{R}^{11}$ 、 NHC(O)OR^{11} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{11}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{11})_2$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{11} 、 OH 、 (O) 、 C(O)OH 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^8 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^8 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{12} 、 OR^{12} 、 SR^{12} 、 S(O)R^{12} 、 SO_2R^{12} 、 NHR^{12} 、 $\text{N(R}^{12})_2$ 、 C(O)R^{12} 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{12} 、 $\text{C(O)N(R}^{12})_2$ 、 NHC(O)R^{12} 、 $\text{NR}^{12}\text{C(O)R}^{12}$ 、 $\text{NHSO}_2\text{R}^{12}$ 、 NHC(O)OR^{12} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{12}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{12})_2$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{12} 、 OH 、 (O) 、 C(O)OH 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 、 OH 、芳基或雜環基取代；

R^{10} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環

烯基；

R^{11} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

R^{12} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 及 R^{12} 表示之環狀部分視情況經一或多個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 $OC(O)R^{13}$ 、 $OC(O)OR^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)R^{13}$ 、 $NHS(O)_2R^{13}$ 、 $NR^{13}S(O)_2R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)OR^{13}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{13}$ 、 $NHC(O)N(R^{13})_2$ 、 $NR^{13}C(O)NHR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{13}$ 、 $C(O)NHOSO_2R^{13}$ 、 $C(O)NR^{13}SO_2R^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{13} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 為烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、

NHC(O)R^{14} 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)R}^{14}$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{S(O)}_2\text{R}^{14}$ 、
 NHC(O)OR^{14} 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)OR}^{14}$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{14} 、
 $\text{NHC(O)N(R}^{14})_2$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)NHR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)N(R}^{14})_2$ 、
 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{14} 、 $\text{C(O)N(R}^{14})_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{14} 、
 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{C(O)NR}^{14}\text{SO}_2\text{R}^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{14}$ 、
 $\text{SO}_2\text{N(R}^{14})_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、
 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取
 代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧
 啉基、吡啉基、噻吩并[3,2-c]吡啉基、呋喃并[3,2-c]吡
 啉基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、二噁
 烷基、四氫哌喃基、哌啉基、嘧啉基、噁唑基、吡唑基、
 噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、環烷基及環烯基視情
 況經一或多個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 S(O)R^{15} 、
 SO_2R^{15} 、 C(O)R^{15} 、 CO(O)R^{15} 、 OC(O)R^{15} 、 OC(O)OR^{15} 、
 NH_2 、 NHR^{15} 、 $\text{N(R}^{15})_2$ 、 NHC(O)R^{15} 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)R}^{15}$ 、
 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{S(O)}_2\text{R}^{15}$ 、 NHC(O)OR^{15} 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)OR}^{15}$ 、
 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{15} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{15})_2$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)NHR}^{15}$ 、
 $\text{NR}^{15}\text{C(O)N(R}^{15})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{15} 、 $\text{C(O)N(R}^{15})_2$ 、
 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{15} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{C(O)NR}^{15}\text{SO}_2\text{R}^{15}$ 、
 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{15})_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、
 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環
 烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨

立選擇之 OCH_3 、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基或環烯基視情況經一或多個獨立選擇之烷基或 OCH_3 取代；且 R^{15} 為烷基；

其限制條件為當 R^2 為未經取代之烷基或視情況經取代之烷基時， R^2 為 $\text{C}_4\text{-C}_6$ 烷基。

在式(Ia)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 N ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為 CH ，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為 CH ，且 X^1 及 X^3 為 N ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 N ；或 X^1 為 CH ， X^2 為 N ，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為 N ，且 X^3 為 CH ；或 X^1 為 N ， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 CH ；或 X^1 為 N ， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 N 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 N 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^2 為 CH ；且 X^1 及 X^3 為 N 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 N 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 CH ； X^2 為 N ；且 X^3 為 CR^1 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N ；且 X^3 為 CH 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 N ； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 N ；

X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N。

在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、

NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{R}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為

R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為

CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{R}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；

其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。

在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 F。

在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl。

在式 (Ia) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br。

在式 (Ia) 之另一個實施例

中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(Ia)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基

或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。

在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。

在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。

在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。

在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。

在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。

(Ia)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(Ia)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ia)之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；

R^2 為烷基、苯基、雜環基，其中各 R^2 烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^4 、 OR^4 、 $C(O)R^4$ 、 $CO(O)R^4$ 、 $NHC(O)R^4$ 、 $C(O)NHR^4$ 或F、Cl、Br或I取代；其中各 R^2 苯基視情況在對位經1個獨立選擇之 R^5 、 $OCH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 NHR^5 、 $NHC(O)R^5$ 、 $C(O)NH_2$ 、

$C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $CHNOR^5$ 、 $C(O)NHOR^5$ 、 CF_3 、 Br 或 I 取代；其中各 R^2 苯基視情況另外經1個 F 取代；其中各 R^2 雜環基視情況經一或多個獨立選擇之 R^5 、 $O(O)R^5$ 、 $NHC(O)R^5$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中 R^2 不為4-甲基苯基；

R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各 R^3 烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^4 為烷基、芳基、環烷基或雜環基；其中各 R^4 烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^7 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^4 芳基及雜環基視情況經一或多個獨立選擇之 R^8 、 $C(O)R^8$ 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $C(O)R^9$ 、 NH_2 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 為烷基或雜環基；

R^7 為芳基；

R^8 為烷基、芳基或雜環基；

R^9 為烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^9 烷基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 、 OH 、芳基或雜環基取代；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 及 R^9 表示之環狀部分視情況經一或多個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、

CO(O)R^{13} 、 NH_2 、 $\text{N(R}^{13})_2$ 、 NHC(O)R^{13} 、 NHC(O)OR^{13} 、 C(O)NH_2 、 $\text{C(O)N(R}^{13})_2$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 為烷基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基或環烷基；其中各 R^{13} 烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 NH_2 、 $\text{N(R}^{14})_2$ 、 NHC(O)R^{14} 、 OH 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基及環烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SO_2R^{15} 、 C(O)R^{15} 、 $\text{N(R}^{15})_2$ 、 NHC(O)R^{15} 、 CN 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 為烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^{14} 烷基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基或環烯基視情況經一或多個獨立選擇之烷基或 OCH_3 取代；且

R^{15} 為烷基；

其限制條件為當 R^2 為未經取代之烷基或視情況經取代之烷基時， R^2 為 C_4 - C_6 烷基。

在式(Ia)之另一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；

R^2 為烷基、苯基、雜環基，其中各 R^2 烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^4 、 OR^4 、 $C(O)R^4$ 、 $CO(O)R^4$ 、 $NHC(O)R^4$ 、 $C(O)NHR^4$ 或F、Cl、Br或I取代；其中各 R^2 苯基視情況在對位經1個獨立選擇之 R^5 、 $OCH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 NHR^3 、 $NHC(O)R^5$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $CHNOR^5$ 、 $C(O)NHOR^5$ 或 CF_3 取代；其中各 R^2 苯基視情況另外經1個F取代；其中各 R^2 雜環基視情況經一或多個獨立選擇之 R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $NHC(O)R^5$ 或 $C(O)NHR^5$ 取代；其中 R^2 不為4-甲基苯基；

R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各 R^3 烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；

R^4 為烷基、芳基、環烷基或雜環基；其中各 R^4 烷基視情

況經一或多個 R^7 取代；其中各 R^4 芳基及雜環基視情況經一或多個獨立選擇之 R^8 、 $C(O)R^8$ 或Cl取代；

R^5 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $C(O)R^9$ 、 NH_2 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 或 CF_3 取代；

R^6 為烷基或雜環基；

R^7 為芳基；

R^8 為烷基、芳基或雜環基；

R^9 為烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^9 烷基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 、 OH 、芳基或雜環基取代；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 及 R^9 表示之環狀部分視情況經一或多個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 NH_2 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、 F 或Cl取代；

R^{13} 為烷基、芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基或環烷基；其中各 R^{13} 烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 NH_2 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 OH 或 CF_3 取代；其中各 R^{13} 芳基、四

氮呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基及環烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 CN 、 CF_3 、 F 或 Cl 取代；

R^{14} 為烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^{14} 烷基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 或 OH 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基或環烯基視情況經一或多個獨立選擇之烷基或 OCH_3 取代；且

R^{15} 為烷基；

其限制條件為當 R^2 為未經取代之烷基或視情況經取代之烷基時， R^2 為 C_4 - C_6 烷基。

另一個實施例係關於具有式(Ia)之化合物，其包括實例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、

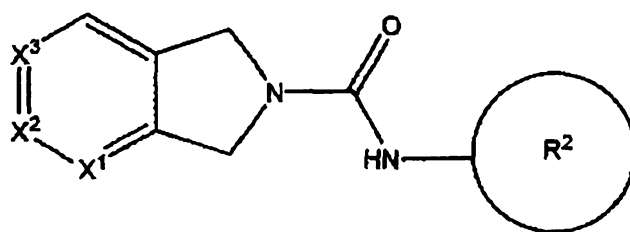
109 、 110 、 111 、 112 、 113 、 114 、 115 、 116 、 117 、 118 、
119 、 120 、 121 、 122 、 123 、 124 、 125 、 126 、 127 、 128 、
129 、 130 、 131 、 132 、 133 、 134 、 135 、 136 、 137 、 138 、
139 、 140 、 141 、 142 、 143 、 144 、 145 、 146 、 147 、 148 、
149 、 150 、 151 、 152 、 153 、 154 、 155 、 156 、 157 、 158 、
159 、 160 、 161 、 162 、 163 、 164 、 165 、 166 、 167 、 168 、
169 、 170 、 171 、 172 、 173 、 174 、 175 、 176 、 177 、 178 、
179 、 180 、 181 、 182 、 183 、 184 、 185 、 186 、 187 、 188 、
189 、 190 、 191 、 192 、 193 、 194 、 195 、 196 、 197 、 198 、
199 、 200 、 201 、 202 、 203 、 204 、 205 、 206 、 207 、 208 、
209 、 210 、 211 、 212 、 213 、 214 、 215 、 216 、 217 、 218 、
219 、 220 、 221 、 222 、 223 、 224 、 225 、 226 、 227 、 228 、
229 、 230 、 231 、 232 、 233 、 234 、 235 、 236 、 237 、 238 、
239 、 240 、 241 、 242 、 243 、 244 、 245 、 246 、 247 、 248 、
249 、 250 、 251 、 252 、 253 、 254 、 255 、 256 、 257 、 258 、
259 、 260 、 261 、 262 、 263 、 264 、 265 、 266 、 267 、 268 、
269 、 270 、 271 、 272 、 273 、 274 、 275 、 276 、 277 、 278 、
279 、 280 、 281 、 282 、 283 、 284 、 285 、 286 、 287 、 288 、
289 、 290 、 291 、 292 、 293 、 294 、 295 、 296 、 297 、 298 、
299 、 300 、 301 、 302 、 303 、 304 、 305 、 306 、 307 、 308 、
309 、 310 、 311 、 312 、 313 、 314 、 315 、 316 、 317 、 318 、
319 、 320 、 321 、 322 、 323 、 324 、 325 、 326 、 327 、 328 、
329 、 330 、 331 、 332 、 333 、 334 、 335 、 336 、 337 、 338 、
339 、 340 、 341 、 342 、 343 、 344 、 345 、 346 、 347 、 348 、

349、350、351、352、353、354、355、356、358、359、
360、361、362、368、369、370、371、372、373、374、
375、376、377、378、379、380、381、382、383、384、
385、386、387、388、389、390、391、392、393、394、
395、396、397、398、399、400、401、402、403、404、
405、406、407、408、409、410、411、412、413、414、
415、416、417、418、419、420、421、422、423、424、
425、426、427、428、429、430、431、432、433、434、
O 435、436、437、438、439、440、441、442、443、444、
445、446、447、448、449、450、451、452、453、454、
455、456、457、458、459、460、461、462、463、464、
465、466、467、468、469、470、471、472、473、474、
475、476、477、478、479、480、481、482、483、484、
485、486、487、488、489、490、491、492、493、494、
495、496、497、498、499、500、501、502、503、504、
O 505、506、507、508、509、510、511、512、513、514、
515、516、517、518、519、520、521、522、523、524、
525、526、527、528、529、530、531、532、533、534、
535、536、537、538、539、540、541、542、543、544、
545、546、547、548、549、550、551、552、553、554、
555、556、557、558、559、560、561、562、563、564、
565、566、567、568、569、570、571、572、573、574、
575、576、577、578、579、580、581、582、583、584、
585、586、587、588、589、590、591、592、593、594、

595、596、597、598、599、600、601、602、603、604、
 605、606、607、608、613、614、615、616、617、618、
 619、620、621、622、623、624、625、626、627、628、
 629、630、631、632、633、634、635、636、637、638、
 639、640、641、642、643、644、645、646、647、648、
 649、650、651、652、653、654、655、656、657、658、
 659、660、661、662、663、664、665、666、667、668、
 669、670、671、672、673、674、675、676、677、678、
 679、680、681、682、683、684、685、686、687、688、
 689、690、691、692、693、694、695、696、697、698、
 699、700、701、702、703、704、705、706、707、708、
 709、710、711、712、713、714、715、716、717及其醫
 藥學上可接受之鹽。

式(IIa)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(IIa)化合物，



(IIa)

或其醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 、 X^2 、 X^3 如本文關於式(Ia)所述；且 R^2 為苯基、雜環基、環烷基或環烯基；其中 R^2 苯基、雜環基、環烷基及環烯基視情況如本文關於式(Ia)中 R^2 上之取代基所述經取代。

在式(IIa)之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、 OH 、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$ 或 $C(O)NH_2$ ；

R^2 為苯基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^2 苯基視情況在對位經1個獨立選擇之 R^5 、 $OCH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 SR^5 、 $S(O)R^5$ 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 $OC(O)R^5$ 、 $OC(O)OR^5$ 、 NH_2 、 NHR^5 、 $N(R^5)_2$ 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NR^5C(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $NR^5S(O)_2R^5$ 、

NHC(O)OR^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)OR}^5$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^5 、
 $\text{NHC(O)N(R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)NHR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、
 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^5 、 $\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 CHNOR^5 、 C(O)NHOH 、
 C(O)NHOR^5 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{C(O)NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 SO_2NH_2 、
 SO_2NHR^5 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 N_3 、
 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、Br或I取代；其中
 各 R^2 苯基視情況另外經1個F取代；其中各 R^2 雜環基、環烷
 基及環烯基視情況經一或多個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、
 S(O)R^5 、 SO_2R^5 、 C(O)R^5 、 CO(O)R^5 、 OC(O)R^5 、 OC(O)OR^5 、
 NH_2 、 NHR^5 、 $\text{N(R}^5)_2$ 、 NHC(O)R^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)R}^5$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^5$ 、
 $\text{NR}^5\text{S(O)}_2\text{R}^5$ 、 NHC(O)OR^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)OR}^5$ 、 NHC(O)NH_2 、
 NHC(O)NHR^5 、 $\text{NHC(O)N(R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)NHR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、
 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^5 、 $\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^5 、
 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{C(O)NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、
 $\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 N_3 、 CF_3 、
 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、F、Cl、Br或I取代；其中 R^2 不
 為4-甲基苯基；

R^3 為烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷
 基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、
 SR^6 、 S(O)R^6 、 SO_2R^6 、 C(O)R^6 、 CO(O)R^6 、 OC(O)R^6 、
 OC(O)OR^6 、 NH_2 、 NHR^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 、 NHC(O)R^6 、
 $\text{NR}^6\text{C(O)R}^6$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{S(O)}_2\text{R}^6$ 、 NHC(O)OR^6 、
 $\text{NR}^6\text{C(O)OR}^6$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^6 、 $\text{NHC(O)N(R}^6)_2$ 、
 $\text{NR}^6\text{C(O)NHR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^6 、

$C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^6$ 、 $C(O)NHOSO_2R^6$ 、 $C(O)NR^6SO_2R^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $SO_2N(R^6)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $S(O)R^9$ 、 SO_2R^9 、 $C(O)R^9$ 、 $CO(O)R^9$ 、 $OC(O)R^9$ 、 $OC(O)OR^9$ 、 NH_2 、 NHR^9 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)R^9$ 、 $NHS(O)_2R^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^9$ 、 $NHC(O)OR^9$ 、 $NR^9C(O)OR^9$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^9$ 、 $NHC(O)N(R^9)_2$ 、 $NR^9C(O)NHR^9$ 、 $NR^9C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^9$ 、 $C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^9$ 、 $C(O)NHOSO_2R^9$ 、 $C(O)NR^9SO_2R^9$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $SO_2N(R^9)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $S(O)R^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $N(R^{10})_2$ 、 $C(O)R^{10}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{10}$ 、 $C(O)N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)R^{10}$ 、 $NR^{10}C(O)R^{10}$ 、 $NHSO_2R^{10}$ 、 $NHC(O)OR^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{10} 、 $SO_2N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基

基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 、 OH 、芳基或雜環基取代；

R^{10} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經一或多個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 $OC(O)R^{13}$ 、 $OC(O)OR^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)R^{13}$ 、 $NHS(O)_2R^{13}$ 、 $NR^{13}S(O)_2R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)OR^{13}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{13}$ 、 $NHC(O)N(R^{13})_2$ 、 $NR^{13}C(O)NHR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{13}$ 、 $C(O)NH SO_2R^{13}$ 、 $C(O)NR^{13}SO_2R^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{13} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 為烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、 $NR^{14}S(O)_2R^{14}$ 、

NHC(O)OR^{14} 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)OR}^{14}$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{14} 、
 $\text{NHC(O)N(R}^{14})_2$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)NHR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)N(R}^{14})_2$ 、
 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{14} 、 $\text{C(O)N(R}^{14})_2$ 、 C(O)NHOH 、
 C(O)NHOR^{14} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{C(O)NR}^{14}\text{SO}_2\text{R}^{14}$ 、 SO_2NH_2 、
 $\text{SO}_2\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{14})_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、
 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、
 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪
 基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-
 c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-
 基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、
 吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、環烷基及環
 烯基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、
 S(O)R^{15} 、 SO_2R^{15} 、 C(O)R^{15} 、 CO(O)R^{15} 、 OC(O)R^{15} 、
 OC(O)OR^{15} 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $\text{N(R}^{15})_2$ 、 NHC(O)R^{15} 、
 $\text{NR}^{15}\text{C(O)R}^{15}$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{S(O)}_2\text{R}^{15}$ 、 NHC(O)OR^{15} 、
 $\text{NR}^{15}\text{C(O)OR}^{15}$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{15} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{15})_2$ 、
 $\text{NR}^{15}\text{C(O)NHR}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)N(R}^{15})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{15} 、
 $\text{C(O)N(R}^{15})_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{15} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{15}$ 、
 $\text{C(O)NR}^{15}\text{SO}_2\text{R}^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{15})_2$ 、
 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、
 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環
 烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨
 立選擇之 OCH_3 、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、

(O)、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；其中各R¹⁴芳基、雜環基、環烷基或環烯基視情況經一或多個獨立選擇之烷基或OCH₃取代；且R¹⁵為烷基。

在式(IIa)之一個實施例中，X¹、X²及X³為CH；或X¹及X³為CH，且X²為N；或X¹及X³為CH，且X²為CR¹；或X²及X³為CH，且X¹為CR¹；或X¹為CH，且X²及X³為CR¹；或X²為CH，且X¹及X³為N；或X²及X³為CH，且X¹為N；或X¹為CH，X²為N，且X³為CR¹；或X¹為CR¹，X²為N，且X³為CH；或X¹為N，X²為CR¹，且X³為CH；或X¹為N，X²為CR¹，且X³為N。在式(IIa)之另一個實施例中，X¹、X²及X³為CH。在式(IIa)之另一個實施例中，X¹及X³為CH；且X²為N。在式(IIa)之另一個實施例中，X¹及X³為CH；且X²為CR¹。在式(IIa)之另一個實施例中，X²及X³為CH；且X¹為CR¹。在式(IIa)之另一個實施例中，X¹為CH；且X²及X³為CR¹。在式(IIa)之另一個實施例中，X²為CH；且X¹及X³為N。在式(IIa)之另一個實施例中，X²及X³為CH；且X¹為N。在式(IIa)之另一個實施例中，X¹為CH；X²為N；且X³為CR¹。在式(IIa)之另一個實施例中，X¹為CR¹；X²為N；且X³為CH。在式(IIa)之另一個實施例中，X¹為N；X²為CR¹；且X³為CH。在式(IIa)之另一個實施例中，X¹為N；X²為CR¹；且X³為N。

在式(IIa)之另一個實施例中，R¹為R³、OR³、C(O)R³、C(O)OR³、C(O)NH₂、C(O)NHR³、NHC(O)R³、NH₂SO₂R³、

F、Cl、Br、I、CN、NH₂、NO₂、CF₃或C(O)OH。在式(IIa)之另一個實施例中，R¹為R³、OR³、C(O)R³、C(O)OR³、C(O)NH₂、C(O)NHR³、NHC(O)R³、NHSO₂R³、F、Cl、Br、I、CN、NH₂、NO₂、CF₃或C(O)OH；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IIa)之另一個實施例中，R¹為R³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IIa)之另一個實施例中，R¹為OR³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IIa)之另一個實施例中，R¹為C(O)OR³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IIa)之另一個實施例中，R¹為C(O)NHR³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IIa)之另一個實施例中，R¹為NHC(O)R³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IIa)之另一個實施例中，R¹為NHSO₂R³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選

擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIa) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1

及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。

在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。

在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。

在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。

在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。

在式 (IIa) 之

另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(IIa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(IIa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(IIa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IIa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、

OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 C(O)NH_2 。在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(IIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為

CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{R}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；

R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (IIa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式

(IIa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為C(O)OH。在式(IIa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為C(O) R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

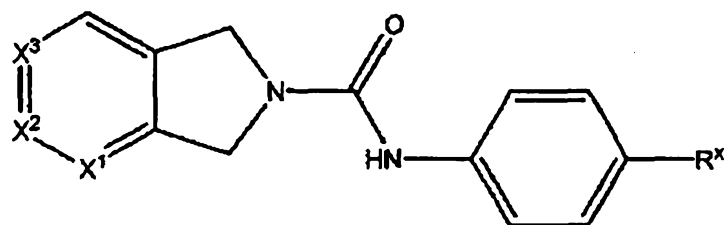
另一個實施例係關於具有式(IIa)之化合物，其包括實例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、149、150、151、152、153、154、155、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、179、180、181、182、183、184、185、186、187、188、189、190、191、192、193、194、195、196、197、198、

199、200、201、202、203、204、205、206、207、208、
209、210、211、212、213、214、215、216、217、218、
219、220、221、222、223、224、225、226、227、228、
229、230、231、232、233、234、235、236、237、238、
239、240、241、242、243、244、245、246、247、248、
249、250、251、252、253、254、255、256、257、258、
259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、
269、270、271、272、273、274、275、276、277、278、
279、280、281、282、283、284、285、286、287、288、
289、290、291、292、293、294、295、296、297、298、
299、300、301、302、303、304、305、306、307、308、
309、310、311、312、313、314、315、316、317、318、
319、320、321、322、323、324、325、326、327、328、
329、330、331、332、333、334、335、336、337、338、
339、340、341、342、343、344、345、346、347、348、
368、369、370、371、372、373、374、375、376、377、
378、379、380、381、382、383、384、385、386、387、
388、389、390、391、392、393、394、395、396、397、
398、399、400、401、402、403、404、405、406、407、
408、409、410、411、412、413、414、415、416、417、
418、419、420、421、422、423、424、425、426、427、
428、429、430、431、432、433、434、435、436、437、
438、439、440、441、442、443、444、445、446、447、
448、449、450、452、453、454、455、456、457、458、

459、460、461、462、463、464、465、466、467、468、
469、470、471、472、473、474、475、476、477、478、
479、480、481、482、483、484、485、486、487、488、
489、490、491、492、493、494、495、496、497、498、
499、500、501、502、503、504、505、506、507、508、
509、510、511、512、513、514、515、516、517、518、
519、520、521、522、523、524、525、526、527、528、
529、530、531、532、533、534、535、536、537、538、
539、540、541、543、544、545、546、547、548、549、
550、551、552、553、554、555、556、557、558、559、
560、561、562、563、564、565、566、567、568、569、
570、571、572、573、574、575、576、577、578、579、
580、581、582、583、584、585、586、587、588、589、
590、591、592、593、594、595、596、597、598、599、
600、601、602、603、604、607、608、613、614、615、
617、618、620、621、622、623、624、625、626、627、
628、629、630、631、632、633、634、635、636、637、
638、639、640、641、642、643、644、645、646、647、
648、649、650、651、652、653、654、682、683、684、
685、686、687、700、701、702、703、704、705、706、
707、708、709、710、711、712、713、714、715、716、
717及其醫藥學上可接受之鹽。

式(IIIa)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(IIIa)化合物，



(IIIa)

或其醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 、 X^2 、 X^3 如本文關於式 (Ia) 所述；且 R^x 如本文關於式 (Ia) 中當 R^2 為苯基時在對位之取代基所述。

在式 (IIIa) 之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N；或

X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH；或

X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH；或

X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、

$C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、OH、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$ 或 $C(O)NH_2$ ；

R^x 為 R^5 、 $OCH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 SR^5 、 $S(O)R^5$ 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 $OC(O)R^5$ 、 $OC(O)OR^5$ 、 NH_2 、 NHR^5 、 $N(R^5)_2$ 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NR^5C(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $NR^5S(O)_2R^5$ 、 $NHC(O)OR^5$ 、 $NR^5C(O)OR^5$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^5$ 、 $NHC(O)N(R^5)_2$ 、 $NR^5C(O)NHR^5$ 、 $NR^5C(O)N(R^5)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $CHNOR^5$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^5$ 、 $C(O)NHSO_2R^5$ 、 $C(O)NR^5SO_2R^5$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、 $SO_2N(R^5)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、OH、CN、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、Br或I；其中 R^x 不為4-甲基；

R^3 為烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)R^6$ 、 SO_2R^6 、 $C(O)R^6$ 、 $CO(O)R^6$ 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NHS(O)_2R^6$ 、 $NR^6S(O)_2R^6$ 、 $NHC(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^6$ 、 $NHC(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^6C(O)NHR^6$ 、 $NR^6C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^6$ 、 $C(O)NHSO_2R^6$ 、 $C(O)NR^6SO_2R^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $SO_2N(R^6)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、OH、(O)、CN、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、F、Cl、Br或I取代；

R^5 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯

基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $S(O)R^9$ 、 SO_2R^9 、 $C(O)R^9$ 、 $CO(O)R^9$ 、 $OC(O)R^9$ 、 $OC(O)OR^9$ 、 NH_2 、 NHR^9 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)R^9$ 、 $NHS(O)_2R^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^9$ 、 $NHC(O)OR^9$ 、 $NR^9C(O)OR^9$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^9$ 、 $NHC(O)N(R^9)_2$ 、 $NR^9C(O)NHR^9$ 、 $NR^9C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^9$ 、 $C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^9$ 、 $C(O)NHSO_2R^9$ 、 $C(O)NR^9SO_2R^9$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $SO_2N(R^9)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $S(O)R^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $N(R^{10})_2$ 、 $C(O)R^{10}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{10}$ 、 $C(O)N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)R^{10}$ 、 $NR^{10}C(O)R^{10}$ 、 $NHSO_2R^{10}$ 、 $NHC(O)OR^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{10} 、 $SO_2N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 、 OH 、芳基或雜環基取代；

R^{10} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經一或多個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 $OC(O)R^{13}$ 、 $OC(O)OR^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)R^{13}$ 、 $NHS(O)_2R^{13}$ 、 $NR^{13}S(O)_2R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)OR^{13}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{13}$ 、 $NHC(O)N(R^{13})_2$ 、 $NR^{13}C(O)NHR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{13}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{13}$ 、 $C(O)NR^{13}SO_2R^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{13} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 為烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、 $NR^{14}S(O)_2R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)OR^{14}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{14}$ 、 $NHC(O)N(R^{14})_2$ 、 $NR^{14}C(O)NHR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{14}$ 、 $C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{14}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{14}$ 、 $C(O)NR^{14}SO_2R^{14}$ 、

SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、
 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、
 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃
 基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡
 啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離
 子基四氫噻吩-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧
 啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃
 基、環烷基及環烯基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{15} 、
 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、
 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、
 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、
 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、
 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{15}\text{SO}_2\text{R}^{15}$ 、
 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、
 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環
 烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨
 立選擇之 OCH_3 、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、
 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基或環
 烯基視情況經一或多個獨立選擇之烷基或 OCH_3 取代；且

R^{15} 為烷基。

在式(IIIa)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為N；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為CH，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為CH，且 X^1 及 X^3 為N；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為N；或 X^1 為CH， X^2 為N，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為N，且 X^3 為CH；或 X^1 為N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為CH；或 X^1 為N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為N。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N。

在式(IIIa)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IIIa)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、

F、Cl、Br、I、CN、NH₂、NO₂、CF₃或C(O)OH；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中，R¹為R³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中，R¹為OR³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中，R¹為C(O)OR³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中，R¹為C(O)NHR³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中，R¹為NHC(O)R³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中，R¹為NH₂SO₂R³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中，R¹為C(O)NH₂。在式(IIIa)之另一個實施例中，R¹為F。在式

(IIIa)之另一個實施例中， R^1 為Cl。在式(IIIa)之另一個實施例中， R^1 為Br。在式(IIIa)之另一個實施例中， R^1 為CN。在式(IIIa)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(IIIa)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(IIIa)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(IIIa)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IIIa)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選

擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (IIIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (IIIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (IIIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (IIIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (IIIa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (IIIa) 之另一個

實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式

(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及

X^3 為 CR^1 ; R^1 為 $C(O)OR^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基 ; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代 ; 其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIa) 之另一個實施例中, X^1 為 CH ; 且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ; R^1 為 $C(O)NHR^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基 ; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代 ; 其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIa) 之另一個實施例中, X^1 為 CH ; 且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ; R^1 為 $NHC(O)R^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基 ; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代 ; 其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIa) 之另一個實施例中, X^1 為 CH ; 且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ; R^1 為 $NHSO_2R^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基 ; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代 ; 其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIa) 之另一個實施例中, X^1 為 CH ; 且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ; 且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (IIIa) 之另一個實施例中, X^1 為 CH ; 且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ; 且 R^1 為 F 。在式 (IIIa) 之另一個實施例中, X^1 為 CH ; 且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ; 且 R^1 為 Cl 。在式 (IIIa) 之另一個實施例中, X^1 為 CH ; 且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ; 且 R^1 為 Br 。在式 (IIIa) 之另一個實施例中, X^1 為 CH ; 且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ; 且 R^1 為 CN 。在式 (IIIa) 之另一個實施例中, X^1 為 CH ; 且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ; 且 R^1 為 NH_2 。在式 (IIIa) 之另一個實施例中, X^1 為 CH ; 且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ; 且 R^1 為 NO_2 。在式 (IIIa) 之另一個實施例中, X^1 為 CH ; 且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ; 且

R^1 為 CF_3 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IIIa)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIa)之一個實施例中， R^x 為 R^5 、 $OCH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 NHR^5 、 $NHC(O)R^5$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $CHNOR^5$ 、 $C(O)NHOR^5$ 或 CF_3 ；其中 R^x 不為 4-甲基。在式(IIIa)之另一個實施例中， R^x 為 R^5 、 $NHC(O)R^5$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $CHNOR^5$ 或 $C(O)NHOR^5$ ；其中 R^x 不為 4-甲基。在式(IIIa)之另一個實施例中， R^x 為 R^5 且 R^5 為雜環基，其視情況如本文實施例中所述經取代。

在式(III)之另一個實施例中， R^x 為酞嗪-1(2H)-酮基、異喹啉基、異喹啉-1(2H)-酮基、5,6,7,8-四氫酞嗪-1(2H)-酮基、5-氟酞嗪-1(2H)-酮基、(Z)-3H-苯并[d][1,2]二氮吡-4(5H)-酮基、5-(三氟甲基)酞嗪-1(2H)-酮基、吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮、異吲哚啉-1-酮基或 1,2,3,6-四氫吡啶基。在式(III)之另一個實施例中， R^x 為酞嗪-1(2H)-酮基、異喹啉基、異喹啉-1(2H)-酮基、5,6,7,8-四氫酞嗪-1(2H)-酮基、5-氟酞嗪-1(2H)-酮基、(Z)-3H-苯并[d][1,2]二氮吡-4(5H)-酮基、5-(三氟甲基)酞嗪-1(2H)-酮基、異吲哚啉-1-酮基或吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮；其視情

況如本文所定義經取代。在式(III)之另一個實施例中， R^x 為1,2,3,6-四氫吡啶基；其視情況如本文所定義經取代。

另一個實施例係關於具有式(IIIa)之化合物，其包括實例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、149、150、151、152、153、154、155、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、179、180、181、182、183、184、185、186、187、188、189、190、191、192、193、194、195、196、197、198、199、200、201、202、203、204、205、206、207、208、209、210、211、212、213、214、215、216、217、218、219、220、221、222、223、224、225、226、227、228、

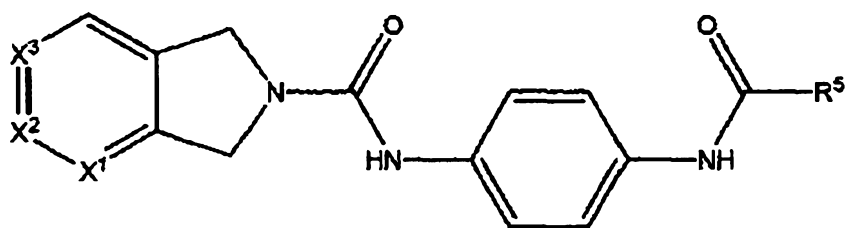
229、230、231、232、233、234、235、236、237、238、
239、240、241、242、243、244、245、246、247、248、
249、250、251、252、253、254、255、256、257、258、
259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、
269、270、271、272、273、274、275、276、277、278、
279、280、281、282、283、284、285、286、287、288、
289、290、291、292、293、294、295、296、297、298、
299、300、301、302、303、304、305、306、307、308、
309、310、311、312、313、314、315、316、317、318、
319、320、321、322、323、324、327、330、331、332、
333、336、337、338、339、340、341、342、343、348、
373、374、375、376、377、378、379、380、381、382、
383、384、385、386、387、388、389、390、391、392、
393、394、395、396、397、398、399、400、401、402、
403、405、406、407、408、409、410、411、412、413、
414、415、416、417、418、419、420、421、424、425、
426、427、428、429、430、431、432、433、434、435、
436、437、438、439、440、441、442、443、444、445、
446、447、448、449、450、456、457、458、459、460、
461、462、463、464、465、466、467、468、469、470、
471、472、473、474、475、476、477、478、479、480、
481、482、483、484、485、486、487、488、489、490、
491、492、493、494、496、497、498、499、500、501、
502、503、504、505、506、507、508、509、510、511、

512、513、514、515、516、517、518、519、520、521、
522、523、524、525、526、527、528、529、530、531、
532、533、534、535、536、537、538、539、540、541、
543、544、545、546、547、548、549、553、554、555、
556、559、560、561、562、563、564、565、566、567、
568、569、570、571、572、573、577、578、579、580、
581、582、583、584、585、586、587、588、589、590、
591、592、593、594、595、596、597、598、599、600、
601、602、603、604、607、608、613、620、621、622、
623、624、625、626、627、628、629、630、631、632、
633、634、635、636、637、638、639、640、641、642、
643、644、645、646、647、649、650、682、683、684、
685、686、687、705、706、707、708、709、710、716、
717及其醫藥學上可接受之鹽。

另一個實施例係關於具有式(IIIa)之化合物，其包括實
例374、375、376、377、378、379、380、381、382、
383、384、385、386、387、388、389、390、391、392、
393、394、395、396、397、398、399、400、547、548、
549、550、551、552及其醫藥學上可接受之鹽。

式(IVa)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(IVa)化合物，



(IVa);

或其醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 、 X^2 、 X^3 及 R^5 如本文關於式 (Ia) 所述。

在式 (IVa) 之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N；或

X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH；或

X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH；或

X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、

F、Cl、Br、I、CN、NH₂、NO₂、N₃、OH、C(O)H、CF₃、C(O)OH或C(O)NH₂；

R³為烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各R³烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、SR⁶、S(O)R⁶、SO₂R⁶、C(O)R⁶、CO(O)R⁶、OC(O)R⁶、OC(O)OR⁶、NH₂、NHR⁶、N(R⁶)₂、NHC(O)R⁶、NR⁶C(O)R⁶、NHS(O)₂R⁶、NR⁶S(O)₂R⁶、NHC(O)OR⁶、NR⁶C(O)OR⁶、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR⁶、NHC(O)N(R⁶)₂、NR⁶C(O)NHR⁶、NR⁶C(O)N(R⁶)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR⁶、C(O)N(R⁶)₂、C(O)NHOH、C(O)NHOR⁶、C(O)NHSO₂R⁶、C(O)NR⁶SO₂R⁶、SO₂NH₂、SO₂NHR⁶、SO₂N(R⁶)₂、C(O)H、C(O)OH、OH、(O)、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；

R⁵為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各R⁵烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之R⁹、OR⁹、SR⁹、S(O)R⁹、SO₂R⁹、C(O)R⁹、CO(O)R⁹、OC(O)R⁹、OC(O)OR⁹、NH₂、NHR⁹、N(R⁹)₂、NHC(O)R⁹、NR⁹C(O)R⁹、NHS(O)₂R⁹、NR⁹S(O)₂R⁹、NHC(O)OR⁹、NR⁹C(O)OR⁹、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR⁹、NHC(O)N(R⁹)₂、NR⁹C(O)NHR⁹、NR⁹C(O)N(R⁹)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR⁹、C(O)N(R⁹)₂、C(O)NHOH、C(O)NHOR⁹、C(O)NHSO₂R⁹、C(O)NR⁹SO₂R⁹、SO₂NH₂、SO₂NHR⁹、SO₂N(R⁹)₂、C(O)H、C(O)OH、OH、(O)、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、F、Cl、Br或I取

代；

R^6 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $S(O)R^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $N(R^{10})_2$ 、 $C(O)R^{10}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{10}$ 、 $C(O)N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)R^{10}$ 、 $NR^{10}C(O)R^{10}$ 、 $NHSO_2R^{10}$ 、 $NHC(O)OR^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{10} 、 $SO_2N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 、 OH 、芳基或雜環基取代；

R^{10} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經一或多個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 $OC(O)R^{13}$ 、 $OC(O)OR^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)R^{13}$ 、 $NHS(O)_2R^{13}$ 、 $NR^{13}S(O)_2R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)OR^{13}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{13}$ 、 $NHC(O)N(R^{13})_2$ 、 $NR^{13}C(O)NHR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{13}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{13}$ 、 $C(O)NR^{13}SO_2R^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{13} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、

SCF₃、F、Cl、Br或I取代；

R¹³為烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、環烷基或環烯基；其中各R¹³烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之R¹⁴、OR¹⁴、SR¹⁴、S(O)R¹⁴、SO₂R¹⁴、C(O)R¹⁴、OC(O)R¹⁴、OC(O)OR¹⁴、NH₂、NHR¹⁴、N(R¹⁴)₂、NHC(O)R¹⁴、NR¹⁴C(O)R¹⁴、NHS(O)₂R¹⁴、NR¹⁴S(O)₂R¹⁴、NHC(O)OR¹⁴、NR¹⁴C(O)OR¹⁴、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR¹⁴、NHC(O)N(R¹⁴)₂、NR¹⁴C(O)NHR¹⁴、NR¹⁴C(O)N(R¹⁴)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR¹⁴、C(O)N(R¹⁴)₂、C(O)NHOH、C(O)NHOR¹⁴、C(O)NHSO₂R¹⁴、C(O)NR¹⁴SO₂R¹⁴、SO₂NH₂、SO₂NHR¹⁴、SO₂N(R¹⁴)₂、C(O)H、C(O)OH、OH、(O)、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；其中各R¹³芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、環烷基及環烯基視情況經一或多個獨立選擇之R¹⁵、OR¹⁵、SR¹⁵、S(O)R¹⁵、SO₂R¹⁵、C(O)R¹⁵、CO(O)R¹⁵、OC(O)R¹⁵、OC(O)OR¹⁵、NH₂、NHR¹⁵、N(R¹⁵)₂、NHC(O)R¹⁵、

$\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、
 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、
 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{15}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{15}\text{SO}_2\text{R}^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、
 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基或環烯基視情況經一或多個獨立選擇之烷基或 OCH_3 取代；且

R^{15} 為烷基；

其限制條件為當 R^2 為未經取代之烷基或視情況經取代之烷基時， R^2 為 C_4 - C_6 烷基。

在式(IVa)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 N ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為 CH ，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為 CH ，且 X^1 及 X^3 為 N ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 N ；或 X^1 為 CH ， X^2 為 N ，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為 N ，且 X^3 為 CH ；或 X^1 為 N ， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 CH ；或 X^1 為 N ， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 N 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且

X^2 為 N。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N。

在式 (IVa) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (IVa) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVa) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVa) 之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中

R^6 為烷基或雜環基。在式(IVa)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVa)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVa)之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVa)之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVa)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(IVa)之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式(IVa)之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式(IVa)之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式(IVa)之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式(IVa)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(IVa)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(IVa)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(IVa)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IVa)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為

CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基

或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、

CF_3 或 C(O)OH 。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVa) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(IVa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(IVa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(IVa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(IVa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、

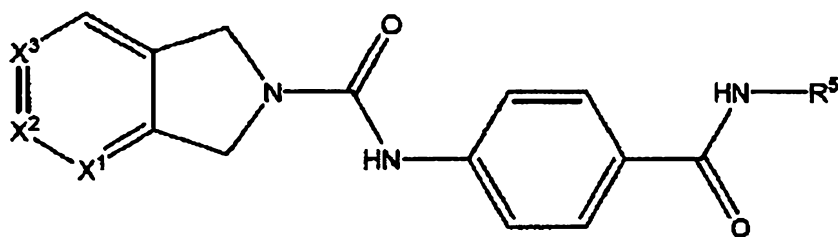
C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其

中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IVa)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

另一個實施例係關於具有式(IVa)之化合物，其包括實例291、292、293、294、295、296、297、298、299、300、301、302、303、304、305、306、307、308、309、310、311、312、313、314、315、563、564、577、579、580、581、582、583、584、596、607、649、650、682、683、684、685及其醫藥學上可接受之鹽。

式(Va)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(Va)化合物，



(Va);

或其醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 、 X^2 、 X^3 及 R^5 如本文關於式(Ia)所述。

在式(Va)之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、

$\text{NHSO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{N(R}^3)_2$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{N(R}^3)_2$ 、
 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、
 NO_2 、 N_3 、OH、 C(O)H 、 CF_3 、 C(O)OH 或 C(O)NH_2 ；

R^3 為烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 S(O)R^6 、 SO_2R^6 、 C(O)R^6 、 CO(O)R^6 、 OC(O)R^6 、 OC(O)OR^6 、 NH_2 、 NHR^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 、 NHC(O)R^6 、 $\text{NR}^6\text{C(O)R}^6$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{S(O)}_2\text{R}^6$ 、 NHC(O)OR^6 、 $\text{NR}^6\text{C(O)OR}^6$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^6 、 $\text{NHC(O)N(R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)NHR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^6 、 $\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^6 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{C(O)NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^6)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、OH、(O)、CN、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、F、Cl、Br或I取代；

R^5 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 S(O)R^9 、 SO_2R^9 、 C(O)R^9 、 CO(O)R^9 、 OC(O)R^9 、 OC(O)OR^9 、 NH_2 、 NHR^9 、 $\text{N(R}^9)_2$ 、 NHC(O)R^9 、 $\text{NR}^9\text{C(O)R}^9$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{S(O)}_2\text{R}^9$ 、 NHC(O)OR^9 、 $\text{NR}^9\text{C(O)OR}^9$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^9 、 $\text{NHC(O)N(R}^9)_2$ 、 $\text{NR}^9\text{C(O)NHR}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^9 、 $\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^9 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^9$ 、 $\text{C(O)NR}^9\text{SO}_2\text{R}^9$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^9)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、OH、(O)、CN、 N_3 、

NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 S(O)R^{10} 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $\text{N(R}^{10})_2$ 、 C(O)R^{10} 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{10} 、 $\text{C(O)N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)R^{10} 、 $\text{NR}^{10}\text{C(O)R}^{10}$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^{10}$ 、 NHC(O)OR^{10} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{10} 、 OH 、 (O) 、 C(O)OH 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 、 OH 、芳基或雜環基取代；

R^{10} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經一或多個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 S(O)R^{13} 、 SO_2R^{13} 、 C(O)R^{13} 、 CO(O)R^{13} 、 OC(O)R^{13} 、 OC(O)OR^{13} 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $\text{N(R}^{13})_2$ 、 NHC(O)R^{13} 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)R}^{13}$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{S(O)}_2\text{R}^{13}$ 、 NHC(O)OR^{13} 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)OR}^{13}$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{13} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{13})_2$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)NHR}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)N(R}^{13})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{13} 、 $\text{C(O)N(R}^{13})_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{13} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{C(O)NR}^{13}\text{SO}_2\text{R}^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{13})_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、

OH、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、SCF₃、F、Cl、Br或I取代；

R¹³為烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、環烷基或環烯基；其中各R¹³烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之R¹⁴、OR¹⁴、SR¹⁴、S(O)R¹⁴、SO₂R¹⁴、C(O)R¹⁴、OC(O)R¹⁴、OC(O)OR¹⁴、NH₂、NHR¹⁴、N(R¹⁴)₂、NHC(O)R¹⁴、NR¹⁴C(O)R¹⁴、NHS(O)₂R¹⁴、NR¹⁴S(O)₂R¹⁴、NHC(O)OR¹⁴、NR¹⁴C(O)OR¹⁴、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR¹⁴、NHC(O)N(R¹⁴)₂、NR¹⁴C(O)NHR¹⁴、NR¹⁴C(O)N(R¹⁴)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR¹⁴、C(O)N(R¹⁴)₂、C(O)NHOH、C(O)NHOR¹⁴、C(O)NHSO₂R¹⁴、C(O)NR¹⁴SO₂R¹⁴、SO₂NH₂、SO₂NHR¹⁴、SO₂N(R¹⁴)₂、C(O)H、C(O)OH、OH、(O)、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；其中各R¹³芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、環烷基及環烯基視情況經一或多個獨立選擇之R¹⁵、OR¹⁵、SR¹⁵、S(O)R¹⁵、SO₂R¹⁵、C(O)R¹⁵、CO(O)R¹⁵、OC(O)R¹⁵、OC(O)OR¹⁵、

NH_2 、 NHR^{15} 、 $\text{N(R}^{15})_2$ 、 NHC(O)R^{15} 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)R}^{15}$ 、
 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{S(O)}_2\text{R}^{15}$ 、 NHC(O)OR^{15} 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)OR}^{15}$ 、
 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{15} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{15})_2$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)NHR}^{15}$ 、
 $\text{NR}^{15}\text{C(O)N(R}^{15})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{15} 、 $\text{C(O)N(R}^{15})_2$ 、
 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{15} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{C(O)NR}^{15}\text{SO}_2\text{R}^{15}$ 、
 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{15})_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、
 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

O

R^{14} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環
 烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨
 立選擇之 OCH_3 、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、
 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基或環
 烯基視情況經一或多個獨立選擇之烷基或 OCH_3 取代；且

R^{15} 為烷基。

O

在式(Va)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或 X^1 及
 X^3 為 CH ，且 X^2 為 N ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及
 X^3 為 CH ，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為 CH ，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2
 為 CH ，且 X^1 及 X^3 為 N ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 N ；或 X^1 為
 CH ， X^2 為 N ，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為 N ，且 X^3 為
 CH ；或 X^1 為 N ， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 CH ；或 X^1 為 N ， X^2 為
 CR^1 ，且 X^3 為 N 。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3
 為 CH 。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2
 為 N 。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為

CR¹。在式(Va)之另一個實施例中，X²及X³為CH；且X¹為CR¹。在式(Va)之另一個實施例中，X¹為CH；且X²及X³為CR¹。在式(Va)之另一個實施例中，X²為CH；且X¹及X³為N。在式(Va)之另一個實施例中，X²及X³為CH；且X¹為N。在式(Va)之另一個實施例中，X¹為CH；X²為N；且X³為CR¹。在式(Va)之另一個實施例中，X¹為CR¹；X²為N；且X³為CH。在式(Va)之另一個實施例中，X¹為N；X²為CR¹；且X³為CH。在式(Va)之另一個實施例中，X¹為N；X²為CR¹；且X³為N。

在式(Va)之另一個實施例中，R¹為R³、OR³、C(O)R³、C(O)OR³、C(O)NH₂、C(O)NHR³、NHC(O)R³、NH₂SO₂R³、F、Cl、Br、I、CN、NH₂、NO₂、CF₃或C(O)OH。在式(Va)之另一個實施例中，R¹為R³、OR³、C(O)R³、C(O)OR³、C(O)NH₂、C(O)NHR³、NHC(O)R³、NH₂SO₂R³、F、Cl、Br、I、CN、NH₂、NO₂、CF₃或C(O)OH；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(Va)之另一個實施例中，R¹為R³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(Va)之另一個實施例中，R¹為OR³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(Va)之另一個實施例中，R¹為

$C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Va)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Va)之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Va)之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Va)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(Va)之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式(Va)之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式(Va)之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式(Va)之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式(Va)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(Va)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(Va)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(Va)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(Va)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Va)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、

NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、

OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；
 R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 C(O)NH_2 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 C(O)OH 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為

CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；

R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{R}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式 (Va) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、

NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或

OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(Va)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

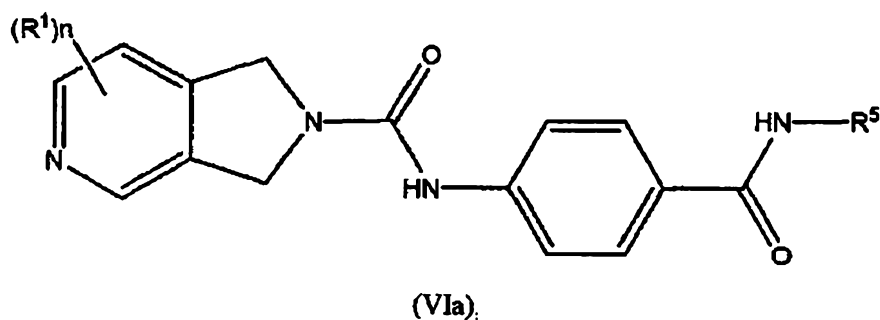
另一個實施例係關於具有式(Va)之化合物，其包括實例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、

87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、
99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、
109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、
119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、
129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、
139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、
149、150、151、152、153、154、155、156、157、158、
159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、
169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、
179、180、181、182、183、184、185、186、187、188、
189、190、191、192、193、194、195、196、197、198、
199、200、201、202、203、204、205、206、207、208、
209、210、211、212、213、214、215、216、217、218、
219、220、221、222、223、224、225、226、227、228、
229、230、231、232、233、234、235、236、237、238、
239、240、241、242、243、244、245、246、247、248、
249、250、251、252、253、254、255、256、257、258、
259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、
269、270、271、272、273、274、275、276、277、278、
279、280、281、282、283、284、285、286、287、288、
289、290、373、410、411、412、413、414、415、416、
417、418、419、420、421、424、425、426、427、430、
431、434、435、436、437、438、439、440、441、442、
445、446、447、448、449、450、496、497、553、554、

555、556、559、560、561、562、565、567、568、569、
570、571、572、585、586、587、588、589、590、591、
592、593、594、595、597、598、599、600、601、602、
603、604、608、613、625、626、627、628、629、630、
631、632、633、634、635、686、687、716、717及其醫
藥學上可接受之鹽。

式(VIa)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(VIa)化合物，



或其醫藥學上可接受之鹽；其中 R^1 及 R^5 如本文關於式(Ia)所述；且 n 為0或1。

在式(VIa)之一個實施例中，

n 為0或1；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、
 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、
 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、
 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、
 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、
 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、
 NO_2 、 N_3 、 OH 、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$ 或 $C(O)NH_2$ ；

R^3 為烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)R^6$ 、 SO_2R^6 、 $C(O)R^6$ 、 $CO(O)R^6$ 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NHS(O)_2R^6$ 、 $NR^6S(O)_2R^6$ 、 $NHC(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^6$ 、 $NHC(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^6C(O)NHR^6$ 、 $NR^6C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^6$ 、 $C(O)NHSO_2R^6$ 、 $C(O)NR^6SO_2R^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $SO_2N(R^6)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $S(O)R^9$ 、 SO_2R^9 、 $C(O)R^9$ 、 $CO(O)R^9$ 、 $OC(O)R^9$ 、 $OC(O)OR^9$ 、 NH_2 、 NHR^9 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)R^9$ 、 $NHS(O)_2R^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^9$ 、 $NHC(O)OR^9$ 、 $NR^9C(O)OR^9$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^9$ 、 $NHC(O)N(R^9)_2$ 、 $NR^9C(O)NHR^9$ 、 $NR^9C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^9$ 、 $C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^9$ 、 $C(O)NHSO_2R^9$ 、 $C(O)NR^9SO_2R^9$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $SO_2N(R^9)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯

基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $S(O)R^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $N(R^{10})_2$ 、 $C(O)R^{10}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{10}$ 、 $C(O)N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)R^{10}$ 、 $NR^{10}C(O)R^{10}$ 、 $NHSO_2R^{10}$ 、 $NHC(O)OR^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{10} 、 $SO_2N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 、 OH 、芳基或雜環基取代；

R^{10} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經一或多個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 $OC(O)R^{13}$ 、 $OC(O)OR^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)R^{13}$ 、 $NHS(O)_2R^{13}$ 、 $NR^{13}S(O)_2R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)OR^{13}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{13}$ 、 $NHC(O)N(R^{13})_2$ 、 $NR^{13}C(O)NHR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{13}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{13}$ 、 $C(O)NR^{13}SO_2R^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{13} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 為烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻吩

基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、 $NR^{14}S(O)_2R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)OR^{14}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{14}$ 、 $NHC(O)N(R^{14})_2$ 、 $NR^{14}C(O)NHR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{14}$ 、 $C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{14}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{14}$ 、 $C(O)NR^{14}SO_2R^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{14} 、 $SO_2N(R^{14})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、環烷基及環烯基視情況經一或多個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、

$\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{15}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{15}\text{SO}_2\text{R}^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{15}$ 、
 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、
 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 為烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個獨立選擇之 OCH_3 、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、
 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基或環烯基視情況經一或多個獨立選擇之烷基或 OCH_3 取代；且

R^{15} 為烷基。

在式 (VIa) 之另一個實施例中， n 為 0。在式 (VIa) 之另一個實施例中， n 為 1。在式 (VIa) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、
 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、
 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式 (VIa) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、
 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、
 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、
 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIa) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$

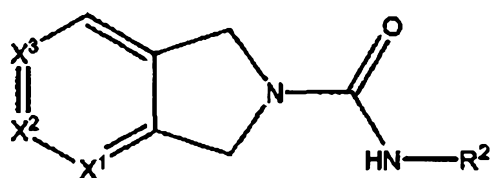
或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIa)之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIa)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIa)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIa)之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIa)之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIa)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(VIa)之另一個實施例中， R^1 為F。在式(VIa)之另一個實施例中， R^1 為Cl。在式(VIa)之另一個實施例中， R^1 為Br。在式(VIa)之另一個實施例中， R^1 為CN。在式(VIa)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(VIa)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(VIa)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(VIa)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(VIa)之另一個實施例

中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

另一個實施例係關於具有式(VIa)之化合物，其包括實例285、286、287、288、289、290、426、427、437、445、553、554、555、556、599、627、628、629、630、631、632、633、634、635、686、687及其醫藥學上可接受之鹽。

式(Ib)之實施例

因此，本發明之一個實施例係關於適用作NAMPT抑制劑之化合物或醫藥學上可接受之鹽，該等化合物具有式(Ib)，



式(Ib)；

其中

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

X^1 為 CH ; X^2 為 N ; 且 X^3 為 CR^1 ; 或

X^1 為 CR^1 ; X^2 為 N ; 且 X^3 為 CH ; 或

X^1 為 N ; X^2 為 CR^1 ; 且 X^3 為 CH ; 或

X^1 為 N ; X^2 為 CR^1 ; 且 X^3 為 N ;

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、 OH 、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$ 或 $C(O)NH_2$;

R^2 為烷基、烯基、炔基、苯基、雜環基、環烷基或環烯基 ; 其中各 R^2 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^4 、 OR^4 、 SR^4 、 $S(O)R^4$ 、 SO_2R^4 、 $C(O)R^4$ 、 $CO(O)R^4$ 、 $OC(O)R^4$ 、 $OC(O)OR^4$ 、 $NHC(O)R^4$ 、 $NR^4C(O)R^4$ 、 $NHS(O)_2R^4$ 、 $NR^4S(O)_2R^4$ 、 $NHC(O)OR^4$ 、 $NR^4C(O)OR^4$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^4$ 、 $NHC(O)N(R^4)_2$ 、 $NR^4C(O)NHR^4$ 、 $NR^4C(O)N(R^4)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^4$ 、 $C(O)N(R^4)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^4$ 、 $C(O)NHSO_2R^4$ 、 $C(O)NR^4SO_2R^4$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^4 、 $SO_2N(R^4)_2$ 、 $C(O)H$ 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代 ; 其中各 R^2 苯基視情況在對位經 1 個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)R^5$ 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 $OC(O)R^5$ 、

OC(O)OR^5 、 NH_2 、 NHR^5 、 $\text{N(R}^5)_2$ 、 NHC(O)R^5 、
 $\text{NR}^5\text{C(O)R}^5$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{S(O)}_2\text{R}^5$ 、 NHC(O)OR^5 、
 $\text{NR}^5\text{C(O)OR}^5$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^5 、 $\text{NHC(O)N(R}^5)_2$ 、
 $\text{NR}^5\text{C(O)NHR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^5 、
 $\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 CHNOR^5 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^5 、
 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{C(O)NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、
 $\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、
 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、Br或I取代；其中各 R^2 苯
 基視情況另外經1個F取代；其中各 R^2 雜環基、環烷基及環
 烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、
 S(O)R^5 、 SO_2R^5 、 C(O)R^5 、 CO(O)R^5 、 OC(O)R^5 、 OC(O)OR^5 、
 NH_2 、 NHR^5 、 $\text{N(R}^5)_2$ 、 NHC(O)R^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)R}^5$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^5$ 、
 $\text{NR}^5\text{S(O)}_2\text{R}^5$ 、 NHC(O)OR^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)OR}^5$ 、 NHC(O)NH_2 、
 NHC(O)NHR^5 、 $\text{NHC(O)N(R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)NHR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、
 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^5 、 $\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 C(O)NHOH 、
 C(O)NHOR^5 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{C(O)NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 SO_2NH_2 、
 SO_2NHR^5 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 N_3 、
 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、F、Cl、Br或I取代；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基
 或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3
 或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 S(O)R^6 、 SO_2R^6 、
 C(O)R^6 、 CO(O)R^6 、 OC(O)R^6 、 OC(O)OR^6 、 NH_2 、 NHR^6 、
 $\text{N(R}^6)_2$ 、 NHC(O)R^6 、 $\text{NR}^6\text{C(O)R}^6$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{S(O)}_2\text{R}^6$ 、
 NHC(O)OR^6 、 $\text{NR}^6\text{C(O)OR}^6$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^6 、

$\text{NHC(O)N(R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)NHR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NH_2 、
 C(O)NHR^6 、 $\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^6 、
 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{C(O)NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、
 $\text{SO}_2\text{N(R}^6)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、
 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取
 代；

R^4 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳
 基、環烷基或雜環基；其中各 R^4 烷基、烯基及炔基視情況
 經1、2、3或4個獨立選擇之 R^7 、 OR^7 、 SR^7 、 S(O)R^7 、
 SO_2R^7 、 C(O)R^7 、 OC(O)R^7 、 OC(O)OR^7 、 NH_2 、 NHR^7 、
 NHC(O)R^7 、 $\text{NR}^7\text{C(O)R}^7$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^7$ 、 $\text{NR}^7\text{S(O)}_2\text{R}^7$ 、
 NHC(O)OR^7 、 $\text{NR}^7\text{C(O)OR}^7$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^7 、
 $\text{NHC(O)N(R}^7)_2$ 、 $\text{NR}^7\text{C(O)NHR}^7$ 、 $\text{NR}^7\text{C(O)N(R}^7)_2$ 、 C(O)NH_2 、
 C(O)NHR^7 、 $\text{C(O)N(R}^7)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^7 、
 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^7$ 、 $\text{C(O)NR}^7\text{SO}_2\text{R}^7$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^7 、
 $\text{SO}_2\text{N(R}^7)_2$ 、 C(O)H 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、
 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^4
 芳基及雜環基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^8 、
 OR^8 、 SR^8 、 S(O)R^8 、 SO_2R^8 、 C(O)R^8 、 CO(O)R^8 、
 OC(O)R^8 、 OC(O)OR^8 、 NH_2 、 NHR^8 、 NHC(O)R^8 、
 $\text{NR}^8\text{C(O)R}^8$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^8$ 、 $\text{NR}^8\text{S(O)}_2\text{R}^8$ 、 NHC(O)OR^8 、
 $\text{NR}^8\text{C(O)OR}^8$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^8 、 $\text{NHC(O)N(R}^8)_2$ 、
 $\text{NR}^8\text{C(O)NHR}^8$ 、 $\text{NR}^8\text{C(O)N(R}^8)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^8 、
 $\text{C(O)N(R}^8)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^8 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^8$ 、

$C(O)NR^8SO_2R^8$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^8 、 $SO_2N(R^8)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $S(O)R^9$ 、 SO_2R^9 、 $C(O)R^9$ 、 $CO(O)R^9$ 、 $OC(O)R^9$ 、 $OC(O)OR^9$ 、 NH_2 、 NHR^9 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)R^9$ 、 $NHS(O)_2R^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^9$ 、 $NHC(O)OR^9$ 、 $NR^9C(O)OR^9$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^9$ 、 $NHC(O)N(R^9)_2$ 、 $NR^9C(O)NHR^9$ 、 $NR^9C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^9$ 、 $C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^9$ 、 $C(O)NHSO_2R^9$ 、 $C(O)NR^9SO_2R^9$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $SO_2N(R^9)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $S(O)R^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $N(R^{10})_2$ 、 $C(O)R^{10}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{10}$ 、 $C(O)N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)R^{10}$ 、 $NR^{10}C(O)R^{10}$ 、 $NHSO_2R^{10}$ 、 $NHC(O)OR^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{10} 、 $SO_2N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^7 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳

基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^7 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{11} 、 OR^{11} 、 SR^{11} 、 $S(O)R^{11}$ 、 SO_2R^{11} 、 NHR^{11} 、 $N(R^{11})_2$ 、 $C(O)R^{11}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{11}$ 、 $C(O)N(R^{11})_2$ 、 $NHC(O)R^{11}$ 、 $NR^{11}C(O)R^{11}$ 、 $NHSO_2R^{11}$ 、 $NHC(O)OR^{11}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{11} 、 $SO_2N(R^{11})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{11}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^8 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^8 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{12} 、 OR^{12} 、 SR^{12} 、 $S(O)R^{12}$ 、 SO_2R^{12} 、 NHR^{12} 、 $N(R^{12})_2$ 、 $C(O)R^{12}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{12}$ 、 $C(O)N(R^{12})_2$ 、 $NHC(O)R^{12}$ 、 $NR^{12}C(O)R^{12}$ 、 $NHSO_2R^{12}$ 、 $NHC(O)OR^{12}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{12} 、 $SO_2N(R^{12})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{12}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、 OH 、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

R^{11} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

R^{12} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳

基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{12} 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個烷氧基取代；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 及 R^{12} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 $OC(O)R^{13}$ 、 $OC(O)OR^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)R^{13}$ 、 $NHS(O)_2R^{13}$ 、 $NR^{13}S(O)_2R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)OR^{13}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{13}$ 、 $NHC(O)N(R^{13})_2$ 、 $NR^{13}C(O)NHR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{13}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{13}$ 、 $C(O)NR^{13}SO_2R^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{13} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、呋喃基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、 $NR^{14}S(O)_2R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、

$\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、
 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{14}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{14}\text{SO}_2\text{R}^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、
 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各
 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶
 基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-
 2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基
 四氫-2H-硫呋喃-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、哌啶基、
 嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、
 噻吩基、呋喃基、嗎啉基、環烷基及環烯基視情況經1、
 2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、
 SO_2R^{15} 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、
 NH_2 、 NHR^{15} 、 $\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、
 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、
 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、
 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{15}\text{SO}_2\text{R}^{15}$ 、
 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、
 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳
 基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及

炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基取代；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH 且 R^2 為苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH 且 R^2 為經 OR^5 取代之苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 R^2 為未經取代之烷基或視情況經取代之烷基時， R^2 為 C_4 - C_6 烷基；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；

且其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為 N 。

在式(Ib)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 N ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為 CH ，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為 CH ，且 X^1 及 X^3 為 N ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 N ；或 X^1 為 CH ， X^2 為 N ，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為 N ，且 X^3 為

CH；或 X^1 為 N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 CH；或 X^1 為 N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 N。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N。

在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取

代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式 (Ib) 之另

一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、

$N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (Ib) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為

C(O)OH。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或C(O)OH。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或C(O)OH；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視

情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(Ib)之

另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為C(O)OH。在式(Ib)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為C(O) R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、C(O) OR^3 、C(O) NH_2 、C(O) NHR^3 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或C(O)OH。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、C(O) OR^3 、C(O) NH_2 、C(O) NHR^3 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或C(O)OH；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為

$C(O)OR^3$ ，其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(Ib)之另一個實

施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(Ib)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ib)之一個實施例中， R^2 為在對位經 R^5 取代之苯基；且 R^5 為酞嗪-1(2H)-酮基、異喹啉基、異喹啉-1(2H)-酮基、5,6,7,8-四氫酞嗪-1(2H)-酮基、5-氟酞嗪-1(2H)-酮基、(Z)-3H-苯并[d][1,2]二氮呋-4(5H)-酮基、5-(三氟甲基)酞嗪-1(2H)-酮基、吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮或異吲哚啉-1-酮基。

在式(Ib)之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；

R^2 為烷基、苯基、雜環基；其中各 R^2 烷基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^4 、 OR^4 、 $C(O)R^4$ 、 $CO(O)R^4$ 、 $NHC(O)R^4$ 、 $NR^4C(O)R^4$ 、 $C(O)NHR^4$ 或 $C(O)N(R^4)_2$ 取代；其中各 R^2 苯基視情況在對位經 1 個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 NHR^5 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $CHNOR^5$ 、 $C(O)NHOR^5$ 、 SO_2NHR^5 、 CF_3 、Br 或 I 取代；其中各 R^2 雜環基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 $C(O)R^5$ 、 $N(R^5)_2$ 、 $NHC(O)R^5$ 、 $C(O)NHR^5$ 、F、Cl、Br 或 I 取代；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基或雜環基；其中各 R^3 烷基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、OH、F、Cl、Br 或 I 取代；

R^4 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、環烷基或雜環基；其中各 R^4 烷基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^7 、F、Cl、Br 或 I 取代；其中各 R^4 芳基、環烷基及雜環基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^8 、 $C(O)R^8$ 、 $CO(O)R^8$ 、F、Cl、Br 或 I 取代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $C(O)R^9$ 、 NH_2 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)OR^9$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^9$ 、 $C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)OH$ 、OH、CN、 CF_3 、F、Cl、Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基或雜環基；其中各 R^6 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之F、Cl、Br或I取代；

R^7 在每次出現時為獨立選擇之芳基或雜環基；

R^8 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^8 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{12} 、 OR^{12} 、OH、 CF_3 、F、Cl、Br或I取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^9 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、OH、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{12} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、雜環基或環烷基；其中各 R^{12} 烷基視情況經一或多個烷氧基取代；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 及 R^{12} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 NH_2 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、OH、CN、 CF_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、F、Cl、Br或I取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、

呋喃基、嗎啉基或環烷基；其中各 R^{13} 烷基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 OH 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基及環烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 CN 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^{14} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基及環烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基取代；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH 且 R^2 為苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH 且 R^2 為經 OR^5 取代之苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 R^2 為未經取代之烷基或視情況經取代之烷基時， R^2 為 C_4 - C_6 烷基；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為N。

在式(Ib)之另一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；

R^2 為烷基、苯基、雜環基；其中各 R^2 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^4 、 OR^4 、 $C(O)R^4$ 、 $CO(O)R^4$ 、 $NHC(O)R^4$ 、 $NR^4C(O)R^4$ 、 $C(O)NHR^4$ 或 $C(O)N(R^4)_2$ 取代；其中各 R^2 苯基視情況在對位經1個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 NHR^5 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $CHNOR^5$ 、 $C(O)NHOR^5$ 、 SO_2NHR^5 或 CF_3 取代；其中各 R^2 苯基視情況另外經1個F取

代；其中各 R^2 雜環基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 $C(O)R^5$ 、 $N(R^5)_2$ 、 $NHC(O)R^5$ 或 $C(O)NHR^5$ 取代；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基或雜環基；其中各 R^3 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；

R^4 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、環烷基或雜環基；其中各 R^4 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^7 取代；其中各 R^4 芳基、環烷基及雜環基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^8 、 $C(O)R^8$ 、 $CO(O)R^8$ 、 F 、 Cl 或 Br 取代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $C(O)R^9$ 、 NH_2 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)OR^9$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^9$ 、 $C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 或 F 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基或雜環基；

R^7 在每次出現時為獨立選擇之芳基或雜環基；

R^8 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^8 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{12} 、 OR^{12} 、 OH 或 CF_3 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^9 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、 OH 、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{12} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、雜環基或環烷基；其中各 R^{12} 烷基視情況經一或多個烷氧基取代；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 及 R^{12} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 NH_2 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、 F 或 Cl 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基或環烷基；其中各 R^{13} 烷基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 OH 或 CF_3 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基及環烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 CN 、 CF_3 、 F 或 Cl 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^{14} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基或OH取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基及環烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、OH或Cl取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基取代；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH且 R^2 為苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH且 R^2 為經 OR^5 取代之苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 R^2 為未經取代之烷基或視情況經取代之烷基時， R^2 為 C_4-C_6 烷基；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為N。

另一個實施例係關於具有式(Ib)之化合物，其包括實例1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、

63 、 64 、 65 、 66 、 67 、 68 、 69 、 70 、 71 、 72 、 73 、 74 、
75 、 76 、 77 、 78 、 79 、 80 、 81 、 82 、 83 、 84 、 85 、 86 、
87 、 88 、 89 、 90 、 91 、 92 、 93 、 94 、 95 、 96 、 97 、 98 、
99 、 100 、 101 、 102 、 103 、 104 、 105 、 106 、 107 、 108 、
109 、 110 、 111 、 112 、 113 、 114 、 115 、 116 、 117 、 118 、
119 、 120 、 121 、 122 、 123 、 124 、 125 、 126 、 127 、 128 、
129 、 130 、 131 、 132 、 133 、 134 、 135 、 136 、 137 、 138 、
139 、 140 、 141 、 142 、 143 、 144 、 145 、 146 、 147 、 148 、
149 、 150 、 151 、 152 、 153 、 154 、 155 、 156 、 157 、 158 、
159 、 160 、 161 、 162 、 163 、 164 、 165 、 166 、 167 、 168 、
169 、 170 、 171 、 172 、 173 、 174 、 175 、 176 、 177 、 178 、
179 、 180 、 181 、 182 、 183 、 184 、 185 、 186 、 187 、 188 、
189 、 190 、 191 、 192 、 193 、 194 、 195 、 196 、 197 、 198 、
199 、 200 、 201 、 202 、 203 、 204 、 205 、 206 、 207 、 208 、
209 、 210 、 211 、 212 、 213 、 214 、 215 、 216 、 217 、 218 、
219 、 220 、 221 、 222 、 223 、 224 、 225 、 226 、 227 、 228 、
229 、 230 、 231 、 232 、 233 、 234 、 235 、 236 、 237 、 238 、
239 、 240 、 241 、 242 、 243 、 244 、 245 、 246 、 247 、 248 、
249 、 250 、 251 、 252 、 253 、 254 、 255 、 256 、 257 、 258 、
259 、 260 、 261 、 262 、 263 、 264 、 265 、 266 、 267 、 268 、
269 、 270 、 271 、 272 、 273 、 274 、 275 、 276 、 277 、 278 、
279 、 280 、 281 、 282 、 283 、 284 、 285 、 286 、 287 、 288 、
289 、 290 、 291 、 292 、 293 、 294 、 295 、 296 、 297 、 298 、
299 、 300 、 301 、 302 、 303 、 304 、 305 、 306 、 307 、 308 、

309、310、311、312、313、314、315、316、317、318、
319、320、321、322、323、324、325、326、327、328、
329、330、331、332、333、334、335、336、337、338、
339、340、341、342、343、344、345、346、347、348、
349、350、351、352、353、354、355、356、358、359、
360、361、362、368、369、370、371、372、373、374、
375、376、377、378、379、380、381、382、383、384、
385、386、387、388、389、390、391、392、393、394、
395、396、397、398、399、400、401、402、403、404、
405、406、407、408、409、410、411、412、413、414、
415、416、417、418、419、420、421、422、423、424、
425、426、427、428、429、430、431、432、433、434、
435、436、437、438、439、440、441、442、443、444、
445、446、447、448、449、450、451、452、453、454、
455、456、457、458、459、460、461、462、463、464、
465、466、467、468、469、470、471、472、473、474、
475、476、477、478、479、480、481、482、483、484、
485、486、487、488、489、490、491、492、493、494、
495、496、497、498、499、500、501、502、503、504、
505、506、507、508、509、510、511、512、513、514、
515、516、517、518、519、520、521、522、523、524、
525、526、527、528、529、530、531、532、533、534、
535、536、537、538、539、540、541、542、543、544、
545、546、547、548、549、550、551、552、553、554、

555、556、557、558、559、560、561、562、563、564、
565、566、567、568、569、570、571、572、573、574、
575、576、577、578、579、580、581、582、583、584、
585、586、587、588、589、590、591、592、593、594、
595、596、597、598、599、600、601、602、603、604、
605、606、607、608、613、614、615、616、617、618、
619、620、621、622、623、624、625、626、627、628、
629、630、631、632、633、634、635、636、637、638、
639、640、641、642、643、644、645、646、647、648、
649、650、651、652、653、654、655、656、657、658、
659、660、661、662、663、664、665、666、667、668、
669、670、671、672、673、674、675、676、677、678、
679、680、681、682、683、684、685、686、687、688、
689、690、691、692、693、694、695、696、697、698、
699、700、701、702、703、704、705、706、707、708、
709、710、711、712、713、714、715、716、717、718、
719、720、721、722、723、724、725、726、727、728、
729、730、731、732、733、734、735、736、737、738、
739、740、741、742、743、744、745、746、747、748、
749、750、751、752、753、754、755、756、757、758、
759、760、761、762、763、764、765、766、767、768、
769、770、771、772、773、774、775、776、777、778、
779、780、781、782、783、784、785、786、787、788、
789、790、791、792、793、794、796、797、798、799、

800、801、802、803、805、806、807、808、809、810、
811、812、813、814、815、816、817、818、819、820、
821、822、823、824、825、826、827、828、829、830、
831、832、833、834、835、836、837、838、839、840、
841、842、843、844、845、846、847、848、849、850、
851、852、853、854、855、856、857、858、859、860、
861、862、863、864、865、866、867、868、869、870、
871、872、873、874、875、876、877、878、879、880、
O 881、882、883、884、885、886、887、888、889、890、
891、892、893、894、895、896、897、898、899、900、
901、902、903、904、905、906、907、908、909、910、
911、912、913、914、915、916、917、918、919、920、
921、922、923、924、925、926、927、928、929、930、
931、932、933、934、935、936、937、938、939、940、
941、942、943、944、945、946、947、948、949、950、
951、952、953、954、955、956、957、958、959、960、
O 961、962、963、964、965、966、967、968、969、970、
971、972、973、974、975、976、977、978、979、980、
981、982、983、984、985、986、987、988、989、990、
991、992、993、994、995、996、997、998、999、
1000、1001、1002、1003、1004、1005、1006、1007、
1008、1009、1010、1011、1012、1013、1014、1015、
1016、1017、1018、1019、1021、1022、1023、1024、
1025、1026、1027、1028、1029、1030、1031、1032、

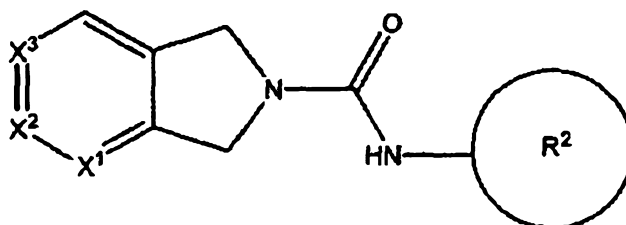
1033 、 1034 、 1035 、 1036 、 1037 、 1038 、 1039 、 1040 、
1041 、 1042 、 1043 、 1044 、 1045 、 1046 、 1047 、 1048 、
1049 、 1050 、 1051 、 1052 、 1053 、 1054 、 1055 、 1056 、
1057 、 1058 、 1059 、 1060 、 1061 、 1062 、 1063 、 1064 、
1065 、 1066 、 1067 、 1068 、 1069 、 1070 、 1071 、 1072 、
1073 、 1074 、 1075 、 1076 、 1077 、 1078 、 1079 、 1080 、
1081 、 1082 、 1083 、 1084 、 1085 、 1086 、 1087 、 1088 、
1089 、 1090 、 1091 、 1092 、 1093 、 1094 、 1095 、 1096 、
1097 、 1098 、 1099 、 1100 、 1101 、 1102 、 1103 、 1104 、
1105 、 1106 、 1107 、 1108 、 1109 、 1110 、 1111 、 1112 、
1113 、 1114 、 1115 、 1116 、 1117 、 1118 、 1119 、 1120 、
1121 、 1122 、 1123 、 1124 、 1125 、 1126 、 1127 、 1128 、
1129 、 1130 、 1131 、 1132 、 1133 、 1134 、 1135 、 1136 、
1137 、 1138 、 1139 、 1140 、 1141 、 1142 、 1143 、 1144 、
1145 、 1146 、 1147 、 1148 、 1149 、 1150 、 1151 、 1152 、
1153 、 1154 、 1155 、 1156 、 1157 、 1158 、 1159 、 1160 、
1161 、 1162 、 1163 、 1164 、 1165 、 1166 、 1167 、 1168 、
1169 、 1170 、 1171 、 1172 、 1173 、 1174 、 1175 、 1176 、
1177 、 1178 、 1179 、 1180 、 1181 、 1182 、 1183 、 1184 、
1185 、 1186 、 1187 、 1188 、 1189 、 1190 、 1191 、 1192 、
1193 、 1194 、 1195 、 1196 、 1197 、 1198 、 1199 、 1200 、
1201 、 1202 、 1203 、 1204 、 1205 、 1206 、 1207 、 1208 、
1209 、 1210 、 1211 、 1212 、 1213 、 1214 、 1215 、 1216 、
1217 、 1218 、 1219 、 1220 、 1221 、 1222 、 1223 、 1224 、

1225 、 1226 、 1227 、 1228 、 1229 、 1230 、 1231 、 1232 、
1233 、 1234 、 1235 、 1236 、 1237 、 1238 、 1239 、 1240 、
1241 、 1242 、 1243 、 1244 、 1245 、 1246 、 1247 、 1248 、
1249 、 1250 、 1251 、 1252 、 1253 、 1254 、 1255 、 1256 、
1257 、 1258 、 1259 、 1260 、 1261 、 1262 、 1263 、 1264 、
1265 、 1266 、 1267 、 1269 、 1270 、 1271 、 1272 、 1273 、
1274 、 1275 、 1276 、 1277 、 1278 、 1279 、 1280 、 1281 、
1282 、 1283 、 1284 、 1285 、 1286 、 1287 、 1288 、 1289 、
O 1292 、 1293 、 1294 、 1295 、 1296 、 1297 、 1298 、 1299 、
1300 、 1301 、 1302 、 1303 、 1304 、 1305 、 1306 、 1307 、
1308 、 1309 、 1310 、 1311 、 1312 、 1313 、 1314 、 1315 、
1316 、 1317 、 1318 、 1319 、 1320 、 1321 、 1322 、 1323 、
1324 、 1325 、 1326 、 1327 、 1328 、 1329 、 1330 、 1331 、
1332 、 1333 、 1334 、 1335 、 1336 、 1337 、 1338 、 1339 、
1340 、 1341 、 1342 、 1343 、 1344 、 1345 、 1346 、 1347 、
1348 、 1349 、 1350 、 1351 、 1352 、 1353 、 1354 、 1355 、
O 1356 、 1357 、 1358 、 1359 、 1360 、 1361 、 1362 、 1363 、
1364 、 1365 、 1366 、 1367 、 1368 、 1369 、 1370 、 1371 、
1372 、 1373 、 1374 、 1375 、 1376 、 1377 、 1378 、 1379 、
1380 、 1381 、 1382 、 1383 、 1384 、 1385 、 1386 、 1387 、
1388 、 1389 、 1390 、 1391 、 1392 、 1393 、 1394 、 1395 、
1396 、 1397 、 1398 、 1399 、 1400 、 1401 、 1402 、 1403 、
1404 、 1405 、 1406 、 1407 、 1408 、 1409 、 1410 、 1411 、
1412 、 1413 、 1414 、 1415 、 1416 、 1417 、 1418 、 1419 、

1420、1421、1422、1423、1424、1425、1426或其醫藥學上可接受之鹽。

式 (IIb) 之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式 (IIb) 化合物，



(IIb);

或其醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 、 X^2 、 X^3 如本文關於式 (Ib) 所述；且 R^2 為苯基、雜環基、環烷基或環烯基；其中 R^2 苯基、雜環基、環烷基及環烯基視情況如本文關於式 (Ib) 中 R^2 上之取代基所述經取代。

在式 (IIb) 之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N；或

X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH；或

X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH；或

X^1 為 N ; X^2 為 CR^1 ; 且 X^3 為 N ;

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、OH、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$ 或 $C(O)NH_2$;

R^2 為 苯基、雜環基、環烷基或環烯基 ; 其中各 R^2 苯基視情況在對位經 1 個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)R^5$ 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 $OC(O)R^5$ 、 $OC(O)OR^5$ 、 NH_2 、 NHR^5 、 $N(R^5)_2$ 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NR^5C(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $NR^5S(O)_2R^5$ 、 $NHC(O)OR^5$ 、 $NR^5C(O)OR^5$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^5$ 、 $NHC(O)N(R^5)_2$ 、 $NR^5C(O)NHR^5$ 、 $NR^5C(O)N(R^5)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $CHNOR^5$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^5$ 、 $C(O)NHSO_2R^5$ 、 $C(O)NR^5SO_2R^5$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、 $SO_2N(R^5)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、OH、CN、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、Br 或 I 取代 ; 其中各 R^2 苯基視情況另外經 1 個 F 取代 ; 其中各 R^2 雜環基、環烷基及環烯基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)R^5$ 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 $OC(O)R^5$ 、 $OC(O)OR^5$ 、 NH_2 、 NHR^5 、 $N(R^5)_2$ 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NR^5C(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $NR^5S(O)_2R^5$ 、 $NHC(O)OR^5$ 、

$\text{NR}^5\text{C(O)OR}^5$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^5 、 $\text{NHC(O)N(R}^5)_2$ 、
 $\text{NR}^5\text{C(O)NHR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^5 、
 $\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^5 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^5$ 、
 $\text{C(O)NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$ 、
 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 N_3 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、
 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 S(O)R^6 、 SO_2R^6 、
 C(O)R^6 、 CO(O)R^6 、 OC(O)R^6 、 OC(O)OR^6 、 NH_2 、 NHR^6 、
 $\text{N(R}^6)_2$ 、 NHC(O)R^6 、 $\text{NR}^6\text{C(O)R}^6$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{S(O)}_2\text{R}^6$ 、
 NHC(O)OR^6 、 $\text{NR}^6\text{C(O)OR}^6$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^6 、
 $\text{NHC(O)N(R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)NHR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NH_2 、
 C(O)NHR^6 、 $\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^6 、
 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{C(O)NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、
 $\text{SO}_2\text{N(R}^6)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、
 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、
 S(O)R^9 、 SO_2R^9 、 C(O)R^9 、 CO(O)R^9 、 OC(O)R^9 、 OC(O)OR^9 、
 NH_2 、 NHR^9 、 $\text{N(R}^9)_2$ 、 NHC(O)R^9 、 $\text{NR}^9\text{C(O)R}^9$ 、
 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{S(O)}_2\text{R}^9$ 、 NHC(O)OR^9 、 $\text{NR}^9\text{C(O)OR}^9$ 、

NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^9 、 $\text{NHC(O)N(R}^9)_2$ 、 $\text{NR}^9\text{C(O)NHR}^9$ 、
 $\text{NR}^9\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^9 、 $\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、
 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^9 、 $\text{C(O)NH}\text{SO}_2\text{R}^9$ 、 $\text{C(O)NR}^9\text{SO}_2\text{R}^9$ 、
 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^9)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、
 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、
 S(O)R^{10} 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $\text{N(R}^{10})_2$ 、 C(O)R^{10} 、 C(O)NH_2 、
 C(O)NHR^{10} 、 $\text{C(O)N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)R^{10} 、 $\text{NR}^{10}\text{C(O)R}^{10}$ 、
 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^{10}$ 、 NHC(O)OR^{10} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{10})_2$ 、
 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{10} 、 OH 、 (O) 、 C(O)OH 、 N_3 、
 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、 OH 、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、
 S(O)R^{13} 、 SO_2R^{13} 、 C(O)R^{13} 、 CO(O)R^{13} 、 OC(O)R^{13} 、 OC(O)OR^{13} 、
 NH_2 、 NHR^{13} 、 $\text{N(R}^{13})_2$ 、 NHC(O)R^{13} 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)R}^{13}$ 、

$\text{NHS(O)}_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{S(O)}_2\text{R}^{13}$ 、 NHC(O)OR^{13} 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)OR}^{13}$ 、
 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{13} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{13})_2$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)NHR}^{13}$ 、
 $\text{NR}^{13}\text{C(O)N(R}^{13})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{13} 、 $\text{C(O)N(R}^{13})_2$ 、
 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{13} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{C(O)NR}^{13}\text{SO}_2\text{R}^{13}$ 、
 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{13})_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、
 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫嘧啶基、嘧啶基、噻唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 S(O)R^{14} 、 SO_2R^{14} 、 C(O)R^{14} 、 OC(O)R^{14} 、 OC(O)OR^{14} 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $\text{N(R}^{14})_2$ 、 NHC(O)R^{14} 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)R}^{14}$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{S(O)}_2\text{R}^{14}$ 、 NHC(O)OR^{14} 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)OR}^{14}$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{14} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{14})_2$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)NHR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)N(R}^{14})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{14} 、 $\text{C(O)N(R}^{14})_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{14} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{C(O)NR}^{14}\text{SO}_2\text{R}^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{14})_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各

R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2*H*-硫呋喃-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、 $NR^{15}C(O)NHR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{15}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{15}$ 、 $C(O)NR^{15}SO_2R^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{15} 、 $SO_2N(R^{15})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基取代；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH且 R^2 為苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH且 R^2 為經 OR^5 取代之苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為N。

在式(IIb)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為N；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為CH，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為CH，且 X^1 及 X^3 為N；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為N；或 X^1 為CH， X^2 為N，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為N，且 X^3 為CH；或 X^1 為N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為CH；或 X^1 為N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為N。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 。在式(IIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式(IIb)之另一個實施例中， X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N。在式(IIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為

N。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N。

在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIb)之另一個實施例

中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。

在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 F 。

在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。

在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 Br 。

在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 CN 。

在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。

在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。

在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。

在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式(IIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。

在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為

CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、

NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；
 R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；
 且 R^1 為 C(O)NH_2 。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；
 且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；
 且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；
 且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；
 且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；
 且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1
 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(IIb)之另一個
 實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式
 (IIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1
 為 C(O)OH 。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；
 且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環
 基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環
 基。

在式(IIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為
 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、
 NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、

CF_3 或 C(O)OH 。在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各

烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。

在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。

在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。

在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。

在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。

在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。

在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。

在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。

在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Iib) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、

NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH 。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；

R^1 為 $\text{NHC(O)}R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC(O)}R^6$ 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC(O)}R^6$ 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 C(O)NH_2 。在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 C(O)OH 。在式 (IIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C(O)}R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC(O)}R^6$ 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

另一個實施例係關於具有式 (IIb) 之化合物，其包括實例

1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、
15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、
27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、
39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、
51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、
63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、
75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、
87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、
99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、
109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、
119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、
129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、
139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、
149、150、151、152、153、154、155、156、157、158、
159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、
169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、
179、180、181、182、183、184、185、186、187、188、
189、190、191、192、193、194、195、196、197、198、
199、200、201、202、203、204、205、206、207、208、
209、210、211、212、213、214、215、216、217、218、
219、220、221、222、223、224、225、226、227、228、
229、230、231、232、233、234、235、236、237、238、
239、240、241、242、243、244、245、246、247、248、
249、250、251、252、253、254、255、256、257、258、

259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、
269、270、271、272、273、274、275、276、277、278、
279、280、281、282、283、284、285、286、287、288、
289、290、291、292、293、294、295、296、297、298、
299、300、301、302、303、304、305、306、307、308、
309、310、311、312、313、314、315、316、317、318、
319、320、321、322、323、324、325、326、327、328、
329、330、331、332、333、334、335、336、337、338、
339、340、341、342、343、344、345、346、347、348、
368、369、370、371、372、373、374、375、376、377、
378、379、380、381、382、383、384、385、386、387、
388、389、390、391、392、393、394、395、396、397、
398、399、400、401、402、403、404、405、406、407、
408、409、410、411、412、413、414、415、416、417、
418、419、420、421、422、423、424、425、426、427、
428、429、430、431、432、433、434、435、436、437、
438、439、440、441、442、443、444、445、446、447、
448、449、450、452、453、454、455、456、457、458、
459、460、461、462、463、464、465、466、467、468、
469、470、471、472、473、474、475、476、477、478、
479、480、481、482、483、484、485、486、487、488、
489、490、491、492、493、494、495、496、497、498、
499、500、501、502、503、504、505、506、507、508、
509、510、511、512、513、514、515、516、517、518、

519、520、521、522、523、524、525、526、527、528、
529、530、531、532、533、534、535、536、537、538、
539、540、541、543、544、545、546、547、548、549、
550、551、552、553、554、555、556、557、558、559、
560、561、562、563、564、565、566、567、568、569、
570、571、572、573、574、575、576、577、578、579、
580、581、582、583、584、585、586、587、588、589、
590、591、592、593、594、595、596、597、598、599、
○ 600、601、602、603、604、607、608、613、614、615、
617、618、620、621、622、623、624、625、626、627、
628、629、630、631、632、633、634、635、636、637、
638、639、640、641、642、643、644、645、646、647、
648、649、650、651、652、653、654、682、683、684、
685、686、687、700、701、702、703、704、705、706、
707、708、709、710、711、712、713、714、715、716、
717、718、719、723、724、725、726、727、728、729、
○ 730、731、732、733、734、735、736、737、738、739、
740、741、742、743、744、745、746、747、748、749、
750、751、752、753、754、755、756、758、759、760、
761、762、763、764、765、766、767、768、769、770、
771、772、773、774、775、776、777、778、779、780、
781、782、783、784、785、786、787、788、789、790、
791、792、793、794、796、799、800、801、802、803、
805、806、808、809、810、811、812、813、814、815、

816、817、818、819、820、821、822、823、824、825、
826、827、828、829、830、831、832、833、834、835、
836、837、838、839、840、841、842、843、844、845、
846、847、848、849、850、851、852、853、854、855、
856、857、858、859、860、861、862、863、864、865、
866、867、868、869、870、871、873、874、875、876、
877、878、879、880、881、882、883、884、885、886、
887、888、889、890、891、892、893、894、895、896、
897、898、899、900、901、902、903、904、905、906、
907、908、910、911、912、913、914、915、916、917、
918、919、920、922、923、924、925、926、927、928、
929、930、931、932、933、934、935、936、937、938、
939、940、941、942、943、944、945、946、947、948、
949、950、951、952、953、954、955、956、957、958、
959、960、961、962、963、964、965、966、967、968、
969、970、971、972、973、974、975、976、977、978、
979、980、981、982、983、984、985、986、987、988、
989、990、991、992、993、994、995、996、997、998、
999、1000、1001、1002、1003、1004、1005、1006、
1007、1008、1009、1010、1011、1012、1013、1014、
1015、1016、1017、1018、1019、1021、1022、1023、
1024、1025、1026、1027、1028、1029、1030、1031、
1032、1033、1034、1035、1036、1037、1038、1039、
1040、1041、1042、1043、1044、1045、1046、1047、

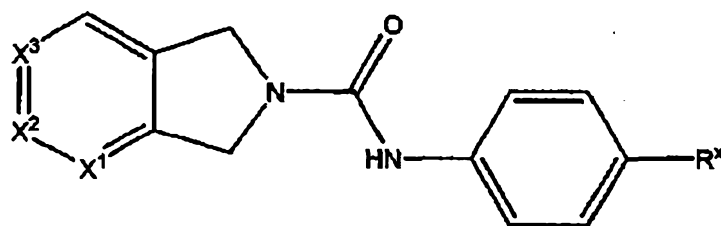


1048 、 1049 、 1050 、 1051 、 1052 、 1053 、 1054 、 1055 、
1056 、 1057 、 1058 、 1059 、 1060 、 1061 、 1062 、 1063 、
1064 、 1065 、 1066 、 1067 、 1068 、 1069 、 1070 、 1071 、
1072 、 1073 、 1074 、 1075 、 1076 、 1077 、 1078 、 1079 、
1080 、 1081 、 1082 、 1083 、 1084 、 1085 、 1086 、 1087 、
1088 、 1089 、 1090 、 1091 、 1092 、 1093 、 1094 、 1095 、
1096 、 1097 、 1098 、 1099 、 1100 、 1101 、 1102 、 1103 、
1104 、 1105 、 1106 、 1107 、 1108 、 1109 、 1110 、 1111 、
○ 1112 、 1113 、 1114 、 1115 、 1116 、 1117 、 1118 、 1119 、
1120 、 1121 、 1122 、 1123 、 1124 、 1125 、 1126 、 1127 、
1128 、 1129 、 1130 、 1131 、 1132 、 1133 、 1134 、 1135 、
1136 、 1137 、 1138 、 1139 、 1140 、 1141 、 1142 、 1143 、
1144 、 1145 、 1146 、 1147 、 1148 、 1149 、 1150 、 1151 、
1152 、 1153 、 1154 、 1155 、 1156 、 1157 、 1158 、 1159 、
1160 、 1161 、 1162 、 1163 、 1164 、 1165 、 1166 、 1167 、
1168 、 1169 、 1170 、 1171 、 1172 、 1173 、 1174 、 1175 、
○ 1176 、 1177 、 1178 、 1179 、 1180 、 1181 、 1182 、 1183 、
1184 、 1185 、 1186 、 1187 、 1188 、 1189 、 1190 、 1191 、
1192 、 1193 、 1194 、 1195 、 1196 、 1197 、 1198 、 1199 、
1200 、 1201 、 1202 、 1203 、 1204 、 1205 、 1206 、 1207 、
1208 、 1209 、 1210 、 1211 、 1212 、 1213 、 1214 、 1215 、
1216 、 1217 、 1218 、 1219 、 1220 、 1221 、 1222 、 1223 、
1224 、 1225 、 1226 、 1227 、 1228 、 1229 、 1230 、 1231 、
1232 、 1233 、 1234 、 1235 、 1236 、 1237 、 1238 、 1239 、

1240、1241、1242、1243、1244、1245、1246、1247、
1248、1249、1250、1251、1252、1253、1254、1255、
1256、1257、1258、1259、1260、1261、1262、1263、
1264、1265、1266、1267、1269、1270、1271、1272、
1273、1274、1275、1276、1277、1278、1279、1280、
1281、1282、1283、1284、1288、1289、1292、1293、
1294、1295、1296、1297、1298、1299、1300、1301、
1302、1303、1304、1305、1306、1307、1308、1309、
1310、1311、1312、1313、1314、1315、1316、1317、
1318、1319、1320、1321、1322、1323、1324、1325、
1326、1327、1328、1329、1330、1331、1332、1333、
1334、1335、1336、1337、1338、1339、1340、1341、
1342、1343、1344、1345、1346、1347、1348、1349、
1363、1364、1365、1366、1367、1368、1370、1371、
1372、1373、1374、1375、1376、1377、1378、1379、
1380、1381、1382、1383、1384、1385、1386、1387、
1388、1389、1390、1391、1392、1393、1394、1395、
1396、1397、1398、1399、1400、1401、1402、1403、
1404、1405、1406、1407、1408、1409、1410、1411、
1412、1413、1414、1415、1416、1417、1418、1419、
1420、1421、1422、1423、1424、1425、1426或其醫藥學
上可接受之鹽。

式(IIIb)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(IIIb)化合物，



(IIIb);

或其醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 、 X^2 、 X^3 如本文關於式(Ib)所述；且 R^x 如本文關於式(IIb)中當 R^2 為苯基時在對位上之取代基所述。

在式(IIIb)之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、

NHSO_2R^3 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、
 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}^3$ 、
 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、 OH 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、
 CF_3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 或 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ ；

R^x 為 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^5$ 、 SO_2R^5 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、
 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 NH_2 、 NHR^5 、 $\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、
 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{S}(\text{O})_2\text{R}^5$ 、
 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^5$ 、
 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{NHR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^5$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 CHNOR^5 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^5$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、
 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、
 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 Br 或 I ；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^6$ 、 SO_2R^6 、
 $\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、
 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{S}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、
 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、
 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^6$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、
 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、
 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取

代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $S(O)R^9$ 、 SO_2R^9 、 $C(O)R^9$ 、 $CO(O)R^9$ 、 $OC(O)R^9$ 、 $OC(O)OR^9$ 、 NH_2 、 NHR^9 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)R^9$ 、 $NHS(O)_2R^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^9$ 、 $NHC(O)OR^9$ 、 $NR^9C(O)OR^9$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^9$ 、 $NHC(O)N(R^9)_2$ 、 $NR^9C(O)NHR^9$ 、 $NR^9C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^9$ 、 $C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^9$ 、 $C(O)NHSO_2R^9$ 、 $C(O)NR^9SO_2R^9$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $SO_2N(R^9)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $S(O)R^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $N(R^{10})_2$ 、 $C(O)R^{10}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{10}$ 、 $C(O)N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)R^{10}$ 、 $NR^{10}C(O)R^{10}$ 、 $NHSO_2R^{10}$ 、 $NHC(O)OR^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{10} 、 $SO_2N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔

基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷基、OH、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 $OC(O)R^{13}$ 、 $OC(O)OR^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)R^{13}$ 、 $NHS(O)_2R^{13}$ 、 $NR^{13}S(O)_2R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)OR^{13}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{13}$ 、 $NHC(O)N(R^{13})_2$ 、 $NR^{13}C(O)NHR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{13}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{13}$ 、 $C(O)NR^{13}SO_2R^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{13} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫嘧啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、

OC(O)OR^{14} 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $\text{N(R}^{14})_2$ 、 NHC(O)R^{14} 、
 $\text{NR}^{14}\text{C(O)R}^{14}$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{S(O)}_2\text{R}^{14}$ 、 NHC(O)OR^{14} 、
 $\text{NR}^{14}\text{C(O)OR}^{14}$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{14} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{14})_2$ 、
 $\text{NR}^{14}\text{C(O)NHR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)N(R}^{14})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{14} 、
 $\text{C(O)N(R}^{14})_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{14} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{14}$ 、
 $\text{C(O)NR}^{14}\text{SO}_2\text{R}^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{14})_2$ 、
 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、
 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各
 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶
基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-
2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基
四氫-2*H*-硫呋喃-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、呋啶基、
嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、
噻吩基、呋喃基、嗎啉基、環烷基及環烯基視情況經1、
2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 S(O)R^{15} 、
 SO_2R^{15} 、 C(O)R^{15} 、 CO(O)R^{15} 、 OC(O)R^{15} 、 OC(O)OR^{15} 、
 NH_2 、 NHR^{15} 、 $\text{N(R}^{15})_2$ 、 NHC(O)R^{15} 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)R}^{15}$ 、
 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{S(O)}_2\text{R}^{15}$ 、 NHC(O)OR^{15} 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)OR}^{15}$ 、
 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{15} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{15})_2$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)NHR}^{15}$ 、
 $\text{NR}^{15}\text{C(O)N(R}^{15})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{15} 、 $\text{C(O)N(R}^{15})_2$ 、
 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{15} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{C(O)NR}^{15}\text{SO}_2\text{R}^{15}$ 、
 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{15})_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、
 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基取代；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH 時， R^x 不為甲基；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH 時， R^x 不為甲氧基；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為 N 。

在式(IIIb)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 N ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為 CH ，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為 CH ，且 X^1 及 X^3 為 N ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 N ；或 X^1 為 CH ， X^2 為 N ，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為 N ，且 X^3 為 CH ；或 X^1 為 N ， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 CH ；或 X^1 為 N ， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 N 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及

X^3 為 CH。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N。

在式 (IIIb) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜

環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(IIIb)之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式(IIIb)之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式(IIIb)之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式(IIIb)之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式(IIIb)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(IIIb)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(IIIb)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(IIIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IIIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其

中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為

CR^1 ; R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIIb) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; R^1 為 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIIb) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; R^1 為 NHSO_2R^3 ; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIIb) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 F 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 Cl 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 Br 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 CN 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 NH_2 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 NO_2 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 CF_3 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{R}^3$; 其中 R^3 為烷

基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2

及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式

(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且

X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(IIIb)之另一個

實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且

R^1 為 CF_3 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IIIb)之另一個實施例

中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、

NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 C(O)NH_2 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(IIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及

X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIIb) 之一個實施例中， R^x 為 R^5 、 OR^5 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 NHR^5 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $CHNOR^5$ 、 $C(O)NHOR^5$ 、 SO_2NHR^5 或 CF_3 。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， R^x 為 R^5 ，且 R^5 為雜環基，其視情況如本文實施例中所述經取代。

在式 (IIIb) 之另一個實施例中， R^x 為酞嗪-1(2H)-酮基、異喹啉基、異喹啉-1(2H)-酮基、5,6,7,8-四氫酞嗪-1(2H)-酮基、5-氟酞嗪-1(2H)-酮基、(Z)-3H-苯并[d][1,2]二氫呋-4(5H)-酮基、5-(三氟甲基)酞嗪-1(2H)-酮基、吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮、異吲哚啉-1-酮基或1,2,3,6-四氫吡啶基。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， R^x 為酞嗪-1(2H)-酮基、異喹啉基、異喹啉-1(2H)-酮基、5,6,7,8-四氫酞嗪-1(2H)-酮基、5-氟酞嗪-1(2H)-酮基、(Z)-3H-苯并[d][1,2]二氫呋-4(5H)-酮基、5-(三氟甲基)酞嗪-1(2H)-酮基、異吲哚啉-1-酮基或吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮；其視情況如本文所定義經取代。在式 (IIIb) 之另一個實施例中， R^x 為1,2,3,6-四氫吡啶基；其視情況如本文所定義經取代。

另一個實施例係關於具有式(IIIb)之化合物，其包括實例 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、85、86、87、88、89、90、91、92、93、94、95、96、97、98、99、100、101、102、103、104、105、106、107、108、109、110、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、132、133、134、135、136、137、138、139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、149、150、151、152、153、154、155、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、179、180、181、182、183、184、185、186、187、188、189、190、191、192、193、194、195、196、197、198、199、200、201、202、203、204、205、206、207、208、209、210、211、212、213、214、215、216、217、218、219、220、221、222、223、224、225、226、227、228、229、230、231、232、233、234、235、236、237、238、239、240、241、242、243、244、245、246、247、248、

249、250、251、252、253、254、255、256、257、258、
259、260、261、262、263、264、265、266、267、268、
269、270、271、272、273、274、275、276、277、278、
279、280、281、282、283、284、285、286、287、288、
289、290、291、292、293、294、295、296、297、298、
299、300、301、302、303、304、305、306、307、308、
309、310、311、312、313、314、315、316、317、318、
319、320、321、322、323、324、327、330、331、332、
O 333、336、337、338、339、340、341、342、343、348、
373、374、375、376、377、378、379、380、381、382、
383、384、385、386、387、388、389、390、391、392、
393、394、395、396、397、398、399、400、401、402、
403、405、406、407、408、409、410、411、412、413、
414、415、416、417、418、419、420、421、424、425、
426、427、428、429、430、431、432、433、434、435、
436、437、438、439、440、441、442、443、444、445、
O 446、447、448、449、450、456、457、458、459、460、
461、462、463、464、465、466、467、468、469、470、
471、472、473、474、475、476、477、478、479、480、
481、482、483、484、485、486、487、488、489、490、
491、492、493、494、496、497、498、499、500、501、
502、503、504、505、506、507、508、509、510、511、
512、513、514、515、516、517、518、519、520、521、
522、523、524、525、526、527、528、529、530、531、

532、533、534、535、536、537、538、539、540、541、
543、544、545、546、547、548、549、553、554、555、
556、559、560、561、562、563、564、565、566、567、
568、569、570、571、572、573、577、578、579、580、
581、582、583、584、585、586、587、588、589、590、
591、592、593、594、595、596、597、598、599、600、
601、602、603、604、607、608、613、620、621、622、
623、624、625、626、627、628、629、630、631、632、
633、634、635、636、637、638、639、640、641、642、
643、644、645、646、647、649、650、682、683、684、
685、686、687、705、706、707、708、709、710、716、
717、718、719、723、724、725、726、727、728、729、
730、731、732、733、734、735、736、737、738、739、
740、741、742、743、744、745、746、747、748、749、
750、751、752、753、754、755、756、759、760、761、
762、763、770、771、772、773、774、775、776、777、
778、779、780、781、782、783、784、785、786、787、
788、789、790、791、792、793、794、796、799、802、
803、806、808、809、810、811、812、813、814、815、
816、817、818、819、820、821、822、823、824、825、
826、827、828、829、830、831、832、833、834、835、
836、837、838、840、841、842、843、844、845、846、
847、848、849、850、851、852、853、854、855、856、
857、858、859、860、861、862、863、864、865、866、

867、868、869、870、871、873、874、875、876、877、
878、879、880、881、882、883、884、885、886、887、
888、889、890、891、892、893、894、895、896、897、
898、899、900、901、902、903、904、905、906、907、
908、910、911、912、913、914、915、916、917、918、
919、922、923、924、925、926、927、928、929、930、
931、932、933、934、935、936、937、938、939、940、
941、942、943、944、945、946、947、948、949、950、
○ 951、952、966、967、968、969、970、971、972、973、
974、975、976、977、978、979、980、981、982、983、
984、985、986、987、988、989、990、991、992、993、
994、995、996、997、998、999、1000、1001、1002、
1003、1004、1005、1006、1007、1008、1009、1010、
1011、1012、1013、1014、1015、1016、1017、1018、
1019、1021、1022、1023、1024、1025、1026、1027、
1028、1029、1030、1031、1032、1033、1034、1035、
○ 1036、1037、1038、1039、1040、1041、1042、1043、
1044、1045、1046、1047、1048、1049、1050、1051、
1052、1053、1054、1055、1056、1057、1058、1059、
1060、1061、1062、1063、1064、1065、1066、1067、
1068、1069、1070、1071、1072、1073、1074、1075、
1076、1077、1078、1079、1080、1081、1082、1083、
1084、1085、1086、1087、1088、1089、1090、1091、
1092、1093、1094、1095、1096、1097、1098、1099、

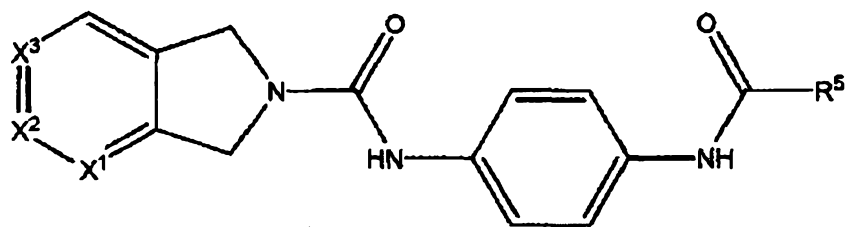
1100 、 1101 、 1102 、 1103 、 1104 、 1105 、 1106 、 1107 、
1108 、 1109 、 1110 、 1111 、 1112 、 1113 、 1114 、 1115 、
1116 、 1117 、 1118 、 1119 、 1120 、 1121 、 1122 、 1123 、
1124 、 1125 、 1126 、 1127 、 1128 、 1129 、 1130 、 1131 、
1132 、 1133 、 1134 、 1135 、 1136 、 1137 、 1138 、 1139 、
1140 、 1141 、 1142 、 1143 、 1144 、 1145 、 1146 、 1147 、
1148 、 1149 、 1150 、 1151 、 1152 、 1153 、 1154 、 1155 、
1156 、 1157 、 1158 、 1159 、 1160 、 1161 、 1162 、 1163 、
1164 、 1165 、 1166 、 1167 、 1168 、 1169 、 1170 、 1171 、
1172 、 1173 、 1174 、 1175 、 1176 、 1177 、 1178 、 1179 、
1180 、 1181 、 1182 、 1183 、 1184 、 1185 、 1186 、 1187 、
1188 、 1189 、 1190 、 1191 、 1192 、 1193 、 1194 、 1195 、
1196 、 1197 、 1198 、 1199 、 1200 、 1201 、 1202 、 1203 、
1204 、 1205 、 1206 、 1207 、 1208 、 1209 、 1210 、 1211 、
1212 、 1213 、 1214 、 1215 、 1216 、 1217 、 1218 、 1219 、
1220 、 1221 、 1222 、 1223 、 1224 、 1225 、 1226 、 1227 、
1228 、 1229 、 1230 、 1231 、 1232 、 1233 、 1234 、 1235 、
1236 、 1237 、 1238 、 1239 、 1240 、 1241 、 1242 、 1243 、
1244 、 1245 、 1246 、 1247 、 1248 、 1249 、 1250 、 1251 、
1252 、 1253 、 1254 、 1255 、 1256 、 1257 、 1258 、 1259 、
1260 、 1261 、 1262 、 1263 、 1264 、 1265 、 1266 、 1267 、
1269 、 1270 、 1271 、 1272 、 1273 、 1274 、 1275 、 1276 、
1277 、 1278 、 1279 、 1280 、 1281 、 1282 、 1283 、 1284 、
1288 、 1289 、 1292 、 1293 、 1294 、 1295 、 1296 、 1297 、

1298、1299、1300、1301、1302、1303、1304、1305、
1306、1307、1308、1309、1310、1311、1312、1313、
1314、1315、1316、1317、1318、1319、1320、1321、
1322、1323、1324、1325、1326、1327、1328、1329、
1330、1331、1332、1333、1334、1335、1336、1337、
1338、1339、1340、1341、1342、1343、1344、1345、
1346、1347、1348、1349、1363、1364、1365、1366、
1367、1368、1370、1371、1372、1373、1374、1375、
1376、1377、1378、1379、1380、1381、1382、1383、
1384、1385、1386、1387、1388、1389、1390、1391、
1392、1393、1394、1395、1396、1397、1398、1399、
1400、1401、1402、1403、1404、1405、1406、1407、
1408、1409、1410、1411、1412、1413、1414、1415、
1416、1417、1418、1419、1420、1421、1422、1423、
1424、1425、1426或其醫藥學上可接受之鹽。

另一個實施例係關於具有式(IIIb)之化合物，其包括
374、375、376、377、378、379、380、381、382、383、
384、385、386、387、388、389、390、391、392、393、
394、395、396、397、398、399、400、547、548、549、
550、551、552及其醫藥學上可接受之鹽。

式(IVb)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(IVb)化合物，



(IVb);

或其醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 、 X^2 、 X^3 及 R^5 如本文關於式(Ib)所述。

在式(IVb)之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、F、Cl、

Br、I、CN、NH₂、NO₂、N₃、OH、C(O)H、CF₃、C(O)OH
或C(O)NH₂；

R³在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基
或雜環基；其中各R³烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3
或4個獨立選擇之R⁶、OR⁶、SR⁶、S(O)R⁶、SO₂R⁶、
C(O)R⁶、CO(O)R⁶、OC(O)R⁶、OC(O)OR⁶、NH₂、NHR⁶、
N(R⁶)₂、NHC(O)R⁶、NR⁶C(O)R⁶、NHS(O)₂R⁶、NR⁶S(O)₂R⁶、
NHC(O)OR⁶、NR⁶C(O)OR⁶、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR⁶、
NHC(O)N(R⁶)₂、NR⁶C(O)NHR⁶、NR⁶C(O)N(R⁶)₂、C(O)NH₂、
C(O)NHR⁶、C(O)N(R⁶)₂、C(O)NHOH、C(O)NHOR⁶、
C(O)NHOSO₂R⁶、C(O)NR⁶SO₂R⁶、SO₂NH₂、SO₂NHR⁶、
SO₂N(R⁶)₂、C(O)H、C(O)OH、OH、(O)、CN、N₃、
NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、F、Cl、Br或I取
代；

R⁵在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳
基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各R⁵烷基、烯基及炔
基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之R⁹、OR⁹、SR⁹、
S(O)R⁹、SO₂R⁹、C(O)R⁹、CO(O)R⁹、OC(O)R⁹、OC(O)OR⁹、
NH₂、NHR⁹、N(R⁹)₂、NHC(O)R⁹、NR⁹C(O)R⁹、NHS(O)₂R⁹、
NR⁹S(O)₂R⁹、NHC(O)OR⁹、NR⁹C(O)OR⁹、NHC(O)NH₂、
NHC(O)NHR⁹、NHC(O)N(R⁹)₂、NR⁹C(O)NHR⁹、NR⁹C(O)N(R⁹)₂、
C(O)NH₂、C(O)NHR⁹、C(O)N(R⁹)₂、C(O)NHOH、
C(O)NHOR⁹、C(O)NHOSO₂R⁹、C(O)NR⁹SO₂R⁹、SO₂NH₂、
SO₂NHR⁹、SO₂N(R⁹)₂、C(O)H、C(O)OH、OH、(O)、

CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；

R⁶在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各R⁶烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之R¹⁰、OR¹⁰、SR¹⁰、S(O)R¹⁰、SO₂R¹⁰、NHR¹⁰、N(R¹⁰)₂、C(O)R¹⁰、C(O)NH₂、C(O)NHR¹⁰、C(O)N(R¹⁰)₂、NHC(O)R¹⁰、NR¹⁰C(O)R¹⁰、NH₂SO₂R¹⁰、NHC(O)OR¹⁰、SO₂NH₂、SO₂NHR¹⁰、SO₂N(R¹⁰)₂、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR¹⁰、OH、(O)、C(O)OH、N₃、CN、NH₂、CF₃、CF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；

R⁹在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各R⁹烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、OH、環烷基、芳基或雜環基取代；

R¹⁰在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由R³、R⁵、R⁶、R⁹及R¹⁰表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之R¹³、OR¹³、SR¹³、S(O)R¹³、SO₂R¹³、C(O)R¹³、CO(O)R¹³、OC(O)R¹³、OC(O)OR¹³、NH₂、NHR¹³、N(R¹³)₂、NHC(O)R¹³、NR¹³C(O)R¹³、NHS(O)₂R¹³、NR¹³S(O)₂R¹³、NHC(O)OR¹³、NR¹³C(O)OR¹³、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR¹³、NHC(O)N(R¹³)₂、NR¹³C(O)NHR¹³、NR¹³C(O)N(R¹³)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR¹³、

$C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{13}$ 、 $C(O)NHOSO_2R^{13}$ 、
 $C(O)NR^{13}SO_2R^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{13} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、
 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、
 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫嘧啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、 $NR^{14}S(O)_2R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)OR^{14}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{14}$ 、 $NHC(O)N(R^{14})_2$ 、 $NR^{14}C(O)NHR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{14}$ 、 $C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{14}$ 、 $C(O)NHOSO_2R^{14}$ 、 $C(O)NR^{14}SO_2R^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{14} 、 $SO_2N(R^{14})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基

四氫-2*H*-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啶基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、 $NR^{15}C(O)NHR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{15}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{15}$ 、 $C(O)NR^{15}SO_2R^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{15} 、 $SO_2N(R^{15})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為 N。

在式 (IVb) 之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH；或 X^1 及 X^3 為 CH，且 X^2 為 N；或 X^1 及 X^3 為 CH，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為 CH，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為 CH，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為 CH，且 X^1 及 X^3 為 N；或 X^2 及 X^3 為 CH，且 X^1 為 N；或 X^1 為 CH， X^2 為 N，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為 N，且 X^3 為 CH；或 X^1 為 N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 CH；或 X^1 為 N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 N。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N。

在式 (IVb) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、

F、Cl、Br、I、CN、NH₂、NO₂、CF₃或C(O)OH。在式(IVb)之另一個實施例中，R¹為R³、OR³、C(O)R³、C(O)OR³、C(O)NH₂、C(O)NHR³、NHC(O)R³、NH₂SO₂R³、F、Cl、Br、I、CN、NH₂、NO₂、CF₃或C(O)OH；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂、NHC(O)R⁶或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IVb)之另一個實施例中，R¹為R³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂、NHC(O)R⁶或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IVb)之另一個實施例中，R¹為OR³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂、NHC(O)R⁶或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IVb)之另一個實施例中，R¹為C(O)OR³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、N(R⁶)₂、NHC(O)R⁶或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IVb)之另一個實施例中，R¹為C(O)NHR³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、NHC(O)R⁶、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。在式(IVb)之另一個實施例中，R¹為NHC(O)R³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、NHC(O)R⁶、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。

中， R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC(O)}R^6$ 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVb)之另一個實施例中， R^1 為 C(O)NH_2 。在式(IVb)之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式(IVb)之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式(IVb)之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式(IVb)之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式(IVb)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(IVb)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(IVb)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(IVb)之另一個實施例中， R^1 為 C(O)OH 。在式(IVb)之另一個實施例中， R^1 為 $\text{C(O)}R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC(O)}R^6$ 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 $\text{NHC(O)}R^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH 。在式(IVb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 $\text{NHC(O)}R^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC(O)}R^6$ 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷

基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1

及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為

CR^1 ; R^1 為 R^3 ; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVb) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; R^1 為 OR^3 ; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVb) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; R^1 為 $C(O)OR^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVb) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; R^1 為 $C(O)NHR^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVb) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; R^1 為 $NHC(O)R^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVb) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; R^1 為 $NHSO_2R^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVb) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為

CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

基。在式(IVb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

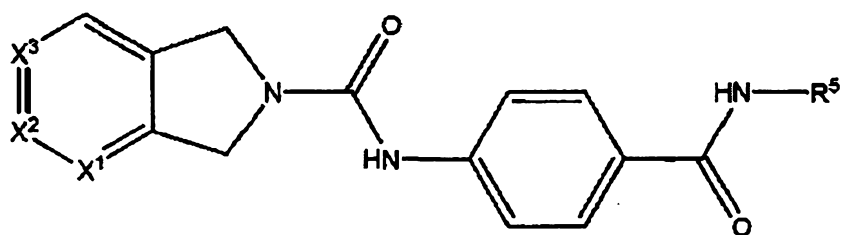
在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式 (IVb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

另一個實施例係關於具有式 (IVb) 之化合物，其包括實例 291、292、293、294、295、296、297、298、299、300、301、302、303、304、305、306、307、308、309、310、311、312、313、314、315、563、564、577、579、580、581、582、583、584、596、607、649、650、682、683、684、685、789、791、792、793、794、796、874、878、879、919、932、934、935、1363、1364、1365、1366、1367、1368、1370、1371、1372 或其醫藥學上可接

受之鹽。

式(Vb)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(Vb)化合物，



(Vb);

或其醫藥學上可接受之鹽；其中X¹、X²、X³及R⁵如本文關於式(Ib)所述。

在式(Vb)之一個實施例中，

X¹、X²及X³為CH；或

X¹及X³為CH；且X²為N；或

X¹及X³為CH；且X²為CR¹；或

X²及X³為CH；且X¹為CR¹；或

X¹為CH；且X²及X³為CR¹；或

X²為CH；且X¹及X³為N；或

X²及X³為CH；且X¹為N；或

X¹為CH；X²為N；且X³為CR¹；或

X¹為CR¹；X²為N；且X³為CH；或

X¹為N；X²為CR¹；且X³為CH；或

X¹為N；X²為CR¹；且X³為N；

R¹ 為 R³、OR³、SR³、S(O)R³、SO₂R³、C(O)R³、C(O)OR³、OC(O)R³、NHR³、N(R³)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR³、

$C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、
 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、
 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、
 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 F 、 Cl 、
 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、 OH 、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$
 或 $C(O)NH_2$ ；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基
 或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3
 或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)R^6$ 、 SO_2R^6 、
 $C(O)R^6$ 、 $CO(O)R^6$ 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、
 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NHS(O)_2R^6$ 、 $NR^6S(O)_2R^6$ 、
 $NHC(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^6$ 、
 $NHC(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^6C(O)NHR^6$ 、 $NR^6C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、
 $C(O)NHR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^6$ 、
 $C(O)NHSO_2R^6$ 、 $C(O)NR^6SO_2R^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、
 $SO_2N(R^6)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、
 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取
 代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳
 基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔
 基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、
 $S(O)R^9$ 、 SO_2R^9 、 $C(O)R^9$ 、 $CO(O)R^9$ 、 $OC(O)R^9$ 、 $OC(O)OR^9$ 、
 NH_2 、 NHR^9 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)R^9$ 、 $NHS(O)_2R^9$ 、
 $NR^9S(O)_2R^9$ 、 $NHC(O)OR^9$ 、 $NR^9C(O)OR^9$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、

NHC(O)NHR^9 、 $\text{NHC(O)N(R}^9)_2$ 、 $\text{NR}^9\text{C(O)NHR}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、
 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^9 、 $\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、 C(O)NHOH 、
 C(O)NHOR^9 、 $\text{C(O)NH}\text{SO}_2\text{R}^9$ 、 $\text{C(O)NR}^9\text{SO}_2\text{R}^9$ 、 SO_2NH_2 、
 SO_2NHR^9 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^9)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、
 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、
 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、
 S(O)R^{10} 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $\text{N(R}^{10})_2$ 、 C(O)R^{10} 、 C(O)NH_2 、
 C(O)NHR^{10} 、 $\text{C(O)N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)R^{10} 、 $\text{NR}^{10}\text{C(O)R}^{10}$ 、
 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^{10}$ 、 NHC(O)OR^{10} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{10})_2$ 、
 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{10} 、 OH 、 (O) 、 C(O)OH 、 N_3 、
 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、 OH 、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、
 S(O)R^{13} 、 SO_2R^{13} 、 C(O)R^{13} 、 CO(O)R^{13} 、 OC(O)R^{13} 、
 OC(O)OR^{13} 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $\text{N(R}^{13})_2$ 、 NHC(O)R^{13} 、

$\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{R}^{13}$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{13}$ 、
 $\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{13}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、
 $\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{13}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{13}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{13}\text{SO}_2\text{R}^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、
 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫嘧啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、
 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、
 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、
 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、
 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、
 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{14}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{14}\text{SO}_2\text{R}^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、
 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各

R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2*H*-硫呋喃-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、環烷基及環烯基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、 $NR^{15}C(O)NHR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{15}$ 、 $C(O)NH SO_2R^{15}$ 、 $C(O)NR^{15}SO_2R^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{15} 、 $SO_2N(R^{15})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為N。

在式(Vb)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為N；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為CH，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為CH，且 X^1 及 X^3 為N；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為N；或 X^1 為CH， X^2 為N，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為N，且 X^3 為CH；或 X^1 為N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為CH；或 X^1 為N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為N。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 為N；

X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N。

在式 (Vb) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (Vb) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Vb) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Vb) 之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Vb) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Vb) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Vb) 之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為

烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^1 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(Vb)之另一個實施例中， R^1 為F。在式(Vb)之另一個實施例中， R^1 為Cl。在式(Vb)之另一個實施例中， R^1 為Br。在式(Vb)之另一個實施例中， R^1 為CN。在式(Vb)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(Vb)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(Vb)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(Vb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(Vb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、

NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、

NHC(O)R⁶、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。

在式(Vb)之另一個實施例中，X¹及X³為CH；且X²為CR¹；且R¹為C(O)NH₂。在式(Vb)之另一個實施例中，X¹及X³為CH；且X²為CR¹；且R¹為F。在式(Vb)之另一個實施例中，X¹及X³為CH；且X²為CR¹；且R¹為Cl。在式(Vb)之另一個實施例中，X¹及X³為CH；且X²為CR¹；且R¹為Br。在式(Vb)之另一個實施例中，X¹及X³為CH；且X²為CR¹；且R¹為CN。在式(Vb)之另一個實施例中，X¹及X³為CH；且X²為CR¹；且R¹為NH₂。在式(Vb)之另一個實施例中，X¹及X³為CH；且X²為CR¹；且R¹為NO₂。在式(Vb)之另一個實施例中，X¹及X³為CH；且X²為CR¹；且R¹為CF₃。在式(Vb)之另一個實施例中，X¹及X³為CH；且X²為CR¹；且R¹為C(O)OH。在式(Vb)之另一個實施例中，X¹及X³為CH；且X²為CR¹；R¹為C(O)R³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、NHC(O)R⁶、N(R⁶)₂或OH取代；且R⁶為烷基或雜環基。

在式(Vb)之另一個實施例中，X²及X³為CH；且X¹為CR¹；且R¹為R³、OR³、C(O)OR³、C(O)NH₂、C(O)NHR³、NHC(O)R³、NH₂SO₂R³、F、Cl、Br、I、CN、NH₂、NO₂、CF₃或C(O)OH。在式(Vb)之另一個實施例中，X²及X³為CH；且X¹為CR¹；且R¹為R³、OR³、C(O)OR³、C(O)NH₂、C(O)NHR³、NHC(O)R³、NH₂SO₂R³、F、Cl、Br、I、CN、NH₂、NO₂、CF₃或C(O)OH；其中R³為烷基、烯基或雜環

基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷

基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、

NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vb)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；

R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC(O)}R^6$ 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Vb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 C(O)NH_2 。在式 (Vb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (Vb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (Vb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (Vb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (Vb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (Vb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (Vb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (Vb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 C(O)OH 。在式 (Vb) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 C(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC(O)}R^6$ 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

另一個實施例係關於具有式 (Vb) 之化合物，其包括實例 1、2、3、4、5、8、9、10、13、14、16、17、18、20、21、23、24、25、26、28、29、30、31、32、33、34、36、37、38、39、40、42、43、45、46、48、49、53、54、57、58、59、60、61、62、63、66、67、68、70、

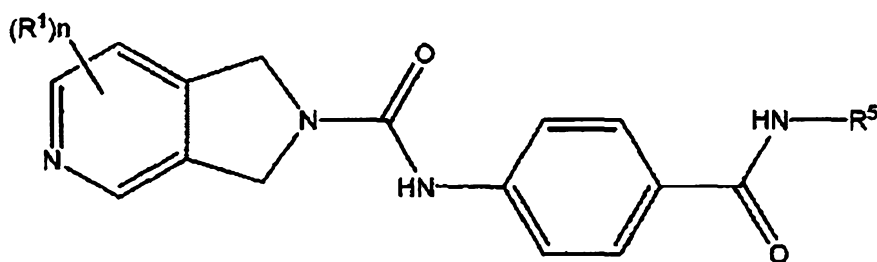
71、73、75、77、79、80、81、82、83、85、86、87、
88、90、91、92、93、94、95、97、98、99、100、101、
103、104、105、106、107、108、111、112、113、114、
115、116、117、118、119、120、121、122、123、124、
125、126、127、128、129、130、131、132、133、134、
135、136、137、139、140、141、142、143、144、145、
146、148、149、150、151、152、153、154、155、156、
157、159、164、165、166、167、168、169、170、171、
172、173、174、176、177、178、179、180、181、182、
184、188、189、190、192、193、194、196、199、201、
203、204、205、209、210、211、213、215、217、220、
223、224、226、227、228、230、231、232、234、235、
236、237、239、243、245、252、253、256、258、260、
268、269、270、271、272、273、274、275、276、277、
278、279、280、281、282、283、284、285、286、288、
289、290、373、410、411、412、413、414、415、416、
417、418、419、420、421、424、426、427、430、431、
435、436、437、440、441、442、445、446、447、449、
450、496、497、553、554、555、556、559、560、562、
567、568、569、570、571、572、585、586、587、588、
589、590、591、592、593、594、595、597、598、599、
600、601、602、603、604、608、613、625、626、628、
629、630、631、632、633、634、687、716、717、718、
719、723、728、729、731、732、733、734、735、737、

738、739、741、743、744、745、747、748、752、770、
771、774、775、776、777、778、779、780、781、782、
783、784、785、786、790、802、803、809、810、811、
812、813、814、815、816、817、818、819、820、821、
822、823、826、827、829、830、831、832、833、834、
835、836、837、838、856、857、858、875、880、881、
882、884、894、895、922、923、924、925、939、969、
970、971、972、976、977、978、1063、1064、1065、
○ 1089、1090、1091、1092、1093、1094、1095、1096、
1097、1098、1100、1102、1103、1104、1105、1106、
1108、1109、1110、1111、1112、1113、1114、1115、
1116、1117、1118、1119、1120、1121、1122、1123、
1124、1125、1127、1129、1130、1132、1133、1135、
1136、1137、1138、1139、1140、1141、1142、1143、
1144、1145、1146、1147、1148、1149、1150、1152、
1153、1154、1155、1156、1157、1158、1160、1161、
○ 1162、1163、1164、1165、1166、1167、1168、1169、
1170、1171、1172、1173、1174、1175、1176、1177、
1178、1179、1180、1181、1182、1183、1184、1185、
1186、1187、1188、1189、1192、1193、1194、1195、
1196、1197、1198、1199、1201、1202、1203、1204、
1205、1206、1207、1208、1209、1210、1211、1212、
1213、1214、1215、1216、1217、1218、1219、1220、
1221、1222、1223、1224、1225、1226、1227、1228、

1229、1230、1231、1232、1233、1234、1235、1236、
 1239、1240、1241、1242、1243、1245、1260、1261、
 1262、1263、1264、1266、1267、1268、1269、1270、
 1271、1272、1273、1274、1275、1276、1277、1278、
 1310、1311、1312、1313、1314、1315、1316、1317、
 1318、1319、1320、1321、1322、1323、1324、1325、
 1326、1327、1328、1329、1330、1331、1332、1333、
 1334、1335、1336、1337、1338、1339、1340、1341、
 1342、1343、1344、1345、1346、1348、1349或其醫藥學
 上可接受之鹽。

式(VIb)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(VIb)化合物，



(VIb);

或其醫藥學上可接受之鹽；其中 R^1 及 R^5 如本文關於式(Ia)所述；且 n 為0或1。

在式(VIb)之一個實施例中，

n 為0或1；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、

$\text{NR}^3\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 NHSO_2R^3 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、 OH 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 CF_3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 或 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ ；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^6$ 、 SO_2R^6 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{S}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^9$ 、 SO_2R^9 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^9$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^9$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^9$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^9$ 、 NH_2 、 NHR^9 、 $\text{N}(\text{R}^9)_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{C}(\text{O})\text{R}^9$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{S}(\text{O})_2\text{R}^9$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{C}(\text{O})\text{OR}^9$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^9$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^9)_2$ 、 $\text{NR}^9\text{C}(\text{O})\text{NHR}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^9)_2$ 、

$C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^9$ 、 $C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^9$ 、 $C(O)NHOSO_2R^9$ 、 $C(O)NR^9SO_2R^9$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $SO_2N(R^9)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $S(O)R^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $N(R^{10})_2$ 、 $C(O)R^{10}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{10}$ 、 $C(O)N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)R^{10}$ 、 $NR^{10}C(O)R^{10}$ 、 $NHSO_2R^{10}$ 、 $NHC(O)OR^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{10} 、 $SO_2N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、 OH 、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 $OC(O)R^{13}$ 、 $OC(O)OR^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)R^{13}$ 、 $NHS(O)_2R^{13}$ 、 $NR^{13}S(O)_2R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、

$\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{13}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、
 $\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{13}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{13}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{13}\text{SO}_2\text{R}^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、
 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{14}\text{SO}_2\text{R}^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶

基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2*H*-硫呋喃-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、 $NR^{15}C(O)NHR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{15}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{15}$ 、 $C(O)NR^{15}SO_2R^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{15} 、 $SO_2N(R^{15})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基。

在式(VIb)之另一個實施例中， n 為0。在式(VIb)之另一個實施例中， n 為1。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

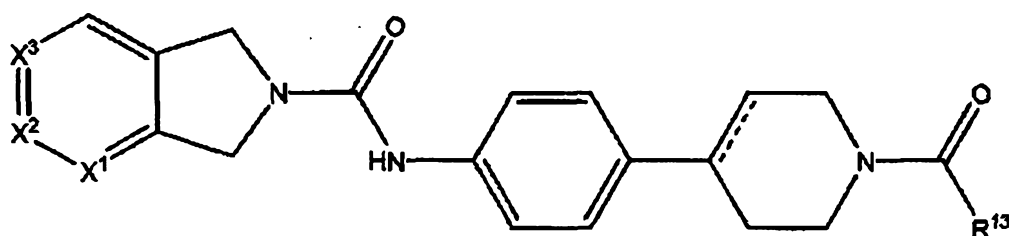
在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為F。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為Cl。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為Br。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為CN。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(VIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

另一個實施例係關於具有式(VIb)之化合物，其包括實例 285、286、288、289、290、426、427、437、445、553、554、555、556、599、627、628、629、630、631、

632、633、634、635、686、687、718、723、725、726、
 727、728、729、731、732、733、734、735、737、738、
 739、741、743、744、745、747、748、749、750、751、
 752、770、771、773、774、775、776、777、778、779、
 780、803、875、880、881、882、884、922、923、924、
 925、939、969、970、971、972、1055、1056、1057、
 1058、1059、1060、1061、1062、1063、1064、1065、
 1066、1067、1068、1069、1070、1071、1072、1073、
 1074、1075、1076或其醫藥學上可接受之鹽。

式(VIIb)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(VIIb)化合物，



(VIIb);

或其醫藥學上可接受之鹽；其中X¹、X²、X³及R¹³如本文關於式(Ib)所述且  指示單鍵或雙鍵。

在式(VIIb)之一個實施例中，

X¹、X²及X³為CH；或

X¹及X³為CH；且X²為N；或

X¹及X³為CH；且X²為CR¹；或

X²及X³為CH；且X¹為CR¹；或

X¹為CH；且X²及X³為CR¹；或

X^2 為 CH ; 且 X^1 及 X^3 為 N ; 或

X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 N ; 或

X^1 為 CH ; X^2 為 N ; 且 X^3 為 CR^1 ; 或

X^1 為 CR^1 ; X^2 為 N ; 且 X^3 為 CH ; 或

X^1 為 N ; X^2 為 CR^1 ; 且 X^3 為 CH ; 或

X^1 為 N ; X^2 為 CR^1 ; 且 X^3 為 N ;

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、
 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、
 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、
 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、
 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、
 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 F 、 Cl 、
 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、 OH 、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$
 或 $C(O)NH_2$;

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基
 或雜環基 ; 其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3
 或 4 個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)R^6$ 、 SO_2R^6 、
 $C(O)R^6$ 、 $CO(O)R^6$ 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、
 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NHS(O)_2R^6$ 、 $NR^6S(O)_2R^6$ 、
 $NHC(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^6$ 、
 $NHC(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^6C(O)NHR^6$ 、 $NR^6C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、
 $C(O)NHR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^6$ 、
 $C(O)NHSO_2R^6$ 、 $C(O)NR^6SO_2R^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、
 $SO_2N(R^6)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、

NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $\text{S(O)}\text{R}^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $\text{N(R}^{10})_2$ 、 $\text{C(O)}\text{R}^{10}$ 、 $\text{C(O)}\text{NH}_2$ 、 $\text{C(O)}\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{C(O)}\text{N(R}^{10})_2$ 、 $\text{NHC(O)}\text{R}^{10}$ 、 $\text{NR}^{10}\text{C(O)}\text{R}^{10}$ 、 $\text{NHSO}_2\text{R}^{10}$ 、 $\text{NHC(O)}\text{OR}^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{10})_2$ 、 $\text{NHC(O)}\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC(O)}\text{NHR}^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $\text{C(O)}\text{OH}$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^6 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $\text{S(O)}\text{R}^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $\text{C(O)}\text{R}^{13}$ 、 $\text{CO(O)}\text{R}^{13}$ 、 $\text{OC(O)}\text{R}^{13}$ 、 $\text{OC(O)}\text{OR}^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $\text{N(R}^{13})_2$ 、 $\text{NHC(O)}\text{R}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)}\text{R}^{13}$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{S(O)}_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{NHC(O)}\text{OR}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)}\text{OR}^{13}$ 、 $\text{NHC(O)}\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC(O)}\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{NHC(O)}\text{N(R}^{13})_2$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)}\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)}\text{N(R}^{13})_2$ 、 $\text{C(O)}\text{NH}_2$ 、 $\text{C(O)}\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{C(O)}\text{N(R}^{13})_2$ 、 $\text{C(O)}\text{NHOH}$ 、 $\text{C(O)}\text{NHOR}^{13}$ 、 $\text{C(O)}\text{NHSO}_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{C(O)}\text{NR}^{13}\text{SO}_2\text{R}^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{13})_2$ 、 $\text{C(O)}\text{H}$ 、 $\text{C(O)}\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳

基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫嘧啶基、嘧啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、 $NR^{14}S(O)_2R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)OR^{14}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{14}$ 、 $NHC(O)N(R^{14})_2$ 、 $NR^{14}C(O)NHR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{14}$ 、 $C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{14}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{14}$ 、 $C(O)NR^{14}SO_2R^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{14} 、 $SO_2N(R^{14})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫嘧啶基、嘧啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、

NH_2 、 NHR^{15} 、 $\text{N(R}^{15})_2$ 、 NHC(O)R^{15} 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)R}^{15}$ 、
 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{S(O)}_2\text{R}^{15}$ 、 NHC(O)OR^{15} 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)OR}^{15}$ 、
 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{15} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{15})_2$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)NHR}^{15}$ 、
 $\text{NR}^{15}\text{C(O)N(R}^{15})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{15} 、 $\text{C(O)N(R}^{15})_2$ 、
 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{15} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{C(O)NR}^{15}\text{SO}_2\text{R}^{15}$ 、
 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{15})_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、
 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

○ R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

○ R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為 N 。

在式(VIIb)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或 X^1 及

X^3 為 CH，且 X^2 為 N；或 X^1 及 X^3 為 CH，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為 CH，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為 CH，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為 CH，且 X^1 及 X^3 為 N；或 X^2 及 X^3 為 CH，且 X^1 為 N；或 X^1 為 CH， X^2 為 N，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為 N，且 X^3 為 CH；或 X^1 為 N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 CH；或 X^1 為 N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 N。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N。

在式(VIIb)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(VIIb)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視

情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIib) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIib) 之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIib) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIib) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIib) 之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIib) 之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (VIib) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (VIib) 之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式

(VIIb)之另一個實施例中， R^1 為Cl。在式(VIIb)之另一個實施例中， R^1 為Br。在式(VIIb)之另一個實施例中， R^1 為CN。在式(VIIb)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(VIIb)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(VIIb)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(VIIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(VIIb)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各

烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且

X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為

CR^1 ; R^1 為 OR^3 ; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIib) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; R^1 為 $C(O)OR^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIib) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; R^1 為 $C(O)NHR^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIib) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; R^1 為 $NHC(O)R^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIib) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; R^1 為 $NHSO_2R^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIib) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (VIib) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 F 。在式 (VIib) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 Cl 。在式 (VIib) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且

R^1 為 Br。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式

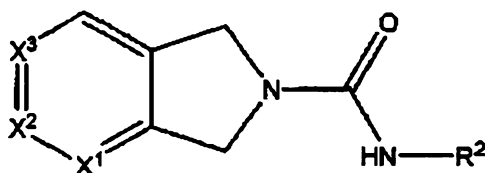
(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(VIIb)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

另一個實施例係關於具有式(VIIb)之化合物，其包括實例317、330、331、332、401、405、406、407、432、456、457、458、459、460、462、463、464、465、466、467、468、469、470、471、472、473、474、475、476、477、478、480、481、482、483、484、485、486、487、488、489、490、491、492、493、494、543、544、545、546、620、646、647、705、706、707、708、709、710、759、760、761、762、763、799、910、911、912、913、914、915、916、917、918、967、968、979、980、981、982、983、984、985、986、1014、1015、1016、1017、1019、1077、1078、1079、1080、1254、1255、1256、1257、1258、1259、1279、1280、1281、1282、1283、

1284、1384、1385或其醫藥學上可接受之鹽。

式(Ic)之實施例

因此，本發明之一個實施例係關於適用作NAMPT抑制劑之化合物或醫藥學上可接受之鹽，該等化合物具有式(Ic)，



式(Ic)；

其中

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、

SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^3)_2$ 、 NHSO_2R^3 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{N(R}^3)_2$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{N(R}^3)_2$ 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、OH、 C(O)H 、 CF_3 、 C(O)OH 或 C(O)NH_2 ；

R^2 為烷基、烯基、炔基、苯基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^2 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^4 、 OR^4 、 SR^4 、 S(O)R^4 、 SO_2R^4 、 C(O)R^4 、 CO(O)R^4 、 OC(O)R^4 、 OC(O)OR^4 、 NHC(O)R^4 、 $\text{NR}^4\text{C(O)R}^4$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^4$ 、 $\text{NR}^4\text{S(O)}_2\text{R}^4$ 、 NHC(O)OR^4 、 $\text{NR}^4\text{C(O)OR}^4$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^4 、 $\text{NHC(O)N(R}^4)_2$ 、 $\text{NR}^4\text{C(O)NHR}^4$ 、 $\text{NR}^4\text{C(O)N(R}^4)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^4 、 $\text{C(O)N(R}^4)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^4 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{C(O)NR}^4\text{SO}_2\text{R}^4$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^4 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^4)_2$ 、 C(O)H 、(O)、CN、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、F、Cl、Br或I取代；其中各 R^2 苯基視情況在對位經1個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、 S(O)R^5 、 SO_2R^5 、 C(O)R^5 、 CO(O)R^5 、 OC(O)R^5 、 OC(O)OR^5 、 NH_2 、 NHR^5 、 $\text{N(R}^5)_2$ 、 NHC(O)R^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)R}^5$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{S(O)}_2\text{R}^5$ 、 NHC(O)OR^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)OR}^5$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^5 、 $\text{NHC(O)N(R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)NHR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^5 、 $\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 CHNOR^5 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^5 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{C(O)NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、OH、CN、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、Br或I取代；其中各 R^2 苯

基視情況另外經1個F取代；其中各 R^2 雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)R^5$ 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 $OC(O)R^5$ 、 $OC(O)OR^5$ 、 NH_2 、 NHR^5 、 $N(R^5)_2$ 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NR^5C(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $NR^5S(O)_2R^5$ 、 $NHC(O)OR^5$ 、 $NR^5C(O)OR^5$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^5$ 、 $NHC(O)N(R^5)_2$ 、 $NR^5C(O)NHR^5$ 、 $NR^5C(O)N(R^5)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^5$ 、 $C(O)NHSO_2R^5$ 、 $C(O)NR^5SO_2R^5$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、 $SO_2N(R^5)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)R^6$ 、 SO_2R^6 、 $C(O)R^6$ 、 $CO(O)R^6$ 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NHS(O)_2R^6$ 、 $NR^6S(O)_2R^6$ 、 $NHC(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^6$ 、 $NHC(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^6C(O)NHR^6$ 、 $NR^6C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^6$ 、 $C(O)NHSO_2R^6$ 、 $C(O)NR^6SO_2R^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $SO_2N(R^6)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^4 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基或雜環基；其中各 R^4 烷基、烯基及炔基視情況

經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^7 、 OR^7 、 SR^7 、 $S(O)R^7$ 、 SO_2R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $OC(O)R^7$ 、 $OC(O)OR^7$ 、 NH_2 、 NHR^7 、 $NHC(O)R^7$ 、 $NR^7C(O)R^7$ 、 $NHS(O)_2R^7$ 、 $NR^7S(O)_2R^7$ 、 $NHC(O)OR^7$ 、 $NR^7C(O)OR^7$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^7$ 、 $NHC(O)N(R^7)_2$ 、 $NR^7C(O)NHR^7$ 、 $NR^7C(O)N(R^7)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^7$ 、 $C(O)N(R^7)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^7$ 、 $C(O)NHSO_2R^7$ 、 $C(O)NR^7SO_2R^7$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^7 、 $SO_2N(R^7)_2$ 、 $C(O)H$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^4 芳基及雜環基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^8 、 OR^8 、 SR^8 、 $S(O)R^8$ 、 SO_2R^8 、 $C(O)R^8$ 、 $CO(O)R^8$ 、 $OC(O)R^8$ 、 $OC(O)OR^8$ 、 NH_2 、 NHR^8 、 $NHC(O)R^8$ 、 $NR^8C(O)R^8$ 、 $NHS(O)_2R^8$ 、 $NR^8S(O)_2R^8$ 、 $NHC(O)OR^8$ 、 $NR^8C(O)OR^8$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^8$ 、 $NHC(O)N(R^8)_2$ 、 $NR^8C(O)NHR^8$ 、 $NR^8C(O)N(R^8)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^8$ 、 $C(O)N(R^8)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^8$ 、 $C(O)NHSO_2R^8$ 、 $C(O)NR^8SO_2R^8$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^8 、 $SO_2N(R^8)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $S(O)R^9$ 、 SO_2R^9 、 $C(O)R^9$ 、 $CO(O)R^9$ 、 $OC(O)R^9$ 、 $OC(O)OR^9$ 、 NH_2 、 NHR^9 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)R^9$ 、

$\text{NHS(O)}_2\text{R}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{S(O)}_2\text{R}^9$ 、 NHC(O)OR^9 、 $\text{NR}^9\text{C(O)OR}^9$ 、
 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^9 、 $\text{NHC(O)N(R}^9)_2$ 、 $\text{NR}^9\text{C(O)NHR}^9$ 、
 $\text{NR}^9\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^9 、 $\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、
 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^9 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^9$ 、 $\text{C(O)NR}^9\text{SO}_2\text{R}^9$ 、
 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^9)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、
 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 S(O)R^{10} 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $\text{N(R}^{10})_2$ 、 C(O)R^{10} 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{10} 、 $\text{C(O)N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)R^{10} 、 $\text{NR}^{10}\text{C(O)R}^{10}$ 、 $\text{NHSO}_2\text{R}^{10}$ 、 NHC(O)OR^{10} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{10} 、 OH 、 (O) 、 C(O)OH 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^7 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^7 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{11} 、 OR^{11} 、 SR^{11} 、 S(O)R^{11} 、 SO_2R^{11} 、 NHR^{11} 、 $\text{N(R}^{11})_2$ 、 C(O)R^{11} 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{11} 、 $\text{C(O)N(R}^{11})_2$ 、 NHC(O)R^{11} 、 $\text{NR}^{11}\text{C(O)R}^{11}$ 、 $\text{NHSO}_2\text{R}^{11}$ 、 NHC(O)OR^{11} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{11}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{11})_2$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{11} 、 OH 、 (O) 、 C(O)OH 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^8 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳

基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^8 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{12} 、 OR^{12} 、 SR^{12} 、 $S(O)R^{12}$ 、 SO_2R^{12} 、 NHR^{12} 、 $N(R^{12})_2$ 、 $C(O)R^{12}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{12}$ 、 $C(O)N(R^{12})_2$ 、 $NHC(O)R^{12}$ 、 $NR^{12}C(O)R^{12}$ 、 $NHSO_2R^{12}$ 、 $NHC(O)OR^{12}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{12} 、 $SO_2N(R^{12})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{12}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、 OH 、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

R^{11} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

R^{12} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{12} 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個烷氧基取代；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 及 R^{12} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 $OC(O)R^{13}$ 、 $OC(O)OR^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)R^{13}$ 、 $NHS(O)_2R^{13}$ 、 $NR^{13}S(O)_2R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)OR^{13}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{13}$ 、 $NHC(O)N(R^{13})_2$ 、

$\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{13}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{13}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{13}\text{SO}_2\text{R}^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、
 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫呋喃-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{14}\text{SO}_2\text{R}^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-

2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2*H*-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啶基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、 $NR^{15}C(O)NHR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{15}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{15}$ 、 $C(O)NR^{15}SO_2R^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{15} 、 $SO_2N(R^{15})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；其中 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH且 R^2 為苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH且 R^2 為經 OR^5 取代之苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 R^2 為未經取代之烷基或視情況經取代之烷基時， R^2 為 C_4 - C_6 烷基；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為N。

在式(Ic)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為N；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為CH，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為CH，且 X^1 及 X^3 為N；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為N；或 X^1 為CH， X^2 為N，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為N，且 X^3 為CH；或 X^1 為N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為CH；或 X^1 為N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為N。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 。在式(Ic)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式(Ic)之另一個實施例中， X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為

N。在式(Ic)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N。

在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基

或雜環基。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為F。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為Cl。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為Br。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為CN。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(Ic)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、

CF_3 或 C(O)OH 。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各

烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。

在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。

在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。

在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。

在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。

在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。

在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。

在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。

在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。

在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、

NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH 。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；

R^1 為 $\text{NHC(O)}R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC(O)}R^6$ 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC(O)}R^6$ 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C(O)}\text{NH}_2$ 。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C(O)}\text{OH}$ 。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C(O)}R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC(O)}R^6$ 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為

CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Ic) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(Ic)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Ic)之一個實施例中， R^2 為在對位經 R^5 取代之苯基；且 R^5 為酞嗪-1(2H)-酮基、異喹啉基、異喹啉-1(2H)-酮基、5,6,7,8-四氫酞嗪-1(2H)-酮基、5-氟酞嗪-1(2H)-酮基、(Z)-3H-苯并[d][1,2]二氮呋-4(5H)-酮基、5-(三氟甲基)酞嗪-1(2H)-酮基、吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮或異吲哚啉-1-酮基。

在式(Ic)之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；

R^2 為烷基、苯基、環烷基或雜環基；其中各 R^2 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^4 、 OR^4 、 $C(O)R^4$ 、 $CO(O)R^4$ 、 $NHC(O)R^4$ 、 $NR^4C(O)R^4$ 、 $C(O)NHR^4$ 或 $C(O)N(R^4)_2$ 取代；其中各 R^2 苯基視情況在對位經1個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 NHR^5 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $CHNOR^5$ 、 $C(O)NHOR^5$ 、 SO_2NHR^5 、 CF_3 、Br或I取代；其

中各 R^2 苯基視情況另外經1個F取代；其中各 R^2 雜環基及環烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 $C(O)R^5$ 、 $C(O)OR^5$ 、 $N(R^5)_2$ 、 $NHC(O)R^5$ 、 $C(O)NHR^5$ 、F、Cl、Br或I取代；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基或雜環基；其中各 R^3 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、OH、F、Cl、Br或I取代；

R^4 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、環烷基或雜環基；其中各 R^4 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^7 、F、Cl、Br或I取代；其中各 R^4 芳基、環烷基及雜環基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^8 、 $C(O)R^8$ 、 $CO(O)R^8$ 、F、Cl、Br或I取代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $C(O)R^9$ 、 NH_2 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)OR^9$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^9$ 、 $C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)OH$ 、OH、CN、 CF_3 、F、Cl、Br或I取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基或雜環基；其中各 R^6 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之F、Cl、Br或I取代；

R^7 在每次出現時為獨立選擇之芳基或雜環基；

R^8 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^8 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之

R^{12} 、 OR^{12} 、 OH 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^9 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、 OH 、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{12} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、雜環基或環烷基；其中各 R^{12} 烷基視情況經一或多個烷氧基取代；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 及 R^{12} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 NH_2 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、呋喃基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SO_2R^{14} 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 OH 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶

基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2*H*-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、OH、CN、 CF_3 、F、Cl、Br或I取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^{14} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、OH、F、Cl、Br或I取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基及環烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、OH、F、Cl、Br或I取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；其中 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH且 R^2 為苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH且 R^2 為經 OR^5 取代之苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 R^2 為未經取代之烷基或視情況經取代之烷基時， R^2 為 C_4 - C_6 烷基；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為 N。

在式 (Ic) 之另一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N；或

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；

R^2 為烷基、苯基、環烷基或雜環基；其中各 R^2 烷基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^4 、 OR^4 、 $C(O)R^4$ 、 $CO(O)R^4$ 、 $NHC(O)R^4$ 、 $NR^4C(O)R^4$ 、 $C(O)NHR^4$ 或 $C(O)N(R^4)_2$ 取代；其中各 R^2 苯基視情況在對位經 1 個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 NHR^5 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $CHNOR^5$ 、 $C(O)NHOR^5$ 、 SO_2NHR^5 或 CF_3 取代；其中各 R^2 苯基視情況另外經 1 個 F 取代；其中各 R^2 雜環基及環烷基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 $C(O)R^5$ 、 $C(O)OR^5$ 、 $N(R^5)_2$ 、 $NHC(O)R^5$ 或 $C(O)NHR^5$ 取代；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基或雜環基；其中各 R^3 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；

R^4 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、環烷基或雜環基；其中各 R^4 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^7 取代；其中各 R^4 芳基、環烷基及雜環基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^8 、 $C(O)R^8$ 、 $CO(O)R^8$ 、 F 、 Cl 或 Br 取代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $C(O)R^9$ 、 NH_2 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)OR^9$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^9$ 、 $C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 或 F 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基或雜環基；

R^7 在每次出現時為獨立選擇之芳基或雜環基；

R^8 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^8 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{12} 、 OR^{12} 、 OH 或 CF_3 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或環烷基；其中各 R^9 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、 OH 、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{12} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、雜環基或環烷基；其中各 R^{12} 烷基視情況經一或多個烷氧基取代；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 及 R^{12} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 NH_2 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 OH 、 CN 、 CF_3 、 OCF_3 、 SCF_3 、 F 或 Cl 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SO_2R^{14} 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 OH 或 CF_3 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 CN 、 OH 、 CF_3 、 F 或 Cl 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、芳基、雜環基或

環烷基；其中各 R^{14} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基或OH取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基及環烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、OH或Cl取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；其中 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基取代；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH且 R^2 為苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH且 R^2 為經 OR^5 取代之苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 R^2 為未經取代之烷基或視情況經取代之烷基時， R^2 為 C_4 - C_6 烷基；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為N。

另一個實施例係關於具有式(Ic)之化合物，其包括

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(胺基甲基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(呋喃并[3,2-c]吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(苯甲基胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(噻吩并[3,2-c]吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(噻嗪-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二氮-1,4-苯并二氧雜環己烯-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氟苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-5-甲基-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(4-氟基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-3-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啉-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-氟-5-(三氟甲基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氯苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚

啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

5-硝基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

5-甲基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-噻吩基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-甲氧基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(3-甲氧基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(4-乙醯基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,3-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-噻吩基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-

1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

4-氯-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(6-胺基己基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

4-氯-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(苯甲基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(噻嗪-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異

吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(3-氟苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二羥基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-丙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-氟基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基-2-甲基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基-1H-吡唑-5-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯甲基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-({4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}胺基)-1H-吡唑-3-甲酸甲酯；

N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啶-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(5-氯吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吲哚-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,3-二氫-1,4-苯并二氧雜環己烯-6-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(5-甲氧基-1H-吲哚-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-氯苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-丙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[5-(三氟甲基)吡啶-2-基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[4-(二甲基胺基)苯基]乙基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(三氟甲氧基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟-4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-氟基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(異丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯

胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺；

4-氯-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-氯苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N²-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二
甲鹽胺；

N-{4-[(2-苯氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-羥基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3-氯苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(3S)-四氫呋喃-3-基]-1H-吡唑-4-基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(甲基硫基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-乙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[(三氟甲基)硫基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(2-氟苯基)吡咯啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(1H-咪唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3-氯苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲

哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二

氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(羥基甲基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基胺甲醯基)苯基]-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-異丙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二

氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲

哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,5-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異

吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(硫嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5,6-二氫咪唑并[1,5-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯甲基哌啶-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(5-乙醯胺基-2-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[3-(三氟甲基)苯基]乙基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-咪唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-1-(3-氟基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[苯甲基(2-羥基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氟基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-氟基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(吡啶-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(氟基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(環己基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[丁基(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-

2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(3,4-二氫異喹啉-2(1H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,3-二氫-1H-吡啶-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(苯基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(二乙基胺基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-苯基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

(1-{4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯甲醯基})

哌啶-4-基)胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({4-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(環己基甲基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(3-氯苯甲基)-1H-吡唑-4-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(二乙基胺甲鹽基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(2-羥基乙基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-羥基-6-甲基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(5,6-二氫[1,2,4]三唑并[4,3-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)

苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(5-氟吡啶-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基甲基)(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3,4,9-四氫-2H-β-吡啶-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(第三丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[4-(三氟甲基)苯基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二氟吡咯啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲

啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-苯甲基吡咯啉-3-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基哌啉-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-[4-(環戊基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-胺甲醯基哌啉-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-[4-(環丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-[4-(甲基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-[4-(戊-2-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-[4-(戊-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲

醯胺；

N-[4-(環丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-二氧戊環-2-基甲基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(4-氟苯基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[4-(三氟甲基)苯基]乙基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(第二丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(三氟甲基)吡啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-乙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[丁基(乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[異丁基(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-胺甲醯基苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-(三氟甲基)吡咯啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基吡咯啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[乙基(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,6-二甲基嗎啉-4-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,5-二甲基吡咯啉-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-[4-(丙-2-炔-1-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[異丙基(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[異丙基(丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-氰基乙基)(環丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-{4-[乙基(異丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-氟吡咯啉-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲鹽基}-N-異丙基-β-丙胺酸；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5,6-二甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(4-氯苯氧基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-苯基-1,3-噻唑-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

2-{[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]胺甲鹽基}異吲哚啉-5-甲酸甲酯；

2-{[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]胺甲鹽基}異吲哚啉-5-甲酸；

5-胺基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-(羥基甲基)-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-(胺基甲基)-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-[(2-羥基-2-甲基丙鹽基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-乙鹽胺基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-[(N,N-二甲基甘胺鹽基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-5-(1H-吡唑-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-5-(1H-吡唑-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-[(甲氧基乙鹽基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-[(甲基磺鹽基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-溴-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-氯苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4,4,4-三氟丁鹽基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-
2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲基戊醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-
2-甲醯胺；

N-(4-{[(苯甲氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-
2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[N-(2-呋喃甲醯基)甘胺醯基]胺基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-噻吩基)丁醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-側氧基-4-苯基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(N-苯甲醯基甘胺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯氧基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯
胺；

N-[4-(戊醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(己醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(庚醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(戊-4-烯醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸甲酯；

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-環戊基乙基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氮-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}-3,6-二氮吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯；

N-[4-(1,2,3,6-四氮吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1E)-5-苯基戊-1-烯-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基乙基)-1H-吡唑-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[6-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)吡啶-3-基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]吡啶-3-基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-苯基戊基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[2-氟-4-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺；

N-{2-氟-4-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]苯基}-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(異丙基磺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
 1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-苯甲醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-苯甲醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-
 2-甲醯胺；

N-{4-[4-(異丙基磺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-
 異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯基磺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(苯甲醯基胺基)吡咯啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(丁醯基胺基)吡咯啉-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}哌嗪-1-甲酸第三丁酯；

N-[4-(4-丙醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環丙基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(2-丁醯基-2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(2-異丁醯基-2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(2-苯甲醯基-2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[2-(3-甲基丁基)-2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(己氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-3-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[6-(4-氯苯氧基)己基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N,N'-己-1,6-二基雙(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺)；

N-(4-苯基丁基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

6-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]己酸乙酯；

N-己基-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-辛基-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(1-甲基-1H-吡啶-4-基)胺基]-6-側氧基己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[6-(甲基胺基)-6-側氧基己基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-側氧基-6-[(3-苯基丙基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-甲基丁基)胺基]-6-側氧基己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(5-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}吡啶-2-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]-1,3-噻唑-2-基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]-1,3-噻唑-2-基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-

甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4,5,6,7,8-六氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(8-氟-4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(嗎啉-4-基甲基)-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氯-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-4,5-二氮-3H-2,3-苯并二氮呋-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮異喹啉-4-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-側氧基-8-(三氟甲基)-3,4-二氮酞嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二甲基胺基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二乙基胺基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二甲基胺基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氮酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二乙基胺基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氮酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-側氧基-8-(三氟甲基)-3,4-二氮酞嗪-1-基]苯基}-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(1-甲基哌啶-4-基)氧基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氮酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-{[(3R)-3-氟吡咯啉-1-基]甲基}-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氮酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-{[(3S)-3-氟吡咯啉-1-基]甲基}-N-[4-(4-側氧基-3,4-二

氮酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(氮雜環丁烷-1-基甲基)-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氮酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氮-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}哌啶-1-甲酸第三丁酯；

N-[4-(5-丙基-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(3-甲基丁基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-苯甲基-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氮-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(5-氯吡啶-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基-4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-側氧基吡咯啶-1-基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基-2,3-二氫-1H-茛-1-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-羥基環丙基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{6-[(1,3-二氮-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]-1H-苯并咪唑-2-基}哌嗪-1-甲酸第三丁酯；

N-[2-(哌嗪-1-基)-1H-苯并咪唑-6-基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-乙烯基-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯甲醯基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(四氫呋喃-3-基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基丁基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(3-苯基丙基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(四氫呋喃-3-基甲基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-甲氧基乙基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-(2-羥基乙基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-3-基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-4-基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N⁵-(2-甲氧基乙基)-N²-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

N-(4-氟基苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(三氟甲基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-吡啶-2-基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基丁基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯

并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(四氫呋喃-3-基甲基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(4-吡啶-2-基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-吡啶-2-基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(1,2-二羥基乙基)-N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-5-氰基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-丁醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；及

N-[2-(4-乙醯基哌嗪-1-基)-1H-苯并咪唑-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-D-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(甲氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(乙氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-
基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯

基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-氯苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(二甲基胺基)苯甲醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[4-(二甲基胺基)苯甲醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-呋喃甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-噻吩基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡咯-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,5-二甲基-1H-吡咯-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫

吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,3-噻唑-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡唑-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3,5-二甲基-1,2-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異菸鹼醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(噻吩-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嘧啶-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-

基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-苯甲醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[6-(苯甲醯基胺基)己基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[(苯甲醯基胺基)甲基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(5-側氧基-L-脯胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(5-側氧基-D-脯胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(1-乙醯基哌啶-4-基)羰基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-乙醯胺基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[4-(甲基磺醯基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-丁醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-異丁醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-甲基丁醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3,3,3-三氟丙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(甲氧基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫呋喃-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫呋喃-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環戊基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環己基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-氯苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-氯苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-氟基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-氰基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[3-(二甲基胺基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[4-(二甲基胺基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3,4-二甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二

氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3,5-二甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二

氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)乙醯基]哌嗪-1-基}苯基)-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(1H-吡咯-2-基羧基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(1H-吡唑-5-基羧基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡啶-2-基羧基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡啶-3-基羧基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-異菸鹼醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(噻嗪-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡嗪-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(嘧啶-4-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(N,N-二甲基-β-丙胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-乙醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(1,3-噻唑-4-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(嗎啉-4-基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-苯基丁基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-2,3-二氫-1H-異吲哚-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)環己-3-烯-1-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)環己-3-烯-1-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)環己-3-烯-1-基]-5-(吡咯啶-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[1-(2-苯基乙基)-1H-吡唑-4-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N^5 -[2-(二甲基胺基)乙基]- N^2 -[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

5-(嗎啉-4-基羰基)-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(異丁氧基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ 5-溴-N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

4-{[(5-氟基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲酸甲酯；

N-(4-{(E)-[(苯甲氧基)亞胺基]甲基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲醯基}
苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯
基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3-胺基吡咯啶-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-
甲醯胺；

N-{6-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]吡啶-3-基}-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N²-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-
2,5-二甲醯胺；

N-[4-({苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}甲基)苯基]-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(1H-吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(1-甲基-1H-吡啶-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N²-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-N⁵-(2-甲氧基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

N²-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-N⁵-(2-羥基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

5-(胺基甲基)-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-(甲基硫基)丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S,3S)-1-羥基-3-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S,3R)-1,3-二羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基己-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基環戊基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S,2R)-2-羥基環戊基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-環己基-3-羥基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({(2R)-1-羥基-3-[(4-甲基苯甲基)硫基]丙-2-基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-第三丁基苯基)-2-羥基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-甲氧基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲氧基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二
氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(四氮-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二
氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[6-(苯甲鹽基胺基)己基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽
胺；

N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-
2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(吡啶-4-基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(6-{[(3S)-四氮呋喃-3-基甲基]胺甲鹽基}噻嗪-3-基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{6-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]噻嗪-3-基}-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-
5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[1'-(四氮呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氮-2,4'-聯吡啶-
5-基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{1'-[(2-甲氧基乙氧基)乙鹽基]-1',2',3',6'-四氮-2,4'-聯
吡啶-5-基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-(羥基甲基)-N-(4-苯基丁基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲
鹽胺；

5-(羥基甲基)-N-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]吡嗪-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-乙醯胺基己基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{(1E)-3-[苯甲基(甲基)胺基]丙-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-苯氧基哌啶-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3-苯氧基氮雜環丁烷-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[苯甲基(甲基)胺基]甲基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并

[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(5,6-二氫咪唑并[1,5-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲基-1H-1,2,3-三唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[2-(2-側氧基吡咯啶-1-基)乙基]-1H-1,2,3-三唑-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1-苯甲基哌啶-4-基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-苯基丙基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]-1H-1,2,3-三唑-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基-1H-1,2,3-三唑-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基甲基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲氧基丙基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]吡啶-2-基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫呋喃-3-基乙基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙基]胺基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-1'-異丁基-1',2',3',6'-四氮-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(1'-苯基-1',2',3',6'-四氮-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氮-2,4'-聯吡啶-

5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{1'-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[4-(甲基磺醯基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(乙氧基乙醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(環戊基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(2-羥基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-羥基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(4-羥基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(2-甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(4-甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(2-氟苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-氟苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-

2-甲醯胺；

N-{6-[(4-氯苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-

2-甲醯胺；

N-{6-[(2-氯苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-

2-甲醯胺；

N-{6-[(3-氯苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-

2-甲醯胺；

N-{6-[(4-氯苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-

2-甲醯胺；

N-{6-[(3-氯基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡

啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(4-氯基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡

啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[3-(二甲基胺基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-

2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[4-(二甲基胺基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-

2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[3-(三氟甲基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-

異吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[4-(三氟甲基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-

異吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[3-(三氟甲氧基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-

2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(2,3-二甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(2,4-二甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(2,5-二甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(苯基乙醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[(3-氟苯基)乙醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫呋喃-2-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(嗎啉-4-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[6-(苯甲醯基胺基)己基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

4-氟-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異

吡啶-2-甲酰胺；

5-氟-N-{6-[(吡啶-3-羧基)氨基]己基}-1,3-二氫-2H-異

吡啶-2-甲酰胺；

5-甲氧基-N-{6-[(吡啶-3-羧基)氨基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{6-[(吡啶-3-羧基)氨基]己基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

4-氟基-N-{6-[(吡啶-3-羧基)氨基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

5-甲基-N-{6-[(吡啶-3-羧基)氨基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

4-氯-N-{6-[(吡啶-3-羧基)氨基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

5-氟基-N-{6-[(吡啶-3-羧基)氨基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

5-氯-N-{6-[(吡啶-3-羧基)氨基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{6-[(吡啶-2-羧基)氨基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[1-(吡啶-2-羧基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-[1'-(四氫呋喃-2-羧基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-[1'-(四氫-2H-哌喃-4-羧基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯

吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯

吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡咯啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(7-側氧基-7-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺基}庚基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{7-側氧基-7-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺基]庚基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡

咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(氮雜環丁烷-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(異丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(環戊基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-噻吩基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[苯甲基(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡

咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(嗎啉-4-基甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-{[(3-甲基丁基)胺基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-羥基哌啶-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-氯苯甲醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]

苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啉-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1-甲基吡咯啉-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-胺基乙基)-1H-咪唑-1-基]羰基}苯基)-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-甲氧基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(4S)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲

醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(4R)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-2-側氧基乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-3-側氧基丙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氟基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-甲基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氟-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異

吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(6-溴-2-側氧基喹啉-1(2H)-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[6-(3-乙醯基苯基)-2-側氧基喹啉-1(2H)-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(嗎啉-4-基乙醯基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(嗎啉-4-基乙醯基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(2-{(4-氟苯基)[4-(吡啶-3-基)苯基]胺基}-1,3-噻唑-5-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2-苯基-1,3-噻唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(7-{苯基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-7-側氧基庚基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1,3-噻唑-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(4-甲基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1,3-二羥基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氮呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(2-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(四氮呋喃-2-基羰基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-四氮呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(乙基磺醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氮呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(2,3-二羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氮-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氰基-N-(4-{[2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氰基-N-{4-[(1-羥基-4-甲基戊-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氰基-N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氰基-N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氰基-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(5-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}吡啶-2-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[3.3]庚-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[3.4]辛-6-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氫雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氫雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氫雜螺[4.4]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.4]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-3-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-

二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(六氮-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(四氮-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(六氫呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羧基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-4-側氧基丁基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-苯基丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-乙醯基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(1-羥基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丁醯基胺基)苯基]-5-氟基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡咯啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-吡咯啶-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啉-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲氧基苯甲基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-6-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-5-氟-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-5-氟-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-5-氟-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(2-氧雜-7-氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(六氫-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(四氫-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(六氫呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[6-(3-乙醯基苯基)-4-(3-羥基丙基)-2-側氧基喹啉-1(2H)-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-(乙醯胺基甲基)-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[2-(2-氯苯甲基)-1,3-噻唑-4-基]-2-噻吩基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-氯苯基)丁基]-5-(羥基甲基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(3R)-1-異丁醯基吡咯啶-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[(3R)-1-苯甲醯基吡咯啶-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(四氫呋喃-3-基羰基)吡咯啶-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(甲基磺醯基)吡咯啶-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮-2H-哌喃-4-基甲基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并

[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(2-羥基丙-2-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲基}胺基甲酸第三丁酯；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(甲氧基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-{[(四氫呋喃-2-基甲基)胺基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-甲氧基哌啶-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-{[4-(2-甲氧基乙基)哌嗪-1-基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(嗎啉-4-基)環戊基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-戊醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡

咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丁醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(1-乙醯基哌啶-4-基)氧基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(1-異丁醯基哌啶-4-基)氧基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(4,4,4-三氟丁醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環丙基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環丁基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環戊基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

(2-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}乙基)胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙鹽基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙鹽基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙鹽基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(4,4,4-三氟丁鹽基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-苯基丙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(苯基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-甲氧基苯基)乙醯基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯甲醯基吡咯啉-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-乙氧基丙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2-甲基環丙基)羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(1-甲基環丙基)羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基吡咯啉-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(4,4,4-三氟丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙氧基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基哌啶-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

[(1-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}氮雜環丁烷-3-基)甲基]胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(嗎啉-4-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己-1-烯-1-

基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,3-二甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}

苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3-二甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(三環[3.3.1.1~3,7~]癸-1-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-甲氧基環己基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[4-(乙醯基胺基)苯基]磺醯基}胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-丙基苯基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(丁基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1S,4R)-7,7-二甲基-2-側氧基雙環[2.2.1]庚-1-基]甲基}磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(苯甲基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-氟苯基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(噻吩-2-基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氫雜螺[4.4]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氫雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氫雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,9-二氫雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氫雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(六氫-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(四氫-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(六氫呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(N,N-二甲基甘胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-2-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環己基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]胺基}環

己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(4,4-二氟環己基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(哌啶-1-基磺醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4,4-二氟環己基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N α -(4-{[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲鹽基)-D-苯基丙胺鹽胺；

N-(4-{[2-(乙鹽基胺基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N α -(4-{[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲鹽基)-L-苯基丙胺鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[3-(甲基胺甲鹽基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-氯-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-胺甲鹽基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

Na-{4-[(5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-基羰基)胺基]苯甲醯基}-L-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-(4,5,6,7-四氫-1H-吡唑-5-基胺甲醯基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-氰基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[苯甲基(甲基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-胺基-1-側氧基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(環戊基胺甲鹽基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氟基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-氟基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二
氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-
5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氮-6H-
吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氮-6H-
吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-胺基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯
并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯
并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氮-
6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯并
[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氰基環丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯
并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-
5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(4-甲基-1,3-噻唑-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-
5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯并
[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲醯基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(1-氰基乙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

1-{4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}氮雜環丁烷-3-甲酸甲酯；

N-(4-{3-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(苯甲基胺甲醯基)氮雜環丁烷-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(環戊基胺甲醯基)氮雜環丁烷-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(環戊基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-2-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡咯啶-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4,4-二氟環己基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-氰基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(6-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({2-[(二甲基胺基)甲基]苯甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(1,3-噁唑-2-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-氟苯甲基)(3-甲基丁鹽基)胺基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(9-氟-5-側氧基-2,3,3a,4,4a,5-六氫-6H-呋喃并[2',3':2,3]環丁并[1,2-c]喹啉-6-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[7-氟-1-(2-羥基乙基)-3-側氧基-1,3-二氫環丁并[c]

喹啉-4(2H)-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲
 醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧
 基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-2-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯
 基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-
 1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-
 1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基哌啶-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡
 咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丁醯基哌啶-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡
 咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-
 二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-呋喃-2-基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-呋喃-4-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,2-二氟乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

Na-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲鹽基}-L-苯基丙胺鹽胺；

N-(4-{[2-(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(噻吩-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(乙鹽基胺基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-4-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(嘧啶-4-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(甲基胺甲鹽基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4,4-二氟環己基)羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(丙-2-基氧基)乙醯基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4,4,4-三氟丁醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-乙醯基哌啶-4-基)羰基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{7-側氧基-7-[(3-苯基丙基)胺基]庚基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(雙環[2.2.1]庚-2-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-噻唑-5-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-側氧基-4,5,6,7-四氫-1-苯并呋喃-3-基)羰基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(3-甲基丁醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(4-甲基戊醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(乙氧基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(環戊基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(環戊基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[2-(苯甲醯基胺基)乙基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫-2H-呋喃-4-基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羧基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羧基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丙醯基氮雜環丁烷-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-乙基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(戊-4-炔醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基羧基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-3-基羧基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(噻吩-3-基羧基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1H-吡咯-2-基羧基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嘧啶-4-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(5-甲基吡嗪-2-基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(N,N-二甲基甘胺鹽基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(N,N-二甲基-β-丙胺鹽基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(吡咯啶-1-基乙鹽基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(吡咯啶-1-基)丙鹽基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(哌啶-1-基)丙鹽基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙鹽基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙鹽基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-環丙基乙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-環戊基乙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3-二甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丁基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(苯基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-氯苯基)磺醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丙-2-基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(苯甲基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-
 2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(噻吩-2-基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-
 二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-2-甲基丁醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-
 二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}氧基)苯
 基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}氧基)苯
 基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4,4-二氟環己基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)
 苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(5-側氧基-D-脯胺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-
 1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-
 二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基戊醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-乙基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1H-吡咯-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1,2-噁唑-5-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(吡啶-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(噻吩-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(吡嗪-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嘧啶-4-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(5-甲基吡嗪-2-基)羰基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

反-3-[(1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]環丁烷甲酸苯甲酯；

N-[4-(4-{[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯甲醯基胺基)環己-1-烯-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-2-甲基丁醯基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(3-甲基丁醯基)胺基]氧雜環丁烷-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

4-({4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}磺醯基)哌啶-1-甲酸第三丁酯；

N-{4-[4-(丙基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-

吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(1,4-二噁烷-2-基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環戊基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫-2H-哌喃-4-基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(嗎啉-4-基羰基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環丙基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(丁-2-基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-

基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫呋喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{(4R)-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{(4S)-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基氮雜環丁烷-3-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基氮雜環丁烷-3-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[反-3-(苯甲基胺甲醯基)環丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{反-3-[(2-苯基乙基)胺甲醯基]環丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{反-3-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]環丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲基-1,3-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2E)-3-(呋喃-2-基)丙-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,3-噁唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3,3,3-三氟丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,5-二甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲氧基環己基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,3-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,2-二氟環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(第三丁氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-乙氧基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-羥基-3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(1H-吡咯-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲基丙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1-甲基脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-羥基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-{[1-(甲氧基甲基)環丙基]羰基}-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(甲基磺醯基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-乙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2E)-4-甲基戊-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲氧基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊-1-烯-1-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(噻吩-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環己基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,2-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(甲氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,2-二甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲基己醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,2-二甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丁基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(哌啶-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[2-(吡咯啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫

吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(順-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(順-4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(順-4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻吩-3-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-1-(3-甲基丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-1-(環丁基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3R)-1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3R)-1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-1-(環丙基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(3-甲基丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(環丁基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3S)-1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3S)-1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(環丙基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(環戊基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(雙環[2.2.1]庚-2-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二
氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(環己基羰基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氮-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(環己基羰基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氮-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二
氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二
氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-
基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-
基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯
基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}
苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環己基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

另一個實施例係關於如下式(Ic)化合物：

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接

受之鹽。

另一個實施例係關於如下式(Ic)化合物：

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

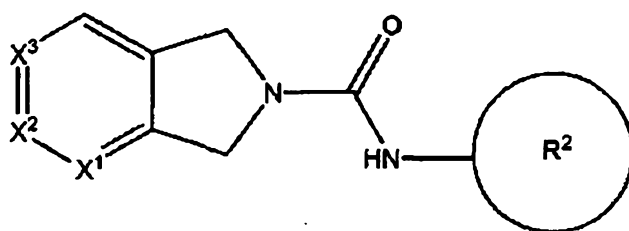
N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

式(IIc)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(IIc)化合物，



(IIIc);

及其醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 、 X^2 、 X^3 如本文關於式(Ic)所述；且 R^2 為苯基、雜環基、環烷基或環烯基；其中 R^2 苯基、雜環基、環烷基及環烯基視情況如本文關於式(Ic)中 R^2 上之取代基所述經取代。

在式(IIc)之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、OH、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$ 或 $C(O)NH_2$ ；

R^2 為苯基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^2 苯基視情況在對位經1個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)R^5$ 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 $OC(O)R^5$ 、 $OC(O)OR^5$ 、 NH_2 、 NHR^5 、 $N(R^5)_2$ 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NR^5C(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $NR^5S(O)_2R^5$ 、 $NHC(O)OR^5$ 、 $NR^5C(O)OR^5$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、

NHC(O)NHR^5 、 $\text{NHC(O)N(R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)NHR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、
 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^5 、 $\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 CHNOR^5 、 C(O)NHOH 、
 C(O)NHOR^5 、 $\text{C(O)NH}\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{C(O)NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 SO_2NH_2 、
 SO_2NHR^5 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 N_3 、
 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、Br或I取代；其中
 各 R^2 苯基視情況另外經1個F取代；其中各 R^2 雜環基、環烷
 基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、
 SR^5 、 S(O)R^5 、 SO_2R^5 、 C(O)R^5 、 CO(O)R^5 、 OC(O)R^5 、
 OC(O)OR^5 、 NH_2 、 NHR^5 、 $\text{N(R}^5)_2$ 、 NHC(O)R^5 、
 $\text{NR}^5\text{C(O)R}^5$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{S(O)}_2\text{R}^5$ 、 NHC(O)OR^5 、
 $\text{NR}^5\text{C(O)OR}^5$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^5 、 $\text{NHC(O)N(R}^5)_2$ 、
 $\text{NR}^5\text{C(O)NHR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^5 、
 $\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^5 、 $\text{C(O)NH}\text{SO}_2\text{R}^5$ 、
 $\text{C(O)NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$ 、
 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 N_3 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、
 OCF_2CF_3 、F、Cl、Br或I取代；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基
 或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3
 或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 S(O)R^6 、 SO_2R^6 、
 C(O)R^6 、 CO(O)R^6 、 OC(O)R^6 、 OC(O)OR^6 、 NH_2 、 NHR^6 、
 $\text{N(R}^6)_2$ 、 NHC(O)R^6 、 $\text{NR}^6\text{C(O)R}^6$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{S(O)}_2\text{R}^6$ 、
 NHC(O)OR^6 、 $\text{NR}^6\text{C(O)OR}^6$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^6 、
 $\text{NHC(O)N(R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)NHR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NH_2 、
 C(O)NHR^6 、 $\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^6 、

$\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{C(O)NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^6)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 S(O)R^9 、 SO_2R^9 、 C(O)R^9 、 CO(O)R^9 、 OC(O)R^9 、 OC(O)OR^9 、 NH_2 、 NHR^9 、 $\text{N(R}^9)_2$ 、 NHC(O)R^9 、 $\text{NR}^9\text{C(O)R}^9$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{S(O)}_2\text{R}^9$ 、 NHC(O)OR^9 、 $\text{NR}^9\text{C(O)OR}^9$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^9 、 $\text{NHC(O)N(R}^9)_2$ 、 $\text{NR}^9\text{C(O)NHR}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^9 、 $\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^9 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^9$ 、 $\text{C(O)NR}^9\text{SO}_2\text{R}^9$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^9)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 S(O)R^{10} 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $\text{N(R}^{10})_2$ 、 C(O)R^{10} 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{10} 、 $\text{C(O)N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)R^{10} 、 $\text{NR}^{10}\text{C(O)R}^{10}$ 、 $\text{NHSO}_2\text{R}^{10}$ 、 NHC(O)OR^{10} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{10} 、 OH 、 (O) 、 C(O)OH 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、OH、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 $OC(O)R^{13}$ 、 $OC(O)OR^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)R^{13}$ 、 $NHS(O)_2R^{13}$ 、 $NR^{13}S(O)_2R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)OR^{13}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{13}$ 、 $NHC(O)N(R^{13})_2$ 、 $NR^{13}C(O)NHR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{13}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{13}$ 、 $C(O)NR^{13}SO_2R^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{13} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫嘧啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中

各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、 $NR^{14}S(O)_2R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)OR^{14}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{14}$ 、 $NHC(O)N(R^{14})_2$ 、 $NR^{14}C(O)NHR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{14}$ 、 $C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{14}$ 、 $C(O)NH SO_2R^{14}$ 、 $C(O)NR^{14}SO_2R^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{14} 、 $SO_2N(R^{14})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并 [3,2-c] 吡啶基、呋喃并 [3,2-c] 吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫脲喃-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、呋喃基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、 $NR^{15}C(O)NHR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{15}$ 、 $C(O)NH SO_2R^{15}$ 、 $C(O)NR^{15}SO_2R^{15}$ 、

SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；其中 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH 且 R^2 為苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH 且 R^2 為經 OR^5 取代之苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為 N 。

在式(IIc)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或 X^1 及

X^3 為 CH，且 X^2 為 N；或 X^1 及 X^3 為 CH，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為 CH，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為 CH，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為 CH，且 X^1 及 X^3 為 N；或 X^2 及 X^3 為 CH，且 X^1 為 N；或 X^1 為 CH， X^2 為 N，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為 N，且 X^3 為 CH；或 X^1 為 N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 CH；或 X^1 為 N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 N。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N。

在式 (IIc) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨

立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式

(IIc)之另一個實施例中， R^1 為Br。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為CN。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IIc)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、

$N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且

X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視

情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(IIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(IIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式(IIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式(IIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且

R^1 為 CN。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；

R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (IIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式

(IIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(IIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(IIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(IIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(IIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OR$ 。在式(IIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

另一個實施例係關於具有式(IIc)之化合物，其包括

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(胺基甲基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(呋喃并[3,2-c]吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(苯甲基胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(噻吩并[3,2-c]吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(噻嗪-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二氫-1,4-苯并二氧雜環己烯-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氟苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯
基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-5-甲基-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(4-氟基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氟苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,2-二甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啉-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯
基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-氟-5-(三氟甲基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

5-甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-氯苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-硝基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-
2-甲鹽胺；

5-甲基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-噻吩基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-苯基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(2-甲氧基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(3-甲氧基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(4-乙醯基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,3-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-噻吩基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異
吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氯-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(6-胺基己基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

4-氯-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(苯甲基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(噻嗪-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(3-氟苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,4-二羥基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-丙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(2-氰基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基-2-甲基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基-1H-吡啶-5-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-苯甲基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-({4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲鹽基}胺基)-1H-吲唑-3-甲酸甲酯；

N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啉-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(5-氯吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1H-吲哚-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(2,3-二氫-1,4-苯并二氧雜環己烯-6-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(2-氟苯甲鹽基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(5-甲氧基-1H-吡啶-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2-氯苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-丙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({4-[5-(三氟甲基)吡啶-2-基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({2-[4-(二甲基胺基)苯基]乙基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(三氟甲氧基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-氟基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-氟-4-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,3-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2-氟苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(異丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲
鹽胺；

N-(4-{[2-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)乙基]胺甲鹽
基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽
胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺；

4-氯-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-氟苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N²-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

N-{4-[(2-苯氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-羥基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3-氟苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({1-[(3S)-四氫呋喃-3-基]-1H-吡唑-4-基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(甲基硫基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-乙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[(三氟甲基)硫基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(2-氟苯基)吡咯啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(1H-咪唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3-氟苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(羥基甲基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基胺甲鹽基)苯基]-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-異丙基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-羥基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,5-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[甲基(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(硫嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲
鹽胺；

N-[4-(5,6-二氮咪唑并[1,5-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(2-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯甲基哌啶-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
 哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
 哚-2-甲醯胺；

○ N-{4-[(5-乙醯胺基-2-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[3-(三氟甲基)苯基]乙基}胺甲醯基)苯基]-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[2-(1H-咪唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-
 異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-1-(3-氟基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[苯甲基(2-羥基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氯基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-氯基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(吡啶-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(氯基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(環己基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[丁基(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3,4-二氫異喹啉-2(1H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,3-二氫-1H-吡啶-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(苯基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(二乙基胺基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-苯基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

(1-{4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}哌啶-4-基)胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(環己基甲基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-氯苯基)-1H-吡唑-4-基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{[3-(二乙基胺甲酰基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{[4-(2-羥基乙基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[(2-羥基-6-甲基苯基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-[4-(5,6-二氫[1,2,4]三唑并[4,3-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-[4-(丙基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[(5-氟吡啶-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環丙基甲基)(丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-
 異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(1,3,4,9-四氫-2H-β-吡啶-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-[4-(第三丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-
 甲鹽胺；

N-[4-({4-[4-(三氟甲基)苯基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二氟吡咯啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-{4-[(2-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
 哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(3S)-1-苯甲基吡咯啶-3-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-羥基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
 哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-氟苯基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-[4-(環戊基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[(4-胺甲酰基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-[4-(環丙基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-[4-(甲基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-[4-(戊-2-基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-[4-(戊-3-基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-[4-(環丁基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[(1,3-二氧戊環-2-基甲基)(甲基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{[1-(4-氟苯基)-1H-吡唑-4-基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[4-(三氟甲基)苯基]乙基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(第二丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-乙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[丁基(乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[異丁基(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-胺甲醯基苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-(三氟甲基)吡咯啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基吡咯啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[乙基(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,6-二甲基嗎啉-4-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,5-二甲基吡咯啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(丙-2-炔-1-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[異丙基(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[異丙基(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氟基乙基)(環丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[乙基(異丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟吡咯啉-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}-N-異丙基-β-丙胺酸；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5,6-二甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(4-氟苯氧基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯基-1,3-噻唑-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

2-{[4-(丙基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}異吲哚啉-5-甲酸甲酯；

2-{[4-(丙基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}異吲哚啉-5-甲酸；

5-胺基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(胺基甲基)-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-乙醯胺基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(N,N-二甲基甘胺醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-(1H-吡唑-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-(1H-吡唑-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(甲氧基乙醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(甲基磺醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-溴-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氯苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4,4,4-三氯丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲基戊醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(苯甲氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲

哌-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[N-(2-呋喃甲醯基)甘胺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-噻吩基)丁醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-側氧基-4-苯基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(N-苯甲醯基甘胺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯氧基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(戊醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(己醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(庚醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(戊-4-烯醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲

醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸甲酯；

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-環戊基乙基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}-3,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯；

N-[4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1E)-5-苯基戊-1-烯-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基乙基)-1H-吡唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[6-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)吡啶-3-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-苯基戊基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[2-氟-4-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{2-氟-4-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(異丙基磺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-苯甲醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-苯甲醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-
2-甲醯胺；

N-{4-[4-(異丙基磺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯基磺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異
吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(苯甲醯基胺基)吡咯啶-1-基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(丁醯基胺基)吡咯啶-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氮-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}哌嗪-1-
甲酸第三丁酯；

N-[4-(4-丙醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-
甲醯胺；

N-{4-[4-(環丙基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異

吡啶-2-甲醯胺；

N-(2-丁醯基-2,3-二氫-1H-異吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(2-異丁醯基-2,3-二氫-1H-異吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(2-苯甲醯基-2,3-二氫-1H-異吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[2-(3-甲基丁基)-2,3-二氫-1H-異吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(己氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(5-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}吡啶-2-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]-1,3-噻唑-2-基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]-1,3-噻唑-2-基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4,5,6,7,8-六氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(8-氟-4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-5-(吡咯啶-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(嗎啉-4-基甲基)-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氯-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-4,5-二氫-3H-2,3-苯并二氮呋-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-側氧基-8-(三氟甲基)-3,4-二氫酞嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二甲基胺基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二乙基胺基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二甲基胺基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二乙基胺基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-側氧基-8-(三氟甲基)-3,4-二氫酞嗪-1-基]苯基}-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(1-甲基哌啶-4-基)氧基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-{[(3R)-3-氟吡咯啉-1-基]甲基}-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-{[(3S)-3-氟吡咯啉-1-基]甲基}-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(氮雜環丁烷-1-基甲基)-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}哌啉-1-甲酸第三丁酯；

N-[4-(5-丙基-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(哌啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基哌啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(3-甲基丁基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-苯甲基-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(5-氯吡啶-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基-4-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(2-側氧基吡咯啶-1-基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基-2,3-二氫-1H-茛-1-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-羥基環丙基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫-2H-呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫-2H-呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

4-{6-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]-1H-苯并咪唑-2-基}哌嗪-1-甲酸第三丁酯；

N-[2-(哌嗪-1-基)-1H-苯并咪唑-6-基]-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-乙烯基-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯甲醯基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(四氫呋喃-3-基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基丁基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(3-苯基丙基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(四氫呋喃-3-基甲基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-甲氧基乙基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-(2-羥基乙基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-3-基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-4-基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N⁵-(2-甲氧基乙基)-N²-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

N-(4-氟基苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(三氟甲基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-吡啶-2-基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基丁基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(四氫呋喃-3-基甲基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(4-吡啶-2-基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-吡啶-2-基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(1,2-二羥基乙基)-N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-丁醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；及

N-[2-(4-乙醯基哌嗪-1-基)-1H-苯并咪唑-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-D-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(甲氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(乙氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-氟苯甲酰基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[1-(3-氟苯甲酰基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[1-(4-氟苯甲酰基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[1-(4-氯苯甲酰基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酰胺；

○ N-(4-{1-[3-(二甲基胺基)苯甲酰基]-1,2,3,6-四氢吡啶-4-
基}苯基)-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{1-[4-(二甲基胺基)苯甲酰基]-1,2,3,6-四氢吡啶-4-
基}苯基)-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[1-(3-呋喃甲酰基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[1-(3-噻吩基羰基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酰胺；

○ N-{4-[1-(1H-吡咯-2-基羰基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{1-[(2,5-二甲基-1H-吡咯-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氢
吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[1-(1,3-噻唑-4-基羰基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[1-(1H-吡唑-4-基羰基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氢-2H-异吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{1-[(3,5-二甲基-1,2-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異菸鹼醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(噻嗪-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嘧啶-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-苯甲醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[6-(苯甲醯基胺基)己基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[(苯甲醯基胺基)甲基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(5-側氧基-L-脯胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(5-側氧基-D-脯胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(1-乙醯基哌啶-4-基)羰基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-乙醯胺基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[4-(甲基磺醯基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-丁醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-異丁醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-甲基丁醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3,3,3-三氟丙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(甲氧基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫呋喃-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫呋喃-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環戊基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環己基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-氯苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-氯苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-氟基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-氟基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[3-(二甲基胺基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[4-(二甲基胺基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3,4-二甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3,5-二甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)乙醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(1H-吡咯-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(1H-吡唑-5-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡啶-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡啶-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-異菸鹼醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(噻嗪-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡嗪-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(嘧啶-4-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(N,N-二甲基-β-丙胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-乙醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(1,3-噻唑-4-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(嗎啉-4-基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-2,3-二氫-1H-異吲哚-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)環己-3-烯-1-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)環己-3-烯-1-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)環己-3-烯-1-基]-5-(吡咯啶-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1-(2-苯基乙基)-1H-吡唑-4-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N⁵-[2-(二甲基胺基)乙基]-N²-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

5-(嗎啉-4-基羰基)-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(異丁氧基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-溴-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{[(5-氟基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲酸甲酯；

N-(4-{(E)-[(苯甲氧基)亞胺基]甲基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(3-胺基吡咯啶-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{6-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{6-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{6-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N²-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

N-[4-({苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}甲基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(1H-吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(1-甲基-1H-吡啶-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N^2 -{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}- N^5 -(2-甲氧基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

N^2 -{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}- N^5 -(2-羥基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

5-(胺基甲基)-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-(甲基硫基)丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S,3S)-1-羥基-3-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S,3R)-1,3-二羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基己-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基環戊基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2R)-2-羥基環戊基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-環己基-3-羥基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({(2R)-1-羥基-3-[(4-甲基苯甲基)硫基]丙-2-基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-第三丁基苯基)-2-羥基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-甲氧基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲氧基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(吡啶-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-
 1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(環戊基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-
 異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-
 5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-
 5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯
 吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]吡嗪-2-基}-1,3-二氫-2H-
 異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-
 基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{(1E)-3-[苯甲基(甲基)胺基]丙-1-烯-1-基}苯基)-
 1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-苯氧基哌啶-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-
 甲醯胺；

N-[4-(3-苯氧基氮雜環丁烷-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[苯甲基(甲基)胺基]甲基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲醯基]苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(5,6-二氫咪唑并[1,5-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲基-1H-1,2,3-三唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[2-(2-側氧基吡咯啶-1-基)乙基]-1H-1,2,3-三唑-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1-苯甲基哌啶-4-基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-苯基丙基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]-1H-1,2,3-三唑-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基-1H-1,2,3-三唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基甲基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲氧基丙基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○ N-(1'-苯甲醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{1'-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫呋喃-2-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(嗎啉-4-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啉-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啉-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡咯啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(氮雜環丁烷-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(異丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(環戊基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-噻吩基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○ N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[苯甲基(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○ N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(嗎啉-4-基甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-{[(3-甲基丁基)胺基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-羥基哌啶-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-胺基乙基)-1H-咪唑-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-甲氧基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(4S)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(4R)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-([3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基)胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-2-側氧基乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-3-側氧基丙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氟基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-甲基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氟-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(嗎啉-4-基乙醯基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(嗎啉-4-基乙醯基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(2-{(4-氟苯基)[4-(吡啶-3-基)苯基]胺基}-1,3-噻唑-5-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2-苯基-1,3-噻唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1,3-噻唑-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(4-甲基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1,3-二羥基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯
 基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯
 基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ 5-氟基-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯
 基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-
 1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ 5-氟基-N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(2-呋喃甲鹽基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-
 1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(四氫呋喃-2-基羰基)哌嗪-1-基]羰基}
 苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(乙基磺鹽基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(2,3-二羥基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(1-羥基-4-甲基戊-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(5-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}吡啶-2-基)-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[3.3]庚-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[3.4]辛-6-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-[4-(2,7-二氫雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氫雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氫雜螺[4.4]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-[4-(2,7-二氫雜螺[4.4]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氫雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氫雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-3-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(六氮-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(四氮-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-[4-(六氮呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-4-側氧基丁基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}乙基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-乙醯基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(1-羥基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丁鹽基胺基)苯基]-5-氟基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡咯啶-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(3S)-吡咯啶-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(3-甲氧基苯甲基)磺鹽基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[3.4]辛-6-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(2,7-二氫雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-5-氟-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-5-氟-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-5-氟-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯
基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯
基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)
苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(2-氧雜-7-氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(六氮-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(四氮-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(六氮呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-(乙醯胺基甲基)-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[2-(2-氯苯甲基)-1,3-噻唑-4-基]-2-噻吩基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(3R)-1-異丁醯基吡咯啶-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[(3R)-1-苯甲醯基吡咯啶-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(四氫呋喃-3-基羰基)吡咯啶-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(甲基磺醯基)吡咯啉-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(2-羥基丙-2-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲基}胺基甲酸第三丁酯；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(甲氧基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-{[(四氫呋喃-2-基甲基)胺基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-甲氧基哌啶-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-{[4-(2-甲氧基乙基)哌嗪-1-基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(嗎啉-4-基)環戊基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-[(1-戊醯基哌啶-4-基)氧基]苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丁醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(1-乙醯基哌啶-4-基)氧基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(1-異丁醯基哌啶-4-基)氧基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(4,4,4-三氟丁醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環丙基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環丁基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環戊基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-(6-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

(2-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}乙基)胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯

胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-

基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(4,4,4-三氟丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-苯基丙醯基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(苯基乙醯基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-甲氧基苯基)乙醯基]吡咯啶-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯甲醯基吡咯啉-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-乙氧基丙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2-甲基環丙基)羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(1-甲基環丙基)羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基吡咯啉-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氮-2H-

吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(4,4,4-三氟丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙氧基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基哌啶-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

[(1-{4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}氮雜環丁烷-3-基)甲基]胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(嗎啉-4-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,3-二甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯
基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}
苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]
氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯
基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-
1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-
1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯
基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3-二甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯
基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(三環[3.3.1.1~3,7~]癸-1-基乙醯基)氮雜環丁
烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲

醯胺；

N-[4-({1-[(4-甲氧基環己基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[4-(乙醯基胺基)苯基]磺醯基}胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-丙基苯基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(丁基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[({(1S,4R)-7,7-二甲基-2-側氧基雙環[2.2.1]庚-1-基]甲基}磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(苯甲基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-氟苯基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(噻吩-2-基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(六氮-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(四氮-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(六氮呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮呋喃-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮-2H-呋喃-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(N,N-二甲基甘胺醯基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-2-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環己基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(4,4-二氟環己基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(哌啶-1-基磺醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4,4-二氟環己基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲醯基})

苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

Na-(4-{[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲醯基)-D-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[2-(乙醯基胺基)苯基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-

1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

Na-(4-{[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基)羰基]胺基}苯甲醯基)-L-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(甲基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-氟-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺甲醯基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-

吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

Na-{4-[(5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-基羰基)胺基]苯甲醯基}-L-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯

基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-(4,5,6,7-四氫-1H-吡唑-5-基胺甲醯基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-氟基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[苯甲基(甲基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲醯基}苯

基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-胺基-1-側氧基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(環戊基胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-氟基乙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-氟基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氮-

6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲酰基]苯基}-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲酰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲酰基]苯基}-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲酰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲酰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲酰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-{4-[(3S)-四氢呋喃-3-基胺甲酰基]苯基}-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲酰基]苯基}-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-{4-[(4-胺基苯甲基)胺甲酰基]苯基}-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲酰基]苯基}-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲酰基]苯基}-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲酰基]苯基}-5,7-二氢-6H-吡咯并

[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(1-氰基環丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(4-甲基-1,3-噻唑-2-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-

二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲醯基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-

6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(1-氰基乙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

1-{4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}氮雜環丁烷-3-甲酸甲酯；

N-(4-{3-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯

基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(苯甲基胺甲醯基)氮雜環丁烷-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(環戊基胺甲醯基)氮雜環丁烷-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(環戊基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-2-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡咯啶-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-

1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4,4-二氟環己基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-氰基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[(二甲基胺基)甲基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3-噁唑-2-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡

啉-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-2-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基哌啶-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丁醯基哌啶-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-2-基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯

基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,2-二氟乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

Na-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}-L-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[2-(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(噻吩-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(乙醯基胺基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-4-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(嘧啶-4-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(甲基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-乙醯基哌啶-4-基)羰基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(雙環[2.2.1]庚-2-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-噻唑-5-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-側氧基-4,5,6,7-四氫-1-苯并呋喃-3-基)羰基]胺

基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(3-甲基丁醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(4-甲基戊醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(乙氧基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(環戊基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(環戊基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[2-(苯甲醯基胺基)乙基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫-2H-呋喃-4-基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]吡啶-4-基}苯基)-1,3-

二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丙醯基氮雜環丁烷-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-乙基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(戊-4-炔醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-3-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(噻吩-3-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1H-吡咯-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嘧啶-4-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(5-甲基吡嗪-2-基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧

基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(N,N-二甲基甘胺醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(N,N-二甲基-β-丙胺醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(吡咯啉-1-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(吡咯啉-1-基)丙醯基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-環丙基乙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-環戊基乙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3-二甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丁基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(苯基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-氟苯基)磺醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丙-2-基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(苯甲基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(噻吩-2-基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-2-甲基丁醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4,4-二氟環己基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(5-側氧基-D-脯胺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基戊醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-乙基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1H-吡咯-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1,2-噁唑-5-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-

二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(吡啶-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(噻吩-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(吡啶-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嘧啶-4-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(5-甲基吡啶-2-基)羰基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(4-甲基哌啶-1-基)丙醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

反-3-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]環丁烷甲酸苯甲酯；

N-[4-(4-{[(4-甲基哌啶-1-基)乙醯基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯甲醯基胺基)環己-1-烯-1-基]苯基}-1,3-二氫-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫呋喃-4-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-2-甲基丁醯基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(3-甲基丁醯基)胺基]氧雜環丁烷-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

4-({4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}磺醯基)哌啶-1-甲酸第三丁酯；

N-{4-[4-(丙基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(1,4-二噁烷-2-基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯
基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環戊基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫-2H-哌喃-4-基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○ N-{4-[4-(嗎啉-4-基羰基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-
吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}
苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環丙基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯
基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○ N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯
基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(丁-2-基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-
基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-
基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫呋喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]呋喃-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]呋喃-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]呋喃-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{(4R)-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{(4S)-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[反-3-(苯甲基胺甲醯基)環丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{反-3-[(2-苯基乙基)胺甲醯基]環丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{反-3-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]環丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲基-1,3-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2E)-3-(呋喃-2-基)丙-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫

吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,3-噁唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3,3,3-三氟丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,5-二甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲氧基環己基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,3-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,2-二氟環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(第三丁氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-乙氧基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-羥基-3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]

苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(1H-吡咯-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲基丙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1-甲基脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-羥基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-{[1-(甲氧基甲基)環丙基]羰基}-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(甲基磺醯基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-乙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2E)-4-甲基戊-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲氧基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊-1-烯-1-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(噻吩-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環己基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,2-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(甲氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-

1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,2-二甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲基己醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,2-二甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丁基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-[1-(哌啶-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[2-(吡咯啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(順-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(順-4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(順-4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-1-(3-甲基丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-1-(環丁基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3R)-1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3R)-1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-1-(環丙基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(3-甲基丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(環丁基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3S)-1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-((3S)-1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(環丙基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(環戊基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(雙環[2.2.1]庚-2-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(環己基羰基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(環己基羰基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

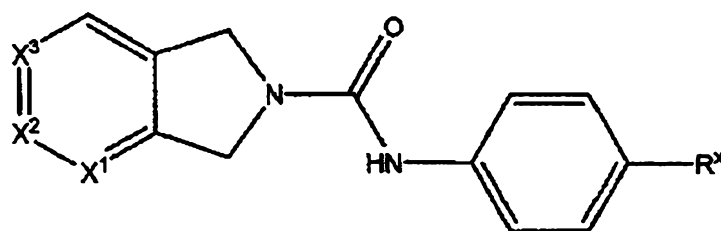
N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環己基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

式(IIIc)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(IIIc)化合物，



(IIIc);

及其醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 、 X^2 、 X^3 如本文關於式(Ic)所述；且 R^x 如本文關於式(Ic)中當 R^2 為苯基時在對位上之取代基所述。

在式(IIIc)之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、OH、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$ 或 $C(O)NH_2$ ；

R^x 為 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)R^5$ 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、

CO(O)R^5 、 OC(O)R^5 、 OC(O)OR^5 、 NH_2 、 NHR^5 、 $\text{N(R}^5)_2$ 、
 NHC(O)R^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)R}^5$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{S(O)}_2\text{R}^5$ 、
 NHC(O)OR^5 、 $\text{NR}^5\text{C(O)OR}^5$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^5 、
 $\text{NHC(O)N(R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)NHR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 C(O)NH_2 、
 C(O)NHR^5 、 $\text{C(O)N(R}^5)_2$ 、 CHNOR^5 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^5 、
 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{C(O)NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、
 $\text{SO}_2\text{N(R}^5)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、
 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 Br 或 I ；

○ R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 S(O)R^6 、 SO_2R^6 、 C(O)R^6 、 CO(O)R^6 、 OC(O)R^6 、 OC(O)OR^6 、 NH_2 、 NHR^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 、 NHC(O)R^6 、 $\text{NR}^6\text{C(O)R}^6$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{S(O)}_2\text{R}^6$ 、 NHC(O)OR^6 、 $\text{NR}^6\text{C(O)OR}^6$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^6 、 $\text{NHC(O)N(R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)NHR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^6 、 $\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^6 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{C(O)NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^6)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 S(O)R^9 、 SO_2R^9 、 C(O)R^9 、 CO(O)R^9 、 OC(O)R^9 、

OC(O)OR^9 、 NH_2 、 NHR^9 、 $\text{N(R}^9)_2$ 、 NHC(O)R^9 、
 $\text{NR}^9\text{C(O)R}^9$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{S(O)}_2\text{R}^9$ 、 NHC(O)OR^9 、
 $\text{NR}^9\text{C(O)OR}^9$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^9 、 $\text{NHC(O)N(R}^9)_2$ 、
 $\text{NR}^9\text{C(O)NHR}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^9 、
 $\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^9 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^9$ 、
 $\text{C(O)NR}^9\text{SO}_2\text{R}^9$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^9)_2$ 、
 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、
 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 S(O)R^{10} 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $\text{N(R}^{10})_2$ 、 C(O)R^{10} 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{10} 、 $\text{C(O)N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)R^{10} 、 $\text{NR}^{10}\text{C(O)R}^{10}$ 、 $\text{NHSO}_2\text{R}^{10}$ 、 NHC(O)OR^{10} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{10} 、 OH 、 (O) 、 C(O)OH 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、 OH 、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、

$S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 $OC(O)R^{13}$ 、
 $OC(O)OR^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、
 $NR^{13}C(O)R^{13}$ 、 $NHS(O)_2R^{13}$ 、 $NR^{13}S(O)_2R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、
 $NR^{13}C(O)OR^{13}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{13}$ 、 $NHC(O)N(R^{13})_2$ 、
 $NR^{13}C(O)NHR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、
 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{13}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{13}$ 、
 $C(O)NR^{13}SO_2R^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{13} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、
 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、
 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫嘧啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、 $NR^{14}S(O)_2R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)OR^{14}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{14}$ 、 $NHC(O)N(R^{14})_2$ 、 $NR^{14}C(O)NHR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{14}$ 、 $C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{14}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{14}$ 、 $C(O)NR^{14}SO_2R^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{14} 、 $SO_2N(R^{14})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、

OH、(O)、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；其中各R¹³芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之R¹⁵、OR¹⁵、SR¹⁵、S(O)R¹⁵、SO₂R¹⁵、C(O)R¹⁵、CO(O)R¹⁵、OC(O)R¹⁵、OC(O)OR¹⁵、NH₂、NHR¹⁵、N(R¹⁵)₂、NHC(O)R¹⁵、NR¹⁵C(O)R¹⁵、NHS(O)₂R¹⁵、NR¹⁵S(O)₂R¹⁵、NHC(O)OR¹⁵、NR¹⁵C(O)OR¹⁵、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR¹⁵、NHC(O)N(R¹⁵)₂、NR¹⁵C(O)NHR¹⁵、NR¹⁵C(O)N(R¹⁵)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR¹⁵、C(O)N(R¹⁵)₂、C(O)NHOH、C(O)NHOR¹⁵、C(O)NH₂SO₂R¹⁵、C(O)NR¹⁵SO₂R¹⁵、SO₂NH₂、SO₂NHR¹⁵、SO₂N(R¹⁵)₂、C(O)H、C(O)OH、OH、(O)、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；

R¹⁴在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各R¹⁴烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、NH₂、SO₂NH₂、C(O)H、C(O)OH、OH、(O)、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；其中各R¹⁴芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經

1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、OH、F、Cl、Br或I取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH時， R^x 不為甲基；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH時， R^x 不為甲氧基；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為N。

在式(IIIc)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為N；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為CH，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為CH，且 X^1 及 X^3 為N；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為N；或 X^1 為CH， X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 ，或 X^1 為 CR^1 ； X^2 為N，且 X^3 為CH；或 X^1 為N， X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH；或 X^1 為N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為N。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^2 為CH；

且 X^1 及 X^3 為 N。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N。

在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH

取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、

CF_3 或 C(O)OH 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其

中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、

NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為

CR^1 ; R^1 為 NHC(O)R^3 ; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIIc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; R^1 為 NHSO_2R^3 ; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIIc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 C(O)NH_2 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 F 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 Cl 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 Br 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 CN 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 NH_2 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 NO_2 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 CF_3 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 C(O)OH 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 C(O)R^3 ; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代; 且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IIIc) 之另一個實施例中, X^1 為 CH ; 且 X^2 及 X^3 為

CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IIIc)之一個實施例中， R^x 為 R^5 、 OR^5 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 NHR^5 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $CHNOR^5$ 、 $C(O)NHOR^5$ 、 SO_2NHR^5 或 CF_3 。在式(IIIc)之另一個實施例中， R^x 為 R^5 且 R^5 為雜環基，其視情況如本文實施例中所述經取代。

在式(IIIc)之另一個實施例中， R^x 為酞嗪-1(2H)-酮基、異喹啉基、異喹啉-1(2H)-酮基、5,6,7,8-四氫酞嗪-1(2H)-酮基、5-氟酞嗪-1(2H)-酮基、(Z)-3H-苯并[d][1,2]二氮吡-4(5H)-酮基、5-(三氟甲基)酞嗪-1(2H)-酮基、吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮、異吲哚啉-1-酮基或1,2,3,6-四氫吡啶基。在式(IIIc)之另一個實施例中， R^x 為酞嗪-1(2H)-酮基、異喹啉基、異喹啉-1(2H)-酮基、5,6,7,8-四氫酞嗪-1(2H)-酮基、5-氟酞嗪-1(2H)-酮基、(Z)-3H-苯并[d][1,2]二氮吡-4(5H)-酮基、5-(三氟甲基)酞嗪-1(2H)-酮基、異吲哚啉-1-酮基或吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮；其視情況如本文所定義經取代。在式(IIIc)之另一個實施例中， R^x 為1,2,3,6-四氫吡啶基；其視情況如本文所定義經取代。

另一個實施例係關於具有式(IIIc)之化合物，其包括

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(胺基甲基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(呋喃并[3,2-c]吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(苯甲基胺甲鹽基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,4-二甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(噻吩并[3,2-c]吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,3-二甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[4-(噻嗪-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二氮-1,4-苯并二氧雜環己烯-5-基甲基)胺甲
醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯
基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氟苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異
吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯
基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-5-甲基-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(4-氟基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氟苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啶-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-氟-5-(三氟甲基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氟苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-硝基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-甲基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-噻吩基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯甲基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-甲氧基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(3-甲氧基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(4-乙醯基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,3-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-噻吩基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

4-氯-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-苯基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(6-胺基己基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

4-氯-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲氧基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(吡啶-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(苯甲基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(噻嗪-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(3-氟苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-
 異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
 哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲
 基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-{4-[(3-丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
 哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,4-二羥基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-丙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
 哚-2-甲鹽胺；

○ N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
 哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(2-氟基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基-2-甲基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基-1H-吡啶-5-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯甲基-1H-吡啶-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-({4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}胺基)-1H-吡啶-3-甲酸甲酯；

N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啶-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(5-氯吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吡啶-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,3-二氫-1,4-苯并二氧雜環己烯-6-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(5-甲氧基-1H-吲哚-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氨基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-氟苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-丙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[5-(三氟甲基)吡啶-2-基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({2-[4-(二甲基胺基)苯基]乙基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(三氟甲氧基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-氟基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-氟-4-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,3-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2-氟苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(異丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

4-氯-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-(4-{[2-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-氟苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N²-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

N-{4-[(2-苯氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-羥基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3-氟苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({1-[(3S)-四氫呋喃-3-基]-1H-吡唑-4-基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-苯基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(甲基硫基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-氟苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({4-[(三氟甲基)硫基]苯甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(2-氟苯基)吡咯啉-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(1H-咪唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3-氯苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(羥基甲基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-異丙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,5-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(硫嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5,6-二氫咪唑并[1,5-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯甲基哌啶-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(5-乙醯胺基-2-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[3-(三氟甲基)苯基]乙基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-咪唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-(3-氟基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[苯甲基(2-羥基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-氟基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-氯苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(吡啶-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(氟基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(環己基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[丁基(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3,4-二氫異喹啉-2(1H)-基羧基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羧基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,3-二氫-1H-吲哚-1-基羧基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(苯基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(二乙基胺基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-苯基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

(1-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}哌啶-4-基)胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(環己基甲基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-氯苯基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二乙基胺甲醯基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-羥基乙基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-6-甲基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5,6-二氫[1,2,4]三唑并[4,3-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(5-氟吡啶-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基甲基)(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3,4,9-四氫-2H-β-吡啶-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(第三丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[4-(三氟甲基)苯基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二氟吡咯啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-苯甲基吡咯啶-3-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(環戊基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-胺甲醯基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(環丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(甲基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(戊-2-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(戊-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲
鹽胺；

N-[4-(環丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲
鹽胺；

N-{4-[(1,3-二氧戊環-2-基甲基)(甲基)胺甲鹽基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(4-氟苯基)-1H-吡唑-4-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-苯基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({2-[4-(三氟甲基)苯基]乙基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(第二丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-
甲鹽胺；

N-(4-{[3-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[雙(2-乙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[丁基(乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-
2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[異丁基(甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-胺甲鹽基苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-2-(三氟甲基)吡咯啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲基吡咯啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[乙基(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,6-二甲基嗎啉-4-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,5-二甲基吡咯啉-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙-2-炔-1-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[異丙基(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[異丙基(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氰基乙基)(環丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[乙基(異丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟吡咯啉-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}-N-異丙基-β-丙胺酸；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-

2-甲醯胺；

5,6-二甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(4-氯苯氧基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯基-1,3-噻唑-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

2-{[4-(丙基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}異吲哚啉-5-甲酸甲酯；

2-{[4-(丙基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}異吲哚啉-5-甲酸；

5-胺基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(胺基甲基)-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-乙醯胺基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(N,N-二甲基甘胺醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯

基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-(1H-吡唑-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-(1H-吡唑-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(甲氧基乙醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(甲基磺醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-溴-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氯苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4,4,4-三氟丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲

哌-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲基戊醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(苯甲氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[N-(2-呋喃甲醯基)甘胺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-噻吩基)丁醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-側氧基-4-苯基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(N-苯甲醯基甘胺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯氧基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯

胺；

N-[4-(戊醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯

胺；

N-[4-(己醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯

胺；

N-[4-(庚醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯

胺；

N-[4-(戊-4-烯醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸甲酯；

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二

氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-環戊基乙基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氮-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}-3,6-二氮吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯；

N-[4-(1,2,3,6-四氮吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-甲基-1H-吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1E)-5-苯基戊-1-烯-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙基-1H-吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲基-1H-吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基乙基)-1H-吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(5-苯基戊基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基)苯基]-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(異丙基磺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-苯甲醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(異丙基磺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯基磺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(苯甲醯基胺基)吡咯啶-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(丁醯基胺基)吡咯啶-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氮-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}哌嗪-1-甲酸第三丁酯；

N-[4-(4-丙醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環丙基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(己氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4,5,6,7,8-六氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(8-氟-4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(嗎啉-4-基甲基)-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氯-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-4,5-二氫-3H-2,3-苯并二氮呋-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-側氧基-8-(三氟甲基)-3,4-二氫酞嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二甲基胺基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二乙基胺基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二甲基胺基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二乙基胺基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-側氧基-8-(三氟甲基)-3,4-二氫酞嗪-1-基]苯基}-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(1-甲基哌啶-4-基)氧基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-{[(3R)-3-氟吡咯啉-1-基]甲基}-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-{[(3S)-3-氟吡咯啉-1-基]甲基}-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(氮雜環丁烷-1-基甲基)-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}哌啶-1-甲酸第三丁酯；

N-[4-(5-丙基-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(3-甲基丁基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-苯甲基-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(5-氯吡啶-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基-4-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(2-側氧基吡咯啶-1-基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基-2,3-二氫-1H-茛-1-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-羥基環丙基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-5-乙烯基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-苯甲醯基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(四氫呋喃-3-基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基丁基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(3-苯基丙基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(四氫呋喃-3-基甲基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-甲氧基乙基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-(2-羥基乙基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-3-基-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-4-基-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N⁵-(2-甲氧基乙基)-N²-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

N-(4-氟基苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(三氟甲基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-吡啶-2-基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基丁基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(四氫呋喃-3-基甲基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(4-吡啶-2-基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-吡啶-2-基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(1,2-二羥基乙基)-N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]
苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-D-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]
苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-{4-[1-(2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(甲氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(乙氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-
基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-氯苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(二甲基胺基)苯甲醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[4-(二甲基胺基)苯甲醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-呋喃甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-噻吩基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡咯-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,5-二甲基-1H-吡咯-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫
吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,3-噻唑-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡唑-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3,5-二甲基-1,2-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫
吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異菸鹼醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(噻嗪-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嘧啶-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[6-(苯甲醯基胺基)己基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[(苯甲醯基胺基)甲基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(5-側氧基-L-脯胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(5-側氧基-D-脯胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(1-乙醯基哌啶-4-基)羰基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-乙醯胺基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[4-(甲基磺醯基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-丁醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-異丁醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-甲基丁醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3,3,3-三氟丙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(甲氧基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫呋喃-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫呋喃-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環戊基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環己基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-氯苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-氯苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-氯基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-氯基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[3-(二甲基胺基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[4-(二甲基胺基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3,4-二甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3,5-二甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)乙醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(1H-吡咯-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(1H-吡唑-5-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡啶-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡啶-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-異菸鹼醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-{4-[4-(噻嗪-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡嗪-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(嘧啶-4-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(N,N-二甲基-β-丙胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-[4-(4-乙醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(1,3-噻唑-4-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(嗎啉-4-基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-2,3-二氫-1H-異吲哚-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N⁵-[2-(二甲基胺基)乙基]-N²-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

5-(嗎啉-4-基羰基)-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(異丁氧基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-溴-N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

4-{[(5-氟基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲酸甲酯；

N-(4-{(E)-[(苯甲氧基)亞胺基]甲基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(3-胺基吡咯啶-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N²-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

N-[4-({苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}甲基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(1H-吡唑-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N²-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-N⁵-(2-甲氧基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

N²-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-N⁵-(2-羥基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

5-(胺基甲基)-N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-(甲基硫基)丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S,3S)-1-羥基-3-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S,3R)-1,3-二羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基己-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基環戊基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2R)-2-羥基環戊基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-環己基-3-羥基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({(2R)-1-羥基-3-[(4-甲基苯甲基)硫基]丙-2-基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-第三丁基苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-甲氧基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

5-甲基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-
2-甲鹽胺；

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡
啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二
氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二
氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-
二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二
氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二
氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(吡啶-4-基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-
5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙鹽基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-
基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{(1E)-3-[苯甲基(甲基)胺基]丙-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-苯氧基哌啶-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3-苯氧基氮雜環丁烷-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[苯甲基(甲基)胺基]甲基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ 5-氟-N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○ N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(5,6-二氫咪唑并[1,5-a]吡嗪-7(8H)-基羥基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(1-苯甲基-1H-1,2,3-三唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{1-[2-(2-側氧基吡咯啶-1-基)乙基]-1H-1,2,3-三唑-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(1-苯甲基哌啶-4-基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(3-苯基丙基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{1-[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]-1H-1,2,3-三唑-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(1-異丁基-1H-1,2,3-三唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(環戊基甲基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(3-甲氧基丙基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫呋喃-2-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(嗎啉-4-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啉-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啉-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡咯啉-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(氮雜環丁烷-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并

[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(異丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(環戊基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-

吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-噻吩基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[苯甲基(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-

吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(嗎啉-4-基甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-{[(3-甲基丁基)胺基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-羥基哌啶-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]

苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-胺基乙基)-1H-咪唑-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲醯基})

苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基)甲基]胺甲醯基}

苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-甲氧基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(4S)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(4R)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-2-側氧基乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-3-側氧基丙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氟基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-甲基-1,3-二氫-2H-

異吲哚-2-甲醯胺；

4-氯-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氯-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2-苯甲基-1,3-噻唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1,3-噻唑-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(4-甲基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1,3-二羥基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(2-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(四氫呋喃-2-基羰基)哌嗪-1-基]羰基}

苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(乙基磺醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(2,3-二羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1-羥基-4-甲基戊-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫-2H-吡喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.3]庚-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-6-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.4]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-3-基羰基)苯基]-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯
基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲醯基]
苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(六氮-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(四氮-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(六氮呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-4-側氧基丁基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}乙基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-乙醯基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲醯基})

苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(1-羥基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丁醯基胺基)苯基]-5-氟基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡咯啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-吡咯啶-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲氧基苯甲基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-6-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-5-氟-

1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-5-氟-

1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-5-氟-

1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(2-氧雜-7-氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(六氮-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(四氮-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯
基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(六氮呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-
二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-(乙醯胺基甲基)-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(3R)-1-異丁醯基吡咯啶-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[(3R)-1-苯甲醯基吡咯啶-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(四氫呋喃-3-基羰基)吡咯啶-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(甲基磺醯基)吡咯啶-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(2-羥基丙-2-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲基}胺基甲酸第三丁酯；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(甲氧基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-{[(四氫呋喃-2-基甲基)胺基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-甲氧基哌啶-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-{[4-(2-甲氧基乙基)哌嗪-1-基]甲基}-1,2,4-噁二

唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(嗎啉-4-基)環戊基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-戊醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丁醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

(2-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}乙基)胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[1-(4,4,4-三氟丁基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[1-(3-苯基丙基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[1-(苯基乙基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-[4-({1-[(4-甲氧基苯基)乙基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[1-(環丙基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯甲醯基吡咯啉-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-乙氧基丙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-
二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

○ N-[4-({1-[(2-甲基環丙基)羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(1-甲基環丙基)羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[1-(2-甲基丙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基吡咯啉-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-
吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(4,4,4-三氟丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙氧基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基哌啶-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

[(1-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}氮雜環丁烷-3-基)甲基]胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基})

苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(嗎啉-4-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,3-二甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3-二甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(三環[3.3.1.1~3,7~]癸-1-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-甲氧基環己基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[4-(乙醯基胺基)苯基]磺醯基}胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-丙基苯基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡
咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(丁基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1S,4R)-7,7-二甲基-2-側氧基雙環[2.2.1]庚-1-
基]甲基}磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡
啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(苯甲基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-氟苯基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯
并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(噻吩-2-基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯
并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氫雜螺[4.4]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氫雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氫雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(六氮-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(四氮-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(六氮呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮呋喃-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮-2H-哌喃-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(N,N-二甲基甘胺醯基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氮呋喃-2-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氮呋喃-3-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}

苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環己基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(4,4-二氟環己基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(哌啶-1-基磺醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4,4-二氟環己基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

Na-(4-{[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲鹽基)-D-苯基丙胺鹽胺；

○ N-(4-{[2-(乙鹽基胺基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

Na-(4-{[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲鹽基)-L-苯基丙胺鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(甲基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-氯-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-胺甲鹽基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N α -{4-[(5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-基羰基)胺基]苯甲鹽基}-L-苯基丙胺鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-(4,5,6,7-四氫-1H-吡唑-5-基胺甲鹽基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-氟基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[苯甲基(甲基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ 5-氟-N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯
 基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯
 基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-
 1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯
 基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-胺基-1-側氧基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-
 氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(環戊基胺甲鹽基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-
 2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯
 基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-
 甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-氟基乙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ 5-氟-N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

○ N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-氟基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-胺基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氰基環丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(4-甲基-1,3-噻唑-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-呋喃-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲鹽基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氰基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

○ N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

○ 1-{4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}氮雜環丁烷-3-甲酸甲酯；

N-(4-{3-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{3-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{3-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲鹽基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[3-(苯甲基胺甲鹽基)氮雜環丁烷-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[3-(環戊基胺甲鹽基)氮雜環丁烷-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{3-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{3-[(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(環戊基乙鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基乙鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-2-基乙鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(吡咯啶-1-基乙鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4,4-二氟環己基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-氯基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-呋喃-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({2-[(二甲基胺基)甲基]苯甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(1,3-噁唑-2-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(四氫-2H-呋喃-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-呋喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-呋喃-2-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基哌啶-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡
咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丁醯基哌啶-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡
咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-
二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-2-基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-{4-[(2,2-二氟乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

Na-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲鹽基}-L-苯基丙胺鹽胺；

N-(4-{[2-(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(噻吩-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(乙鹽基胺基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-4-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(嘧啶-4-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(甲基胺甲鹽基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(5-側氧基-L-脯胺鹽基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-乙醯基哌啶-4-基)羰基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(雙環[2.2.1]庚-2-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-噻唑-5-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-側氧基-4,5,6,7-四氫-1-苯并呋喃-3-基)羰基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(3-甲基丁醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(4-甲基戊醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(乙氧基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(環戊基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(環戊基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-{4-[2-(苯甲醯基胺基)乙基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫-2H-呋喃-4-基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丙醯基氮雜環丁烷-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-乙基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(戊-4-炔醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-3-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(噻吩-3-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1H-吡咯-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嘧啶-4-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(5-甲基吡嗪-2-基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(N,N-二甲基甘胺醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(N,N-二甲基-β-丙胺醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(吡咯啉-1-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(吡咯啉-1-基)丙醯基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[1-(2-環丙基乙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-環戊基乙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[1-(3,3-二甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丁基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(苯基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-氟苯基)磺醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丙-2-基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(苯甲基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(噻吩-2-基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-2-甲基丁醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4,4-二氟環己基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(5-側氧基-D-脯胺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基戊醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-乙基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1H-吡咯-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1,2-噁唑-5-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(吡啶-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(噻吩-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(吡嗪-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嘧啶-4-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(5-甲基吡嗪-2-基)羰基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氮-2H-哌喃-4-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯甲醯基胺基)環己-1-烯-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-四氮呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2R)-四氮呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(1,1-二氧離子基四氮-2H-硫哌喃-4-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡

啖-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啖-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啖-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-2-甲基丁醯基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啖-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(3-甲基丁醯基)胺基]氧雜環丁烷-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啖-2-甲醯胺；

4-({4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啖-2-基羰基)胺基]苯基}磺醯基)哌啖-1-甲酸第三丁酯；

N-{4-[4-(丙基胺甲醯基)哌啖-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啖-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]哌啖-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啖-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]哌啖-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啖-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(1,4-二噁烷-2-基甲基)胺甲醯基]哌啖-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啖-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環戊基胺甲醯基)哌啖-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啖-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫-2H-哌喃-4-基胺甲醯基)哌啖-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啖-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(嗎啉-4-基羰基)哌啖-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-

吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環丙基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(丁-2-基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{(4R)-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{(4S)-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲基-1,3-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2E)-3-(呋喃-2-基)丙-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,3-噁唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3,3,3-三氟丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,5-二甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲氧基環己基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,3-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,2-二氟環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(第三丁氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-乙氧基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-羥基-3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(1H-吡咯-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲基丙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1-甲基脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-羥基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-{[1-(甲氧基甲基)環丙基]羰基}-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(甲基磺醯基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-乙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2E)-4-甲基戊-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲氧基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊-1-烯-1-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(噻吩-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環己基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,2-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(甲氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,2-二甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲基己醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,2-二甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丁基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(哌啶-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[2-(吡咯啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-

基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(順-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○ N-[4-(順-4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(順-4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[(3R)-1-(3-甲基丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-1-(環丁基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3R)-1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3R)-1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-1-(環丙基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(3-甲基丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(環丁基羧基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-[4-({(3S)-1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羧基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-[4-({(3S)-1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羧基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(環丙基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(環己基羧基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(環己基羧基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環己基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

另一個實施例係關於具有式(IIIc)之化合物，其包括

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4,5,6,7,8-六氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二

氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(8-氟-4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-(嗎啉-4-基甲基)-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氯-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-4,5-二氮-3H-2,3-苯并二氮呋-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮異喹啉-4-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-側氧基-8-(三氟甲基)-3,4-二氫酞嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-[(二甲基胺基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮異喹啉-

4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二乙基胺基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二甲基胺基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(二乙基胺基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-側氧基-8-(三氟甲基)-3,4-二氫酞嗪-1-基]苯基}-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(1-甲基哌啶-4-基)氧基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-{[(3R)-3-氟吡咯啉-1-基]甲基}-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-{[(3S)-3-氟吡咯啉-1-基]甲基}-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(氮雜環丁烷-1-基甲基)-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；及

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-2,3-二氫-1H-異吲哚-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

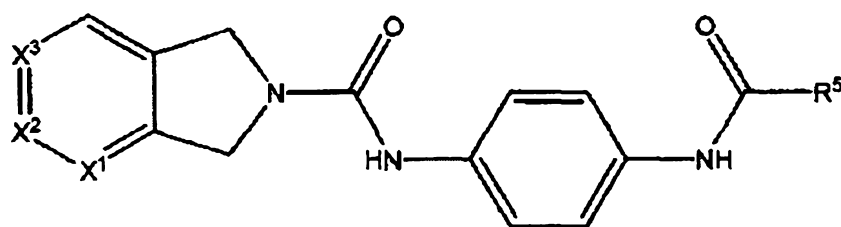
N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)環己-3-烯-1-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)環己-3-烯-1-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)環己-3-烯-1-基]-5-(吡咯啶-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

式(IVc)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(IVc)化合物，



(IVc);

及其醫藥學上可接受之鹽；其中X¹、X²、X³及R⁵如本文關於式(Ic)所述。

在式(IVc)之一個實施例中，

X¹、X²及X³為CH；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N；或

X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH；或

X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH；或

X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、OH、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$ 或 $C(O)NH_2$ ；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)R^6$ 、 SO_2R^6 、 $C(O)R^6$ 、 $CO(O)R^6$ 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NHS(O)_2R^6$ 、 $NR^6S(O)_2R^6$ 、 $NHC(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^6$ 、

$\text{NHC(O)N(R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)NHR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NH_2 、
 C(O)NHR^6 、 $\text{C(O)N(R}^6)_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^6 、
 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{C(O)NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、
 $\text{SO}_2\text{N(R}^6)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、
 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取
 代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳
 基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔
 基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、
 S(O)R^9 、 SO_2R^9 、 C(O)R^9 、 CO(O)R^9 、 OC(O)R^9 、 OC(O)OR^9 、
 NH_2 、 NHR^9 、 $\text{N(R}^9)_2$ 、 NHC(O)R^9 、 $\text{NR}^9\text{C(O)R}^9$ 、
 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{S(O)}_2\text{R}^9$ 、 NHC(O)OR^9 、 $\text{NR}^9\text{C(O)OR}^9$ 、
 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^9 、 $\text{NHC(O)N(R}^9)_2$ 、 $\text{NR}^9\text{C(O)NHR}^9$ 、
 $\text{NR}^9\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^9 、 $\text{C(O)N(R}^9)_2$ 、
 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^9 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^9$ 、 $\text{C(O)NR}^9\text{SO}_2\text{R}^9$ 、
 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^9)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、
 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳
 基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔
 基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、
 S(O)R^{10} 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $\text{N(R}^{10})_2$ 、 C(O)R^{10} 、 C(O)NH_2 、
 C(O)NHR^{10} 、 $\text{C(O)N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)R^{10} 、 $\text{NR}^{10}\text{C(O)R}^{10}$ 、
 $\text{NHSO}_2\text{R}^{10}$ 、 NHC(O)OR^{10} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{10})_2$ 、

NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{10} 、 OH 、 (O) 、 C(O)OH 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、 OH 、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 S(O)R^{13} 、 SO_2R^{13} 、 C(O)R^{13} 、 CO(O)R^{13} 、 OC(O)R^{13} 、 OC(O)OR^{13} 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $\text{N(R}^{13})_2$ 、 NHC(O)R^{13} 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)R}^{13}$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{S(O)}_2\text{R}^{13}$ 、 NHC(O)OR^{13} 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)OR}^{13}$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{13} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{13})_2$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)NHR}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)N(R}^{13})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{13} 、 $\text{C(O)N(R}^{13})_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{13} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{C(O)NR}^{13}\text{SO}_2\text{R}^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{13})_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、呋喃基、嘧啶

基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、 $NR^{14}S(O)_2R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)OR^{14}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{14}$ 、 $NHC(O)N(R^{14})_2$ 、 $NR^{14}C(O)NHR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{14}$ 、 $C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{14}$ 、 $C(O)NH SO_2R^{14}$ 、 $C(O)NR^{14}SO_2R^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{14} 、 $SO_2N(R^{14})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫呋喃-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、呋喃基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、 $NR^{15}C(O)NHR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{15}$ 、

$C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{15}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{15}$ 、 $C(O)NR^{15}SO_2R^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{15} 、 $SO_2N(R^{15})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；其中 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為 N 。

在式(IVc)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 N ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為 CH ，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為 CH ，且 X^1 及 X^3 為 N ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 N ；或 X^1 為

CH, X^2 為 N, 且 X^3 為 CR^1 ; 或 X^1 為 CR^1 , X^2 為 N, 且 X^3 為 CH; 或 X^1 為 N, X^2 為 CR^1 , 且 X^3 為 CH; 或 X^1 為 N, X^2 為 CR^1 , 且 X^3 為 N。在式(IVc)之另一個實施例中, X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH。在式(IVc)之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH; 且 X^2 為 N。在式(IVc)之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH; 且 X^2 為 CR^1 。在式(IVc)之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH; 且 X^1 為 CR^1 。在式(IVc)之另一個實施例中, X^1 為 CH; 且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式(IVc)之另一個實施例中, X^2 為 CH; 且 X^1 及 X^3 為 N。在式(IVc)之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH; 且 X^1 為 N。在式(IVc)之另一個實施例中, X^1 為 CH; X^2 為 N; 且 X^3 為 CR^1 。在式(IVc)之另一個實施例中, X^1 為 CR^1 ; X^2 為 N; 且 X^3 為 CH。在式(IVc)之另一個實施例中, X^1 為 N; X^2 為 CR^1 ; 且 X^3 為 CH。在式(IVc)之另一個實施例中, X^1 為 N; X^2 為 CR^1 ; 且 X^3 為 N。

在式(IVc)之另一個實施例中, R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IVc)之另一個實施例中, R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVc)之另一個實施例中, R^1 為 R^3 ; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況

經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVc) 之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVc) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVc) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVc) 之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVc) 之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (IVc) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (IVc) 之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式 (IVc) 之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式 (IVc) 之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式 (IVc) 之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式 (IVc) 之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式 (IVc) 之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式 (IVc)

之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(IVc)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IVc)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其

中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為

CF_3 。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $\text{C}(\text{O})\text{R}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 。在式(IVc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為

CR^1 ; R^1 為 $C(O)OR^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; R^1 為 $C(O)NHR^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; R^1 為 $NHC(O)R^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; R^1 為 $NHSO_2R^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (IVc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 F 。在式 (IVc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 Cl 。在式 (IVc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 Br 。在式 (IVc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 CN 。在式 (IVc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 NH_2 。在式 (IVc) 之另一個實施例中, X^2 及 X^3 為 CH ; 且 X^1 為 CR^1 ; 且 R^1 為 NO_2 。在式 (IVc) 之

另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(IVc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IVc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (IVc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (IVc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F。在式 (IVc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl。在式 (IVc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br。在式 (IVc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN。在式 (IVc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式 (IVc) 之另一個實

施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(IVc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

另一個實施例係關於具有式(IVc)之化合物，其包括

N-{4-[(4,4,4-三氟丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲基戊醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(苯甲氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[N-(2-呋喃甲醯基)甘胺醯基]胺基}苯基)-1,3-二

氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-噻吩基)丁醯基]胺基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-側氧基-4-苯基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(N-苯甲醯基甘胺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯氧基丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(丙醯基胺基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(戊醯基胺基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(己醯基胺基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(庚醯基胺基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(戊-4-烯醯基胺基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-

2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-

2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸甲酯；

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-5-甲酸；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-溴-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N²-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(1H-吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(1-甲基-1H-吡啶-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N²-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-N⁵-(2-甲氧基乙基)-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

N^2 -{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}- N^5 -(2-羥基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

5-(胺基甲基)-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-甲氧基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(吡啶-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫呋喃-2-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(嗎啉-4-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氟基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-甲基-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氯-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氯-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-乙醯基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(1-羥基乙基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丁醯基胺基)苯基]-5-氟基-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(乙醯胺基甲基)-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(2-羥基丙-2-基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(甲氧基甲基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并

[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-乙醯基哌啶-4-基)羰基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

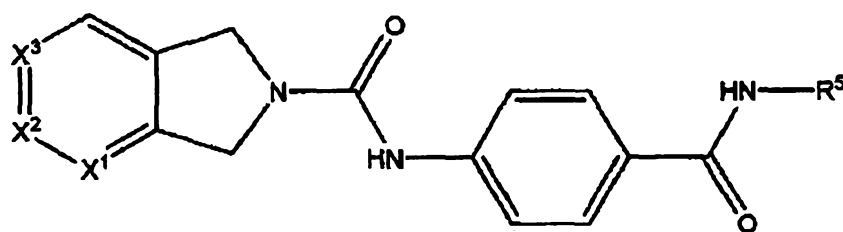
N-{4-[(雙環[2.2.1]庚-2-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-噻唑-5-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-側氧基-4,5,6,7-四氫-1-苯并呋喃-3-基)羰基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

式(Vc)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(Vc)化合物，



(Vc);

及其醫藥學上可接受之鹽；其中 X^1 、 X^2 、 X^3 及 R^5 如本文關於式 (Ic) 所述。

在式 (Vc) 之一個實施例中，

X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N；或

X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N；或

X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N；或

X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH；或

X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH；或

X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、F、Cl、

Br、I、CN、NH₂、NO₂、N₃、OH、C(O)H、CF₃、C(O)OH
或C(O)NH₂；

R³在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基
或雜環基；其中各R³烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3
或4個獨立選擇之R⁶、OR⁶、SR⁶、S(O)R⁶、SO₂R⁶、
C(O)R⁶、CO(O)R⁶、OC(O)R⁶、OC(O)OR⁶、NH₂、NHR⁶、
N(R⁶)₂、NHC(O)R⁶、NR⁶C(O)R⁶、NHS(O)₂R⁶、NR⁶S(O)₂R⁶、
NHC(O)OR⁶、NR⁶C(O)OR⁶、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR⁶、
NHC(O)N(R⁶)₂、NR⁶C(O)NHR⁶、NR⁶C(O)N(R⁶)₂、C(O)NH₂、
C(O)NHR⁶、C(O)N(R⁶)₂、C(O)NHOH、C(O)NHOR⁶、
C(O)NHSO₂R⁶、C(O)NR⁶SO₂R⁶、SO₂NH₂、SO₂NHR⁶、
SO₂N(R⁶)₂、C(O)H、C(O)OH、OH、(O)、CN、N₃、
NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、F、Cl、Br或I取
代；

R⁵在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳
基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各R⁵烷基、烯基及炔
基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之R⁹、OR⁹、SR⁹、
S(O)R⁹、SO₂R⁹、C(O)R⁹、CO(O)R⁹、OC(O)R⁹、OC(O)OR⁹、
NH₂、NHR⁹、N(R⁹)₂、NHC(O)R⁹、NR⁹C(O)R⁹、
NHS(O)₂R⁹、NR⁹S(O)₂R⁹、NHC(O)OR⁹、NR⁹C(O)OR⁹、
NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR⁹、NHC(O)N(R⁹)₂、NR⁹C(O)NHR⁹、
NR⁹C(O)N(R⁹)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR⁹、C(O)N(R⁹)₂、
C(O)NHOH、C(O)NHOR⁹、C(O)NHSO₂R⁹、C(O)NR⁹SO₂R⁹、
SO₂NH₂、SO₂NHR⁹、SO₂N(R⁹)₂、C(O)H、C(O)OH、OH、

(O)、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；

R⁶在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各R⁶烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之R¹⁰、OR¹⁰、SR¹⁰、S(O)R¹⁰、SO₂R¹⁰、NHR¹⁰、N(R¹⁰)₂、C(O)R¹⁰、C(O)NH₂、C(O)NHR¹⁰、C(O)N(R¹⁰)₂、NHC(O)R¹⁰、NR¹⁰C(O)R¹⁰、NH₂SO₂R¹⁰、NHC(O)OR¹⁰、SO₂NH₂、SO₂NHR¹⁰、SO₂N(R¹⁰)₂、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR¹⁰、OH、(O)、C(O)OH、N₃、CN、NH₂、CF₃、CF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；

R⁹在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各R⁹烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、OH、環烷基、芳基或雜環基取代；

R¹⁰在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由R³、R⁵、R⁶、R⁹及R¹⁰表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之R¹³、OR¹³、SR¹³、S(O)R¹³、SO₂R¹³、C(O)R¹³、CO(O)R¹³、OC(O)R¹³、OC(O)OR¹³、NH₂、NHR¹³、N(R¹³)₂、NHC(O)R¹³、NR¹³C(O)R¹³、NHS(O)₂R¹³、NR¹³S(O)₂R¹³、NHC(O)OR¹³、NR¹³C(O)OR¹³、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR¹³、NHC(O)N(R¹³)₂、NR¹³C(O)NHR¹³、NR¹³C(O)N(R¹³)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR¹³、C(O)N(R¹³)₂、C(O)NHOH、C(O)NHOR¹³、C(O)NHSO₂R¹³、

$C(O)NR^{13}SO_2R^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{13} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫脲-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、 $NR^{14}S(O)_2R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)OR^{14}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{14}$ 、 $NHC(O)N(R^{14})_2$ 、 $NR^{14}C(O)NHR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{14}$ 、 $C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{14}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{14}$ 、 $C(O)NR^{14}SO_2R^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{14} 、 $SO_2N(R^{14})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫脲-3-基、二噁烷基、四

氮哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啶基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、 $NR^{15}C(O)NHR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{15}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{15}$ 、 $C(O)NR^{15}SO_2R^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{15} 、 $SO_2N(R^{15})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情

況經1、2、3或4個烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為N。

在式(Vc)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為N；或 X^1 及 X^3 為CH，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為CH，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為CH，且 X^1 及 X^3 為N；或 X^2 及 X^3 為CH，且 X^1 為N；或 X^1 為CH， X^2 為N，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為N，且 X^3 為CH；或 X^1 為N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為CH；或 X^1 為N， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為N。在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為CH。在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N。在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 。在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 。在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N。在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N。在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 。在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH。在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH。在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N。

在式(Vc)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、

$C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、
 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式
(Vc) 之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、
 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、
 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3
為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨
立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；
其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Vc) 之另一個實施例中， R^1
為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況
經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、
 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Vc)
之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜
環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、
 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基
或雜環基。在式 (Vc) 之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；
其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或
多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH
取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式 (Vc) 之另一個實施例
中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其
中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、
 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
在式 (Vc) 之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷
基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選
擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中

R^6 為烷基或雜環基。在式(Vc)之另一個實施例中， R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC(O)}R^6$ 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vc)之另一個實施例中， R^1 為 C(O)NH_2 。在式(Vc)之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式(Vc)之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式(Vc)之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式(Vc)之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式(Vc)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(Vc)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(Vc)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(Vc)之另一個實施例中， R^1 為 C(O)OH 。在式(Vc)之另一個實施例中， R^1 為 C(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC(O)}R^6$ 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH 。在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 NHSO_2R^3 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $\text{NHC(O)}R^6$ 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為

CR^1 ; R^1 為 R^3 ; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Vc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; R^1 為 OR^3 ; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Vc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; R^1 為 $C(O)OR^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Vc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; R^1 為 $C(O)NHR^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Vc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; R^1 為 $NHC(O)R^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Vc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; R^1 為 $NHSO_2R^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Vc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ;

且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (Vc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (Vc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (Vc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (Vc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (Vc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^2 為 NH_2 。在式 (Vc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式 (Vc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式 (Vc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式 (Vc) 之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (Vc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式 (Vc) 之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH ；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

基。在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(Vc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、

NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(Vc)之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、

NHC(O)R⁶、N(R⁶)₂或OH取代；其中R⁶為烷基或雜環基。

在式(Vc)之另一個實施例中，X¹為CH；且X²及X³為CR¹；且R¹為C(O)NH₂。在式(Vc)之另一個實施例中，X¹為CH；且X²及X³為CR¹；且R¹為F。在式(Vc)之另一個實施例中，X¹為CH；且X²及X³為CR¹；且R¹為Cl。在式(Vc)之另一個實施例中，X¹為CH；且X²及X³為CR¹；且R¹為Br。在式(Vc)之另一個實施例中，X¹為CH；且X²及X³為CR¹；且R¹為CN。在式(Vc)之另一個實施例中，X¹為CH；且X²及X³為CR¹；且R¹為NH₂。在式(Vc)之另一個實施例中，X¹為CH；且X²及X³為CR¹；且R¹為NO₂。在式(Vc)之另一個實施例中，X¹為CH；且X²及X³為CR¹；且R¹為CF₃。在式(Vc)之另一個實施例中，X¹為CH；且X²及X³為CR¹；且R¹為C(O)OH。在式(Vc)之另一個實施例中，X¹為CH；且X²及X³為CR¹；且R¹為C(O)R³；其中R³為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之R⁶、OR⁶、NH₂、NHC(O)R⁶、N(R⁶)₂或OH取代；且R⁶為烷基或雜環基。

另一個實施例係關於具有式(Vc)之化合物，其包括

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(胺基甲基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(苯甲基胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二氫-1,4-苯并二氧雜環己烯-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氟苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啉-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5-甲基-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-氟苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,2-二甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啉-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-氟-5-(三氟甲基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-氯苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-硝基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-噻吩基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-5-氯-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-苯甲基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-5-氯-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,3-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-噻吩基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲氧基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ 5-氟-N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(6-氨基己基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ 4-氟-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(苯甲基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲
鹽胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,4-二羥基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-丙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基-2-甲基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基-1H-吲唑-5-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-苯甲基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-({4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲鹽基}胺基)-1H-吲唑-3-甲酸甲酯；

○ N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啶-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1H-吲哚-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(2,3-二氫-1,4-苯并二氧雜環己烯-6-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(5-甲氧基-1H-吲哚-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-氯苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-丙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[4-(二甲基胺基)苯基]乙基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(三氟甲氧基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氯基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氯-4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2-氟苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(異丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-(4-{[2-(2-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ 4-氯-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-氟苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啉-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N²-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

N-{4-[(2-苯氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-羥基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3-氟苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({1-[(3S)-四氫呋喃-3-基]-1H-吡唑-4-基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-苯基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(甲基硫基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-氟苯基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-[4-({4-[(三氟甲基)硫基]苯甲基}胺甲酰基)苯基]-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

○ N-(4-{[3-(1H-咪唑-1-基)丙基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{[2-(3-氟苯基)乙基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲酰基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

○ N-(4-{[4-(羥基甲基)苯基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-[4-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基胺甲酰基)苯基]-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[(1-異丙基-1H-吡唑-4-基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[(4-羥基苯基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,5-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-苯甲基哌啶-4-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(5-乙鹽胺基-2-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({2-[3-(三氟甲基)苯基]乙基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1H-咪唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-(3-氟基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-氟基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-氯苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(吡啶-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(氟基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-
2-甲鹽胺；

N-[4-(環己基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲
鹽胺；

N-{4-[(3-羥基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(苯基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽
胺；

N-{4-[(4-氟基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-
2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(二乙基胺基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-氯苯甲基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-6-甲基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(5-氟吡啶-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(第三丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-
 甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(3S)-1-苯甲基吡咯啶-3-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-氟苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-
 2-甲鹽胺；

N-[4-(環戊基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲
 鹽胺；

N-[4-(環丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲
 鹽胺；

N-[4-(甲基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽
 胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(戊-2-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲
 鹽胺；

N-[4-(戊-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲
 鹽胺；

N-[4-(環丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲
鹽胺；

N-(4-{[1-(4-氟苯基)-1H-吡唑-4-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-苯基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({2-[4-(三氟甲基)苯基]乙基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(第二丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-
甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丙-2-炔-1-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5,6-二甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(4-氯苯氧基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-{4-[(4-苯基-1,3-噻唑-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

2-{[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]胺甲鹽基}異吲哚啉-5-甲酸甲酯；

2-{[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]胺甲鹽基}異吲哚啉-5-甲酸；

5-胺基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ 5-(羥基甲基)-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-(胺基甲基)-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-[(2-羥基-2-甲基丙鹽基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-乙鹽胺基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-[(N,N-二甲基甘胺鹽基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-5-(1H-吡唑-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-5-(1H-吡唑-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-[(甲氧基乙鹽基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-[(甲基磺鹽基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-溴-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-氯苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(5-氯吡啶-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基-4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-側氧基吡咯啶-1-基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基-2,3-二氫-1H-茛-1-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-羥基環丙基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-乙烯基-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基丁基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(3-苯基丙基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-3-基-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-4-基-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N⁵-(2-甲氧基乙基)-N²-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2,5-二甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-吡啶-2-基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基丁基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(四氫呋喃-3-基甲基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-吡啶-2-基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(1,2-二羥基乙基)-N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[6-(苯甲醯基胺基)己基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[(苯甲醯基胺基)甲基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N⁵-[2-(二甲基胺基)乙基]-N²-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

5-(嗎啉-4-基羰基)-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(異丁氧基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-吡喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-吡喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-吡喃-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-(甲基硫基)丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S,3S)-1-羥基-3-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S,3R)-1,3-二羥基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基己-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基環戊基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2R)-2-羥基環戊基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-環己基-3-羥基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-[4-({(2R)-1-羥基-3-[(4-甲基苯甲基)硫基]丙-2-基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-第三丁基苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二
氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(四氮-2H-咪喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二
氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-
5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3R)-四氮咪喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-四氮咪喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-
二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-
吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-
吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡咯啶-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(異丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(環戊基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-噻吩基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

○ N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

○ N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-甲氧基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({[(4S)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲
醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(4R)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲
醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲醯基)
苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1,3-噻唑-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲醯基}苯
基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(4-甲基苯基)乙基]胺甲醯基}苯
基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1,3-二羥基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(2,3-二羥基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(1-羥基-4-甲基戊-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡咯啉-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(3S)-吡咯啉-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啉-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({[(3R)-1-異丁鹽基吡咯啉-3-基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({[(3R)-1-苯甲鹽基吡咯啉-3-基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({[1-(四氫呋喃-3-基羰基)吡咯啉-3-基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({[1-(甲基磺鹽基)吡咯啉-3-基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({[1-(嗎啉-4-基)環戊基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4,4-二氟環己基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

Na-(4-{[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲醯基)-D-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[2-(乙醯基胺基)苯基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]

胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

Na-(4-{[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲鹽基)-L-苯基丙胺鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[3-(甲基胺甲鹽基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-氯-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺甲醯基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

Na-{4-[(5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-基羰基)胺基]}

苯甲醯基}-L-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-(4,5,6,7-四氫-1H-吡啶-5-基胺甲醯基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-氟基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲醯基}苯

基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-胺基-1-側氧基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(環戊基胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-

2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-4-基)乙基]胺甲醯基}苯
基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-
甲醯胺；

N-{4-[(1-氟基乙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯
基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-
二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡
咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-

6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-氰基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(4-胺基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-

6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(1-氰基環丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(4-甲基-1,3-噻唑-2-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯

并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-(4-{[2-(四氢-2H-吡喃-3-基)乙基]胺甲酰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲酰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-侧氧基丁基)胺甲酰基]苯基}-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲酰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲酰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲酰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-[4-(四氢-2H-吡喃-3-基胺甲酰基)苯基]-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲酰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲酰基]苯基}-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲酰基]苯基}-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲酰基}苯基)-5,7-二氢-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲酰胺；

N-{4-[(四氢-2H-吡喃-3-基甲基)胺甲酰基]苯基}-5,7-二

氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(1-氟基乙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3R)-四氮呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氮-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4,4-二氟環己基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-氟基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲

哌-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-呋喃-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[(二甲基胺基)甲基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3-噁唑-2-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(四氫-2H-呋喃-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,2-二氟乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

Na-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}-L-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[2-(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(噻吩-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(乙醯基胺基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-4-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(嘧啶-4-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(甲基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-

2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

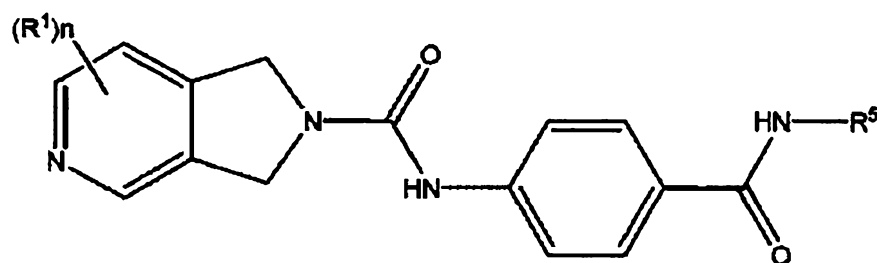
N-(4-{[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

式(VIc)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(VIc)化合物，



(VIc);

及其醫藥學上可接受之鹽；其中 R^1 及 R^5 如本文關於式(Ic)所述；且 n 為0或1。

在式(VIc)之一個實施例中，

n 為0或1；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、

NHSO_2R^3 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、 OH 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 CF_3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 或 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ ；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^6$ 、 SO_2R^6 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{S}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^9$ 、 SO_2R^9 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^9$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^9$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^9$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^9$ 、 NH_2 、 NHR^9 、 $\text{N}(\text{R}^9)_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{C}(\text{O})\text{R}^9$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{S}(\text{O})_2\text{R}^9$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{C}(\text{O})\text{OR}^9$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^9$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^9)_2$ 、 $\text{NR}^9\text{C}(\text{O})\text{NHR}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^9)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^9$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^9)_2$ 、

C(O)NHOH 、 $\text{C(O)NHO}R^9$ 、 C(O)NHSO_2R^9 、 $\text{C(O)NR}^9\text{SO}_2R^9$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^9)_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $\text{S(O)}R^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $\text{N(R}^{10})_2$ 、 $\text{C(O)}R^{10}$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{10} 、 $\text{C(O)N(R}^{10})_2$ 、 $\text{NHC(O)}R^{10}$ 、 $\text{NR}^{10}\text{C(O)}R^{10}$ 、 NHSO_2R^{10} 、 NHC(O)OR^{10} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{10} 、 OH 、 (O) 、 C(O)OH 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、 OH 、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $\text{S(O)}R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $\text{C(O)}R^{13}$ 、 $\text{CO(O)}R^{13}$ 、 $\text{OC(O)}R^{13}$ 、 OC(O)OR^{13} 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $\text{N(R}^{13})_2$ 、 $\text{NHC(O)}R^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)}R^{13}$ 、 NHS(O)_2R^{13} 、 $\text{NR}^{13}\text{S(O)}_2R^{13}$ 、 NHC(O)OR^{13} 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)OR}^{13}$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{13} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{13})_2$ 、

$\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{13}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{13}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{13}$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{13}\text{SO}_2\text{R}^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{13})_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、
 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫嘧啶-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{R}^{14}$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{14}\text{SO}_2\text{R}^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-

c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2*H*-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、 $NR^{15}C(O)NHR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{15}$ 、 $C(O)NH SO_2R^{15}$ 、 $C(O)NR^{15}SO_2R^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{15} 、 $SO_2N(R^{15})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基。

在式(VIc)之另一個實施例中， n 為0。在式(VIc)之另一個實施例中， n 為1。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIc)之

另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(VIc)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

另一個實施例係關於具有式(VIc)之化合物，其包括

N -{4-[(3,5-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氯苯基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(四氢呋喃-3-基甲基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氢-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[(2S)-四氢呋喃-2-基甲基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二
氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[(2R)-四氢呋喃-2-基甲基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二
氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-[4-({[(1S)-2-羧基-1-苯基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-
二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-[4-({[(1S)-2-羧基-1-吡啶-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-
1,3-二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(四氢-2H-呋喃-2-基甲基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二
氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(四氢-2H-呋喃-3-基甲基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二
氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(四氢-2H-呋喃-4-基甲基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二
氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[(2S)-1-羧基-4-甲基戊-2-基]胺甲酰基}苯基)-1,3-
二氢-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲酰胺；

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-羥基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

○ N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

○ N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(5,6-二氫咪唑并[1,5-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(氮雜環丁烷-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(異丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(環戊基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-噻吩基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡咯啉-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-吡咯啉-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啉-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[(3R)-1-異丁醯基吡咯啉-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[(3R)-1-苯甲醯基吡咯啉-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(四氫呋喃-3-基羰基)吡咯啉-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(甲基磺醯基)吡咯啉-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(嗎啉-4-基)環戊基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氫雜螺[4.4]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氫雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氫雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,9-二氫雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氫雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氫雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氫雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-

二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(六氫-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

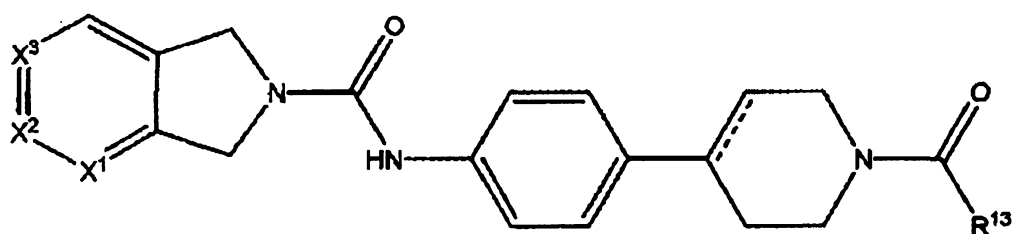
N-[4-(四氫-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(六氫呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-

二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

式(VIIc)之實施例

在另一個態樣中，本發明提供式(VIIc)化合物，



(VIIc);

及其醫藥學上可接受之鹽；其中 X¹、X²、X³ 及 R¹³ 如本文關於式(Ic)所述且  指示單鍵或雙鍵。

在式(VIIc)之一個實施例中，

X¹、X²及X³為CH；或

X¹及X³為CH；且X²為N；或

X¹及X³為CH；且X²為CR¹；或

X²及X³為CH；且X¹為CR¹；或

X¹為CH；且X²及X³為CR¹；或

X²為CH；且X¹及X³為N；或

X²及X³為CH；且X¹為N；或

X¹為CH；X²為N；且X³為CR¹；或

X¹為CR¹；X²為N；且X³為CH；或

X¹為N；X²為CR¹；且X³為CH；或

X¹為N；X²為CR¹；且X³為N；

 指示單鍵或雙鍵；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、 OH 、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$ 或 $C(O)NH_2$ ；

○ R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)R^6$ 、 SO_2R^6 、 $C(O)R^6$ 、 $CO(O)R^6$ 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NHS(O)_2R^6$ 、 $NR^6S(O)_2R^6$ 、 $NHC(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^6$ 、 $NHC(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^6C(O)NHR^6$ 、 $NR^6C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^6$ 、 $C(O)NHSO_2R^6$ 、 $C(O)NR^6SO_2R^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $SO_2N(R^6)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

○ R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $S(O)R^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $N(R^{10})_2$ 、 $C(O)R^{10}$ 、 $C(O)NH_2$ 、

$C(O)NHR^{10}$ 、 $C(O)N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)R^{10}$ 、 $NR^{10}C(O)R^{10}$ 、 $NHSO_2R^{10}$ 、 $NHC(O)OR^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{10} 、 $SO_2N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^6 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 $OC(O)R^{13}$ 、 $OC(O)OR^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)R^{13}$ 、 $NHS(O)_2R^{13}$ 、 $NR^{13}S(O)_2R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)OR^{13}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{13}$ 、 $NHC(O)N(R^{13})_2$ 、 $NR^{13}C(O)NHR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{13}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{13}$ 、 $C(O)NR^{13}SO_2R^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{13} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中

各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、 $NR^{14}S(O)_2R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)OR^{14}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{14}$ 、 $NHC(O)N(R^{14})_2$ 、 $NR^{14}C(O)NHR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{14}$ 、 $C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{14}$ 、 $C(O)NH SO_2R^{14}$ 、 $C(O)NR^{14}SO_2R^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{14} 、 $SO_2N(R^{14})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并 [3,2-c] 吡啶基、呋喃并 [3,2-c] 吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、 $NR^{15}C(O)NHR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{15}$ 、 $C(O)NH SO_2R^{15}$ 、 $C(O)NR^{15}SO_2R^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{15} 、

$\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為 N 。

在式(VIIc)之一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 N ；或 X^1 及 X^3 為 CH ，且 X^2 為 CR^1 ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 CR^1 ；或 X^1 為 CH ，且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或 X^2 為 CH ，且 X^1 及 X^3 為 N ；或 X^2 及 X^3 為 CH ，且 X^1 為 N ；或 X^1 為 CH ， X^2 為 N ，且 X^3 為 CR^1 ；或 X^1 為 CR^1 ， X^2 為 N ，且 X^3 為 CH ；或 X^1 為 N ， X^2 為 CR^1 ，且 X^3 為 CH ；或 X^1 為 N ， X^2 為

CR^1 ，且 X^3 為 N。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 N。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH；且 X^2 為 CR^1 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 CR^1 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 為 CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 為 CH；且 X^1 及 X^3 為 N。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為 CH；且 X^1 為 N。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 為 CH； X^2 為 N；且 X^3 為 CR^1 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 為 CR^1 ； X^2 為 N；且 X^3 為 CH。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 CH。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 為 N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為 N。

在式(VIIc)之一個實施例中， 為單鍵。在式(VIIc)之另一個實施例中， 為雙鍵。

在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基

或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 F 。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 Cl 。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 Br 。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 CN 。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 NH_2 。在式(VIIc)

之另一個實施例中， R^1 為 NO_2 。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 CF_3 。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 C(O)OH 。在式(VIIc)之另一個實施例中， R^1 為 C(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 、 OR^3 、 C(O)OR^3 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^3 、 NHC(O)R^3 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 C(O)OH ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為

CR^1 ; R^1 為 $C(O)OR^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIIc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; R^1 為 $C(O)NHR^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIIc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; R^1 為 $NHC(O)R^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIIc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; R^1 為 $NHSO_2R^3$; 其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基; 其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或 OH 取代; 其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式 (VIIc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式 (VIIc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 F 。在式 (VIIc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 Cl 。在式 (VIIc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 Br 。在式 (VIIc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 CN 。在式 (VIIc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 NH_2 。在式 (VIIc) 之另一個實施例中, X^1 及 X^3 為 CH ; 且 X^2 為 CR^1 ; 且 R^1 為 NO_2 。在

式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)OR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $C(O)NHR^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHC(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ； R^1 為 $NHSO_2R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)NH_2$ 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為F。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Cl。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為Br。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為CN。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(VIIc)之另一

個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 R^3 、 OR^3 、 $C(O)OR^3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NHSO_2R^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CF_3 或 $C(O)OH$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、

NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式 (VIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)OR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式 (VIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 C(O)NHR^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式 (VIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 NHC(O)R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式 (VIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ； R^1 為 NHSO_2R^3 ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 NHC(O)R^6 、 $\text{N(R}^6)_2$ 或 OH 取代；其中 R^6 為烷基或雜環基。
 在式 (VIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 C(O)NH_2 。在式 (VIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 F 。在式 (VIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Cl 。在式 (VIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 Br 。在式 (VIIc) 之另一個實施例中， X^1 為 CH ；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CN 。在式 (VIIc) 之另一個實施例中， X^1

為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NH_2 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 NO_2 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 CF_3 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)OH$ 。在式(VIIc)之另一個實施例中， X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；且 R^1 為 $C(O)R^3$ ；其中 R^3 為烷基、烯基或雜環基；其中各烷基視情況經一或多個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 NH_2 、 $NHC(O)R^6$ 、 $N(R^6)_2$ 或OH取代；且 R^6 為烷基或雜環基。

另一個實施例係關於具有式(VIIc)之化合物，其包括

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}-3,6-二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯；

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}哌啶-1-甲酸第三丁酯；

N-[4-(1-丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-D-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(乙氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(二甲基胺基)苯甲醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[4-(二甲基胺基)苯甲醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-噻吩基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡咯-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,5-二甲基-1H-吡咯-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫
吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,3-噻唑-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡唑-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3,5-二甲基-1,2-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫
吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異菸鹼醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(噻嗪-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嘧啶-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啉-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啉-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-

二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基哌啶-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(N,N-二甲基甘胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-2-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡咯啉-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲基-1,3-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-

4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2E)-3-(呋喃-2-基)丙-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,3-噁唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3,3,3-三氟丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,5-二甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲氧基環己基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,3-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,2-二氟環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(第三丁氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡

啉-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-乙氧基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啉-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-羥基-3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啉-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(1H-吡咯-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啉-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啉-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲基丙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啉-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1-甲基脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啉-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啉-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-羥基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啉-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啉-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啉-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-[4-(1-{[1-(甲氧基甲基)環丙基]羰基}-1,2,3,6-四氫吡啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啉-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(甲基磺醯基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啉-4-基})

苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-乙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2E)-4-甲基戊-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲氧基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊-1-烯-1-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(噻吩-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環己基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,2-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯

基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(甲氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,2-二甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲基己醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,2-二甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丁基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

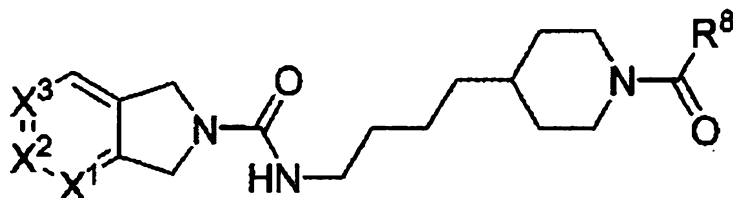
N-{4-[1-(哌啶-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[2-(吡咯啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

式(VIIIc)之實施例

因此，本發明之一個實施例係關於適用作NAMPT抑制劑之化合物或其醫藥學上可接受之鹽，該等化合物具有式(VIIIc)，



式(VIIIc)

其中

X¹、X²及X³為CH；或

X¹及X³為CH；且X²為N；或

X¹及X³為CH；且X²為CR¹；或

X²及X³為CH；且X¹為CR¹；或

X¹為CH；且X²及X³為CR¹；或

X²為CH；且X¹及X³為N；或

X²及X³為CH；且X¹為N；或

X¹為CH；X²為N；且X³為CR¹；或

X¹為CR¹；X²為N；且X³為CH；或

X¹為N；X²為CR¹；且X³為CH；或

X¹為N；X²為CR¹；且X³為N；

R¹為R³、OR³、SR³、S(O)R³、SO₂R³、C(O)R³、C(O)OR³、OC(O)R³、NHR³、N(R³)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR³、C(O)N(R³)₂、NHC(O)R³、NR³C(O)R³、NHC(O)OR³、

$\text{NR}^3\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 NHSO_2R^3 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^3$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、 OH 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 CF_3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 或 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ ；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^6$ 、 SO_2R^6 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{S}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $\text{N}(\text{R}^{10})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{10})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $\text{NR}^{10}\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $\text{NHSO}_2\text{R}^{10}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{10})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 N_3 、

CN、NH₂、CF₃、CF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；

R⁸在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各R⁸烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之R¹²、OR¹²、SR¹²、S(O)R¹²、SO₂R¹²、NHR¹²、N(R¹²)₂、C(O)R¹²、C(O)NH₂、C(O)NHR¹²、C(O)N(R¹²)₂、NHC(O)R¹²、NR¹²C(O)R¹²、NH₂SO₂R¹²、NHC(O)OR¹²、SO₂NH₂、SO₂NHR¹²、SO₂N(R¹²)₂、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR¹²、OH、(O)、C(O)OH、N₃、CN、NH₂、CF₃、CF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；

R¹⁰在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

R¹²在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各R¹²烷基、烯基及炔基視情況經一或多個烷氧基取代；

其中由R³、R⁶、R⁸、R¹⁰及R¹²表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之R¹³、OR¹³、SR¹³、S(O)R¹³、SO₂R¹³、C(O)R¹³、CO(O)R¹³、OC(O)R¹³、OC(O)OR¹³、NH₂、NHR¹³、N(R¹³)₂、NHC(O)R¹³、NR¹³C(O)R¹³、NHS(O)₂R¹³、NR¹³S(O)₂R¹³、NHC(O)OR¹³、NR¹³C(O)OR¹³、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR¹³、NHC(O)N(R¹³)₂、NR¹³C(O)NHR¹³、NR¹³C(O)N(R¹³)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR¹³、C(O)N(R¹³)₂、C(O)NHOH、C(O)NHOR¹³、C(O)NHSO₂R¹³、C(O)NR¹³SO₂R¹³、SO₂NH₂、SO₂NHR¹³、SO₂N(R¹³)₂、C(O)H、C(O)OH、OH、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、

OCF₃、OCF₂CF₃、SCF₃、F、Cl、Br或I取代；

R¹³在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫呋喃-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各R¹³烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之R¹⁴、OR¹⁴、SR¹⁴、S(O)R¹⁴、SO₂R¹⁴、C(O)R¹⁴、OC(O)R¹⁴、OC(O)OR¹⁴、NH₂、NHR¹⁴、N(R¹⁴)₂、NHC(O)R¹⁴、NR¹⁴C(O)R¹⁴、NHS(O)₂R¹⁴、NR¹⁴S(O)₂R¹⁴、NHC(O)OR¹⁴、NR¹⁴C(O)OR¹⁴、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR¹⁴、NHC(O)N(R¹⁴)₂、NR¹⁴C(O)NHR¹⁴、NR¹⁴C(O)N(R¹⁴)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR¹⁴、C(O)N(R¹⁴)₂、C(O)NHOH、C(O)NHOR¹⁴、C(O)NHSO₂R¹⁴、C(O)NR¹⁴SO₂R¹⁴、SO₂NH₂、SO₂NHR¹⁴、SO₂N(R¹⁴)₂、C(O)H、C(O)OH、OH、(O)、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、OCF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；其中各R¹³芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫呋喃-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視

情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、 $NR^{15}C(O)NHR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{15}$ 、 $C(O)NH SO_2R^{15}$ 、 $C(O)NR^{15}SO_2R^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{15} 、 $SO_2N(R^{15})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中 R^{16} 烷基視情況經 1、2、3 或 4 個烷氧基取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；其中 R^{15} 烷基視情況經 1、2、3 或 4 個烷氧基取代；

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中 R^{16} 烷基視情況經 1、2、3 或 4 個烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

發明專利說明書

101年7月9日	修正 補充
----------	----------

(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：100141323

※ 申請日：100.11.11

※IPC 分類：

一、發明名稱：(中文/英文)

NAMPT及ROCK抑制劑

NAMPT AND ROCK INHIBITORS

C07D 209/44 (2006.01)

C07D 403/12 (2006.01)

C07D 413/12 (2006.01)

C07D 471/04 (2006.01)

A61K 31/4035 (2006.01)

A61K 31/407 (2006.01)

A61P 9/10 (2006.01)

A61P 19/02 (2006.01)

A61P 29/00 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

A61P 37/06 (2006.01)

二、中文發明摘要：

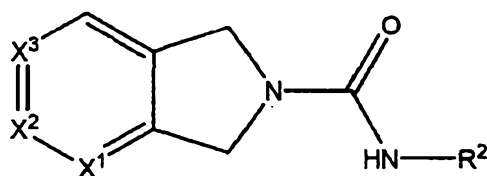
本發明揭示抑制NAMPT活性之化合物、含有該等化合物之組合物及治療其中表現NAMPT之疾病之方法。揭示抑制ROCK活性之化合物、含有該等化合物之組合物及治療其中表現ROCK之疾病之方法。

三、英文發明摘要：

Disclosed are compounds which inhibit the activity of NAMPT, compositions containing the compounds and methods of treating diseases during which NAMPT is expressed. Disclosed are compounds which inhibit the activity of ROCK, compositions containing the compounds and methods of treating diseases during which ROCK is expressed.

七、申請專利範圍：

1. 一種式(Ic)化合物及其醫藥學上可接受之鹽，



式(Ic)；

其中

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、F、Cl、

Br、I、CN、NH₂、NO₂、N₃、OH、C(O)H、CF₃、
C(O)OH或C(O)NH₂；

R²為烷基、烯基、炔基、苯基、雜環基、環烷基或環
烯基；其中各R²烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4
個獨立選擇之R⁴、OR⁴、SR⁴、S(O)R⁴、SO₂R⁴、
C(O)R⁴、CO(O)R⁴、OC(O)R⁴、OC(O)OR⁴、NHC(O)R⁴、
NR⁴C(O)R⁴、NHS(O)₂R⁴、NR⁴S(O)₂R⁴、NHC(O)OR⁴、
NR⁴C(O)OR⁴、NHC(O)NH₂、NHC(O)NHR⁴、NHC(O)N(R⁴)₂、
NR⁴C(O)NHR⁴、NR⁴C(O)N(R⁴)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR⁴、
C(O)N(R⁴)₂、C(O)NHOH、C(O)NHOR⁴、C(O)NHSO₂R⁴、
C(O)NR⁴SO₂R⁴、SO₂NH₂、SO₂NHR⁴、SO₂N(R⁴)₂、
C(O)H、(O)、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、OCF₃、
OCF₂CF₃、F、Cl、Br或I取代；其中各R²苯基視情況在
對位經1個獨立選擇之R⁵、OR⁵、SR⁵、S(O)R⁵、SO₂R⁵、
C(O)R⁵、CO(O)R⁵、OC(O)R⁵、OC(O)OR⁵、NH₂、
NHR⁵、N(R⁵)₂、NHC(O)R⁵、NR⁵C(O)R⁵、NHS(O)₂R⁵、
NR⁵S(O)₂R⁵、NHC(O)OR⁵、NR⁵C(O)OR⁵、NHC(O)NH₂、
NHC(O)NHR⁵、NHC(O)N(R⁵)₂、NR⁵C(O)NHR⁵、
NR⁵C(O)N(R⁵)₂、C(O)NH₂、C(O)NHR⁵、C(O)N(R⁵)₂、
CHNOR⁵、C(O)NHOH、C(O)NHOR⁵、C(O)NHSO₂R⁵、
C(O)NR⁵SO₂R⁵、SO₂NH₂、SO₂NHR⁵、SO₂N(R⁵)₂、
C(O)H、C(O)OH、OH、CN、N₃、NO₂、CF₃、CF₂CF₃、
OCF₃、OCF₂CF₃、Br或I取代；其中各R²苯基視情況另外
經1個F取代；其中各R²雜環基、環烷基及環烯基視情況

經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^5 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)R^5$ 、 SO_2R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $CO(O)R^5$ 、 $OC(O)R^5$ 、 $OC(O)OR^5$ 、 NH_2 、 NHR^5 、 $N(R^5)_2$ 、 $NHC(O)R^5$ 、 $NR^5C(O)R^5$ 、 $NHS(O)_2R^5$ 、 $NR^5S(O)_2R^5$ 、 $NHC(O)OR^5$ 、 $NR^5C(O)OR^5$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^5$ 、 $NHC(O)N(R^5)_2$ 、 $NR^5C(O)NHR^5$ 、 $NR^5C(O)N(R^5)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^5$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^5$ 、 $C(O)NHSO_2R^5$ 、 $C(O)NR^5SO_2R^5$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^5 、 $SO_2N(R^5)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經 1、2、3 或 4 個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)R^6$ 、 SO_2R^6 、 $C(O)R^6$ 、 $CO(O)R^6$ 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NHS(O)_2R^6$ 、 $NR^6S(O)_2R^6$ 、 $NHC(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^6$ 、 $NHC(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^6C(O)NHR^6$ 、 $NR^6C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^6$ 、 $C(O)NHSO_2R^6$ 、 $C(O)NR^6SO_2R^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $SO_2N(R^6)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^4 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、環烷基或雜環基；其中各 R^4 烷基、烯基及炔基視情

況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^7 、 OR^7 、 SR^7 、 $S(O)R^7$ 、 SO_2R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $OC(O)R^7$ 、 $OC(O)OR^7$ 、 NH_2 、 NHR^7 、 $NHC(O)R^7$ 、 $NR^7C(O)R^7$ 、 $NHS(O)_2R^7$ 、 $NR^7S(O)_2R^7$ 、 $NHC(O)OR^7$ 、 $NR^7C(O)OR^7$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^7$ 、 $NHC(O)N(R^7)_2$ 、 $NR^7C(O)NHR^7$ 、 $NR^7C(O)N(R^7)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^7$ 、 $C(O)N(R^7)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^7$ 、 $C(O)NHSO_2R^7$ 、 $C(O)NR^7SO_2R^7$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^7 、 $SO_2N(R^7)_2$ 、 $C(O)H$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^4 芳基及雜環基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^8 、 OR^8 、 SR^8 、 $S(O)R^8$ 、 SO_2R^8 、 $C(O)R^8$ 、 $CO(O)R^8$ 、 $OC(O)R^8$ 、 $OC(O)OR^8$ 、 NH_2 、 NHR^8 、 $NHC(O)R^8$ 、 $NR^8C(O)R^8$ 、 $NHS(O)_2R^8$ 、 $NR^8S(O)_2R^8$ 、 $NHC(O)OR^8$ 、 $NR^8C(O)OR^8$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^8$ 、 $NHC(O)N(R^8)_2$ 、 $NR^8C(O)NHR^8$ 、 $NR^8C(O)N(R^8)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^8$ 、 $C(O)N(R^8)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^8$ 、 $C(O)NHSO_2R^8$ 、 $C(O)NR^8SO_2R^8$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^8 、 $SO_2N(R^8)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、 $S(O)R^9$ 、 SO_2R^9 、 $C(O)R^9$ 、 $CO(O)R^9$ 、 $OC(O)R^9$ 、 $OC(O)OR^9$ 、 NH_2 、 NHR^9 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)R^9$ 、 $NHS(O)_2R^9$ 、

$\text{NR}^9\text{S}(\text{O})_2\text{R}^9$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{C}(\text{O})\text{OR}^9$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、
 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^9$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^9)_2$ 、 $\text{NR}^9\text{C}(\text{O})\text{NHR}^9$ 、
 $\text{NR}^9\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^9)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^9$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^9)_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^9$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^9$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^9\text{SO}_2\text{R}^9$ 、
 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^9)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、
 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、
 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

○

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $\text{N}(\text{R}^{10})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{10})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $\text{NR}^{10}\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $\text{NHSO}_2\text{R}^{10}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{10})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

○

R^7 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^7 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{11} 、 OR^{11} 、 SR^{11} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{11}$ 、 SO_2R^{11} 、 NHR^{11} 、 $\text{N}(\text{R}^{11})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{11}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{11})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{11}$ 、 $\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$ 、 $\text{NHSO}_2\text{R}^{11}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{11}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{11}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{11})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{11}$ 、 OH 、 (O) 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、

Cl、Br或I取代；

R^8 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^8 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{12} 、 OR^{12} 、 SR^{12} 、 $S(O)R^{12}$ 、 SO_2R^{12} 、 NHR^{12} 、 $N(R^{12})_2$ 、 $C(O)R^{12}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{12}$ 、 $C(O)N(R^{12})_2$ 、 $NHC(O)R^{12}$ 、 $NR^{12}C(O)R^{12}$ 、 $NHSO_2R^{12}$ 、 $NHC(O)OR^{12}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{12} 、 $SO_2N(R^{12})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{12}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、 OH 、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

R^{11} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

R^{12} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{12} 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個烷氧基取代；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 及 R^{12} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、

CO(O)R^{13} 、 OC(O)R^{13} 、 OC(O)OR^{13} 、 NH_2 、 NHR^{13} 、
 $\text{N(R}^{13})_2$ 、 NHC(O)R^{13} 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)R}^{13}$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{13}$ 、
 $\text{NR}^{13}\text{S(O)}_2\text{R}^{13}$ 、 NHC(O)OR^{13} 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)OR}^{13}$ 、 NHC(O)NH_2 、
 NHC(O)NHR^{13} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{13})_2$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)NHR}^{13}$ 、
 $\text{NR}^{13}\text{C(O)N(R}^{13})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{13} 、 $\text{C(O)N(R}^{13})_2$ 、
 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{13} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{C(O)NR}^{13}\text{SO}_2\text{R}^{13}$ 、
 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{13})_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、
 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 S(O)R^{14} 、 SO_2R^{14} 、 C(O)R^{14} 、 OC(O)R^{14} 、 OC(O)OR^{14} 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $\text{N(R}^{14})_2$ 、 NHC(O)R^{14} 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)R}^{14}$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{S(O)}_2\text{R}^{14}$ 、 NHC(O)OR^{14} 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)OR}^{14}$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{14} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{14})_2$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)NHR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C(O)N(R}^{14})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{14} 、 $\text{C(O)N(R}^{14})_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{14} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{C(O)NR}^{14}\text{SO}_2\text{R}^{14}$ 、

SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、
 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、
 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHSO}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{15}\text{SO}_2\text{R}^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br

或I取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、OH、F、Cl、Br或I取代；其中該 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；其中該 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中該 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

○

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH且 R^2 為苯基時， R^5 不為甲基；

其限制條件為當 X^1 、 X^2 及 X^3 為CH且 R^2 為經 OR^5 取代之苯基時， R^5 不為甲基；

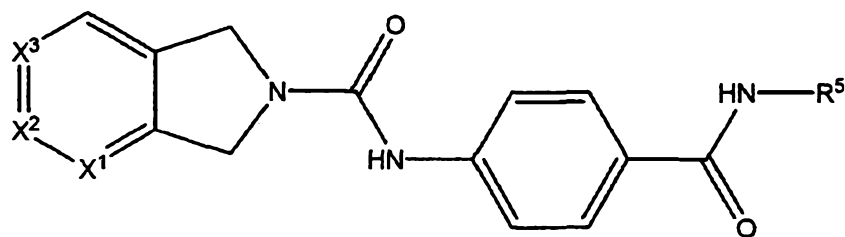
其限制條件為當 R^2 為未經取代之烷基或視情況經取代之烷基時， R^2 為 C_4 - C_6 烷基；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

○

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為N。

2. 一種具有式(Vc)之化合物或其醫藥學上可接受之鹽，



(Vc);

其中

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、OH、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$ 或 $C(O)NH_2$ ；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)R^6$ 、 SO_2R^6 、 $C(O)R^6$ 、 $CO(O)R^6$ 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、

$N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NHS(O)_2R^6$ 、 $NR^6S(O)_2R^6$ 、
 $NHC(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^6$ 、
 $NHC(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^6C(O)NHR^6$ 、 $NR^6C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、
 $C(O)NHR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^6$ 、
 $C(O)NHSO_2R^6$ 、 $C(O)NR^6SO_2R^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、
 $SO_2N(R^6)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、
 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取
 代；

○

R^5 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳
 基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^5 烷基、烯基及
 炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^9 、 OR^9 、 SR^9 、
 $S(O)R^9$ 、 SO_2R^9 、 $C(O)R^9$ 、 $CO(O)R^9$ 、 $OC(O)R^9$ 、 $OC(O)OR^9$ 、
 NH_2 、 NHR^9 、 $N(R^9)_2$ 、 $NHC(O)R^9$ 、 $NR^9C(O)R^9$ 、
 $NHS(O)_2R^9$ 、 $NR^9S(O)_2R^9$ 、 $NHC(O)OR^9$ 、 $NR^9C(O)OR^9$ 、
 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^9$ 、 $NHC(O)N(R^9)_2$ 、 $NR^9C(O)NHR^9$ 、
 $NR^9C(O)N(R^9)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^9$ 、 $C(O)N(R^9)_2$ 、
 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^9$ 、 $C(O)NHSO_2R^9$ 、 $C(O)NR^9SO_2R^9$ 、
 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^9 、 $SO_2N(R^9)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、
 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

○

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳
 基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及
 炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、
 SR^{10} 、 $S(O)R^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $N(R^{10})_2$ 、 $C(O)R^{10}$ 、

C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{10} 、 $\text{C(O)N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)R^{10} 、 $\text{NR}^{10}\text{C(O)R}^{10}$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^{10}$ 、 NHC(O)OR^{10} 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{10})_2$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{10} 、 OH 、 (O) 、 C(O)OH 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^9 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^9 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之烷氧基、 OH 、環烷基、芳基或雜環基取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^9 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 S(O)R^{13} 、 SO_2R^{13} 、 C(O)R^{13} 、 CO(O)R^{13} 、 OC(O)R^{13} 、 OC(O)OR^{13} 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $\text{N(R}^{13})_2$ 、 NHC(O)R^{13} 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)R}^{13}$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{S(O)}_2\text{R}^{13}$ 、 NHC(O)OR^{13} 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)OR}^{13}$ 、 NHC(O)NH_2 、 NHC(O)NHR^{13} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{13})_2$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)NHR}^{13}$ 、 $\text{NR}^{13}\text{C(O)N(R}^{13})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{13} 、 $\text{C(O)N(R}^{13})_2$ 、 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{13} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{13}$ 、 $\text{C(O)NR}^{13}\text{SO}_2\text{R}^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{13}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{13})_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、

噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2*H*-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、 $NR^{14}S(O)_2R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)OR^{14}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{14}$ 、 $NHC(O)N(R^{14})_2$ 、 $NR^{14}C(O)NHR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{14}$ 、 $C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{14}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{14}$ 、 $C(O)NR^{14}SO_2R^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{14} 、 $SO_2N(R^{14})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻嗪基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2*H*-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、

NHR^{15} 、 $\text{N(R}^{15})_2$ 、 NHC(O)R^{15} 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)R}^{15}$ 、 $\text{NHS(O)}_2\text{R}^{15}$ 、
 $\text{NR}^{15}\text{S(O)}_2\text{R}^{15}$ 、 NHC(O)OR^{15} 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)OR}^{15}$ 、 NHC(O)NH_2 、
 NHC(O)NHR^{15} 、 $\text{NHC(O)N(R}^{15})_2$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C(O)NHR}^{15}$ 、
 $\text{NR}^{15}\text{C(O)N(R}^{15})_2$ 、 C(O)NH_2 、 C(O)NHR^{15} 、 $\text{C(O)N(R}^{15})_2$ 、
 C(O)NHOH 、 C(O)NHOR^{15} 、 $\text{C(O)NHSO}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{C(O)NR}^{15}\text{SO}_2\text{R}^{15}$ 、
 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{SO}_2\text{N(R}^{15})_2$ 、 C(O)H 、 C(O)OH 、
 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、
 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 C(O)H 、 C(O)OH 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

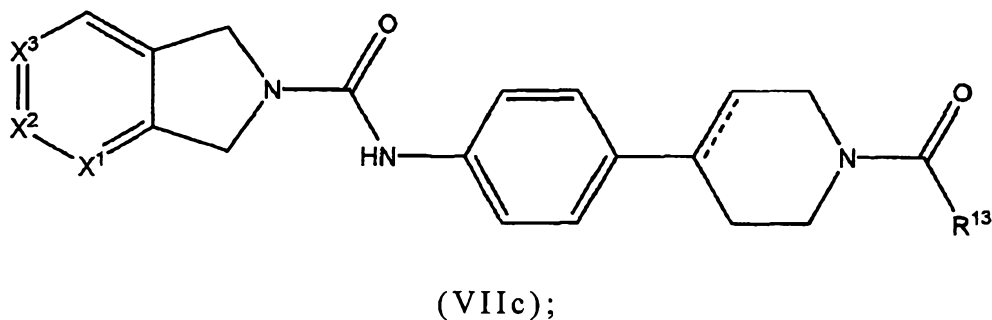
R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中該 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中該 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為 N 。

3. 一種具有式(VIIc)之化合物或其醫藥學上可接受之鹽，



其中

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N；

/// 指示單鍵或雙鍵；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、

$\text{NH}\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{NHR}^3$ 、 $\text{NR}^3\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{NHR}^3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、 OH 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 CF_3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 或 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ ；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^6$ 、 SO_2R^6 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{S}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $\text{N}(\text{R}^{10})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{10})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $\text{NR}^{10}\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^{10}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{10})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

其中由 R^3 、 R^6 及 R^{10} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 $OC(O)R^{13}$ 、 $OC(O)OR^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)R^{13}$ 、 $NHS(O)_2R^{13}$ 、 $NR^{13}S(O)_2R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)OR^{13}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{13}$ 、 $NHC(O)N(R^{13})_2$ 、 $NR^{13}C(O)NHR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{13}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{13}$ 、 $C(O)NR^{13}SO_2R^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{13} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、 $C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、

$\text{NR}^{14}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、
 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、
 $\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、
 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^{14}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{14}\text{SO}_2\text{R}^{14}$ 、
 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{14}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{14})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、
 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、
 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-*c*]吡啶基、呋喃并[3,2-*c*]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2*H*-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{CO}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{15}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{NR}^{15}\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHOR}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^{15}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{15}\text{SO}_2\text{R}^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^{15}$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{15})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳

基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、 OH 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

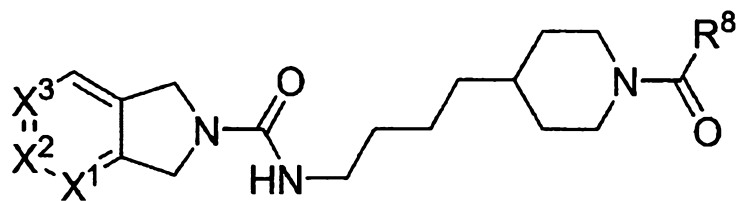
R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中該 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；且

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中該 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為 N 。

4. 一種具有式(VIIIc)之化合物或其醫藥學上可接受之鹽，



(VIIIc);

其中

X^1 、 X^2 及 X^3 為 CH ；或

X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 N ；或

X^1 及 X^3 為 CH ；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 ；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N；

R^1 為 R^3 、 OR^3 、 SR^3 、 $S(O)R^3$ 、 SO_2R^3 、 $C(O)R^3$ 、 $C(O)OR^3$ 、 $OC(O)R^3$ 、 NHR^3 、 $N(R^3)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^3$ 、 $C(O)N(R^3)_2$ 、 $NHC(O)R^3$ 、 $NR^3C(O)R^3$ 、 $NHC(O)OR^3$ 、 $NR^3C(O)OR^3$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^3 、 $SO_2N(R^3)_2$ 、 $NHSO_2R^3$ 、 $NR^3SO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、 $NHSO_2N(R^3)_2$ 、 $NR^3SO_2NHR^3$ 、 $NR^3SO_2N(R^3)_2$ 、 $C(O)NHSO_2R^3$ 、 $NHSO_2NHR^3$ 、F、Cl、Br、I、CN、 NH_2 、 NO_2 、 N_3 、OH、 $C(O)H$ 、 CF_3 、 $C(O)OH$ 或 $C(O)NH_2$ ；

R^3 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基或雜環基；其中各 R^3 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^6 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)R^6$ 、 SO_2R^6 、 $C(O)R^6$ 、 $CO(O)R^6$ 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 NH_2 、 NHR^6 、 $N(R^6)_2$ 、 $NHC(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NHS(O)_2R^6$ 、 $NR^6S(O)_2R^6$ 、 $NHC(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^6$ 、 $NHC(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^6C(O)NHR^6$ 、 $NR^6C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^6$ 、

$C(O)NHSO_2R^6$ 、 $C(O)NR^6SO_2R^6$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^6 、 $SO_2N(R^6)_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^6 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^6 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{10} 、 OR^{10} 、 SR^{10} 、 $S(O)R^{10}$ 、 SO_2R^{10} 、 NHR^{10} 、 $N(R^{10})_2$ 、 $C(O)R^{10}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{10}$ 、 $C(O)N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)R^{10}$ 、 $NR^{10}C(O)R^{10}$ 、 $NHSO_2R^{10}$ 、 $NHC(O)OR^{10}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{10} 、 $SO_2N(R^{10})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{10}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^8 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^8 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{12} 、 OR^{12} 、 SR^{12} 、 $S(O)R^{12}$ 、 SO_2R^{12} 、 NHR^{12} 、 $N(R^{12})_2$ 、 $C(O)R^{12}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{12}$ 、 $C(O)N(R^{12})_2$ 、 $NHC(O)R^{12}$ 、 $NR^{12}C(O)R^{12}$ 、 $NHSO_2R^{12}$ 、 $NHC(O)OR^{12}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{12} 、 $SO_2N(R^{12})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{12}$ 、 OH 、 (O) 、 $C(O)OH$ 、 N_3 、 CN 、 NH_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{10} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；

R^{12} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{12} 烷基、烯基及炔基視情況經一或多個烷氧基取代；

其中由 R^3 、 R^6 、 R^8 、 R^{10} 及 R^{12} 表示之環狀部分視情況經1、2、3、4、5或6個獨立選擇之 R^{13} 、 OR^{13} 、 SR^{13} 、 $S(O)R^{13}$ 、 SO_2R^{13} 、 $C(O)R^{13}$ 、 $CO(O)R^{13}$ 、 $OC(O)R^{13}$ 、 $OC(O)OR^{13}$ 、 NH_2 、 NHR^{13} 、 $N(R^{13})_2$ 、 $NHC(O)R^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)R^{13}$ 、 $NHS(O)_2R^{13}$ 、 $NR^{13}S(O)_2R^{13}$ 、 $NHC(O)OR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)OR^{13}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{13}$ 、 $NHC(O)N(R^{13})_2$ 、 $NR^{13}C(O)NHR^{13}$ 、 $NR^{13}C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{13}$ 、 $C(O)N(R^{13})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{13}$ 、 $C(O)NHSO_2R^{13}$ 、 $C(O)NR^{13}SO_2R^{13}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{13} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 SCF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；

R^{13} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫呋喃-3-基、二噁烷基、四氫呋喃基、呋喃基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基或環烯基；其中各 R^{13} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{14} 、 OR^{14} 、 SR^{14} 、 $S(O)R^{14}$ 、 SO_2R^{14} 、

$C(O)R^{14}$ 、 $OC(O)R^{14}$ 、 $OC(O)OR^{14}$ 、 NH_2 、 NHR^{14} 、 $N(R^{14})_2$ 、 $NHC(O)R^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)R^{14}$ 、 $NHS(O)_2R^{14}$ 、 $NR^{14}S(O)_2R^{14}$ 、 $NHC(O)OR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)OR^{14}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{14}$ 、 $NHC(O)N(R^{14})_2$ 、 $NR^{14}C(O)NHR^{14}$ 、 $NR^{14}C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{14}$ 、 $C(O)N(R^{14})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{14}$ 、 $C(O)NH SO_2R^{14}$ 、 $C(O)NR^{14}SO_2R^{14}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{14} 、 $SO_2N(R^{14})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 (O) 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 或 I 取代；其中各 R^{13} 芳基、四氫呋喃基、噻吩基、吡嗪基、嘧啶基、吡啶基、噻吩并[3,2-c]吡啶基、呋喃并[3,2-c]吡啶基、吡咯啉-2-酮基、1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基、1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-3-基、二噁烷基、四氫哌喃基、哌啶基、嘧啶基、噁唑基、吡唑基、噻唑基、吡咯啉基、吡咯基、噻吩基、呋喃基、嗎啉基、異噁唑基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{15} 、 OR^{15} 、 SR^{15} 、 $S(O)R^{15}$ 、 SO_2R^{15} 、 $C(O)R^{15}$ 、 $CO(O)R^{15}$ 、 $OC(O)R^{15}$ 、 $OC(O)OR^{15}$ 、 NH_2 、 NHR^{15} 、 $N(R^{15})_2$ 、 $NHC(O)R^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 $NHS(O)_2R^{15}$ 、 $NR^{15}S(O)_2R^{15}$ 、 $NHC(O)OR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{15}$ 、 $NHC(O)N(R^{15})_2$ 、 $NR^{15}C(O)NHR^{15}$ 、 $NR^{15}C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{15}$ 、 $C(O)N(R^{15})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{15}$ 、 $C(O)NH SO_2R^{15}$ 、 $C(O)NR^{15}SO_2R^{15}$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^{15} 、 $SO_2N(R^{15})_2$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 OH 、 CN 、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、

OCF_3 、 OCF_2CF_3 、F、Cl、Br或I取代；

R^{14} 在每次出現時為獨立選擇之烷基、烯基、炔基、芳基、雜環基、環烷基或環烯基；其中各 R^{14} 烷基、烯基及炔基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之雜環基、烷氧基、 NH_2 、 SO_2NH_2 、 $\text{C}(\text{O})\text{H}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、OH、(O)、CN、 N_3 、 NO_2 、 CF_3 、 CF_2CF_3 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、F、Cl、Br或I取代；其中各 R^{14} 芳基、雜環基、環烷基及環烯基視情況經1、2、3或4個獨立選擇之 R^{16} 、 OR^{16} 、OH、F、Cl、Br或I取代；其中該 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

R^{15} 在每次出現時為獨立選擇之烷基；其中該 R^{15} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

R^{16} 在每次出現時為獨立選擇之烷基，其中該 R^{16} 烷基視情況經1、2、3或4個烷氧基取代；

其限制條件為當 R^{13} 為哌啶基時，其為經取代之哌啶基；且

其限制條件為當 R^{13} 為吡咯啉基時， X^1 、 X^2 及 X^3 中至少一者為N。

5. 如請求項1、請求項2、請求項3或請求項4之化合物或其醫藥學上可接受之鹽；其中

X^1 、 X^2 及 X^3 為CH，或

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為 CR^1 ；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為 CR^1 ；或

X^1 為CH；且 X^2 及 X^3 為 CR^1 。

6. 如請求項1、請求項2、請求項3或請求項4之化合物或其醫藥學上可接受之鹽；其中

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N；或

X^2 為CH；且 X^1 及 X^3 為N；或

X^2 及 X^3 為CH；且 X^1 為N；或

X^1 為CH； X^2 為N；且 X^3 為 CR^1 ；或

X^1 為 CR^1 ； X^2 為N；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為CH；或

X^1 為N； X^2 為 CR^1 ；且 X^3 為N。

7. 如請求項1、請求項2、請求項3或請求項4之化合物或其醫藥學上可接受之鹽；其中

X^1 及 X^3 為CH；且 X^2 為N。

8. 如請求項1之化合物或其醫藥學上可接受之鹽；其中

R^2 為在對位經 R^5 取代之苯基；且

R^5 為酞嗪-1(2H)-酮基、異喹啉基、異喹啉-1(2H)-酮基、5,6,7,8-四氫酞嗪-1(2H)-酮基、5-氟酞嗪-1(2H)-酮基、(Z)-3H-苯并[d][1,2]二氮呋-4(5H)-酮基、5-(三氟甲基)酞嗪-1(2H)-酮基、吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-1(2H)-酮或異吲哚啉-1-酮基。

9. 如請求項1之化合物，其係選自由以下組成之群：

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(胺基甲基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(呋喃并[3,2-c]吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(苯甲基胺甲鹽基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,4-二甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(噻吩并[3,2-c]吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,3-二甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[4-(噻嗪-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二氫-1,4-苯并二氧雜環己烯-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氟苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-5-甲基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(4-氟基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-3-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啶-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-氟-5-(三氟甲基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-硝基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

○ 5-甲基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-噻吩基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[4-(嘧啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-甲氧基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(3-甲氧基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(4-乙醯基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,3-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-噻吩基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氯-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(6-胺基己基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氯-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(苯甲基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(噻嗪-3-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(3-氟苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,4-二羥基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-丙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(2-氟基苯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基-2-甲基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基-1H-吡啶-5-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二
氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5-(三氟甲
基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-
1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-苯甲基-1H-吡啶-4-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二
氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-({4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯甲鹽基}
胺基)-1H-吡啶-3-甲酸甲酯；

N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啉-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-
1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-
異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(5-氯吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1H-吡啶-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-
2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,3-二氫-1,4-苯并二氧雜環己烯-6-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(5-甲氧基-1H-吲哚-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-氯苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-丙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-4-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[5-(三氟甲基)吡啶-2-基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[4-(二甲基胺基)苯基]乙基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(三氟甲氧基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟-4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○ N-(4-{[2-(2-氟苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(異丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

4-氯-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-氟苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啉-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N²-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

N-{4-[(2-苯氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-羥基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3-氟苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({1-[(3S)-四氫呋喃-3-基]-1H-吡唑-4-基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-{4-[(2-苯基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(甲基硫基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-{4-[(2-氟苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({4-[(三氟甲基)硫基]苯甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(2-氟苯基)吡咯啉-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(1H-咪唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3-氯苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(羥基甲基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-異丙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,5-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(硫嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(5,6-二氫咪唑并[1,5-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(2-呋喃甲鹽基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-苯甲基哌啶-4-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(5-乙鹽胺基-2-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({2-[3-(三氟甲基)苯基]乙基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1H-咪唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-(3-氟基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[苯甲基(2-羥基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-氟基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-氟基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(吡啶-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(氟基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(環己基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-
甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[丁基(甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(3,4-二氮異喹啉-2(1H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(1,3-二氮-2H-異吡啶-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(2,3-二氮-1H-吡啶-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(苯基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-氟苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(二乙基胺基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-羥基-2-苯基乙基)(甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-胺基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

(1-{4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}哌啶-4-基)胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(環己基甲基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-氯苯基)-1H-吡唑-4-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二乙基胺甲醯基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-羥基乙基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-6-甲基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(5,6-二氫[1,2,4]三唑并[4,3-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(5-氟吡啶-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基甲基)(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3,4,9-四氫-2H-β-咔啉-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(第三丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[4-(三氟甲基)苯基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二氟吡咯啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-苯甲基吡咯啶-3-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(環戊基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-胺甲醯基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(環丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(甲基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(戊-2-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(戊-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(環丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1,3-二氧戊環-2-基甲基)(甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(4-氟苯基)-1H-吡唑-4-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-苯基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({2-[4-(三氟甲基)苯基]乙基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(第二丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[雙(2-乙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[丁基(乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[異丁基(甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-胺甲鹽基苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-2-(三氟甲基)吡咯啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲基吡咯啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[乙基(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,6-二甲基嗎啉-4-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,5-二甲基吡咯啉-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙-2-炔-1-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[異丙基(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[異丙基(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氰基乙基)(環丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[乙基(異丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟吡咯啉-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}-N-異丙基-β-丙胺酸；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚

啉-2-甲醯胺；

5,6-二甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(4-氯苯氧基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯基-1,3-噁唑-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

2-{[4-(丙基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}異吲啉-5-甲酸甲酯；

2-{[4-(丙基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}異吲啉-5-甲酸；

5-胺基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

5-(胺基甲基)-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

5-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

5-乙醯胺基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

5-[(N,N-二甲基甘胺醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)

苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-(1H-吡唑-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-(1H-吡唑-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(甲氧基乙醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(甲基磺醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-溴-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氯苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4,4,4-三氟丁醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異

吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙酰基)胺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(4-苯基丁酰基)胺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(4-甲基戊酰基)胺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[(苯甲氧基)乙酰基]胺基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(3-苯基丙酰基)胺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(3-苯氧基丙酰基)胺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[N-(2-呋喃甲酰基)甘胺酰基]胺基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[4-(2-噻吩基)丁酰基]胺基}苯基)-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(4-側氧基-4-苯基丁酰基)胺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(N-苯甲酰基甘胺酰基)胺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(4-苯氧基丁酰基)胺基]苯基}-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-[4-(丙酰基胺基)苯基]-1,3-二氢-2H-異吡啶-2-甲酰胺

胺；

N-[4-(戊醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯

胺；

N-[4-(己醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯

胺；

N-[4-(庚醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯

胺；

N-[4-(戊-4-烯醯基胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-

甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲

哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲

哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲

哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]胺基}苯基)-1,3-二

氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-

5-甲酸甲酯；

2-({4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}胺甲醯基)異吲哚啉-

5-甲酸；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-環戊基乙基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氮-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}-3,6-二氮吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯；

N-[4-(1,2,3,6-四氮吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-甲基-1H-吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1E)-5-苯基戊-1-烯-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙基-1H-吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲基-1H-吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基乙基)-1H-吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[6-(1-丙基-1H-吡啶-4-基)吡啶-3-基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡啶-4-基]吡啶-3-基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-苯基戊基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯

胺；

N-[2-氟-4-(1-丙基-1H-吡唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{2-氟-4-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(異丙基磺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-苯甲醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-苯甲醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(異丙基磺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯基磺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(苯甲醯基胺基)吡咯啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(丁醯基胺基)吡咯啉-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}哌嗪-1-甲酸第三丁酯；

N-[4-(4-丙醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環丙基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(2-丁醯基-2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(2-異丁醯基-2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(2-苯甲醯基-2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[2-(3-甲基丁基)-2,3-二氫-1H-異吲哚-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(己氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-3-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[6-(4-氯苯氧基)己基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N,N'-己-1,6-二基雙(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺)；

N-(4-苯基丁基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

6-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]己酸乙酯；

N-己基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-辛基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)胺基]-6-側氧基己基}-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[6-(甲基胺基)-6-側氧基己基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-側氧基-6-[(3-苯基丙基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-甲基丁基)胺基]-6-側氧基己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(5-{[4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基]羰基}吡啶-2-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]-1,3-噻唑-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]-1,3-噻唑-2-基}-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氮酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4,5,6,7,8-六氮酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(8-氟-4-側氧基-3,4-二氮酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氮酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氮酞嗪-1-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(嗎啉-4-基甲基)-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氮酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氮異喹啉-4-基)苯基]-

1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氯-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-4,5-二氫-3H-2,3-苯并二氮呋-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-側氧基-8-(三氟甲基)-3,4-二氫酞嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-[(二甲基胺基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-[(二乙基胺基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-[(二甲基胺基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-[(二乙基胺基)甲基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-側氧基-8-(三氟甲基)-3,4-二氫酞嗪-1-基]苯基}-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-[(1-甲基哌啶-4-基)氧基]-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-{\[(3R)-3-氟吡咯啉-1-基]甲基}-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-{\[(3S)-3-氟吡咯啉-1-基]甲基}-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(氮雜環丁烷-1-基甲基)-N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫吡咯并[1,2-d][1,2,4]三嗪-4-基)苯基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}哌啶-1-甲酸第三丁酯；

N-[4-(5-丙基-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲

啉-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(3-甲基丁基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二
氮-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-[4-(5-苯甲基-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氮-2H-
異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-
二氮-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-
二氮-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異
吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(5-氯吡啶-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異
吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基-4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
氮-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-側氧基吡咯啶-1-基)苯基]胺甲醯基}苯
基)-1,3-二氮-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基-2,3-二氮-1H-茛-1-基]胺甲醯
基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-羥基環丙基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-
2H-異吲啉-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氮-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{6-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]-1H-苯并咪唑-2-基}哌嗪-1-甲酸第三丁酯；

N-[2-(哌嗪-1-基)-1H-苯并咪唑-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-乙烯基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-苯甲醯基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(四氫呋喃-3-基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基丁基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(3-苯基丙基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡

咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(四氫呋喃-3-基甲基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-甲氧基乙基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-(2-羥基乙基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-3-基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-4-基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N⁵-(2-甲氧基乙基)-N²-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

N-(4-氟基苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(三氟甲基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-吡啶-2-基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基丁基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(四氫呋喃-3-基甲基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(4-吡啶-2-基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-吡啶-2-基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(1,2-二羥基乙基)-N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-5-氟基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-丁醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；及

N-[2-(4-乙醯基哌嗪-1-基)-1H-苯并咪唑-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-D-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(甲氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(乙氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-氯苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(二甲基胺基)苯甲醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[4-(二甲基胺基)苯甲醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-呋喃甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-噻吩基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡咯-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,5-二甲基-1H-吡咯-3-基)羰基]-1,2,3,6-四
氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,3-噻唑-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]
苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡唑-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3,5-二甲基-1,2-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四
氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異菸鹼醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(噻嗪-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嘧啶-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-苯甲醯基-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[6-(苯甲醯基胺基)己基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[(苯甲醯基胺基)甲基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(5-側氧基-L-脯胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(5-側氧基-D-脯胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(1-乙醯基哌啶-4-基)羰基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-乙醯胺基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[4-(甲基磺醯基)苯甲醯基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-丁醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-異丁醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-甲基丁醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3,3,3-三氟丙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(甲氧基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫呋喃-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫呋喃-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環戊基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環己基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-甲氧基苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(3-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-氯苯甲酰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[4-(4-氯苯甲酰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[4-(3-氯基苯甲酰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[4-(4-氯基苯甲酰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{4-[3-(二甲基胺基)苯甲酰基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{4-[4-(二甲基胺基)苯甲酰基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[4-(3,4-二甲氧基苯甲酰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[4-(3,5-二甲氧基苯甲酰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-(4-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)乙酰基]哌嗪-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[4-(2-呋喃甲酰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[4-(3-呋喃甲酰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[4-(1H-吡咯-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲酰胺；

N-{4-[4-(1H-吡唑-5-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡啶-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡啶-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-異菸鹼醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(噻嗪-3-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(吡嗪-2-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(嘧啶-4-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(N,N-二甲基-β-丙胺醯基)哌嗪-1-基]苯基}-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-乙醯基哌嗪-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-
2-甲醯胺；

N-{4-[4-(2-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(4-氟苯甲醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異
吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(1,3-噻唑-4-基羰基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(嗎啉-4-基乙醯基)哌嗪-1-基]苯基}-1,3-二氫-
 2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-苯基丁基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯
 胺；

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二
 氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二
 氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二
 氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]
 苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-2,3-二氫-1H-異吲哚-4-基)苯基]-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-
 吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)苯基]-5,7-二氫-6H-
 吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-(1-側氧基-1,2-二氫異喹啉-4-基)環己-3-烯-1-基]-
 1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)環己-3-烯-1-基]-
 1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-側氧基-3,4-二氫酞嗪-1-基)環己-3-烯-1-基]-5-(吡咯啉-1-基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1-(2-苯基乙基)-1H-吡唑-4-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N⁵-[2-(二甲基胺基)乙基]-N²-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

5-(嗎啉-4-基羰基)-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(異丁氧基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-溴-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{[(5-氟基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲酸甲酯；

N-(4-{(E)-[(苯甲氧基)亞胺基]甲基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3-胺基吡咯啶-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]吡啶-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N²-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

N-[4-({苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}甲基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(1H-吡唑-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N²-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-N⁵-(2-甲氧基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

N²-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-N⁵-(2-羥基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

5-(胺基甲基)-N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-(甲基硫基)丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S,3S)-1-羥基-3-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S,3R)-1,3-二羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基己-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基環戊基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2R)-2-羥基環戊基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-環己基-3-羥基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({(2R)-1-羥基-3-[(4-甲基苯甲基)硫基]丙-2-基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-第三丁基苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-甲氧基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

O

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[6-(苯甲醯基胺基)己基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(吡啶-4-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

O

5-(羥基甲基)-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}噻吩-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(環戊基甲基)胺甲醯基]噻吩-3-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-(4-苯基丁基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]吡嗪-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-乙醯胺基己基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{(1E)-3-[苯甲基(甲基)胺基]丙-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-苯氧基哌啶-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3-苯氧基氮雜環丁烷-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[苯甲基(甲基)胺基]甲基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(5,6-二氫咪唑并[1,5-a]吡嗪-7(8H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲基-1H-1,2,3-三唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯

基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[2-(2-側氧基吡咯啉-1-基)乙基]-1H-1,2,3-三唑-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1-苯甲基哌啶-4-基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-苯基丙基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]-1H-1,2,3-三唑-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁基-1H-1,2,3-三唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基甲基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲氧基丙基)-1H-1,2,3-三唑-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]吡啶-2-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基})

苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(1'-異丁醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(1'-苯甲醯基-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-3-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{1'-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[4-(甲基磺醯基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(乙氧基乙醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(環戊基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(2-羥基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-羥基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(4-羥基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(2-甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(3-甲氧基苯甲酰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異
吡啶-2-甲酰胺；

N-{6-[(4-甲氧基苯甲酰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異
吡啶-2-甲酰胺；

N-{6-[(2-氯苯甲酰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡
啶-2-甲酰胺；

N-{6-[(3-氯苯甲酰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡
啶-2-甲酰胺；

N-{6-[(4-氯苯甲酰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡
啶-2-甲酰胺；

N-{6-[(2-氯苯甲酰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡
啶-2-甲酰胺；

N-{6-[(3-氯苯甲酰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡
啶-2-甲酰胺；

N-{6-[(4-氯苯甲酰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡
啶-2-甲酰胺；

N-{6-[(3-氯基苯甲酰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡
啶-2-甲酰胺；

N-{6-[(4-氯基苯甲酰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吡
啶-2-甲酰胺；

N-(6-{[3-(二甲基胺基)苯甲酰基]胺基}己基)-1,3-二氫-
2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-(6-{[4-(二甲基胺基)苯甲酰基]胺基}己基)-1,3-二氫-
2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-(6-{[3-(三氟甲基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[4-(三氟甲基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[3-(三氟甲氧基)苯甲醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(2,3-二甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(2,4-二甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(2,5-二甲氧基苯甲醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(苯基乙醯基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[(3-氟苯基)乙醯基]胺基}己基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫呋喃-2-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-5-(羥基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(嗎啉-4-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(嗎啉-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[6-(苯甲醯基胺基)己基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

4-氟-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氟基-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲基-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氯-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氯-N-{6-[(吡啶-3-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(吡啶-2-基羰基)胺基]己基}-1,3-二氫-2H-異吲
噪-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-2-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-
2H-異吲噪-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡
啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯
吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡
啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-
1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡
啶-5-基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]
苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-
基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-
基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-
4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-

1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡咯啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(7-側氧基-7-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺基}庚基)-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{7-側氧基-7-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺基]庚基}-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-
吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-
吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(氮雜環丁烷-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯
并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯
并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并
[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(異丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-
c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]

吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(環戊基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-噻吩基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[苯甲基(甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)哌啶-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[5-(嗎啉-4-基甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-甲基哌嗪-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-{[(3-甲基丁基)胺基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-羥基哌啶-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}

苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-氯苯甲醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫呋喃-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{1'-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1',2',3',6'-四氫-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-胺基乙基)-1H-咪唑-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-甲氧基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(4S)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(4R)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-2-側氧基乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-3-側氧基丙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氯基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-甲基-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-氯-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(四氮-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氯-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(6-溴-2-側氧基喹啉-1(2H)-基)丁基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[6-(3-乙醯基苯基)-2-側氧基喹啉-1(2H)-基]丁基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[1'-(嗎啉-4-基乙醯基)-1',2',3',6'-四氮-2,4'-聯吡啶-5-基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[1'-(嗎啉-4-基乙醯基)-1',2',3',6'-四氮-3,4'-聯吡啶-6-基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲醯基}苯

基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(2-{(4-氟苯基)[4-(吡啶-3-基)苯基]胺基}-1,3-噻唑-5-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2-苯基-1,3-噻唑-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(7-{苯基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-7-側氧基庚基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(環戊基基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1,3-噻唑-5-基基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(4-甲基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1,3-二羥基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基})

苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(2-呋喃甲醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(四氫呋喃-2-基羰基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[4-(乙基磺醯基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(2,3-二羥基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(1-羥基-4-甲基戊-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫-2H-呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(5-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}吡啶-2-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[3.3]庚-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-6-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[4.4]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.4]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(3,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-3-基羰基)苯基]-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(六氮-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-

二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(四氮-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯

基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(六氮呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-

二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}-4-側氧基丁

基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-苯基丁基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲

醯胺；

N-[4-(2-{苯甲基[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺基}乙基)苯基]-

1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-乙醯基-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲醯

基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氰基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氮-

2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺磺醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-5-(1-羥基乙基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丁醯基胺基)苯基]-5-氟基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡咯啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-吡咯啶-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲氧基苯甲基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氫雜螺[3.4]辛-6-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氫雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氫雜螺[4.4]壬-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氫雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-5-氟-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-5-氟-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-5-氟-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氫雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氫雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(5-氧雜-2-氫雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(6-氧雜-2-氫雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(2-氧雜-7-氫雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(六氫-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(四氫-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(六氫呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[6-(3-乙醯基苯基)-4-(3-羥基丙基)-2-側氧基喹啉-1(2H)-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氮噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-(乙醯胺基甲基)-N-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{5-[2-(2-氯苯甲基)-1,3-噻唑-4-基]-2-噻吩基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-氯苯基)丁基]-5-(羥基甲基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(3R)-1-異丁醯基吡咯啶-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[(3R)-1-苯甲醯基吡咯啶-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(四氮呋喃-3-基羰基)吡咯啶-3-基]甲基}胺甲

鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-([1-(甲基磺鹽基)吡咯啉-3-基]甲基)胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(1-異丁基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(1-異丁基呋啉-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基甲基)呋啉-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)呋啉-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(2-羥基丙-2-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羧基)胺基]苯甲基}胺基甲酸第三丁酯；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基乙鹽基)胺基]苯基}-5-(甲氧基甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(5-{[(四氫呋喃-2-基甲基)胺基]甲基}-1,2,4-噁二

唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{5-[(4-甲氧基哌啶-1-基)甲基]-1,2,4-噁二唑-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(5-{[4-(2-甲氧基乙基)哌嗪-1-基]甲基}-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[1-(嗎啉-4-基)環戊基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-戊醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丁醯基哌啶-4-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(1-乙醯基哌啶-4-基)氧基]吡啶-3-基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{6-[(1-異丁醯基哌啶-4-基)氧基]吡啶-3-基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(4,4,4-三氟丁醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環丙基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-

二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環丁基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環戊基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}吡啶-3-基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

(2-{4-[(1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}乙基)胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基

乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺磺鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(4,4,4-三氟丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-苯基丙醯基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(苯基乙醯基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-甲氧基苯基)乙醯基]吡咯啶-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯甲醯基吡咯啉-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-乙氧基丙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2-甲基環丙基)羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(1-甲基環丙基)羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基吡咯啉-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(4,4,4-三氟丁醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙氧基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基哌啶-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-

基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

[(1-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}氮雜環丁烷-3-基)甲基]胺基甲酸第三丁酯；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(嗎啉-4-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,3-二甲基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3-二甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(三環[3.3.1.1~3,7~]癸-1-基乙醯基)氮雜環丁

烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-甲氧基環己基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[4-(乙醯基胺基)苯基]磺醯基}胺基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-丙基苯基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(丁基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[({(1S,4R)-7,7-二甲基-2-側氧基雙環[2.2.1]庚-1-基]甲基}磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(苯甲基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(4-氟苯基)磺醯基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(噻吩-2-基磺醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氫雜螺[4.4]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氫-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,6-二氮雜螺[4.5]癸-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,7-二氮雜螺[4.5]癸-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,9-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-2-基羰基)苯基]-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.6]十一碳-8-基羰基)苯基]-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲醯基]苯

基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲醯基)苯基]-

1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲醯

基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-氧雜-4,8-二氮雜螺[5.5]十一碳-4-基羰基)苯

基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-

2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,8-二氮雜螺[4.5]癸-8-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,7-二氮雜螺[3.5]壬-7-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1,6-二氮雜螺[3.5]壬-1-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(2,5-二氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(5-氧雜-2-氮雜螺[3.4]辛-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(6-氧雜-2-氮雜螺[3.5]壬-2-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(六氮-5H-呋喃并[2,3-c]吡咯-5-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(四氮-1H-呋喃并[3,4-c]吡咯-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(六氮呋喃并[3,4-c]吡啶-5(3H)-基羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮呋喃-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮-2H-呋喃-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(N,N-二甲基甘胺鹽基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙鹽基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-2-基乙鹽基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基乙鹽基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{4-[(環己基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(4-{[(4,4-二氟環己基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙鹽基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(哌啶-1-基磺鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4,4-二氟環己基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二

氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-甲基-1,3-噁唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

Na-(4-{[(5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯基)-D-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[2-(乙醯基胺基)苯基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-

1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5-
氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-
基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯
胺；

N α -(4-{[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-基)羰基]胺基}苯
甲醯基)-L-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯
基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-
2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(甲基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-
5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二
氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-
5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲醯基}
苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
氫-2H-異吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-氟-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-({4-[2-(2-羥基乙氧基)乙基]哌嗪-1-基}羰基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺甲醯基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[雙(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[4-(吡嗪-2-基)哌嗪-1-基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N α -{4-[(5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-基羰基)胺基]苯甲醯基}-L-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(4-環己基哌嗪-1-基)羰基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-(4,5,6,7-四氫-1H-吡啶-5-基胺甲鹽基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-氟基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[苯甲基(甲基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5-
氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-胺基-1-側氧基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(環戊基胺甲鹽基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯
 基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-
 2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-
 1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-
 二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氟基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-
 異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯
 基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-
 二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-
 吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二
 氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-氰基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[甲基(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-胺基苯基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氰基環丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(4-甲基-1,3-噻唑-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲鹽基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[甲基(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)(甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氟基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[甲基(丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

1-{4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}氮雜環丁烷-3-甲酸甲酯；

N-(4-{3-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(苯甲基胺甲醯基)氮雜環丁烷-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[3-(環戊基胺甲醯基)氮雜環丁烷-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(環戊基甲基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]氮雜環丁烷-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-2-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡

啉-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡咯啉-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4,4-二氟環己基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-氰基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(6-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[(二甲基胺基)甲基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

O

N-(4-{[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3-噁唑-2-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

O

N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氟苯基)(3-甲基丁醯基)胺基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(9-氯-5-側氧基-2,3,3a,4,4a,5-六氫-6H-呋喃并[2',3':2,3]環丁并[1,2-c]喹啉-6-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[7-氯-1-(2-羥基乙基)-3-側氧基-1,3-二氫環丁并[c]喹啉-4(2H)-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-2-基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙醯基哌啶-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丁醯基哌啶-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(甲氧基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3,3-三氟丙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丁基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-2-基羰基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,2-二氟乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N α -{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲醯基}-L-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[2-(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(噻吩-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(乙鹽基胺基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-4-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(嘧啶-4-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(甲基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4,4-二氟環己基)羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(丙-2-基氧基)乙醯基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4,4,4-三氟丁醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-乙醯基哌啶-4-基)羰基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(乙氧基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○

N-{4-[(環戊基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{7-側氧基-7-[(3-苯基丙基)胺基]庚基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(雙環[2.2.1]庚-2-基乙醯基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1,3-噻唑-5-基羰基)胺基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

○

N-(4-{[(4-側氧基-4,5,6,7-四氫-1-苯并呋喃-3-基)羰基]胺基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(3-甲基丁醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(4-甲基戊醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(乙氧基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(2-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}乙基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫呋喃-2-基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(環戊基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(環戊基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[2-(苯甲醯基胺基)乙基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫-2H-呋喃-4-基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{2-[(四氫呋喃-3-基乙醯基)胺基]乙基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-丙醯基氮雜環丁烷-3-基)氧基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-乙基丁醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(戊-4-炔醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-3-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(噻吩-3-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1H-吡咯-2-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嘧啶-4-基羰基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(5-甲基吡嗪-2-基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(N,N-二甲基甘胺醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(N,N-二甲基-β-丙胺醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(吡咯啉-1-基乙醯基)氮雜環丁烷-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(吡咯啉-1-基)丙基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(哌啶-1-基)丙基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-環丙基乙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-環戊基乙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-3-基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,3-二甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環己基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環戊基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(四氫呋喃-2-基甲基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基丙基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丁基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(環丙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(苯基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4-氟苯基)磺醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丙-2-基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(苯甲基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(丙基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(噻吩-2-基磺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-2-甲基丁醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-

1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(4,4-二氟環己基)羰基]氮雜環丁烷-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(5-側氧基-D-脯胺醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2,2-二甲基丙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-甲基戊醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(2-乙基丁醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1H-吡咯-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1,2-噁唑-5-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(吡啶-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(噻吩-3-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(吡嗪-2-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嘧啶-4-基羰基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(5-甲基吡嗪-2-基)羰基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]氧基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[3-(4-甲基哌嗪-1-基)丙醯基]哌啶-4-基}氧基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

反-3-[(1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]環丁烷甲酸苯甲酯；

N-[4-(4-{[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氮-2H-哌喃-4-基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(苯甲醯基胺基)環己-1-烯-1-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-四氮呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2R)-四氮呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-

基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-2-甲基丁醯基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{3-[(3-甲基丁醯基)胺基]氧雜環丁烷-3-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

4-({4-[(1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-基羰基)胺基]苯基}磺醯基)哌啶-1-甲酸第三丁酯；

N-{4-[4-(丙基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(1,4-二噁烷-2-基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環戊基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(四氫-2H-哌喃-4-基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(嗎啉-4-基羰基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(環丙基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]哌啶-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[4-(丁-2-基胺甲醯基)哌啶-1-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-

1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{(4R)-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯

基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{(4S)-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯

基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基氮雜環丁烷-3-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基氮雜環丁烷-3-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[反-3-(苯甲基胺甲醯基)環丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{反-3-[(2-苯基乙基)胺甲醯基]環丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{反-3-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]環丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲基-1,3-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2E)-3-(呋喃-2-基)丙-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯

胺；

N-{4-[1-(1,3-噁唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3,3,3-三氟丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,5-二甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲氧基環己基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,3-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,2-二氟環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(第三丁氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-乙氧基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-羥基-3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-

基}苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(1H-吡咯-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲基丙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1-甲基脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-羥基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-{[1-(甲氧基甲基)環丙基]羰基}-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(甲基磺醯基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯

胺；

N-[4-(1-乙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2E)-4-甲基戊-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲氧基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊-1-烯-1-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(噻吩-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環己基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,2-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡

啉-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(甲氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,2-二甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲基己醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,2-二甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丁基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(哌啶-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[2-(吡咯啉-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(順-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(順-4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(順-4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(反-4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-1-(3-甲基丁醯基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-1-(環丁基羰基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[(3R)-1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啶-3-基]氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({[(3R)-1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啶-3-基]氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-1-(環丙基乙醯基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(3-甲基丁醯基)吡咯啶-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(環丁基羰基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3S)-1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-({(3S)-1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]吡咯啉-3-基}氧基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-(環丙基乙醯基)吡咯啉-3-基]氧基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(6-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}噻嗪-3-基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(四氫-2H-呋喃-4-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(環戊基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{6-[(雙環[2.2.1]庚-2-基甲基)胺甲醯基]噻嗪-3-基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(環己基羰基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(環己基羰基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{反-4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{順-4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○

N-[4-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]胺基}環己-1-烯-1-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環戊基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環丙基乙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

○

N-(4-{4-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{4-[(環己基羰基)胺基]環己-1-烯-1-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

10. 如請求項1之化合物，其係選自由以下組成之群：

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-

二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

11. 如請求項1之化合物，其係選自由以下組成之群：

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

12. 如請求項2之化合物，其係選自由以下組成之群：

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(胺基甲基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(苯甲基胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4-二甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,3-二甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,3-二氫-1,4-苯并二氧雜環己烯-5-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-氟苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-氟苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啉-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5-甲基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-氟苯基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-3-基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(2,2-二甲基丙基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啶-1-基)乙基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-(4-{[3-氟-5-(三氟甲基)苯基]胺甲酰基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

5-甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(4-氟苯基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(環戊基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯基)胺甲酰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲酰胺；

5-硝基-N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-噻吩基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-苯甲基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,3-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-噻吩基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-甲氧基-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(3-甲基丁基)-1H-吡唑-4-基]胺甲鹽基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(6-胺基己基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

4-氯-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2-噻吩基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基甲基)胺甲鹽基]
苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(苯甲基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-
甲鹽胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,4-二羥基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-丙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基-2-甲基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基-1H-吲唑-5-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-苯甲基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-({4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲鹽基}胺基)-1H-吲唑-3-甲酸甲酯；

N-(4-{[2-(2-側氧基吡咯啉-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1H-吲哚-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(三氟甲基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(2,3-二氫-1,4-苯并二氧雜環己烯-6-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(5-甲氧基-1H-吲哚-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2-氯苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-丙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4,5-三甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲基哌啶-1-基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[4-(二甲基胺基)苯基]乙基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(三氟甲氧基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-氟-4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,3-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-氟苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(異丁基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○

4-氯-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-氟苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啉-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N²-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2,5-二甲鹽胺；

N-{4-[(2-苯氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-羥基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3-氟苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({1-[(3S)-四氫呋喃-3-基]-1H-吡唑-4-基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(甲基硫基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-乙氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-氟苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[(三氟甲基)硫基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,4-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(1H-咪唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3-氯苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-5-(三氟甲基)-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(羥基甲基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基胺甲醯基)苯基]-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-異丙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-乙基-1H-吡唑-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,5-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-苯甲基哌啶-4-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(5-乙鹽胺基-2-甲氧基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({2-[3-(三氟甲基)苯基]乙基}胺甲鹽基)苯基]-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(1H-咪唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二
氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-
異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-(3-氟基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-氟基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲
哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-氟基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(吡啶-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(氰基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(環己基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

O

N-{4-[(3-羥基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(苯基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-氟苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

O

N-(4-{[2-(二乙基胺基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-胺基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(3-氯苯甲基)-1H-吡唑-4-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-羥基-6-甲基苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(5-氟吡啶-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(第三丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(3S)-1-苯甲基吡咯啉-3-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-氟苯基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(環戊基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(環丙基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(甲基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(戊-2-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(戊-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(環丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(4-氟苯基)-1H-吡唑-4-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-苯基-1H-吡唑-4-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({2-[4-(三氟甲基)苯基]乙基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(第二丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-羥基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(丙-2-炔-1-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

5,6-二甲氧基-N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(4-氯苯氧基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(三氟甲氧基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-苯基-1,3-噻唑-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

2-{[4-(丙基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}異吲哚啉-5-甲酸
甲酯；

2-{[4-(丙基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}異吲哚啉-5-甲
酸；

5-胺基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲
哚-2-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲醯胺；

5-(胺基甲基)-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(2-羥基-2-甲基丙醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)
苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-乙醯胺基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-
異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(N,N-二甲基甘胺醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)
苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-(1H-吡唑-3-基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-(1H-吡唑-4-基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(甲氧基乙醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-[(甲基磺醯基)胺基]-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-溴-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,5-二甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-氯苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-苯基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(5-氯吡啶-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-羥基-4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,4-二甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[4-(2-側氧基吡咯啉-1-基)苯基]胺甲醯基}苯
基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基-2,3-二氮-1H-茛-1-基]胺甲醯
基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-羥基環丙基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氮-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氮-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氮-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-
二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-5-乙烯基-1,3-二氮-2H-異
吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氮呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-
二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-四氮呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-
二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基丁基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氮-6H-吡
咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(3-苯基丙基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-d]嘧啶-6-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-[4-({[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-3-基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-5-吡啶-4-基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N⁵-(2-甲氧基乙基)-N²-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-吡啶-2-基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3-甲基丁基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(四氫呋喃-3-基甲基)胺基]羰基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-({[(1S)-2-羥基-1-吡啶-2-基乙基]胺基}羰基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-(1,2-二羥基乙基)-N-{4-[(丙基胺基)羰基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[6-(苯甲醯基胺基)己基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({4-[(苯甲醯基胺基)甲基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-5-氟-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氮-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氮-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氮-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N⁵-[2-(二甲基胺基)乙基]-N²-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2,5-二甲醯胺；

5-(嗎啉-4-基羰基)-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(異丁氧基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氮-2H-哌喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氮-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氮-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-(甲基硫基)丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S,3S)-1-羥基-3-甲基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S,3R)-1,3-二羥基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基己-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S,2S)-2-羥基環戊基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S,2R)-2-羥基環戊基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-環己基-3-羥基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({(2R)-1-羥基-3-[(4-甲基苯基)硫基]丙-2-基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-第三丁基苯基)-2-羥基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲氧基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-甲基-N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(丙基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-4-甲基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

5-(羥基甲基)-N-{4-[(3-甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3R)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯
并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-羥基-2-甲基丙-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-
吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-
吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-
2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(2-側氧基吡咯啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-
二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(吡咯啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-四氫呋喃-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-異丙氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(異丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-(環戊基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-噻吩基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-異丙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-異丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(嘧啶-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(吡啶-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

○ N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-甲氧基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

○ N-[4-({[(4S)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({[(4R)-2,2-二甲基-1,3-二氧戊環-4-基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(環戊基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(1,3-噻唑-5-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(1R)-3-羥基-1-苯基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(4-甲基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(1,3-二羥基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-1-羥基-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(4-羥基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-2-羥基丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(3-呋喃基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2R)-四氫呋喃-2-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫呋喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(1R)-2-羥基-1-苯基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(2S)-1-羥基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(2,3-二羥基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-4-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[2-羥基-1-(吡啶-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(1-羥基-4-甲基戊-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟基-N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-氧雜-9-氮雜螺[5.5]十一碳-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-{4-[(吡咯啶-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(3S)-吡咯啶-3-基甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基吡咯啶-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基哌啶-4-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-[4-(1-氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-({[(3R)-1-異丁鹽基吡咯啶-3-基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({[(3R)-1-苯甲鹽基吡咯啶-3-基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({[1-(四氫呋喃-3-基羰基)吡咯啶-3-基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({[1-(甲基磺鹽基)吡咯啶-3-基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({[1-(嗎啉-4-基)環戊基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-(4-氟苯基)-2-羥基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-2-羥基-1-(4-甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-[4-({[3-(羥基甲基)氧雜環丁烷-3-基]甲基}胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3-苯并間二氧雜環戊烯-5-基)-2-羥基乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-

甲 醯 胺 ；

N-(4-{[(1S)-1-(4- 氟 苯 基)-2- 羥 基 乙 基] 胺 甲 醯 基 } 苯 基)-1,3-二 氫 -2H-異 吲 哚 -2-甲 醯 胺 ；

N-(4-{[(1S)-2- 羥 基 -1-(4- 甲 氧 基 苯 基) 乙 基] 胺 甲 醯 基 } 苯 基)-1,3-二 氫 -2H-異 吲 哚 -2-甲 醯 胺 ；

N-(4-{[(1S)-1-(1,3- 苯 并 間 二 氧 雜 環 戊 烯 -5- 基)-2- 羥 基 乙 基] 胺 甲 醯 基 } 苯 基)-1,3-二 氫 -2H-異 吲 哚 -2-甲 醯 胺 ；

N-{4-[(1- 氧 雜 -8- 氮 雜 螺 [4.5] 癸 -2- 基 甲 基) 胺 甲 醯 基] 苯 基 }-1,3-二 氫 -2H-吡 咯 并 [3,4-c] 吡 啶 -2-甲 醯 胺 ；

N-[4-(1- 氧 雜 -8- 氮 雜 螺 [4.5] 癸 -3- 基 胺 甲 醯 基) 苯 基]-1,3-二 氫 -2H-吡 咯 并 [3,4-c] 吡 啶 -2-甲 醯 胺 ；

N-{4-[(2- 氧 雜 -9- 氮 雜 螺 [5.5] 十 一 碳 -3- 基 甲 基) 胺 甲 醯 基] 苯 基 }-1,3-二 氫 -2H-吡 咯 并 [3,4-c] 吡 啶 -2-甲 醯 胺 ；

5- 氟 -N-(4-{[1-(1,3- 噻 唑 -2- 基) 丙 -2- 基] 胺 甲 醯 基 } 苯 基)-1,3-二 氫 -2H-異 吲 哚 -2-甲 醯 胺 ；

N-{4-[(4,4- 二 氟 環 己 基) 胺 甲 醯 基] 苯 基 }-5- 氟 -1,3-二 氫 -2H-異 吲 哚 -2-甲 醯 胺 ；

N-(4-{[1-(3,5- 二 甲 基 -1H- 吡 唑 -1- 基) 丙 -2- 基] 胺 甲 醯 基 } 苯 基)-5- 氟 -1,3-二 氫 -2H-異 吲 哚 -2-甲 醯 胺 ；

5- 氟 -N-(4-{[2- 甲 基 -2-(嗎 啉 -4- 基) 丁 基] 胺 甲 醯 基 } 苯 基)-1,3-二 氫 -2H-異 吲 哚 -2-甲 醯 胺 ；

5- 氟 -N-(4-{[2-(2- 甲 基 -1,3- 噻 唑 -4- 基) 乙 基] 胺 甲 醯 基 } 苯 基)-1,3-二 氫 -2H-異 吲 哚 -2-甲 醯 胺 ；

5- 氟 -N-(4-{[2- 甲 基 -1-(嗎 啉 -4- 基) 丙 -2- 基] 胺 甲 醯 基 }

苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(4-甲氧基苯基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N α -(4-{[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲醯基)-D-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[2-(乙醯基胺基)苯基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N α -(4-{[(5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基)羰基]胺基}苯甲醯基)-L-苯基丙胺醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(甲基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-氯-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-胺甲鹽基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3,4-二甲氧基苯基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

Na-{4-[(5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-基羰基)胺基]苯甲鹽基}-L-苯基丙胺鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基苯甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[2-(4-甲基哌嗪-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[4-(嗎啉-4-基)苯甲基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-(4-{[3-(哌啶-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-[4-(4,5,6,7-四氫-1H-吡啶-5-基胺甲醯基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-氟基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2R)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(吡啶-3-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-呋喃-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟-N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-胺基-1-側氧基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-甲氧基乙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(環戊基胺甲鹽基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氟基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5-氟-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

5-氟-N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(3-甲基-1,2-噁唑-5-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-1-氟基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[4-(二甲基胺基)丁基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-胺基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(6-甲氧基吡啶-3-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氰基環丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(4-甲基-1,3-噻唑-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3-羥基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(噻吩-2-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(4-甲氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-呋喃-3-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-1-甲氧基丙-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(丙-2-基氧基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[3-(二甲基胺基)丙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-3-基胺甲鹽基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

○

N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3-胺基苯甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

○

N-{4-[(四氫-2H-哌喃-3-基甲基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(2-羥基-2-甲基丙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-[4-(丁基胺甲鹽基)苯基]-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(1-氰基乙基)胺甲鹽基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲鹽胺；

N-{4-[(3R)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(環戊基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(環丙基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(吡啶-4-基甲基)胺甲醯基]苯基}-5,7-二氫-6H-吡咯并[3,4-b]吡啶-6-甲醯胺；

N-{4-[(3-甲氧基-2,2-二甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(4,4-二氟環己基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-氰基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基丁基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(乙基胺基)-1-側氧基丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1S)-1-環丙基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3S)-四氫呋喃-3-基胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-呋喃-3-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(5-甲基-1,3-噁唑-2-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-({2-[(二甲基胺基)甲基]苯甲基}胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1R)-2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1,3-噁唑-2-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(四氫-2H-呋喃-3-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(2,6-二甲基嗎啉-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1-甲基環丙基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(呋喃-2-基)-2-(吡咯啉-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(3S)-1-甲基-2-側氧基氮雜環庚烷-3-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1,3-噻唑-2-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(呋喃-2-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(1-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-1-胺基-4-甲基-1-側氧基戊-2-基]胺甲醯
基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[1-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)丙-2-基]胺甲醯
基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2,2-二氟乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-2H-異
吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(四氫-2H-哌喃-4-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(四氫呋喃-2-基甲基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氮-
2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-甲氧基-2-甲基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二
氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(5-甲基-1,2-噁唑-3-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基]胺甲醯基}苯基)-
1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N α -{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯甲鹽基}-L-苯基丙胺鹽胺；

N-(4-{[2-(2-甲基-1,3-噻唑-4-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(2S)-3,3-二甲基-1-(甲基胺基)-1-側氧基丁-2-基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(噻吩-3-基胺甲鹽基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(5-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(3-甲基-1H-吡唑-1-基)乙基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(2S)-丁-2-基胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(3,3-二甲基-2-側氧基丁基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[(1-甲基-1H-吡唑-3-基)甲基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-(4-{[2-(乙鹽基胺基)苯基]胺甲鹽基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-{4-[(1-甲氧基丁-2-基)胺甲鹽基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲鹽胺；

N-[4-(四氫-2H-哌喃-4-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(嘧啶-4-基胺甲醯基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-(1H-吡咯-1-基)乙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-2-甲基丁基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(1-胺基-1-側氧基己-2-基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-胺基-2-側氧基-1-苯基乙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(3-第三丁氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[3-(甲基胺甲醯基)苯基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2R)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[(2S)-3-甲基丁-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-1-(嗎啉-4-基)丙-2-基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{[2-甲基-2-(嗎啉-4-基)丙基]胺甲醯基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[(2-乙氧基丙基)胺甲醯基]苯基}-1,3-二氫-2H-異
 吲哚-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

13. 如請求項3之化合物，其係選自由以下組成之群：

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}-3,6-
 二氫吡啶-1(2H)-甲酸第三丁酯；

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二
 氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

4-{4-[(1,3-二氫-2H-異吲哚-2-基羰基)胺基]苯基}哌啶-
 1-甲酸第三丁酯；

N-[4-(1-丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-
 2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲
 哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲
 哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯
 基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-
 基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-D-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-

基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(乙氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯

基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲氧基苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-氟苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-氯苯甲醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(二甲基胺基)苯甲醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[4-(二甲基胺基)苯甲醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-噻吩基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡咯-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,5-二甲基-1H-吡咯-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,3-噻唑-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]

苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡唑-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3,5-二甲基-1,2-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異菸鹼醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(噻嗪-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嘧啶-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(哌啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丁醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-異丁醯基哌啶-4-基)苯基]-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮呋喃-2-基羰基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氮-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氮噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氮吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啶-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二

氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啉-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,4-二噁烷-2-基羰基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基吡咯啉-3-基)羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氮-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-

基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)哌啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基哌啶-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-哌喃-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(N,N-二甲基甘胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲基哌嗪-1-基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-

4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫-2H-呋喃-2-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡咯啶-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡嗪-2-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(四氫-2H-呋喃-4-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

5-氟基-N-{4-[1-(嗎啉-4-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3S)-四氫呋喃-3-基羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫-2H-硫哌喃-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(3R)-四氫呋喃-3-基羰基]哌啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲基-1,3-噁唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(呋喃-3-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2E)-3-(呋喃-2-基)丙-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1,3-噁唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3,3,3-三氟丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,5-二甲基-1H-吡唑-3-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4-甲氧基環己基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,3-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,2-二氟環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1H-吡唑-5-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(第三丁氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-乙氧基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}

基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(3-羥基-3-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[3-(1H-吡咯-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲基丙氧基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(1-甲基脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-羥基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-{[1-(甲氧基甲基)環丙基]羰基}-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(甲基磺醯基)乙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-乙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-乙基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(5-側氧基-L-脯胺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2E)-4-甲基戊-2-烯醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-甲氧基-2-甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環戊-1-烯-1-基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(噻吩-3-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環己基羰基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-[4-(1-丙醯基-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,2-二甲基丁醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯

基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1-甲基-1H-吡咯-2-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(甲氧基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2,2-二甲基丙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4-甲基己醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2,2-二甲基環丙基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丁基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(哌啶-1-基乙醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基]苯基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[2-(吡咯啶-1-基)丙醯基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基)羰基]-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基}苯基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

14. 如請求項4之化合物，其係選自由以下組成之群：

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-3-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-5-氟基-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(吡啶-2-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-異吲哚-2-甲醯胺；

N-[4-(1-苯甲醯基哌啶-4-基)丁基]-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-氟苯甲醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-2-基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(1,1-二氧離子基四氫噻吩-3-基)羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環己基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(4,4-二氟環己基)羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(2-羥基-2-甲基丙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2R)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2S)-四氫呋喃-2-基羰基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(2-甲氧基乙氧基)乙醯基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(四氫呋喃-3-基羰基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-(4-{1-[(丙-2-基氧基)乙醯基]哌啶-4-基}丁基)-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(環丙基乙醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；

N-{4-[1-(4,4,4-三氟丁醯基)哌啶-4-基]丁基}-1,3-二氫-2H-吡咯并[3,4-c]吡啶-2-甲醯胺；及其醫藥學上可接受之鹽。

15. 一種用於治療如下病症、用於減少缺血-再灌注損傷、心肌梗塞面積及心肌纖維化、用於預防移植失敗及囊腫性纖維化之組合物，該組合物包含賦形劑及治療有效量之如請求項1之化合物或其醫藥學上可接受之鹽，該等病症為高血壓、慢性及充血性心臟衰竭、心臟肥大、再狹窄、慢性腎衰竭、蛛網膜下腔出血後腦血管痙攣、肺高血壓、動脈粥樣硬化、哮喘、男性勃起障礙、女性性功能障礙、膀胱過度活動症候群、脊髓損傷、創傷性腦損傷、中風、發炎及脫髓鞘疾病、阿茲海默氏症

(Alzheimer's disease)、疼痛、多發性硬化症、肌萎縮性側索硬化、亨廷頓氏病(Huntington's disease)、帕金森氏症(Parkinson's disease)、發炎性疼痛、類風濕性關節炎、骨關節炎、大腸急躁症、克羅恩氏病(Crohn's disease)、牛皮癬、潰瘍性結腸炎、狼瘡、發炎性腸道疾病、癌症、腫瘤轉移、病毒感染、細菌感染、胰島素抗性、糖尿病、眼高壓、早產、動脈粥樣硬化、脊髓性肌萎縮、腦脊髓炎、骨質疏鬆症、HIV-1、腦炎、缺血性CNS病症、血管型或AD型癡呆、青光眼、視網膜病、良性前列腺肥大、精神病症(尤其抑鬱症、精神分裂症、強迫症及躁鬱症)、癲癇症及癲癇發作病症。

16. 一種用於治療如下病症之組合物，該組合物包含賦形劑及治療有效量之如請求項1之化合物或其醫藥學上可接受之鹽，該等病症為發炎及組織修復病症；包括類風濕性關節炎、發炎性腸道疾病、哮喘及COPD(慢性阻塞性肺病)、骨關節炎、骨質疏鬆症及纖維化疾病；皮膚病，包括牛皮癬、異位性皮炎及紫外線誘發之皮膚損害；自體免疫疾病，包括全身性紅斑狼瘡、多發性硬化症、牛皮癬性關節炎、強直性脊柱炎、組織及器官排斥反應、阿茲海默氏症、中風、動脈粥樣硬化、再狹窄、糖尿病、腎小球性腎炎、癌症(包括乳癌、前列腺癌、肺癌、結腸癌、子宮頸癌、卵巢癌、皮膚癌、CNS癌、膀胱癌、胰臟癌、白血病、淋巴瘤或霍奇金氏病(Hodgkin's disease))、惡病質、與感染有關之發炎及病毒感染，包

括後天免疫缺乏症候群(AIDS)、成人呼吸窘迫症候群及共濟失調毛細管擴張症。

17. 一種治療患者之如下病症、用於減少患者之缺血-再灌注損傷、心肌梗塞面積及心肌纖維化、用於預防患者之移植失敗及囊腫性纖維化的方法，該方法包括向該患者投與治療有效量之如請求項1之化合物或其醫藥學上可接受之鹽，該等病症為高血壓、慢性及充血性心臟衰竭、心臟肥大、再狹窄、慢性腎衰竭、蛛網膜下腔出血後腦血管痙攣、肺高血壓、動脈粥樣硬化、哮喘、男性勃起障礙、女性性功能障礙、膀胱過度活動症候群、脊髓損傷、創傷性腦損傷、中風、發炎及脫髓鞘疾病、阿茲海默氏症、疼痛、多發性硬化症、肌萎縮性側索硬化、亨廷頓氏病、帕金森氏症、發炎性疼痛、類風濕性關節炎、骨關節炎、大腸急躁症、克羅恩氏病、牛皮癬、潰瘍性結腸炎、狼瘡、發炎性腸道疾病、癌症、腫瘤轉移、病毒感染、細菌感染、胰島素抗性、糖尿病、眼高壓、早產、動脈粥樣硬化、脊髓性肌萎縮、腦脊髓炎、骨質疏鬆症、HIV-1、腦炎、缺血性CNS病症、血管型或AD型癡呆、青光眼、視網膜病、良性前列腺肥大、精神病症(包括抑鬱症、精神分裂症、強迫症及躁鬱症)、癲癇症及癲癇發作病症。
18. 一種治療患者之如下病症之方法，該方法包括向該患者投與治療有效量之如請求項1之化合物或其醫藥學上可接受之鹽，該等病症為發炎及組織修復病症，包括類風

濕性關節炎、發炎性腸道疾病、哮喘及COPD(慢性阻塞性肺病)、骨關節炎、骨質疏鬆症及纖維化疾病；皮膚病，包括牛皮癬、異位性皮炎及紫外線誘發之皮膚損害；自體免疫疾病，包括全身性紅斑狼瘡、多發性硬化症、牛皮癬性關節炎、強直性脊柱炎、組織及器官排斥反應、阿茲海默氏症、中風、動脈粥樣硬化、再狹窄、糖尿病、腎小球性腎炎、癌症(包括乳癌、前列腺癌、肺癌、結腸癌、子宮頸癌、卵巢癌、皮膚癌、CNS癌、膀胱癌、胰臟癌、白血病、淋巴瘤或霍奇金氏病)、惡病質、與感染有關之發炎及病毒感染，包括後天免疫缺乏症候群(AIDS)、成人呼吸窘迫症候群及共濟失調毛細管擴張症。

19. 一種治療患者之如下病症、用於減少患者之缺血-再灌注損傷、心肌梗塞面積及心肌纖維化、用於預防患者之移植失敗及囊腫性纖維化的方法，該方法包括向該患者投與治療有效量之如請求項1之化合物或其醫藥學上可接受之鹽及治療有效量之一種其他治療劑或一種以上其他治療劑，該等病症為高血壓、慢性及充血性心臟衰竭、心臟肥大、再狹窄、慢性腎衰竭、蛛網膜下腔出血後腦血管痙攣、肺高血壓、動脈粥樣硬化、哮喘、男性勃起障礙、女性性功能障礙、膀胱過度活動症候群、脊髓損傷、創傷性腦損傷、中風、發炎及脫髓鞘疾病、阿茲海默氏症、疼痛、多發性硬化症、肌萎縮性側索硬化、亨廷頓氏病、帕金森氏症、發炎性疼痛、類風濕性關節

炎、骨關節炎、大腸急躁症、克羅恩氏病、牛皮癬、潰瘍性結腸炎、狼瘡、發炎性腸道疾病、癌症、腫瘤轉移、病毒感染、細菌感染、胰島素抗性、糖尿病、眼高壓、早產、動脈粥樣硬化、脊髓性肌萎縮、腦脊髓炎、骨質疏鬆症、HIV-1、腦炎、缺血性CNS病症、血管型或AD型癡呆、青光眼、視網膜病、良性前列腺肥大、精神病癰(包括抑鬱症、精神分裂症、強迫症及躁鬱症)、癲癇症及癲癇發作病症。

20. 一種治療患者之如下病症之方法，該方法包括向該患者投與治療有效量之如請求項1之化合物或其醫藥學上可接受之鹽及治療有效量之一種其他治療劑或一種以上其他治療劑，該等病症為發炎及組織修復病症，包括類風濕性關節炎、發炎性腸道疾病、哮喘及COPD(慢性阻塞性肺病)、骨關節炎、骨質疏鬆症及纖維化疾病；皮膚病，包括牛皮癬、異位性皮炎及紫外線誘發之皮膚損害；自體免疫疾病，包括全身性紅斑狼瘡、多發性硬化症、牛皮癬性關節炎、強直性脊柱炎、組織及器官排斥反應、阿茲海默氏症、中風、動脈粥樣硬化、再狹窄、糖尿病、腎小球性腎炎、癌症(包括乳癌、前列腺癌、肺癌、結腸癌、子宮頸癌、卵巢癌、皮膚癌、CNS癌、膀胱癌、胰臟癌、白血病、淋巴瘤或霍奇金氏病)、惡病質、與感染有關之發炎及某些病毒感染，包括後天免疫缺乏症候群(AIDS)、成人呼吸窘迫症候群及共濟失調毛細管擴張症或脾癌。

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：(無)

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

