



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本

(11)證書號數：TW I469979 B

(45)公告日：中華民國 104 (2015) 年 01 月 21 日

(21)申請案號：098144476

(22)申請日：中華民國 98 (2009) 年 12 月 23 日

(51)Int. Cl.：

*C07D413/06 (2006.01)**C07D401/04 (2006.01)**C07D413/14 (2006.01)**C07D401/14 (2006.01)**C07D403/04 (2006.01)**C07D403/10 (2006.01)**C07D413/10 (2006.01)**C07D405/14 (2006.01)**C07D471/04 (2006.01)**A61K31/5377(2006.01)**A61K31/4709(2006.01)**A61K31/472 (2006.01)**A61K31/496 (2006.01)**A61K31/437 (2006.01)**A61P25/00 (2006.01)**A61P3/00 (2006.01)**A61P9/00 (2006.01)**A61P19/02 (2006.01)**A61P19/10 (2006.01)*

(30)優先權：2008/12/24 美國

61/140,640

2009/03/11 美國

61/159,281

2009/05/01 美國

61/174,712

2009/06/29 美國

61/221,166

2009/09/15 美國

61/242,472

(71)申請人：巴爾 波特拉及康邦亞公司 (葡萄牙) BIAL-PORTELA&CA., S. A. (PT)
葡萄牙(72)發明人：凱斯 萊斯洛 E KISS, LASZLO ERNO (HU)；雷蒙斯 大衛 A LEARMONTH,
DAVID ALEXANDER (GB)；羅莎 卡拉 P C D C P ROSA, CARLA
PATR CIA DA COSTA PEREIRA (PT)；古斯默 德諾洛哈 利塔 GUSMO DE
NORONHA, RITA (PT)；帕瑪 佩德洛 N L PALMA, PEDRO NUNO LEAL
(PT)；索瑞斯 達錫爾瓦 帕翠西歐 M V A J SOARES DA SILVA,
PATRICIO MANUEL VIEIRA ARA JO (PT)；貝利夫 亞歷山大 BELIAEV,
ALEXANDER (RU)

(74)代理人：憚軼群；陳文郎

(56)參考文獻：

TW 200740801

TW 200820979

CN 101291918A

WO 2008/145839A1

WO 2008/145843A1

審查人員：林美君

申請專利範圍項數：26 項 圖式數：0 共 451 頁

(54)名稱

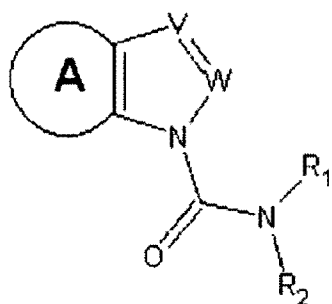
脂肪酸醯胺水解酶(FAAH)抑制劑、以及其藥學組成物與用途

FAAH INHIBITOR, AND PHARMACEUTICAL COMPOSITION AND USE THEREOF

(57)摘要

本發明有關用於抑制酵素脂肪酸醯胺水解酶(FAAH)之化合物與組成物，該化合物於治療上(特別是用於治療或預防進展或症狀與 FAAH 酵素之基質有關聯之病況)之用途，以及使用該化合物與組成物進行治療或預防之方法。

The invention relates to compounds and compositions for inhibiting the enzyme fatty acid amide hydrolase (FAAH), the use of the compounds in therapy and, in particular, for treating or preventing conditions whose development or symptoms are linked to substrates of the FAAH enzyme, and methods of treatment or prevention using the compounds and compositions.



式I

公告本**發明專利說明書**103年8月4日修正頁(本)
劃線

(本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號：98144476

※ 申請日：98.12.23

※IPC 分類：

C07D	413/06	2006.01
C07D	401/04	2006.01
C07D	413/14	2006.01
C07D	401/14	2006.01
C07D	403/04	2006.01
C07D	403/10	2006.01
C07D	413/10	2006.01
C07D	405/14	2006.01
C07D	471/04	2006.01

A61K	31/5377	2006.01
A61K	31/4709	2006.01
A61K	31/472	2006.01
A61K	31/496	2006.01
A61K	31/437	2006.01
A61P	25/00	2006.01
A61P	3/00	2006.01
A61P	9/00	2006.01
A61P	19/02	2006.01
A61P	19/10	2006.01

一、發明名稱：(中文/英文)

脂肪酸醯胺水解酶(FAAH)抑制劑、以及其藥學組成物與用途
FAAH inhibitor, and pharmaceutical composition and use thereof

二、中文發明摘要：

本發明有關用於抑制酵素脂肪酸醯胺水解酶(FAAH)之化合物與組成物，該化合物於治療上(特別是用於治療或預防進展或症狀與FAAH酵素之基質有關聯之病況)之用途，以及使用該化合物與組成物進行治療或預防之方法。

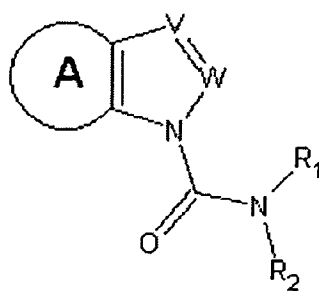
三、英文發明摘要：

The invention relates to compounds and compositions for inhibiting the enzyme fatty acid amide hydrolase (FAAH), the use of the compounds in therapy and, in particular, for treating or preventing conditions whose development or symptoms are linked to substrates of the FAAH enzyme, and methods of treatment or prevention using the compounds and compositions.

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第 () 圖。(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：

式I

六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明有關化合物以及其等之用途，特別是有關化合物以及其等用於治療或預防與基質(諸如神經傳導物質大麻素(anandamide)，其會被脂肪酸醯胺水解酶(FAAH)酵素分解)相關聯之病況之治療用途。

【先前技術】

FAAH酵素會分解諸如大麻素(N-花生四烯醯乙醇胺)、N-油醯乙醇胺、N-棕櫚醯乙醇胺以及油醯胺之脂肪酸醯胺。大麻素，亦稱作N-花生四烯醯乙醇胺或AEA，係一種在動物以及人類器官(特別是腦)中發現之內源性大麻(cannabinoid)神經傳導物質。亦發現，大麻素會結合到香草素受體。脂肪酸醯胺水解酶(FAAH)酵素會將大麻素分解成乙醇胺以及花生四烯酸。據此，FAAH之抑制物可使大麻素之位準升高。

大麻素是內生性大麻系統內之神經傳導物質，其可使大麻受體興奮。大麻受體，諸如CB1與CB2，係一種G蛋白偶合受體。CB1主要在中樞神經系統中發現，而CB2主要在周邊組織中發現。內生性大麻系統已與中樞以及周邊神經系統以及周邊器官二者中越來越多的生理功能有關聯。調控內生性大麻系統之活性，在許多不同的疾病以及病理病況上，已顯示出具有潛在的治療作用。因此，內生性大麻系統，特別是FAAH酵素，已成為用於發展可能可以治療許多疾病之治療標的。內生性大麻系統已知與食慾調節、肥

胖、代謝失調、惡病質、厭食症、疼痛、發炎、神經毒性、神經創傷、中風、多發性硬化症、脊髓損傷、帕金森氏症 (Parkinson's disease)、左旋多巴藥劑引起的運動障礙、杭丁頓氏舞蹈症 (Huntington's disease)、妥瑞症 (Gilles de la Tourette's syndrome)、遲發性運動障礙、肌萎縮性脊髓側索硬化症、阿滋海默症 (Alzheimer's disease)、癲癇、精神分裂症、焦慮症、憂鬱症、失眠、噁心、嘔吐、酒精疾患、諸如鴉片、尼古丁、古柯鹼、酒與精神興奮劑之藥物成癮、高血壓、循環性休克、心肌再灌注損傷、動脈硬化、氣喘、青光眼、視網膜病變、癌症、發炎性腸道疾病、諸如肝炎與肝硬化之急性以及慢性肝疾病、關節炎以及骨質疏鬆有關聯。內生性大麻系統以及與其相關聯之病狀之詳細內容述於 Pacher *et al.* (2006) *Pharmacol. Rev.* 58:389-462 中。

為調控諸如大麻素之內源性 FAAH 基質之位準，其接著調控內生性大麻系統，已發展出 FAAH 酵素之抑制物。此使得與內生性大麻系統相關聯之病況以及疾病可得到至少部分地治療以及預防。

因為 FAAH 之基質會結合其它的受體，如香草素受體，和/或牽涉其它訊號路徑，所以 FAAH 之抑制物亦可使得與其它路徑或系統，如香草素系統，相關聯之病況以及疾病，得到至少部分地治療以及預防。

FR 2915198 以及 FR 2915199 揭示作為 FAAH 之抑制物之化合物。

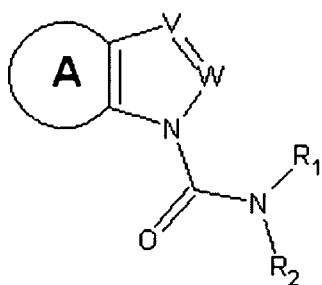
US 7,208,504 以及 FR2915197 亦揭示一系列與該等於

FR 2915198以及FR 2915199中所揭示之化合物不相同之化合物。此等化合物被揭示適合用於分別抑制荷爾蒙敏感性脂解酶(HSL)以及單醯基甘油脂肪酶(MAGL)。然而，此等化合物並沒有被揭示適合用於抑制FAAH。

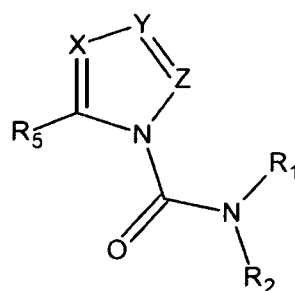
WO 2009/117444揭示作為FAAH以及MAGL二者之抑制物之化合物。

【發明內容】

根據本發明之第一態樣，提供有一種具有式I或式II之化合物，或其藥學上可接受之鹽類或酯類：



式I



式II

其中：

R1與R2可各自獨立地擇自於H、C₁₋₂₀烷基、C₁₋₆烷氧基、芳基、雜芳基、部分或完全飽和的雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基、R1a、鹵素、OH、OR1a、OCOR1a、SH、SR1a、SCOR1a、NH₂、NHR1a、NHSO₂NH₂、NHSO₂R1a、NR1aCOR1b、NHCOR1a、NR1aR1b、COR1a、CSR1a、CN、COOH、COOR1a、CONH₂、CONHOH、CONHR1a、CONHOR1a、SO₂R1a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR1aR1b、SO₂NR1aR1b，其中R1a與R1b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取

代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，或R1a與R1b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R1或R2為 C_{1-20} 烷基、烷氧基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{3-10} 環烷基、芳基 C_{1-6} 烷基、雜芳基 C_{1-6} 烷基、雜環基 C_{1-6} 烷基、 C_{3-10} 環烷基 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷基、 C_{3-8} 環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：R1c、鹵素、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基 C_{1-6} 烷基、雜芳基 C_{1-6} 烷基、雜環基 C_{1-6} 烷基、芳基 C_{1-6} 烷氧基、雜芳基 C_{1-6} 烷氧基、雜環基 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷胺基、 C_{1-6} 二烷胺基、 C_{1-10} 烷基、OH、OR1c、OCOR1c、SH、SR1c、SCOR1c、 NH_2 、 NO_2 、NHR1c、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R1c$ 、NR1cCOR1d、 $NHC(NH)NH_2$ 、NHCOR1c、NR1cR1d、COR1c、CSR1c、CN、COOH、COOR1c、 $CONH_2$ 、CONHOH、CONHR1c、CONHOR1c、 $C(NO_2)NH_2$ 、CONR1cR1d、 SO_2R1c 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、 $SO_2NR1cR1d$ ，其中R1c與R1d係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，或R1c與R1d可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R1或R2之取代基係 C_{1-10} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基 C_{1-6} 烷基、雜芳基 C_{1-6} 烷基、雜環基 C_{1-6} 烷基、芳基 C_{1-6} 烷氧基、雜芳基 C_{1-6} 烷氧基、雜環基 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷胺基、 C_{1-6} 二烷胺基、 C_{1-6} 烷基、 C_{3-8} 環烷基，或為含有一或多個部

分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：R1e、鹵素、C₁₋₁₀烷基、OH、OR1e、OCOR1e、SH、SR1e、SCOR1e、NH₂、NO₂、NHR1e、NHSO₂NH₂、NHSO₂R1e、NR1eCOR1f、NHC(NH)NH₂、NHCOR1e、NR1eR1f、COR1e、CSR1e、CN、COOH、COOR1e、CONH₂、CONHOH、CONHR1e、CONHOR1e、C(NO₂)NH₂、CONR1eR1f、SO₂R1e、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR1eR1f，其中R1e與R1f係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R1e與R1f可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

但是，R1與R2不能均為H或均為未被取代的甲基，
或，

R1與R2可與其等接觸之N一起形成雜芳基或雜環基基團，其等中之每一個可任擇地被一或多個氧原子或一或多種擇自於下列之基團取代：芳基、雜芳基、部分或全部飽和的雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R2a、鹵素、OH、OR2a、OCOR2a、SH、SR2a、SCOR2a、NH₂、NO₂、NHR2a、NHSO₂NH₂、NHSO₂R2a、NR2aCOR2b、NHC(NH)NH₂、NHCOR2a、NR2aR2b、COR2a、CSR2a、CN、COOH、COOR2a、CONH₂、CONHOH、CONHR2a、CONHOR2a、C(NO₂)NH₂、CONR2aR2b、SO₂R2a、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR2aR2b，其中R2a與R2b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取

代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R2a與R2b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當由R1與R2一起形成之雜芳基或雜環基之取代基為芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、羥基、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₄烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基氧基、芳基C₁₋₄烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₄烷氧基、C₃₋₈環烷基C₁₋₄烷氧基、R2c、OR2c、OCOR2c、SH、SR2c、SCOR2c、NH₂、NO₂、NHR2c、NHSO₂NH₂、NHSO₂R2c、NR2cCOR2d、NHC(NH)NH₂、NHCOR2c、NR2cR2d、COR2c、CSR2c、CN、COOH、COOR2c、CONH₂、CONHOH、CONHR2c、CONHOR2c、C(NO₂)NH₂、CONR2cR2d、SO₂R2c、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR2cR2d，其中R2c與R2d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R2c與R2d可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當由R1與R2一起形成之雜芳基或雜環基之取代基之取代基為C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基氧基、芳基C₁₋₄烷氧基、雜芳基C₁₋₄烷氧基、雜環基C₁₋₄烷氧基、C₃₋₈環烷基C₁₋₄烷氧基，或為含有一或多個部分之基團

時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代： C_{1-4} 烷氧基、 R_{2e} 、鹵素、 OH 、 OR_{2e} 、 $OCOR_{2e}$ 、 SH 、 SR_{2e} 、 $SCOR_{2e}$ 、 NH_2 、 NO_2 、 NHR_{2e} 、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R_{2e}$ 、 $NR_{2e}COR_{2f}$ 、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NR_{2e}R_{2f}$ 、 $NHCOR_{2e}$ 、 COR_{2e} 、 CSR_{2e} 、 CN 、 $COOH$ 、 $COOR_{2e}$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHOH$ 、 $CONHR_{2e}$ 、 $CONHOR_{2e}$ 、 $C(NOHNH_2)$ 、 $CONR_{2e}R_{2f}$ 、 SO_2R_{2e} 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、 $SO_2NR_{2e}R_{2f}$ ，其中 R_{2e} 與 R_{2f} 係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，或 R_{2e} 與 R_{2f} 可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

環A係擇自於芳基、雜芳基以及雜環基部分，其等中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、 R_a 、 C_{1-10} 烷基、 OH 、 OR_a 、 $OCOR_a$ 、 SH 、 SR_a 、 $SCOR_a$ 、 NH_2 、 NO_2 、 NHR_a 、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R_a$ 、 NR_aCOR_b 、 $NHCOR_a$ 、 $NHC(NH)NH_2$ 、 NR_aR_b 、 COR_a 、 CSR_a 、 CN 、 $COOH$ 、 $COOR_a$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHR_a$ 、 $CONHOH$ 、 $CONHOR_a$ 、 $C(NOHNH_2)$ 、 $CONR_aR_b$ 、 SO_2R_a 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、 $SO_2NR_aR_b$ ，其中 R_a 與 R_b 係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，或 R_a 與 R_b 可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當環A被 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、 C_{1-10} 烷基、 C_{3-8} 環烷基取代，或被含有一或多個部分之基團取代時，此等

部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、Rc、C₁₋₁₀烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、OH、ORc、OCORc、SH、SRc、SCORc、NH₂、NO₂、NHRc、NHSO₂NH₂、NHSO₂Rc、NRcCORd、NHCORc、NHC(NH)NH₂、NRcRd、CORc、CSRc、CN、COOH、COORc、CONH₂、CONHOH、CONHRc、CONHORc、C(NO₂)NH₂、CONRcRd、SO₂Rc、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NRcRd，其中Rc與Rd係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或Rc與Rd可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

V可為N、CH或C-R₃，其中R₃係鹵素、C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R_{3a}、OH、OR_{3a}、SH、SR_{3a}、OCOR_{3a}、SCOR_{3a}、NH₂、NO₂、NHR_{3a}、NHSO₂NH₂、NHSO₂R_{3a}、NR_{3a}COR_{3b}、NHCOR_{3a}、NHC(NH)NH₂、NR_{3a}R_{3b}、COR_{3a}、CSR_{3a}、CN、COOH、COOR_{3a}、CONH₂、CONHOH、CONHR_{3a}、CONHOR_{3a}、C(NO₂)NH₂、CONR_{3a}R_{3b}、SO₂R_{3a}、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR_{3a}R_{3b}，其中R_{3a}與R_{3b}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R_{3a}與R_{3b}可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

其中，當R₃係C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每

一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、 R_{3c} 、 C_{1-10} 烷基、OH、 OR_{3c} 、 $OCOR_{3c}$ 、SH、 SR_{3c} 、 $SCOR_{3c}$ 、 NH_2 、 NO_2 、 NHR_{3c} 、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R_{3c}$ 、 $NR_{3c}COR_{3d}$ 、 $NHCOR_{3c}$ 、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NR_{3c}R_{3d}$ 、 COR_{3c} 、 CSR_{3c} 、CN、COOH、 $COOR_{3c}$ 、 $CONH_2$ 、CONHOH、 $CONHR_{3c}$ 、 $CONHOR_{3c}$ 、 $C(NO_2)NH_2$ 、 $CONR_{3c}R_{3d}$ 、 SO_2R_{3c} 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、 $SO_2NR_{3c}R_{3d}$ ，其中 R_{3c} 與 R_{3d} 係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，或 R_{3c} 與 R_{3d} 可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當 R_3 之取代基為 C_{1-10} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、 C_{1-6} 烷基、 C_{3-8} 環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、 R_{3e} 、 C_{1-10} 烷基、OH、 OR_{3e} 、 $OCOR_{3e}$ 、SH、 SR_{3e} 、 $SCOR_{3e}$ 、 NH_2 、 NO_2 、 NHR_{3e} 、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R_{3e}$ 、 $NR_{3e}COR_{3f}$ 、 $NHCOR_{3e}$ 、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NR_{3e}R_{3f}$ 、 COR_{3e} 、 CSR_{3e} 、CN、COOH、 $COOR_{3e}$ 、 $CONH_2$ 、CONHOH、 $CONHR_{3e}$ 、 $CONHOR_{3e}$ 、 $C(NO_2)NH_2$ 、 $CONR_{3e}R_{3f}$ 、 SO_2R_{3e} 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、 $SO_2NR_{3e}R_{3f}$ ，其中 R_{3e} 與 R_{3f} 係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，或 R_{3e} 與 R_{3f} 可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

W可為N、CH或C-R4，其中R4為鹵素、C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基、R4a、OH、OR4a、SH、SR4a、OCOR4a、SCOR4a、NH₂、NO₂、NHR4a、NHSO₂NH₂、NHSO₂R4a、NR4aCOR4b、NHCOR4a、NHC(NH)NH₂、NR4aR4b、COR4a、CSR4a、CN、COOH、COOR4a、CONH₂、CONHOH、CONHR4a、CONHOR4a、C(NO₂)NH₂、CONR4aR4b、SO₂R4a、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR4aR4b，其中R4a與R4b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R4a與R4b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R4為C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R4c、C₁₋₁₀烷基、OH、OR4c、OCOR4c、SH、SR4c、SCOR4c、NH₂、NO₂、NHR4c、NHSO₂NH₂、NHSO₂R4c、NR4cCOR4d、NHCOR4c、NHC(NH)NH₂、NR4cR4d、COR4c、CSR4c、CN、COOH、COOR4c、CONH₂、CONHOH、CONHR4c、CONHOR4c、C(NO₂)NH₂、CONR4cR4d、SO₂R4c、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR4cR4d，其中R4c與R4d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R4c與R4d可與其

等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R4之取代基為C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、R4e、C₁₋₁₀烷基、OH、OR4e、OCOR4e、SH、SR4e、SCOR4e、NH₂、NO₂、NHR4e、NHSO₂NH₂、NHSO₂R4e、NR4eCOR4f、NHCOR4e、NHC(NH)NH₂、NR4eR4f、COR4e、CSR4e、CN、COOH、COOR4e、CONH₂、CONHOH、CONHR4e、CONHOR4e、C(NOH)NH₂、CONR4eR4f、SO₂R4e、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR4eR4f，其中R4e與R4f係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R4e與R4f可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

R5可與其接觸之環碳一起形成羰基基團，同時式II之環上其所接觸之雙鍵因此而重新排列和/或飽和，或R5係擇自於H、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R5a、鹵素、OH、OR5a、SH、SR5a、OCOR5a、SCOR5a、NH₂、NO₂、NHR5a、NHSO₂NH₂、NHSO₂R5a、NR5aCOR5b、NHCOR5a、NHC(NH)NH₂、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH₂、CONHOH、CONHR5a、CONHOR5a、C(NOH)NH₂、CONR5aR5b、SO₂R5a、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR5aR5b，其中R5a與R5b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取

代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R5a與R5b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R5係C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R5c、C₁₋₆烷基、OH、OR5c、OCOR5c、SH、SR5c、SCOR5c、NH₂、NO₂、NHR5c、NHSO₂NH₂、NHSO₂R5c、NR5cCOR5d、NHCOR5c、NHC(NH)NH₂、NR5cR5d、COR5c、CSR5c、CN、COOH、COOR5c、CONH₂、CONHOH、CONHR5c、CONHOR5c、C(NO₂)NH₂、CONR5cR5d、SO₂R5c、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR5cR5d，其中R5c與R5d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R5c與R5d可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R5之取代基為C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、R5e、C₁₋₆烷基、OH、OR5e、OCOR5e、SH、SR5e、SCOR5e、NH₂、NO₂、NHR5e、NHSO₂NH₂、NHSO₂R5e、NR5eCOR5f、NHCOR5e、NHC(NH)NH₂、NR5eR5f、COR5e、CSR5e、CN、COOH、COOR5e、CONH₂、CONHOH、CONHR5e、

CONHOR5e、C(NO₂)NH₂、CONR5eR5f、SO₂R5e、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR5eR5f，其中R5e與R5f係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R5e與R5f可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

X可為O（式II中接觸X之環雙鍵因此由單鍵取代）、N、CH或C-R6，其中R6係擇自於C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R6a、鹵素、OH、OR6a、SH、SR6a、OCOR6a、SCOR6a、NH₂、NO₂、NHR6a、NHSO₂NH₂、NHSO₂R6a、NR6aCOR6b、NHCOR6a、NHC(NH)NH₂、NR6aR6b、COR6a、CSR6a、CN、COOH、COOR6a、CONH₂、CONHOH、CONHR6a、CONHOR6a、C(NO₂)NH₂、CONR6aR6b、SO₂R6a、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR6aR6b，其中R6a與R6b係獨立地擇自C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R6a與R6b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R6係雜芳基或雜環基時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多個氧原子取代，當R6係C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、R6c、C₁₋₆烷基、C₁₋₆炔基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、OH、OR6c、

OCOR6c、SH、SR6c、SCOR6c、NH₂、NO₂、NHR6c、NHC(NH)NH₂、NHSO₂NH₂、NHSO₂R6c、NR6cCOR6d、NHCOR6c、NR6cR6d、COR6c、CSR6c、CN、COOH、COOR6c、CONH₂、CONHR6c、CONHOR6c、CONHOH、C(NO₂)NH₂、CONR6cR6d、SO₂R6c、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR6cR6d，其中R6c與R6d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R6c與R6d可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R6之取代基為雜芳基或雜環基時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多個氧原子取代，或當R6之取代基為C₁₋₆烷基、C₁₋₆炔基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、R6e、C₁₋₆烷基、C₁₋₄烷氧基、OH、OR6e、OCOR6e、SH、SR6e、SCOR6e、NH₂、NO₂、NHR6e、NHC(NH)NH₂、NHSO₂NH₂、NHSO₂R6e、NR6eCOR6f、NHCOR6e、NR6eR6f、COR6e、CSR6e、CN、COOH、COOR6e、CONH₂、CONHOH、CONHR6e、CONHOR6e、C(NO₂)NH₂、CONR6eR6f、SO₂R6e、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR6eR6f，其中R6e與R6f係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R6e與R6f可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

Y可為N、CH或C-R7，其中R7係擇自於C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R7a、鹵素、OH、OR7a、SH、SR7a、OCOR7a、SCOR7a、NH₂、NO₂、NHR7a、NHSO₂NH₂、NHSO₂R7a、NR7aCOR7b、NHCOR7a、NHC(NH)NH₂、NR7aR7b、COR7a、CSR7a、CN、COOH、COOR7a、CONH₂、CONHOH、CONHR7a、CONHOR7a、C(NO₂)NH₂、CONR7aR7b、SO₂R7a、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR7aR7b，其中R7a與R7b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R7a與R7b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R7為雜芳基或雜環基時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多個氧原子取代，當R7係C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、R7c、C₁₋₆烷基、C₁₋₆炔基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、OH、OR7c、OCOR7c、SH、SR7c、SCOR7c、NH₂、NO₂、NHR7c、NHC(NH)NH₂、NHSO₂NH₂、NHSO₂R7c、NR7cCOR7d、NHCOR7c、NR7cR7d、COR7c、CSR7c、CN、COOH、COOR7c、CONH₂、CONHR7c、CONHOR7c、CONHOH、C(NO₂)NH₂、CONR7cR7d、SO₂R7c、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR7cR7d，其

中R7c與R7d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R7c與R7d可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R7之取代基係雜芳基或雜環基時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多個氧原子取代，或當R7之取代基為C₁₋₆烷基、C₁₋₆炔基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、C₃₋₈環烷基，或為有含一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、芳基、雜芳基、雜環基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₁₋₄烷氧基、R7e、C₁₋₆烷基、OH、OR7e、OCOR7e、SH、SR7e、SCOR7e、NH₂、NO₂、NHR7e、NH₂SO₂、NH₂SO₂R7e、NHC(NH)NH₂、NR7eCOR7f、NHCOR7e、NR7eR7f、COR7e、CSR7e、CN、COOH、COOR7e、CONH₂、CONHOH、CONHR7e、CONHOR7e、C(NO₂)NH₂、CONR7eR7f、SO₂R7e、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR7eR7f，其中R7e與R7f係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R7e與R7f可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

Z可為N、CH或C-R8，其中R8係擇自於C₁₋₁₀烷基、芳

基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、 R_{8a} 、鹵素、 OH 、 OR_{8a} 、 SH 、 SR_{8a} 、 $OCOR_{8a}$ 、 $SCOR_{8a}$ 、 NH_2 、 NO_2 、 NHR_{8a} 、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R_{8a}$ 、 $NR_{8a}COR_{8b}$ 、 $NHCOR_{8a}$ 、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NR_{8a}R_{8b}$ 、 COR_{8a} 、 CSR_{8a} 、 CN 、 $COOH$ 、 $COOR_{8a}$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHOH$ 、 $CONHR_{8a}$ 、 $CONHOR_{8a}$ 、 $C(NO_2)NH_2$ 、 $CONR_{8a}R_{8b}$ 、 SO_2R_{8a} 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、 $SO_2NR_{8a}R_{8b}$ ，其中 R_{8a} 與 R_{8b} 係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，或 R_{8a} 與 R_{8b} 可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當 R_8 為 C_{1-6} 烷基、 C_{1-10} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、 C_{3-8} 環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、 R_{8c} 、 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基 C_{1-6} 烷基、雜芳基 C_{1-6} 烷基、雜環基 C_{1-6} 烷基、芳基 C_{1-6} 烷氧基、雜芳基 C_{1-6} 烷氧基、雜環基 C_{1-6} 烷氧基、 OH 、 OR_{8c} 、 $OCOR_{8c}$ 、 SH 、 SR_{8c} 、 $SCOR_{8c}$ 、 NH_2 、 NO_2 、 NHR_{8c} 、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R_{8c}$ 、 $NR_{8c}COR_{8d}$ 、 $NHCOR_{8c}$ 、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NR_{8c}R_{8d}$ 、 COR_{8c} 、 CSR_{8c} 、 CN 、 $COOH$ 、 $COOR_{8c}$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHOH$ 、 $CONHR_{8c}$ 、 $CONHOR_{8c}$ 、 $C(NO_2)NH_2$ 、 $CONR_{8c}R_{8d}$ 、 SO_2R_{8c} 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、 $SO_2NR_{8c}R_{8d}$ ，其中 R_{8c} 與 R_{8d} 係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜

環基，或R8c與R8d可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R8之取代基為C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、R8e、C₁₋₆烷基、OH、OR8e、OCOR8e、SH、SR8e、SCOR8e、NH₂、NO₂、NHR8e、NH₂SO₂、NHSO₂R8e、NR8eCOR8f、NHCOR8e、NHC(NH)NH₂、NR8eR8f、COR8e、CSR8e、CN、COOH、COOR8e、CONH₂、CONHOH、CONHR8e、CONHOR8e、C(NO₂)NH₂、CONR8eR8f、SO₂R8e、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR8eR8f，其中R8e與R8f係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R8e與R8f可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

其中，至多，代表X、Y與Z之原子或基團中之二個可為N；

其中，當W為N時，CONR1R2基團可改為連結至W，同時式I中之雙鍵因此而重新排列；

有條件的是，當R1與R2一起形成具有式I之化合物中之哌啶基時，該哌啶基不被下列取代：甲基、二甲基、乙基、異丙基、叔-丁基、甲氧羰基、三氟甲基、氯基、溴基或苯甲基，

有條件的是，具式I之化合物中之R1與R2一起不會形成

6,7-二甲氧基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、6-甲氧基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、7-甲氧基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、7-胺基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、7-硝基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、3,4-二氫-1H-異喹啉-1-基、3,4-二氫-2H-喹啉-1-基、吡咯烷-1-基、3,6-二氫-2H-吡啶-1-基、8-氮雜-螺[4.5]癸-8-基、1,3-二氫異吲哚-2-基、八氫異吲哚-2-基、1,2,6-三氮雜-螺[2.5]辛-1-烯-6-基或氮雜環庚烷-1-基，

有條件的是，當R1或R2沒有被甲基取代時，其它的R1或R2不是4-氯丁基、4-疊氮丁基或4-異氰硫基丁基，

有條件的是，當R1與R2與其等連接之N一起形成哌啶基、哌嗪基、取代的哌啶基或取代的哌嗪基時，具式I之化合物中之環A不會形成吡啶、嘧啶、取代的吡啶或取代的嘧啶，

有條件的是，該化合物不為(4-苯基-1H-咪唑-1-基)(4-(喹啉-2-基甲基)哌嗪-1-基)甲酮。

已發現本發明之化合物可調控酵素脂肪酸醯胺水解酶(FAAH)之活性。特別是，該化合物具有此酵素之抑制特性且在試管中10 μ M或更低之濃度下，顯示出會抑制FAAH。此外，此等化合物中有許多在試管內100 nM或更低之濃度下，顯示出強力的抑制FAAH之作用，且在活體內中樞神經系統組織以及周邊組織中，亦顯示出抑制作用。亦發現本發明之化合物對FAAH具有相對的專一性，所以其等對其它絲胺酸水解酶(如單醯基甘油水解酶)顯示出相對低的抑制

作用。其等之代謝亦相對地穩定，且對FAAH顯示出相對高的親和力。此意謂著可預期其等能提供對FAAH相對長效的抑制作用。

此外，已發現本發明之某些化合物具有使其等在中樞神經系統組織中抑制FAAH之程度高於周邊組織之選擇性。已發現其它化合物具有使其等在周邊組織中抑制FAAH之程度大於中樞神經系統組織之選擇性。

亦發現本發明之某幾個化合物特別適合用於投與至治療對象之肺。已發現該化合物可有效地抑制肺中之FAAH，然而不會進入該對象之血流。如此，其等在FAAH上具有局部化的抑制作用，而非全身性作用。

在此使用之術語‘C_{x-y}烷基’意指含x至y個碳原子之線性或分枝的飽和烴基團。例如，C₁₋₆烷基意指含1至6個碳原子之線性或分枝的飽和烴基團。C₁₋₆烷基基團之例子包括甲基、乙基、正-丙基、異丙基、正丁基、異丁基、仲-丁基、叔丁基、正-戊基、異戊基、新戊基以及己基。較佳地，該烴基團係線性的。基團C₁₋₁₀烷基較佳地係C₁₋₆烷基。術語‘C_{x-y}烷基’亦用於意指含x至y個碳原子之線性或分枝的飽和烴基團，而其中終端甲基基團進一步被取代，如C_{x-y}烷撐基團。

在此使用之術語‘C_{x-y}炔基’意指含x至y個碳原子以及至少一個碳-碳三鍵之線性或分枝的烴基團。例如，C₁₋₆炔基意指含1至6個碳原子之線性或分枝的烴基團。C₁₋₆炔基基團之例子包括乙炔、甲基丁炔基(如，3-甲基-1-丁炔基)、1,3-

丁二炔基以及1,3,5-己三炔基。

在此使用之術語‘芳基’意指 C_{6-12} 單環或雙環烴環，其中至少一個環係芳族的。此基團之例子包括苯基、萘基以及四氫萘基。

在此使用之術語‘雜芳基’意指5-6元之單環芳族或融合的8-10元雙環芳族環，其單環或雙環含有1至4個擇自於氧、氮以及硫之雜原子。此單環芳族環之例子包括噻吩基、呋喃基、吡喃基、吡咯基、三唑基、四唑基、咪唑基、噁唑基、噻唑基、噁二唑基、異噻唑基、異噁唑基、噻二唑基、吡喃基、吡唑基、嘧啶基、噻嗪基、吡嗪基、吡啶基、三嗪基、四嗪基以及相似物。此雙環芳族環之例子包括喹啉基、異喹啉基、喹唑啉基、喹喔啉基、蝶啶基、噌啉基、酞嗪基、萘鎧基、吲哚基、異吲哚基、氮雜吲哚基、吲哚嗪基、吲唑基、嘌呤基、吡咯吡啶基、呋吡啶基、苯并呋喃基、異苯并呋喃基、苯并噻吩基、苯并咪唑基、苯并噁唑基、苯并異噁唑基、苯并噻唑基、苯并異噻唑基、苯并噁二唑基、苯并噻二唑基以及咪唑吡啶基。

術語‘被一或多個氧原子取代的雜芳基’意指一種雜芳基環，其具有一或多個氧原子結合至該環。並不是指該雜芳基環含有一或多個氧原子作為環原子，雖然於某些具體例中可能為此種情況。較佳地，該一或多個氧原子結合至在該雜芳基環中之氮雜原子。被氧原子取代的雜芳基可含有N-氧化物。被一或多個氧原子取代的雜芳基之例子為其中吡啶氮被氧化之1-氧撐吡啶基。

術語‘雜環基’意指3-8 (較佳地4-8, 更佳地4-7)元單環或融合的8-12元雙環之環, 其可為飽和或部分飽和的, 其單環或雙環之環含有1至4個擇自於氧、氮、矽或硫之雜原子。此單環之環之例子包括噁氮雜環丙烷(oxaziridinyl)、環氧乙烷基、二環氧乙烷基、氮雜環丙烷、吡咯烷基、氮雜環丁烷、吡唑烷基、噁唑烷基、哌啶基、哌嗪基、嗎啉基、硫代嗎啉基、噻唑烷基、乙內醯脲基、戊內醯胺基、環氧乙烷基、氧雜環丁烷、二氧戊環基、二噁烷基、噁四氫噻吩(oxathiolanyl)、噁噻烷基(oxathianyl)、二噻烷基、二氫呋喃基、四氫呋喃基、二氫吡喃基、四氫吡喃基、四氫吡啶基、四氫嘧啶基、四氫硫代苯基、四氫硫代吡喃基、二氮雜環庚烷基以及氮雜環庚烷基。此雙環之環之例子包括吡啶基、異吡啶基、苯并吡喃基、奎寧環基、2,3,4,5-四氫-1H-3-苯吡庚因、4-(苯并[d][1,3]二噁茂5-基甲基)哌嗪-1-基以及四氫異喹啉基。

術語‘被一或多個氧原子取代的雜環基’意指一種雜環基之環, 其具有一或多個氧原子結合至該環。並不是指該雜環基之環含有一或多個氧原子作為環原子, 雖然於某些具體例中可能為此種情況。較佳地, 該一或多個氧原子結合至該雜環基之環上之雜原子(諸如氮或硫)。被一或多個氧原子取代的雜環基之例子為1,1-二氧撐-1,3-噻唑烷基。

在有關雙環之環中之術語‘雙環之環’以及‘融合的’, 意指二個環, 其等透過二個原子之間的鍵連接在一起(如, 萘)、透過一系列之原子形成橋連接在一起(如, 奎寧環)或

在單一原子處一起形成螺化合物(如1,4-二噁-8-氮雜-螺[4.5]癸烷以及N,3,3-二甲基-1,5-二噁螺[5.5]十一烷-9-基)。

在此使用之術語‘ C_{x-y} 環烷基’意指一種具有x至y個碳原子之飽和烴環，其可為單、雙或三環。例如， C_{3-10} 環烷基意指具有3至10個碳原子之飽和單、雙或三環烴。 C_{3-10} 環烷基基團之例子包括環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、環辛基以及金剛烷基。

在此使用之術語‘芳基 C_{x-y} 烷基’意指一種如上所定義之芳基基團接觸至以上所定義之 C_{x-y} 烷基。例如，芳基 C_{1-6} 烷基意指芳基基團接觸至含1至6個碳原子之線性或分枝的飽和烴基團。芳基 C_{1-6} 烷基基團之例子包括苯甲基、苯乙基、苯丙基、苯丁基、苯戊基以及苯己基。

在此使用之術語‘雜芳基 C_{x-y} 烷基’、‘雜環基 C_{x-y} 烷基’以及‘ C_{x-y} 環烷基 C_{x-y} 烷基’，意指如上所定義之雜芳基、雜環基或 C_{x-y} 環烷基基團接觸至如上所定義之 C_{x-y} 烷基。

在此使用之術語‘ C_{x-y} 烷氧基’意指一種-O- C_{x-y} 烷基基團，其中 C_{x-y} 烷基之定義如上。此基團之例子包括甲氧基、乙氧基、丙氧基、丁氧基、戊氧基以及己氧基。

在此使用之術語‘芳氧基’意指-O-芳基基團。此基團之例子包括苯氧基。在此使用之術語‘雜芳氧基’以及‘雜環氧基’，分別意指-O-雜芳基以及-O-雜環基基團。

在此使用之術語‘鹵素’，除非有特別指示，否則意指氟、氯、溴或碘原子。

在此使用之術語‘ C_{x-y} 烷基胺基’意指二級胺基團

(-NH(R))，其中該R基團係擇自於含x至y個碳原子之線性或分枝的飽和烴基團。C_{x-y}烷胺基基團之例子包括甲胺基、乙胺基以及丙胺基。

在此使用之術語‘C_{x-y}二烷胺基’意指一種三級胺基團(-NR(R*))，其中該R與R*基團各自獨立地擇自於含x至y個碳原子之線性或分枝的飽和烴基團。C_{x-y}二烷胺基基團之例子包括二甲胺基、甲乙胺基以及二乙胺基。

在此所使用，與定義為R之各種基團之特性有關之術語‘取代的C₁₋₆烷基’（例如，‘其中R8e與R8f係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基’之詞中）意指，該個別的R基團（如，R1a、R2c、R4d、R5e等等）可被一或多種擇自於下列之基團取代：R'、鹵素、OH、OR'、SH、SR'、OCOR'、SCOR'、NH₂、NO₂、NHR'、NHSO₂NH₂、NHSO₂R'、NR'COR''、NHC(NH)NH₂、NHCOR'、NR'R''、COR'、CSR'、CN、COOH、COOR'、CONH₂、CONHOH、CONHR'、CONR'R''、CONHOR'、C(NO₂)NH₂、SO₂R'、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR'R''，其中R'與R''係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R'與R''可與其等連接之雜原子一起形成雜環基。

本發明之化合物之“藥學上可接受之鹽類”包括具無機鹼之鹽類、具有機鹼之鹽類、具無機酸之鹽類、具有機酸之鹽類以及具鹼性或酸性胺基酸之鹽類。具酸之鹽類特別可用於某些情況。例示性鹽類包括鹽酸鹽、醋酸鹽、三氟醋酸鹽、甲磺酸鹽、2-丙醇-1,2,3-三羧酸鹽、(2R,3R)-2,3-

二羥基酒石酸鹽、磷酸鹽以及草酸鹽。本發明之化合物可為溶劑化物(如，水合物)或非溶劑化物(如非水合物)形式。當呈溶劑化物形式時，額外的溶劑可為諸如丙-2-醇之醇類。

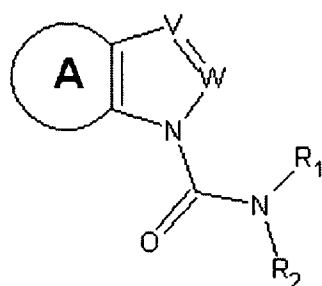
本發明之化合物之‘藥學上可接受之酯類’為一種其中該化合物之一或多個羧基(即， $-C(O)OH$)基團，經由與醇部分 $U-OH$ 反應而改質成 $-C(O)OU$ 基團之衍生物，其中 U 可為 C_{1-18} 烷基(如， C_{1-6} 烷基)、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基或其等之組合。

一般用於製備鹽類以及酯類之方法係熟悉此技藝之人士所熟知之技術。鹽類以及酯類之藥學上可接受性取決於各種因子，包括配方加工特性以及活體內行為，熟悉此技藝之人士在參考本發明之揭露內容後，可輕易地評估此等因子。

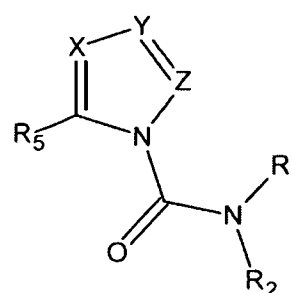
當本發明之化合物存在不同的鏡像異構物和/或非鏡像異構物形式(包括繞著雙鍵之幾何異構物)時，此等化合物可製成異構混合物或外消旋，然而本發明有關全部此等鏡像異構物或異構物，不管呈光學純的形式存在或為與其它異構物之混合物。個別的鏡像異構物或異構物可以此技藝中已知之方法獲得，諸如光解析產物或中間體(例如，手性色層分離法(如，手性HPLC))或鏡像異構物合成方法。相似地，當本發明之化合物可呈供選擇的互變異構物形式存在(如，酮/烯醇、醯胺/亞胺酸)時，本發明有關分開形式之個別的互變異構物，以及以各種比例混合之互變異構物混合物。

在式II之化合物方面，零、一或二個表示X、Y與Z之原子或基團可為N。

在特別的具體例中，本發明之化合物具有擇自於式I或式II之化學式，或其藥學上可接受之鹽類或酯類：



式I



式II

其中：

R1與R2可各自獨立地擇自於H、C₁₋₂₀烷基、烷氧基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基以及C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基，其等中除了H之外，每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、胺基、C₁₋₆烷胺基以及C₁₋₆二烷胺基，但是R1與R2不能均為H，或

R1與R2可與其等接觸之N一起形成雜芳基或雜環基基團，其等中每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：羥基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基以及雜環

氧基，其等中之每一個可任擇地被擇自於下列之基團取代：鹵素、羥基、 C_{1-4} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{1-4} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、芳基 C_{1-4} 烷氧基以及雜芳基 C_{1-4} 烷氧基，其等中除了鹵素與羥基外，每一個可任擇地被 C_{1-4} 烷氧基取代；

環A係擇自於芳基、雜芳基以及雜環基部分，其等中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、羥基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基以及雜環氧基，其等中除了鹵素以及羥基外，每一個可任擇地被鹵素、氰基、醯胺以及羧酸取代；

V可為N、CH或C-R3，其中R3係鹵素、芳基、雜芳基、雜環基或 C_{3-8} 環烷基，其等中除了鹵素外，每一個可任擇地被鹵素取代；

W可為N、CH或C-R4，其中R4為 C_{1-10} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基或 C_{3-8} 環烷基，其等中之每一個可任擇地被鹵素取代；

R5係擇自於H、 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基以及 C_{3-8} 環烷基，其等中除了H外，每一個可任擇地被鹵素取代；

X可為N、CH或C-R6，其中R6係擇自於 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基以及雜環基，其等中除了H外，每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、羥基、胺、醯胺、氰基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基 C_{1-6} 烷基、雜芳基 C_{1-6} 烷基、雜環基 C_{1-6} 烷基、芳基 C_{1-6} 烷氧基、雜芳基 C_{1-6} 烷氧基以及雜環基

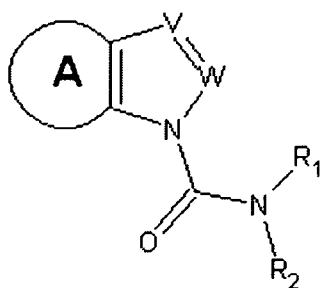
C₁₋₆烷氧基；

Y可為N、CH或C-R7，其中R7係擇自於C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基以及雜環基，其等中除了H外，每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基以及雜環基C₁₋₆烷氧基，其等中之每一個可任擇地被下列取代：C₁₋₄烷基、氰基、胺、醯胺、鹵素、芳基、雜芳基、雜環基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基以及雜環基C₁₋₆烷基；

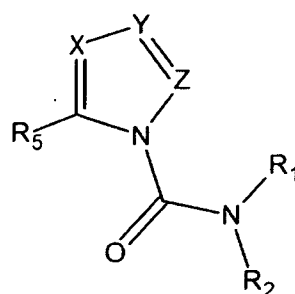
Z可為N、CH或C-R8，其中R8係擇自於C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基或C₃₋₈環烷基，其等中之每一個可任擇地被鹵素取代；

有條件的是，當R1與R2一起形成具式I之化合物中之哌啶基時，該哌啶基不被甲基、二甲基、乙基、異丙基、叔丁基、三氟甲基、氰基、溴基或苯甲基取代。

根據本發明之另一具體例，提供有一種具式I或式II之化合物，或其藥學上可接受之鹽類或酯類：



式I



式II

其中：

R1與R2可各自獨立地擇自於H、C₁₋₂₀烷基、烷氧基、芳基、雜芳基、部分或全部飽和的雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₁₀環烷基、C₁₋₆烷基、R1a、鹵素、OH、OR1a、SH、SR1a、OCOR1a、SCOR1a、NH₂、NHR1a、NR1aR1b、COR1a、CSR1a、CN、COOH、COOR1a、CONH₂、SO₂R1a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR1aR1b、SO₂NR1aR1b，其中R1a與R1b係獨自地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，以及R1a與R1b可與鄰接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R1或R2為C₁₋₂₀烷基、烷氧基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：R1c、鹵素、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆烷胺基、C₁₋₆二烷胺基、C₁₋₁₀烷基、OH、OR1c、OCOR1c、SH、SR1c、SCOR1c、NH₂、NHR1c、NR1cR1d、COR1c、CSR1c、CN、COOH、COOR1c、CONH₂、SO₂R1c、SO₃H、SO₂NH₂、CONR1cR1d、SO₂NR1cR1d，其中R1c與R1d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，以及R1c與R1d可與鄰接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R1或R2之取代基為C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、

雜環基、 C_{1-6} 烷基氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基
 C_{1-6} 烷基、雜芳基 C_{1-6} 烷基、雜環基 C_{1-6} 烷基、芳基 C_{1-6} 烷基
 基、雜芳基 C_{1-6} 烷基氧基、雜環基 C_{1-6} 烷基氧基、 C_{1-6} 烷基胺基、
 C_{1-6} 二烷基胺基、 C_{1-6} 烷基、 C_{3-8} 環烷基，或為一或多個部分之
 基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：R1e、
 C_{1-10} 烷基、OH、OR1e、OCOR1e、SH、SR1e、SCOR1e、
 NH_2 、NHR1e、NR1eR1f、COR1e、CSR1e、CN、COOH、
 COOR1e、CONH₂、SO₂R1e、SO₃H、SO₂NH₂、CONR1eR1f、
 SO₂NR1eR1f，其中R1e與R1f係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取
 代的 C_{1-6} 烷基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，以及R1e與R1f可與
 鄰接的雜原子一起形成雜環基，但是R1與R2不能均為H，
 或

R1與R2可與其等接觸之N一起形成雜芳基或雜環基基
 團，其等中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基
 團取代：羥基、芳基、雜芳基、部分或完全飽和的雜環基、
 C_{3-8} 環烷基、 C_{1-6} 烷基、芳基 C_{1-6} 烷基、雜芳基 C_{1-6} 烷基、雜
 環基 C_{1-6} 烷基、 C_{3-8} 環烷基 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷基氧基、芳氧基、
 雜芳氧基以及雜環氧基、R2a、鹵素、OH、OR2a、SH、SR2a、
 OCOR2a、SCOR2a、 NH_2 、NHR2a、NR2aR2b、COR2a、
 CSR2a、CN、COOH、COOR2a、CONH₂、SO₂R2a、SO₃H、
 SO₂NH₂、CONR2aR2b、SO₂NR2aR2b，其中R2a與R2b係獨
 立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環
 基，且R2a與R2b可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

其中，當由R1與R2一起所形成之雜芳基或雜環基之取

代基為芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被擇自於下列之基團取代：鹵素、羥基、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₄烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基氧基、芳基C₁₋₄烷氧基、雜芳基C₁₋₄烷氧基、雜環基C₁₋₄烷氧基、C₃₋₈環烷基C₁₋₄烷氧基、R_{2c}、OR_{2c}、SH、SR_{2c}、OCOR_{2c}、SCOR_{2c}、NH₂、NHR_{2c}、NR_{2c}R_{2d}、COR_{2c}、CSR_{2c}、CN、COOH、COOR_{2c}、CONH₂、SO₂R_{2c}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{2c}R_{2d}、SO₂NR_{2c}R_{2d}，其中R_{2c}與R_{2d}係獨立地擇自C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R_{2c}與R_{2d}可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

其中，當R₁與R₂一起之雜芳基或雜環基之取代基之取代基為C₁₋₄烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₄烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基氧基、芳基C₁₋₄烷氧基、雜芳基C₁₋₄烷氧基、雜環基C₁₋₄烷氧基、C₃₋₈環烷基C₁₋₄烷氧基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：C₁₋₄烷氧基、R_{2e}、鹵素、OH、OR_{2e}、SH、SR_{2e}、OCOR_{2e}、SCOR_{2e}、NH₂、NHR_{2e}、NR_{2e}R_{2f}、COR_{2e}、CSR_{2e}、CN、COOH、COOR_{2e}、CONH₂、SO₂R_{2e}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{2e}R_{2f}、SO₂NR_{2e}R_{2f}，其中R_{2e}與R_{2f}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取

代的 C_{1-6} 烷基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，且R2e與R2f可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

環A係擇自於芳基、雜芳基以及雜環基部分，其中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、 C_{1-6} 烷基、羥基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、Ra、 C_{1-10} 烷基、OH、ORa、OCORa、SH、SRa、SCORa、 NH_2 、NHRa、NRaRb、CORa、CSRa、CN、COOH、COORa、 $CONH_2$ 、 SO_2Ra 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、CONRaRb、 SO_2NRaRb ，其中Ra與Rb係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，且Ra與Rb可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

其中，當環A係被 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、 C_{1-10} 烷基、 C_{3-8} 環烷基取代，或被含有一或多個部分之基團取代時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：Rc、 C_{1-10} 烷基、OH、ORc、OCORc、SH、SRc、SCORc、 NH_2 、NHRc、NRcRd、CORc、CSRc、CN、COOH、COORc、 $CONH_2$ 、 SO_2Rc 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、CONRcRd、 SO_2NRcRd ，其中Rc與Rd係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，且Rc與Rd可與鄰接的雜原子一起形成雜環基；

V可為N、CH或C-R3，其中R3係鹵素、 C_{1-10} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{3-8} 環烷基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R3a、OH、OR3a、SH、SR3a、OCOR3a、SCOR3a、 NH_2 、NHR3a、NR3aR3b、COR3a、CSR3a、CN、

COOH、COOR_{3a}、CONH₂、SO₂R_{3a}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{3a}R_{3b}、SO₂NR_{3a}R_{3b}，其中R_{3a}與R_{3b}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R_{3a}與R_{3b}可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

其中，當R₃為C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R_{3c}、C₁₋₁₀烷基、OH、OR_{3c}、OCOR_{3c}、SH、SR_{3c}、SCOR_{3c}、NH₂、NHR_{3c}、NR_{3c}R_{3d}、COR_{3c}、CSR_{3c}、CN、COOH、COOR_{3c}、CONH₂、SO₂R_{3c}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{3c}R_{3d}、SO₂NR_{3c}R_{3d}，其中R_{3c}與R_{3d}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R_{3c}與R_{3d}可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

其中，當R₃之取代基為C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：R_{3e}、C₁₋₁₀烷基、OH、OR_{3e}、OCOR_{3e}、SH、SR_{3e}、SCOR_{3e}、NH₂、NHR_{3e}、NR_{3e}R_{3f}、COR_{3e}、CSR_{3e}、CN、COOH、COOR_{3e}、CONH₂、SO₂R_{3e}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{3e}R_{3f}、SO₂NR_{3e}R_{3f}，其中R_{3e}與R_{3f}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R_{3e}與R_{3f}可與鄰接的雜原子一起形

成雜環基；

W可為N、CH或C-R4，其中R4係鹵素、C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基、R4a、OH、OR4a、SH、SR4a、OCOR4a、SCOR4a、NH₂、NHR4a、NR4aR4b、COR4a、CSR4a、CN、COOH、COOR4a、CONH₂、SO₂R4a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR4aR4b、SO₂NR4aR4b，其中R4a與R4b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R4a與R4b可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

其中，當R4係C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R4c、C₁₋₁₀烷基、OH、OR4c、OCOR4c、SH、SR4c、SCOR4c、NH₂、NHR4c、NR4cR4d、COR4c、CSR4c、CN、COOH、COOR4c、CONH₂、SO₂R4c、SO₃H、SO₂NH₂、CONR4cR4d、SO₂NR4cR4d，其中R4c與R4d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R4c與R4d可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

其中，當R4之取代基為C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：R4e、C₁₋₁₀烷基、OH、

OR_{4e}、OCOR_{4e}、SH、SR_{4e}、SCOR_{4e}、NH₂、NHR_{4e}、NR_{4e}R_{4f}、COR_{4e}、CSR_{4e}、CN、COOH、COOR_{4e}、CONH₂、SO₂R_{4e}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{4e}R_{4f}、SO₂NR_{4e}R_{4f}，其中R_{4e}與R_{4f}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R_{4e}與R_{4f}可與鄰接的雜原子一起形成雜環基；

R₅係擇自於H、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R_{5a}、鹵素、OH、OR_{5a}、SH、SR_{5a}、OCOR_{5a}、SCOR_{5a}、NH₂、NHR_{5a}、NR_{5a}R_{5b}、COR_{5a}、CSR_{5a}、CN、COOH、COOR_{5a}、CONH₂、SO₂R_{5a}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{5a}R_{5b}、SO₂NR_{5a}R_{5b}，其中R_{5a}與R_{5b}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R_{5a}與R_{5b}可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

其中，當R₅係C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R_{5c}、C₁₋₆烷基、OH、OR_{5c}、OCOR_{5c}、SH、SR_{5c}、SCOR_{5c}、NH₂、NHR_{5c}、NR_{5c}R_{5d}、COR_{5c}、CSR_{5c}、CN、COOH、COOR_{5c}、CONH₂、SO₂R_{5c}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{5c}R_{5d}、SO₂NR_{5c}R_{5d}，其中R_{5c}與R_{5d}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R_{5c}與R_{5d}可與鄰接的雜原子一起形

成雜環基，

其中，當R5之取代基為C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：R5e、C₁₋₆烷基、OH、OR5e、OCOR5e、SH、SR5e、SCOR5e、NH₂、NHR5e、NR5eR5f、COR5e、CSR5e、CN、COOH、COOR5e、CONH₂、SO₂R5e、SO₃H、SO₂NH₂、CONR5eR5f、SO₂NR5eR5f，其中R5e與R5f係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R5e與R5f可與鄰接的雜原子一起形成雜環基；

X可為N、CH或C-R6，其中R6係擇自於C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R6a、鹵素、OH、OR6a、SH、SR6a、OCOR6a、SCOR6a、NH₂、NHR6a、NR6aR6b、COR6a、CSR6a、CN、COOH、COOR6a、CONH₂、SO₂R6a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR6aR6b、SO₂NR6aR6b，其中R6a與R6b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R6a與R6b可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

其中，當R6為C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：R6c、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、

雜芳基 C_{1-6} 烷基、雜環基 C_{1-6} 烷基、芳基 C_{1-6} 烷氧基、雜芳基 C_{1-6} 烷氧基、雜環基 C_{1-6} 烷氧基、OH、OR_{6c}、OCOR_{6c}、SH、SR_{6c}、SCOR_{6c}、NH₂、NHR_{6c}、NR_{6c}R_{6d}、COR_{6c}、CSR_{6c}、CN、COOH、COOR_{6c}、CONH₂、SO₂R_{6c}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{6c}R_{6d}、SO₂NR_{6c}R_{6d}，其中R_{6c}與R_{6d}係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，且R_{6c}與R_{6d}可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

其中，當R₆之取代基為 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基 C_{1-6} 烷基、雜芳基 C_{1-6} 烷基、雜環基 C_{1-6} 烷基、芳基 C_{1-6} 烷氧基、雜芳基 C_{1-6} 烷氧基、雜環基 C_{1-6} 烷氧基、 C_{3-8} 環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：R_{6e}、 C_{1-6} 烷基、OH、OR_{6e}、OCOR_{6e}、SH、SR_{6e}、SCOR_{6e}、NH₂、NHR_{6e}、NR_{6e}R_{6f}、COR_{6e}、CSR_{6e}、CN、COOH、COOR_{6e}、CONH₂、SO₂R_{6e}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{6e}R_{6f}、SO₂NR_{6e}R_{6f}，其中R_{6e}與R_{6f}係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，且R_{6e}與R_{6f}可與鄰接的雜原子一起形成雜環基；

Y可為N、CH或C-R₇，其中R₇係擇自於 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R_{7a}、鹵素、OH、OR_{7a}、SH、SR_{7a}、OCOR_{7a}、SCOR_{7a}、NH₂、NHR_{7a}、NR_{7a}R_{7b}、COR_{7a}、CSR_{7a}、CN、COOH、COOR_{7a}、CONH₂、SO₂R_{7a}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{7a}R_{7b}、SO₂NR_{7a}R_{7b}，其中R_{7a}與R_{7b}係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取

代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R7a與R7b可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

其中，當R7為C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：R7c、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、OH、OR7c、OCOR7c、SH、SR7c、SCOR7c、NH₂、NHR7c、NR7cR7d、COR7c、CSR7c、CN、COOH、COOR7c、CONH₂、SO₂R7c、SO₃H、SO₂NH₂、CONR7cR7d、SO₂NR7cR7d，其中R7c與R7d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R7c與R7d可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

其中，當R7之取代基為C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：R7e、C₁₋₆烷基、OH、OR7e、OCOR7e、SH、SR7e、SCOR7e、NH₂、NHR7e、NR7eR7f、COR7e、CSR7e、CN、COOH、COOR7e、CONH₂、SO₂R7e、SO₃H、SO₂NH₂、CONR7eR7f、SO₂NR7eR7f，其中R7e與R7f係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R7e

與R7f可與鄰接的雜原子一起形成雜環基；

Z可為N、CH或C-R8，其中R8係擇自於C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R8a、鹵素、OH、OR8a、SH、SR8a、OCOR8a、SCOR8a、NH₂、NHR8a、NR8aR8b、COR8a、CSR8a、CN、COOH、COOR8a、CONH₂、SO₂R8a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR8aR8b、SO₂NR8aR8b，其中R8a與R8b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R8a與R8b可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

其中，當R8係C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：R8c、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、OH、OR8c、OCOR8c、SH、SR8c、SCOR8c、NH₂、NHR8c、NR8cR8d、COR8c、CSR8c、CN、COOH、COOR8c、CONH₂、SO₂R8c、SO₃H、SO₂NH₂、CONR8cR8d、SO₂NR8cR8d，其中R8c與R8d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R8c與R8d可與鄰接的雜原子一起形成雜環基，

其中，當R8之取代基為C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、

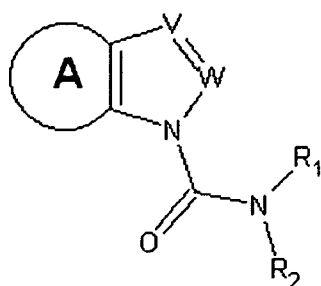
雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：R_{8e}、C₁₋₆烷基、OH、OR_{8e}、OCOR_{8e}、SH、SR_{8e}、SCOR_{8e}、NH₂、NHR_{8e}、NR_{8e}R_{8f}、COR_{8e}、CSR_{8e}、CN、COOH、COOR_{8e}、CONH₂、SO₂R_{8e}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{8e}R_{8f}、SO₂NR_{8e}R_{8f}，其中R_{8e}與R_{8f}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R_{8e}與R_{8f}可與鄰接的雜原子一起形成雜環基；

有條件的是，當R₁與R₂一起形成具有式I之化合物中之哌啶基時，該哌啶基不被下列取代：甲基、二甲基、乙基、異丙基、叔-丁基、三氟甲基、氯基、溴基或苯甲基，

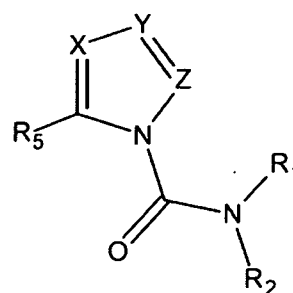
有條件的是，具式I之化合物中之R₁與R₂一起不會形成6,7-二甲氧基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、6-甲氧基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、7-甲氧基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、7-胺基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、7-硝基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、3,4-二氫-1H-異喹啉-1-基、3,4-二氫-2H-喹啉-1-基、吡咯烷-1-基、3,6-二氫-2H-吡啶-1-基、8-氮雜-螺[4.5]癸-8-基、1,3-二氫異吲哚-2-基、八氫異吲哚-2-基、1,2,6-三氮雜-螺[2.5]辛-1-烯-6-基或氮雜環庚烷-1-基，以及

有條件的是，當R₁與R₂與其等接觸之N一起形成哌啶基、哌嗪基、取代的哌啶基或取代的哌嗪基時，具式I之化合物中之環A不會形成吡啶、哌嗪、取代的吡啶或取代的哌嗪。

根據本發明之另外的具體例，提供有一種具式I或式II之化合物，或其藥學上可接受之鹽類或酯類；



式I



式II

其中：

R1與R2可各自獨立地擇自於H、C₁₋₂₀烷基、C₁₋₆烷氧基、芳基、雜芳基、部分或完全飽和的雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基、R1a、鹵素、OH、OR1a、SH、SR1a、OCOR1a、SCOR1a、NH₂、NHR1a、NR1aR1b、COR1a、CSR1a、CN、COOH、COOR1a、CONH₂、SO₂R1a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR1aR1b、SO₂NR1aR1b，其中R1a與R1b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R1a與R1b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R1或R2為C₁₋₂₀烷基、烷氧基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：R1c、鹵素、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜

環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆烷基胺基、C₁₋₆二烷基胺基、C₁₋₁₀烷基、OH、OR_{1c}、OCOR_{1c}、SH、SR_{1c}、SCOR_{1c}、NH₂、NO₂、NHR_{1c}、NR_{1c}R_{1d}、COR_{1c}、CSR_{1c}、CN、COOH、COOR_{1c}、CONH₂、SO₂R_{1c}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{1c}R_{1d}、SO₂NR_{1c}R_{1d}，其中R_{1c}與R_{1d}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R_{1c}與R_{1d}可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R₁或R₂之取代基為C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆烷基胺基、C₁₋₆二烷基胺基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：R_{1e}、鹵素、C₁₋₁₀烷基、OH、OR_{1e}、OCOR_{1e}、SH、SR_{1e}、SCOR_{1e}、NH₂、NO₂、NHR_{1e}、NR_{1e}R_{1f}、COR_{1e}、CSR_{1e}、CN、COOH、COOR_{1e}、CONH₂、SO₂R_{1e}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{1e}R_{1f}、SO₂NR_{1e}R_{1f}，其中R_{1e}與R_{1f}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R_{1e}與R_{1f}可與其等接觸之雜原子一起形成雜環基，

但是R₁與R₂二者不能均為H，

或

R1與R2可與其等接觸之N形成雜芳基或雜環基基團，其等中之每一個可任擇地被一或多個氧原子或一或多種擇自於下列之基團取代：羥基、芳基、雜芳基、部分或全部飽和的雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R2a、鹵素、OH、OR2a、SH、SR2a、OCOR2a、SCOR2a、NH₂、NO₂、NHR2a、NR2aR2b、COR2a、CSR2a、CN、COOH、COOR2a、CONH₂、SO₂R2a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR2aR2b、SO₂NR2aR2b，其中R2a與R2b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R2a與R2b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當由R1與R2一起形成之雜芳基或雜環基之取代基為芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、羥基、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₄烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷氧基、芳基C₁₋₄烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₄烷氧基、C₃₋₈環烷基C₁₋₄烷氧基、R2c、OR2c、SH、SR2c、OCOR2c、SCOR2c、NH₂、NO₂、NHR2c、NR2cR2d、COR2c、CSR2c、CN、COOH、COOR2c、CONH₂、SO₂R2c、SO₃H、SO₂NH₂、CONR2cR2d、

SO₂NR_{2c}R_{2d}，其中R_{2c}與R_{2d}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R_{2c}與R_{2d}可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當由R₁與R₂一起形成之雜芳基或雜環基之取代基之取代基為C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷氧基、芳基C₁₋₄烷氧基、雜芳基C₁₋₄烷氧基、雜環基C₁₋₄烷氧基、C₃₋₈環烷基C₁₋₄烷氧基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：C₁₋₄烷氧基、R_{2e}、鹵素、OH、OR_{2e}、SH、SR_{2e}、OCOR_{2e}、SCOR_{2e}、NH₂、NO₂、NHR_{2e}、NR_{2e}R_{2f}、NHCOR_{2e}、COR_{2e}、CSR_{2e}、CN、COOH、COOR_{2e}、CONH₂、SO₂R_{2e}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{2e}R_{2f}、SO₂NR_{2e}R_{2f}，其中R_{2e}與R_{2f}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R_{2e}與R_{2f}可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

環A係擇自於芳基、雜芳基以及雜環基部分，其等中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、C₁₋₆烷基、羥基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、Ra、C₁₋₁₀烷基、OH、ORa、OCORa、SH、SRa、SCORa、NH₂、NO₂、NHRa、NRaRb、CORa、CSRa、CN、COOH、COORa、CONH₂、CONHOH、CONHORA、SO₂Ra、SO₃H、SO₂NH₂、CONRaRb、SO₂NRaRb，其中Ra與Rb係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳

基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，或Ra與Rb可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當環A被 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、 C_{1-10} 烷基、 C_{3-8} 環烷基取代，或被含有一或多個部分之基團取代時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、Rc、 C_{1-10} 烷基、芳基 C_{1-6} 烷基、OH、ORc、OCORc、SH、SRc、SCORc、 NH_2 、 NO_2 、NHRc、NRcRd、CORc、CSRc、CN、COOH、COORc、CONH₂、 SO_2 Rc、 SO_3 H、 SO_2NH_2 、CONRcRd、 SO_2NRcRd ，其中Rc與Rd係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，或Rc與Rd可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

V可為N、CH或C-R3，其中R3係鹵素、 C_{1-10} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{3-8} 環烷基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R3a、OH、OR3a、SH、SR3a、OCOR3a、SCOR3a、 NH_2 、 NO_2 、NHR3a、NR3aR3b、COR3a、CSR3a、CN、COOH、COOR3a、CONH₂、 SO_2 R3a、 SO_3 H、 SO_2NH_2 、CONR3aR3b、 $SO_2NR3aR3b$ ，其中R3a與R3b係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，或R3a與R3b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R₃係 C_{1-10} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、 C_{1-6} 烷基、 C_{3-8} 環

烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、 R_{3c} 、 C_{1-10} 烷基、OH、 OR_{3c} 、 $OCOR_{3c}$ 、SH、 SR_{3c} 、 $SCOR_{3c}$ 、 NH_2 、 NO_2 、 NHR_{3c} 、 $NR_{3c}R_{3d}$ 、 COR_{3c} 、 CSR_{3c} 、CN、COOH、 $COOR_{3c}$ 、 $CONH_2$ 、 SO_2R_{3c} 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、 $CONR_{3c}R_{3d}$ 、 $SO_2NR_{3c}R_{3d}$ ，其中 R_{3c} 與 R_{3d} 係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，或 R_{3c} 與 R_{3d} 可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當 R_3 之取代基為 C_{1-10} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、 C_{1-6} 烷基、 C_{3-8} 環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、 R_{3e} 、 C_{1-10} 烷基、OH、 OR_{3e} 、 $OCOR_{3e}$ 、SH、 SR_{3e} 、 $SCOR_{3e}$ 、 NH_2 、 NO_2 、 NHR_{3e} 、 $NR_{3e}R_{3f}$ 、 COR_{3e} 、 CSR_{3e} 、CN、COOH、 $COOR_{3e}$ 、 $CONH_2$ 、 SO_2R_{3e} 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、 $CONR_{3e}R_{3f}$ 、 $SO_2NR_{3e}R_{3f}$ ，其中 R_{3e} 與 R_{3f} 係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，或 R_{3e} 與 R_{3f} 可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

W可為N、CH或C- R_4 ，其中 R_4 為鹵素、 C_{1-10} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、 C_{3-8} 環烷基、 R_{4a} 、OH、 OR_{4a} 、SH、 SR_{4a} 、 $OCOR_{4a}$ 、

SCOR4a、NH₂、NO₂、NHR4a、NR4aR4b、COR4a、CSR4a、CN、COOH、COOR4a、CONH₂、SO₂R4a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR4aR4b、SO₂NR4aR4b，其中R4a與R4b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R4a與R4b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R4為C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R4c、C₁₋₁₀烷基、OH、OR4c、OCOR4c、SH、SR4c、SCOR4c、NH₂、NO₂、NHR4c、NR4cR4d、COR4c、CSR4c、CN、COOH、COOR4c、CONH₂、SO₂R4c、SO₃H、SO₂NH₂、CONR4cR4d、SO₂NR4cR4d，其中R4c與R4d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R4c與R4d可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R4之取代基為C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、R4e、C₁₋₁₀烷基、OH、OR4e、OCOR4e、SH、SR4e、SCOR4e、NH₂、NO₂、NHR4e、NR4eR4f、COR4e、

CSR4e、CN、COOH、COOR4e、CONH₂、SO₂R4e、SO₃H、SO₂NH₂、CONR4eR4f、SO₂NR4eR4f，其中R4e與R4f係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R4e與R4f可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

R5係擇自於H、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R5a、鹵素、OH、OR5a、SH、SR5a、OCOR5a、SCOR5a、NH₂、NO₂、NHR5a、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH₂、SO₂R5a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR5aR5b、SO₂NR5aR5b，其中R5a與R5b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R5a與R5b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R5係C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R5c、C₁₋₆烷基、OH、OR5c、OCOR5c、SH、SR5c、SCOR5c、NH₂、NO₂、NHR5c、NR5cR5d、COR5c、CSR5c、CN、COOH、COOR5c、CONH₂、SO₂R5c、SO₃H、SO₂NH₂、CONR5cR5d、SO₂NR5cR5d，其中R5c與R5d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R5c與R5d可與其等連接之雜原子一

起形成雜環基，

其中，當R5之取代基為C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、R5e、C₁₋₆烷基、OH、OR5e、OCOR5e、SH、SR5e、SCOR5e、NH₂、NO₂、NHR5e、NR5eR5f、COR5e、CSR5e、CN、COOH、COOR5e、CONH₂、SO₂R5e、SO₃H、SO₂NH₂、CONR5eR5f、SO₂NR5eR5f，其中R5e與R5f係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R5e與R5f可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

X可為N、CH或C-R6，其中R6係擇自於C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R6a、鹵素、OH、OR6a、SH、SR6a、OCOR6a、SCOR6a、NH₂、NO₂、NHR6a、NR6aR6b、COR6a、CSR6a、CN、COOH、COOR6a、CONH₂、SO₂R6a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR6aR6b、SO₂NR6aR6b，其中R6a與R6b係獨立地擇自C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R6a與R6b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R6係雜芳基或雜環基時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多個氧原子取代，當R6係C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團

取代：鹵素、R6c、C₁₋₆烷基、C₁₋₆炔基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、OH、OR6c、OCOR6c、SH、SR6c、SCOR6c、NH₂、NO₂、NHR6c、NR6cR6d、COR6c、CSR6c、CN、COOH、COOR6c、CONH₂、CONHOH、C(NO₂)NH₂、SO₂R6c、SO₃H、SO₂NH₂、CONR6cR6d、SO₂NR6cR6d，其中R6c與R6d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R6c與R6d可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R6之取代基為雜芳基或雜環基時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多個氧原子取代，或當R6之取代基為C₁₋₆烷基、C₁₋₆炔基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、R6e、C₁₋₆烷基、C₁₋₄烷氧基、OH、OR6e、OCOR6e、SH、SR6e、SCOR6e、NH₂、NO₂、NHR6e、NR6eR6f、COR6e、CSR6e、CN、COOH、COOR6e、CONH₂、C(NO₂)NH₂、SO₂R6e、SO₃H、SO₂NH₂、CONR6eR6f、SO₂NR6eR6f，其中R6e與R6f係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及

雜環基，或R6e與R6f可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

Y可為N、CH或C-R7，其中R7係擇自於C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R7a、鹵素、OH、OR7a、SH、SR7a、OCOR7a、SCOR7a、NH₂、NO₂、NHR7a、NR7aR7b、COR7a、CSR7a、CN、COOH、COOR7a、CONH₂、SO₂R7a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR7aR7b、SO₂NR7aR7b，其中R7a與R7b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R7a與R7b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R7為雜芳基或雜環基時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多個氧原子取代，當R7係C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、R7c、C₁₋₆烷基、C₁₋₆炔基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、OH、OR7c、OCOR7c、SH、SR7c、SCOR7c、NH₂、NO₂、NHR7c、NR7cR7d、COR7c、CSR7c、CN、COOH、COOR7c、CONH₂、CONHOH、C(NO₂)NH₂、SO₂R7c、SO₃H、SO₂NH₂、CONR7cR7d、SO₂NR7cR7d，其中R7c與R7d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或

R7c與R7d可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R7之取代基係雜芳基或雜環基時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多個氧原子取代，或當R7之取代基為C₁₋₆烷基、C₁₋₆炔基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、芳基、雜芳基、雜環基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₁₋₄烷氧基、R7e、C₁₋₆烷基、OH、OR7e、OCOR7e、SH、SR7e、SCOR7e、NH₂、NO₂、NHR7e、NR7eR7f、COR7e、CSR7e、CN、COOH、COOR7e、CONH₂、C(NOH)NH₂、SO₂R7e、SO₃H、SO₂NH₂、CONR7eR7f、SO₂NR7eR7f，其中R7e與R7f係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R7e與R7f可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

Z可為N、CH或C-R8，其中R8係擇自於C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R8a、鹵素、OH、OR8a、SH、SR8a、OCOR8a、SCOR8a、NH₂、NO₂、NHR8a、NR8aR8b、COR8a、CSR8a、CN、COOH、COOR8a、CONH₂、SO₂R8a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR8aR8b、SO₂NR8aR8b，其中R8a與R8b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以

及雜環基，或R8a與R8b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R8為C₁₋₆烷基、C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、R8c、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、OH、OR8c、OCOR8c、SH、SR8c、SCOR8c、NH₂、NO₂、NHR8c、NR8cR8d、COR8c、CSR8c、CN、COOH、COOR8c、CONH₂、SO₂R8c、SO₃H、SO₂NH₂、CONR8cR8d、SO₂NR8cR8d，其中R8c與R8d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R8c與R8d可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R8之取代基為C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、C₃₋₈環烷基，或為含有一或多個部分之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、R8e、C₁₋₆烷基、OH、OR8e、OCOR8e、SH、SR8e、SCOR8e、NH₂、NO₂、NHR8e、NR8eR8f、COR8e、CSR8e、CN、COOH、COOR8e、

CONH₂、SO₂R_{8e}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{8e}R_{8f}、SO₂NR_{8e}R_{8f}，其中R_{8e}與R_{8f}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R_{8e}與R_{8f}可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

其中，至多，代表X、Y與Z之原子或基團中之二個可為N；

其中，當W為N時，該CONR₁R₂基團可改為連結至W，同時式I中之雙鍵因此而重新排列；

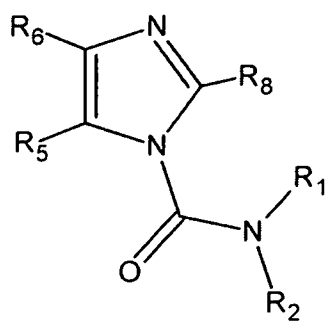
有條件的是，當R₁與R₂一起形成具有式I之化合物中之哌啶基時，該哌啶基不被下列取代：甲基、二甲基、乙基、異丙基、叔-丁基、甲氧羰基、三氟甲基、氯基、溴基或苯甲基，

有條件的是，具式I之化合物中之R₁與R₂一起不會形成6,7-二甲氧基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、6-甲氧基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、7-甲氧基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、7-胺基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、7-硝基-3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、3,4-二氫-1H-異喹啉-2-基、3,4-二氫-1H-異喹啉-1-基、3,4-二氫-2H-喹啉-1-基、吡咯烷-1-基、3,6-二氫-2H-吡啶-1-基、8-氮雜-螺[4.5]癸-8-基、1,3-二氮異吲哚-2-基、八氮異吲哚-2-基、1,2,6-三氮雜-螺[2.5]辛-1-烯-6-基或氮雜環庚烷-1-基，以及

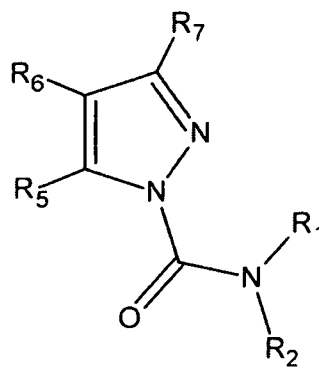
有條件的是，當R₁與R₂與其等接觸之N一起形成哌啶基、哌嗪基、取代的哌啶基或取代的哌嗪基時，具式I之化合物中之環A不會形成吡啶、嘧啶、取代的吡啶或取代的嘧

啉。

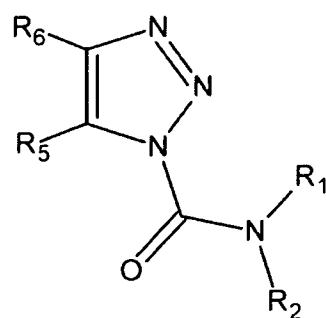
較佳地，本發明之化合物具有擇自於式I、式IIa、式IIb、式IIc以及式IId之化學式。



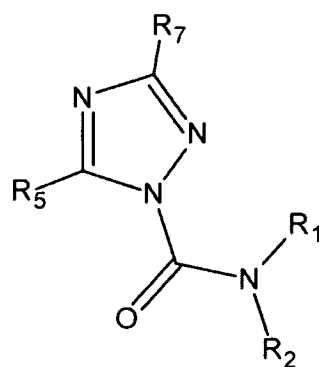
式IIa



式IIb

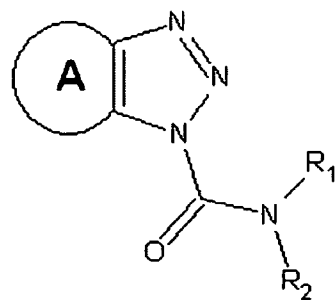


式IIc



式IId

更佳地，該化合物具有擇自於式Ia、式IIa、式IIb、式IIc以及式IId之化學式。



式Ia

在本發明之一具體例中，R1較佳地擇自於H以及C₁₋₄烷基。更佳地，R1係擇自於H以及C₁₋₃烷基，甚至更佳地，R1

係擇自於H、甲基以及乙基，以及最佳地，R1係擇自於H以及甲基。

R2較佳地擇自於C₁₋₄烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基以及C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。較佳地，該芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₁₀環烷基(包括芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基以及C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基中)具有6元單環之環結構。更佳地，該芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₁₀環烷基(包括芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基以及C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基中)係擇自於苯基、環己基、苯基C₁₋₆烷基以及環己基C₁₋₆烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。較佳地，芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基以及C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基中之每一個之C₁₋₆烷基為線性烷基。

選擇性地，R2可擇自於芳基、雜芳基、雜環基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基以及雜環基C₁₋₆烷基。其等中之每一個可被取代或未被取代，以及其中該芳基、雜芳基以及雜環基(包括芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基以及雜環基C₁₋₆烷基中)具有雙環之環結構，較佳地10元雙環之環結構。更佳地，R2係擇自於萘基以及萘基C₁₋₆烷基。

R2之芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₁₀環烷基基團中之每一個(包括芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基以及C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基中)可被一或多個鹵素取代。

任擇地，芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₁₀環烷基基團

中之每一個(包括芳基 C_{1-6} 烷基、雜芳基 C_{1-6} 烷基、雜環基 C_{1-6} 烷基以及 C_{3-10} 環烷基 C_{1-6} 烷基中)可被 C_{1-4} 烷氧基或芳氧基取代。較佳地，該 C_{1-4} 烷氧基係甲氧基或乙氧基。較佳地，該芳氧基係單環芳氧基，更佳地，苯氧基。

在一較佳具體例中，R1係擇自於H以及 C_{1-4} 烷基，而R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基、 C_{3-10} 環烷基、芳基 C_{1-6} 烷基、雜芳基 C_{1-6} 烷基、雜環基 C_{1-6} 烷基以及 C_{3-10} 環烷基 C_{1-6} 烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。更佳地，R1係擇自於H、甲基以及乙基，而R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及 C_{3-10} 環烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。更佳地，R1係甲基。更佳地，R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及 C_{5-8} 環烷基，其等中每一個為單環的，且可被取代或未被取代。又更佳地，R2係擇自於飽和雜環基以及 C_{5-8} 環烷基，其等中之每一個為單環的，且可被取代或未被取代。當R2為單環 C_{5-8} 環烷基時，其較佳地未被取代。較佳地，R2係環己基，諸如未被取代的環己基。當R2為單環飽和雜環基時，該雜環基之環較佳地含有單一雜原子。較佳地，該雜原子係氮或氧原子。更佳地，該雜環基係6元的，諸如哌啶基或四氫吡喃基基團。假如該雜原子係氧原子，則該雜環基較佳地未被取代。假如該雜原子為氮原子，則該氮雜原子可被取代或未被取代。假如該氮雜原子被取代，則其較佳地被擇自於下列之基團取代： C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{3-10} 環烷基、芳基 C_{1-6} 烷基、雜芳基 C_{1-6} 烷基、雜環基 C_{1-6} 烷基以及 C_{3-10} 環烷基 C_{1-6} 烷基，其等中之

每一個可被取代或未被取代。更佳地，該氮雜原子被擇自於下列之基團取代： C_{1-4} 烷基、芳基 C_{1-4} 烷基、雜芳基 C_{1-4} 烷基、雜環基 C_{1-4} 烷基以及 C_{5-8} 環烷基 C_{1-4} 烷基。更佳地，該氮雜原子被擇自於下列之基團取代：芳基 C_{1-4} 烷基以及雜芳基 C_{1-4} 烷基，其中該芳基以及雜芳基係單環的，較佳地為6元的。較佳地，該氮雜原子被擇自於下列之基團取代：苯基 C_{1-2} 烷基以及吡啶基 C_{1-2} 烷基。較佳地，於該雜環基基團中之雜原子，相對於該雜環基基團R2接觸至尿素氮之位置，位在4的位置。當R1與R2如此節之定義時，該化合物較佳地具有式IIa。較佳地，當R1與R2如此節之定義時，R6為被取代的或未被取代的芳基或雜芳基，較佳地，被取代的或未被取代的單環芳基或雜芳基。該單環芳基或雜芳基較佳係為6元的。於一具體例中，R6係取代的或未被取代的芳基(諸如苯基)，以及較佳地未被取代的。於另一具體例中，R6係取代的或未被取代的雜芳基，較佳地，取代的或未被取代的吡啶基。於一具體例中，該雜芳基被氧原子取代。例如，吡啶基之氮雜原子可被氧原子取代，以致其被氧化，如，形成N-氧化物。

已發現，依照以上節段之方式選擇R1與R2之化合物，對FAAH顯示出相對高的親和力。此外，已發現R2係雜環基，諸如哌啶基或四氫吡喃基，之化合物，具相對穩定的代謝性。

於一供選擇的具體例中，R2較佳地為 C_{2-20} 烷基。更佳地，R2為 C_{3-16} 烷基，又更佳地，R2為 C_{4-12} 烷基。較佳地，

該烷基係線性烷基。

於一較佳具體例中，R1係擇自於H以及C₁₋₄烷基，而R2為C₂₋₂₀烷基。

於許多具體例中，當R1係：H或C₁₋₄烷基；H或C₁₋₃烷基；H、甲基或乙基；H或甲基；或甲基時，R2可擇自於C₁₋₆烷氧基、芳基、雜芳基、部分或完全飽和雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基、鹵素、OH、OR1a、OCOR1a、SH、SR1a、SCOR1a、NH₂、NHR1a、NHSO₂NH₂、NHSO₂R1a、NR1aCOR1b、NHCOR1a、NR1aR1b、COR1a、CSR1a、CN、COOH、COOR1a、CONH₂、CONHOH、CONHR1a、CONHOR1a、SO₂R1a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR1aR1b、SO₂NR1aR1b，其中R1a與R1b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R1a與R1b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，其中R2可被取代或未被取代。

選擇性地，於另一具體例中，當R1係：H以及C₁₋₄烷基；H以及C₁₋₃烷基；H、甲基以及乙基；H以及甲基；或甲基時，則R2可擇自於芳基、雜芳基、部分或完全飽和雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基，其中R2可被取代或未被取代。

於一較佳具體例中，R1與R2與其等接觸之N一起形成雜環基基團，其可被取代或未被取代。較佳地，該雜環基係5或6元單環之環，更佳地5元單環之環。於某些具體例

中，該雜環基含有一或二個，較佳地1個，額外的雜原子(即，除了N之外)。此等額外的雜原子可為，例如，N、O和/或S。較佳地，該雜環基係噁唑烷基。較佳地，該噁唑烷基中之氧原子，相對於該尿素氮，位在3的位置。較佳地，該噁唑烷基被一、二或三個甲基或乙基基團取代。更佳地，該噁唑烷基被二個甲基或乙基取代。又更佳地，該噁唑烷基在相同的碳原子上被二個甲基基團取代。更佳地，該噁唑烷基係4,4-二甲基噁唑烷-3-基。當R1與R2如此節段之定義時，該化合物較佳地具有式Ia或IIa。較佳地，當R1與R2如此節段之定義且該化合物具有式IIa時，R6為取代的或未被取代的芳基，更佳地，苯基。當R1與R2如此節段之定義且該化合物具有式Ia時，環A較佳地為未被取代或取代的苯并部分。

已發現R1與R2之定義如前述節段之化合物，為對FAAH具相對強效之抑制劑。亦發現其等對FAAH具相對高的親和力。

於一供選擇的具體例中，R1與R2與其等接觸之N一起形成雜環基其團，其可被取代或未被取代。較佳地，該雜環基係5或6元單環之環，更佳地，6元單環之環。較佳地，R1與R2一起形成嗎啉基、哌嗪基、噁唑烷基、吡咯烷基或哌啶基。更佳地，R1與R2一起形成嗎啉基或哌嗪基。

較佳地，該R1與R2一起之雜環基被下列取代：C₁₋₄烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、芳氧基、雜芳氧基、芳基C₁₋₆烷氧基以及雜芳基C₁₋₆

烷氧基，其等中之每一個可任擇地被一或多個鹵素或 C_{1-4} 烷基基團取代。較佳地，該取代基芳基、雜芳基或 C_{3-8} 環烷基係5或6元單環之環。更佳地，該R1與R2一起之雜環基被芳基、芳基 C_{1-6} 烷基以及芳氧基取代，其等中之每一個任擇地被一或多個鹵素取代。又更佳地，該R1與R2一起之雜環基被苯基、苯基 C_{1-6} 烷基或苯氧基取代，其等中之每一個任擇地被一或多個鹵素取代。

選擇性地，該R1與R2一起之雜環基可被雜芳基或雜芳基 C_{1-6} 烷基取代。於一具體例中，該雜芳基具有雙環之環結構，例如，苯并二噁茂甲基。選擇性地，該雜芳基可為單環的，例如，吡啶基。

於另一選擇中，該R1與R2一起之雜環基可被 C_{3-8} 環烷基取代。較佳地，該 C_{3-8} 環烷基為單環環烷基，諸如環己基。

於一具體例中，該R1與R2一起之雜環基可為1,4-二噁-8-氮雜螺[4.5]癸-8-基、二甲基噁唑烷基、甲基哌嗪基、苯甲氧基苯哌嗪基、甲苯氧基哌啶基、吡咯烷基 C_{1-4} 烷基哌啶基、吡啶基哌啶基、吡啶基噁二唑-5-基哌啶基或苯甲氧基哌啶基。

於一具體例中，該R1與R2一起之雜環基可為被苯氧基或苯基 C_{1-4} 烷氧基取代之哌啶基，其中該苯基可任擇地被鹵素取代。

於本發明之一具體例中，當V為C-R3時，R3為H或鹵素。

於本發明之另一具體例中，當W為C-R4時，R4係擇自於H以及芳基。較佳地，R4係擇自於H以及苯基。更佳地，

R4係H。

根據本發明之化合物，環A較佳地係取代的或未被取代的單環芳基或雜芳基部分，更佳地單環芳基部分。較佳地，環A係取代的或未被取代的苯并部分。當環A之單環芳基被取代時，則該取代基係下列中之一或多個：鹵素、C₁₋₆烷基或芳基，其可任擇地被下列中之一或多個取代：鹵素、氰基、羧酸或醯胺。較佳地，該取代基芳基係單環芳基，更佳地，苯基。於較佳具體例中，具環A之定義如上節段之化合物，具有式Ia。

於一具體例中，環A被擇自於下列之部分取代：C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基以及C₀₋₆烷基-CO-C₀₋₆烷基，其中該C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基或C₀₋₆烷基-CO-C₀₋₆烷基被擇自於下列之部分取代：芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₁₀環烷基，其中此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基以及C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基。較佳地，環A被C₀₋₆烷基-CO-C₀₋₆烷基取代，其中該C₀₋₆烷基-CO-C₀₋₆烷基被擇自於下列之部分取代：芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₁₀環烷基，其中此等部分中之每一個可任擇地被下列取代：芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基以及C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基。較佳地，環A被羰基部分(即，C₀烷基-CO-C₀烷基)取代。較佳地，該C₀₋₆烷基-CO-C₀₋₆烷基被雜環基取代，更佳地單環雜環基，又更佳地含有一或二個氮雜原子之雜環

基，甚至更佳地6元雜環基，最佳地哌嗪。較佳地，該C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基或C₀₋₆烷基-CO-C₀₋₆烷基係線性的。較佳地，於此節段中所述之化合物具式Ia。

於另一具體例中，環A被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、OH、ORa、OCORa、SH、SRa、SCORa、NH₂、NO₂、NHRa、NHSO₂NH₂、NHSO₂Ra、NRaCORb、NHCORa、NHC(NH)NH₂、NRaRb、CORa、CSRa、CN、COOH、COORa、CONH₂、CONHRa、CONHOH、CONHORA、C(NO₂)NH₂、CONRaRb、SO₂Ra、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NRaRb，其中Ra與Rb係C₁₋₆烷基。較佳地，環A被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、OH、SH、NH₂、NO₂、NHC(NH)NH₂、CN、COOH、CONH₂、CONHOH、C(NO₂)NH₂、SO₃H以及SO₂NH₂。更佳地，環A被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、OH、NH₂、NO₂、NHC(NH)NH₂、CN、COOH、CONH₂、CONHOH、C(NO₂)NH₂、SO₃H以及SO₂NH₂。較佳地，如此節段中所述之化合物具式Ia。

較佳地，本發明之化合物中，R5係H或鹵素，更佳地，R5係H。

於一具體例中，R5與其接觸之環碳一起不會形成羰基基團。該化合物具以上所示之式II。

於另一具體例中，X不是O。該化合物具以上所示之式II。

於具式II之化合物中，當X係C-R6時，R6較佳地係取代

的或未被取代的芳基。較佳地，該芳基R6係苯基或萘基。更佳地，該芳基R6係苯基。較佳地，該芳基R6被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、C₁₋₄烷氧基、羥基、醯胺、芳基、雜環基、雜芳基、雜環基、芳氧基，其等中之每一個可被取代或未被取代。較佳地，該R6之芳基取代基係苯基，其可被取代或未被取代。當R6如此節段之定義時，具式II之化合物較佳地為咪唑(即，X是CH或C-R6，Y為N以及Z為CH或C-R8)或1,2,3-三唑(即，X係CH或C-R6，Y係N以及Z係N)。更佳地，該化合物具式IIa。

選擇性地，R6較佳地係H、鹵素或芳基，更佳地係H。當R6如此節段之定義時，式II之化合物較佳地係吡唑(即，X係CH或C-R6，Y係CH或C-R7以及Z係N)。

於本發明之具體例中，當Y係C-R7時，R7係擇自於芳基或雜芳基，其等中之每一個可被取代或未被取代。較佳地，該芳基以及雜芳基係單環的。較佳地，該芳基或雜芳基被一或多個鹵素取代。於本發明之較佳具體例中，R7係取代的或未被取代的芳基。當R7如此節段之定義時，式II之化合物較佳地係吡唑(即，X係CH或C-R6，Y係CH或C-R7以及Z係N)或1,2,4-三唑(即，X係N，Y係CH或C-R7以及Z係N)。

於一具體例中，當Y係C-R7時，R7係H。

於本發明之另一具體例中，當Z係C-R8時，R8係擇自於H以及芳基。較佳地，R8係擇自於H以及苯基。更佳地，R8係H。

於本發明之一具體例中，R6係擇自於下列之基團：芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基，其中該R6基團被擇自於下列之基團取代：C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基以及C₀₋₆烷基-CO-C₀₋₆烷基，其中該C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基或C₀₋₆烷基-CO-C₀₋₆烷基基團被擇自於下列之基團取代：芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₁₀環烷基。較佳地，R6係擇自於下列之基團：芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基，其中該R6基團被擇自於下列之基團取代：C₁₋₆烷氧基以及C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基，其中該C₁₋₆烷氧基或C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基基團被擇自於下列之基團取代：芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₁₀環烷基。較佳地，R6係擇自於下列之基團：芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基，其中該R6基團被擇自於下列之基團取代：C₁₋₆烷氧基以及C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基，其中該C₁₋₆烷氧基或C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基基團被雜環基取代。更佳地，R6係芳基，其被擇自於C₁₋₆烷氧基以及C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基之基團取代，其中該C₁₋₆烷氧基或C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基基團被雜環基取代。又更佳地，R6係芳基，其被C₁₋₆烷氧基取代，其中該C₁₋₆烷氧基被雜環基取代。

較佳地，R6係芳基。較佳地，R6具單環之環結構，諸如單環芳基。於一具體例中，R6具有6元環結構，諸如苯基。

較佳地，該C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基或C₀₋₆烷基-CO-C₀₋₆烷基係線性的。

較佳地，該C₁₋₆烷氧基或C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基之取代基係單環的。較佳地，該C₁₋₆烷氧基或C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基之取代

基係6元的。較佳地，該C₁₋₆烷氧基或C₁₋₆烷氧基C₁₋₆烷基之取代基係雜環基。較佳地，該雜環基係完全飽和的。較佳地，該雜環基含有一或二個雜原子，諸如氮或氧。較佳地，該雜環基含有至少一個氮雜原子。於一具體例中，該雜環基係哌啶基、哌嗪基或四氫吡喃基。於此具體例中，該化合物較佳地具式IIa。

於一具體例中，當W係N時，該CONR₁R₂基團可不改為連接至W。於此具體例中，該化合物具有如上所示之式I。
式I以及Ia

在具有式I之化合物，特別是具式Ia之化合物中，環A較佳地係取代的或未被取代的芳基或雜芳基部分。更佳地，環A係取代的或未被取代的單環芳基或雜芳基部分。又更佳地，環A係取代的或未被取代的6元芳基或雜芳基部分。更佳地，環A係取代的或未被取代的單環芳基，諸如苯并部分。

當環A被取代時，該取代基可為一或多種擇自於下列之基團：鹵素、OH、C₁₋₄烷基、C₁₋₄烷氧基、SH、NH₂、NO₂、CN、COOH、CONH₂、CONHOH、苯甲醯氧基胺羧基、SO₃H、SO₂NH₂、芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₈環烷基。當該取代基係C₁₋₄烷基、芳基、雜芳基、雜環基或C₃₋₈環烷基時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、OH、SH、NH₂、NO₂、CN、COOH、CONH₂、SO₃H、SO₂NH₂、C₁₋₃烷基、C₁₋₃烷氧基以及苯甲基。

較佳地，該環A之取代基係一或多種擇自於下列之基

團：鹵素、OH、 C_{1-3} 烷基、 C_{1-3} 烷氧基、 NH_2 、 NO_2 、CN、 $COOH$ 、 $CONH_2$ 、單環芳基、單環雜芳基、單環雜環基以及 C_{5-8} 環烷基。當該取代基係 C_{1-3} 烷基、單環芳基、單環雜芳基、單環雜環基或 C_{5-8} 環烷基時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、CN、 $COOH$ 、 $CONH_2$ 以及 C_{1-3} 烷氧基。

更佳地，環A之取代基係一或多種擇自於下列之基團：鹵素、OH、 C_{1-2} 烷基、 C_{1-2} 烷氧基以及苯基。當該取代基係 C_{1-2} 烷基或苯基時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、CN、 $COOH$ 、 $CONH_2$ 以及 C_{1-3} 烷氧基。

於具式I之化合物，特別是具式Ia之化合物之較佳具體例中，R1與R2與其等接觸之N一起形成被取代或未被取代的雜環基。較佳地，該雜環基係5或6元單環之環，更佳地，6元單環之環。於某些具體例中，該雜環基含有一或二個，較佳地1個額外的雜原子(即，除了N之外)，此等額外的雜原子可為，例如，N、O和/或S。於一具體例中，該雜環基係嗎啉基。於供選擇的具體例中，該雜環基係哌嗪基。於其它具體例中，該雜環基不含額外的雜原子(即，其含單一個N原子)。於一具體例中，該雜環基係哌啶基。當該雜環基被取代時，其較佳地被芳基或芳基 C_{1-4} 烷基取代，其中該芳基較佳地係單環的，更佳地係苯基。該烷基較佳地為線性的。更佳地，該雜環基被芳基或芳基 C_{1-2} 烷基取代，其中該芳基較佳地為單環的，更佳地為苯基。

於具式I之化合物，特別是具式Ia之化合物中，R1係擇自於H以及C₁₋₄烷基，R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基以及C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。於一具體例中，R1係擇自於H、甲基以及乙基，R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及C₅₋₈環烷基，其等中之每一個可為單環的且可被取代或未被取代。更佳地，R1係擇自於H以及甲基。於一具體例中，R1係甲基。於供選擇的具體例中，R1係H。更佳地，R2係擇自於飽和雜環基以及C₅₋₈環烷基，其等中之每一個可為單環的且可被取代或未被取代。當R2係單環C₅₋₈環烷基時，其較佳地未被取代。較佳地，R2係環戊基或環己基。更佳地，R2係環己基，諸如未被取代的環己基。當R2係單環飽和雜環基時，該雜環基環較佳地含有單一雜原子。更佳地，該雜環基係6元的，諸如哌啶基或四氫吡喃基基團。該氮雜原子可被取代或未被取代。

於供選擇的具體例中，R1係擇自於H、甲基以及乙基，R2係擇自於芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基以及C₅₋₈環烷基C₁₋₆烷基，其等中之每一個可為單環的且可被取代或未被取代。更佳地，R2係芳基C₁₋₆烷基，其中該芳基係單環的，且可被取代或未被取代。又更佳地，R2係芳基C₁₋₆烷基，其中該芳基係單環的且可被取代或未被取代，以及該C₁₋₆烷基係線性的。甚至更佳地，R2係苯基C₁₋₆烷基，其可被取代或未被取代，以及該C₁₋₆烷基係線性的。

於一具體例中，該苯基未被取代。

於供選擇的具體例中，R1係擇自於H、甲基以及乙基，R2係被擇自於下列之基團取代之C₁₋₄烷基：芳基C₁₋₄烷氧基、雜芳基C₁₋₄烷氧基、雜環基C₁₋₄烷氧基以及C₅₋₈環烷基C₁₋₄烷氧基，其等中之每一個為單環的，且可被取代或未被取代。較佳地，R2被C₁₋₃烷基取代。於一具體例中，R2被C₁₋₂烷基取代。較佳地，R2之取代基係芳基C₁₋₄烷氧基，其中該芳基係單環的，且可被取代或未被取代。又更佳地，R2之取代基係芳基C₁₋₄烷氧基，其中該芳基係單環的，且可被取代或未被取代，以及該C₁₋₄烷氧基係線性的。甚至更佳地，R2之取代基係苯基C₁₋₄烷氧基，其可被取代或未被取代，以及該C₁₋₄烷氧基係線性的。於一具體例中，R2之取代基係芳基C₁₋₃烷氧基，其中該芳基係單環的(如，苯基)，且可被取代或未被取代，以及該C₁₋₃烷氧基係線性的。於一些具體例中，該苯基未被取代。

於具式I之化合物，特別是具式Ia之化合物之又另一具體例中，R1係擇自於H以及C₁₋₄烷基，R2係擇自於雜環基，其可被取代或未被取代。較佳地，R1係H、甲基或乙基，R2係雙環雜環基，其可被取代或未被取代。更佳地，R1係H或甲基，R2係雙環雜環基，其可被取代或未被取代，其中該雜環基之環中之一個含有二個氧原子。於一具體例中，R2係3,3-二甲基-1,5-二噁螺[5.5]十一烷-9-基。

於具式I之化合物，特別是具式Ia之化合物之供選擇的較佳具體中，R1係擇自於H以及C₁₋₄烷基，R2係C₂₋₂₀烷基。

更佳地，R1係H、甲基或乙基，又更佳地，R1係H或甲基。
較佳地，R2係C₃₋₁₆烷基，其中該烷基係線性烷基。更佳地，
R2係C₄₋₁₄烷基，其中該烷基係線性烷基。

式IIa

於具式IIa之化合物之較佳具體例中，R1係擇自於H以及C₁₋₄烷基，R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基以及C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。更佳地，R1係擇自於H、甲基以及乙基，R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₁₀環烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。更佳地，R1係甲基。更佳地，R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及C₅₋₈環烷基，其等中之每一個可為單環的且可被取代或未被取代。又更佳地，R2係擇自於芳基，諸如苯基、飽和雜環基以及C₅₋₈環烷基，其等中之每一個可為單環的且可被取代或未被取代。當R2係單環C₅₋₈環烷基(即，環戊基、環己基、環庚基或環辛基)或芳基時，其較佳地未被取代。較佳地，R2係環己基，諸如未被取代的環己基。當R2係單環飽和雜環基時，該雜環基環較佳地含有單一雜原子，諸如氮或氧。更佳地，該雜環基係6元的，諸如哌啶基或四氫吡喃基基團。於一具體例中，該雜原子係氮雜原子，其可被取代或未被取代。較佳地，於該雜環基基團中之雜原子，相對於該雜環基基團R2接觸至尿素氮之位置，位在4的位置。於一具體例中，該氮原子被單環芳基(較佳地苯基)C₁₋₃烷基取代；較佳地，該氮原子

被苯甲基或苯乙基取代；以及更佳地，該氮原子被苯甲基取代。

於具式IIa之化合物之供選擇的較佳具體例中，R1與R2與其等接觸之N一起形成雜環基基團，其可被取代或未被取代。較佳地，該雜環基係5或6元單環之環，更佳地，5元單環之環。於某些具體例中，該雜環基含有一或二個，較佳地1個額外的雜原子(即，除N外)。此等額外的雜原子可為，例如，N、O和/或S。較佳地，該雜環基係噁唑烷基。較佳地，該噁唑烷基中之氧原子，相對於尿素氮，位在3的位置。較佳地，該噁唑烷基被一、二或三個甲基或乙基基團取代。更佳地，該噁唑烷基被二個甲基或乙基基團取代。又更佳地，該噁唑烷基在相同的碳原子上，被二個甲基基團取代。更佳地，該噁唑烷基係4,4-二甲基噁唑烷-3-基。

於具式IIa之化合物之又另一較佳具體例中，R1與R2與其等接觸之N一起形成雜環基其團，其可被取代或未被取代。較佳地，該雜環基係5或6元單環之環，更佳地，6元單環之環。於某些具體例中，該雜環基含有一或二個，較佳地1個額外的雜原子(即，除N外)。此等額外的雜原子可為，例如，N、O和/或S。於一具體例中，該雜環基係嗎啉基。於供選擇的具體例中，該雜環基係哌嗪基。於其它具體例中，該雜環基不含額外的雜原子(即，其含單一個N原子)。於一具體例中，該雜環基係哌啶基(piperidinyl)。當該雜環基被取代時，其較佳地被芳基、芳基C₁₋₄烷基、C₅₋₆環烷基或C₅₋₆環烷基C₁₋₄烷基取代，其中該芳基較佳地係單環的，

更佳地為苯基，以及該環烷基較佳地係環己基。該烷基較佳地係線性的。於一具體例中，該雜環基被芳基或芳基 C_{1-4} 烷基(較佳地 C_{1-2} 烷基)取代，其中該芳基較佳地係單環的，更佳地為苯基。該芳基可任擇地被一或多個鹵素原子取代。

於具式IIa之化合物中，R5較佳地擇自於H、 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{3-8} 環烷基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R5a、鹵素、OH、OR5a、SH、SR5a、OCOR5a、SCOR5a、 NH_2 、 NO_2 、NHR5a、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH₂、 SO_2R5a 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、CONR5aR5b、 $SO_2NR5aR5b$ ，其中R5a與R5b係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，且R5a與R5b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基。更佳地，R5係擇自於H、 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{3-8} 環烷基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、鹵素、OH、SH、 NH_2 、 NO_2 、CN、COOH、CONH₂、 SO_3H 、 SO_2NH_2 。又更較佳地，R5係擇自於H、 C_{1-4} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{5-8} 環烷基、 C_{1-4} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、鹵素、OH、SH、 NH_2 、 NO_2 、CN、COOH、CONH₂、 SO_3H 、 SO_2NH_2 ，其中該芳基、雜芳基、雜環基以及 C_{5-8} 環烷基基團可為單環的。甚至更佳地，R5係擇自於H、 C_{1-3} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{5-8} 環烷基、鹵素、OH、 NH_2 、COOH以及CONH₂，其中該芳基、雜芳基、雜環基以及 C_{5-8} 環烷基基團係單環的。又更佳地，R5係擇自於H、 C_{1-2} 烷基以及鹵素。甚至更佳地，R5係擇自於H以及鹵

素，諸如F、Cl以及Br。於一具體例中，R5係H。

於具式IIa之具體例中，R6較佳地擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₈環烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。更佳地，R6係擇自於芳基以及雜芳基，其等中之每一個可被取代或未被取代。於一具體例中，該雜芳基含有一個雜原子，如氧或氮原子。較佳地，該芳基或雜芳基係單環的。更佳地，該芳基或雜芳基係6元單環之環，例如，苯基或吡啶基。於一具體例中，該雜芳基含有氮原子，其被氧原子取代，諸如氧撐吡啶基。於另一具體例中，R6係未被取代的單環芳基(諸如苯基)，或被一或多種擇自於下列之基團取代之單環芳基(諸如苯基)：鹵素、C₁₋₂烷氧基(任擇地被一或多個鹵素原子取代)或OH。

於一具體例中，R6係未被取代的或取代的2-側氧-2,3-二氫-1H-苯并[d]咪唑基。

當R6被取代時，該取代基較佳地係一或多種擇自於下列之基團：鹵素、C₁₋₄烷氧基、芳基、雜芳基、雜環基、OH、CN、CONH₂、NH₂、雜環基C₁₋₄烷氧基、芳基C₁₋₄烷氧基、雜芳基C₁₋₄烷氧基、NO₂、SO₂NH₂、SO₃、C(NO₂)NH₂、CONHOH、2H-四唑-5-基、二甲胺基、苯甲胺基、甲磺醯基、嗎啉磺醯基以及哌啶基磺醯基。該哌啶基磺醯基可任擇地被芳基甲氧基(較佳地苯甲磺醯氧基)或OH取代。較佳地，該芳基、雜芳基以及雜環基為單環的。於一具體例中，該芳基、雜芳基以及雜環基係6元單環之環。於R6為單環芳基之特別的具體例中，其可任擇地被一或多種擇自於下列

之基團取代：鹵素、OH、 C_{1-3} 烷氧基(較佳地 C_{1-2} 烷氧基)、芳基(如，單環芳基，諸如苯基)、雜芳基(如，含一或二個氮原子或一個氧原子之單環雜芳基)、雜環基(如，哌嗪基、哌啶基(piperadiny)或嗎啉基) C_{1-3} 烷氧基(較佳地 C_{1-2} 烷氧基)、芳基(如，單環芳基，諸如苯基) C_{1-3} 烷氧基(較佳地 C_{1-2} 烷氧基)、 $CONH_2$ 、 NH_2 、 NO_2 、 $OCHF_2$ 、 SO_2NH_2 、嗎啉磺醯基以及 $C(NO_2)NH_2$ 。

於R6為單環芳基之另一具體例中，其可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、OH、甲氧基、苯基、吡啶基、吡嗪基、吡喃基、哌嗪甲氧基、哌啶甲氧基、嗎啉基甲氧基、苯甲氧基、 $CONH_2$ 、 NH_2 、 NO_2 、 $OCHF_2$ 、 SO_2NH_2 、嗎啉磺醯基以及 $C(NO_2)NH_2$ 。

於一具體例中，當R6係單環芳基，諸如苯基，時，該R6之取代基係芳基，較佳地單環芳基，諸如苯基，其可被取代或未被取代。當其被取代時，較佳地其被 $CONH_2$ 取代。

當R6之取代基為 C_{1-4} 烷氧基、芳基、雜芳基、雜環基、雜環基 C_{1-4} 烷氧基、芳基 C_{1-4} 烷氧基、雜芳基 C_{1-4} 烷氧基或 SO_3 時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、OH、 C_{1-3} 烷氧基(其可被一或多個鹵素取代)、 $CONH_2$ 、CN、 NCH_3CH_3 、 $NHCOCH_3$ 、甲羥基丁基以及甲羥基丁炔基。

於具式IIa之化合物中，R8較佳地擇自於H、 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{3-8} 環烷基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R8a、鹵素、OH、OR8a、SH、SR8a、

OCOR_{8a} 、 SCOR_{8a} 、 NH_2 、 NO_2 、 NHR_{8a} 、 $\text{NR}_{8a}\text{R}_{8b}$ 、 COR_{8a} 、 CSR_{8a} 、 CN 、 COOH 、 COOR_{8a} 、 CONH_2 、 SO_2R_{8a} 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、 $\text{CONR}_{8a}\text{R}_{8b}$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}_{8a}\text{R}_{8b}$ ，其中 R_{8a} 與 R_{8b} 係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，且 R_{8a} 與 R_{8b} 可與其等連接之雜原子一起形成雜環基。更佳地， R_8 係擇自於 H 、 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{3-8} 環烷基、 C_{1-6} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、鹵素、 OH 、 SH 、 NH_2 、 NO_2 、 CN 、 COOH 、 CONH_2 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 。又更佳地， R_8 係擇自於 H 、 C_{1-4} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{5-8} 環烷基、 C_{1-4} 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、鹵素、 OH 、 SH 、 NH_2 、 NO_2 、 CN 、 COOH 、 CONH_2 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 ，其中該芳基、雜芳基、雜環基以及 C_{5-8} 環烷基基團為單環的。甚至更佳地， R_8 係擇自於 H 、 C_{1-3} 烷基、芳基、雜芳基、雜環基、 C_{5-8} 環烷基、鹵素、 OH 、 NH_2 、 COOH 以及 CONH_2 ，其中該芳基、雜芳基、雜環基以及 C_{5-8} 環烷基基團係單環的。又更佳地， R_8 係擇自於 H 、 C_{1-2} 烷基、鹵素以及單環芳基，諸如苯基。甚至更佳地， R_8 係擇自於 H 、 C_{1-2} 烷基以及鹵素，諸如 F 、 Cl 以及 Br 。又更佳地， R_8 係擇自於 H 以及鹵素，諸如 F 、 Cl 以及 Br 。於一具體例中， R_8 係 H 。

於具式IIa之化合物之具體例中， R_1 係擇自於 H 以及 C_{1-4} 烷基，

R_2 係擇自於芳基、雜芳基、雜環基、 C_{3-10} 環烷基、芳基 C_{1-6} 烷基、雜芳基 C_{1-6} 烷基、雜環基 C_{1-6} 烷基以及 C_{3-10} 環烷

基 C_{1-6} 烷基，其等中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代： R_{2a} 、鹵素、OH、 OR_{2a} 、 $OCOR_{2a}$ 、SH、 SR_{2a} 、 $SCOR_{2a}$ 、 NH_2 、 NHR_{2a} 、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R_{2a}$ 、 $NR_{2a}COR_{2b}$ 、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NHCOR_{2a}$ 、 $NR_{2a}R_{2b}$ 、 COR_{2a} 、 CSR_{2a} 、CN、COOH、 $COOR_{2a}$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHOH$ 、 $CONHR_{2a}$ 、 $CONHOR_{2a}$ 、 $C(NO_2)NH_2$ 、 SO_2R_{2a} 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、 $CONR_{2a}R_{2b}$ 、 $SO_2NR_{2a}R_{2b}$ ，其中 R_{2a} 與 R_{2b} 係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，或 R_{2a} 與 R_{2b} 可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當 R_2 之取代基係 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基、雜環基，或為含此等部分中之一或多個之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代： R_{2c} 、鹵素、OH、 OR_{2c} 、 $OCOR_{2c}$ 、SH、 SR_{2c} 、 $SCOR_{2c}$ 、 NH_2 、 NHR_{2c} 、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R_{2c}$ 、 $NR_{2c}COR_{2d}$ 、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NHCOR_{2c}$ 、 $NR_{2c}R_{2d}$ 、 COR_{2c} 、 CSR_{2c} 、CN、COOH、 $COOR_{2c}$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHOH$ 、 $CONHR_{2c}$ 、 $CONHOR_{2c}$ 、 $C(NO_2)NH_2$ 、 SO_2R_{2c} 、 SO_3H 、 SO_2NH_2 、 $CONR_{2c}R_{2d}$ 、 $SO_2NR_{2c}R_{2d}$ ，其中 R_{2c} 與 R_{2d} 係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基，或 R_{2c} 與 R_{2d} 可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

R_5 係擇自於H、 R_{5a} 、鹵素、OH、 OR_{5a} 、 $OCOR_{5a}$ 、SH、 SR_{5a} 、 $SCOR_{5a}$ 、 NH_2 、 NHR_{5a} 、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R_{5a}$ 、

NR5aCOR5b、NHC(NH)NH₂、NHCOR5a、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH₂、CONHOH、CONHR5a、CONHOR5a、C(NOH)NH₂、SO₂R5a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR5aR5b、SO₂NR5aR5b，其中R5a與R5b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R5a與R5b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

R6係擇自於芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基，其等中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：R6a、鹵素、OH、OR6a、OCOR6a、SH、SR6a、SCOR6a、NH₂、NHR6a、NHSO₂NH₂、NHSO₂R6a、NR6aCOR6b、NHC(NH)NH₂、NHCOR6a、NR6aR6b、COR6a、CSR6a、CN、COOH、COOR6a、CONH₂、CONHOH、CONHR6a、CONHOR6a、C(NOH)NH₂、SO₂R6a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR6aR6b、SO₂NR6aR6b，其中R6a與R6b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R6a與R6b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，以及其中，當R6係雜芳基或雜環基時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多個氧原子取代，

其中，當R6之取代基係C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基，雜環基，或為含此等部分中之一或多個之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：R6c、鹵素、OH、OR6c、OCOR6c、SH、SR6c、SCOR6c、NH₂、NHR6c、NHSO₂NH₂、

NHSO₂R_{6c}、NR_{6c}COR_{6d}、NHC(NH)NH₂、NHCOR_{6c}、NR_{6c}R_{6d}、COR_{6c}、CSR_{6c}、CN、COOH、COOR_{6c}、CONH₂、CONHOH、CONHR_{6c}、CONHOR_{6c}、C(NOH)NH₂、SO₂R_{6c}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{6c}R_{6d}、SO₂NR_{6c}R_{6d}。其中，R_{6c}與R_{6d}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R_{2c}與R_{2d}可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，以及其中，當R₆之取代基係雜芳基或雜環基時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多個氧原子取代，以及

R₈係擇自於H、R_{5a}、鹵素、OH、OR_{5a}、OCOR_{5a}、SH、SR_{5a}、SCOR_{5a}、NH₂、NHR_{5a}、NHSO₂NH₂、NHSO₂R_{5a}、NR_{5a}COR_{5b}、NHC(NH)NH₂、NHCOR_{5a}、NR_{5a}R_{5b}、COR_{5a}、CSR_{5a}、CN、COOH、COOR_{5a}、CONH₂、CONHOH、CONHR_{5a}、CONHOR_{5a}、C(NOH)NH₂、SO₂R_{5a}、SO₃H、SO₂NH₂、CONR_{5a}R_{5b}、SO₂NR_{5a}R_{5b}，其中R_{5a}與R_{5b}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R_{5a}與R_{5b}可與其等連接之雜原子一起形成雜環基。

於以上具體例中，較佳地，R₁係擇自於H、甲基以及乙基，R₂係擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₁₀環烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。更佳地，R₁係甲基。更佳地，R₂係擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及C₅₋₈環烷基，其等中之每一個可為單環的，且可被取代或未被取代。又更佳地，R₂係擇自於雜環基以及C₅₋₈環烷基，其等中之每一

個為單環的，且可被取代或未被取代。較佳地，該雜環基係完全飽和的。當R2係單環C₅₋₈環烷基(即，環戊基、環己基、環庚基或環辛基)時，其較佳地未被取代。於一具體例中，R2係環庚基或環己基，諸如未被取代的環庚基或未被取代的環己基。當R2係單環飽和雜環基時，該雜環基之環較佳地含有單一雜原子，諸如氮或氧。較佳地，該雜環基係6元的，諸如哌啶基或四氫吡喃基基團。較佳地，該雜環基基團中之雜原子，相對於該雜環基基團R2接觸至尿素氮之位置，位在4的位置。於一具體例中，該雜原子係氮雜原子，其可被取代或未被取代。

於特別的具體例中，該氮原子被擇自於下列之基團取代：CN、CONH₂、C(NO₂)NH₂、SO₂-C₁₋₄烷基、SO₂-芳基(任擇地被C₁₋₄烷基或C₁₋₄鹵烷基取代，諸如三氟甲基)、CO-雜芳基(任擇地被雜芳基或鹵素取代)、CO-C₁₋₄烷基、COO-C₁₋₄烷基、C₁₋₄烷基(任擇地被OH、CN、COOH取代)、芳基C₁₋₃烷基、雜芳基C₁₋₃烷基，諸如哌啶C₁₋₃烷基(任擇地被COO-C₁₋₃烷基取代)、雜環基C₁₋₃烷基、芳基、雜芳基(任擇地被一或多個鹵素取代，諸如氯)以及雜環基。較佳地，該氮原子被擇自於下列之基團取代：CN、CONH₂、C(NO₂)NH₂、SO₂-C₁₋₄烷基、SO₂-單環芳基(任擇地被C₁₋₄鹵烷基取代，諸如三氟甲基)、CO-單環雜芳基(任擇地被單環雜芳基或鹵素取代)、CO-C₁₋₄烷基、COO-C₁₋₄烷基、C₁₋₄烷基(任擇地被OH、CN、COOH取代)、單環芳基C₁₋₃烷基、單環雜芳基C₁₋₃烷基，諸如哌啶基C₁₋₃烷基(任擇地被

COO- C_{1-3} 烷基取代)、單環雜環基 C_{1-3} 烷基、單環芳基、單環雜芳基(任擇地被一或多個鹵素取代,諸如氯)以及單環雜環基。更佳地,該氮原子被擇自於下列之基團取代:CN、 C_{1-4} 烷基(任擇地被OH、CN、COOH取代)、單環芳基 C_{1-3} 烷基以及單環雜芳基 C_{1-3} 烷基(較佳地,哌啶基 C_{1-3} 烷基)。又更佳地,該氮原子被擇自於下列之基團取代: C_{1-4} 烷基(任擇地被OH、CN、COOH取代)、單環芳基 C_{1-3} 烷基以及單環雜芳基 C_{1-3} 烷基(較佳地,哌啶基 C_{1-3} 烷基)。

於一具體例中,該氮原子被單環芳基(較佳地,苯基) C_{1-3} 烷基取代;較佳地,該氮原子被苯甲基或苯乙基取代,更佳地,該氮原子被苯甲基取代。

於一具體例中,R5係H、鹵素、OH或 C_{1-4} 烷基。較佳地,R5係H。

於另一具體例中,R6係擇自於芳基、雜芳基以及雜環基,其等中之每一個可被取代或未被取代。較佳地,R6係擇自於單環芳基(諸如苯基)、單環雜芳基(諸如吡啶基)以及雜環基,其等中之每一個可被取代或未被取代。於一具體例中,R6係未被取代的芳基。當R6係取代的芳基時,其較佳地被一或多種擇自於下列之基團取代:鹵素、R6a、OH、OR6a、 NH_2 、 NO_2 、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NHR6a$ 、 $NR6aR6b$ 、 $C(NOH)NH_2$ 、 $COR6a$ 、 $COOH$ 、 $COOR6a$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHOH$ 、 SO_2R6a 、 $SO_2NR6aR6b$,其中R6a與R6b係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷基、取代的 C_{1-6} 烷基、芳基、雜芳基、 C_{3-8} 環烷基以及雜環基,其中R6a與R6b係獨立地擇自於 C_{1-6} 烷

基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，

其中，當R6之取代基係C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基、雜環基，或為含此等部分中之一或多個之基團時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：OR6c、OH以及CONH₂，其中R6c與R6d係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且其中，當R6之取代基係雜芳基或雜環基時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多個氧原子取代。

較佳地，當R6係取代的芳基時，其被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、OH、C₁₋₄烷氧基、CONH₂、C(NO₂)NH₂、CONHOH、SO₂-C₁₋₄烷基、雜環基(任擇地被氧原子取代)以及芳基(任擇地被CONH₂取代)。於一具體例中，R6可被一或多種擇自於下列之基團取代：5-側氧-4,5-二氫-1,2,4-噁二唑-3-基、3-氨基甲醯基苯基、2H-四唑-5-基、C₁₋₄烷氧基、鹵素、OH、CONHOH。

當R6係雜環基時，其較佳地被氧原子取代。R6之取代基可為2-側氧-2,3-二氫-1H-苯并[d]咪唑-5-基或2-側氧-2,3-二氫苯并[d]噁唑-5-基。

當R6係雜芳基時，其較佳地未被取代或被氧原子取代。例如，該雜環基可含N-氧化物。於一具體例中，R6係吡啶基或吡啶基氧化物。

於另一具體例中，R8係H、鹵素、OH或C₁₋₄烷基。較

佳地，R8係H。

式IIb

於具式IIb之化合物之較佳具體例中，R1係擇自於H以及C₁₋₄烷基，R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基以及C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。更佳地，R1係擇自於H、甲基以及乙基，R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₁₀環烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。更佳地，R1係甲基。更佳地，R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及C₅₋₈環烷基，其等中之每一個可為單環的且可被取代或未被取代。又更佳地，R2係單環芳基，諸如苯基，且可被取代或未被取代。當R2被取代時，該取代基可為芳基、C₁₋₄烷氧基、芳基C₁₋₄烷氧基或芳氧基。較佳地，R2之取代基係芳基、C₁₋₃烷氧基、芳基C₁₋₃烷氧基或芳氧基，其中該芳基係單環的，更佳地，苯基。

當R2係單環C₅₋₈環烷基或芳基時，其較佳地未被取代。較佳地，R2係環己基，諸如未被取代的環己基。當R2係單環飽和雜環基時，該雜環基之環較佳地含有單一雜原子，諸如氮或氧。更佳地，該雜環基係6元的，諸如哌啶基或四氫吡喃基基團。於一具體例中，該雜原子係氮雜原子，其可被取代或未被取代。較佳地，該雜環基基團中之雜原子相對於該雜環基R2接觸至尿素氮之位置，位在4的位置。於一具體例中，該氮原子被單環芳基(較佳地苯基) C₁₋₃烷基取代。

於具式 IIb 之化合物之供選擇的較佳具體例中，R1 與 R2 與其等接觸之 N 一起形成雜環基基團，其可被取代或未被取代。較佳地，該雜環基係 5 或 6 元單環之環，更佳地，5 元單環之環。於某些具體例中，該雜環基含有一或二個，較佳地 1 個額外的雜原子(即，除 N 外)。此等額外的雜原子可為，例如，N、O 和/或 S。較佳地，該雜環基係噁唑烷基。較佳地，該噁唑烷基中之氧原子，相對於該尿素氮之位置，位在 3 的位置。較佳地，該噁唑烷基被一、二或三個甲基或乙基基團取代。更佳地，該噁唑烷基被二個甲基或乙基基團取代。又更佳地，該噁唑烷基在相同的碳原子上被二個甲基基團取代。更佳地，該噁唑烷基係 4,4-二甲基噁唑烷-3-基。

於具式 IIb 之化合物之又另一較佳具體例中，R1 與 R2 與其等接觸之 N 一起形成雜環基基團，其可被取代或未被取代。較佳地，該雜環基係 5 或 6 元單環之環，更佳地，6 元單環之環。於某些具體例中，該雜環基含有一或二個，較佳地 1 個額外的雜原子(即，除 N 外)。此等額外的雜原子可為，例如，N、O 和/或 S。於一具體例中，該雜環基係嗎啉基。於供選擇的具體例中，該雜環基係哌嗪基。於其它具體例，該雜環基不含額外的雜原子(即，其含單一個 N 原子)。於一具體例中，該雜環基係哌啶基(piperidinyl)。當該雜環基被取代時，其較佳地被芳基、芳基 C₁₋₄ 烷基、C₅₋₆ 環烷基或 C₅₋₆ 環烷基 C₁₋₄ 烷基取代，其中該芳基較佳地係單環的，更佳地為苯基，以及該環烷基較佳地係環己基。該烷基較佳地係

線性的。於一具體例中，該雜環基被芳基或芳基C₁₋₄烷基(較佳地，C₁₋₂烷基)取代，其中該芳基較佳地係單環的，更佳地為苯基。該芳基可任擇地被一或多個鹵素取代。

於具式IIb之化合物之具體例中，R5較佳地擇自於H、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R5a、鹵素、OH、OR5a、SH、SR5a、OCOR5a、SCOR5a、NH₂、NO₂、NHR5a、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH₂、SO₂R5a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR5aR5b、SO₂NR5aR5b，其中R5a與R5b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R5a與R5b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基。更佳地，R5係擇自於H、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、鹵素、OH、SH、NH₂、NO₂、CN、COOH、CONH₂、SO₃H、SO₂NH₂。又更佳地，R5係擇自於H、C₁₋₄烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₅₋₈環烷基、C₁₋₄烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、鹵素、OH、SH、NH₂、NO₂、CN、COOH、CONH₂、SO₃H、SO₂NH₂，其中該芳基、雜芳基、雜環基以及C₅₋₈環烷基基團係單環的。甚至更佳地，R5係擇自於H、C₁₋₃烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₅₋₈環烷基、鹵素、OH、NH₂、COOH以及CONH₂，其中該芳基、雜芳基、雜環基以及C₅₋₈環烷基基團係單環的。又更佳地，R5係擇自於H、C₁₋₂烷基以及鹵素。甚至更佳地，R5係擇自於H以及鹵素，諸如F、Cl以及Br。於一具體例中，R5係H。

於具式IIb之化合物中，R6較佳地擇自於H、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R6a、鹵素、OH、OR6a、SH、SR6a、OCOR6a、SCOR6a、NH₂、NO₂、NHR6a、NR6aR6b、COR6a、CSR6a、CN、COOH、COOR6a、CONH₂、SO₂R6a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR6aR6b、SO₂NR6aR6b，其中R6a與R6b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R6a與R6b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基。更佳地，R6係擇自於H、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、鹵素、OH、SH、NH₂、NO₂、CN、COOH、CONH₂、SO₃H、SO₂NH₂。又更佳地，R6係擇自於H、C₁₋₄烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₅₋₈環烷基、C₁₋₄烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、鹵素、OH、SH、NH₂、NO₂、CN、COOH、CONH₂、SO₃H、SO₂NH₂，其中該芳基、雜芳基、雜環基以及C₅₋₈環烷基基團係單環的。甚至更佳地，R6係擇自於H、C₁₋₃烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₅₋₈環烷基、鹵素、OH、NH₂、COOH以及CONH₂，其中該芳基、雜芳基、雜環基以及C₅₋₈環烷基基團係單環的。又更佳地，R6係擇自於H、C₁₋₂烷基以及鹵素。甚至更佳地，R6係擇自於H以及鹵素，諸如F、Cl以及Br。於一具體例中，R6係H。

於具式IIb之化合物中，R7較佳地擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₈環烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。更佳地，R7係擇自於芳基以及雜芳基，其等中之

每一個可被取代或未被取代。於一具體例中，該雜芳基含一個雜原子，如氧或氮原子。較佳地，該芳基或雜芳基係單環的。更佳地，該芳基或雜芳基係6元單環之環。於一具體例中，該雜芳基含有氮原子，其可被氧原子取代，諸如氧撐吡啶基。於另一具體例中，R7係未被取代的單環芳基，諸如苯基，或被一或多種擇自於下列之基團取代之單環芳基，諸如苯基：鹵素、C₁₋₂烷氧基(任擇地被一或多個鹵素取代)或OH。於特別的具體例中，R7係未被取代的單環芳基，諸如苯基。

當R7被取代時，該取代基較佳地係一或多種擇自於下列之基團：鹵素、C₁₋₄烷氧基、芳基、雜芳基、雜環基、OH、CONH₂、NH₂、雜環基C₁₋₄烷氧基、芳基C₁₋₄烷氧基、雜芳基C₁₋₄烷氧基、NO₂、SO₂NH₂、SO₃、C(NO₂)NH₂以及嗎啉磺醯基。較佳地，該芳基、雜芳基以及雜環基係單環的。於一具體例中，該芳基、雜芳基以及雜環基係6元單環之環。於R7係單環芳基之特別的具體例中，其可任擇地被芳基或雜芳基取代，其等中之每一個為單環的。

式IIc

於具式IIc之化合物之較佳的具體例中，R1係擇自於H以及C₁₋₄烷基，R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基以及C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。更佳地，R1係擇自於H、甲基以及乙基，R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₁₀環烷基，其等中之每一個

可被取代或未被取代。更佳地，R1係甲基。更佳地，R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及C₅₋₈環烷基，其等中之每一個為單環的，且可被取代或未被取代。又更佳地，R2係擇自於芳基，諸如苯基、飽和雜環基以及C₅₋₈環烷基，其等中之每一個可為單環的，且可被取代或未被取代。當R2係單環C₅₋₈環烷基或芳基時，其較佳地未被取代。較佳地，R2係環己基，諸如未被取代的環己基。當R2係單環飽和雜環基時，該雜環基之環較佳地含有單一雜原子，諸如氮或氧。更佳地，該雜環基係6元的，諸如哌啶基或四氫吡喃基團。於一具體例中，該雜原子係氮雜原子，其可被取代或未被取代。較佳地，於該雜環基基團中之雜原子，相對於該雜環基基團R2接觸至尿素氮之位置，位在4的位置。於一具體例中，該氮原子被單環芳基(較佳地苯基) C₁₋₃烷基取代。

於具IIc之化合物之供選擇的較佳具體例中，R1與R2與其等接觸之N一起形成雜環基基團，其可被取代或未被取代。較佳地，該雜環基係5或6元單環之環，更佳地，5元單環之環。於某些具體例中，該雜環基含有一或二個，較佳地1個額外的雜原子(即，除N外)。此等額外的雜原子可為，例如，N、O和/或S。較佳地，該雜環基係噁唑烷基。較佳地，該噁唑烷基中之氧原子，相對於該尿素氮之位置，位在3的位置。較佳地，該噁唑烷基被一、二或三個甲基或乙基基團取代。更佳地，該噁唑烷基被二個甲基或乙基基團取代。又更佳地，該噁唑烷基在相同的碳原子上被二個甲

基取代。更佳地，該噁唑烷基係4,4-二甲基噁唑烷-3-基。

於具式IIb之化合物之又另一較佳具體例中，R1與R2與其等接觸之N一起形成雜環基基團，其可被取代或未被取代。較佳地，該雜環基係5或6元單環之環，更佳地，6元單環之環。於某些具體例中，該雜環基含有一或二個，較佳地1個額外的雜原子(即，除N外)。此等額外的雜原子可為，例如，N、O和/或S。於一具體例中，該雜環基係嗎啉基。於供選擇的具體例中，該雜環基係哌嗪基。於其它具體例中，該雜環基不含額外的雜原子(即，其含單一個N原子)。於一具體例中，該雜環基係哌啶基(piperidinyl)。當該雜環基被取代時，其較佳地被芳基、芳基C₁₋₄烷基、C₅₋₆環烷基或C₅₋₆環烷基C₁₋₄烷基取代，其中該芳基較佳地係單環，更佳地為苯基，以及該環烷基較佳地係環己基。該烷基較佳地係線性的。於一具體例中，該雜環基被芳基或芳基C₁₋₄烷基(較佳地，C₁₋₂烷基)取代，其中該芳基較佳地係單環的，更佳地，苯基。該芳基可任擇地被一或多個鹵素取代。

於具式IIb之化合物之具體例中，R5較佳地擇自於H、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R5a、鹵素、OH、OR5a、SH、SR5a、OCOR5a、SCOR5a、NH₂、NO₂、NHR5a、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH₂、SO₂R5a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR5aR5b、SO₂NR5aR5b，其中R5a與R5b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R5a與R5b可與其等連接之雜原子一

起形成雜環基。更佳地，R5係擇自於H、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、鹵素、OH、SH、NH₂、NO₂、CN、COOH、CONH₂、SO₃H、SO₂NH₂。又更佳地，R5係擇自於H、C₁₋₄烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₅₋₈環烷基、C₁₋₄烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、鹵素、OH、SH、NH₂、NO₂、CN、COOH、CONH₂、SO₃H、SO₂NH₂，其中該芳基、雜芳基、雜環基以及C₅₋₈環烷基基團係單環的。甚至更佳地，R5係擇自於H、C₁₋₃烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₅₋₈環烷基、鹵素、OH、NH₂、COOH以及CONH₂，其中該芳基、雜芳基、雜環基以及C₅₋₈環烷基基團係單環的。又更佳地，R5係擇自於H、C₁₋₂烷基以及鹵素。甚至更佳地，R5係擇自於H以及鹵素，諸如F、Cl以及Br。於一具體例中，R5係H。

於具式IIc之化合物中，R6較佳地擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₈環烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。更佳地，R6係擇自於芳基以及雜芳基，其等中之每一個可被取代或未被取代。於一具體例中，該雜芳基含有一個雜原子，如氧或氮原子。較佳地，該芳基或雜芳基係單環的。更佳地，該芳基或雜芳基係6元單環之環。於一具體例中，該雜芳基含氮原子，其可被氧原子取代，諸如氧撐吡啶基。於另一具體例中，R6係未被取代的單環芳基，諸如苯基，或被一或多種擇自於下列之基團取代之單環芳基，諸如芳基：鹵素、C₁₋₂烷氧基(任擇地被一或多個鹵素取代)或OH。於較佳具體例中，R6係未被取代的芳基，較

佳地，單環芳基，諸如苯基。

當R6被取代時，該取代基較佳地係一或多種擇自於下列之基團：鹵素、C₁₋₄烷氧基、芳基、雜芳基、雜環基、OH、CONH₂、NH₂、雜環基C₁₋₄烷氧基、芳基C₁₋₄烷氧基、雜芳基C₁₋₄烷氧基、NO₂、SO₂NH₂、SO₃、C(NO₂)NH₂以及嗎啉磺醯基。較佳地，該芳基、雜芳基以及雜環基係單環的。於一具體例中，該芳基、雜芳基以及雜環基係6元單環之環。於其中R6係單環芳基之特別具體例中，其可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、OH、C₁₋₃烷氧基、芳基(如，單環芳基，諸如苯基)、雜芳基(即，含一或二個氮原子或一個氧原子之單環雜芳基)、雜環基(如，哌嗪基、哌啶基(piperidinyl)或嗎啉基) C₁₋₃烷氧基、芳基(如，單環芳基，諸如苯基) C₁₋₃烷氧基、CONH₂、NH₂、NO₂、OCHF₂、SO₂NH₂、嗎啉磺醯基以及C(NO₂)NH₂。

於一具體例中，當R6係單環芳基，諸如苯基時，該R6之取代基係芳基，較佳地單環芳基，諸如苯基，其可被取代或未被取代。當其被取代時，較佳地其被CONH₂取代。

當R6之取代基為C₁₋₄烷氧基、芳基、雜芳基、雜環基、雜環基C₁₋₄烷氧基、芳基C₁₋₄烷氧基、雜芳基C₁₋₄烷氧基或SO₃時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、OH、C₁₋₃烷氧基(其可被一或多個鹵素取代)、CONH₂、CN、NCH₃CH₃、NHCOCH₃、甲羥基丁基以及甲羥基丁炔。

式IIId

於具 IIId 之化合物之較佳的具體例中，R1 係擇自於 H 以及 C₁₋₄ 烷基，R2 係擇自於芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀ 環烷基、芳基 C₁₋₆ 烷基、雜芳基 C₁₋₆ 烷基、雜環基 C₁₋₆ 烷基以及 C₃₋₁₀ 環烷基 C₁₋₆ 烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。更佳地，R1 係擇自於 H、甲基以及乙基，R2 係擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及 C₃₋₁₀ 環烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。更佳地，R1 係甲基。更佳地，R2 係擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及 C₅₋₈ 環烷基，其等中之每一個為單環的，且可被取代或未被取代。又更較佳地，R2 係擇自於芳基，諸如苯基、飽和雜環基以及 C₅₋₈ 環烷基，其等中之每一個可為單環的，且可被取代或未被取代。甚至更佳地，R2 係芳基，諸如苯基，其係單環的且可被取代或未被取代。當 R2 被取代時，該取代基較佳地係一或多個鹵素。

於一具體例中，R2 係環己基，諸如未被取代的環己基。當 R2 係單環飽和雜環基時，該雜環基之環較佳地含有單一雜原子，諸如氮或氧。更佳地，該雜環基係 6 元的，諸如吡啶基或四氫吡喃基基團。於一具體例中，該雜原子係氮雜原子，其可被取代的或未被取代。較佳地，該雜環基基團中之雜原子相對於該雜環基基團 R2 接觸至尿素氮之位置，位在 4 的位置。於一具體例中，該氮原子被單環芳基(較佳地苯基) C₁₋₃ 烷基取代。

於具 IIId 之化合物之供選擇的較佳具體列中，R1 與 R2 與其等接觸之 N 一起形成雜環基基團，其可被取代或未被取

代。較佳地，該雜環基係5或6元單環之環，更佳地，5元單環之環。於某些具體例中，該雜環基含有一或二個，較佳地1個額外的雜原子(即，除了N之外)。此等額外的雜原子可為，例如，N、O和/或S。較佳地，該雜環基係噁唑烷基。較佳地，該噁唑烷基中之氧原子，相對於該尿素氮，位在3的位置。較佳地，該噁唑烷基被一、二或三個甲基或乙基基團取代。更佳地，該噁唑烷基被二個甲基或乙基取代。又更佳地，該噁唑烷基在相同的碳原子上被二個甲基基團。更佳地，該噁唑烷基係4,4-二甲基噁唑烷-3-基。

於具式IIId之化合物之又另一較佳具體列中，R1與R2與其等接觸之N一起形成雜環基基團，其可被取代或未被取代。較佳地，該雜環基係5或6元單環之環，更佳地，6元單環之環。於某些具體例中，該雜環基含有一或多個，較佳地1個，額外的雜原子(即，除了N之外)。此等額外的雜原子可為，例如，N、O和/或S。於一具體例中，該雜環基係嗎啉基。於供選擇的具體例中，該雜環基係哌嗪基。於其它具體例中，該雜環基不含額外的雜原子(即，其含單一個N原子)。於一具體例中，該雜環基係哌啶基(piperidinyl)。當該雜環基被取代時，其較佳地被芳基、芳基C₁₋₄烷基、C₅₋₆環烷基或C₅₋₆環烷基C₁₋₄烷基取代，其中該芳基較佳地係單環的，更佳地苯基，以及該環烷基較佳地係環己基。該烷基較佳地係線性的。於一具體例中，該雜環基被芳基或芳基C₁₋₄烷基(較佳地C₁₋₂烷基)取代，其中芳基較佳地係單環的，更佳地為苯基。該芳基可任擇地被一或多個鹵素取代。

於具IId之化合物中，R5較佳地擇自於H、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、R5a、鹵素、OH、OR5a、SH、SR5a、OCOR5a、SCOR5a、NH₂、NO₂、NHR5a、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH₂、SO₂R5a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR5aR5b、SO₂NR5aR5b，其中R5a與R5b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，且R5a與R5b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基。更佳地，R5係擇自於H、C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、鹵素、OH、SH、NH₂、NO₂、CN、COOH、CONH₂、SO₃H、SO₂NH₂。又更佳地，R5係擇自於H、C₁₋₄烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₅₋₈環烷基、C₁₋₄烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、鹵素、OH、SH、NH₂、NO₂、CN、COOH、CONH₂、SO₃H、SO₂NH₂，其中該芳基、雜芳基、雜環基以及C₅₋₈環烷基基團係單環的。甚至更佳地，R5係擇自於H、C₁₋₃烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₅₋₈環烷基、鹵素、OH、NH₂、COOH以及CONH₂，其中該芳基、雜芳基、雜環基以及C₅₋₈環烷基基團係單環的。又更佳地，R5係擇自於H、C₁₋₂烷基以及鹵素。甚至更佳地，R5係擇自於H以及鹵素，諸如F、Cl以及Br。於一具體例中，R5係H。

於具IId之化合物中，R7較佳地擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₈環烷基，其等中之每一個可被取代或未被取代。更佳地，R7係擇自於芳基以及雜芳基，其等中之每一

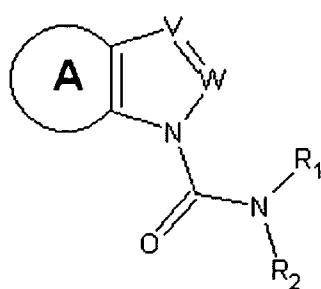
個可被取代或未被取代。於一具體例中，該雜芳基含有一雜原子，如氧或氮原子。較佳地，該芳基或雜芳基係單環的。更佳地，該芳基或雜芳基係6元單環之環。於一具體例中，該雜芳基含有氮原子，其可被氧原子取代，諸如氧撐吡啶基。於另一具體例中，R7係未被取代的單環芳基，諸如苯基，或為被一或多種擇自於下列之基團取代之單環芳基，諸如苯基：鹵素、C₁₋₂烷氧基(任擇地被一或多個鹵素取代)或OH。

當R7被取代時，該取代基較佳地係一或多種擇自於下列之基團：鹵素、C₁₋₄烷氧基、芳基、雜芳基、雜環基、OH、CONH₂、NH₂、雜環基C₁₋₄烷氧基、芳基C₁₋₄烷氧基、雜芳基C₁₋₄烷氧基、NO₂、SO₂NH₂、SO₃、C(NOH)NH₂以及嗎啉磺醯基。較佳地，該芳基、雜芳基以及雜環基係單環的。於一具體例中，該芳基、雜芳基以及雜環基係6元單環之環。於R7為單環芳基之特別具體例中，其可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、OH、C₁₋₃烷氧基、芳基(如，單環芳基，諸如苯基)、雜芳基(如，含一或二個氮原子或一個氧原子之單環雜芳基)、雜環基(如，哌嗪基、哌啶基(piperidinyl)或嗎啉基) C₁₋₃烷氧基、芳基(如，單環芳基，諸如苯基) C₁₋₃烷氧基、CONH₂、NH₂、NO₂、OCHF₂、SO₂NH₂、嗎啉磺醯基以及C(NOH)NH₂。於一具體例中，當R7係諸如苯基之單環芳基時，R7之取代基係芳基(如，單環芳基，諸如苯基) C₁₋₃烷氧基。

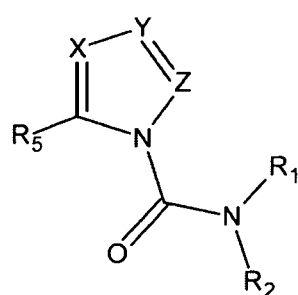
當R7之取代基係C₁₋₄烷氧基、芳基、雜芳基、雜環基 雜

環基 C_{1-4} 烷氧基、芳基 C_{1-4} 烷氧基、雜芳基 C_{1-4} 烷氧基或 SO_3 時，此等部分中之每一個可任擇地被一或多種擇自於下列之基團取代：鹵素、OH、 C_{1-3} 烷氧基(其可被一或多個鹵素取代)、 $CONH_2$ 、CN、 NCH_3CH_3 、 $NHCOCH_3$ 、甲羥基丁基以及甲羥基丁炔基。

於本發明之供選擇的具體例中，提供有一種具式I或式II之化合物，或其藥學上可接受之鹽類或酯類；



式I



式II

其中 R_1 、 R_2 、 R_5 、環A、V、W、X、Y以及Z之定義如上；

有條件的是，當 R_1 與 R_2 與其等接觸之N一起形成哌啶基、哌嗪基、取代的哌啶基或取代的哌嗪基時，具式I之化合物中之環A不會形成吡啶、嘧啶、取代的吡啶或取代的嘧啶，

有條件的是，環A不是未被取代的苯并、羥苯并、苯氧苯并、氟氟苯并、氯苯并、溴苯并、硝苯并、胺苯并、氯苯并、甲苯并、三氟甲基苯并、三氟甲基氯苯并、苯基酮苯并、苯羥基甲苯并、環己硫代苯并、甲氧羰基苯并或甲氧苯并，

有條件的是，當 R_1 或 R_2 係甲基時，其它的 R_1 或 R_2 不是4-氯丁基、4-疊氮丁基或4-異氰硫基丁基，以及

有條件的是，該化合物不是(4-苯基-1H-咪唑-1-基)(4-(喹啉-2-基甲基)哌嗪-1-基)甲酮。

根據本發明之第二態樣，提供有一種藥學組成物，其包含如本發明第一態樣之化合物以及一或多種藥學上可接受之賦形劑。

本發明之藥學組成物包含本發明第一態樣中之任一種化合物以及任一種藥學上可接受之載劑、佐劑或載體。可於本發明之藥學組成物中使用之藥學上可接受之載劑、佐劑以及載體，係該等於製藥領域中慣常使用之載劑、佐劑以及載體，包括，但不限於，糖、糖醇、澱粉、離子交換劑、氧化鋁、硬脂酸鋁、卵磷脂、血清蛋白，諸如人類血清白蛋白、緩衝物質，諸如磷酸鹽、甘油、山梨酸、山梨酸鉀、飽和植物脂肪酸之部分甘油酸酯混合物、水、鹽類或電解質，諸如硫酸魚精蛋白、磷酸氫二鈉、磷酸氫二鉀、氯化鈉、鋅鹽、矽酸膠、三矽酸鎂、聚乙烯吡咯烷酮、纖維素為主的物質、聚乙二醇、羧甲基纖維素鈉、聚丙烯酸酯、蠟、聚乙烯-聚丙烯-嵌段聚合物、聚乙二醇以及羊毛脂。

本發明之藥學組成物可以口服、非口服、吸入噴霧、直腸、鼻、頰、陰道或經由植入儲存器之方式投與。口服投與係較佳的。本發明之藥學組成物可含任何習用之無毒性藥學上可接受之載劑、佐劑或載體。在此使用之術語非口服包括皮下、皮內、靜脈內、肌肉內、關節內、滑液內、胸骨內、腦脊髓膜內、病灶內以及顱內注射或輸注技術。

該藥學組成物可呈無菌注射製劑之形式，例如，無菌

注射液或油質懸浮液。此懸浮液可按照此技藝中已知之技術，使用適合的分散或潤濕劑(諸如，Tween 80)以及懸浮劑配製成。無菌注射製劑亦可為配製於無毒性腸胃外可接受之稀釋液或溶劑(例如，配製於1,3-丁二醇中之溶液)中之無菌注射溶液或懸浮液。在可接受的載劑與溶劑中，可使用的是甘露醇、水、林格氏溶液(Ringer's solution)以及等張氯化鈉溶液。此外，無菌、固定油常用作為溶劑或懸浮介質。為此目的，可使用任何無刺激性的固定油，包括合成單-或雙酸甘油酯。脂肪酸，諸如油酸以及其甘油酯衍生物，可用於製備注射劑，如天然藥學上可接受之油類，諸如橄欖或蓖麻油，特別是呈其等之聚氧乙基化型式。此等油溶液或懸浮液亦可包含諸如在Ph. Helv中所述之長鏈醇稀釋液或分散劑，或相似之醇。

本發明之藥學組成物可呈任何口服可接受之劑型經口投與，包括，但不限於，膠囊、錠劑、粉末、顆粒以及水性懸浮液以及溶液。此等劑型係按照製藥領域中眾所周知之技術製備。在供口服使用之錠劑方面，一般使用之載劑包括乳糖以及玉米澱粉。典型地亦可加入潤滑劑，諸如硬脂酸鎂。在呈膠囊形式之口服投與方面，可使用的稀釋劑包括乳糖以及乾的玉米澱粉。當水性懸浮液經口服投與時，活性成分係與乳化劑以及懸浮劑結合。需要時，可加入某些甘味劑和/或香料和/或色素。

本發明之藥學組成物亦可呈供直腸投與之栓劑形式投與。此等組成物可藉由混合本發明之化合物與在室溫下呈

固態，但在直腸環境下呈液態，因此在直腸中會融化而釋出活性成份之適合的、無刺激性賦形劑製得。此等材料包括，但不限於，可可油、蜜蠟以及聚乙二醇。

本發明之藥學組成物可經由鼻氣化噴霧或吸入方式投與。此組成物係按照製藥領域中眾所周知之技術製備，且可製備成配製於食鹽水中之溶液，使用此技藝中已知之苯甲醇或其它適合的防腐劑、吸收促進劑以提高生物可利用性、碳氟化合物和/或其它增溶或分散劑。

本發明之化合物投與之劑量為每劑約1至約20,000 $\mu\text{g/kg}$ ，取決於欲進行治療或預防之病況以及欲投與該化合物之對象的特徵。在許多情況下，劑量可為每劑約1至約1500 $\mu\text{g/kg}$ 。對於指定化合物之劑量規則，可由熟悉此技藝人士在了解此揭露內容後即能容易地決定。

於一特別的具體例中，本發明之藥學組成物額外包含一或多種額外的藥學成份。本發明之化合物可與一或多種額外的活性藥學成分一起投與。此可呈包含本發明之化合物以及一或多種額外的藥學成份之單一組成物形式。選擇性地，此可呈二或多個分開的組成物，此時本發明之化合物裝成一組成物，而該一或多種額外的活性藥學成份裝成一或多個分開的組成物。

在第三態樣方面，本發明提供一種如本發明第一態樣之化合物或一種如第二態樣之組成物，供用於治療。

在第四態樣方面，本發明提供一種如本發明第一態樣之化合物或一種如第二態樣之組成物，供用於治療或預防

進展或病狀關聯到FAAH酵素之基質之病況，其中施用第一態樣之唯一但書是i)當R1與R2與其等接觸之N一起形成哌啶基、哌嗪基、取代的哌啶基或取代的哌嗪基時，具式I之化合物中之環A不會形成吡啶、嘧啶、取代的吡啶或取代的嘧啶、ii)當R1或R2為甲基時，其它的R1或R2不為4-氯丁基、4-疊氮丁基或4-異氰硫基丁基，以及iii)該化合物不為(4-苯基-1H-咪唑-1-基)(4-(喹啉-2-基甲基)哌嗪-1-基)甲酮。

本發明亦提供本發明第一態樣之化合物或第二態樣之組成物，在製造用於治療或預防進展或病狀關聯到FAAH酵素之基質之病況之藥劑上之用途，其中施用第一態樣之唯一但書是i)當R1與R2與其等接觸之N一起形成哌啶基、哌嗪基、取代的哌啶基或取代的哌嗪基時，具式I之化合物中之環A不會形成吡啶、嘧啶、取代的吡啶或取代的嘧啶、ii)當R1或R2為甲基時，其它的R1或R2不為4-氯丁基、4-疊氮丁基或4-異氰硫基丁基，以及iii)該化合物不為(4-苯基-1H-咪唑-1-基)(4-(喹啉-2-基甲基)哌嗪-1-基)甲酮。

一些進展或病狀關聯到FAAH酵素之基質之病況係此技藝之人士已知的。此等中之某些於下文中討論。

在第五態樣方面，本發明亦提供治療或預防進展或病狀關聯到FAAH酵素之基質之病況之方法，該方法包含對需要此治療或預防之對象投與一治療上有效量之如本發明第一態樣之化合物或如第二態樣之組成物，其中施用第一態樣之唯一但書是i)當R1與R2與其等接觸之N一起形成哌啶基、哌嗪基、取代的哌啶基或取代的哌嗪基時，具式I之化

合物中之環A不會形成吡啶、嘧啶、取代的吡啶或取代的嘧啶、ii)當R1或R2為甲基時，其它的R1或R2不為4-氯丁基、4-疊氮丁基或4-異氰硫基丁基，以及iii)該化合物不為(4-苯基-1H-咪唑-1-基)(4-(喹啉-2-基甲基)哌嗪-1-基)甲酮。

如第四態樣之化合物或第五態樣之方法，其中該病況係一種與內生性大麻系統有關聯之病症。

於某些具體例中，欲治療之病況可擇自於：

(i)疼痛，特別是急性或慢性神經源性疼痛，諸如偏頭痛以及神經病變性疼痛(例如糖尿病神經病變性疼痛、帶狀泡疹後神經痛、三叉神經痛)；與發炎性疾病有關連之急性或慢性疼痛，諸如關節炎、類風濕性關節炎、骨關節炎、脊椎炎、痛風、血管炎、克隆氏症以及腸躁症；急性或慢性末梢疼痛；

(ii)頭昏、嘔吐以及噁心，特別是因化療所引起的；

(iii)飲食失調，特別是厭食症以及種種的惡病質；

(iv)神經學以及精神病學病變，諸如震顫、運動困難、肌張力不全、痙攣、強迫症、妥瑞症、任何本質與起因之憂鬱與焦慮之全部形式、情緒性疾病以及精神病；

(v)急性以及慢性神經退化性疾病，諸如帕金森氏症、阿滋海默症、老人癡呆症、亨丁頓氏舞蹈病、與腦缺氧有關以及與顱和髓創傷有關之傷害；

(vi)癲癇；

(vii)睡眠異常，包括睡眠呼吸暫停；

(viii)心臟血管疾病，諸如心臟衰竭、高血壓、心律不

整、動脈硬化，心臟病發作、心肌缺血以及腎缺血；

(ix)癌症，例如，良性皮膚腫瘤、腦腫瘤以及乳頭狀瘤、前列腺腫瘤以及大腦腫瘤(膠質母細胞瘤、髓上皮瘤、髓母細胞瘤、神經母細胞瘤、胚胎起源之腫瘤、星狀細胞瘤、星形母細胞瘤、室管膜瘤、寡樹突神經膠質瘤、叢腫瘤、神經上皮瘤、生長板腫瘤、室管膜母細胞瘤、惡性腦膜瘤、肉瘤病、惡性黑色素瘤以及神經鞘膜瘤)；

(x)免疫系統之病症，特別是自體免疫疾病，諸如牛皮癬、紅斑性狼瘡、結締組織或之疾病或膠原疾病、修格連氏症候群(Sjögren's syndrome)、僵直性脊椎炎、未分化型脊椎炎、貝西氏病(Behcet's disease)、自體免疫溶血性貧血、多發性硬化症、肌萎縮性脊髓側索硬化症、澱粉樣變性、移植排斥、影響漿細胞株之疾病、過敏性疾病；立即性以及延遲性過敏反應、過敏性鼻炎或結膜炎、接觸性皮膚炎；

(xi)寄生蟲、病毒或細菌感染疾病，諸如AIDS以及腦膜炎；

(xii)發炎性疾病，特別是關節疾病，諸如關節炎、類風濕性關節炎、骨關節炎、脊椎炎、痛風、血管炎、克隆氏症(Crohn's disease)、腸躁症；

(xiii)骨質疏鬆；

(xiv)眼睛病況，諸如高眼壓症以及青光眼；

(xv)肺病，包括呼吸道之疾病、支氣管痙攣、咳嗽、氣喘、慢性支氣管炎、呼吸道之慢性阻塞以及肺氣腫；

(xvi)胃腸疾病，諸如腸躁症、發炎性小腸疾病、潰瘍、腹瀉、尿失禁以及膀胱發炎。

在第六態樣方面，本發明提供一種如本發明第一態樣之化合物，在製備用於治療或預防進展或病狀關聯到FAAH酵素之基質之病況之藥劑之用途，其中施用第一態樣之唯一但書是，當R1與R2與其等接觸之N一起形成哌啶基、哌嗪基、取代的哌啶基或取代的哌嗪基時，具I之化合物中之環A不會形成吡啶、嘧啶、取代的吡啶或取代的嘧啶。

關連到第六態樣之示範性病況如上所提及。

在第四、第五或第六態樣之某些具體例中，亦適用第一態樣中之一或二個其它但書。

【實施方式】

現在將經由範例更詳細的說明本發明：

1.合成方法

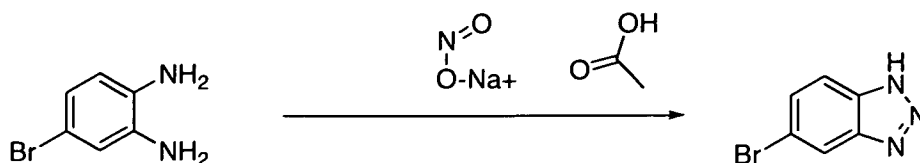
合成本發明化合物之方法，以以下概略摘要以及接著的製備範例作說明。全部的化合物以及中間體以核磁共振(NMR)描述特徵。用於製備此等化合物之起始材料以及試劑可從供應商取得，或利用對熟悉此技藝之人士而言顯而易見之方法製得。此等概略摘要僅僅係說明可合成本發明之化合物之方法，熟悉此技藝之人士在參考本揭示內容後，可針對此等摘要作各種修改以及建議。

下列摘要中之室溫意指範圍從20°C至25°C之溫度。

苯并三唑類

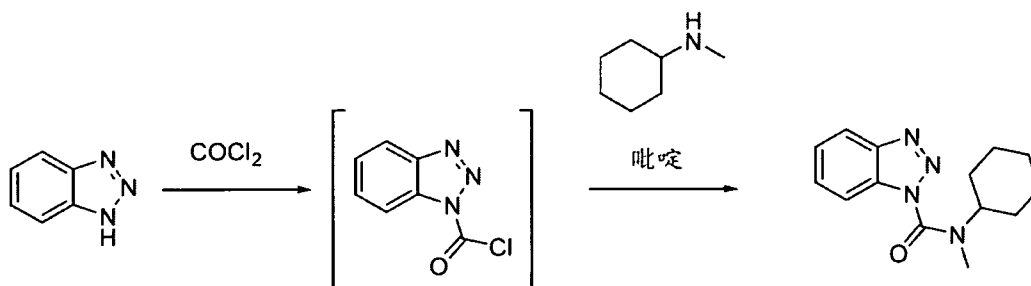
5-溴基-1*H*-苯并[d][1,2,3]三唑(1*H*-苯并[d][1,2,3]三唑衍生

物之形成)。



於0-5°C下配製於醋酸(20 ml, 349 mmol)與水(100 ml)之混合物中之4-溴苯-1,2-二胺(10 g, 53.5 mmol)溶液中，逐滴加入配製於水(10 ml)中之硝酸鈉(4.06 g, 58.8 mmol)溶液。在冰浴下攪拌1個小時，加入額外的醋酸(20 ml, 349 mmol)，加熱至80-85°C，攪拌1個小時，過濾該熱溶液，以便移除不溶性黑性材料，冷卻至0-5°C，熟成30分鐘，收集沈澱物，用水清洗，在真空中45°C下乾燥。產率9.48 g (90%)。

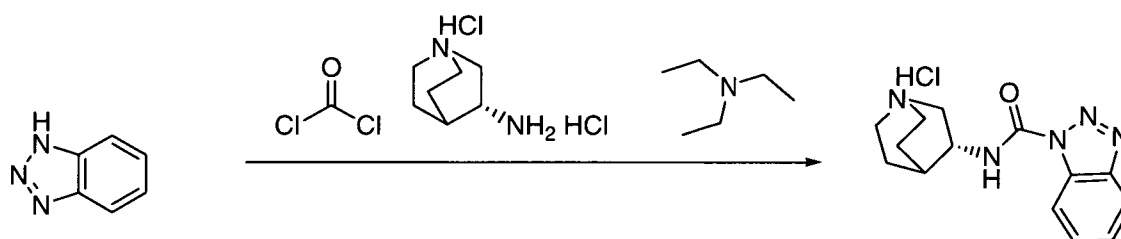
N-環己基-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氮甲醯(二取代的三唑-1-氮甲醯之形成)



將配製於四氫呋喃(25 ml)中之1H-苯并[d][1,2,3]三唑(0.5 g, 4.20 mmol)溶液，逐滴加入0-5°C下配製於甲苯中正在攪拌的20%光氣(5.30 ml, 10.1 mmol)溶液中。使該反應混合物在20-25°C下攪拌2個小時(以TLC判斷反應完成)。在溶液中打入氫氣15分鐘。之後於真空中使溶劑揮發掉，產生如透明油狀之1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-碳醯氯(0.763 g, 4.20 mmol)。在沒有進一步純化之情況下使用此產物。於0-5

℃下配製於四氫呋喃(25 ml)中正在攪拌之該油狀物溶液中，逐滴加入吡啶(0.357 ml, 4.41 mmol)。之後在0-5℃下逐滴加入N-甲基環己胺(0.499 g, 4.41 mmol)。令該反應在20-25℃下攪拌一整夜。加入水以及EtOAc，將有機層分開來，用1M HCl、水以及濃鹽水清洗。乾燥有機層(MgSO₄)，然後於真空中揮發，產生清澈油狀物。使該油狀物從2-丙醇/DCM中再結晶出來，收集固狀物，於真空中40-45℃下乾燥。產率230 mg (21%)。

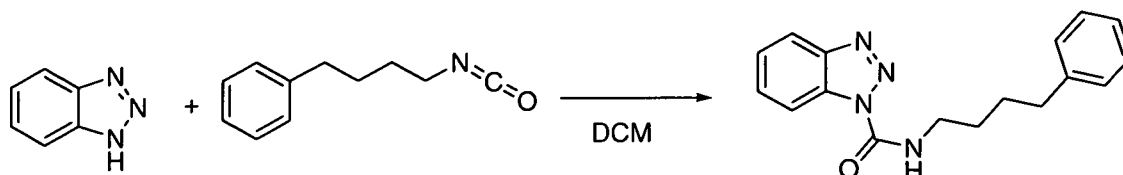
(R)-N-(奎寧環-3-基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲醯二氫化物(單取代的三唑-1-基甲醯之形成)



0-5℃下於配製於乾DCM (5 ml)中之1H-苯并[d][1,2,3]三唑(0.238 g, 2 mmol)溶液中，加入配製於甲苯中之20%光氣(1.052 ml, 2.000 mmol)溶液。在20-25℃下攪拌該混合物30分鐘，冷卻至0-5℃，攪拌同時加入三乙胺(0.279 ml, 2.000 mmol)。0-5℃下用乾DCM (5 ml)稀釋懸浮液，加入固體(R)-奎寧環-3-胺二氫氯化物(0.398 g, 2.000 mmol)以及三乙胺(0.836 ml, 6.00 mmol)。在30分鐘期間將該混合物加熱至20-25℃，用2-丙醇稀釋，使揮發至乾燥。使殘留物分佈於水(15 ml)與DCM (15 ml)之間，乾燥有機相(MgSO₄)，濃縮，於管柱上分離(DCM-MeOH 9:1)，收集區段，產生油狀物。

將該油狀物溶於具有最少量DCM之乙醚中，用配製於乙醚中之2M HCl酸化該溶液至pH 1-2，收集沈澱物，用乙醚清洗，於真空中45°C下乾燥。產率0.12 g (19.5%)。

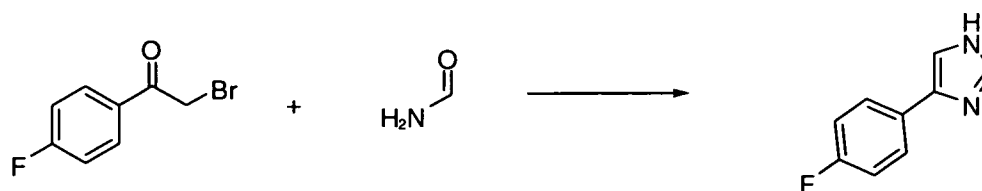
N-(4-苯丁基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氨甲醯(單取代的三唑-1-氨甲醯之形成)



0-5°C下於配製於DCM (18 ml)中，正在攪拌之1H-苯并[d][1,2,3]三唑(300 mg, 2.52 mmol)溶液中，逐滴加入(4-異氰醯丁基)苯(463 mg, 2.64 mmol)。令該清澈反應混合物在20-25°C下攪拌一整夜。於真空中移除溶劑，產生清澈油狀物。靜置該油狀物使產生無色固體。使該產物從2-丙醇中再結晶出來，收集固狀物，於真空中45°C下乾燥。產率477 mg (64%)。

咪唑類：

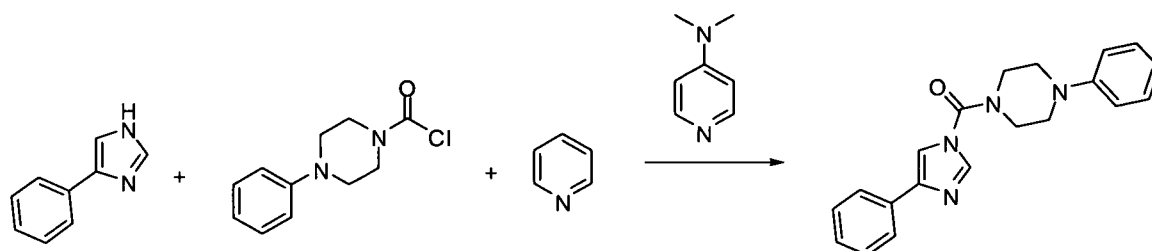
4-(4-氟苯基)-1H-咪唑-(咪唑之合成)



於50 ml梨形瓶中放置2-溴基-1-(4-氟苯基)乙酮(5.93 g, 27.31 mmol)、甲醯胺(13.45 ml, 339 mmol)以及水(1 ml)。在140°C下加熱該反應4個小時。之後冷卻至室溫，然後倒入150 ml之水中。過濾出沈澱物，用水清洗。藉由加入10%

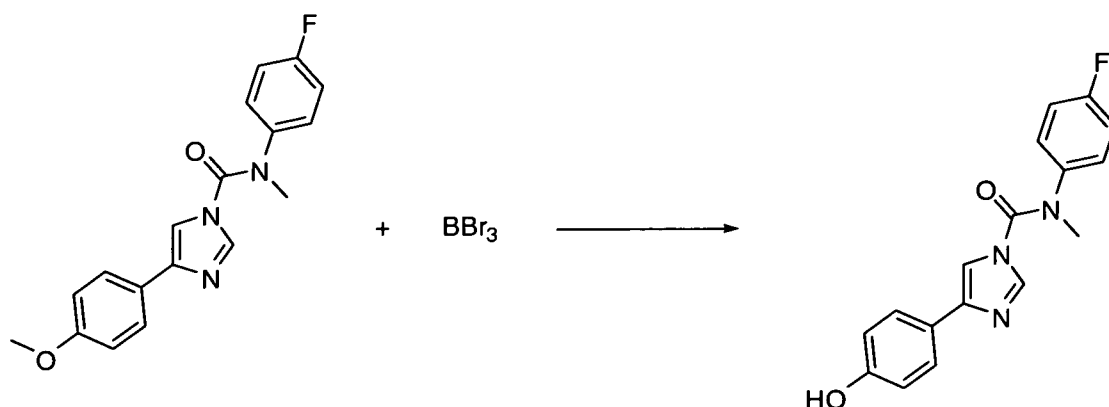
NaOH溶液，將濾液之pH調整至12。過濾出所產生之沈澱物，用水清洗，在真空下乾燥。(產率：2.02 g，45%)。

(4-苯基-1*H*-咪唑-1-基)(4-苯哌嗪-1-基)甲酮(鹽化)



於配製於四氫呋喃(20 ml)中，正在攪拌之4-苯基-1*H*-咪唑(577 mg，4 mmol)溶液中，加入吡啶(0.489 ml，6.00 mmol)以及DMAP (48.9 mg，0.400 mmol)。用4-苯哌嗪-1-碳醯氯(944 mg，4.20 mmol)處理該淡黃色溶液，加熱至90℃，歷時20個小時。之後，利用真空移除THF，將殘留物分配於DCM：IPA (70：30)混合物以及水之間。透過MgSO₄乾燥有機層，之後過濾。揮發後，使粗製產物從熱IPA中再結晶出來，過濾，在真空下乾燥。(產率：777 mg，58%)。

N-(4-氟苯基)-4-(4-羥苯基)-*N*-甲基-1*H*-咪唑-1-基甲醯(去保護基)

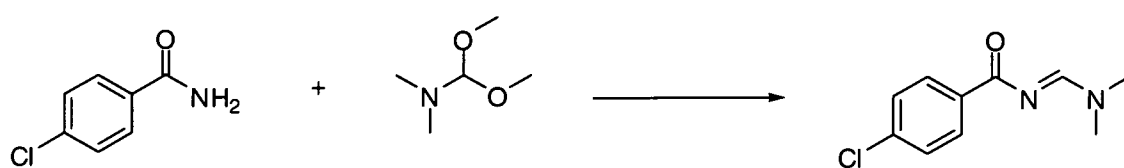


於配製於二氯甲烷(8 ml)中之甲醇乾冰冷卻的N-(4-氟

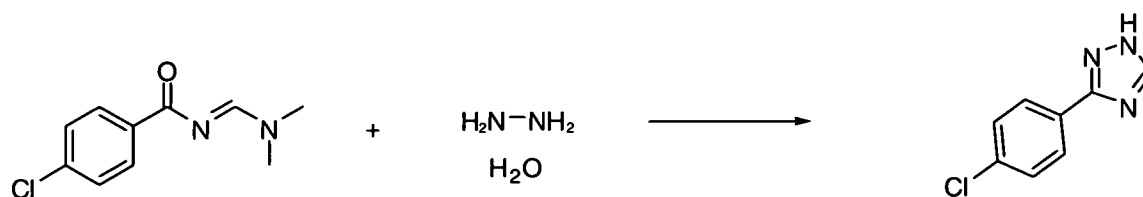
苯基)-4-(4-甲氧苯基)-*N*-甲基-1*H*-咪唑-1-基甲鹽(0.283 g, 0.870 mmol)溶液中，加入三溴化硼(0.164 ml, 1.740 mmol)。使該深色反應混合物回到室溫以及攪拌2個小時。TLC顯示反應已經完成，之後倒入冰與水之混合物中，攪拌30分鐘。沒有沈澱產生。用DCM:IPA (70:30)萃取該混合物，透過MgSO₄乾燥有機相，過濾。利用真空移除DCM，使該產物從IPA中沈澱出來，過濾，在真空下乾燥。(產率: 210 mg, 78%)。

1,2,4-三唑類：

3-(4-氯苯基)-1*H*-1,2,4-三唑(環之合成)



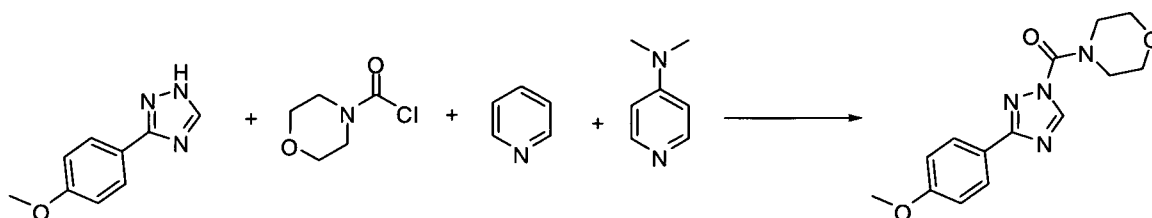
將4-氯苯甲醯胺(7.371 g, 47.4 mmol)懸浮於1,1-二甲氧基-*N,N*-二甲基甲胺(15.73 ml, 118 mmol)中。在80℃下加熱該反應混合物1個小時。之後冷卻至室溫，然後利用真空移除過量的1,1-二甲氧基-*N,N*-二甲基甲胺。用石油醚研製所產生之固狀物，過濾，在真空下乾燥。(產率: 9.44 g, 95%)。



於配製於醋酸(13.5 ml)中，正在攪拌之(E)-4-氯-*N*-((二甲基氨基)甲撐)苯甲醯胺(9.4 g, 44.6 mmol)溶液中，加入水合肼(1.524 ml, 49.1 mmol)。該反應混合物馬上固化，之後

將其加熱至120℃，歷時2個小時。隨之冷卻至室溫，然後與甲苯共沸。將結晶殘留物與水攪拌一會兒。過濾出沈澱物，用水清洗，然後於真空下乾燥。(產率；7.27 g，91%)。

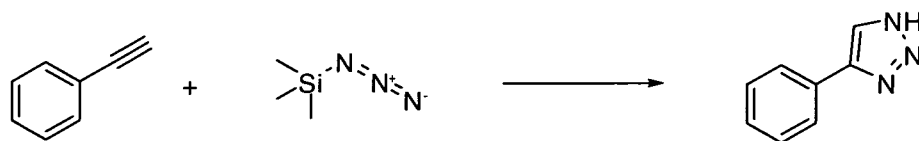
(3-(4-甲氧苯基)-1*H*-1,2,4-三唑-1-基)(嗎啉基)甲酮(鹽化)



於配製於四氫呋喃(20 ml)中，正在攪拌之3-(4-甲氧苯基)-1*H*-1,2,4-三唑(701 mg，4 mmol)溶液中，加入吡啶(0.489 ml，6.00 mmol)、DMAP (48.9 mg，0.400 mmol)。用嗎啉-4-碳醯氯(0.490 ml，4.20 mmol)處理該溶液，之後加熱至90℃，歷時20個小時。TLC顯示出反應幾乎完全。利用真空移除THF，將殘留物分配於DCM與水之間。透過MgSO₄乾燥有機相，過濾以及揮發。從熱IPA中再結晶出來，提供749 mg之白色結晶物(產率：65%)。

1,2,3-三唑類：

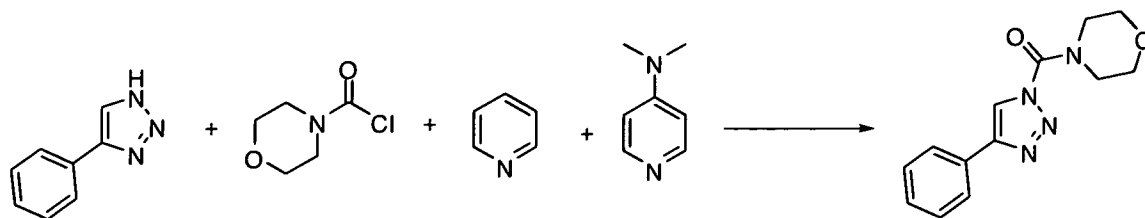
4-苯基-1*H*-1,2,3-三唑(環之合成)



於配製於絕對甲苯(10 ml)中，正在攪拌之苯乙炔(1.098 ml，10 mmol)溶液中，一次加入全部的疊氮三甲基矽烷(2.65 ml，20.00 mmol)。在100℃下加熱該反應物3天，隨之冷卻至室溫，且利用真空移除甲苯。將殘留物分配於DCM與水之間。透過MgSO₄乾燥有機層，過濾。揮發後，於石油醚：

EtOAc = 2 : 1 中進行色層分析。(產率：355 mg，24%)。

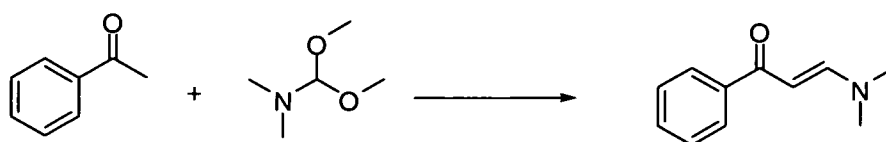
嗎啉基(4-苯基-1H-1,2,3-三唑-1-基)甲酮(醯化)



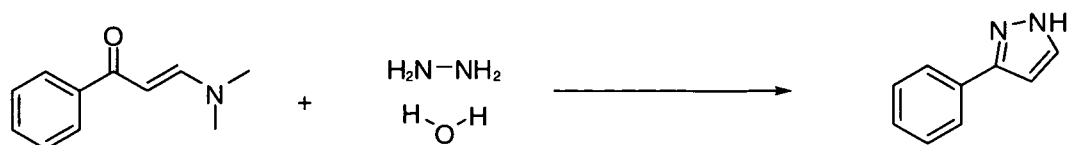
於配製於四氫呋喃(12 ml)中，正在攪拌之4-苯基-1H-1,2,3-三唑(0.340 g，2.342 mmol)溶液中，加入吡啶(0.286 ml，3.51 mmol)、DMAP(0.029 g，0.234 mmol)。用嗎啉-4-碳醯氯(0.287 ml，2.459 mmol)處理該溶液。將該反應加熱至90℃，歷時20個小時。之後利用真空移除THF，將殘留物分配於DCM與水之間。透過MgSO₄乾燥有機相，然後過濾。揮發後，使粗製產物從IPA中再結晶出來，過濾，在真空下乾燥。(產率：193 mg，29%)。

吡唑類：

3-苯基-1H-吡唑(環之合成)

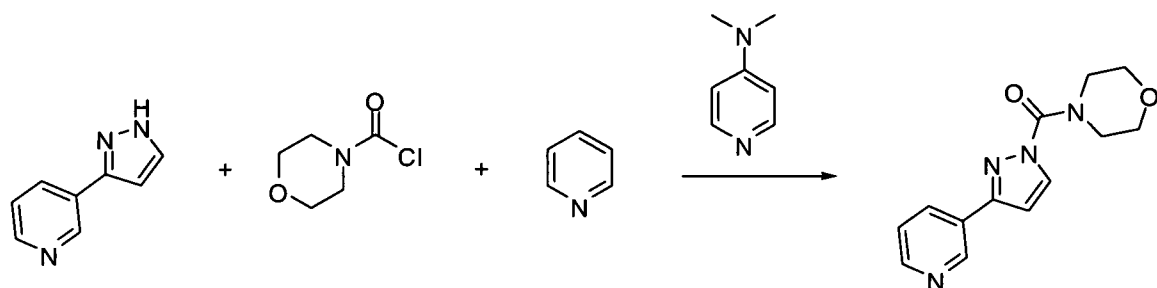


將乙醯苯(5.89 ml，50 mmol)溶於1,1-二甲氧基-N,N-二甲基甲胺(13.39 ml，100 mmol)中。在120℃下加熱該反應混合物24個小時。使深紅色溶液冷卻至室溫，之後利用真空移除過量的1,1-二甲氧基-N,N-二甲基甲胺。用石油醚研製所產生之固狀物，過濾以及在真空下乾燥。(產率：6.78 g，77%)。



於配製於乙醇(40 ml)中，正在攪拌之(*E*)-3-(二甲胺基)-1-苯基丙-2-烯-1-酮(2.63g, 15mmol)溶液中，加入水合肼(1.459ml, 30.0mmol)。將該反應加熱至100℃，歷時2個小時。隨之冷卻至室溫，利用真空移除乙醇。將殘留物分配於DCM與水之間。透過MgSO₄乾燥有機相，然後過濾。揮發後，利用以石油醚以及醋酸乙酯之混合物研磨，純化粗製產物(產率：1.59g, 73%)。

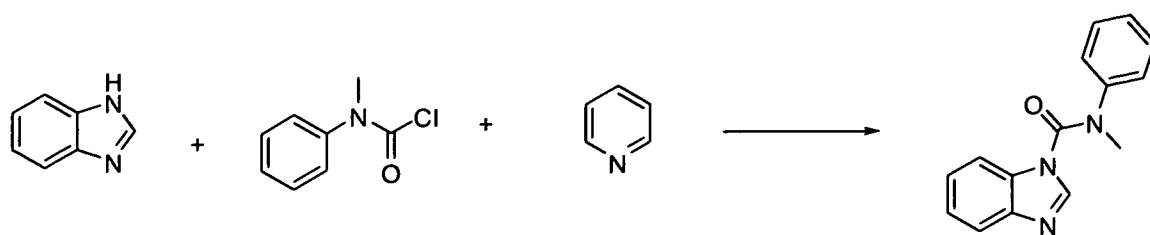
嗎啉基(3-(吡啶-3-基)-1*H*-吡唑-1-基)甲酮(醃化)



於配製於四氫呋喃(15 ml)中，正在攪拌之3-(1*H*-吡唑-3-基)吡啶(0.435g, 3mmol)溶液中，加入吡啶(0.367ml, 4.50mmol)、DMAP (18.33mg, 0.150mmol)。用4-嗎啉碳醃氯(0.368ml, 3.15mmol)處理該溶液。將該反應加熱至80℃，歷時20個小時。利用真空移除THF，將殘留物分配於DCM與水之間。透過MgSO₄乾燥有機相，過濾。揮發後，於石油醚：EtOAc = 2：1中色層分析粗製產物。(產率：174 mg, 21%)。

苯并咪唑類：

N-甲基-N-苯基-1*H*-苯并[d]-咪唑-1-氯甲醃(醃化)

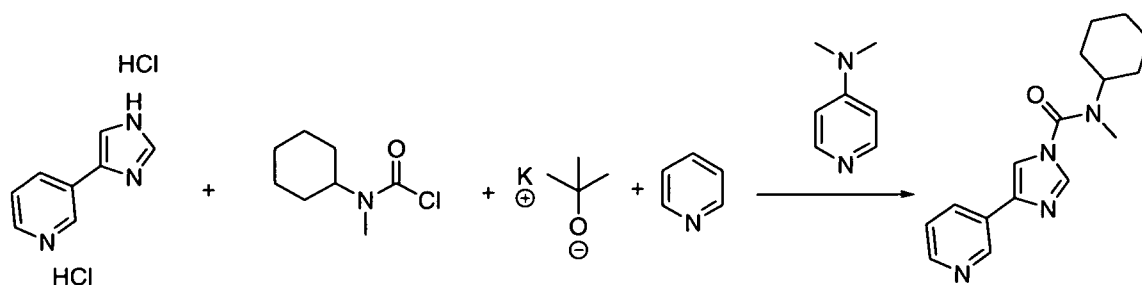


於配製於四氫呋喃(15ml)中，正在攪拌之1*H*-苯并[d]咪唑(354mg，3mmol)溶液中，加入吡啶(0.367ml，4.50mmol)，接著加入甲基(苯基)氨基甲醯氯(534mg，3.15mmol)。將該反應加熱至80℃，歷時20個小時。利用真空移除THF，將殘留物分配於DCM與水之間。透過MgSO₄乾燥有機相，過濾。揮發後，於石油醚：EtOAc = 2：1中色層分析粗製產物。(產率：365 mg，46%)。

於下節中，提供針對特別化合物之額外的合成範例。

化合物362之製備方法

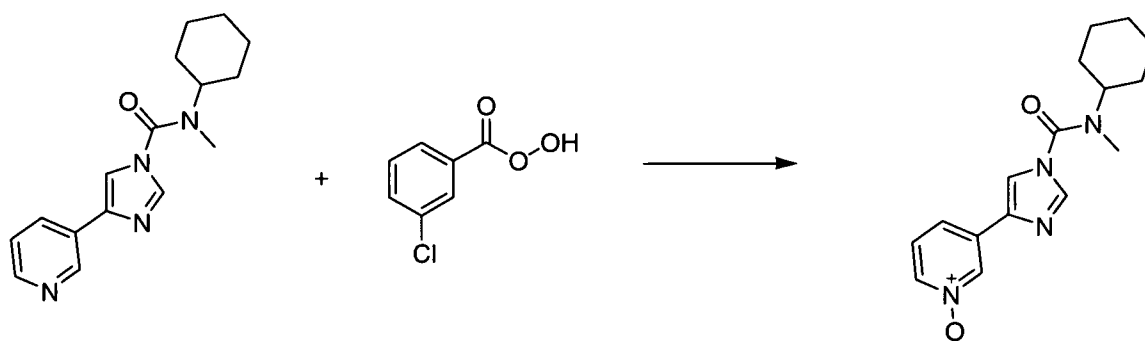
a) N-環己基-N-甲基-4-(吡啶-3-基)-1*H*-咪唑-1-氨基甲醯



於配製於四氫呋喃(29mL)與DMF (2.90mL)之混合物中，正在攪拌之3-(1*H*-咪唑-4-基)吡啶二氫氯化物(1.745g，8mmol)懸浮液中，加入2-叔丁醇鉀(1.795g，16.0mmol)，使該混合物迴流30分鐘。令所產生之棕色懸浮液冷卻至室溫，用吡啶(0.979mL，12mmol)以及N,N-4-二甲胺吡啶(0.098g，0.8mmol)處理之，接著添加環己基(甲基)氨基甲醯氯(1.476g，8.4mmol)。將該反應加熱至90℃一整夜，隨之

用水稀釋該混合物，且用醋酸乙酯萃取之。乾燥有機相(MgSO₄)，過濾。揮發後，透過矽膠，使用二氯甲烷/甲醇(9:1)混合物色層分析粗製產物。將均質區段倒在一起，揮發至留下白色粉末(160 mg, 7%)。

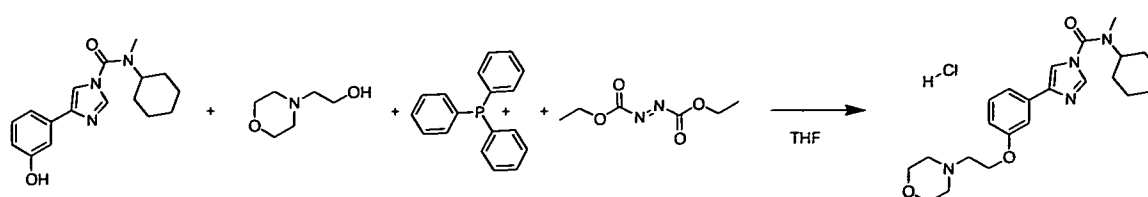
b) 3-(1-(環己基(甲基)氨基甲醯基)-1H-咪唑-4-基)吡啶1-氧化物



於配製於氯仿(5mL)中，正在攪拌中之N-環己基-N-甲基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-基甲醯(90mg, 0.317mmol)溶液中，一次加入全部的3-氯苯并過氧酸(149mg, 0.475mmol)。使該反應在室溫下攪拌20個小時。TLC顯示出該反應已完全，使該混合物揮發至乾燥。用醚研磨該殘留物，過濾所產生之白色結晶物，於空氣中乾燥。於熱異丙醇中再結晶，產生白色粉末(46 mg, 46%)。

化合物408之配製方法

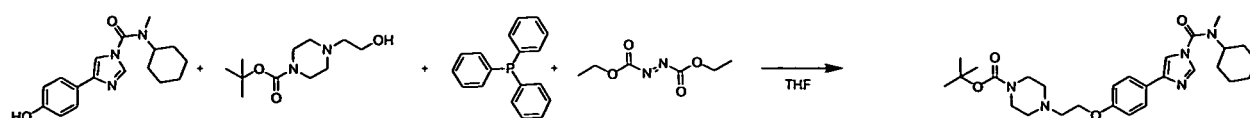
N-環己基-N-甲基-4-(3-(2-嗎啉乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-基甲醯氮氯化物



在氮氣下，使N-環己基-4-(3-羥苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲鹽(170mg, 0.568mmol)化於無水四氫呋喃(10mL)中，產生無色溶液。加入N-β-羥乙基嗎啉(0.068mL, 0.568mmol)，使該溶液冷卻至0°C。加入三苯膦(179mg, 0.681mmol)，接著逐滴加入DEAD (0.108mL, 0.68mmol)，使得在添加各滴後所形成之黃色在添加下滴之前退去。使所產生之淡黃色溶液回溫至室溫，且攪拌18個小時。之後使該反應混合物冷卻至0°C，加入另一部分之三苯膦(179mg, 0.681mmol)以及DEAD (0.108mL, 0.68mmol)。再攪拌該溶液另一個6小時。使溶劑揮發掉，利用色層分析純化黃色油狀物(矽膠H; 9/1、8/2、6/4、5/5、4/6 甲苯/丙酮)。使純產物之區段進行揮發，將該淡黃色油狀物溶於醋酸乙酯中，其之後導致沈澱。加熱懸浮液以便溶解該固狀物，之後使溶液冷卻至0°C。過量的配製於乙醚中之2 N HCl逐滴加入。在0°C下攪拌所產生之混合物10分鐘，之後讓其回溫至室溫，再攪拌另一個15分鐘。過濾出沈澱物，用乙醚清洗並乾燥。從醋酸乙酯中再結晶出來，產生淡奶油固狀物(39 mg, 14%)。

化合物397之製備

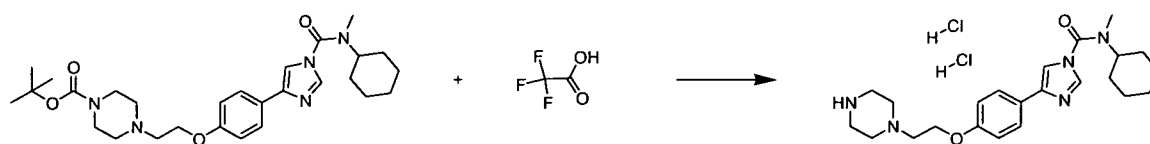
a) 叔-丁基4-(2-(4-(1-(環己基(甲基)氨基甲鹽基)-1H-咪唑-4-基)苯氧基)乙基)哌嗪-1-羧酸酯



在氮氣下，於50 mL梨形瓶中放置配製於四氫呋喃

(10mL) 中之 N-環己基-4-(4-羥苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氨基甲鹽(200mg, 0.668mmol), 以產生淡粉紅色溶液。加入叔-丁基4-(2-羥乙基)哌嗪-1-羧酸酯(184mg, 0.8mmol), 將該溶液冷卻至0°C。加入三苯膦(210mg, 0.801mmol), 接著逐滴加入 DEAD (0.127mL, 0.8mmol), 使得在添加各滴後所形成之黃色在添加下滴之前退去。使所產生之淡黃色溶液回溫至室溫, 攪拌24個小時。使溶劑揮發掉, 利用色層分析法純化該淡黃色油狀物(矽膠H; 10%、20%、30%、40%、50%、60%丙酮/甲苯)。使純產物之區段進行揮發, 在沒有進一步純化之情況下將該米黃色固狀物(167mg)用於下一個步驟中。

b) N-環己基-N-甲基-4-(4-(2-(哌嗪-1-基)乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-氨基甲鹽二氫氯化物

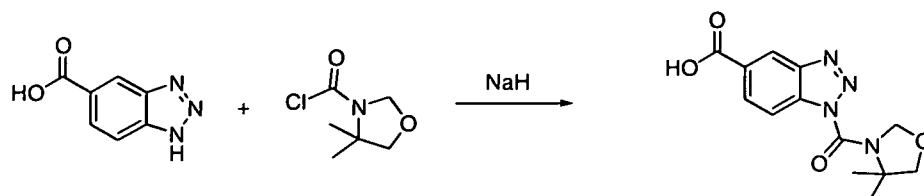


於25mL梨形瓶中放置叔-丁基4-(2-(4-(1-(環己基(甲基)氨基甲鹽基)-1H-咪唑-4-基)苯氧基)乙基)哌嗪-1-羧酸酯(167mg, 0.326mmol)。加入三氟醋酸(3mL, 38.9mmol)以產生淡黃色溶液, 在室溫下攪拌1個小時。使溶劑揮發掉, 將殘留的黃色油狀物溶於醋酸乙酯中, 冷卻至0°C。隨後, 加入過量的配製於乙醚中之2 N HCl溶液。在0°C下攪拌該混合物10分鐘, 之後使其回溫至室溫, 攪拌15分鐘。使該混合物進行揮發, 使殘留物從異丙醇中再結晶出來。過濾該結晶物, 用異丙醇清洗, 乾燥以產生呈白色固狀之產物(115

mg, 69%)。

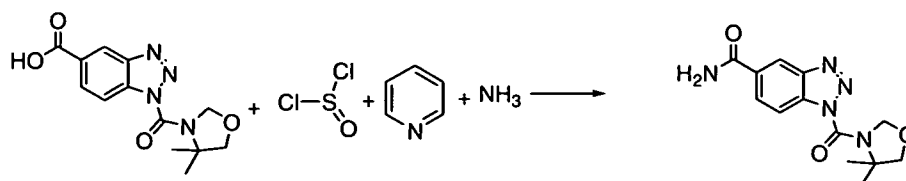
化合物389之製備

a) 1-(4,4-二甲噁唑烷-3-羰基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-羧酸



0°C下將配製於四氫呋喃(90 mL)以及二甲基甲醯胺(50 mL)之混合物中之1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-羧酸(3 g, 18.39 mmol)溶液，逐滴加至配製於四氫呋喃(30 mL)中，正在攪拌之氫化鈉(1.839 g, 46 mmol)溶液中。於在0°C下逐滴添加配製於四氫呋喃(10 mL)中之4,4-二甲噁唑烷-3-碳醯氯(3.16 g, 19.31 mmol)溶液之前，使該懸浮物在室溫下攪拌30分鐘。使該反應混合物在室溫下攪拌4個小時。在0°C下加入水，使溶劑揮發掉。加入二氯甲烷/異丙醇(7:3)之混合物，將有機層分開來。用二氯甲烷再萃取水層，然後乾燥合併的有機層(MgSO₄)，過濾以及揮發。使有機殘留物從異丙醇中再結晶出來，產生米黃色固狀物(840 mg)，其在沒有進一步純化之情況下用於下一步驟。

b) 1-(4,4-二甲噁唑烷-3-羰基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-氨基甲醯

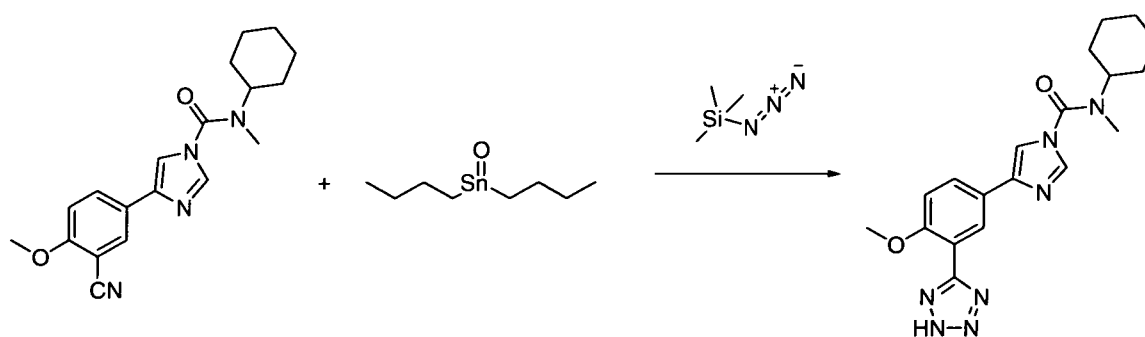


室溫下將亞硫醯氯(0.633 mL, 8.67 mmol)逐滴加入配

製於二氯甲烷(17 mL)中，正在攪拌的1-(4,4-二甲噁唑烷-3-羰基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-6-羧酸(0.763 g, 2.63 mmol)以及吡啶(0.702 mL, 8.67 mmol)溶液中。使該黃色溶液在室溫下攪拌15分鐘。之後將此溶液逐滴加至0°C配製於乙醇中之1.75 N氨水(15.02 mL, 26.3 mmol)溶液，隨之有白色懸浮物形成。使該反應混合物再於室溫下攪拌30分鐘。加入水，讓乙醇揮發掉。之後用二氯甲烷稀釋殘留物，將有機層分開來，用1 N HCl溶液清洗。乾燥有機層(MgSO₄)，過濾並揮發，產生黃色固狀物。使該固狀物從二氯甲烷/乙醇之混合物中再結晶出來，產生呈米黃色固體狀之產物(151 mg, 20%)。

化合物438之製備

N-環己基-4-(4-甲氧基-3-(2H-四唑-5-基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮甲醯

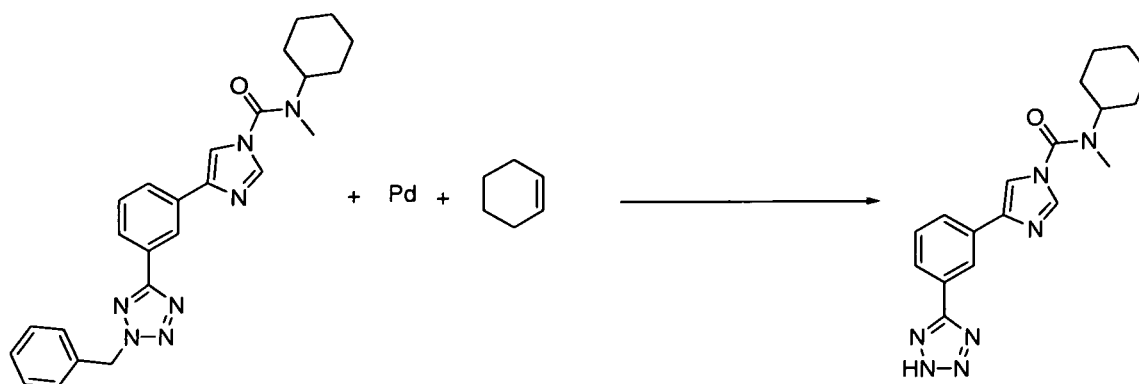


將4-(3-氰基-4-甲氧基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氮甲醯(305 mg, 0.901 mmol)、二丁基錫酮(28.0 mg, 0.113 mmol)以及疊氮三甲基矽烷(0.239 ml, 1.803 mmol)之混合物，於115°C下之甲苯(8 mL)中加熱20個小時。之後讓該混合物冷卻至室溫，然後揮發至乾燥。通過矽膠，使用二氯

甲烷/甲醇(95：5)之混合物對該粗製產物進行色層分析。在均質區段揮發後，用二乙醚研製該殘留物，過濾並乾燥，產生呈灰白色結晶狀之產物(196 mg，54%)。

化合物576之製備

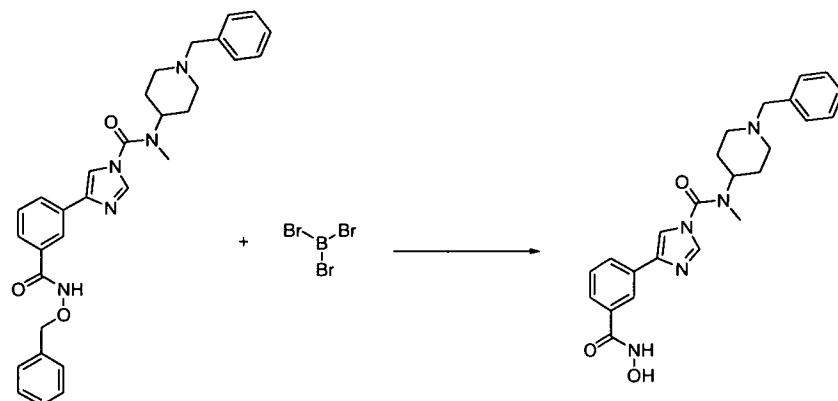
4-(3-(2H-四唑-5-基)苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氨甲醯



在密封管中以80°C加熱正在攪拌之4-(3-(2-苯甲基-2H-四唑-5-基)苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氨甲醯(256 mg，0.58 mmol)、10%鈀碳(30.9 mg，0.029 mmol)以及環己烯(1.175 ml，11.6 mmol)之混合物。之後讓該反應冷卻至室溫，通過矽藻土墊過濾，然後揮發至乾燥。通過矽膠，使用二氯甲烷/甲醇(90：10)對該剩餘的油狀物進行色層分析予以純化。將均質區段倒在一起，揮發後，使殘留之油狀物從二乙醚中產生結晶，產生呈灰白色粉末狀之產物(45 mg，21%)。

化合物423之製備

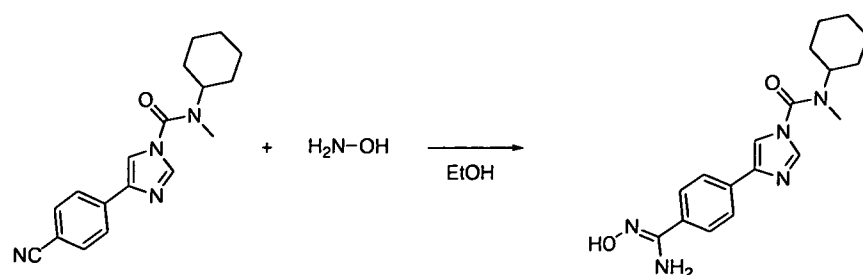
N-(1-苯甲基哌啶-4-基)-4-(3-(羥氨基甲醯基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氨甲醯



於配製於 -78°C 下之二氯甲烷(5 mL)中，正在攪拌之4-(3-(苯甲氧基氨基甲醯基)苯基)-N-(1-苯甲哌啶-4-基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氨基甲醯(120 mg, 0.229 mmol)懸浮液中，添加三溴化硼(0.022 mL, 0.229 mmol)。該反應在冰冷中攪拌5分鐘，之後讓其回溫至室溫持續1個小時，將該混合物冷卻至 -20°C ，用甲醇小心地使反應驟止。之後，使溶劑揮發掉，將殘留物化於二氯甲烷/異丙醇(7:3)中，用飽和 NaHCO_3 清洗，之後乾燥(MgSO_4)。過濾後，使二氯甲烷揮發至小小的量，將所產生之沈澱物過濾出，用異丙醇清洗，乾燥產生呈灰白色粉末狀之產物(58 mg, 55%)。

化合物551之製備

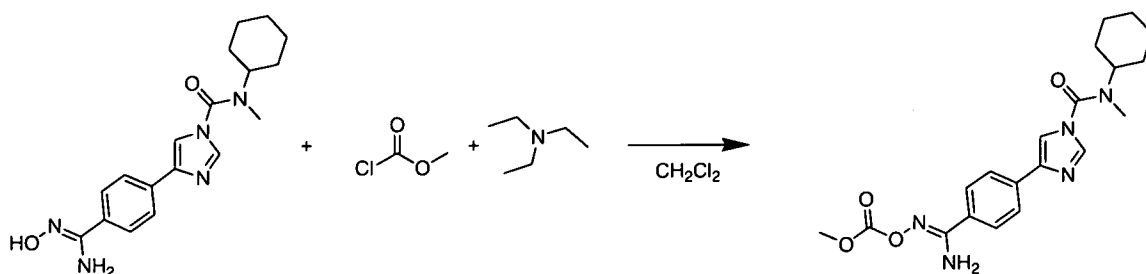
a) (Z)-N-環己基-4-(4-(N'-羥基甲脒基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氨基甲醯



室溫下於25 mL圓底瓶中，置入配製於乙醇(9 mL)中之

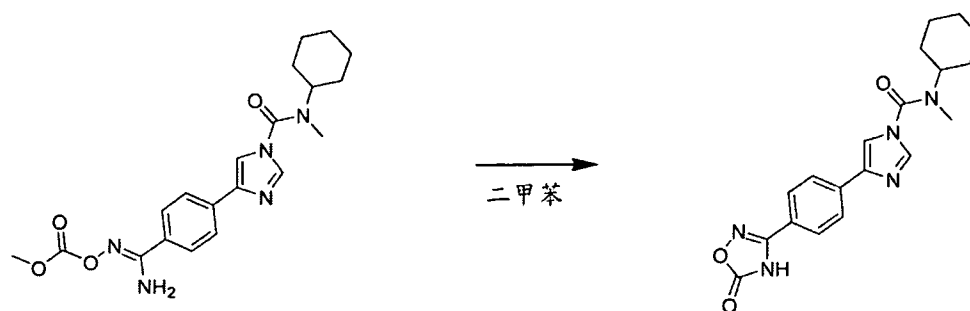
4-(4-氯苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氯甲鹽(600 mg, 1.946 mmol)溶液，產生白色懸浮液。逐滴加入配製於水(0.298 mL, 4.86 mmol)中之50%羥胺溶液，以90°C加熱所產生之混合物90分鐘。之後讓該混合物冷卻至室溫，有一些沈澱物形成，將其過濾，用乙醇清洗。使此固狀物從熱醋酸乙酯(~70 mL)以及石油醚(~150 mL)之混合物中再結晶出來。過濾該結晶物，用石油醚清洗，乾燥產生白色固狀物(230 mg, 29%)。

b) (Z)-N-環己基-4-(4-(N'-(甲氧羰基氧基)甲脒基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氯甲鹽



於25 mL梨形瓶中，置入配製於氮氣下無水二氯甲烷(3 mL)中之(Z)-N-環己基-4-(4-(N'-羥基甲脒基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氯甲鹽(228 mg, 0.668 mmol)，產生白色懸浮液。加入三乙胺(0.102 mL, 0.735 mmol)，將該懸浮液冷卻至0°C，並攪拌30分鐘。之後，逐滴加入氯甲酸甲酯(0.065 mL, 0.835 mmol)，將該混合物置於0°C下攪拌30分鐘，之後讓其回溫至室溫，再攪拌30分鐘。濾出沈澱物，溶於異丙醇以及二氯甲烷(3:7)之混合物中。合併此溶液與以上之濾液，用1 N HCl、水以及濃鹽水清洗，之後乾燥(MgSO₄)，過濾，揮發，產生白色固狀物(228 mg, 82%)。

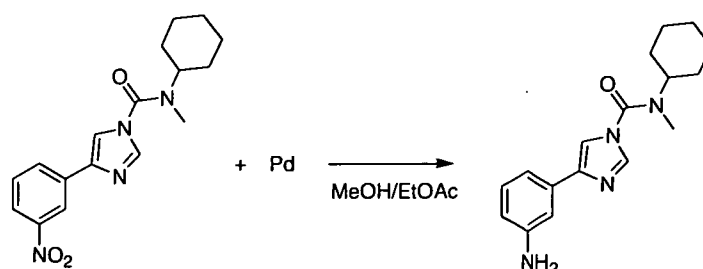
c) N-環己基-N-甲基-4-(4-(5-側氧-4,5-二氫-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基)-1H-咪唑-1-氮甲鹽



於50 mL梨形瓶中置入配製於氮氣下二甲苯(10 mL)中之(Z)-N-環己基-4-(4-(N'-(甲氧羰氧基)甲脒基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮甲鹽(200 mg, 0.501 mmol)，產生白色懸浮液。在140℃下加熱該混合物4個小時，之後冷卻至室溫。濾出所形成之沈澱物，用二甲苯清洗濾餅。乾燥後，將此固狀物溶於二氯甲烷與異丙醇之混合物中。揮發至小小的量後，讓該溶液冷卻至室溫，濾出所形成之沈澱物，乾燥產生呈淡粉紅色固狀物之產物(134 mg, 69%)。

化合物553之製備

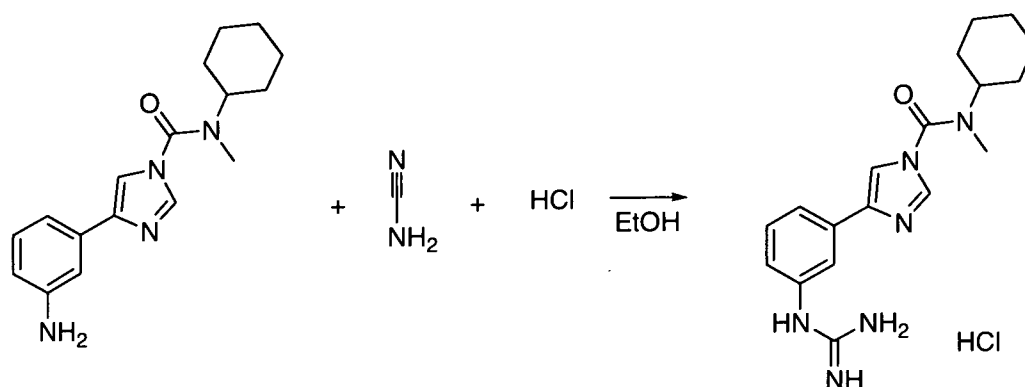
a) 4-(3-胺苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氮甲鹽



室溫下將10%鈀碳(0.122 g, 0.115 mmol)加至配製於氮氣氬圍中醋酸乙酯(46 mL)與甲醇(46 mL)的混合物中，正在攪拌之N-環己基-N-甲基-4-(3-硝苯基)-1H-咪唑-1-氮甲鹽(0.755

g, 2.299 mmol)溶液中。之後令該混合物在氫氣氛圍中室溫下攪拌50分鐘。通過矽藻土過濾該混合物，用甲醇清洗濾墊。使合併的濾液進行揮發，產生清澈油狀物/泡沫物(691 mg, 100%)，其在沒有進一步純化之情況下用於下一步驟。

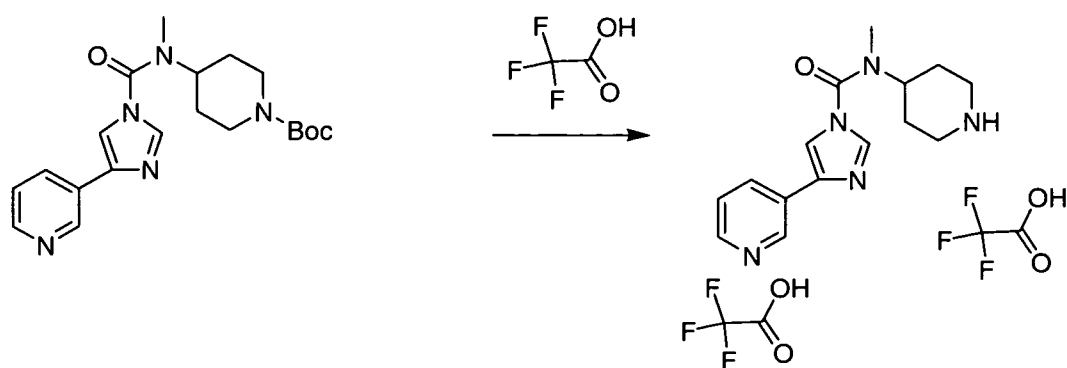
b) N-環己基-4-(3-胍苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氨甲醯氫氯化物



室溫下於配製於乙醇(1.2 mL)中，正在攪拌的4-(3-胺苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氨甲醯(0.345 g, 1.156 mmol)與胺基胍(0.135 mL, 1.734 mmol)懸浮液中，加入氣態無水氯化氫(0.096 mL, 1.156 mmol)。使該清澈溶液在回流下攪拌1小時，無色固狀物形成。使該反應混合物在回流下進一步攪拌7小時，之後，讓該混合物冷卻。利用過濾法將該固狀物分開來，用乙醇清洗，產生呈無色固狀物之產物(298 mg, 68%)。

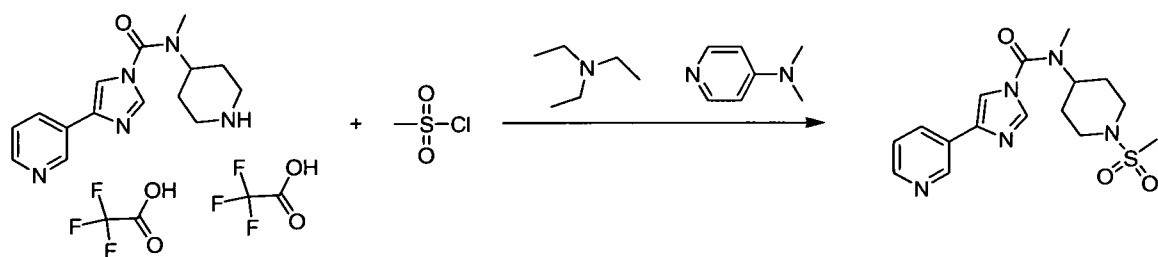
化合物533之製備

a) N-甲基-N-(哌啶-4-基)-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-氨甲醯雙(2,2,2-三氟醋酸酯)



於叔-丁基 4-(N-甲基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-甲醯胺基)哌啶-1-羧酸酯(500 mg, 1.297 mmol)中加入三氟醋酸(4 mL, 51.9 mmol), 產生混濁的溶液。使該混合物在室溫下攪拌1小時, 之後利用揮發移除溶劑。用乙醚研製油狀殘留物, 濾出所產生之白色固狀物, 產生白色固狀物(653.2 mg, 88%產率)。

b) N-甲基-N-(1-(甲磺醯基)哌啶-4-基)-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-氮甲醯

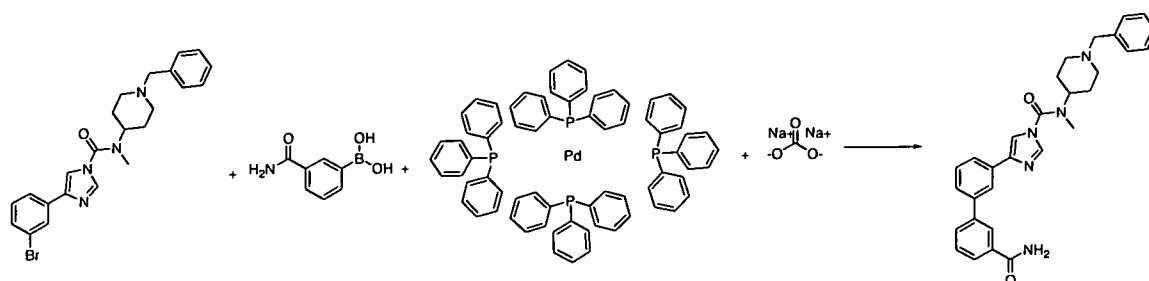


於配製於二氯甲烷(10 mL)中, 冰水冷卻的N-甲基-N-(哌啶-4-基)-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-氮甲醯雙(2,2,2-三氟醋酸酯)(300 mg, 0.584 mmol)懸浮液中, 加入DMAP(35.7 mg, 0.292 mmol), 接著逐滴添加三乙胺(0.326 mL, 2.337 mmol), 接著再添加甲烷磺醯氯(0.072 mL, 0.934 mmol)。使該溶液在室溫下攪拌一整夜, 之後藉由添加甲醇使反應驟止, 且容許在室溫下攪拌。利用過濾法收集白色

沈澱物，用甲醇與乙醚清洗，之後乾燥產生呈白色固體狀之產物(158 mg，74%)。

化合物550之製備

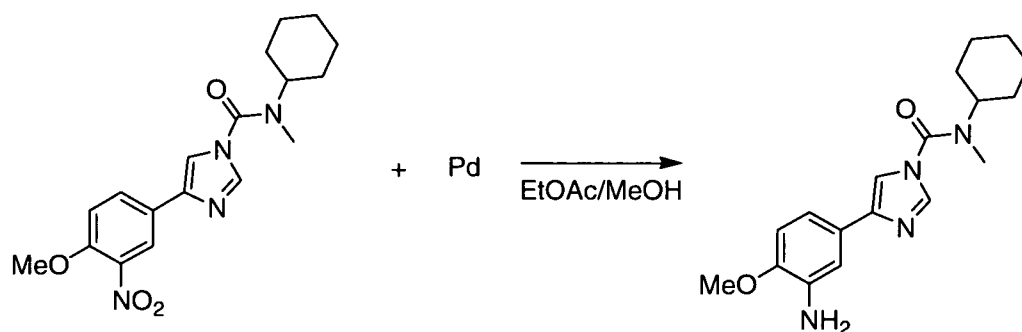
N-(1-苯甲哌啶-4-基)-4-(3'-氨基甲醯基二苯基-3-基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氨甲醯



室溫下於配製於1-丙醇(5 mL)與水(1 mL)之混合物中，正在攪拌之N-(1-苯甲哌啶-4-基)-4-(3-溴苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氨甲醯(0.600 g，1.323 mmol)、3-氨基甲醯基苯硼酸(0.229 g，1.390 mmol)以及2 M碳酸鈉溶液(0.794 mL，1.588 mmol)分散物中，加入四(三苯膦)鈰錯合物(0.076 g，0.066 mmol)。使該反應混合物在90°C下攪拌1小時。加入水，用二氯甲烷/異丙醇(7：3)之混合物稀釋有機層。將有機層分開來，乾燥(MgSO₄)，過濾且揮發，產生橘色油狀物。管柱色層分析(矽膠，二氯甲烷/甲醇5%)產生呈橘色油狀之產物。用石油醚/醋酸乙酯/乙醚之混合物研製該油狀物，產生呈米黃固體狀之產物(123mg，17%)。

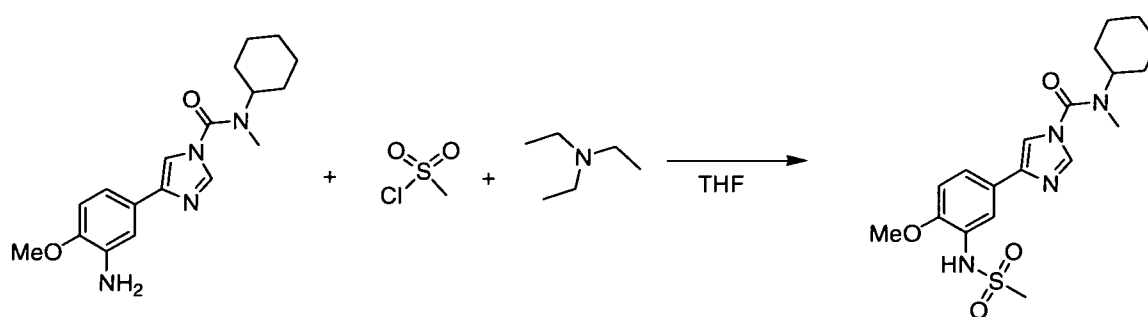
化合物485之製備

a) 4-(3-胺基-4-甲氧苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氨甲醯



於氫氣中室溫下配製於醋酸乙酯(50 mL)與甲醇(50 mL)之混合物中，正在攪拌的N-環己基-4-(4-甲氧基-3-硝苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮甲鹽(1.075 g, 3 mmol)溶液中，加入10%鈀碳(0.16 g, 0.15 mmol)。於該溶液中打入氫氣1個小時。之後通過矽藻土過濾該溶液，用醋酸乙酯清洗濾墊。使合併之濾液揮發，產生棕色油狀固體，其在沒有進一步純化之情況下用於下一個步驟。

b) N-環己基-4-(4-甲氧基-3-(甲磺醯胺基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮甲鹽

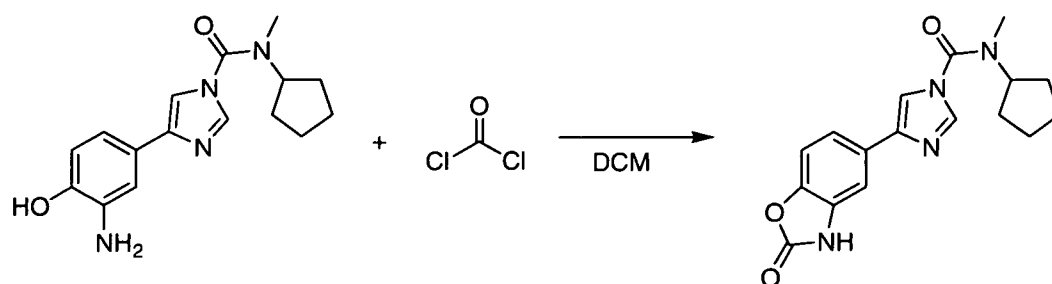


於室溫下配製於四氫呋喃(6 mL)中，正在攪拌之4-(3-胺基-4-甲氧基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氮甲鹽(1.04 g, 3.17 mmol)與三乙胺(0.441 mL, 3.17 mmol)溶液中，加入甲磺醯氯(0.247 mL, 3.17 mmol)。使該棕色混合物在室溫下攪拌過一週末。加入水，使溶劑揮發掉。之後

將水層酸化，用醋酸乙酯萃取殘留物。用二氯甲烷/異丙醇(7：3)之混合物萃取水層二次。將有機層分開來，乾燥(MgSO_4)，過濾，揮發產生灰白色固狀物。使該固狀物從乙醇/二氯甲烷混合物中再結晶出來，產生呈灰白色固體狀之產物(434 mg，34%)。

化合物564之製備

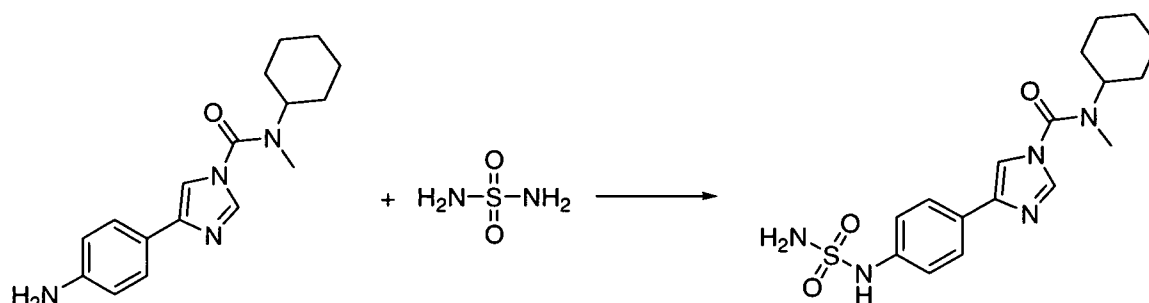
N-環戊基-N-甲基-4-(2-側氧-2,3-二氫苯并[d]噁唑-5-基)-1H-咪唑-1-氯甲醯



室溫下將20%光氣(0.590 mL，1.121 mmol)之甲苯溶液，逐滴加至配製於二氯甲烷(5 mL)中，正在攪拌的4-(3-胺基-4-羥苯基)-N-環戊基-N-甲基-1H-咪唑-1-氯甲醯(0.259 g，0.862 mmol)溶液中，使該灰白色懸浮液攪拌5個小時。加入水，用二氯甲烷/異丙醇(7：3)之混合物稀釋有機層。將有機層分開來，乾燥(MgSO_4)，過濾且揮發，產生灰白色固狀物，其用熱甲醇研製之。過濾並乾燥，產生呈白色固體狀之產物(90 mg，30%)。

化合物580之製備

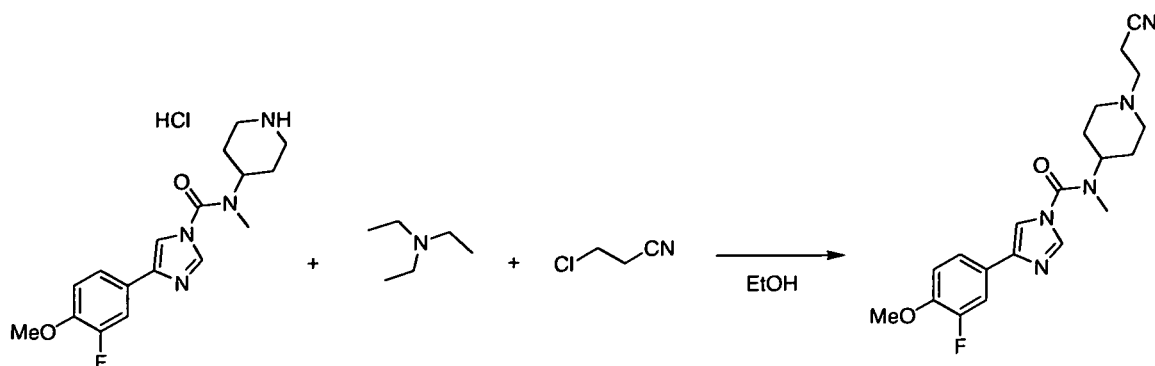
N-環己基-N-甲基-4-(4-(胺磺醯基胺基)苯基)-1H-咪唑-1-氯甲醯



於室溫下配製於二噁烷(2 mL)中，正在攪拌的4-(4-胺苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氨甲醯(0.250 g，0.838 mmol)懸浮液中，加入磺醯胺(0.089 g，0.922 mmol)。使該懸浮液在回流下加熱4個小時，產生清澈溶液，之後加入另外的磺醯胺(0.089 g，0.922 mmol)，使該混合物在回流下再加熱2.5個小時。移除溶劑，利用色層分析法純化棕色殘留物(矽膠，二氯甲烷/甲醇，1%、2%、5%)。將均質區段倒在一起，進行揮發。用醋酸乙酯研製殘留物，利用過濾移除所形成之無色固狀物。使濾液揮發，再用製備級TLC(矽膠，二氯甲烷/10%甲醇)純化。用醋酸乙酯/10%甲醇之混合物，將產物從矽膠中萃取出來。溶劑揮發後產生清澈油狀物，用醋酸乙酯以及甲醇之混合物研製之，產生呈灰白色固體狀之產物(19 mg，6%)。

化合物541之製備

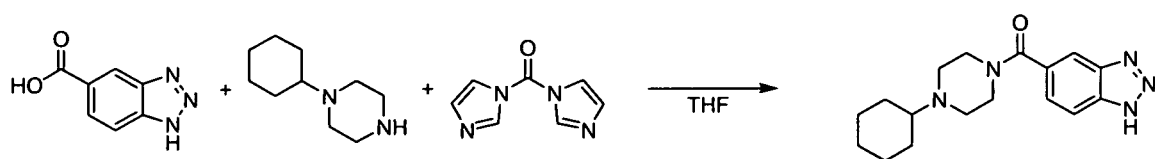
N-(1-(2-氰乙基)哌啶-4-基)-4-(3-氟基-4-甲氧苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氨甲醯



於室溫下正在攪拌之4-(3-氟基-4-甲氧苯基)-N-甲基-N-(哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-基甲醯氫氯化物(0.200 g, 0.542 mmol)與3-氯丙腈(0.058 g, 0.651 mmol)之懸浮液中，加入三乙胺(0.159 mL, 1.139 mmol)。使該清澈溶液在回流下攪拌2個小時，期間白色懸浮液形成。使該混合物冷卻至室溫，用二氯甲烷/異丙醇(7:3)之混合物稀釋，之後用水清洗。乾燥有機層(MgSO₄)，過濾並揮發，產生無色固狀物，其用乙醇研製，產生產物(142 mg, 64%)。

化合物505之製備

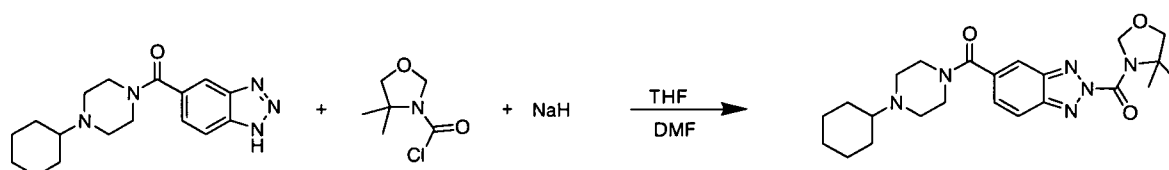
a) (1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-基)(4-環己基哌嗪-1-基)甲酮



於氮氣下100 mL圓底瓶中置入配製於無水四氫呋喃(10 mL)中之1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-羧酸(510 mg, 3.126 mmol)，產生棕色懸浮液。一部分一部分地加入CDI (558 mg, 3.439 mmol)，在室溫下攪拌該混合物1.5個小時。之後，一部分一部分地加入1-環己基哌嗪(658 mg, 3.908 mmol)，在室溫下再攪拌所產生之棕色溶液30分鐘。使溶劑揮發

掉，將棕色油狀物分配於30%異丙醇/二氯甲烷/水中。將相分開來，用水與濃鹽水清洗有機相，之後乾燥(MgSO₄)，過濾以及揮發。用色層分析法(矽膠H；二氯甲烷，2%、3%、5%甲醇/二氯甲烷)純化所產生之米黃色泡沫狀物。使具純產物之區段進行揮發，用庚烷研製淡橘色泡沫狀物。過濾固狀物，乾燥產生米黃色固狀物(605 mg，54%)。

b) (4-環己基哌嗪-1-基)(2-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羰基)-2H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-基)甲酮草酸酯



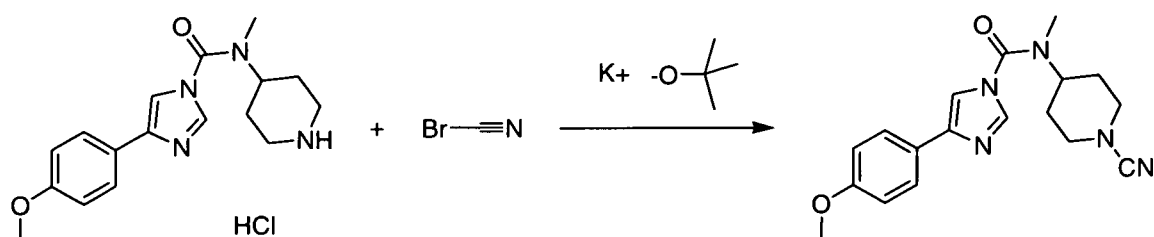
於100 mL圓底瓶中置入配製於四氫呋喃(15 mL)與N,N-二甲基甲醯胺(3 mL)中之(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-基)(4-環己基哌嗪-1-基)甲酮(612 mg，1.953 mmol)，產生淡黃色溶液。將此溶液冷卻至0℃，加入氫化鈉(70.3 mg，2.93 mmol)之60%礦物油分散物。使所產生之淡粉紅色溶液回溫至室溫，攪拌45分鐘。之後再將該混合物冷卻至0℃，逐滴加入配製於四氫呋喃(2.5 mL)中之4,4-二甲基噁唑烷-3-碳醯氯(351 mg，2.148 mmol)溶液。使所產生之淡黃色溶液回溫至室溫，攪拌4個小時。使溶劑揮發掉，於殘留物中加入水，用甲苯萃取。用水與濃鹽水清洗有機相，之後乾燥(MgSO₄)，過濾以及揮發。利用色層分析法(矽膠H；二氯甲烷，2%甲醇/二氯甲烷)純化所產生之黃色油狀物。將具純產物之區段倒在一起，揮發後產生淡黃色泡沫狀物(690

mg, 80%)。

室溫下於50 mL梨形瓶中置入配製於甲醇(5 mL)中之(4-環己基哌嗪-1-基)(2-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羰基)-2H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-基)甲酮(300 mg, 0.681 mmol), 產生黃色溶液。一部分一部分地加入草酸二水合物(86 mg, 0.681 mmol), 在室溫下攪拌該溶液2個小時。使溶劑揮發掉, 使所產生之淡黃色泡沫狀物從異丙醇中產生結晶。過濾後, 乾燥, 獲得呈白色固體狀之產物(150 mg, 39%)。

化合物595之製備

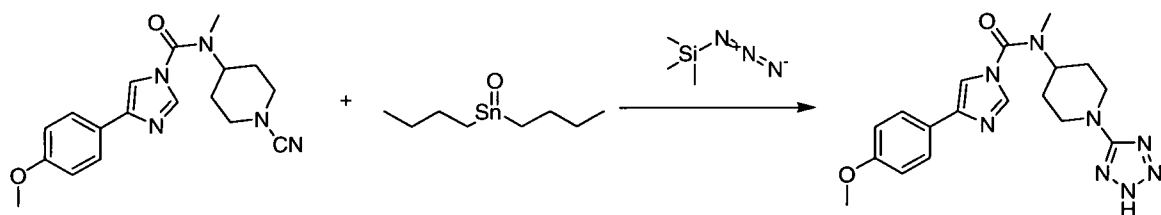
a) N-(1-氰哌啶-4-基)-4-(4-甲氧苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲醯



於配製於DMF (5 mL)中之4-(4-甲氧苯基)-N-甲基-N-(哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-基甲醯氫氯化物(287 mg, 0.818 mmol)溶液中, 加入叔丁醇鉀(184 mg, 1.636 mmol), 使該混合物在室溫下攪拌30分鐘, 之後於冰/水浴中冷卻, 在10-15分鐘期間逐滴加入溴化氰(0.818 mL, 2.454 mmol, 3 N 二氯甲烷溶液)。在1小時期間, 使該反應混合物慢慢回到室溫, 之後分配於水與二氯甲烷/異丙醇(7:3)之間。將層分開來, 用水與濃鹽水進一步清洗有機相, 之後乾燥(Na_2SO_4), 過濾, 在減壓下移除溶劑。將殘留物溶在最少

量的氯仿中，利用過濾法移除不溶性物質。濃縮濾液，產生灰白色固狀物(345 mg，67%)。

b) N-(1-(2H-四唑-5-基)哌啶-4-基)-4-(4-甲氧苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氯甲鹽

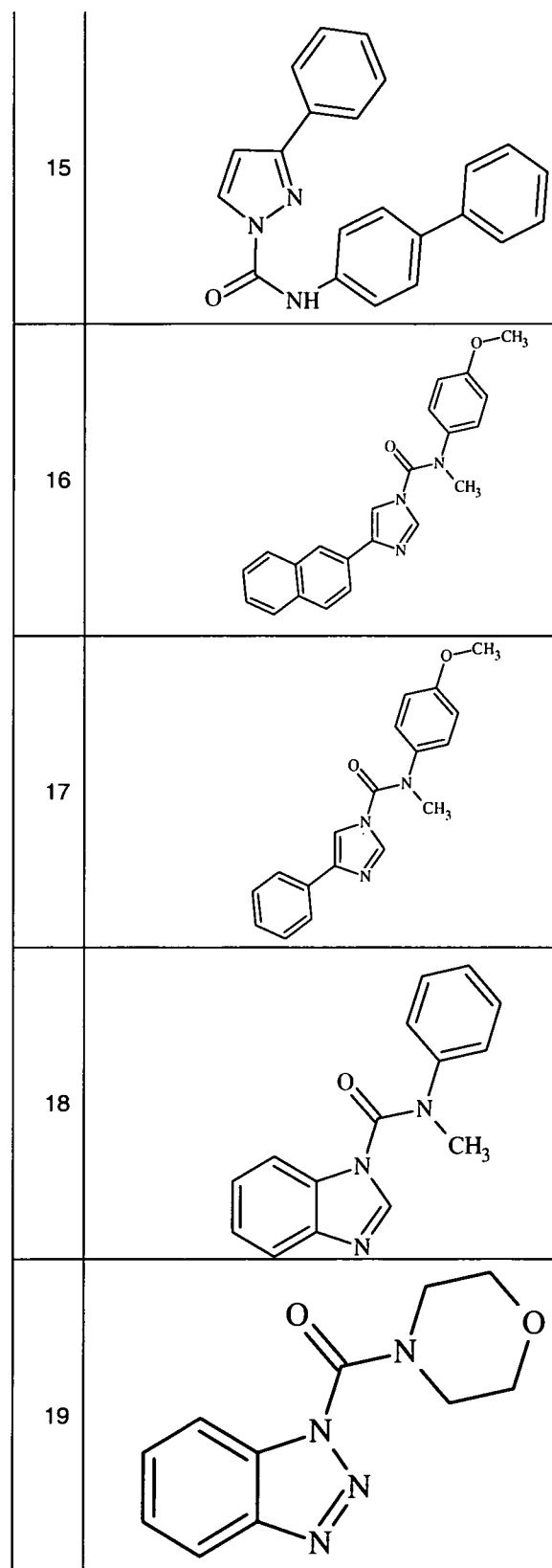
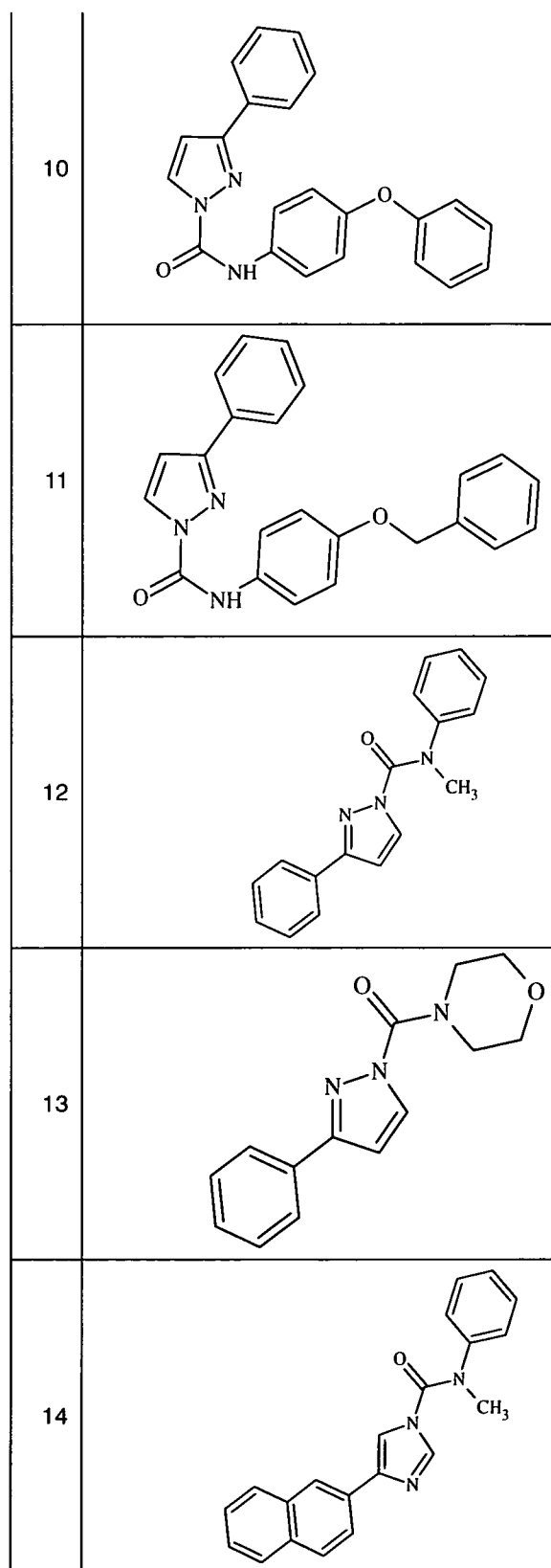


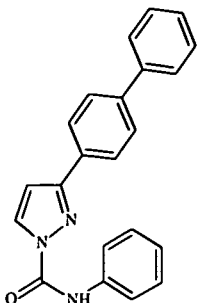
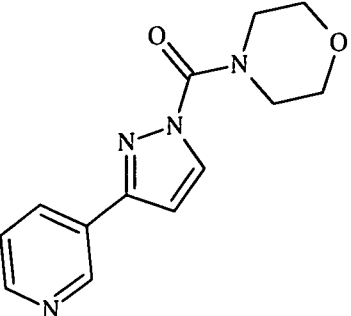
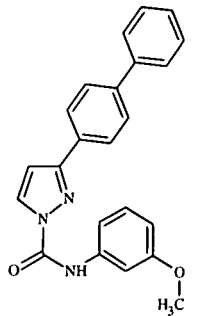
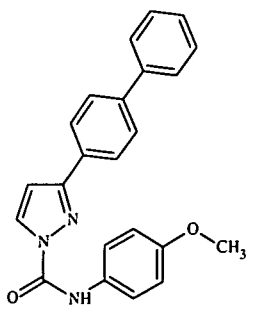
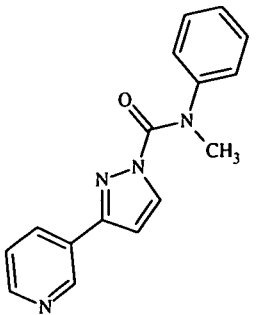
於配製於甲苯(10 mL)中之N-(1-氯哌啶-4-基)-4-(4-甲氧苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氯甲鹽(151 mg，0.445 mmol)懸浮液中，加入二丁基錫酮(13.84 mg，0.056 mmol)，接著加入疊氮三甲基矽烷(0.207 mL，1.557 mmol)。使該反應混合物在回流下加熱5個小時，之後在仍熱的時候過濾，依序以甲苯、二氯甲烷，最後乙醚清洗所產生之粉紅色固狀物。使該固狀物從甲醇中再結晶出來，產生呈淡粉紅色固體狀之產物(100 mg，56%)。

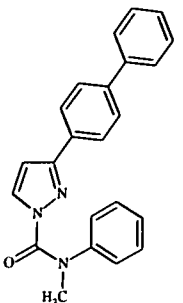
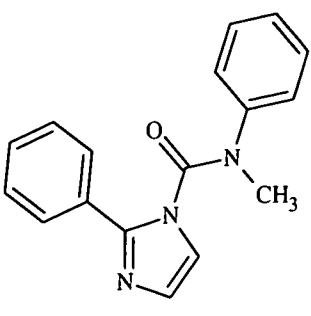
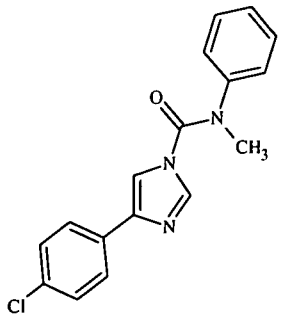
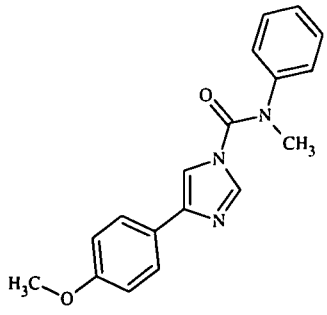
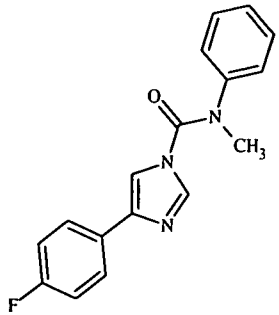
2. 範例化合物

編號	結構
1	
2	
3	
4	

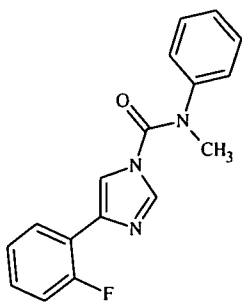
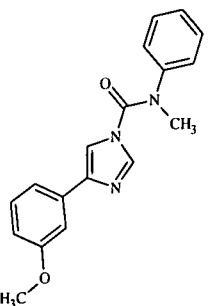
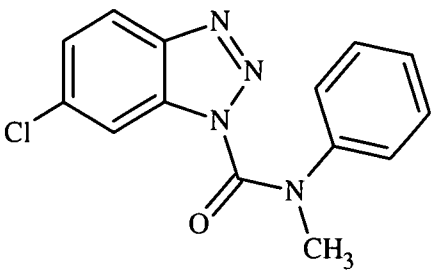
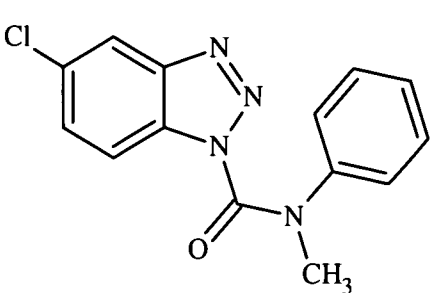
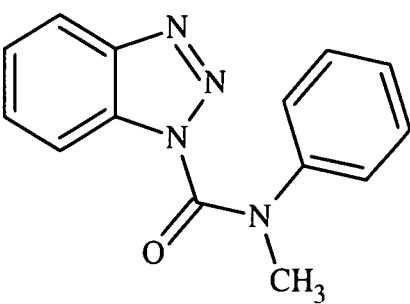
5	
6	
7	
8	
9	

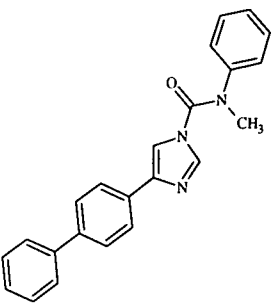
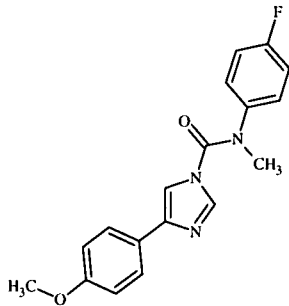
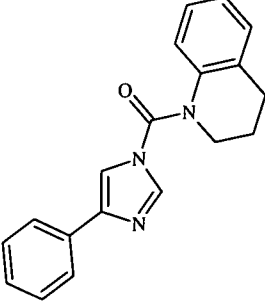
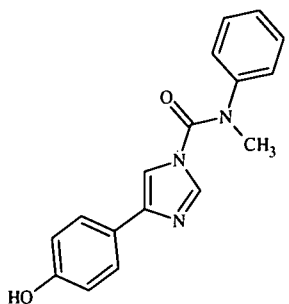
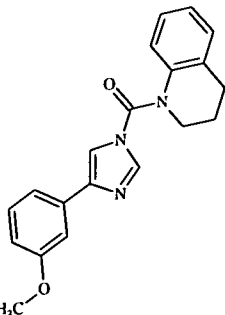


20	
21	
22	
23	
24	

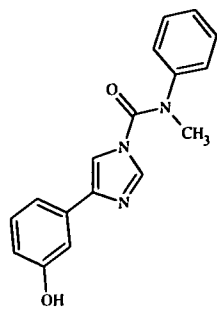
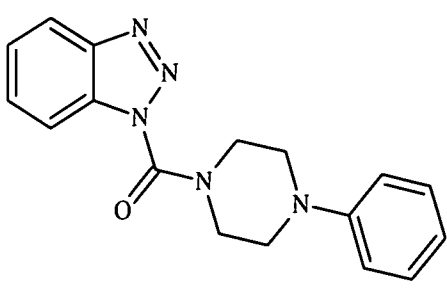
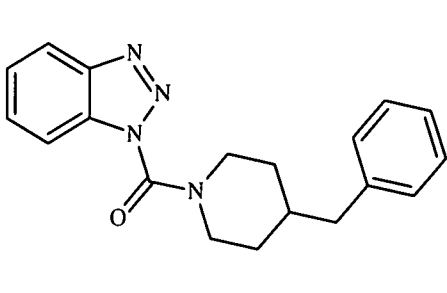
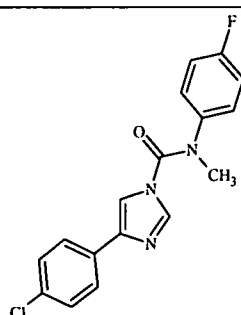
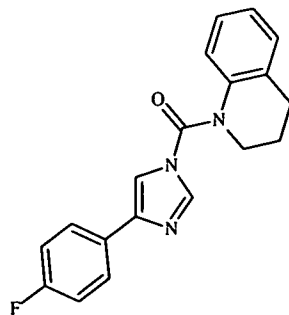
25	
26	
27	
28	
29	

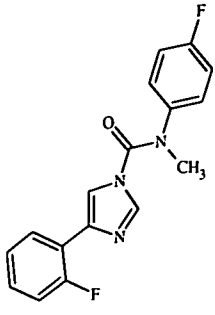
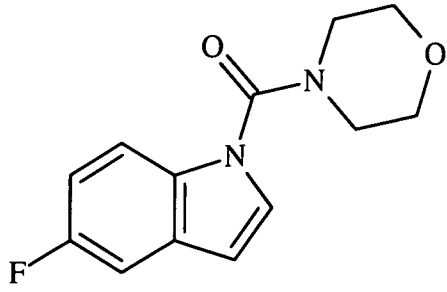
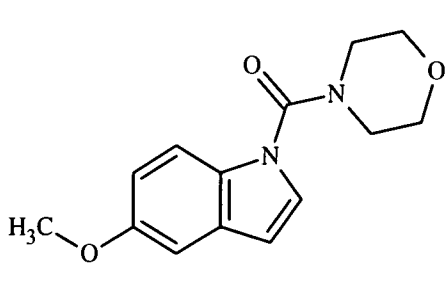
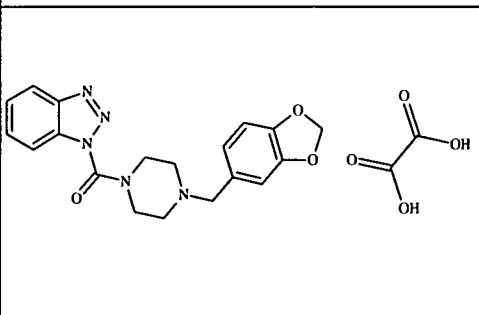
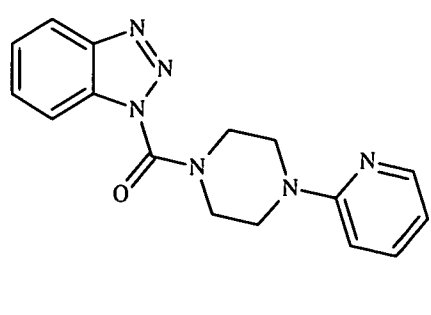


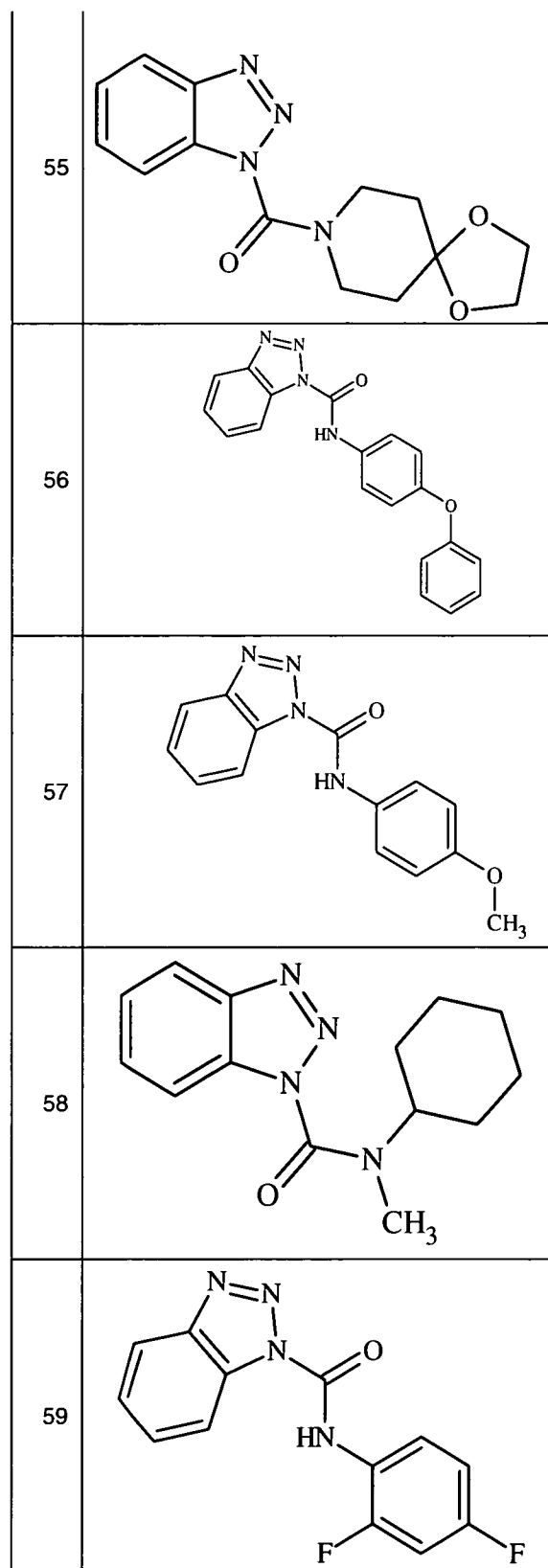
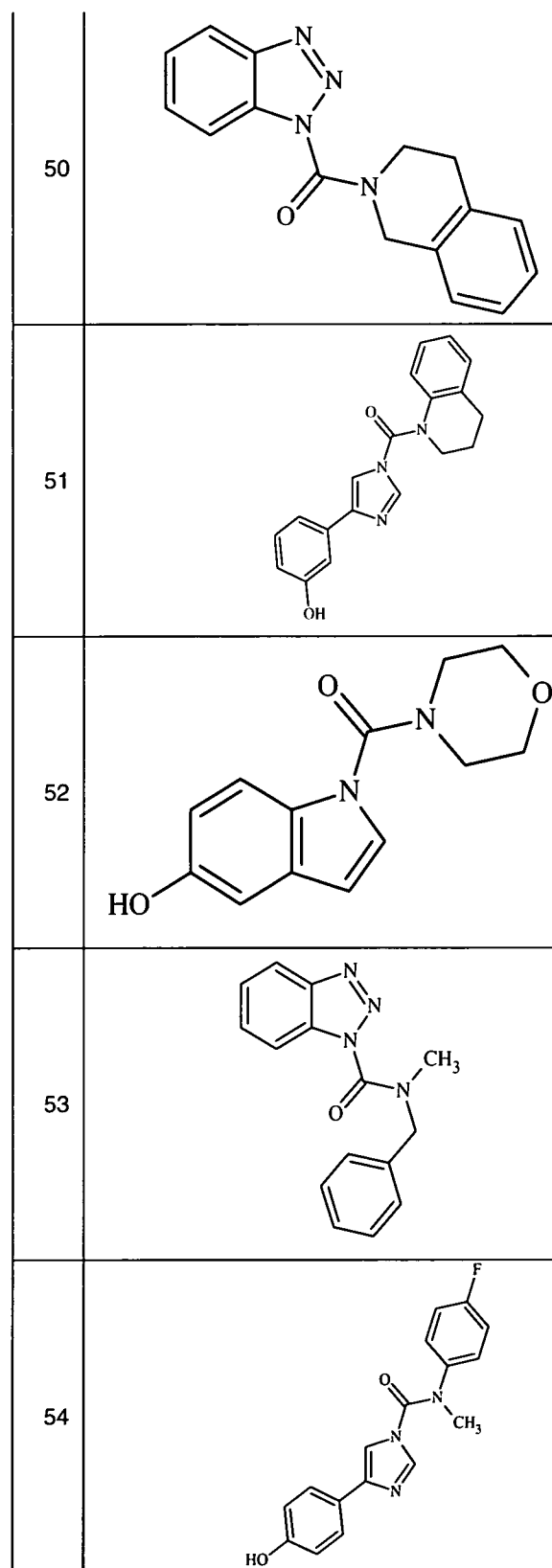
30	
31	
32	
33	
34	

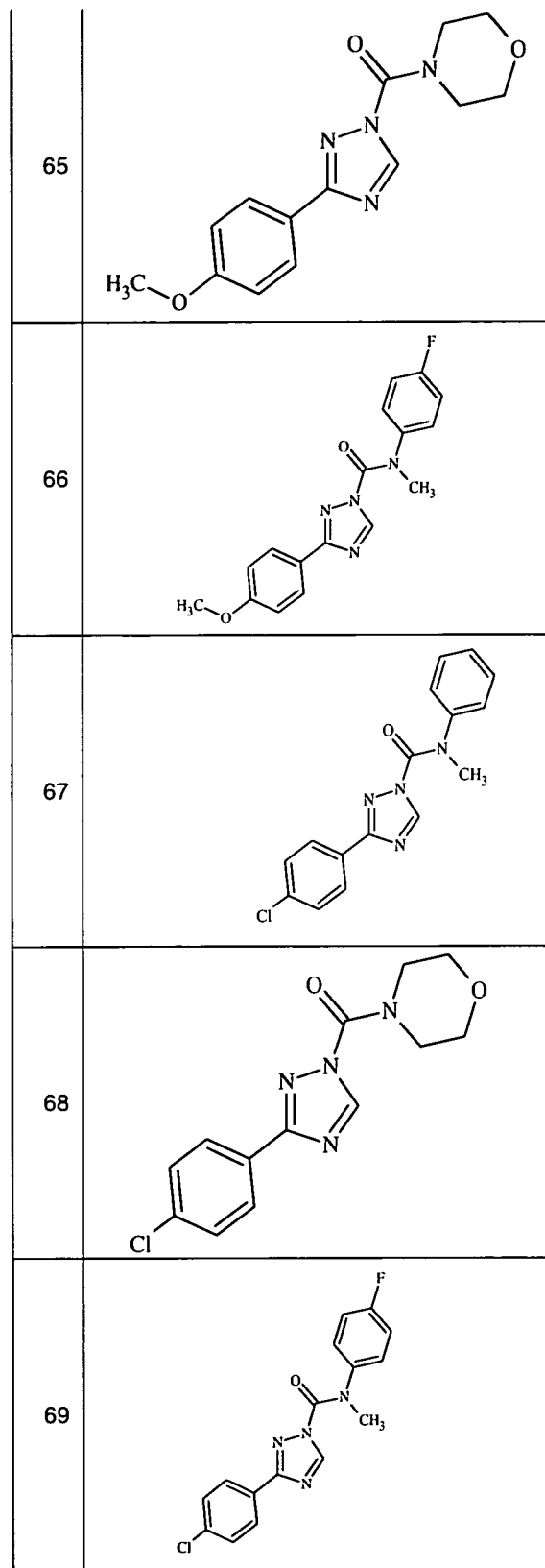
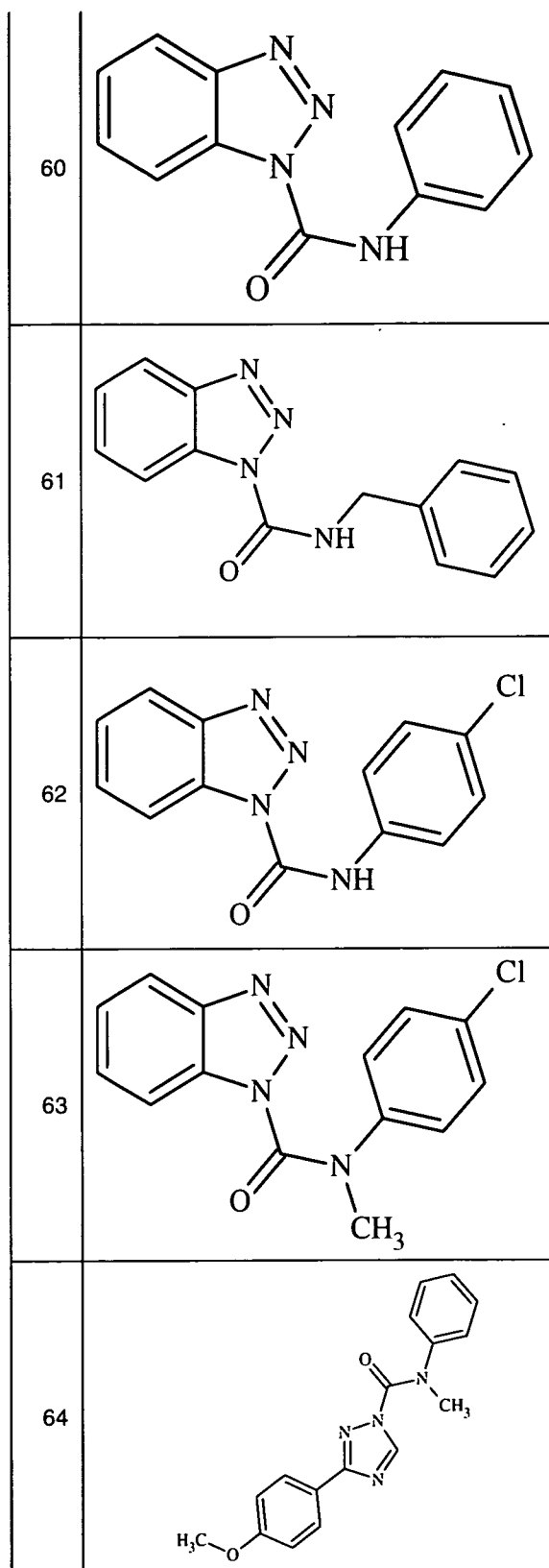
35	
36	
37	
38	
39	

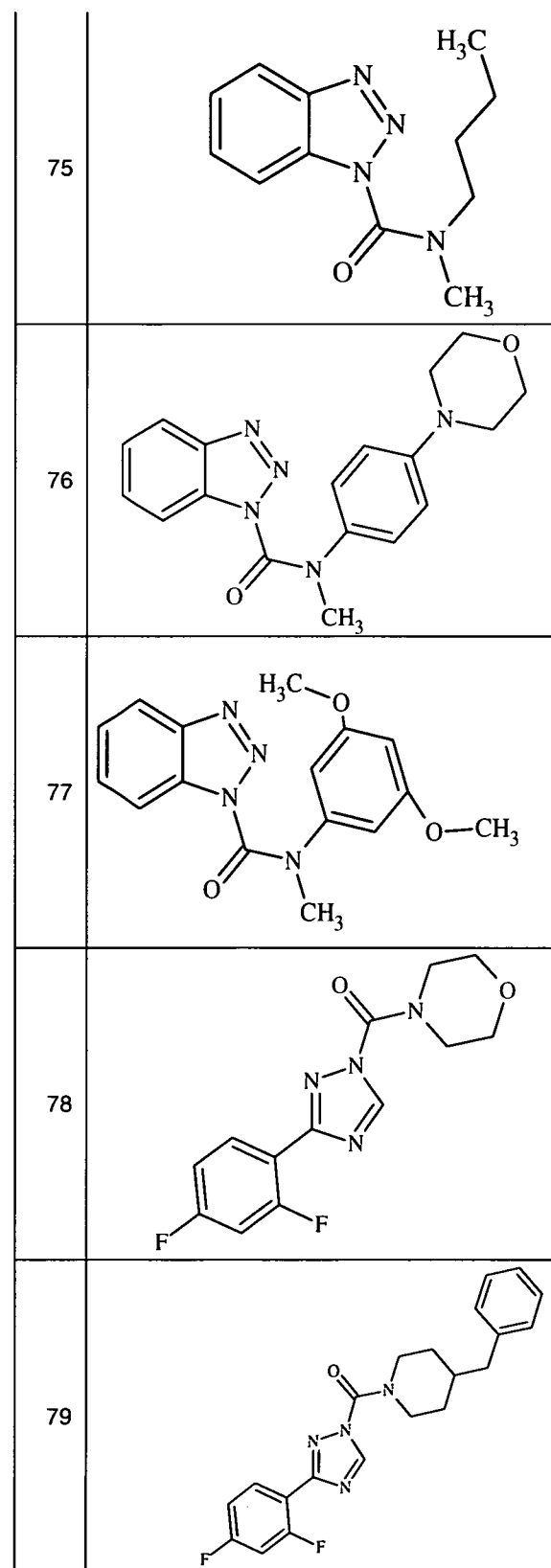
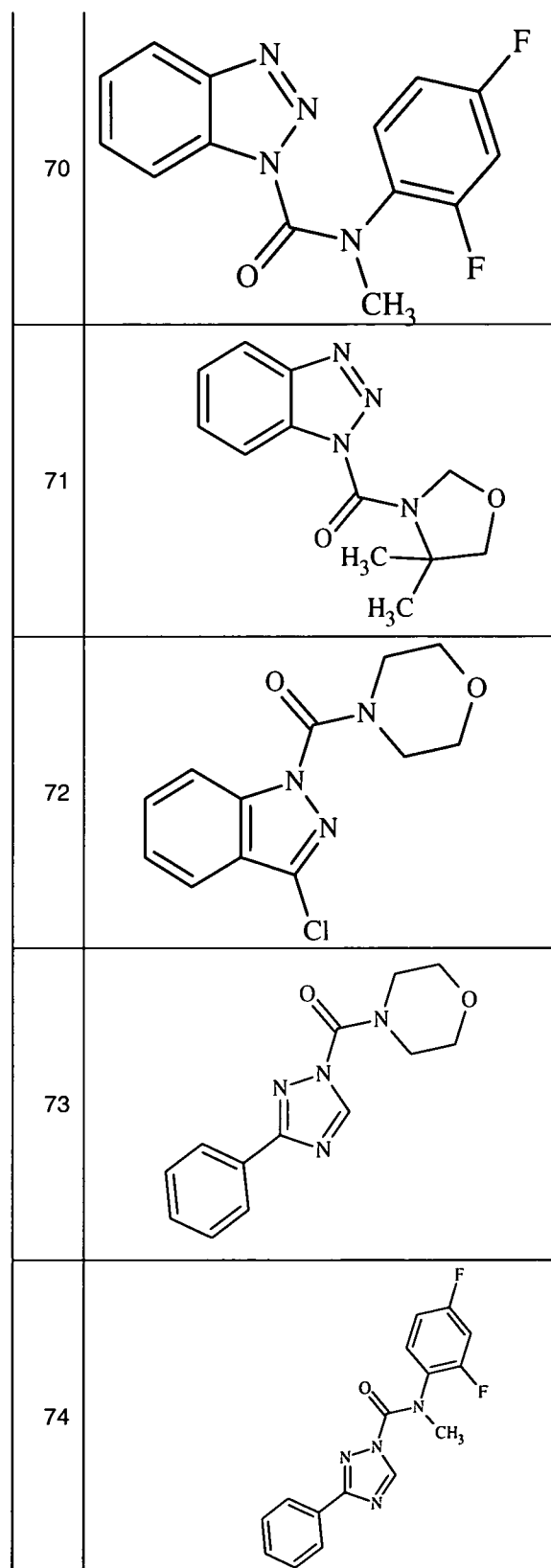


40	
41	
42	
43	
44	

45	
46	
47	
48	
49	

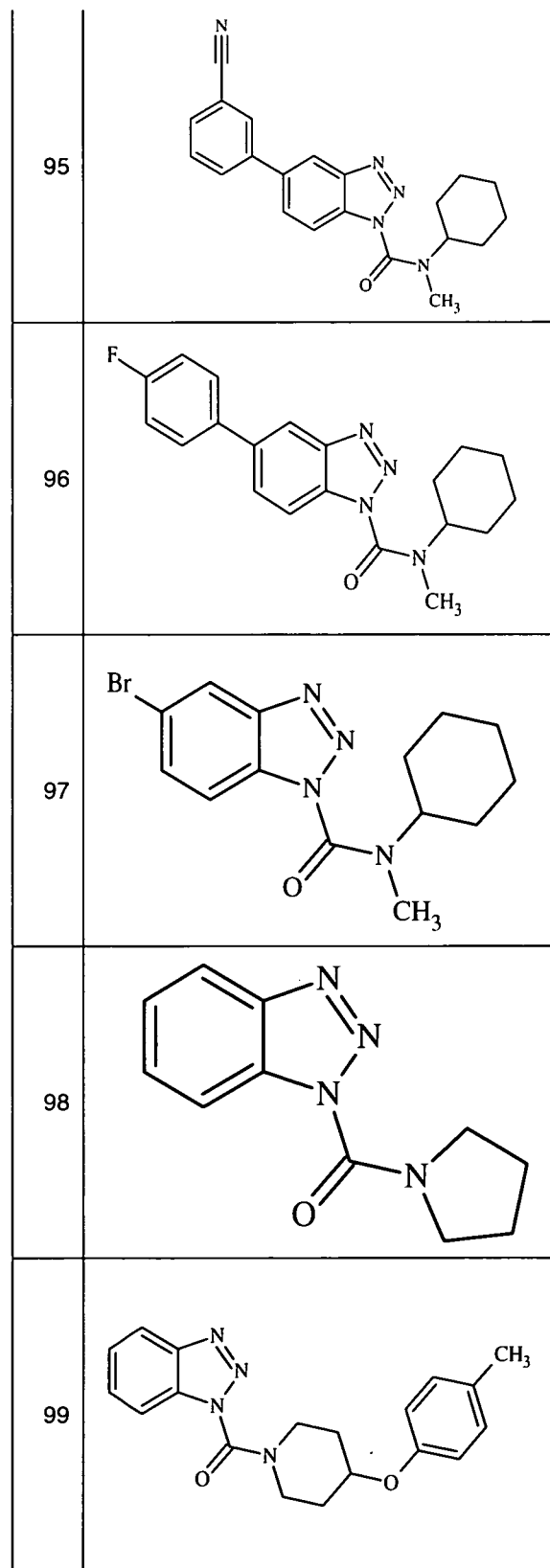
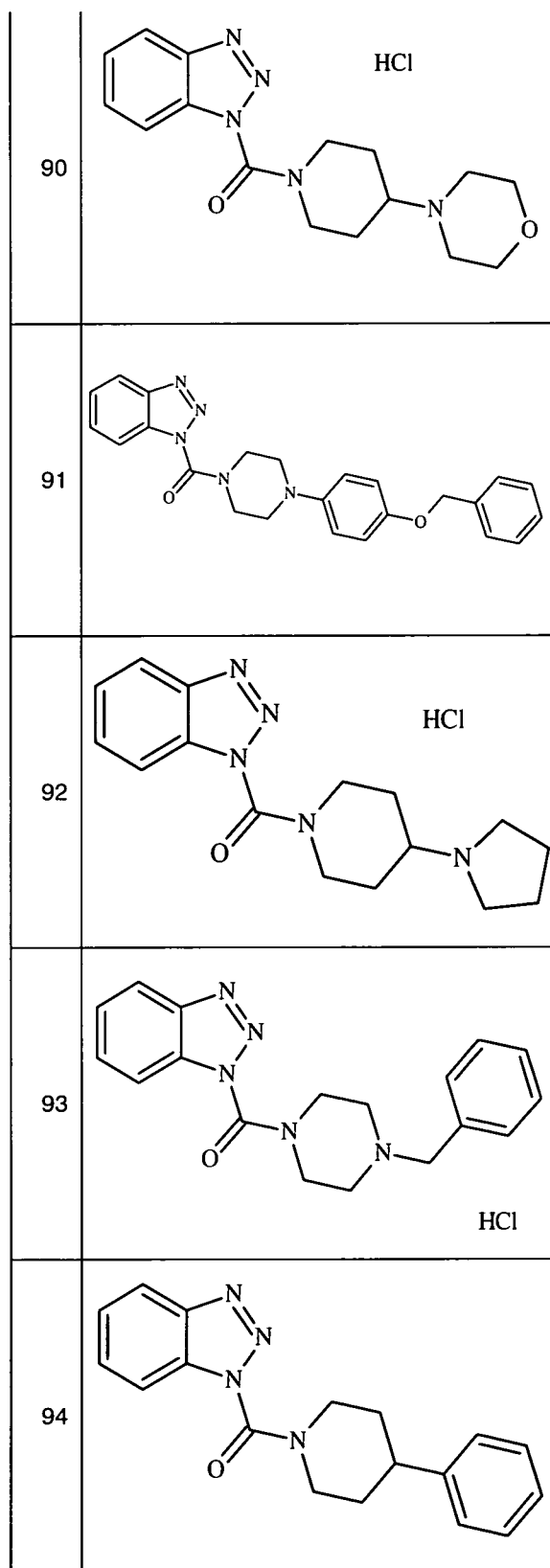


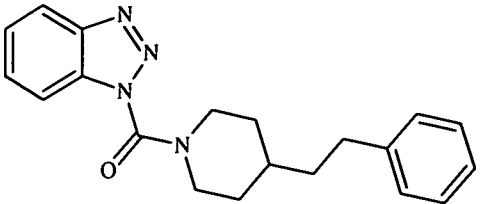
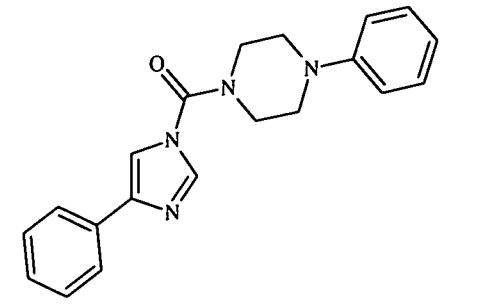
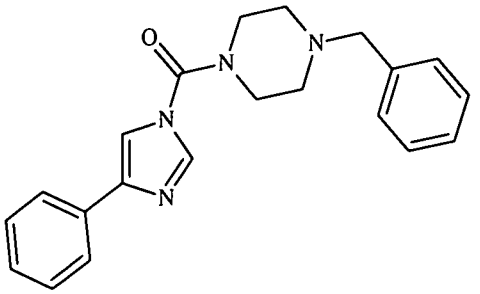
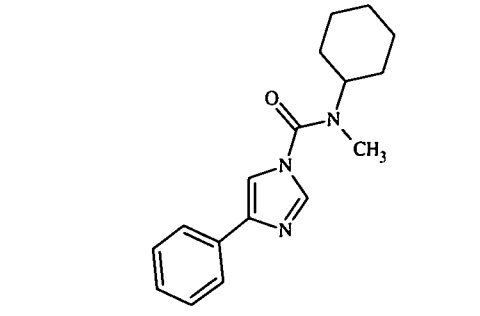
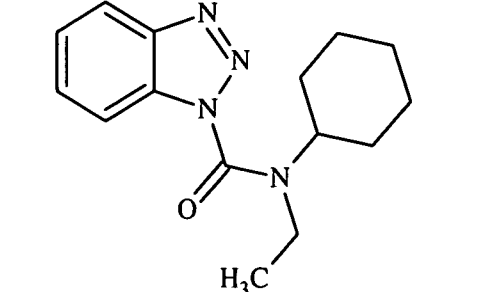


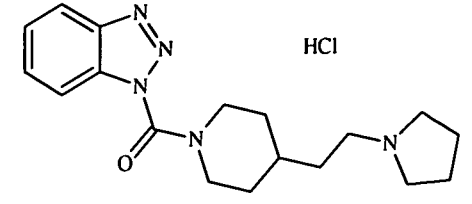
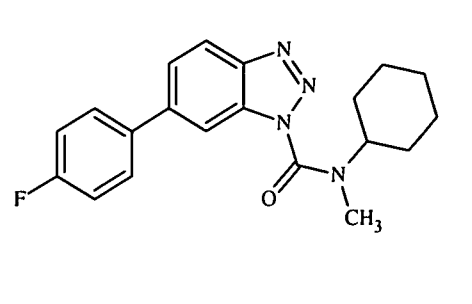
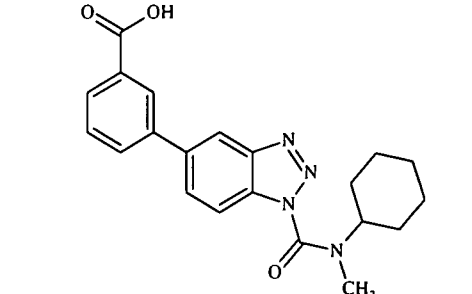
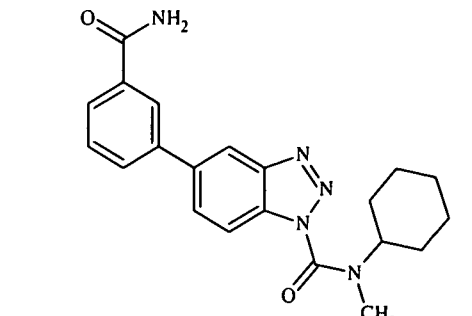
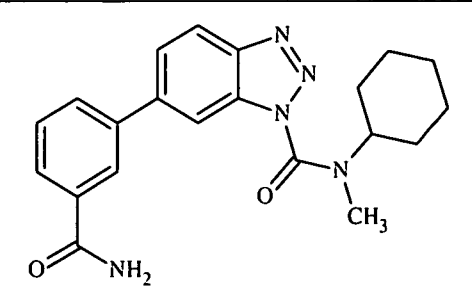


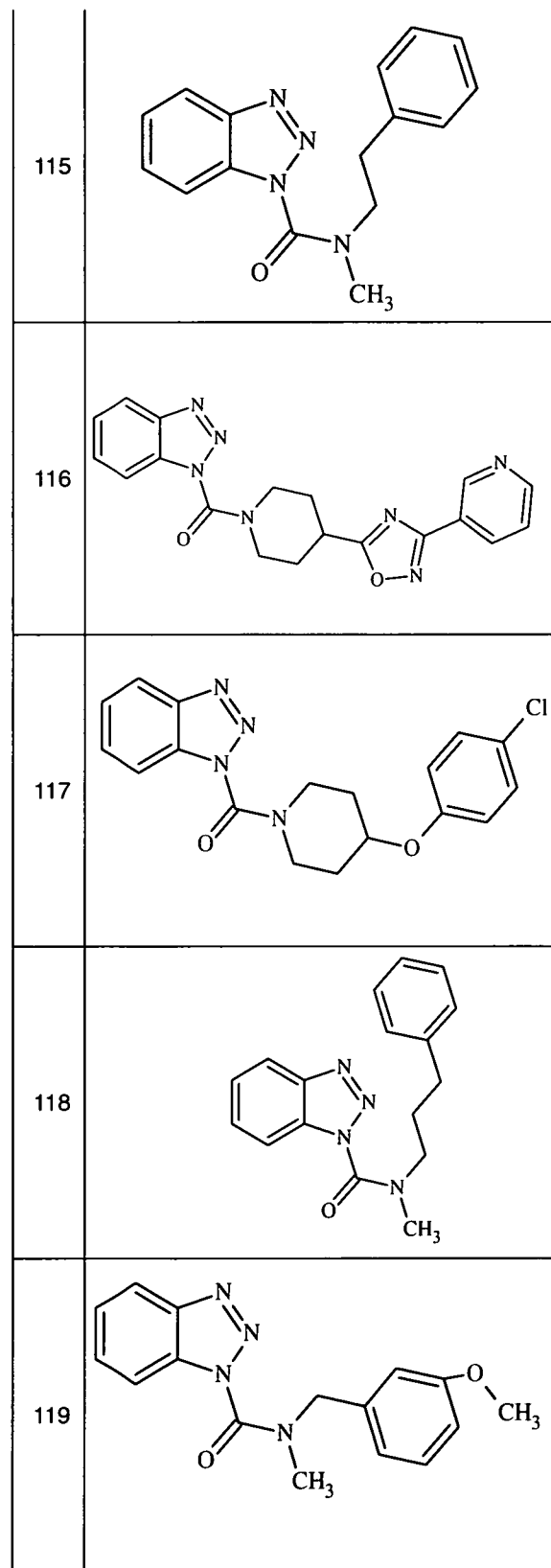
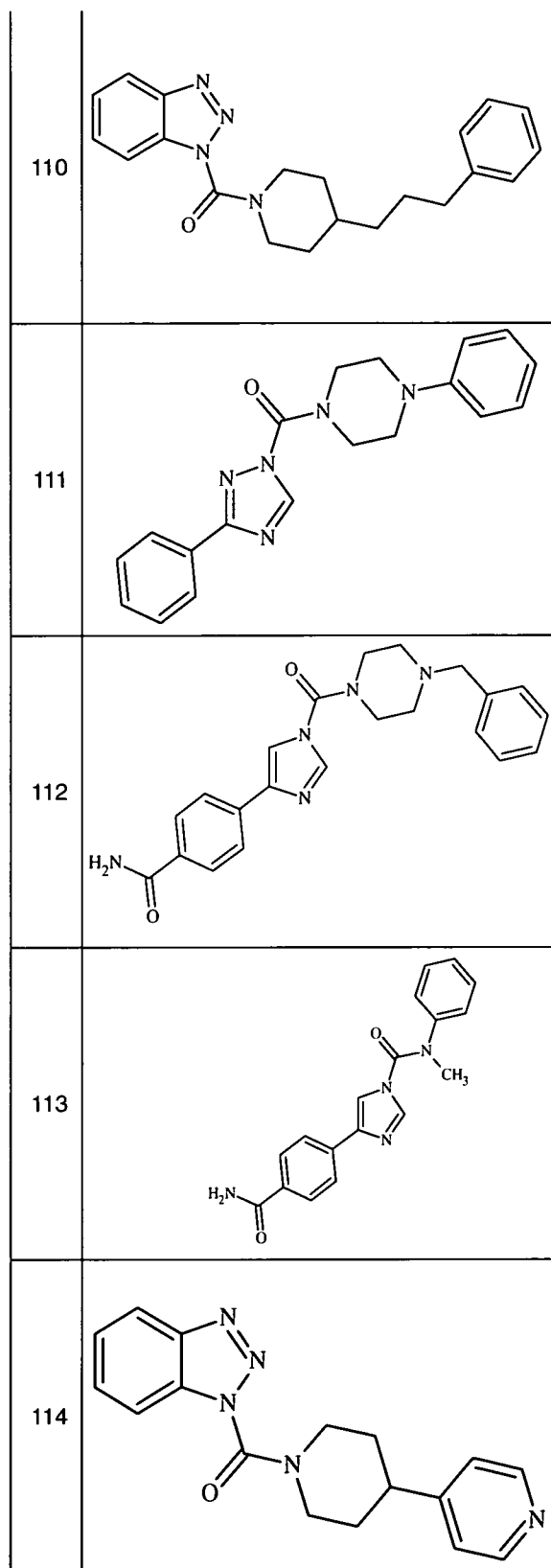
80	
81	
82	
83	
84	

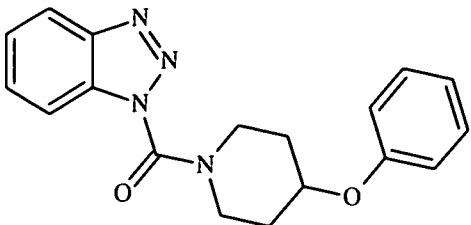
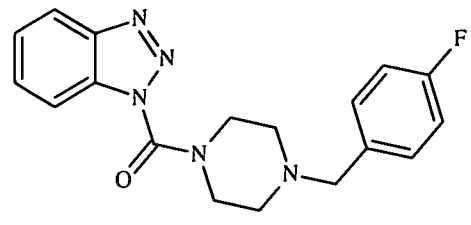
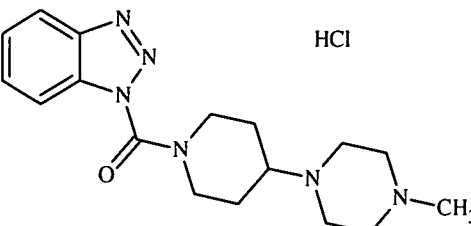
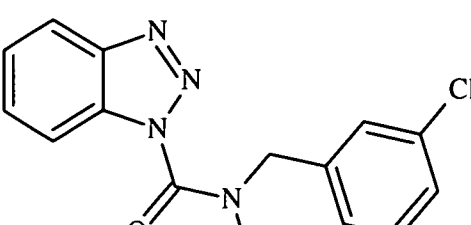
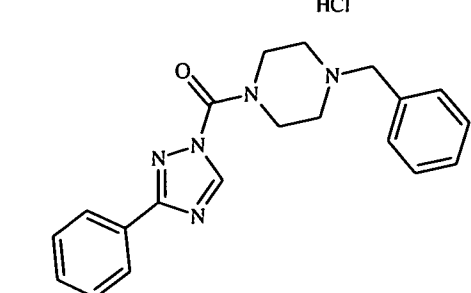
85	
86	
87	
88	
89	

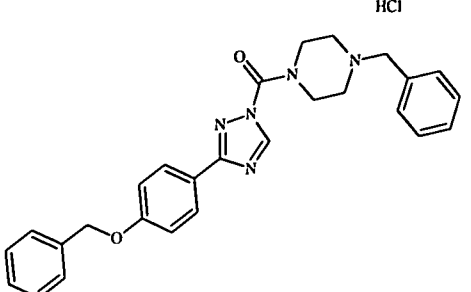
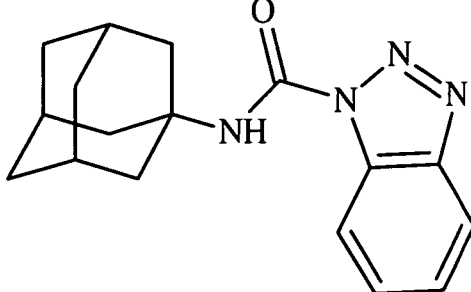
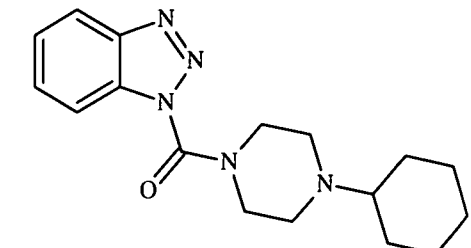
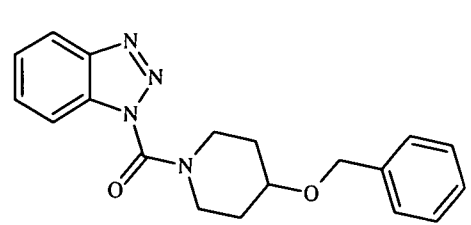
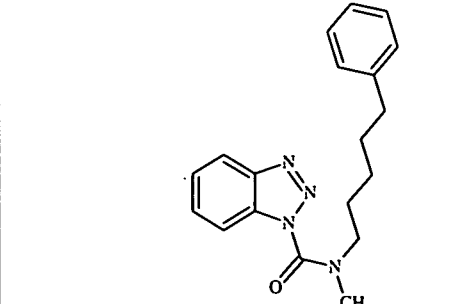


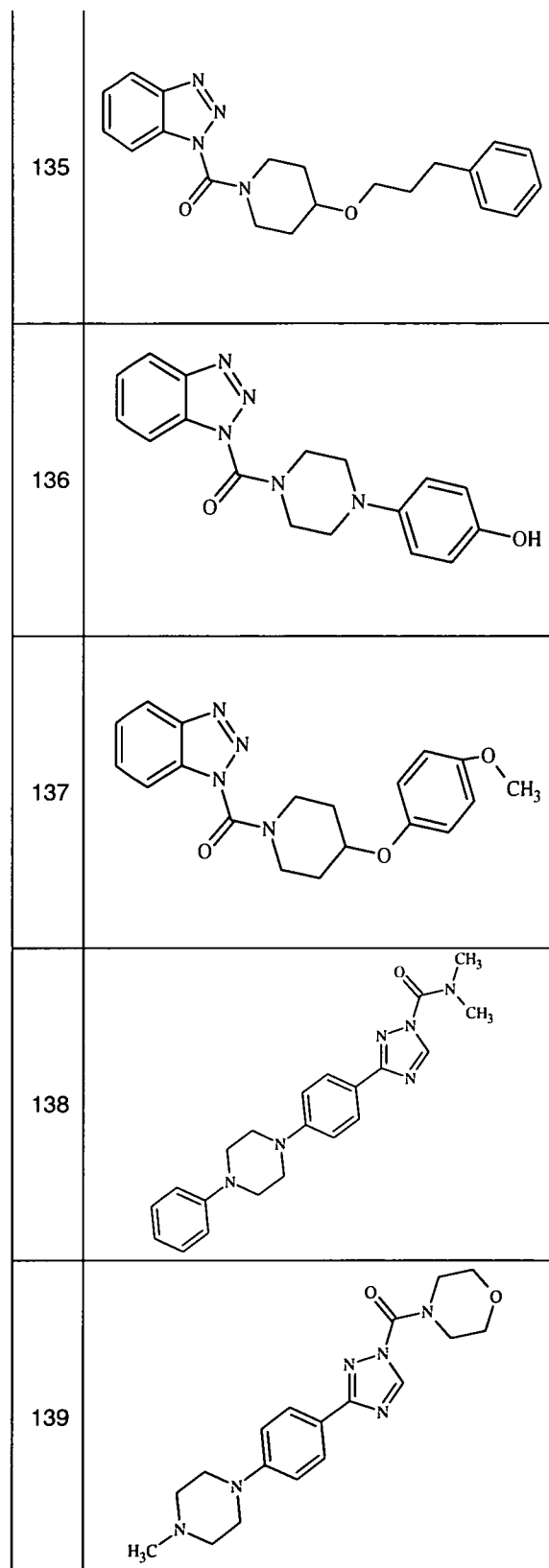
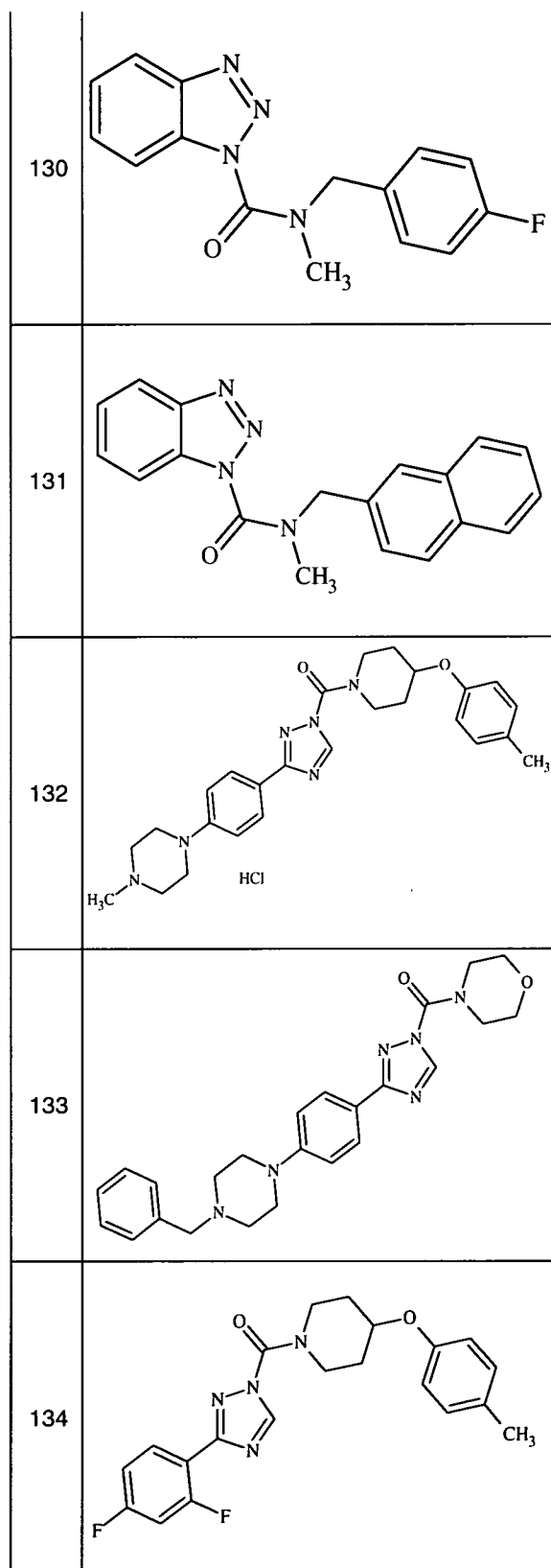
100	
101	
102	
103	
104	

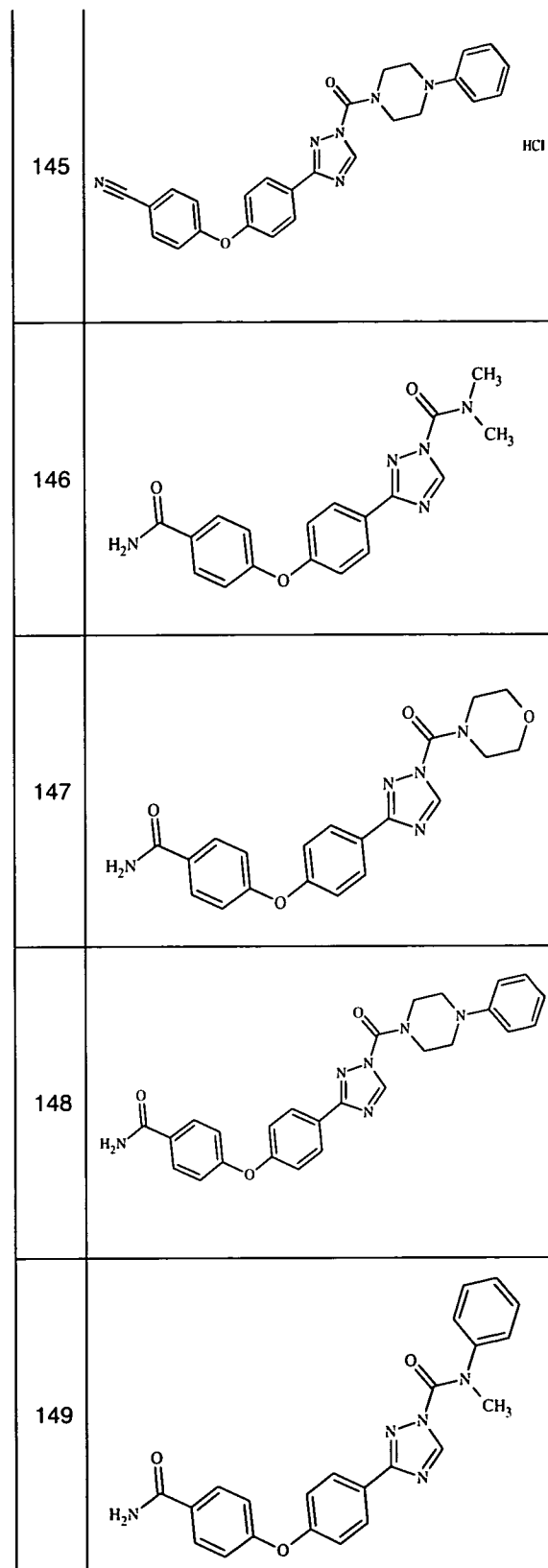
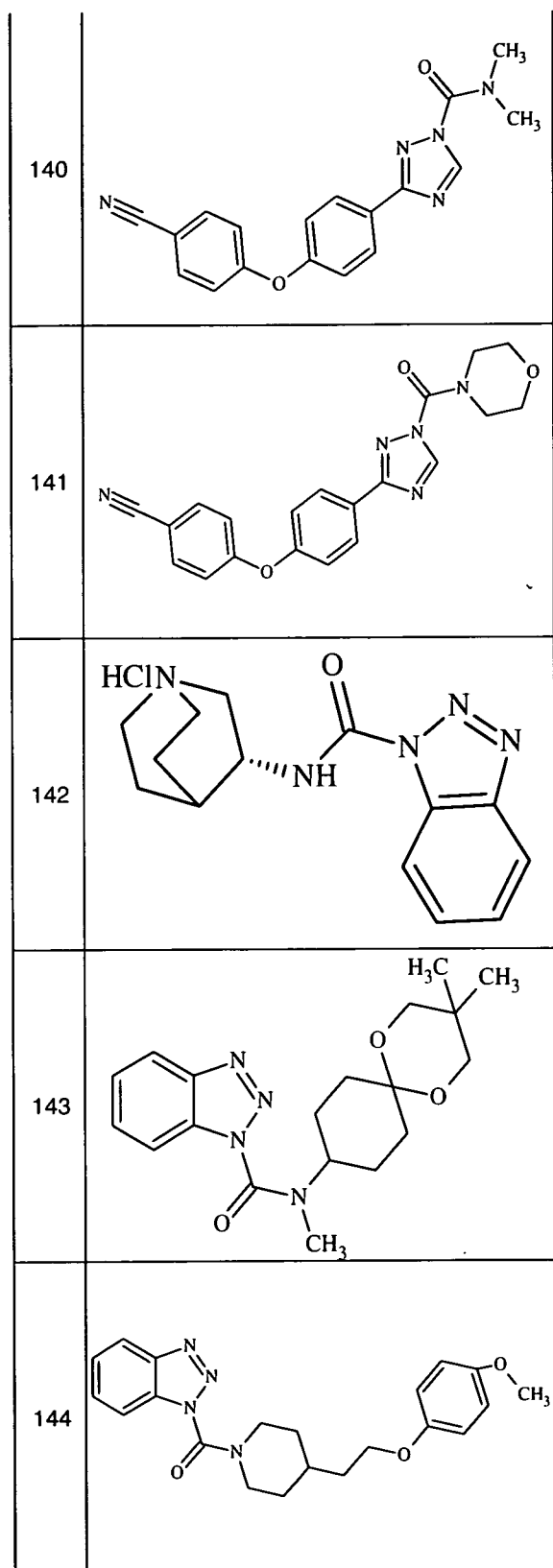
105	 HCl
106	
107	
108	
109	

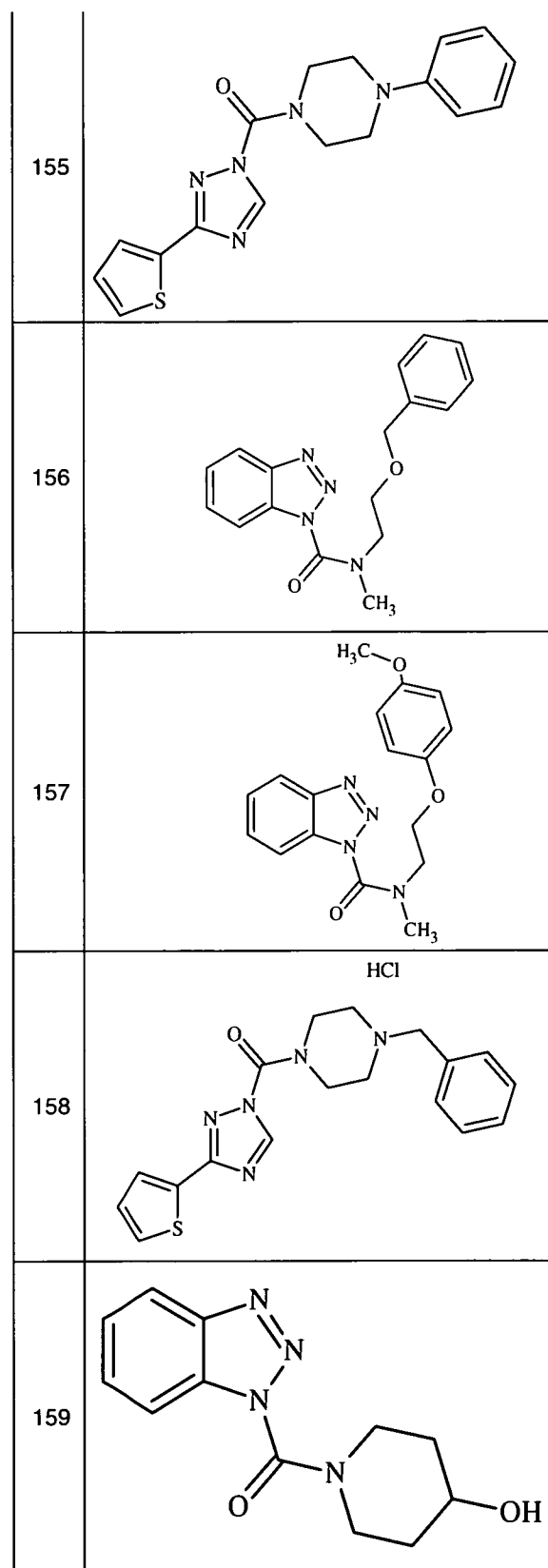
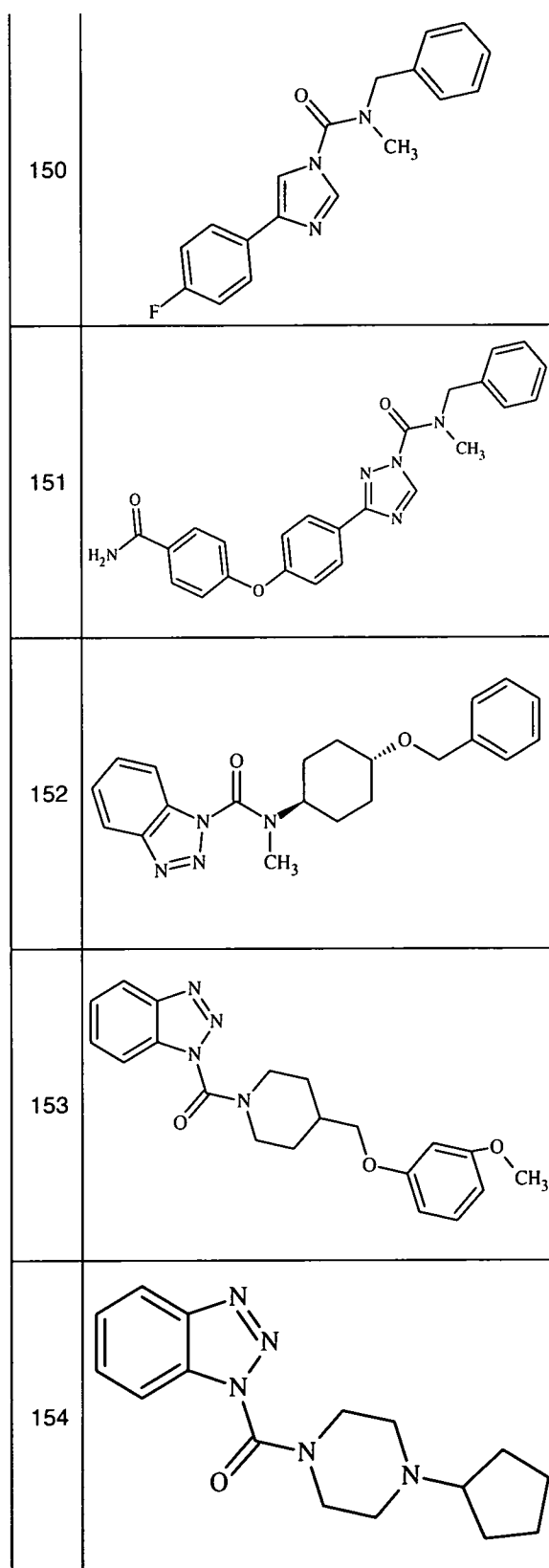


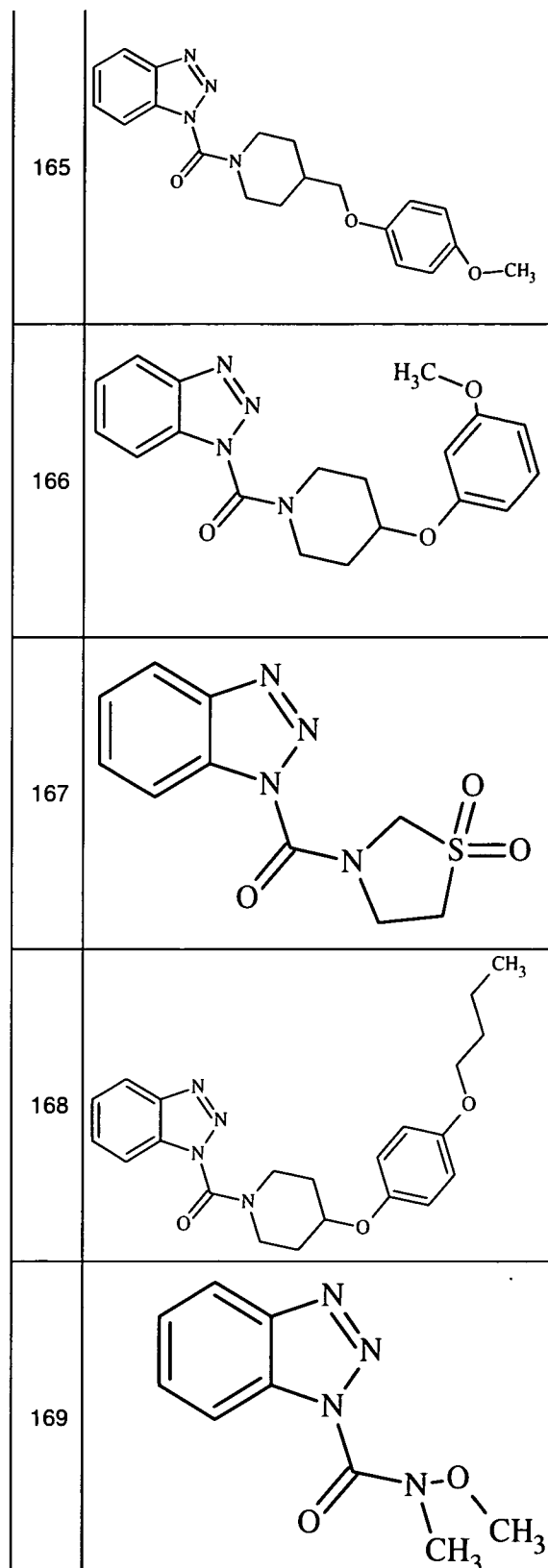
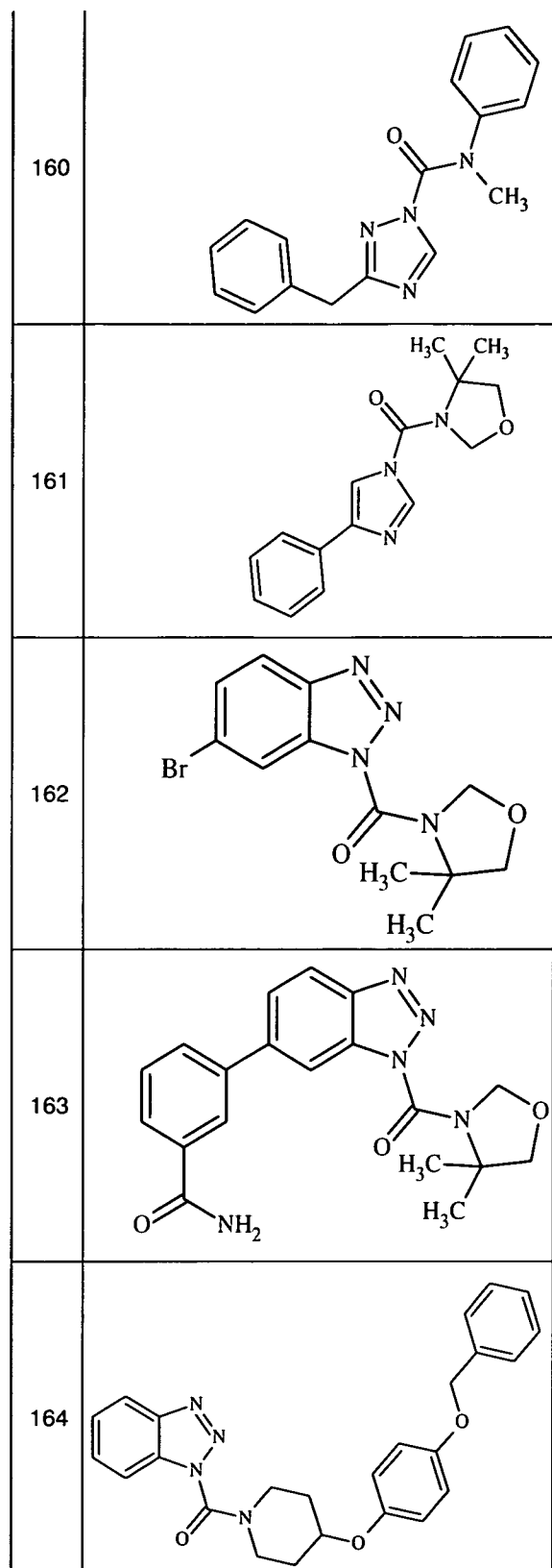
120	
121	
122	
123	
124	

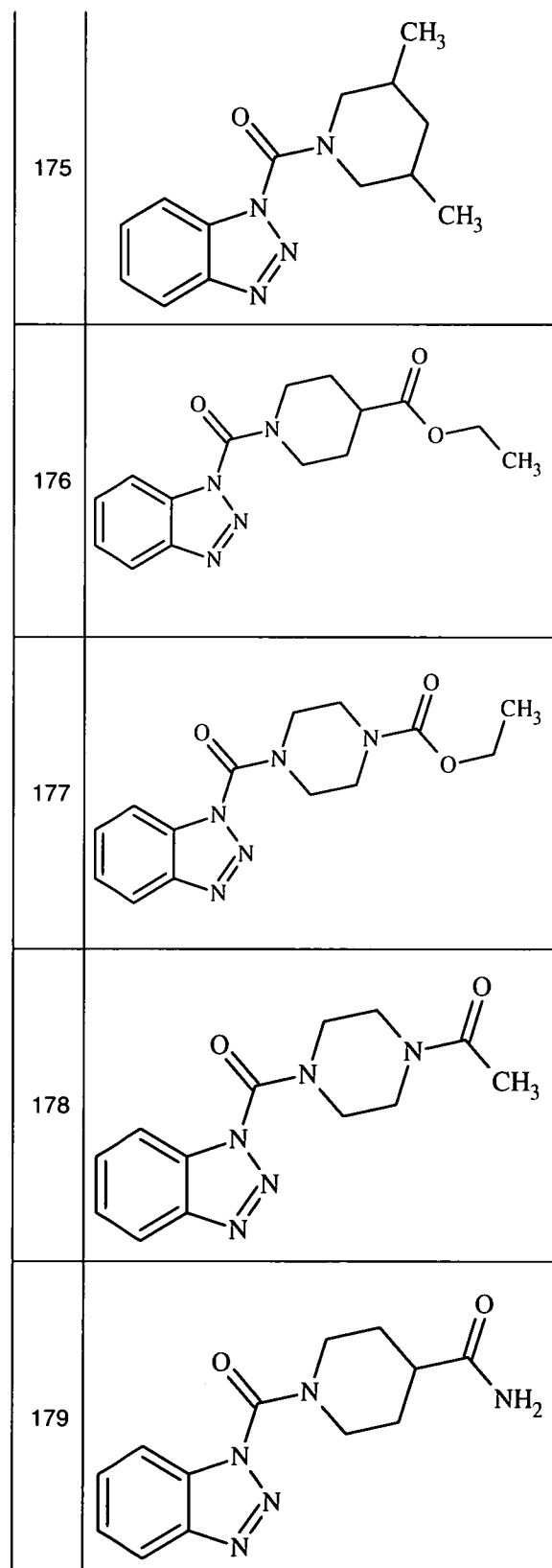
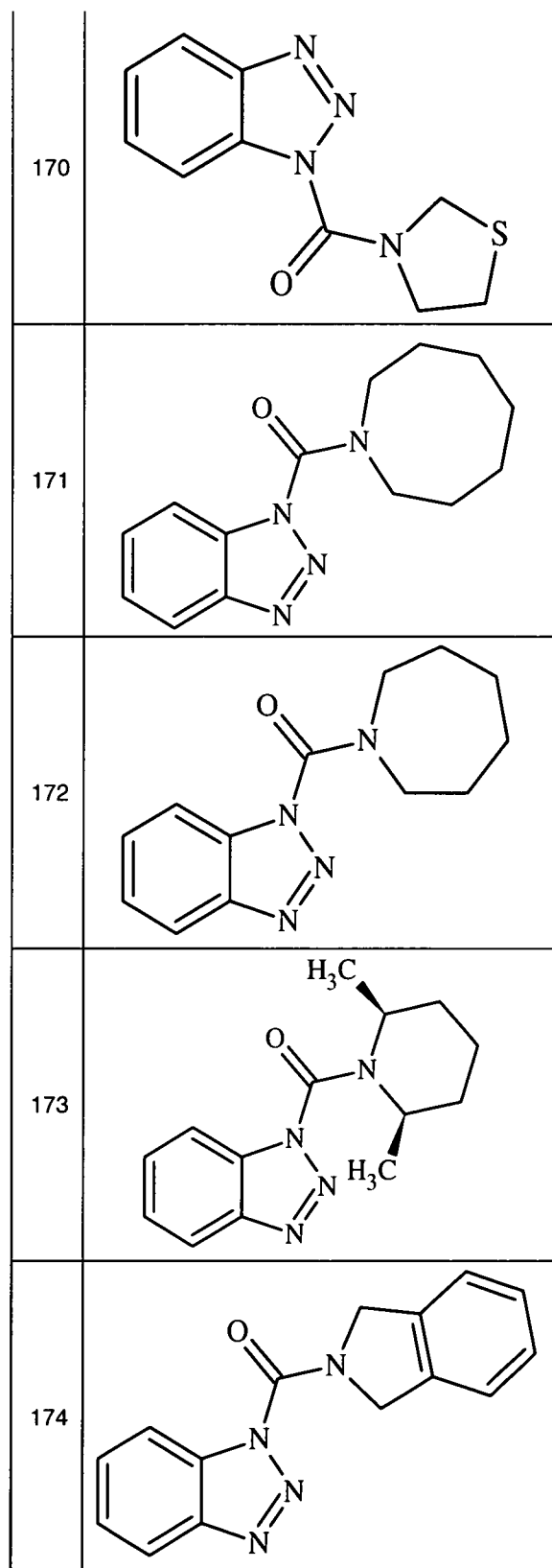
125	
126	
127	
128	
129	

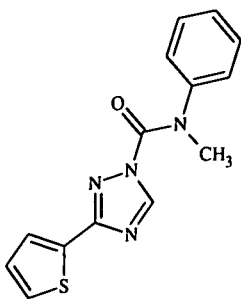
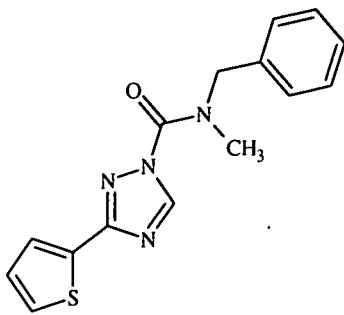
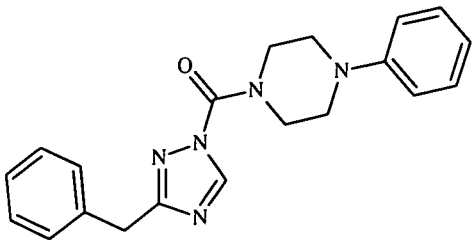
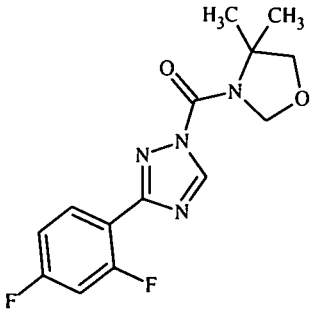
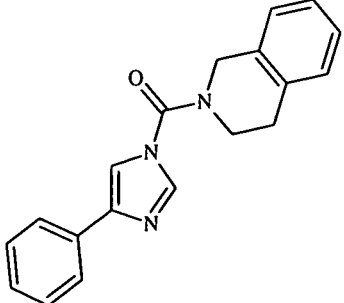


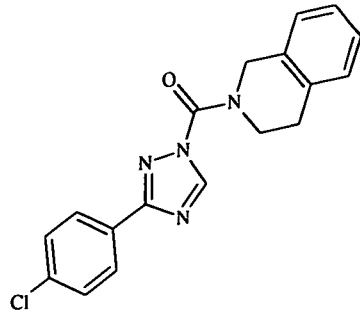
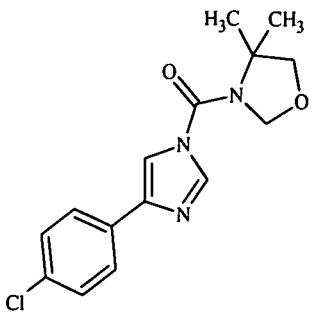
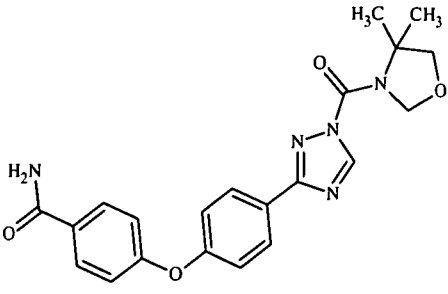
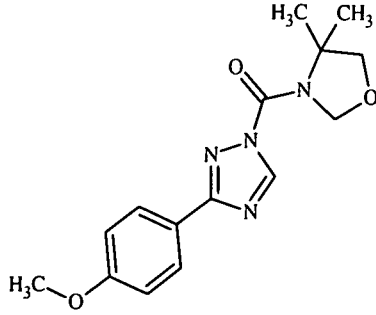
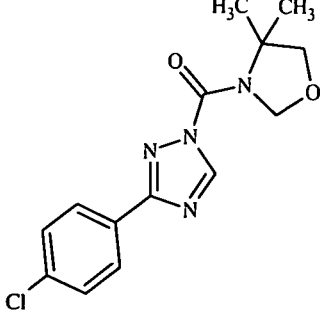


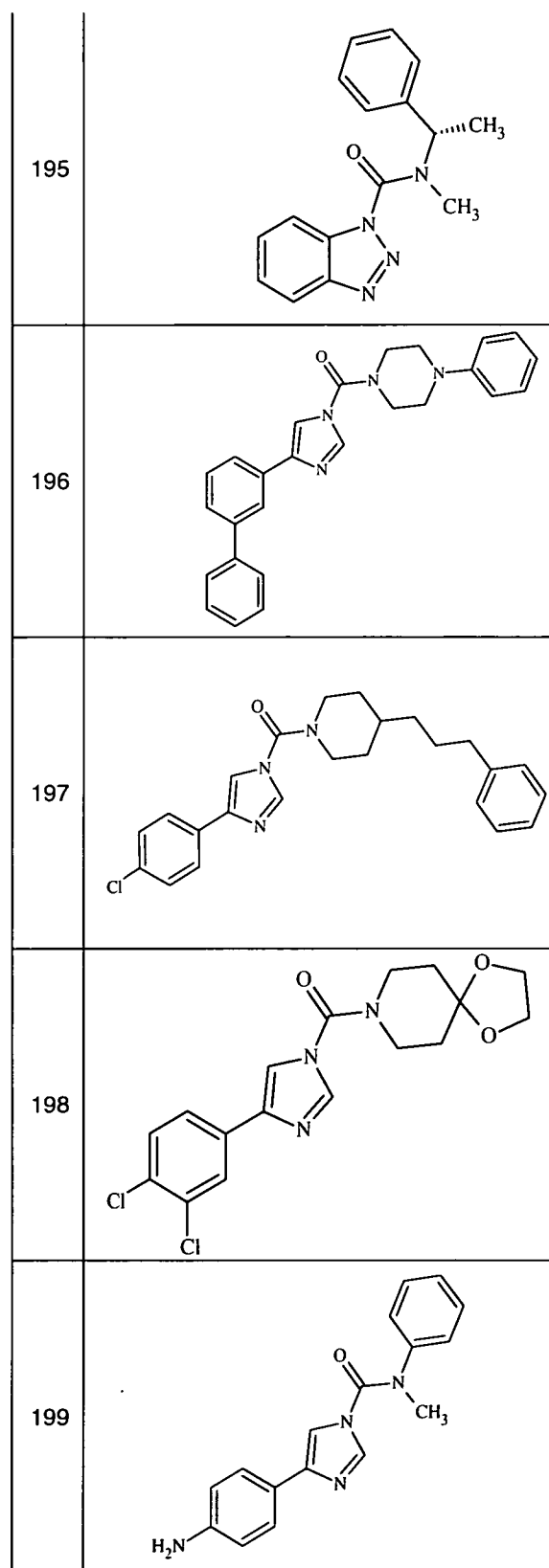
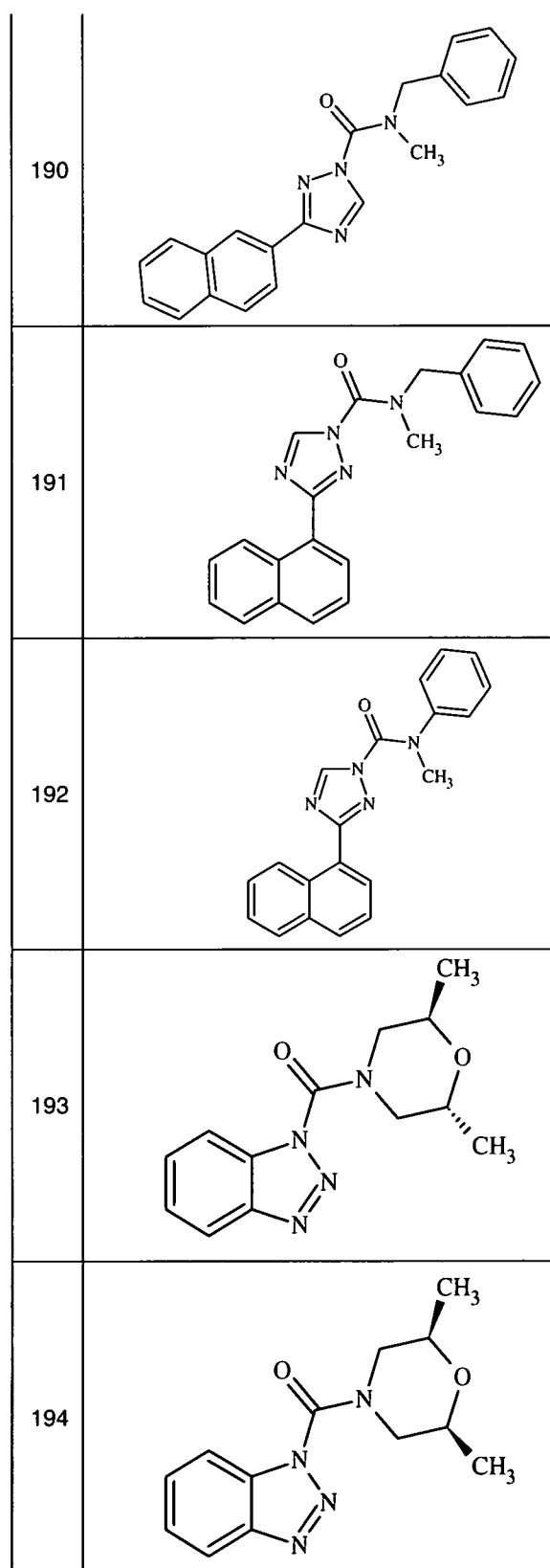




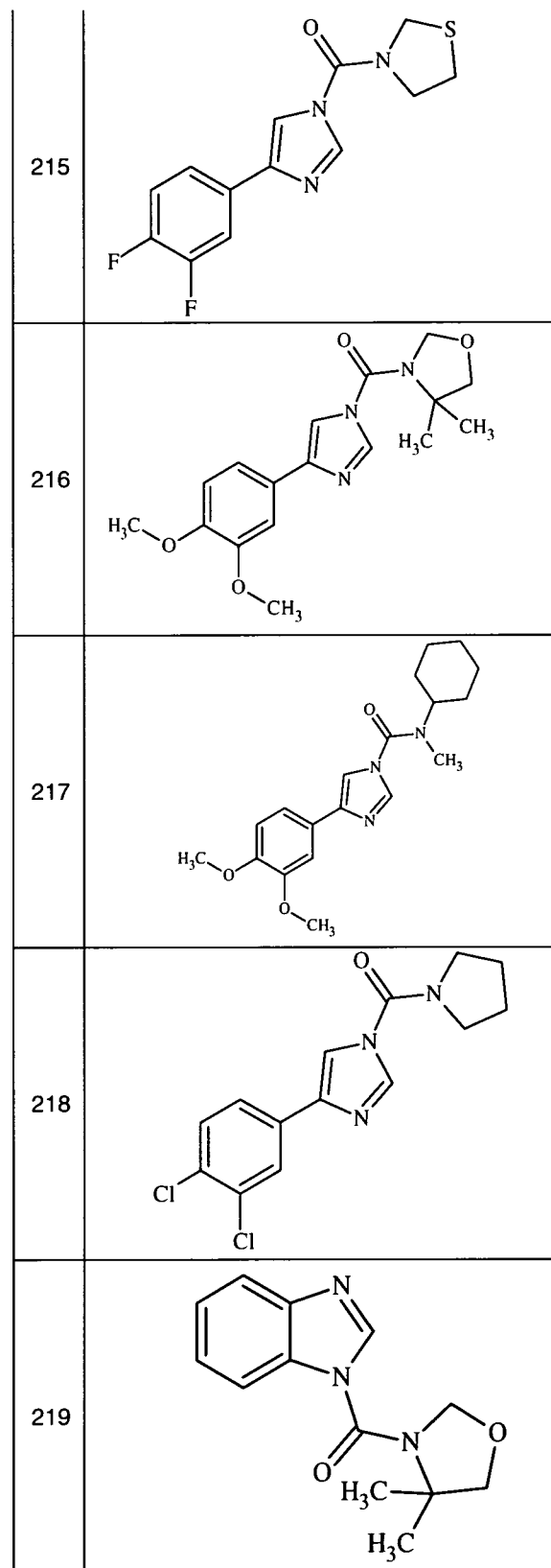
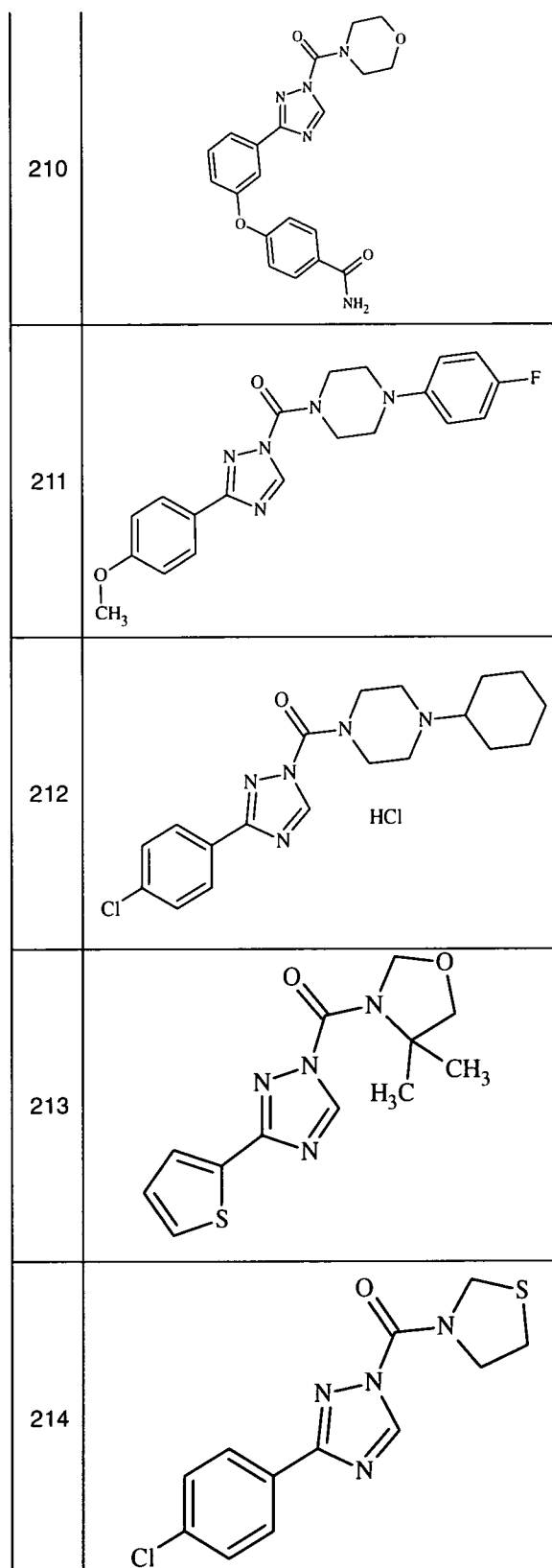


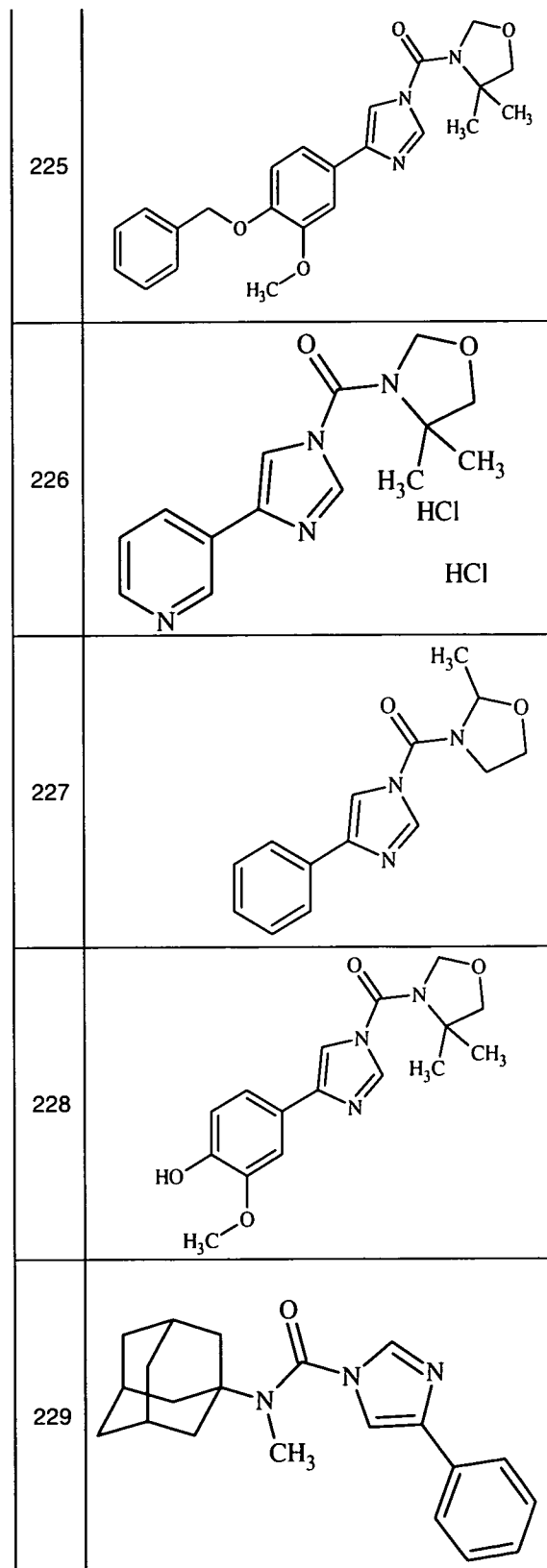
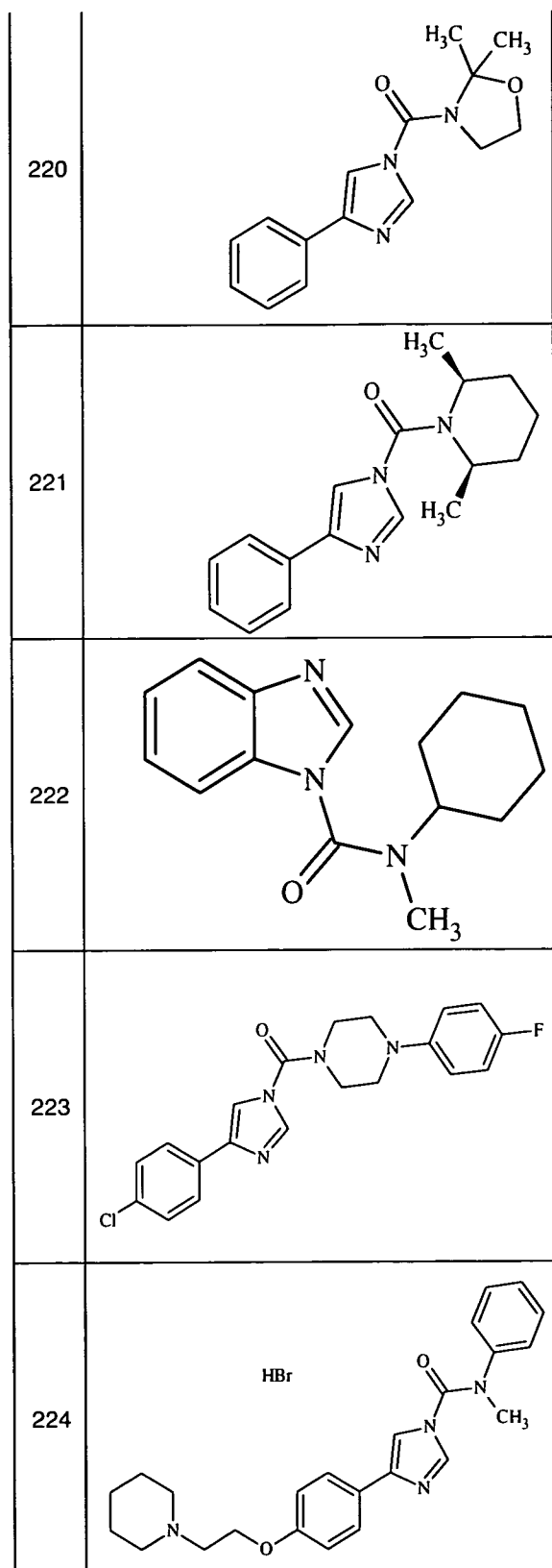
180	
181	
182	
183	
184	

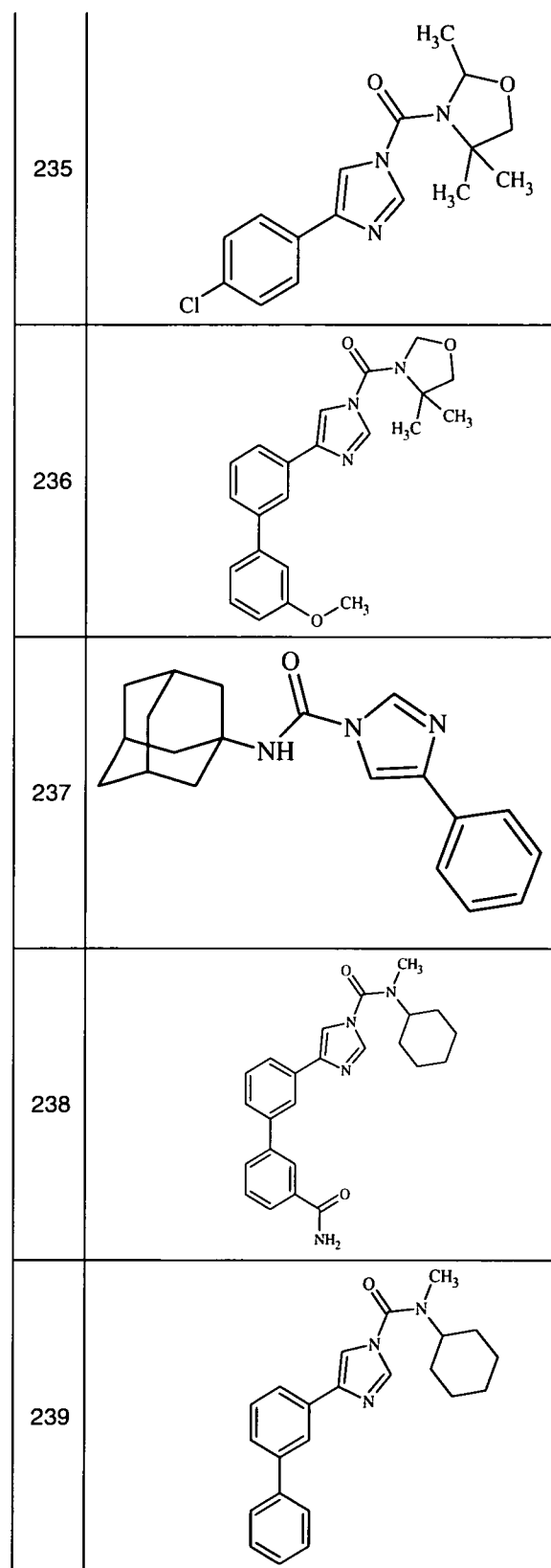
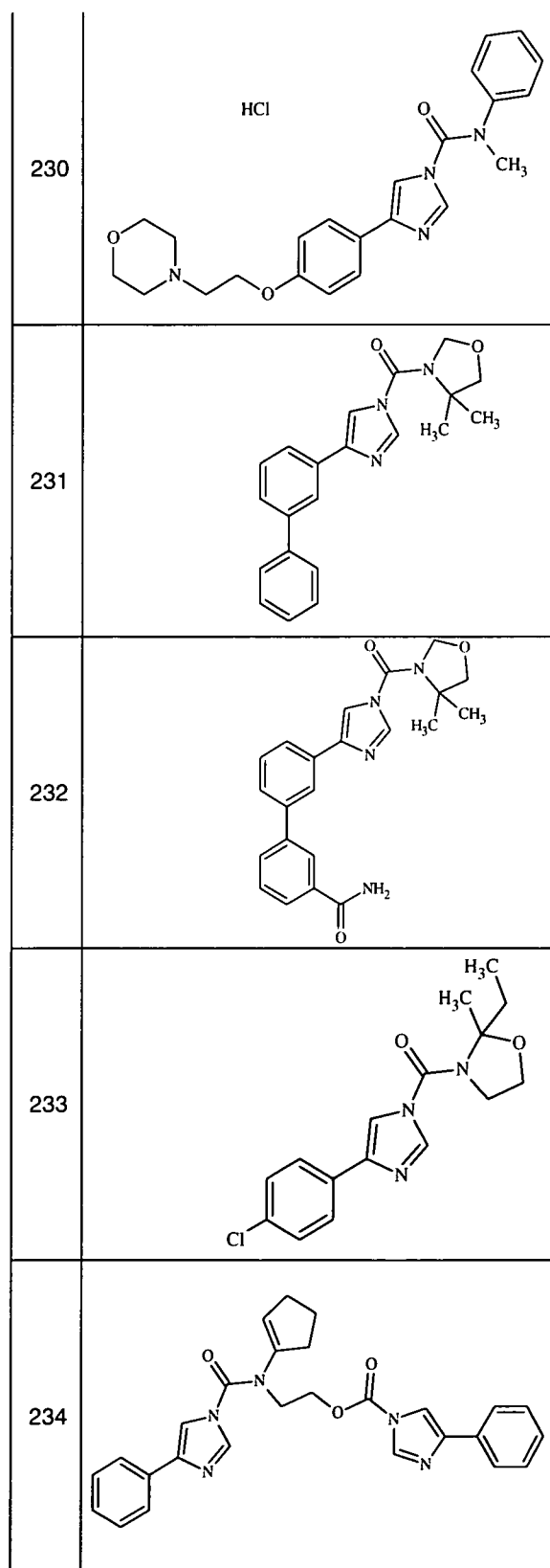
185	
186	
187	
188	
189	

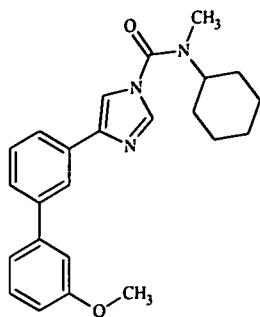
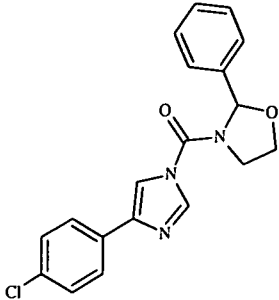
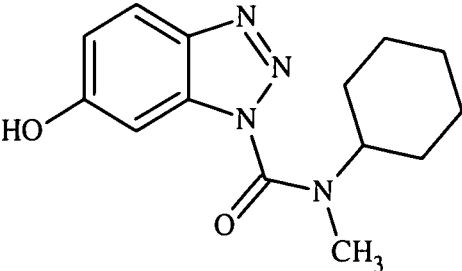
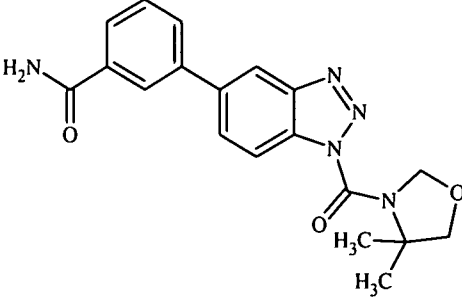
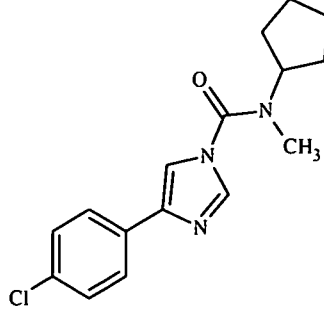


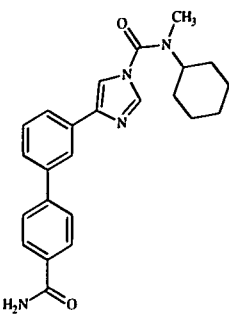
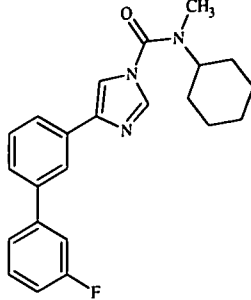
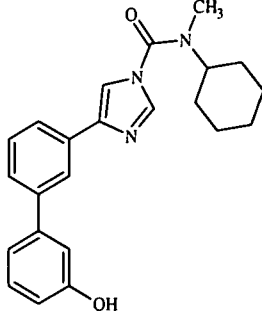
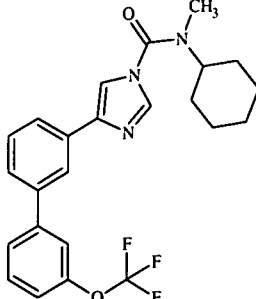
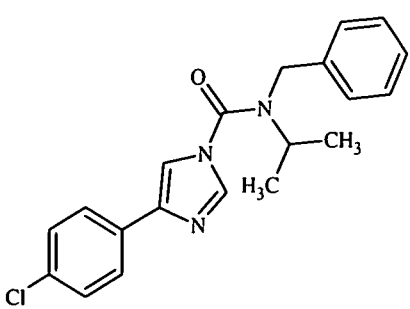
205	
206	
207	
208	
209	







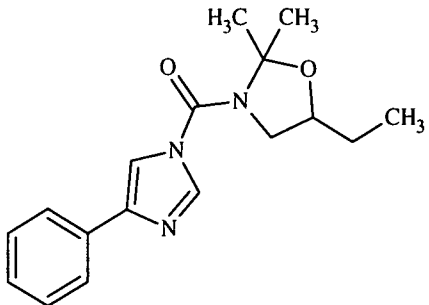
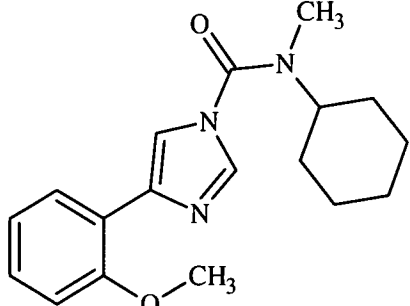
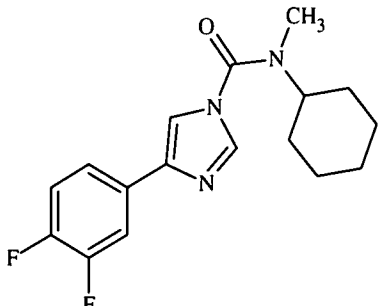
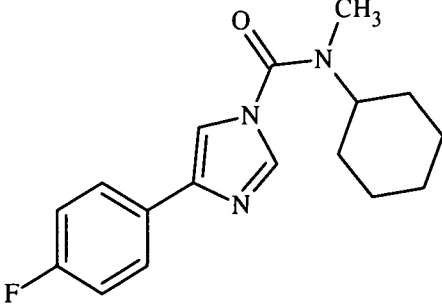
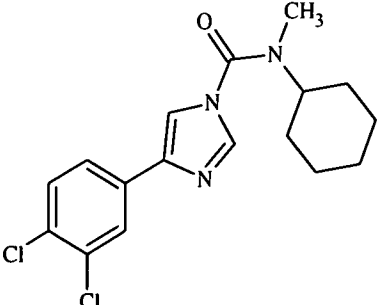
240	
241	
242	
243	
244	

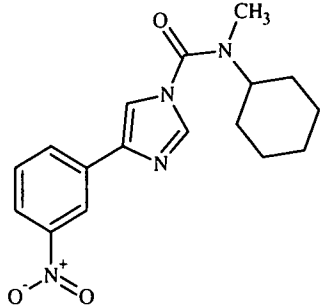
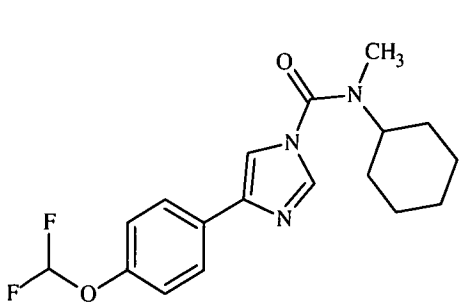
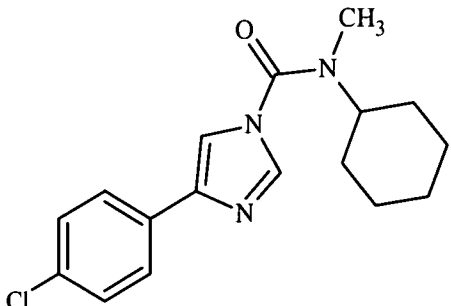
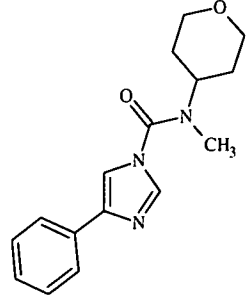
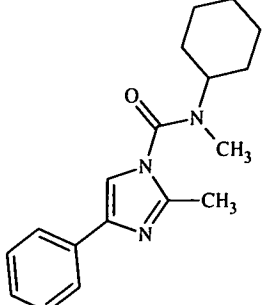
245	
246	
247	
248	
249	

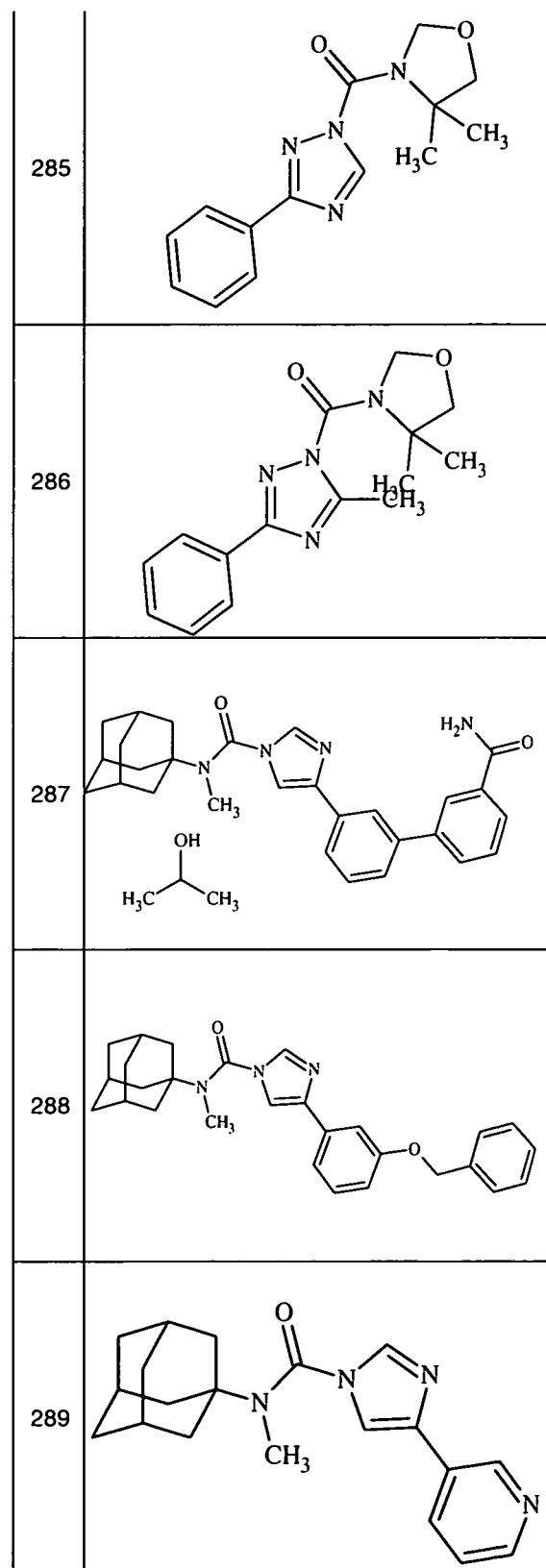
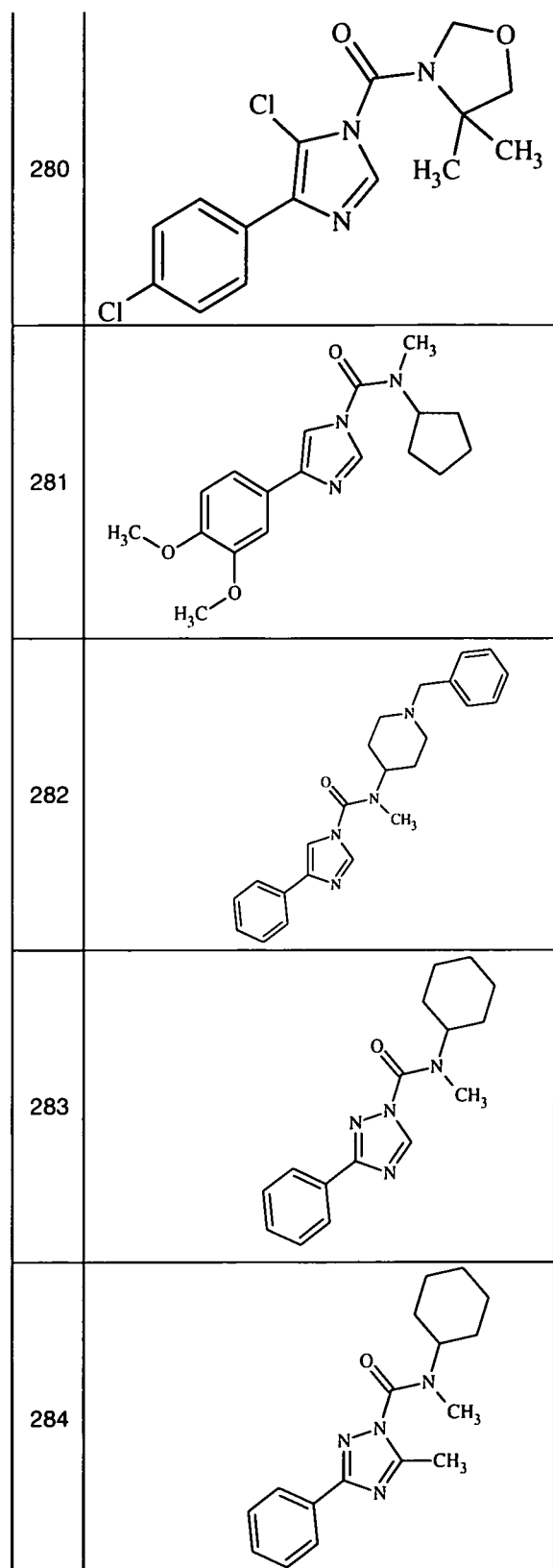
250	
251	
252	
253	
254	

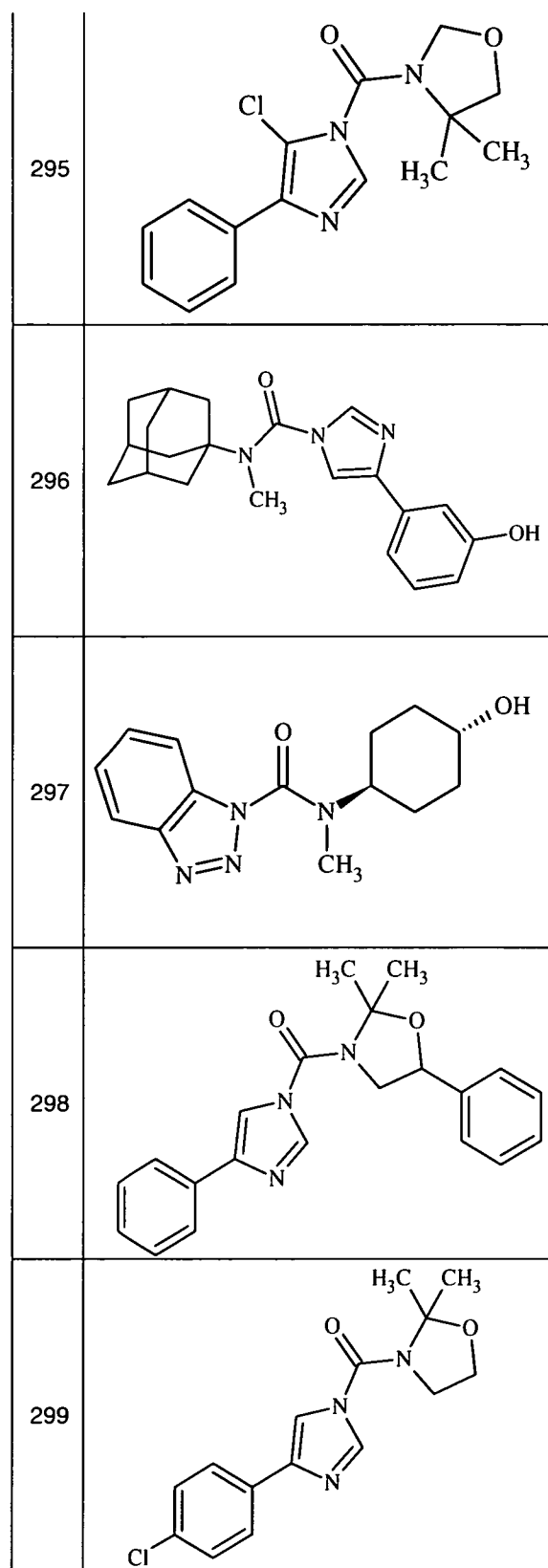
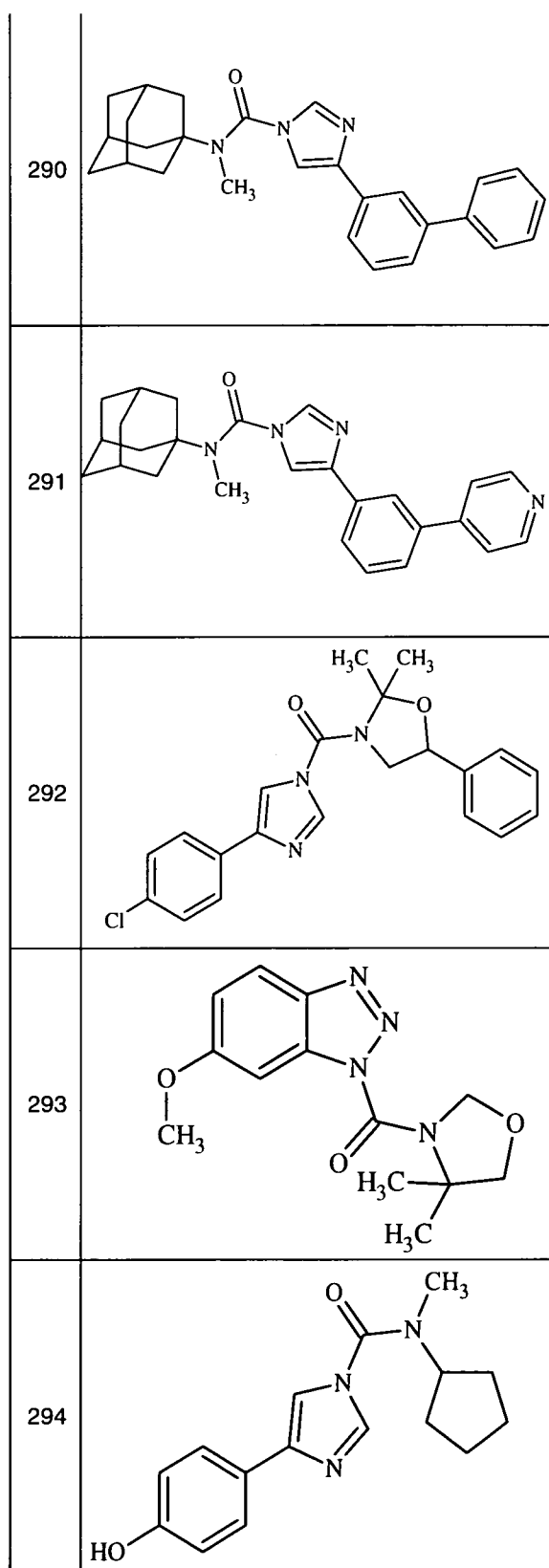
255	
256	
257	
258	
259	

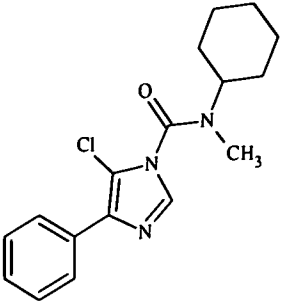
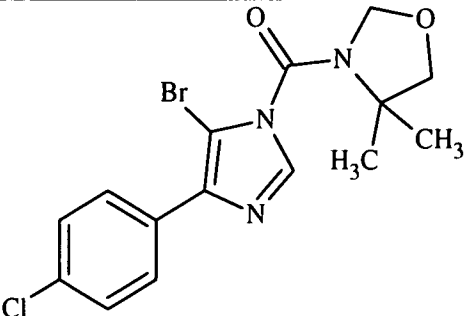
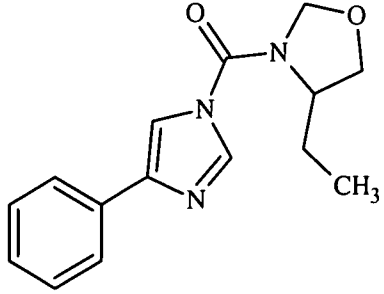
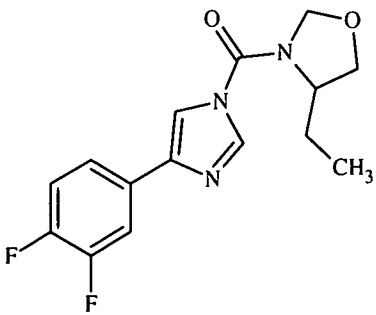
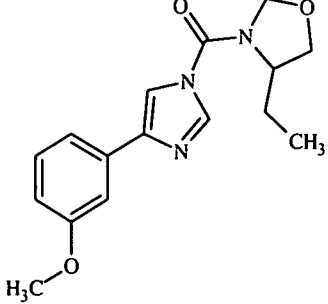
260	
261	
262	
263	
264	
265	
266	
267	
268	
269	

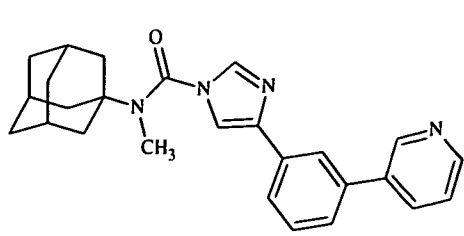
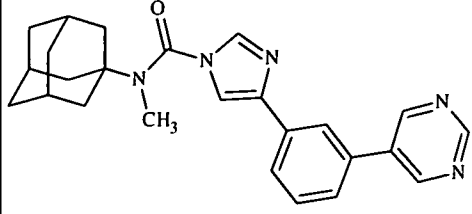
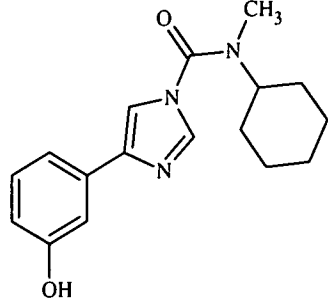
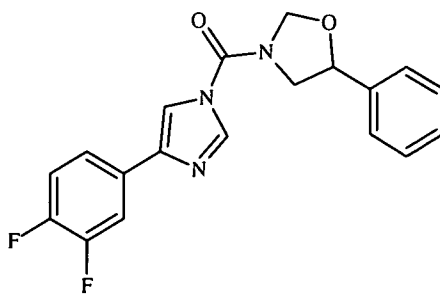
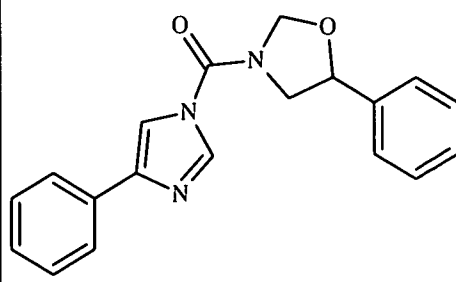
270	
271	
272	
273	
274	

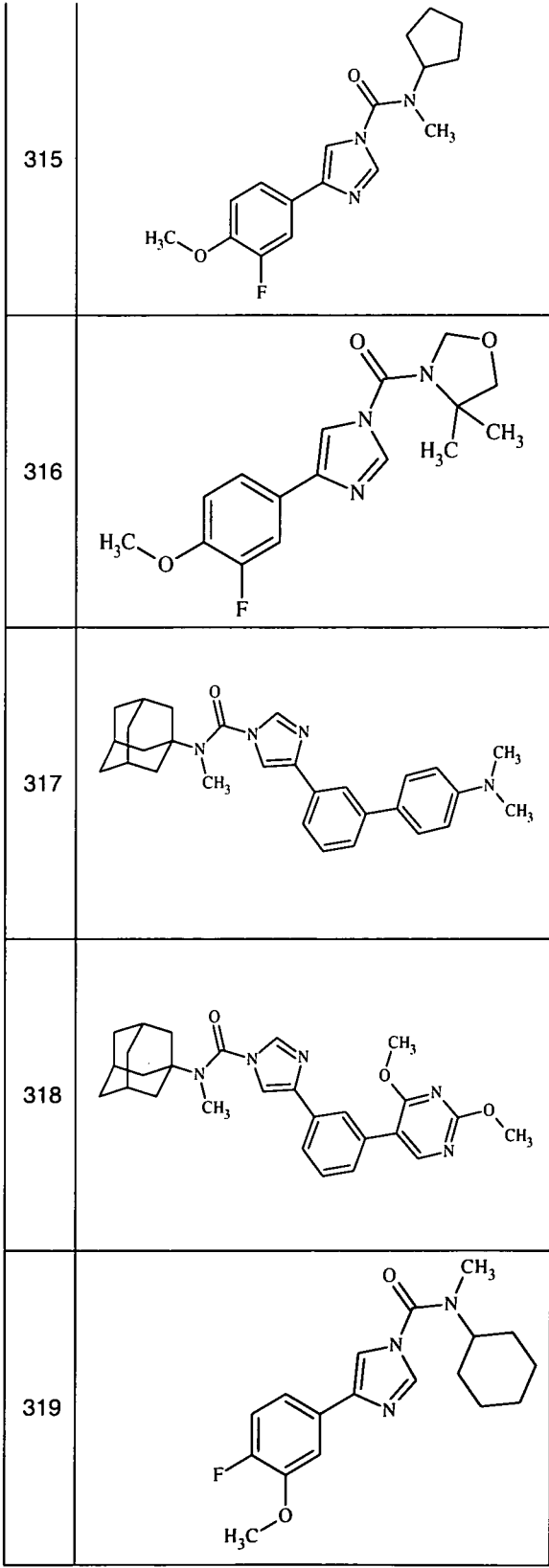
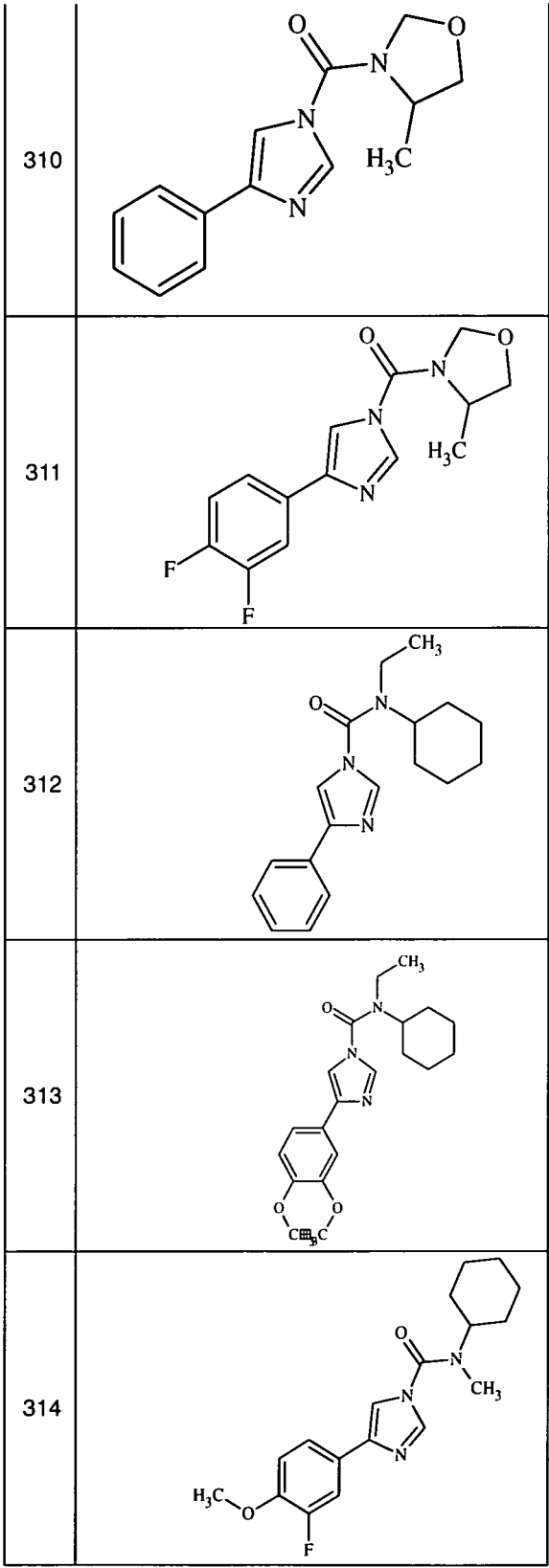
275	
276	
277	
278	
279	

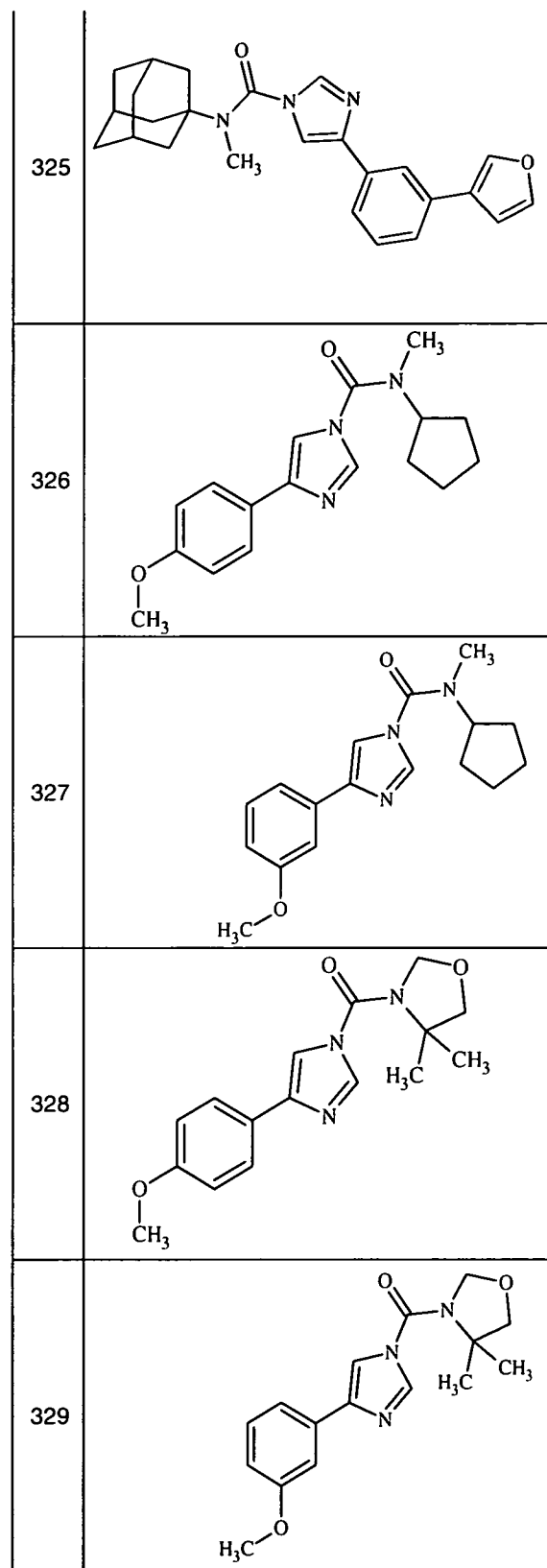
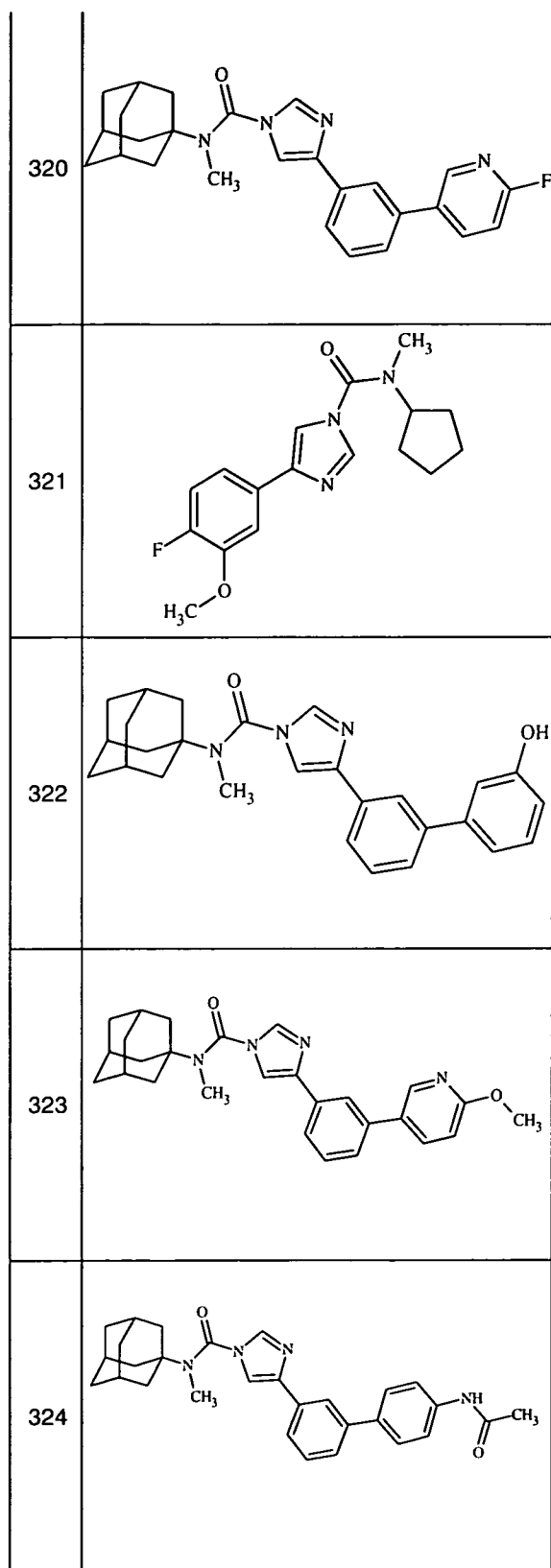


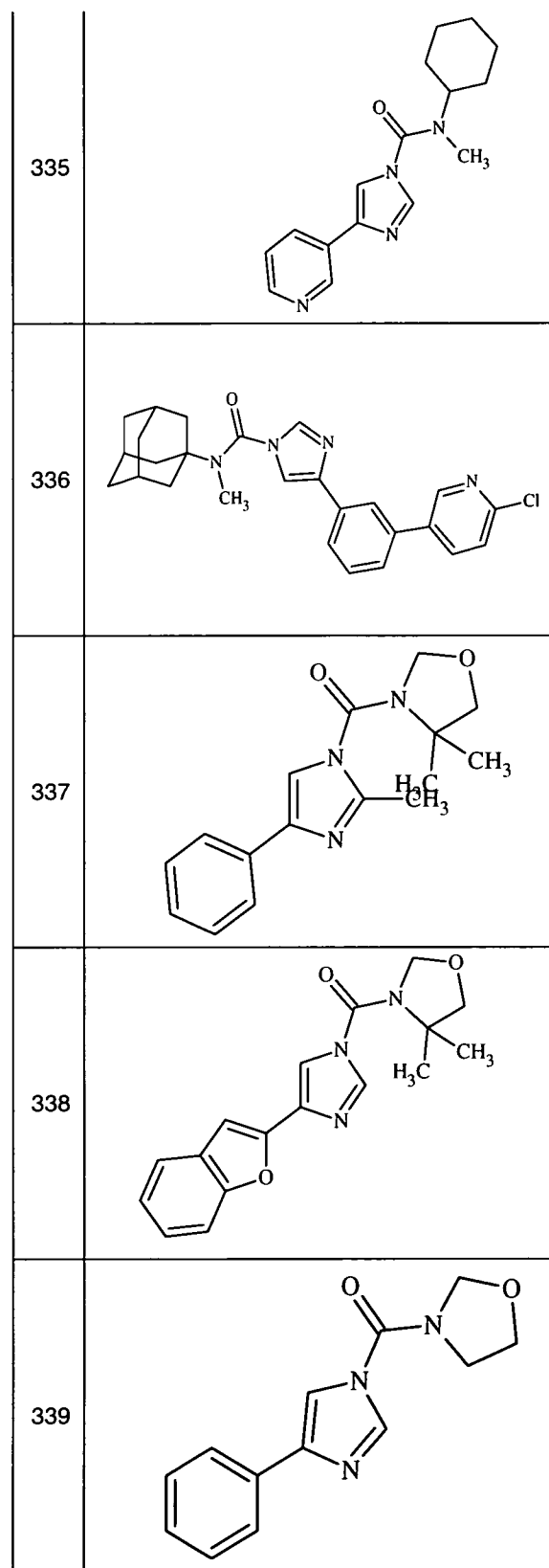
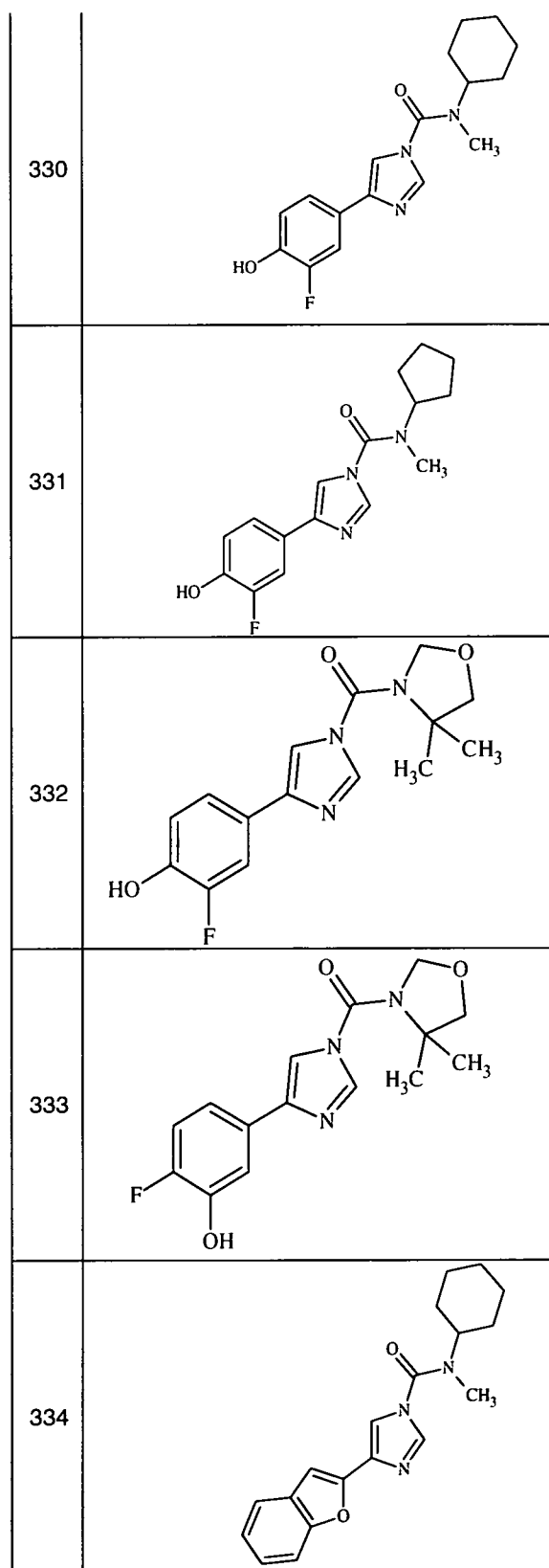


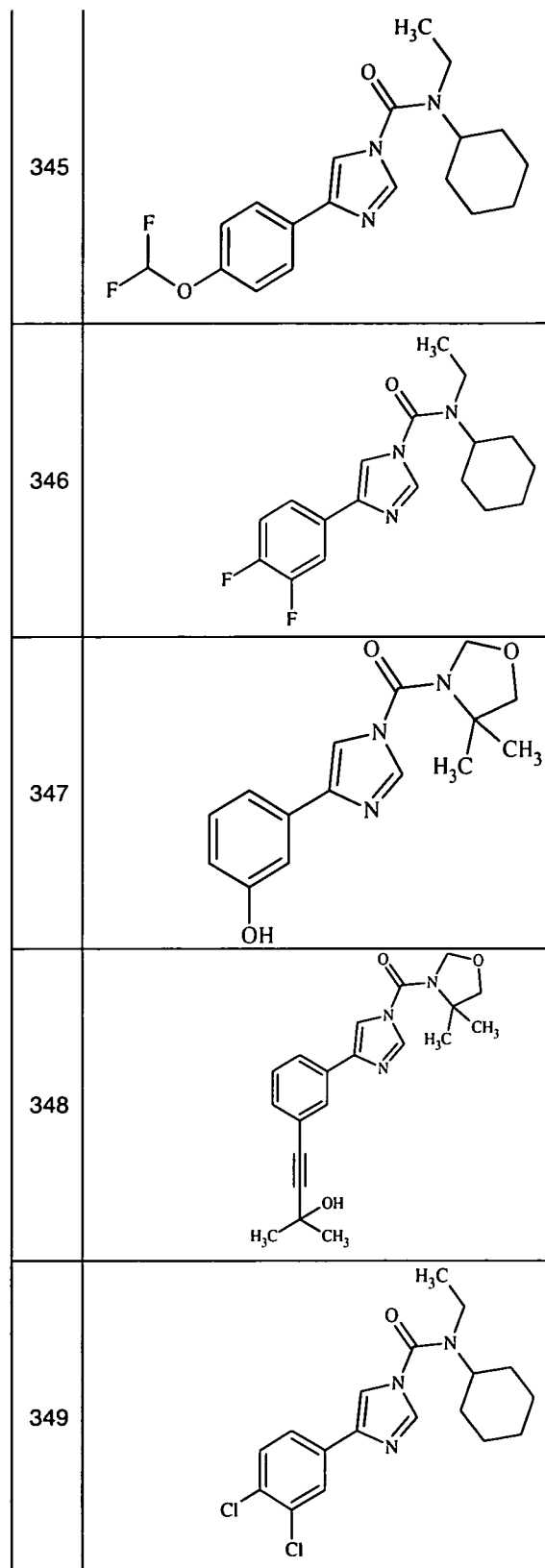
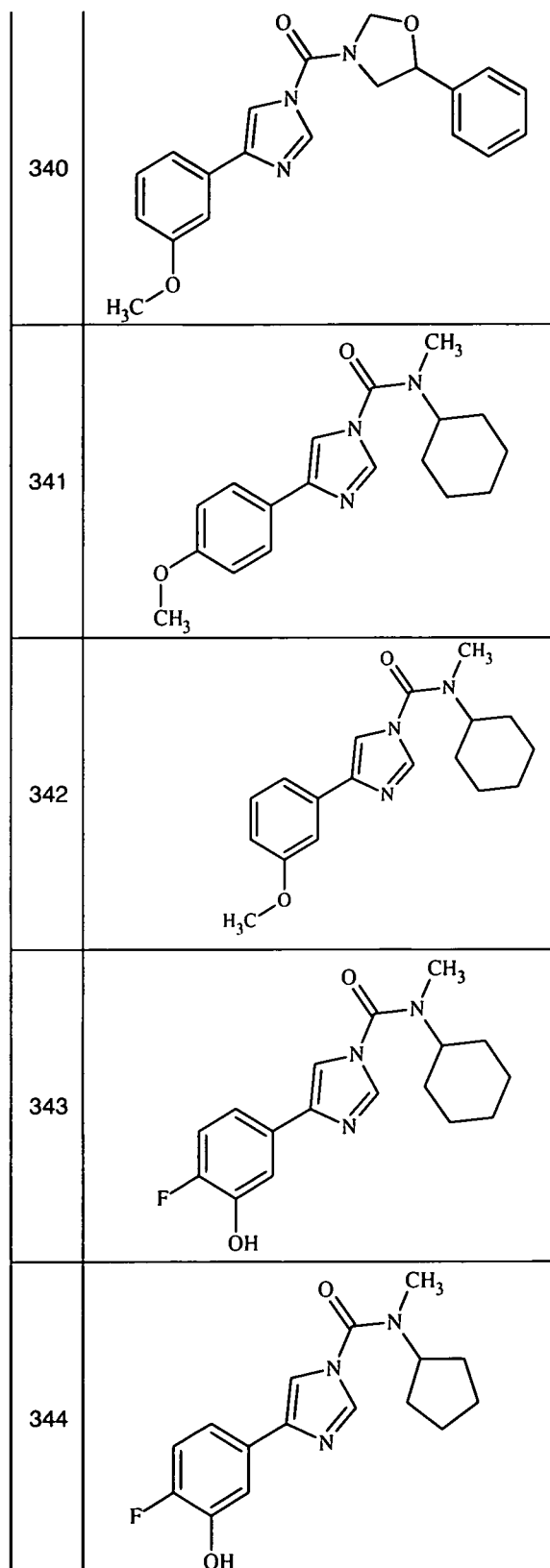
300	
301	
302	
303	
304	

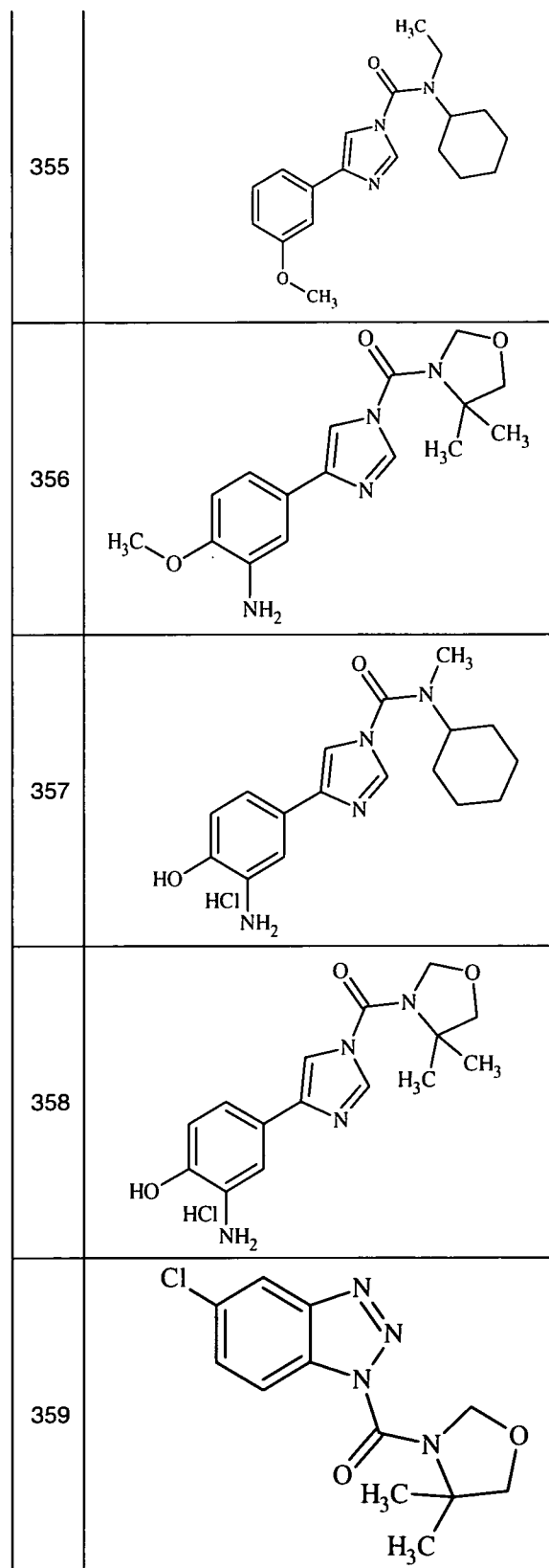
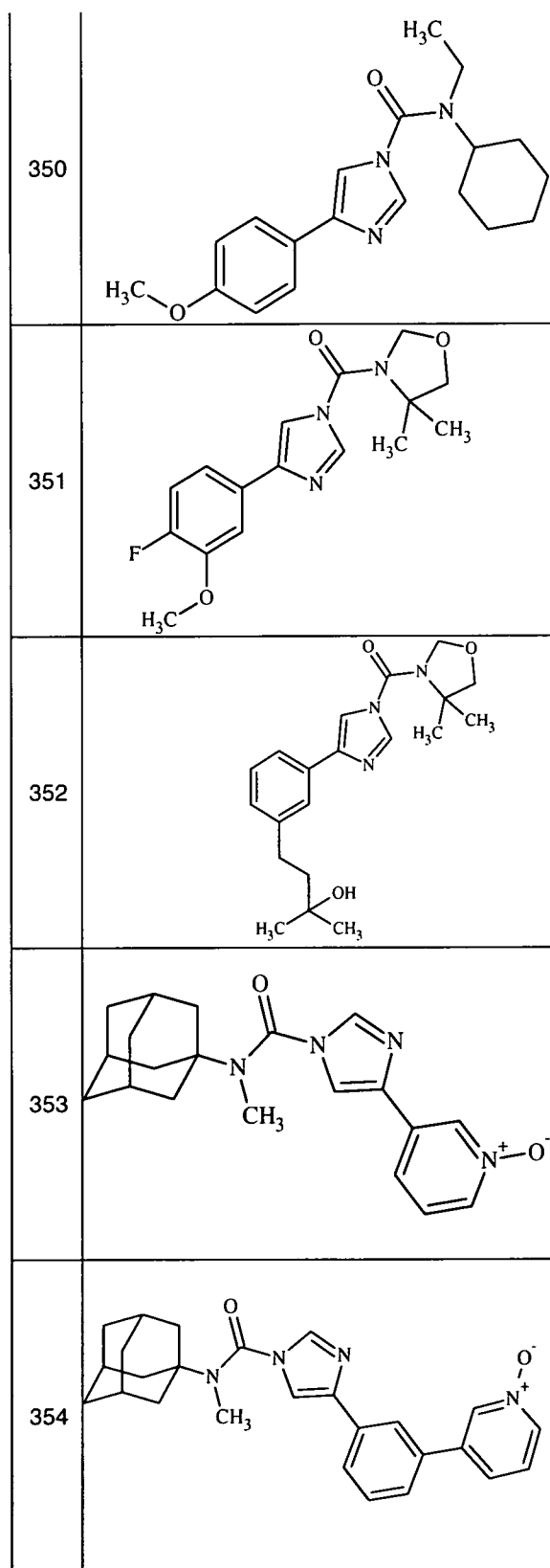
305	
306	
307	
308	
309	

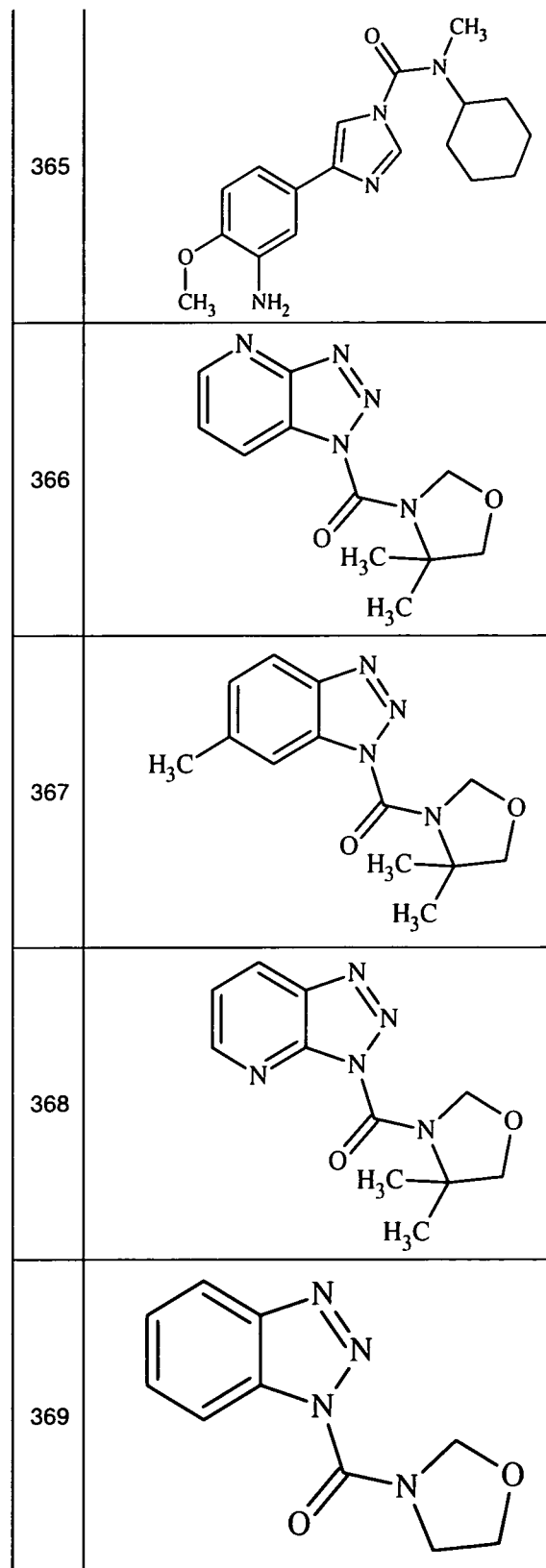
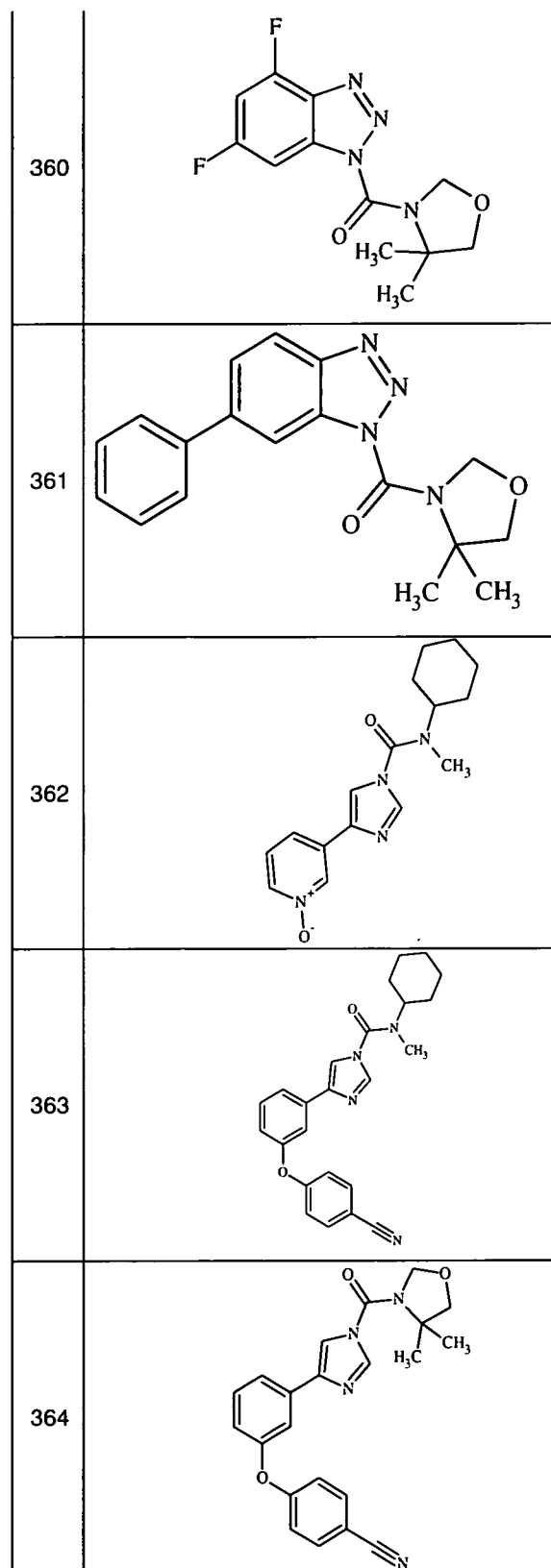


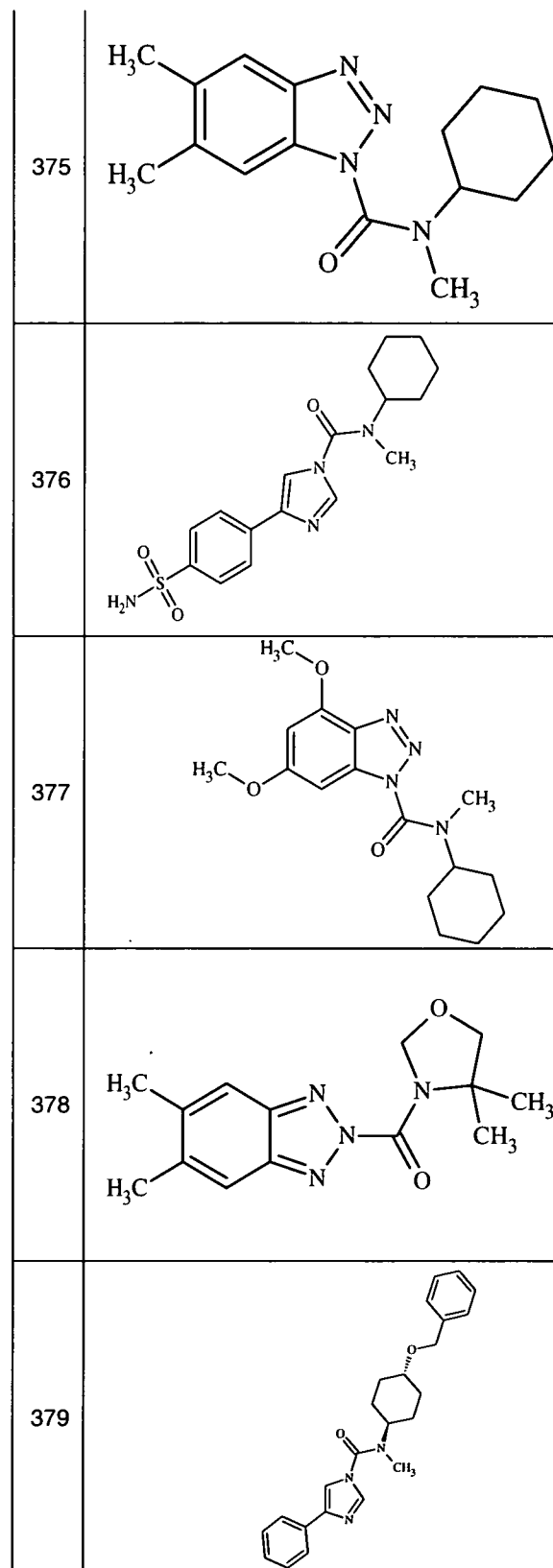
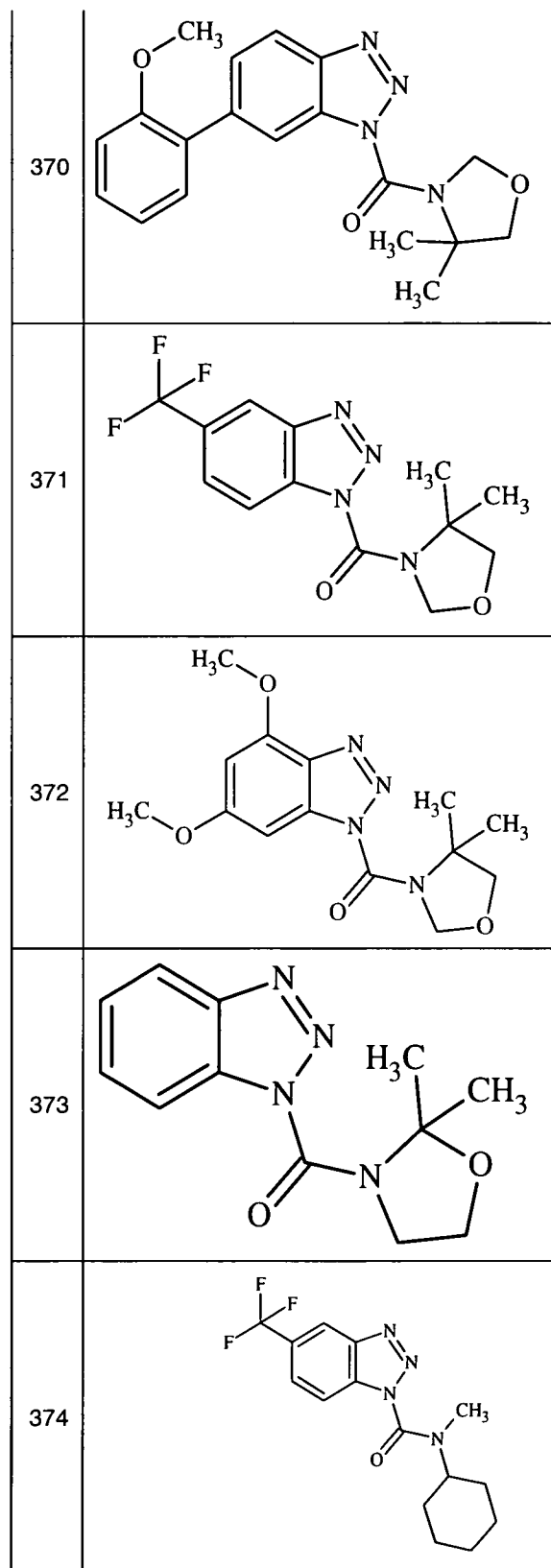


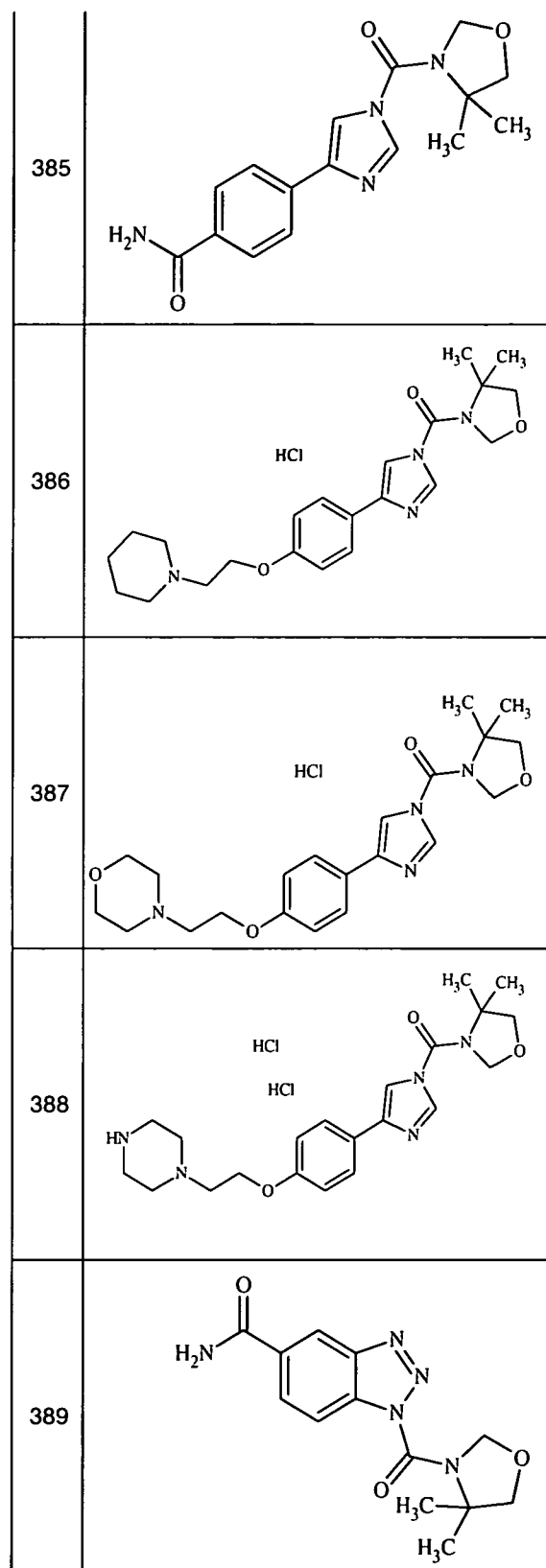
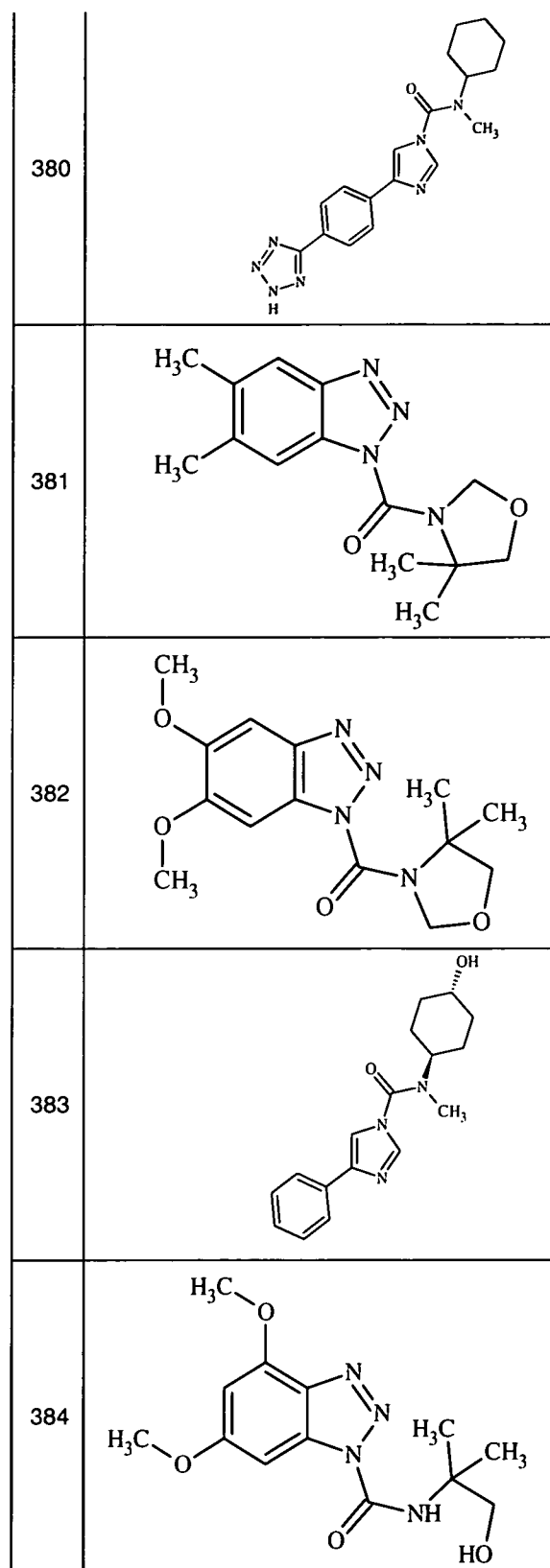


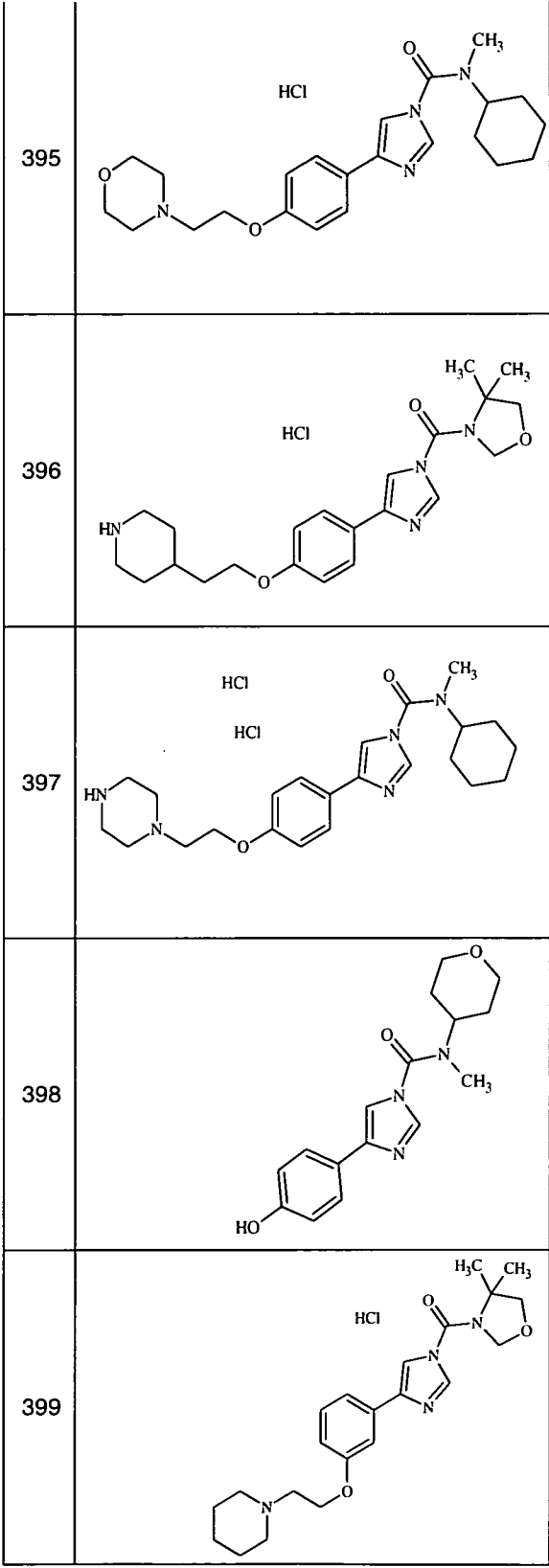
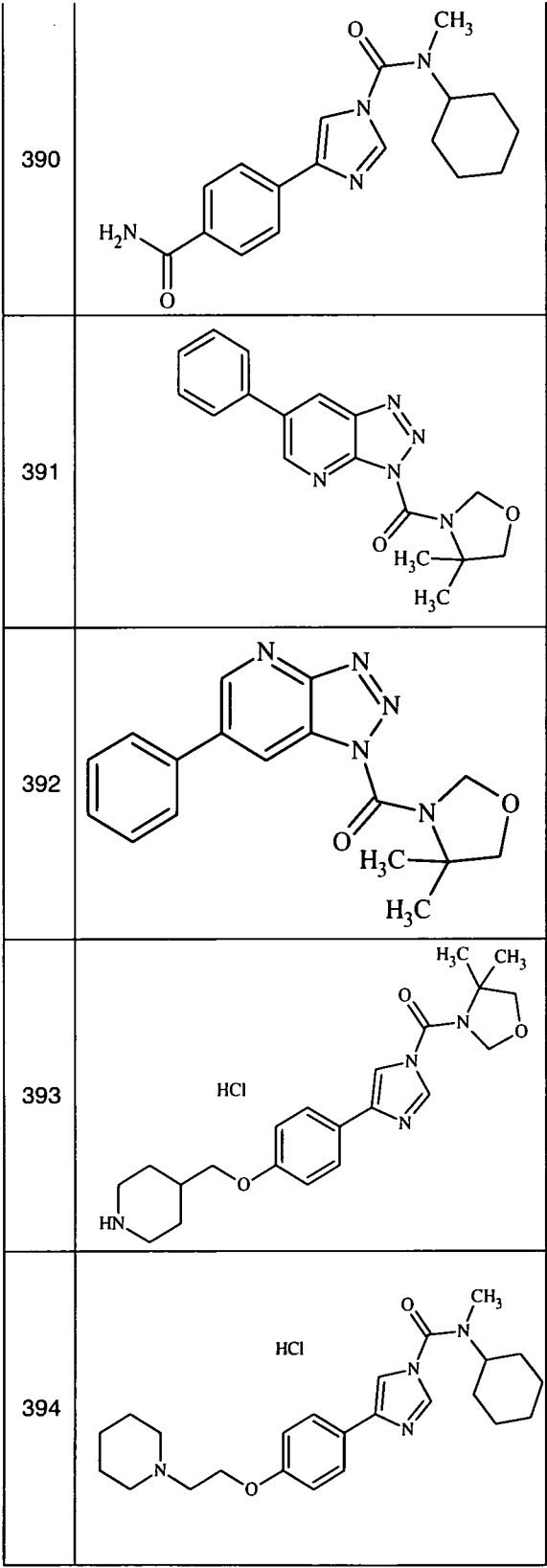










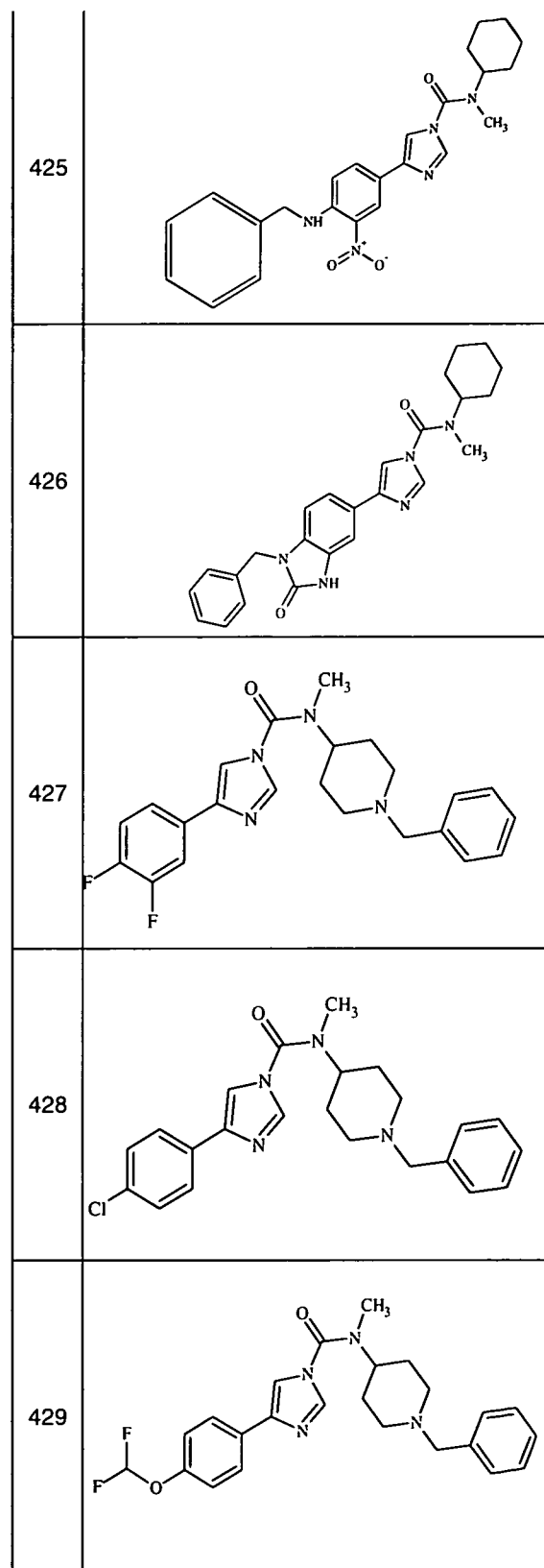
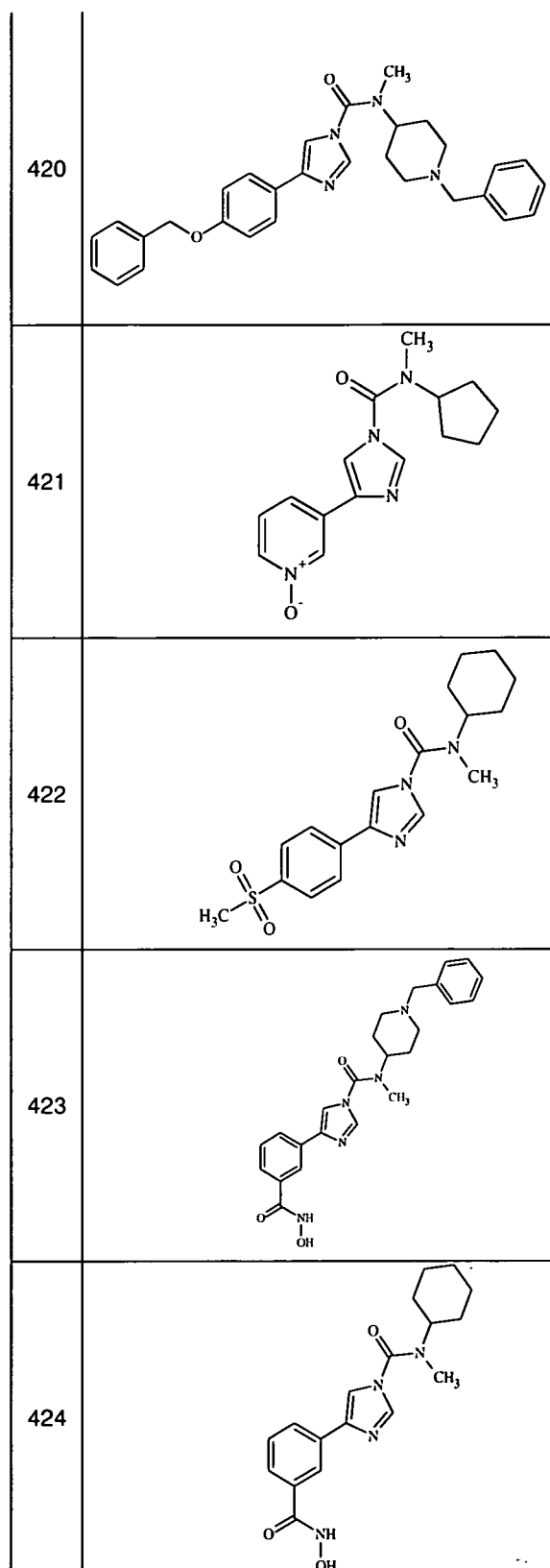


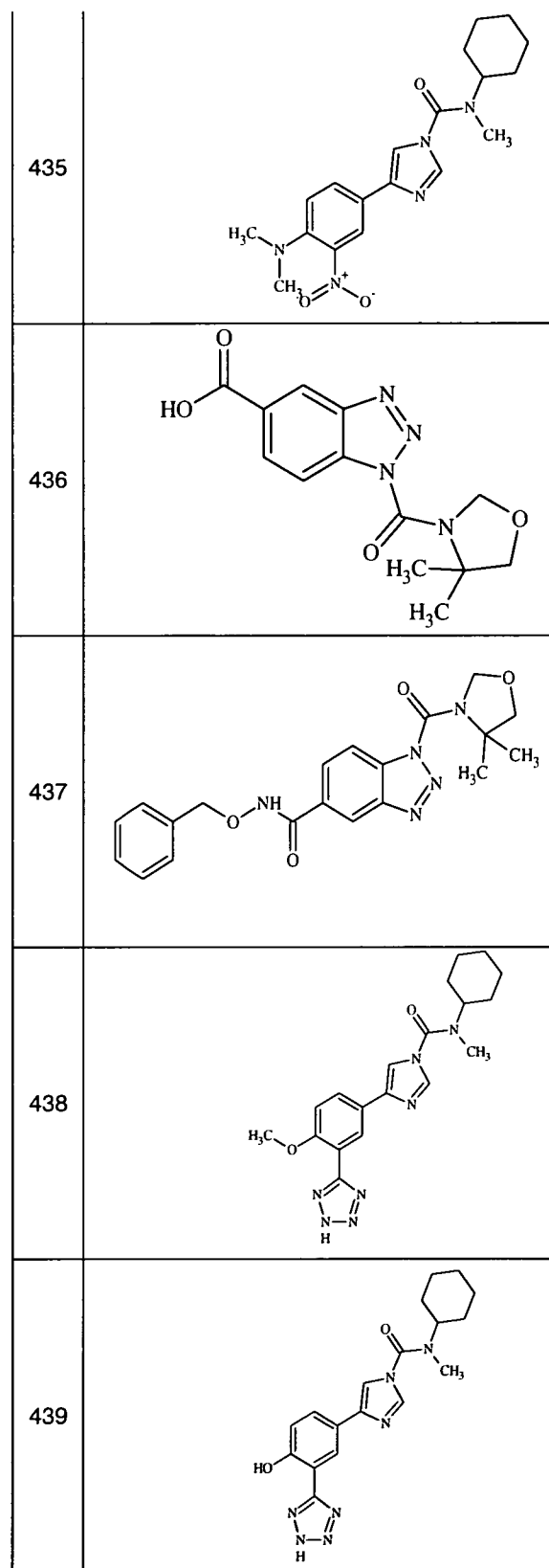
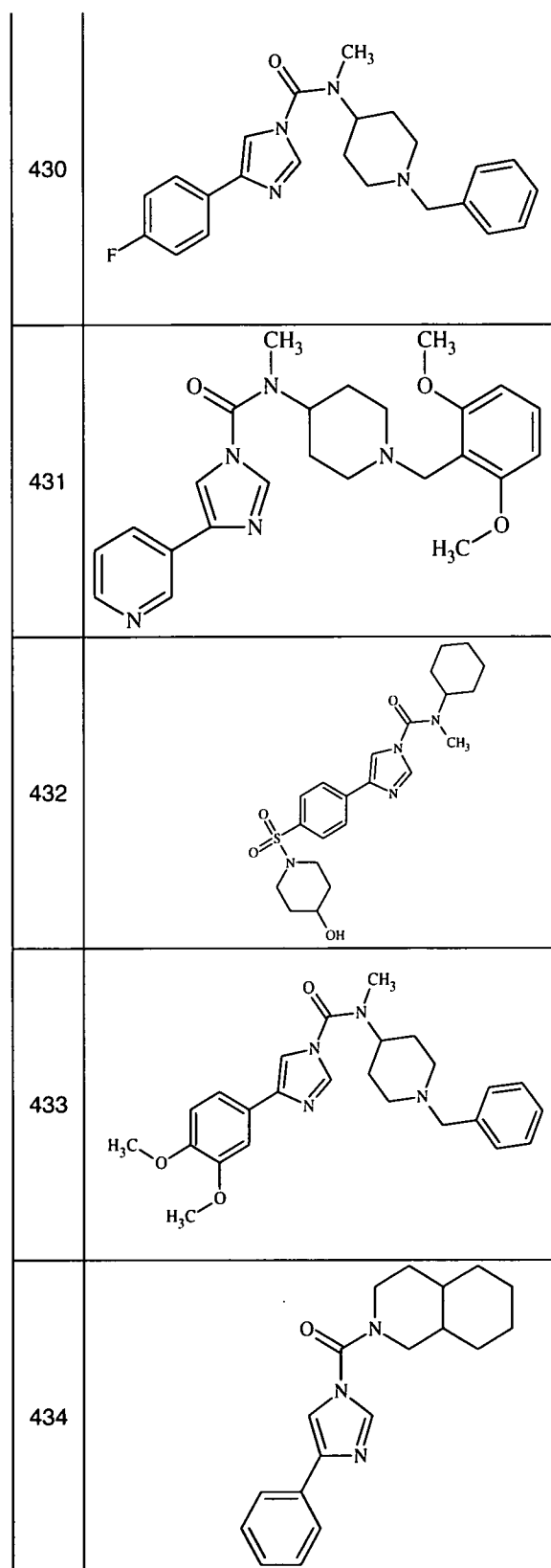
5

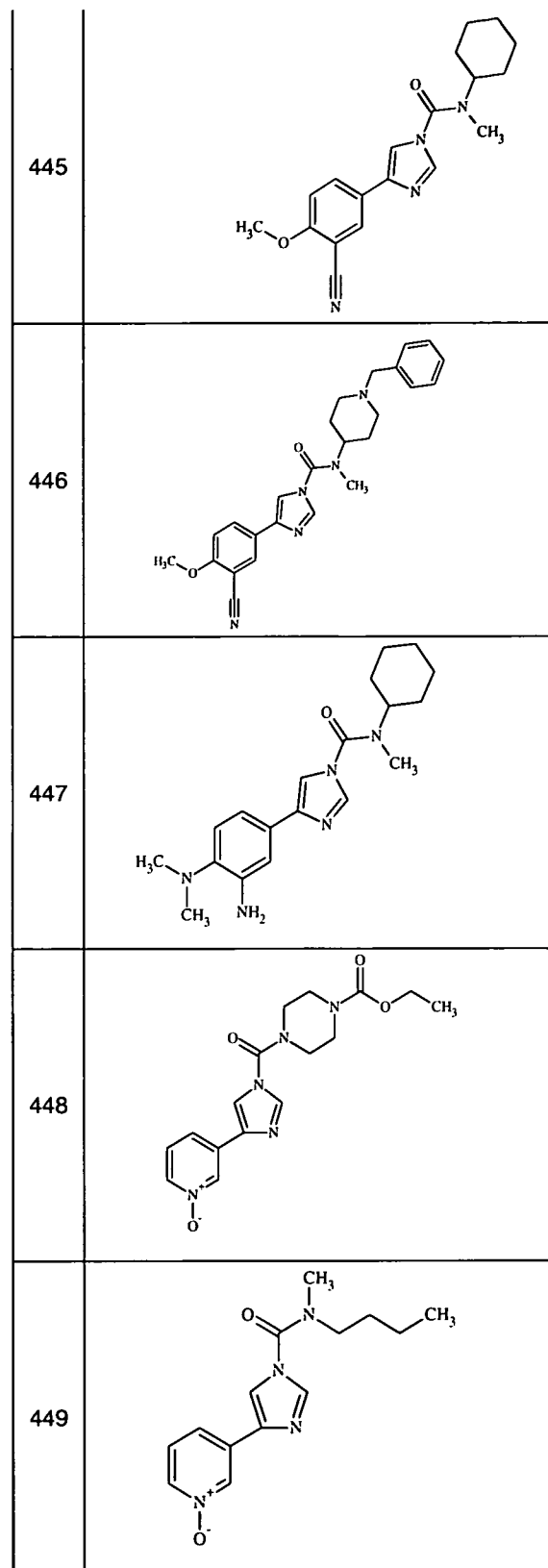
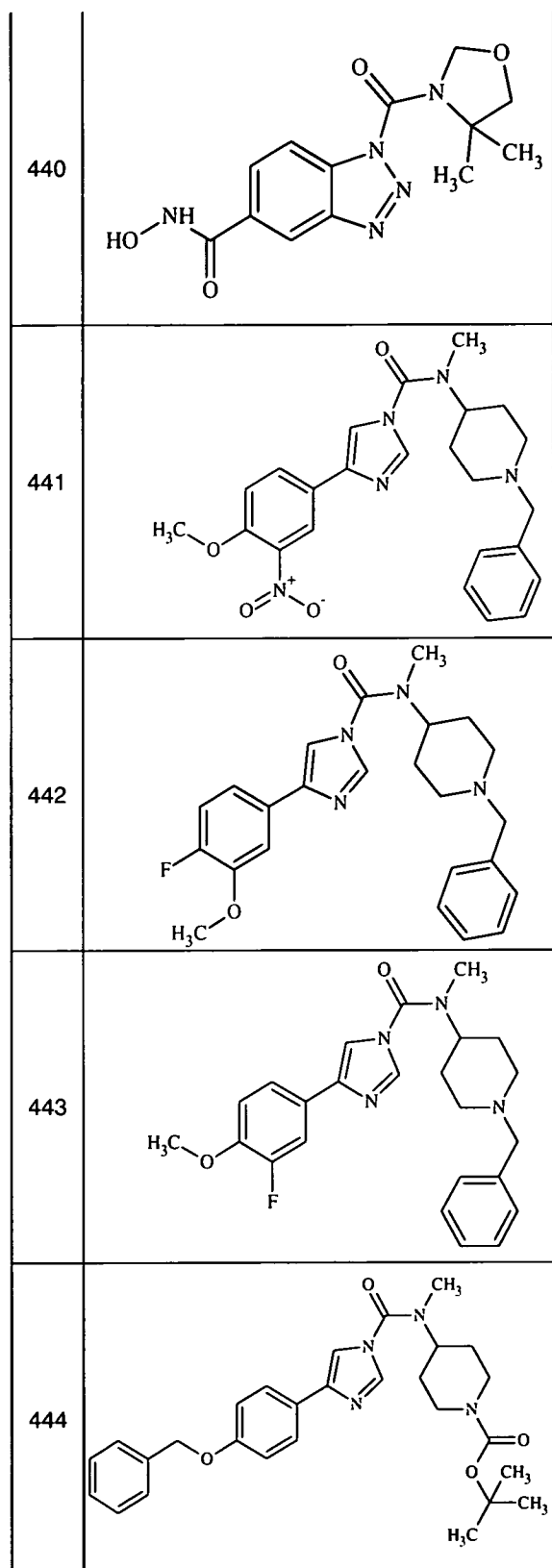
410	 <chem>CN(C(=O)c1nc(C2=CC=CC=C2)n1)C3CCN(CC4=CC=CC=C4)CC3</chem> HCl
411	 <chem>CN(C(=O)c1nc(C2=CC=CC=C2)n1)C3CCN(CC4=CC=CC=C4)CC3OS(=O)(=O)C</chem>
412	 <chem>CN(C(=O)c1nc(C2=CC=CC=C2)n1)C3CCN(CC4=CC=CC=C4)CC3OC(=O)C(O)C(O)C(=O)O</chem>
413	 <chem>CN(C(=O)c1nc(C2=CC=CC=C2)n1)C3CCN(CC4=CC=CC=C4)CC3OC(=O)C(O)C(O)C(=O)O</chem>
414	 <chem>CN(C(=O)c1nc(C2=CC=CC=C2)n1)C3CCN(CC4=CC=CC=C4)CC3OP(=O)(O)O</chem>

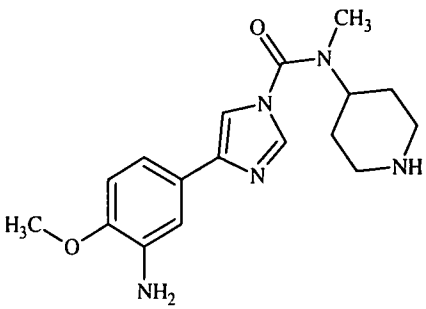
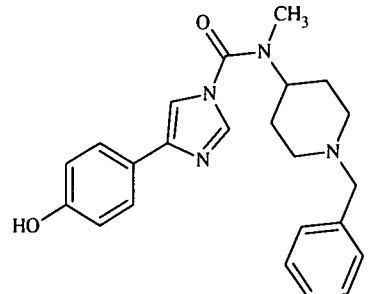
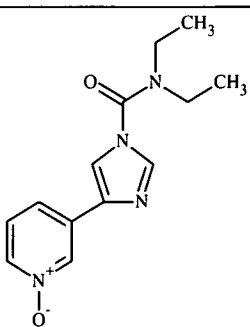
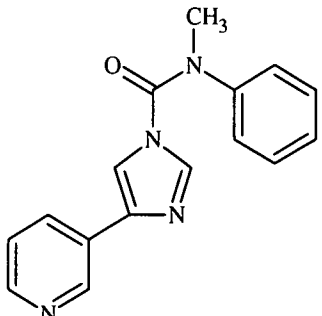
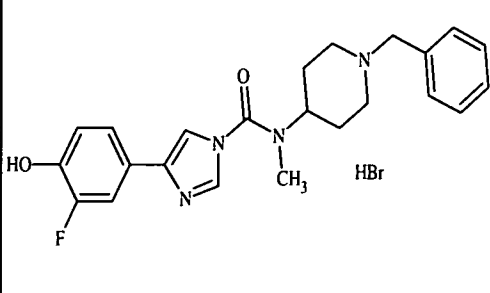
415	 <chem>CN(C(=O)c1nc(C2=CC=CC=C2)n1)C3CCN(CC4=CC=CC=C4)CC3</chem>
416	 <chem>CN(C(=O)c1nc(C2=CC=CC=C2)n1)C3CCN(CC4=CC=CC=C4)CC3</chem>
417	 <chem>CN(C(=O)c1nc(C2=CC=CC=C2)n1)C3CCN(CC4=CC=CC=C4)CC3</chem>
418	 <chem>CN(C(=O)c1nc(C2=CC=C(C=C2)OC)n1)C3CCN(CC4=CC=CC=C4)CC3</chem>
419	 <chem>CN(C(=O)c1nc(C2=CC=C(C=C2)OC)n1)C3CCN(CC4=CC=CC=C4)CC3</chem>

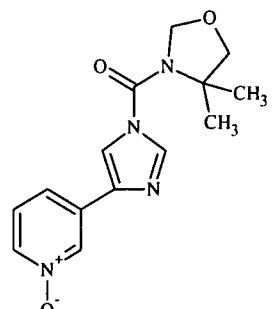
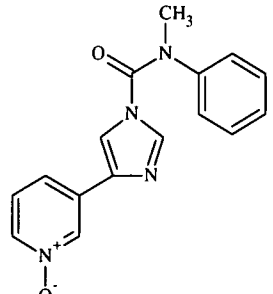
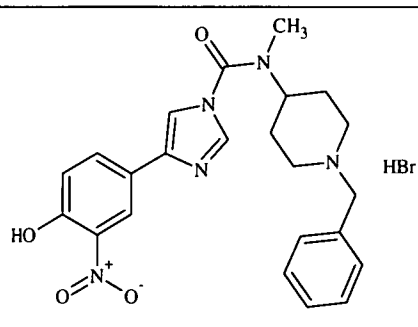
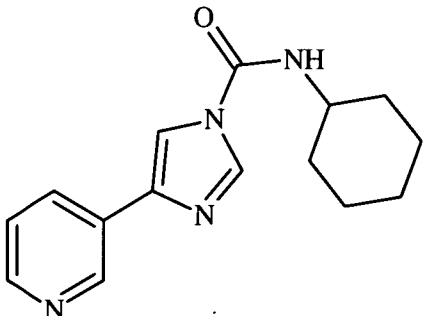
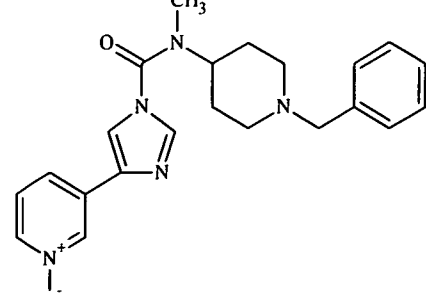


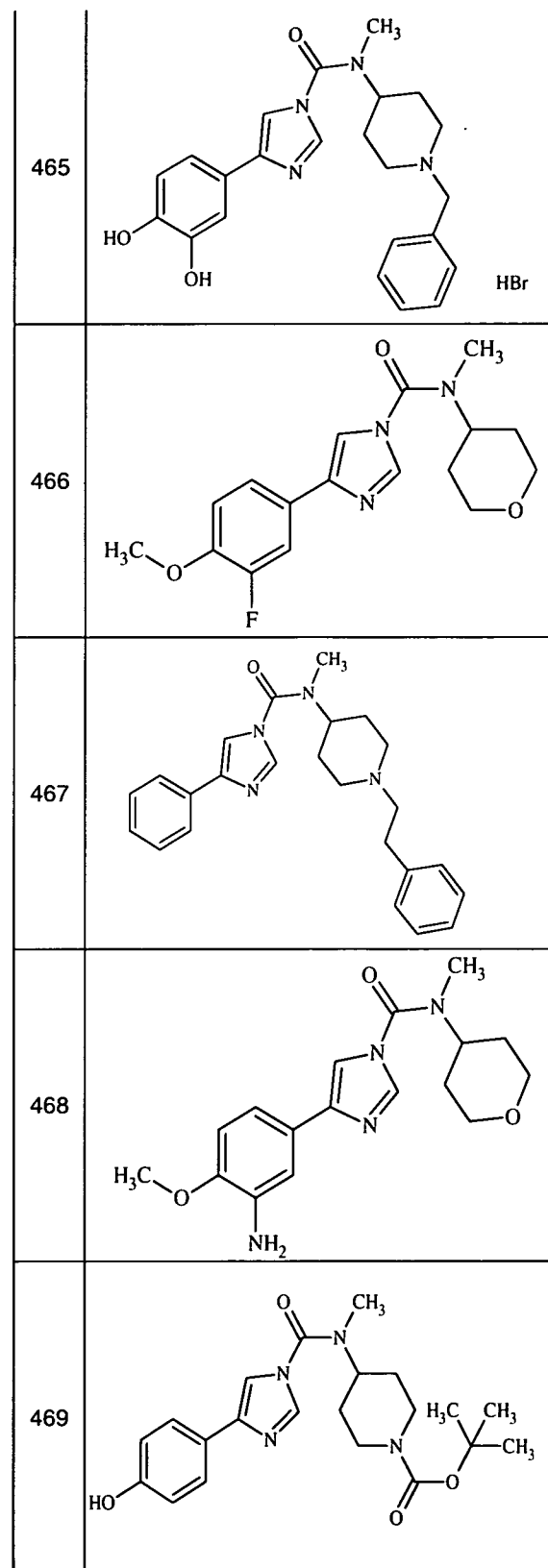
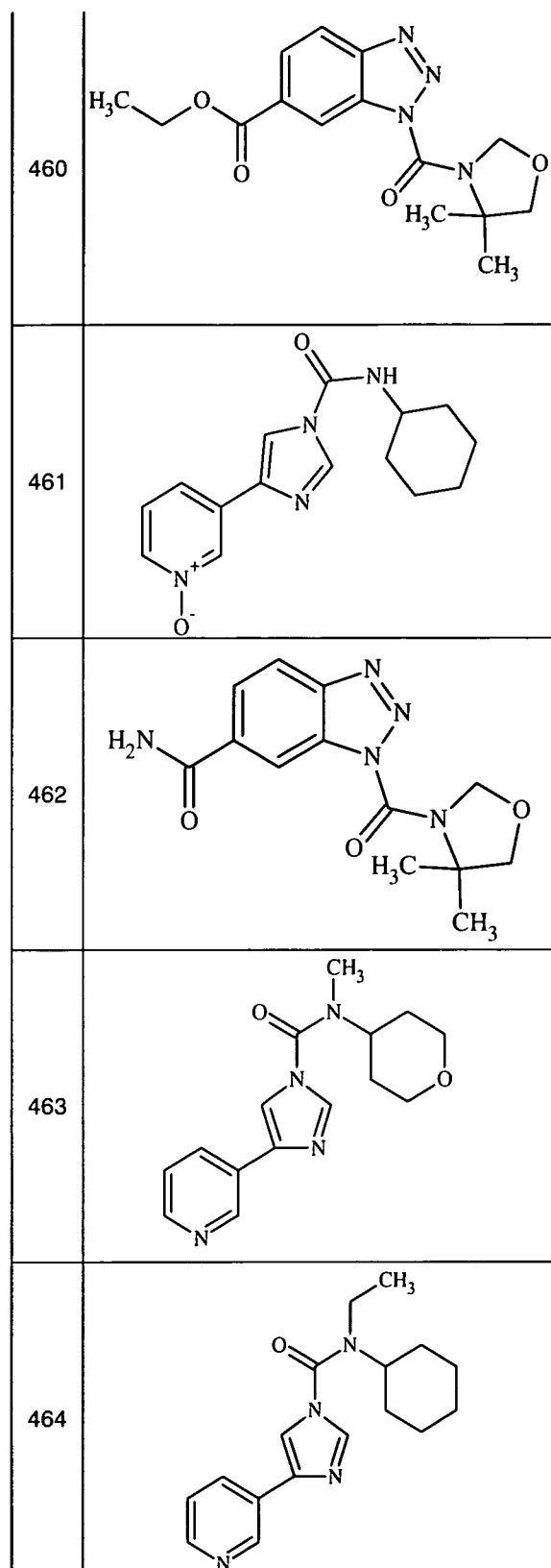


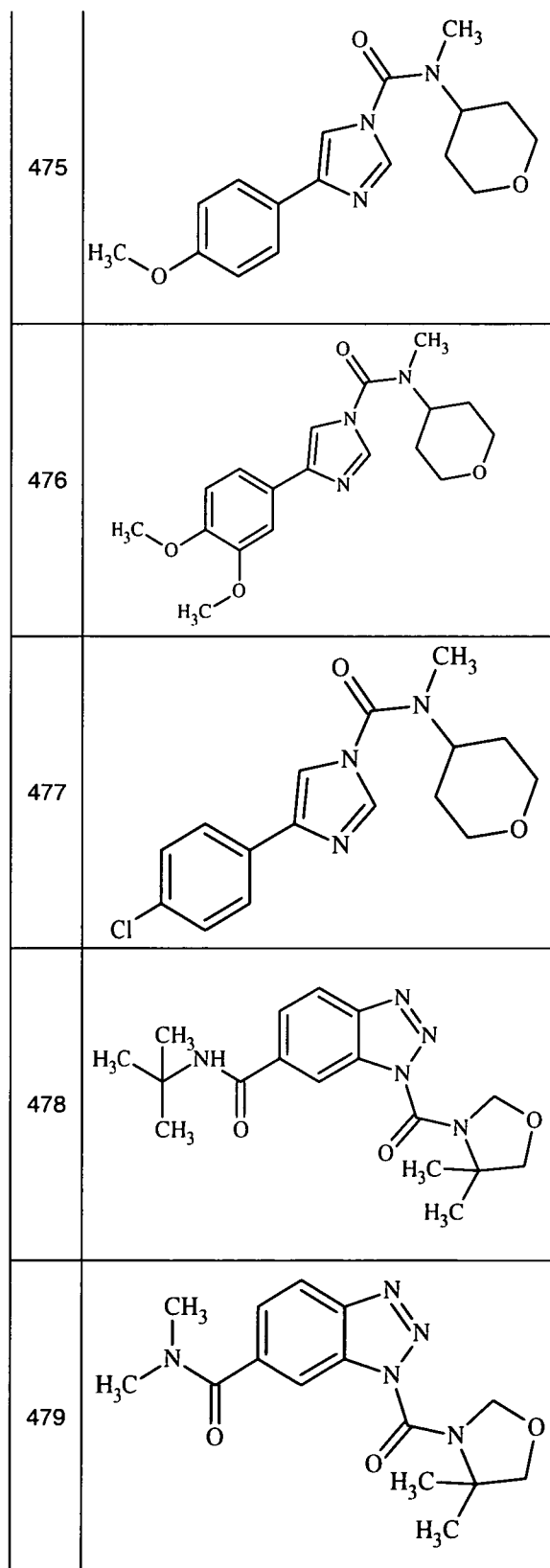
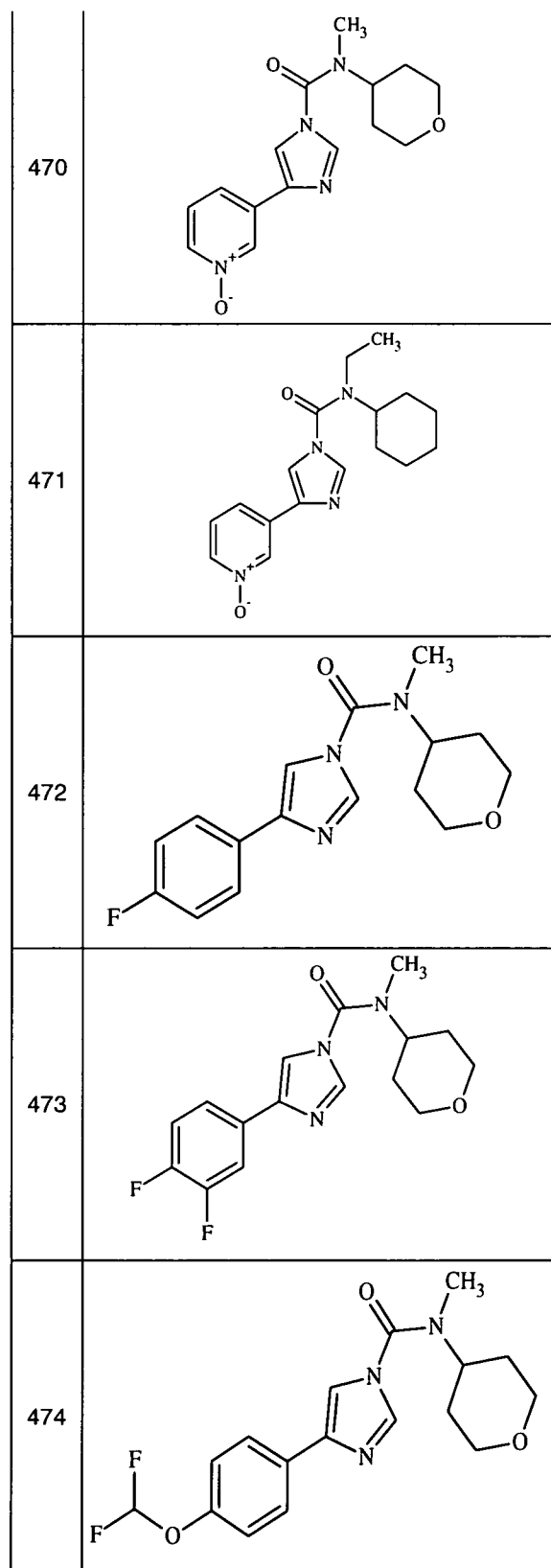


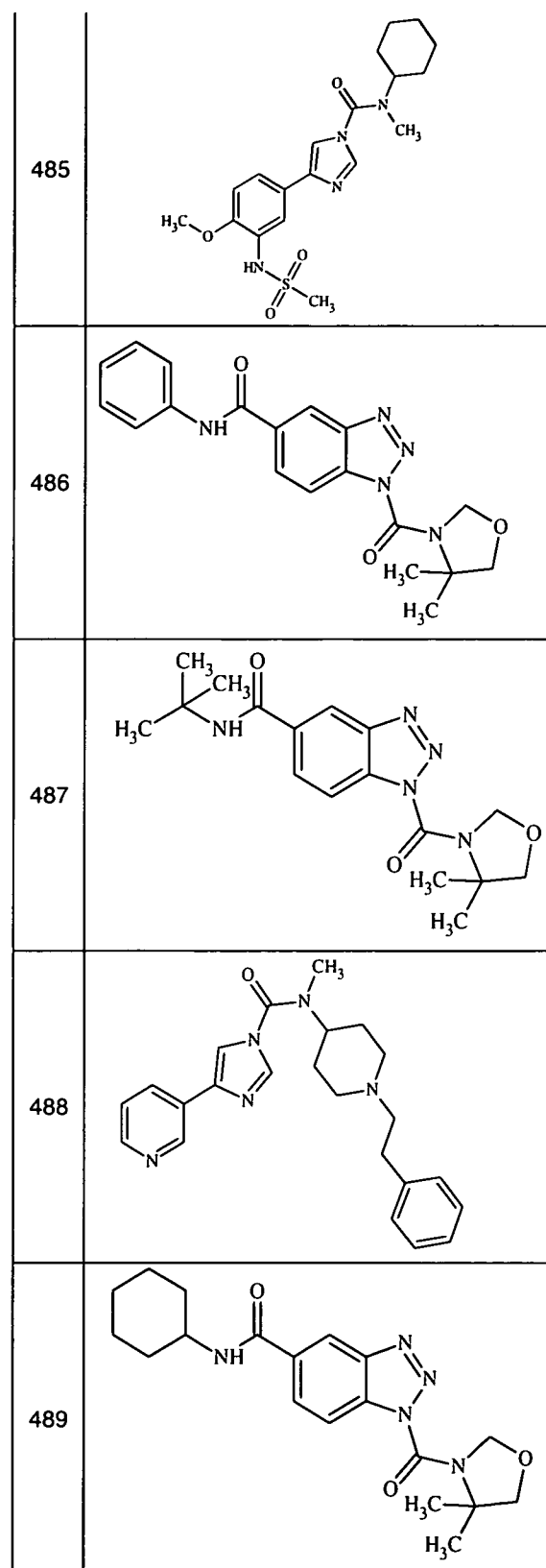
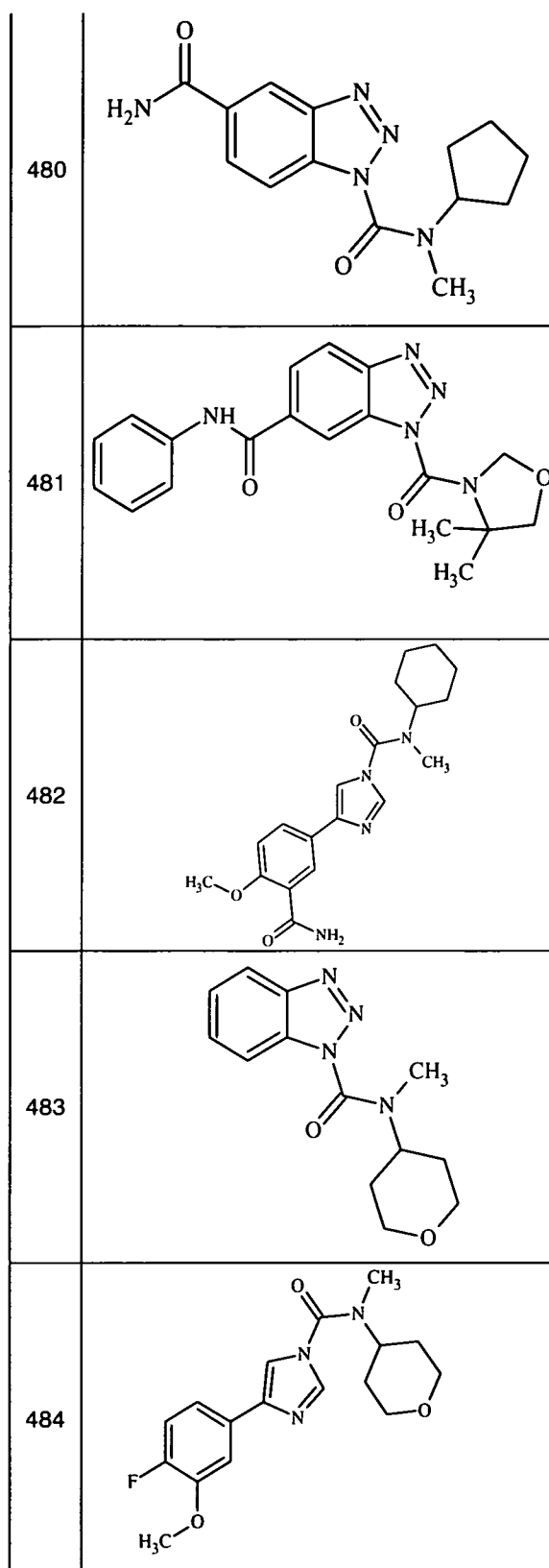


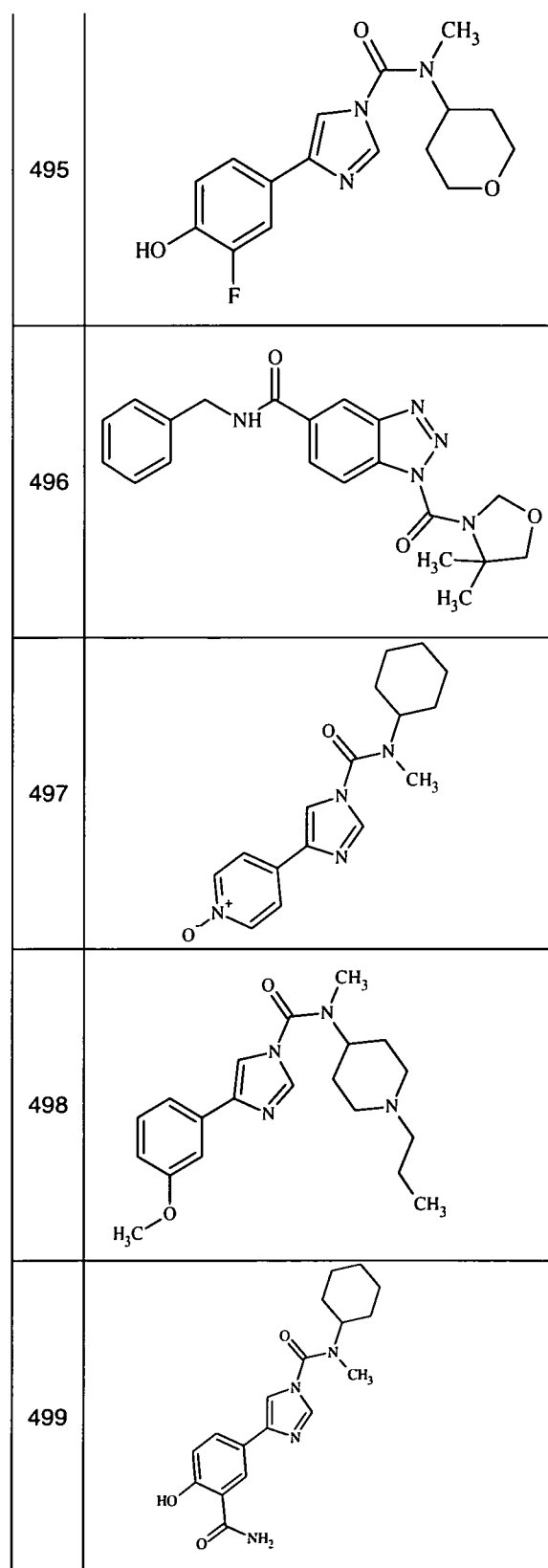
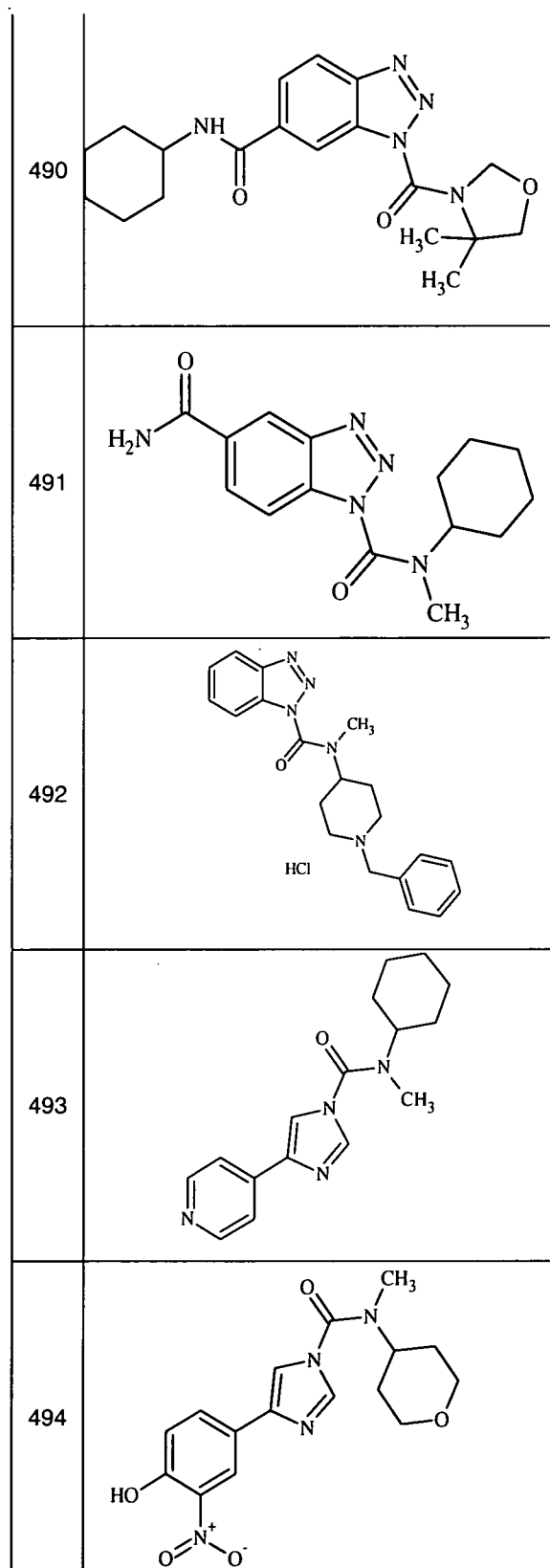
450	
451	
452	
453	
454	

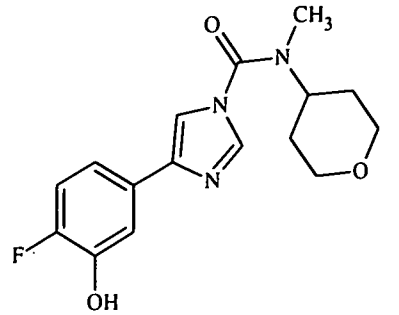
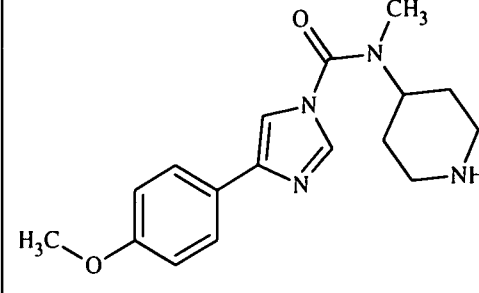
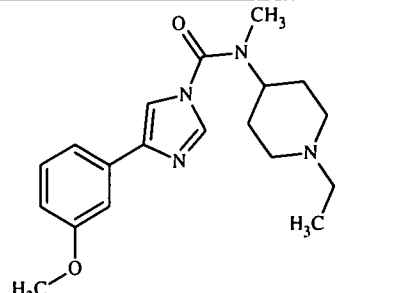
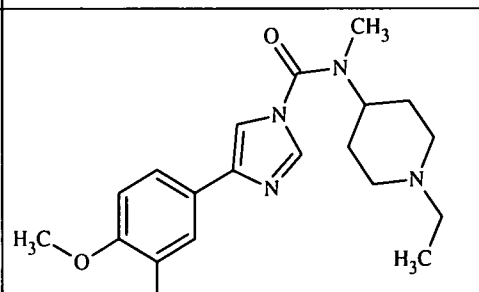
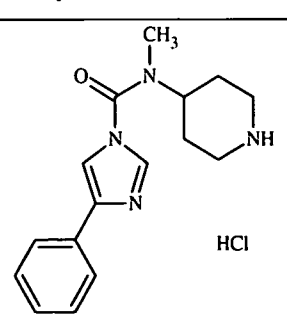
455	
456	
457	
458	
459	

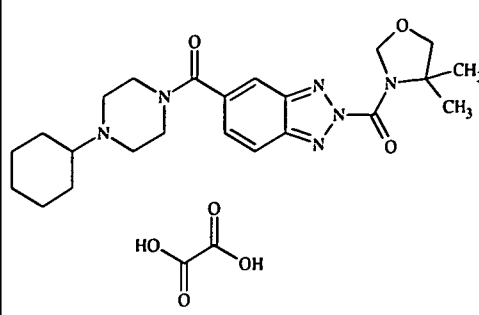
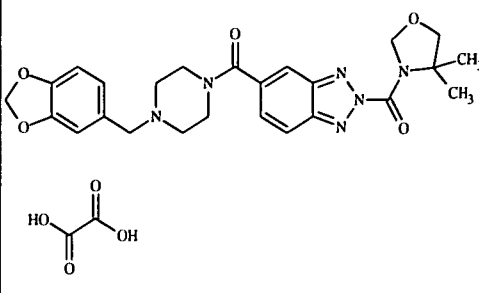
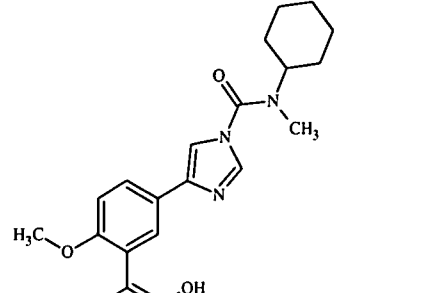
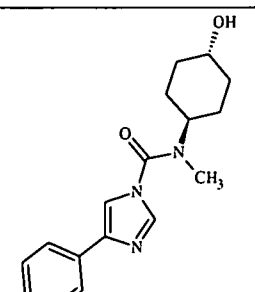
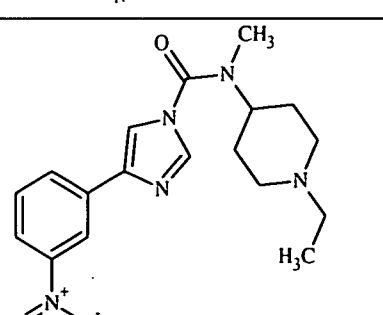


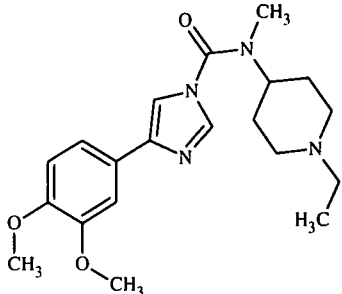
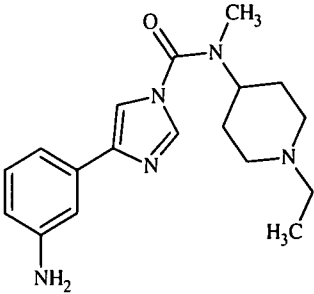
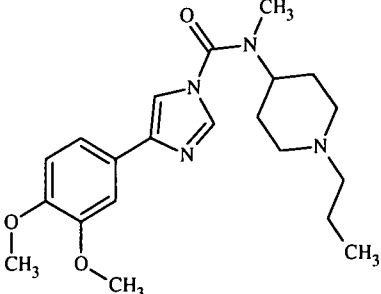
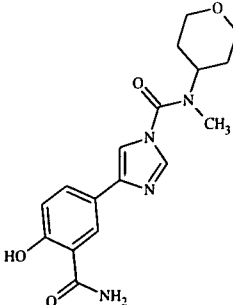
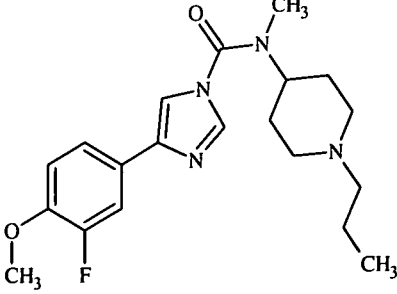
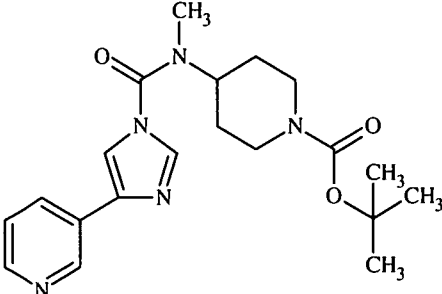
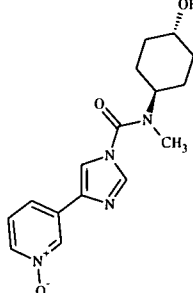
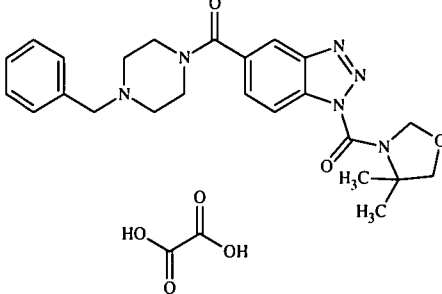
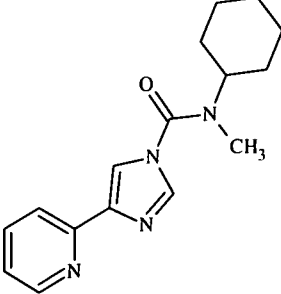
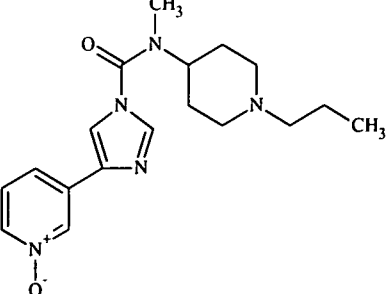






500	
501	
502	
503	
504	

505	
506	
507	
508	
509	

510	
511	
512	
513	
514	
515	
516	
517	
518	
519	



520	
521	
522	
523	
524	

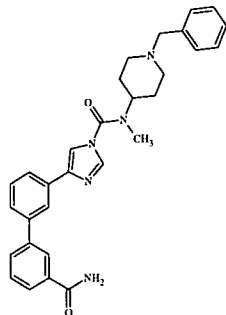
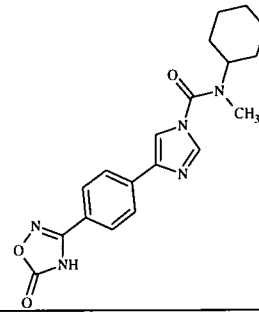
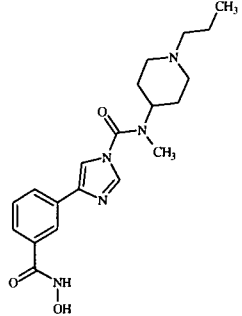
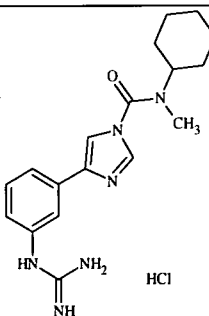
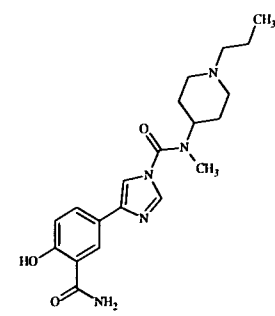
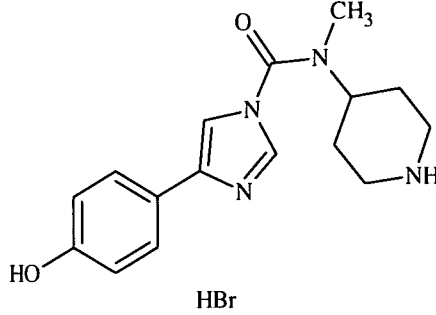
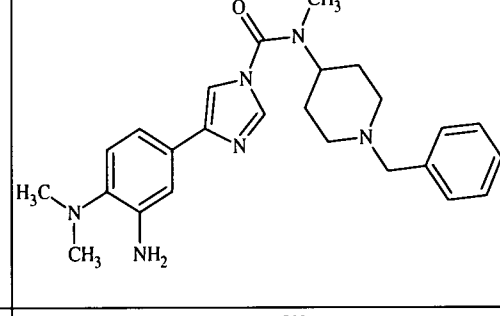
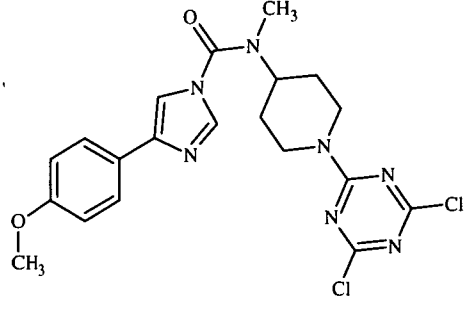
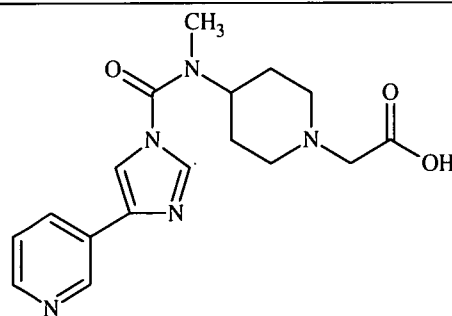
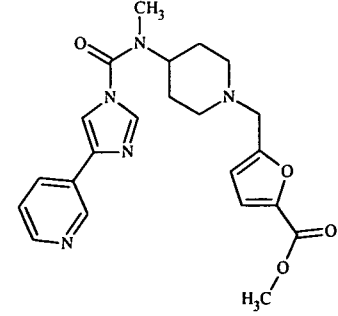
525	
526	
527	
528	
529	

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	

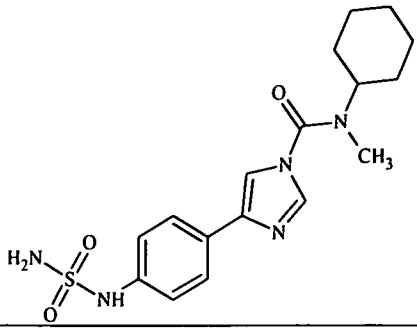
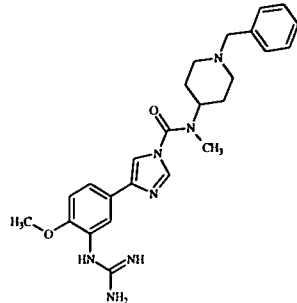
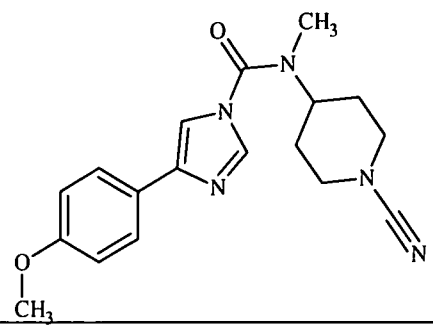
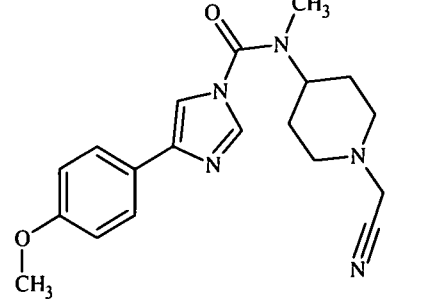
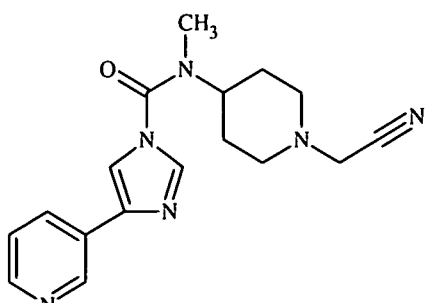
560	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=CC=C2)n1)C3CCOCC3</chem>
561	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(C=C2)C(F)=C(O))n1)C3CCN(CC)CC3.Br</chem>
562	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(C=C2)C(O)=C(N))n1)C3CCCC3.Cl</chem>
563	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(C=C2)NC(=N)N)n1)C3CCCCC3</chem>
564	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)OC(=O)N3)n1)C4CCCC4</chem>

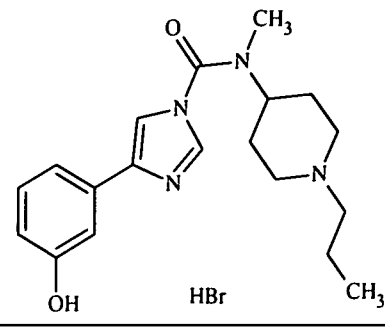
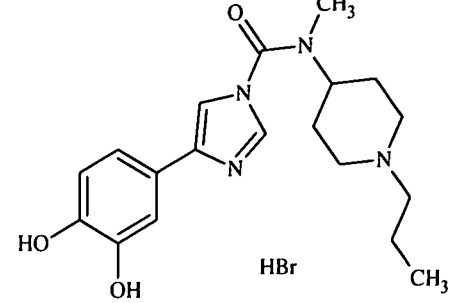
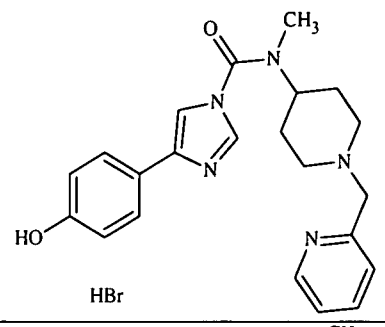
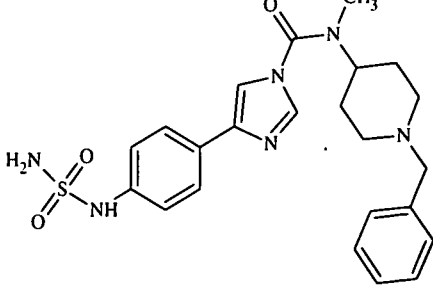
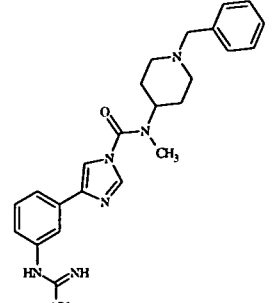
565	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(N)C=C2)n1)C3CCN(CC4=CC=CC=C4)CC3</chem>
566	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(C=C2)C3=CC=C(C=C3)OC(=O)N3)n1)C4CCCC(O)C4</chem>
567	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(C=C2)S(=O)(=O)C)n1)C3CCN(CC4=CC=CC=C4)CC3</chem>
568	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=C(C=C2)O)n1)C3CCN(S(=O)(=O)C4=CC=C(C=C4)C(F)(F)F)CC3</chem>
569	 <chem>CN(C(=O)c1cn(C2=CC=CC=C2N)cn1)C3CCN(CC4=CC=CC=N4)CC3</chem>

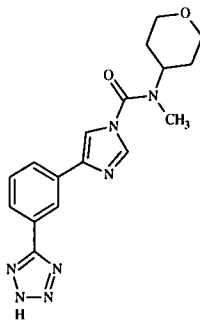
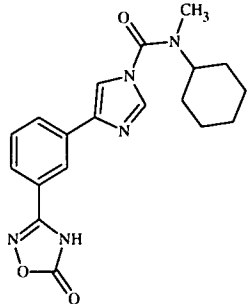
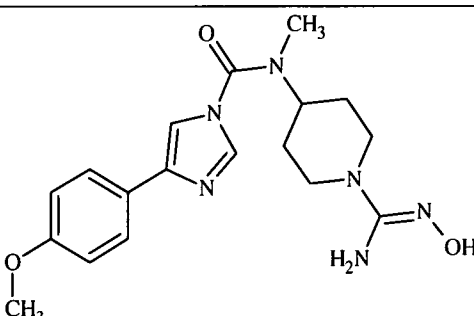
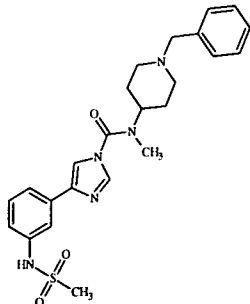
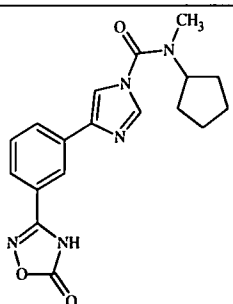
570	 <chem>CN(C(=O)N1CCN(CC1)c2ncnc2c3ccc(F)cc3)CC1CCNCC1.[Br-]</chem>
571	 <chem>CN(C(=O)N1CCN(Cc2ccccc2)CC1)c2ncnc2c3ccc(NC(=O)O)cc3.[Br-]</chem>
572	 <chem>CN(C(=O)N1CCN(Cc2ccccc2)CC1)c2ncnc2c3cc(O)c(NC(=O)O)cc3.[Br-]</chem>
573	 <chem>CN(C(=O)N1CCN(C(=O)N2C=CC=CC=C2Cl)CC1)c2ncnc2c3ccc(OC)cc3.[Br-]</chem>
574	 <chem>CN(C(=O)N1CCN(C(=O)CC)CC1)c2ncnc2c3ccc(O)cc3.[Br-]</chem>

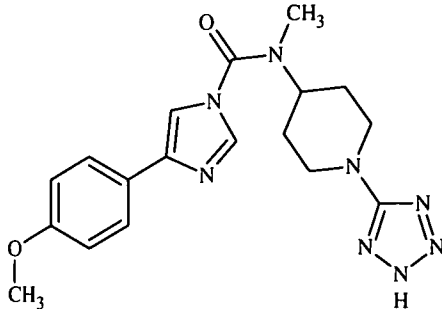
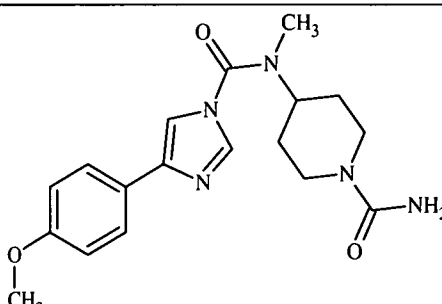
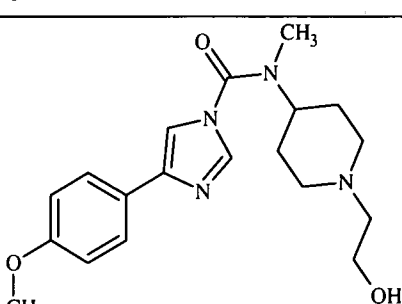
575	 <chem>CN(C(=O)N1CCN(C2CCCCC2)CC1)c2ncnc2c3cc(OC)c(NC(=O)O)cc3.[Cl-]</chem>
576	 <chem>CN(C(=O)N1CCN(C2CCCCC2)CC1)c2ncnc2c3ccc4nn[nH]4cc3.[Cl-]</chem>
577	 <chem>CN(C(=O)N1CCN(Cc2ccccc2)CC1)c2ncnc2c3cc(N)cc(NC(=O)O)c3.[Cl-]</chem>
578	 <chem>CN(C(=O)N1CCN(Cc2ccccc2)CC1)c2ncnc2c3cc(N)cc(S(=O)(=O)N)c3.[Cl-]</chem>
579	 <chem>CN(C(=O)N1CCN(C2CCCCC2)CC1)c2ncnc2c3cc(N)cc(NC(=O)O)c3.[Cl-]</chem>



580	
581	
582	
583	
584	

585	
586	
587	
588	
589	

590	
591	
592	
593	
594	

595	
596	
597	

以上本發明之化合物以熔點以及NMR描述特徵，詳細如下。NMR光譜係在Bruker Avance DPX400光譜儀上紀錄得，以溶劑作為內標。13C光譜在100 MHz下紀錄得，而1H光譜在400 MHz下紀錄得。數據以下列順序記述：近似化學位移(ppm)、質子數、多重性(br，寬峰；d，雙峰；m，多重峰；s，單峰，t；三重峰)以及偶合常數(Hz)。

化合物1 (MP: 89-91)。NMR溶劑：DMSO

13C: 150.4, 137.1, 128.9, 118.6, 65.7, 46.1

1H: 8.04 (1H, s), 7.48 (1H, s), 7.03 (1H, s), 3.65 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.50 (4H, m, J = 5.0 Hz)

化合物2 (MP: 58)。NMR溶劑：CDCl3

13C: 150.2, 142.9, 137.7, 130.3, 129, 128, 125.9, 118.4, 40.1

1H: 7.57 (1H, s), 7.39 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.32 (1H, t, J = 7.3 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.7 Hz), 6.85 (1H, s), 6.81 (1H, s), 3.50 (3H, s)

化合物3 (MP: 97-99)。NMR溶劑：CDCl3

13C: 150.8, 142.7, 136.9, 132.7, 128.7, 127.7, 125.2, 112.8, 66.5, 46.8

1H: 7.92 (1H, s), 7.79 (2H, d, J = 7.8 Hz), 7.47 (1H, s), 7.41 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.30 (1H, m, J = 7.6 Hz), 3.78 (4H, m), 3.68 (4H, m)

化合物4 (MP: 104-105)。NMR溶劑：CDCl3

13C: 150.1, 142.9, 141.4, 137.7, 132.8, 130.4, 128.5,

128.2, 127.4, 126, 125, 113.5, 40.2

¹H: 7.60 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.53 (1H, s), 7.40 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.34 (1H, m), 7.32 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.25 (1H, m), 7.19 (2H, m), 7.18 (1H, s), 3.52 (3H, s)

化合物5 (MP: 117)。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 154.2, 146.9, 136.6, 131.7, 129.9, 129.2, 129.1, 128.8, 126.3, 124.7, 119.8, 106.7

¹H: 9.19 (1H, s), 8.36 (1H, d, J = 2.7 Hz), 7.91 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.67 (2H, d, J = 7.8 Hz), 7.49 (2H, m, J = 7.2 Hz), 7.43 (3H, m), 7.19 (1H, t, J = 7.4 Hz), 6.79 (1H, d, J = 2.7 Hz)

化合物6 (MP: 98-99)。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 156.7, 154.1, 147.2, 131.8, 129.9, 129.5, 129.1, 128.8, 126.2, 121.7, 114.4, 106.5, 55.5

¹H: 9.05 (1H, s), 8.34 (1H, d, J = 2.8 Hz), 7.89 (2H, m, J = 8.4 Hz), 7.55 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.47 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.41 (1H, t, J = 7.3 Hz), 6.94 (2H, m, J = 8.8 Hz), 6.76 (1H, d, J = 2.8 Hz), 3.83 (3H, s)

化合物7 (MP: 62)。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 151.7, 149.1, 145.7, 143.1, 129.6, 127.7, 125.8, 40.5

¹H: 8.64 (1H, s), 7.73 (1H, s), 7.37 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.3 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.8 Hz), 3.56 (3H, s)

化合物8 (MP: 64-65) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.7, 144.6, 141.8, 131.1, 129.3, 126.6, 125.4, 107.3, 40.4

¹H: 8.01 (1H, d br, J = 2.7 Hz), 7.40 (1H, br), 7.33 (2H, m, J = 8.1 Hz), 7.23 (1H, m, J = 7.6 Hz), 7.11 (2H, m, J = 8.3 Hz), 6.25 (1H, d d, J = 1.7, 2.7 Hz), 3.55 (3H, s)

化合物9 (MP: 71-72) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 146.8, 142.3, 136.6, 129.2, 128.7, 124.7, 119.6, 109

¹H: 9.13 (1H, s), 8.33 (1H, d d, J = 0.6, 2.7 Hz), 7.69 (1H, d d, J = 0.6, 1.6 Hz), 7.63 (2H, m, J = 8.7 Hz), 7.40 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.18 (1H, m, J = 7.5 Hz), 6.47 (1H, d d, J = 1.6, 2.7 Hz)

化合物10 (MP: 125-126) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 157.4, 154.3, 154, 147.1, 132, 131.7, 130, 129.8, 129.2, 128.8, 126.3, 123.2, 121.6, 119.7, 118.6, 106.6

¹H: 9.14 (1H, s), 8.36 (1H, d, J = 2.8 Hz), 7.91 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.62 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.49 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.43 (1H, t, J = 7.2 Hz), 7.36 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.12 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.08 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.04 (2H, d, J = 8.2 Hz), 6.80 (1H, d, J = 2.8 Hz)

化合物11 (MP : 110) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 155.9, 154.1, 147.1, 136.8, 131.8, 129.9, 129.8, 129.1, 128.8, 128.6, 128, 127.5, 126.2, 121.7, 115.4, 106.5,

70.3

¹H: 9.06 (1H, s), 8.35 (1H, d, J = 2.7 Hz), 7.90 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.56 (2H, m, J = 9.0 Hz), 7.47 (2H, m), 7.45 (2H, m), 7.43 (1H, m), 7.40 (2H, m), 7.34 (1H, m), 7.03 (2H, m, J = 9.0 Hz), 6.78 (1H, d, J = 2.7 Hz), 5.09 (2H, s)

化合物12 (MP: 79) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 153, 151.3, 144.9, 132.3 (2 sig.), 129.2, 128.5 (2 sig.), 126.7, 125.9, 125.9, 104.7, 40.5

¹H: 8.11 (1H, d, J = 2.5 Hz), 7.40 (2H, m), 7.36 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.28 (4H, m), 7.17 (2H, d, J = 7.8 Hz), 6.55 (1H, d, J = 2.5 Hz), 3.59 (3H, s)

化合物13 (MP: 79-80) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 153.7, 151, 133.3, 132.1, 128.8, 128.7, 126, 104.9, 66.8, 47

¹H: 8.19 (1H, d, J = 2.8 Hz), 7.83 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.44 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.39 (1H, m, J = 7.2 Hz), 6.70 (1H, d, J = 2.8 Hz), 4.0 (4H, s br), 3.84 (4H, m)

化合物14 (MP: 132) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150, 142.9, 141.4, 137.9, 133.5, 132.8, 130.4, 130.1, 128.2, 128.2, 128.1, 127.6, 126.2, 126, 125.7, 123.6, 123.3, 114, 40.2

¹H: 8.19 (1H, s), 7.85-7.77 (3H, m), 7.64 (1H, d d, J = 1.8, 8.7 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (4H, m), 7.36 (1H, m, J = 7.4 Hz), 7.34 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.21 (2H, m, J = 8.1

Hz), 3.54 (3H, s)

化合物15 (MP: 134) 。 NMR溶劑：丙酮

^{13}C : 154.8, 148.1, 141.2, 138, 137.9, 133, 131.1, 129.9, 129.8, 129.7, 128.2, 128.1, 127.6, 127.1, 121.5, 107.4

^1H : 10.05 (1H, s), 8.45 (1H, d, $J = 3.0$ Hz), 8.03 (2H, m, $J = 8.7$ Hz), 7.94 (2H, m, $J = 8.6$ Hz), 7.72 (2H, m, $J = 8.6$ Hz), 7.69 (2H, m, $J = 8.3$ Hz), 7.49 (2H, m), 7.47 (2H, m), 7.43 (1H, m), 7.36 (1H, m, $J = 7.4$ Hz), 7.06 (1H, d, $J = 3.0$ Hz)

化合物16 (MP: 119-120) 。 NMR溶劑： CDCl_3

^{13}C : 159.2, 150.1, 141.2, 137.9, 135.5, 133.6, 132.8, 130.2, 128.2, 128.1, 127.6, 127.3, 126.2, 125.7, 123.6, 123.3, 115.5, 114.2, 55.5, 40.5

^1H : 8.21 (1H, m), 7.82-7.80 (3H, m), 7.67 (1H, d d, $J = 1.7, 8.6$ Hz), 7.49 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.45 (2H, m), 7.42 (1H, m), 7.14 (2H, m, $J = 9.0$ Hz), 6.93 (2H, m, $J = 9.0$ Hz), 3.81 (3H, s), 3.50 (3H, s)

化合物17 (MP: 138) 。 NMR溶劑： CDCl_3

^{13}C : 159.1, 150.1, 141.2, 137.7, 135.5, 132.8, 128.6, 127.4, 127.3, 125, 115.5, 113.7, 55.5, 40.5

^1H : 7.64 (2H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.47 (1H, s), 7.35 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 7.30 (1H, s), 7.25 (1H, m, $J = 7.4$ Hz), 7.11 (2H, s, $J = 8.6$ Hz), 6.91 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 3.81 (3H, s), 3.49 (3H, s)

化合物18 (MP: 123-124) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.9, 143.4, 142.7, 141.5, 132.4, 130.3, 127.6, 125.4, 124.8, 123.9, 120.2, 114, 39.7

¹H: 7.95 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.69 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.54 (1H, s), 7.38 (1H, m), 7.33 (2H, m), 7.32 (1H, m), 7.25 (1H, m), 7.12 (2H, d, J = 7.8 Hz), 3.58 (3H, s)

化合物19 (MP: 104) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 149.4, 145.3, 133.1, 129.5, 125.4, 119.9, 113.6, 66.7, 48.2, 45.6

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.01 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.47 (1H, t, J = 7.6 Hz), 3.96 (4H, s br), 3.89 (4H, s br)

化合物20 (MP: 181-183) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 153, 147.4, 140.6, 139.5, 137.4, 130.8, 130.7, 129, 128.8, 127.8, 127, 126.8, 126.7, 124.4, 121, 106.8

¹H: 10.36 (1H, s), 8.51 (1H, d, J = 2.6 Hz), 8.18 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.82 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.78 (2H, m), 7.76 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.50 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.41 (2H, m), 7.39 (1H, m), 7.19 (1H, d, J = 2.6 Hz), 7.19 (1H, m)

化合物21 (MP: 208-211) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 150, 147.8, 143.2, 140.7, 140, 134.5, 130.5, 126.8, 106.1, 66, 46.6

¹H: 9.35 (1H, s), 8.86 (2H, m), 8.40 (1H, d, J = 2.5 Hz), 8.02 (1H, t br, J = 6.3 Hz), 7.31 (1H, d, J = 2.5 Hz), 3.77 (4H,

br), 3.71 (4H, br)

化合物22 (MP: 168-170) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 159.6, 153, 147.3, 140.6, 139.5, 138.6, 130.8, 130.7, 129.6, 129, 127.8, 127, 126.9, 126.7, 113, 109.9, 106.9, 106.6, 55.2

^1H : 10.32 (1H, s), 8.50 (1H, d, $J = 3.0$ Hz), 8.18 (2H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.81 (2H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.76 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.75 (1H, t, $J = 2.3$ Hz), 7.50 (2H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.42 (1H, m), 7.39 (1H, m, $J = 7.2$ Hz), 7.31 (1H, t, $J = 8.5$ Hz), 7.19 (1H, d, $J = 3.0$ Hz), 6.76 (1H, m, $J = 1.0, 2.4, 8.3$ Hz), 3.76 (3H, s)

化合物23 (MP: 163) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 156.2, 152.9, 147.5, 140.5, 139.5, 130.8, 130.7, 130.2, 129, 127.8, 127, 126.8, 126.7, 122.9, 113.9, 106.6, 55.3

^1H : 10.25 (1H, s), 8.49 (1H, d, $J = 2.6$ Hz), 8.18 (2H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.82 (2H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.77 (2H, d, $J = 7.4$ Hz), 7.66 (2H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.50 (2H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.40 (1H, t, $J = 7.3$ Hz), 7.16 (1H, d, $J = 2.6$ Hz), 6.98 (2H, d, $J = 9.0$ Hz), 3.77 (3H, s)

化合物24 (MP: 99) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.9, 150.1, 149.4, 147.4, 144.7, 133, 132.6, 129.3, 128.1, 126.9, 125.9, 123.4, 104.6, 40.5

^1H : 8.61 (1H, s), 8.50 (1H, d, $J = 4.9$ Hz), 8.16 (1H, d, J

= 2.6 Hz), 7.65 (1H, d, $J = 7.9$ Hz), 7.36 (2H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.29 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.22 (1H, d d, $J = 4.9, 7.9$ Hz), 7.17 (2H, d, $J = 7.8$ Hz), 6.59 (1H, d, $J = 2.6$ Hz), 3.58 (3H, s)

化合物25 (MP: 137) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.6, 150.7, 144.5, 140.1, 139.5, 133, 131, 129.1, 129, 127.7, 126.8, 126.6, 126.5, 126.1, 125.8, 105.1, 40

^1H : 8.22 (1H, d, $J = 2.5$ Hz), 7.69 (2H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.64 (2H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.59 (2H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.46 (2H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.37 (3H, m), 7.26 (3H, m), 6.92 (1H, d, $J = 2.5$ Hz), 3.48 (3H, s)

化合物26 (MP: 123-125) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.9, 146.5, 141.4, 130.3, 129.3, 129, 128.9, 128.3, 127.3, 126.9, 124.1, 120, 38.9

^1H : 7.43-7.24 (6H, m), 7.14-6.93 (4H, m), 6.33 (2H, br), 3.37 (3H, s br)

化合物27 (MP: 121) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.9, 142.8, 140.3, 137.8, 133, 131.3, 130.4, 128.7, 128.2, 126.2, 126, 113.7, 40.2

^1H : 7.54 (2H, m, $J = 8.6$ Hz), 7.50 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.42 (2H, m, $J = 7.7$ Hz), 7.35 (1H, m, $J = 7.4$ Hz), 7.29 (2H, m, $J = 8.6$ Hz), 7.19 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.18 (2H, m), 3.52 (3H, s)

化合物28 (MP: 127) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159, 150.1, 142.9, 141.2, 137.6, 130.3, 128.1,

126.3, 125.9, 125.5, 113.9, 112.4, 55.2, 40.2

^1H : 7.53 (2H, m, $J = 8.9$ Hz), 7.51 (1H, d, $J = 1.4$ Hz), 7.41 (2H, m, $J = 7.9$ Hz), 7.34 (1H, m, $J = 7.5$ Hz), 7.19 (2H, m, $J = 8.3$ Hz), 7.09 (1H, d, $J = 1.4$ Hz), 6.87 (2H, m, $J = 8.9$ Hz), 3.80 (3H, s), 3.52 (3H, s)

化合物29 (MP: 127-129) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.2 (d, $J = 246.0$ Hz), 150.0, 142.9, 140.5, 137.8, 130.4, 129.0 (d, $J = 3.3$ Hz), 128.2, 126.7 (d, $J = 8.0$ Hz), 126.0, 111.5 (d, $J = 21.5$ Hz), 113.2, 40.2

^1H : 7.57 (2H, m, $J = 5.4, 9.0$ Hz), 7.50 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.43 (2H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.35 (1H, m, $J = 7.3$ Hz), 7.18 (2H, m), 7.15 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.01 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 3.52 (3H, s)

化合物30 (MP: 126) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.5 (d, $J = 249.0$ Hz), 150.0, 142.8, 137.3, 135.1 (d, $J = 2.6$ Hz), 130.3, 128.3 (d, $J = 8.6$ Hz), 128.2, 127.7 (d, $J = 4.0$ Hz), 125.9, 124.2 (d, $J = 3.2$ Hz), 120.7 (d, $J = 12.8$ Hz), 117.7 (d, $J = 16.0$ Hz), 115.4 (d, $J = 22.0$ Hz), 40.2

^1H : 8.02 (1H, d t, $J = 2.0, 7.6$ Hz), 7.65 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.41 (2H, m), 7.34 (1H, m), 7.31 (1H, d d, $J = 1.3, 3.6$ Hz), 7.19 (2H, m), 7.16 (1H, m), 7.15 (1H, m, $J = 1.6, 7.4$), 7.03 (1H, m, $J = 1.5, 7.8, 11.4$ Hz), 3.53 (3H, s)

化合物31 (MP: 128-129) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.8, 150, 142.9, 141.2, 137.7, 134.2, 130.4,

129.6, 128.2, 126, 117.4, 113.8, 113.6, 109.9, 55.2, 40.2

¹H: 7.52 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.41 (2H, m, J = 7.8 Hz),
7.34 (1H, m, J = 7.4 Hz), 7.23 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.21 (1H,
m), 7.19 (3H, m), 7.16-7.13 (1H, m), 6.79 (1H, d d d, 1.0, 2.5,
8.0 Hz), 3.81 (3H, s), 3.52 (3H, s)

化合物32 (MP: 144-146) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 149.7, 143.5, 143.4, 136, 133.4, 129.6, 127.6,
126.4, 126, 120.7, 113.3, 40.4

¹H: 8.10 (1H, d, J = 1.6 Hz), 7.91 (1H, d, J = 8.8 Hz),
7.40 (1H, d d, J = 1.6, 8.8 Hz), 7.34 (2H, m, J = 7.9 Hz), 7.27
(1H, m), 7.17 (2H, d, J = 7.6 Hz), 3.67 (3H, s)

化合物33 (MP: 112) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 149.7, 145.6, 143.4, 131.5, 131, 130.1, 129.6,
127.6, 125.9, 119.3, 114.2, 40.4

¹H: 8.0 (1H, d, J = 8.9 Hz), 7.98 (1H, d, J = 1.6 Hz),
7.57 (1H, d d, J = 1.6, 8.9 Hz), 7.34 (2H, t, J = 8.1 Hz), 7.27
(1H, m), 7.17 (2H, d, J = 7.8 Hz), 3.67 (3H, s)

化合物34 (MP: 89-90) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.2, 145, 143.6, 132.8, 129.5, 129.3, 127.4,
125.9, 125.1, 119.9, 113.2, 40.3

¹H: 8.06 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz),
7.61 (1H, m, J = 7.7 Hz), 7.43 (1H, m, J = 7.7 Hz), 7.32 (2H,
t, J = 7.8 Hz), 7.25 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.18 (2H, d, J = 7.5
Hz), 3.68 (3H, s)

化合物35 (MP: 166-169) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 149.8, 142.9, 139.7, 139.7, 138.7, 137.9, 132.1, 129.9, 129, 127.7, 127.4, 126.9, 126.5, 126.2, 125.2, 114.5, 39.6

^1H : 7.73 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.69-7.61 (6H, m), 7.48-7.39 (4H, m), 7.39-7.30 (4H, m), 3.44 (3H, s)

化合物36 (MP: 油狀) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 160.8 (d, $J = 245$ Hz), 158.6, 149.9, 140.2, 139.3 (d, $J = 3$ Hz), 137.6, 128.6 (d, $J = 9$ Hz), 126.0, 125.6, 116.7 (d, $J = 23.5$ Hz), 114.1, 113.0, 55.1, 39.5

^1H : 7.69 (1H, s), 7.57 (2H, d, $J = 8.7$ Hz), 7.45 (1H, s), 7.41 (2H, m), 7.25 (2H, t, $J = 8.7$ Hz), 6.90 (2H, d, $J = 8.7$ Hz), 3.73 (3H, s), 3.40 (3H, s)

化合物37 (MP: 162-164) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.7, 142, 137.6, 137.4, 132.8, 131.7, 128.9, 128.6, 127.5, 127.1, 125.8, 125.1, 123, 113.1, 45.8, 26.6, 23.9

^1H : 7.68 (1H, s), 7.68 (2H, d, $J = 7.7$ Hz), 7.36 (2H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.28 (1H, s), 7.26 (1H, m), 7.23 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 7.11 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.03 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 6.75 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 3.92 (2H, t, $J = 6.6$ Hz), 2.87 (2H, t, $J = 6.6$ Hz), 2.11 (2H, qt, $J = 6.6$ Hz)

化合物38 (MP: 232-233) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 158.3, 147.9, 141.9, 137.2, 135.4, 129.9, 128.2,

126.9, 126.3, 118.8, 115.8, 114, 39.9

¹H: 8.79 (1H, s), 8.78 (1H, s), 7.67 (1H, s), 7.43 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.41 (4H, m), 7.34 (1H, m), 6.80 (2H, m, J = 8.6 Hz), 3.74 (3H, s)

化合物39 (MP: 97-98) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 159.9, 149.6, 141.8, 137.6, 137.4, 134.2, 131.8, 129.6, 128.9, 127.1, 125.8, 123, 117.5, 113.7, 113.4, 110.1, 55.3, 45.8, 26.6, 23.9

¹H: 7.68 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.29 (1H, m), 7.28 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.24 (2H, m), 7.23 (1H, m), 7.12 (1H, d t, J = 1.2, 7.5 Hz), 7.04 (1H, d t, J = 1.5, 8.0 Hz), 6.83 (1H, d d d, 1.5, 2.5, 7.5 Hz), 6.75 (1H, d br, J = 8.0 Hz), 3.93 (2H, t, J = 6.7 Hz), 3.84 (3H, s), 2.88 (2H, t, J = 6.6 Hz), 2.12 (2H, qt, J = 6.6 Hz)

化合物40 (MP: 139-141) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 157.6, 149.7, 142.8, 139.9, 137.7, 133.9, 129.9, 129.7, 127.7, 126.2, 115.5, 114.3, 114.2, 111.5, 39.6

¹H: 9.43 (1H, s), 7.68 (1H, s), 7.43 (1H, s), 7.41 (2H, m), 7.35 (2H, m), 7.32 (1H, m), 7.11 (1H, t), 7.03 (1H, br), 7.02 (1H, m), 6.62 (1H, d, J = 8.0 Hz), 3.42 (3H, s)

化合物41 (MP: 152) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 150.6, 148.8, 144.7, 132.5, 129.6, 129.1, 125.5, 119.6, 119.5, 115.9, 113.4, 48.3, 47.1, 44.8

¹H: 8.21 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.97 (1H, d, J = 8.3 Hz),

7.71 (1H, m, $J = 7.8$ Hz), 7.55 (1H, m, $J = 7.6$ Hz), 7.25 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.0 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 6.83 (1H, t, $J = 7.3$ Hz), 3.92 (4H, m), 3.33 (4H, m)

化合物42 (MP: 79-80) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 148.6, 144.7, 140, 132.5, 129.4, 129.1, 128.3, 125.9, 125.4, 119.6, 113.1, 47.6, 45, 41.9, 37.1, 31.6

^1H : 8.18 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.90 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.68 (1H, m, $J = 8.0$ Hz), 7.53 (1H, m, $J = 7.6$ Hz), 7.29 (2H, t, $J = 7.3$ Hz), 7.20 (2H, d, $J = 7.3$ Hz), 7.19 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 4.20 (2H, s br), 3.13 (2H, s br), 2.58 (2H, d, $J = 7.2$ Hz), 1.88 (1H, m), 1.70 (2H, br), 1.34 (2H, m, $J = 4.0, 12.5$ Hz)

化合物43 (MP: 105) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 161.7 (d, $J = 250.0$ Hz), 149.8, 140.5, 138.8 (d, $J = 3.6$ Hz), 137.7, 133.1, 131.2, 128.8, 127.8 (d, $J = 8.4$ Hz), 126.3, 117.4 (d, $J = 23.2$ Hz), 113.6, 40.4

^1H : 7.56 (2H, m, $J = 8.8$ Hz), 7.49 (1H, d, $J = 1.4$ Hz), 7.31 (2H, m, $J = 8.8$ Hz), 7.23 (1H, d, $J = 1.4$ Hz), 7.17 (2H, m), 7.12 (2H, m), 3.50 (3H, s)

化合物44 (MP: 145) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.3 (d, $J = 246.5$ Hz), 149.6, 141.1, 137.6, 137.5, 131.8, 129.0 (d, $J = 3.0$ Hz), 129, 127.1, 126.8 (d, $J = 8.0$ Hz), 125.9, 123, 115.5 (d, $J = 21.5$ Hz), 112.8 (d, $J = 1.6$ Hz), 45.8, 26.6, 23.9

^1H : 7.65 (2H, m), 7.65 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.24 (1H, m),

7.23 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.12 (1H, m), 7.05 (2H, m, $J = 8.9$ Hz), 7.05 (1H, m, $J = 1.2, 7.5$ Hz), 6.75 (1H, m, $J = 8.1$ Hz), 3.92 (2H, t, $J = 6.6$ Hz), 2.88 (2H, t, $J = 6.6$ Hz), 2.12 (2H, qt, $J = 6.6$ Hz)

化合物45 (MP: 93-96) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 161.7 (d, $J = 249.5$ Hz), 159.6 (d, $J = 249.0$ Hz), 150.0, 138.9 (d, $J = 3.5$ Hz), 137.2, 135.3 (d, $J = 2.0$ Hz), 128.4 (d, $J = 8.3$ Hz), 127.8 (d, $J = 8.3$ Hz), 127.7 (d, $J = 4.0$ Hz), 124.3 (d, $J = 3.2$ Hz), 120.6 (d, $J = 13.0$ Hz), 117.5 (d, $J = 16.0$ Hz), 117.4 (d, $J = 23.0$ Hz), 115.5 (d, $J = 22.0$ Hz), 40.3

^1H : 8.03 (1H, d t, $J = 2.0, 7.8$ Hz), 7.68 (1H, d, $J = 1.4$ Hz), 7.30 (1H, d d, $J = 1.4, 3.5$ Hz), 7.19 (2H, m), 7.16 (1H, m), 7.15 (1H, m), 7.10 (2H, m), 7.04 (1H, d d d, $J = 1.4, 7.9, 11.3$ Hz), 3.50 (3H, s)

化合物46 (MP: 90-91) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 158.9 (d, $J = 238.0$ Hz), 154, 131.7, 130.2 (d, 10.0 Hz), 127.5, 114.2 (d, $J = 9.5$ Hz), 111.9 (d, $J = 26.0$ Hz), 106.3 (d, $J = 27.5$ Hz), 106.2, 66.6, 47.1

^1H : 7.66 (1H, d d, $J = 4.5, 9.1$ Hz), 7.34 (1H, d, $J = 3.5$ Hz), 7.25 (1H, d d, $J = 2.5, 9.0$ Hz), 7.05 (1H, d t, $J = 2.5, 9.1$ Hz), 6.58 (1H d d, $J = 0.7, 3.5$ Hz), 3.80 (4H, m, $J = 5.0, 6.0$ Hz), 3.62 (4H, m, $J = 5.0, 6.0$ Hz)

化合物47 (MP: 112-113) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

¹³C: 155.5, 154.4, 130.3, 130, 126.7, 114, 113.2, 106.1, 103.1, 66.7, 55.7, 47.1

¹H: 7.60 (1H, d, J = 8.9 Hz), 7.30 (1H, d, J = 3.5 Hz), 7.06 (1H, d br, J = 2.5 Hz), 6.95 (1H, d d, J = 2.5, 8.9 Hz), 6.55 (1H, d d, J = 0.7, 3.5 Hz), 3.86 (3H, s), 3.79 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.61 (4H, m, J = 5.0 Hz)

化合物48 (MP: 184) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 162.4, 148.7, 147.4, 147, 144.7, 132.5, 129.6, 128.6, 125.5, 123.3, 119.7, 113.4, 109.9, 108.1, 101.1, 60.5, 51.4, 46.5, 43.8

¹H: 8.20 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.93 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.71 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.54 (1H, t, J = 7.5 Hz), 6.97 (1H, s br), 6.91 (1H, d, J = 8.0 Hz), 6.85 (1H, d d, J = 1.5, 8.0 Hz), 6.02 (2H, s), 3.84 (4H, m), 3.75 (2H, s), 2.80 (4H, m)

化合物49 (MP: 89) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 158.6, 148.9, 147.6, 144.7, 137.8, 132.5, 129.6, 125.5, 119.6, 113.5, 113.4, 107.3, 46.9, 44.4

¹H: 8.21 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.15 (1H, d d, J = 1.5, 4.8 Hz), 7.97 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.71 (1H, m), 7.58 (1H, m), 7.55 (1H, m), 6.88 (1H, d, J = 8.7 Hz), 6.69 (1H, d d, J = 4.8, 7.1 Hz), 3.88 (4H, m), 3.71 (4H, m)

化合物50 (MP: 113-114) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 149.2, 144.7, 134.4, 132.6, 129.5, 128.6, 128.6, 126.8, 126.5, 126.3, 125.5, 119.6, 113.5, 48.6, 46.7, 45.5,



42.8, 28.8, 27.2

¹H: 8.21 (1H, d t, J = 0.8, 8.3 Hz), 7.95 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.70 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.54 (1H, d d d, J = 1.0, 7.1, 8.3 Hz), 7.24 (4H, br), 4.94 (2H, br), 3.96 (2H, t, J = 6.0 Hz), 3.04 (2H, t, J = 6.0 Hz)

化合物51 (MP: 188) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 158.6, 150.8, 142.6, 138.8, 138.6, 134.8, 133.7, 130.8, 130, 127.8, 127, 124.1, 117.6, 115.8, 114.9, 113, 47.1, 27.5, 24.9

¹H: 7.76 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.36 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.28 (1H, d br, J = 7.7 Hz), 7.15 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.13 (1H, t), 7.09 (1H, m), 7.07 (1H, m), 7.04 (1H, d t, J = 1.5, 8.0 Hz), 6.79 (1H, d br, J = 8.2 Hz), 6.69 (1H, d d d, J = 1.1, 2.5, 8.0 Hz), 3.91 (2H, t, J = 6.5 Hz), 2.90 (2H, t, J = 6.5 Hz), 2.10 (2H, qt, J = 6.5 Hz)

化合物52 (MP: 174) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 153.5, 152.6, 130.2, 129.1, 127.3, 113.8, 112.9, 105.1, 105, 65.9, 46.5

¹H: 9.09 (1H, s), 7.47 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.44 (1H, d, J = 3.5 Hz), 6.91 (1H, d, J = 2.0 Hz), 6.74 (1H, d d, J = 2.0, 9.0 Hz), 6.50 (1H, d, J = 3.5 Hz), 3.67 (4H, m), 3.47 (4H, m)

化合物53 (MP:油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.9, 145.3, 135.7, 133.2, 129.4, 128.8, 128.1 (br), 128.0, 125.2, 119.8, 113.7, 55.3, 53.8, 37.7

^1H : 8.11 (1H, d, $J = 8.2$ Hz), 8.06 (1H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.63 (1H, t, $J = 7.4$ Hz), 7.48 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.40 (5H, br), 4.94 (2H, br), 3.31 (3H, br)

化合物 54 (MP: 218-220) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 161.8 (d, $J = 251.0$ Hz), 159, 146.3, 136.7 (d, $J = 4.0$ Hz), 136, 134.3, 127.9 (d, $J = 9.0$ Hz), 127, 117.2 (d, $J = 23.0$ Hz), 115.9, 115.6, 113.6, 40.1

^1H : 8.89 (1H, m), 7.18 (2H, m), 7.09 (2H, m, $J = 8.7$ Hz), 7.05 (1H, m), 6.95 (2H, m, $J = 8.6$ Hz), 6.65 (2H, m, $J = 8.7$ Hz), 3.35 (3H, s)

化合物 55 (MP: 116) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.3, 145.3, 133.2, 129.3, 125.2, 119.8, 113.5, 106.6, 64.6, 46.1, 43.6, 35.3

^1H : 8.09 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.99 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.61 (1H, t, $J = 8.1$ Hz), 7.46 (1H, t, $J = 7.4$ Hz), 4.03 (4H, s), 3.98 (4H, br), 1.93 (4H, t, $J = 6.0$ Hz)

化合物 56 (MP: 134) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 157.1, 154.5, 146.6, 146.5, 131.6, 131.3, 130.3, 129.8, 125.7, 123.4, 121.9, 120.2, 119.7, 118.7, 114

^1H : 9.15 (1H, s), 8.35 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 8.15 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.69 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.65 (2H, m, $J = 9.2$ Hz), 7.52 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.37 (2H, t, $J = 8.1$ Hz), 7.14 (1H, t, $J = 7.3$ Hz), 7.10 (2H, m, $J = 9.2$ Hz), 7.05 (2H, m, $J = 8.5$ Hz)

化合物57 (MP: 156-157) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 157.2, 146.6, 146.4, 131.6, 130.2, 128.9, 125.6, 122, 120.2, 114.5, 114, 55.5

¹H: 9.06 (1H, s), 8.34 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.14 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.67 (1H, m, J = 7.5 Hz), 7.59 (2H, m, J = 9.1 Hz), 7.51 (1H, m, J = 7.8 Hz), 6.97 (2H, m, J = 9.1 Hz), 3.85 (3H, s)

化合物58 (MP: 101-102) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.4, 145.2, 133.2, 129.1, 125, 119.7, 113.5, 57.1, 32.4, 30.4, 29.7, 25.5, 25.3

¹H: 8.09 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.60 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.45 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.26 (1H, br), 3.18 (3H, s), 2.0 (2H, d br, J = 11.0 Hz), 1.87 (2H, br), 1.67 (1H, br), 1.63 (2H, m, J = 3.0, 12.3 Hz), 1.43 (2H, m), 1.16 (1H, m)

化合物59 (MP: 148-150) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 160.6 (d d, J = 11.5, 248.0 Hz), 153.4 (d d, J = 12.0, 249.0 Hz), 146.5, 146.4, 131.5, 130.5, 125.9, 122.7 (d d, J = 2.0, 9.3 Hz), 121.0 (d d, J = 3.7, 11.0 Hz), 120.4, 113.8, 111.6 (d d, J = 4.0, 22.5 Hz), 104.2 (d d, J = 22.5, 27.0 Hz)

¹H: 9.28 (1H, s), 8.32 (1H, m, J = 8.3 Hz), 8.27 (1H, m, J = 6.0, 8.9 Hz), 8.17 (1H, m, J = 8.3 Hz), 7.70 (1H, m, J = 8.2 Hz), 7.53 (1H, m, J = 8.1 Hz), 7.0 (2H, m)

化合物60 (MP: 142-143) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

^{13}C : 146.5, 146.4, 136.1, 131.6, 130.3, 129.4, 125.7, 125.3, 120.2, 120, 114

^1H : 9.19 (1H, s), 8.35 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 8.15 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.70 (2H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.69 (1H, m), 7.52 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.45 (2H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.25 (1H, t, $J = 7.4$ Hz)

化合物61 (MP: 109) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.2, 146.3, 136.9, 131.6, 130, 128.9, 128, 127.8, 125.5, 120, 113.9, 44.4

^1H : 8.32 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 8.11 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.67 (1H, m), 7.65 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.49 (1H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.43 (2H, m), 7.40 (2H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.34 (1H, m), 4.75 (2H, d, $J = 6.0$ Hz)

化合物62 (MP: 195-197) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 146.5, 146.3, 134.7, 131.5, 130.4 (2 sig.), 129.4, 125.9, 121.2, 120.3, 113.9

^1H : 9.19 (1H, s), 8.34 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 8.16 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.70 (1H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.66 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.53 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.42 (2H, d, $J = 8.8$ Hz)

化合物63 (MP: 62) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150, 145, 142.2, 133.1, 132.8, 129.7, 129.5, 127.3, 125.3, 119.9, 113.3, 40.3

^1H : 8.06 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 8.02 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.62 (1H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.45 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.30 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.13 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 3.65 (3H, s)

化合物64 (MP: 84-85) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 161.9, 160.9, 149.1, 146.3, 143.5, 129.5, 128, 127.5, 126.1, 122.4, 113.8, 55.2, 40.4

¹H: 8.66 (1H, s), 7.71 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.32 (1H, t, J = 7.2 Hz), 7.19 (2H, d, J = 7.9 Hz), 6.87 (2H, d, J = 8.5 Hz), 3.82 (3H, s), 3.58 (3H, s)

化合物65 (MP: 105-106) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 162.6, 161.2, 148.8, 147.3, 128.3, 122.3, 114.1, 66.6, 55.3, 46.9

¹H: 8.81 (1H, s), 8.06 (2H, d, J = 8.9 Hz), 6.98 (2H, d, J = 8.9 Hz), 3.98 (4H, br), 3.87 (3H, s), 3.83 (4H, m br)

化合物66 (MP: 116) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 162.1, 161.5 (d, J = 248.0 Hz), 161, 149.1, 146.5, 139.5 (d, J = 3.5 Hz), 128.1 (d, J = 9.0 Hz), 128, 122.3, 116.3 (d, J = 22.5 Hz), 113.9, 55.3, 40.7

¹H: 8.74 (1H, s), 7.72 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.20 (2H, m, J = 5.0, 9.0 Hz), 7.09 (2H, t, J = 8.8 Hz), 6.89 (2H, d, J = 8.9 Hz), 3.83 (3H, s), 3.56 (3H, s)

化合物67 (MP: 91) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 161.2, 148.8, 146.5, 143.3, 135.8, 129.5, 128.7, 128.3, 127.8, 127.7, 126.1, 40.5

¹H: 8.69 (1H, s), 7.69 (2H, m, J = 8.3 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.32 (1H, m), 7.31 (2H, m, J = , 8.3 Hz), 7.19 (2H, d, J = 8.0 Hz), 3.58 (3H, s)

化合物68 (MP: 120-121) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 161.9, 148.5, 147.6, 136.2, 129, 128.2, 128.1, 66.6, 47.5, 46

¹H: 8.84 (1H, s), 8.06 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.44 (2H, d, J = 8.7 Hz), 3.98 (4H, br), 3.84 (4H, s br)

化合物69 (MP: 127-128) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 161.6 (d, J = 248.5 Hz), 161.4, 148.8, 146.7, 139.3 (d, J = 3.3 Hz), 135.9, 128.8, 128.2, 128.1 (d, J = 8.5 Hz), 127.8, 116.3 (d, J = 23.0 Hz), 40.7

¹H: 8.76 (1H, s), 7.71 (2H, d, J = 7.0 Hz), 7.35 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.19 (2H, m), 7.09 (2H, t, J = 8.5 Hz), 3.56 (3H, s)

化合物70 (MP: 91-92) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 161.8 (d d, J = 11.5, 251.0 Hz), 157.7 (d d, J = 12.5, 252.0 Hz), 150.1, 144.9, 132.7, 129.6, 129.3 (d d, J = 1.5, 10.0 Hz), 127.7 (d d, J = 5.0, 12.0 Hz), 125.4, 119.9, 113.5, 112.1 (d d, J = 4.0, 23.0 Hz), 105.1 (d d, J = 24.0, 26.5 Hz), 39.7

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.01 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.63 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.30 (1H, m), 6.88 (1H, m), 6.84 (1H, m), 3.60 (3H, s)

化合物71 (MP: 65-66) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 146.1, 145.3, 132.8, 129.4, 125.5, 119.8, 114.4, 82.5, 79.6, 62.2, 23

¹H: 8.23 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz),

7.62 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.48 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 5.54 (2H, s),
3.90 (2H, s), 1.69 (6H, s)

化合物72 (MP: 85)。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 152, 142.2, 138.9, 130.1, 124.2, 122.8, 119.8,
115.2, 67.1, 47.2

¹H: 8.09 (1H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.69 (1H, d, $J = 8.2$ Hz),
7.58 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.36 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 3.87 (4H,
br), 3.80 (4H, br)

化合物73 (MP: 80)。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 162.8, 148.7, 147.4, 130.2, 129.6, 128.7, 126.7,
66.6, 47.3, 46.2

¹H: 8.85 (1H, s), 8.12 (2H, m), 7.47 (3H, m), 4.02 (4H,
br), 3.84 (4H, m)

化合物74 (MP: 114)。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 162.4, 162.0 (d d, $J = 15.0, 251.0$ Hz), 158.0 (d d,
 $J = 13.0, 252.0$ Hz), 148.9, 146.7, 130.0, 129.6, 129.2 (d d, J
 $= 2.0, 10.0$ Hz), 128.6, 127.6 (m, $J = 13.0$ Hz), 126.5, 111.8
(d d, $J = 4.0, 22.5$ Hz), 104.8 (t, $J = 25.0$ Hz), 39.9

¹H: 8.86 (1H, s), 7.74 (2H, br), 7.38 (3H, m br), 7.28
(1H, m), 6.95 (1H, m), 6.92 (1H, m), 3.52 (3H, s)

化合物75 (MP: 油狀)。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 150.5, 145.2, 133.2, 129.2, 125.1, 119.7, 113.6,
51.7, 50.4, 38.0, 35.7, 30.1, 29.0, 19.8, 13.8

¹H: 8.10 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 8.0 (1H, d, $J = 8.3$ Hz),

7.59 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.45 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 3.67 (2H, br), 3.31 (3H, m br), 1.78 (2H, m), 1.45-1.30 (2H, m br), 1.0-0.9 (3H, m br)

化合物76 (MP: 130) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.3, 150.1, 144.9, 135.3, 132.8, 129.2, 126.8, 125, 119.8, 115.8, 113.2, 66.7, 48.7, 40.5

^1H : 8.04 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 8.0 (1H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.60 (1H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.42 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.08 (2H, d, $J = 7.7$ Hz), 6.80 (2H, d, $J = 8.7$ Hz), 3.83 (4H, m), 3.63 (3H, s), 3.13 (4H, m)

化合物77 (MP: 163-138) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 161.2, 150.1, 145.2, 145, 132.8, 129.3, 125.1, 119.8, 113.2, 104.4, 99.1, 55.4, 40.3

^1H : 8.05 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 8.02 (1H, d, $J = 8.9$ Hz), 7.61 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.44 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 6.34 (1H, t, $J = 2.0$ Hz), 6.31 (2H, d, $J = 2.0$ Hz), 3.70 (6H, s), 3.65 (3H, s)

化合物78 (MP: 155-157) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 163.8 (d d, $J = 12.0, 253.0$ Hz), 160.8 (d d, $J = 12.0, 258.0$ Hz), 158.4 (d, $J = 6.0$ Hz), 148.4, 146.9, 131.5 (d d, $J = 4.0, 10.0$ Hz), 114.3 (d d, $J = 4.0, 11.5$ Hz), 111.8 (d d, $J = 4.0, 21.5$ Hz), 105.0 (t, $J = 25.0$ Hz), 66.6, 47.9, 45.9

^1H : 8.87 (1H, s), 8.12 (1H, m, $J = 6.7, 8.5$ Hz), 7.0 (1H, m), 6.95 (1H, m), 4.10 (4H, br), 3.83 (4H, s br)



化合物79 (MP: 86) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 163.8 (d d, J = 12.0, 253.0 Hz), 160.8 (d d, J = 12.5, 259.0 Hz), 158.2 (d, J = 5.5 Hz), 148.5, 146.7, 139.7, 131.5 (d d, J = 4.0, 10.0 Hz), 129, 128.3, 126.1, 114.6 (d d, J = 4.0, 11.0 Hz), 111.7 (d d, J = 4.5, 21.0 Hz), 105.0 (t, J = 26.0 Hz), 47.7, 46.2, 42.8, 38, 31.9

¹H: 8.83 (1H, s), 8.13 (1H, m, J = 6.8, 8.3 Hz), 7.31 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.23 (1H, m, J = 7.3 Hz), 7.17 (2H, d, J = 7.8 Hz), 7.0 (1H, m), 6.96 (1H, m), 4.62 (2H, m br), 3.02 (2H, br), 2.61 (2H, d, J = 6.9 Hz), 1.87 (1H, m), 1.81 (2H, d br, J = 14.0 Hz), 1.43 (2H, m, J = 4.0, 13.0 Hz)

化合物80 (MP: 91) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 163.7 (d d, J = 12, 253.5 Hz), 162.1 (d d, J = 11.0, 250.5 Hz), 160.7 (d d, J = 12.0, 260.0 Hz), 158.2, 157.9 (d d, J = 12.5, 251.5 Hz), 148.8, 146.2, 131.2 (d d, J = 4.0, 10.0 Hz), 129.0 (d br, J = 10.5 Hz), 126.4 (d d, J = 4.5, 13.0 Hz), 114.2 (d d, J = 4.0, 12.0 Hz), 111.8 (d d, J = 3.0, 22.5 Hz), 111.6 (d d, J = 4.0, 21.5 Hz), 104.9 (t, J = 25.3 Hz, 2碳), 40.0

¹H: 8.89 (1H, s), 7.84 (1H, br), 7.26 (1H, m), 6.98-6.77 (4H, m), 3.51 (3H, s)

化合物81 (MP: 99-100) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.4, 149.4, 144.9, 132.9, 132.2, 129, 126.7, 124.9, 119.7, 113.1, 112.5, 40.5, 40.4

¹H: 8.03 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz),

7.59 (1H, m, $J = 7.8$ Hz), 7.41 (1H, t, 7.6 Hz), 7.03 (2H, br),
6.59 (2H, d br, $J = 8.0$ Hz), 3.62 (3H, s), 2.92 (6H, s)

化合物82 (MP: 179-182 (分解))。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 148.6, 144.7, 132.5, 129.6, 125.5, 119.7, 113.4,
61.7, 49, 46, 43.5, 25.8, 22.5, 21.6

^1H : 10.52 (1H, s br), 8.20 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.93 (1H,
d, $J = 8.4$ Hz), 7.71 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.55 (1H, t, $J = 7.7$
Hz), 4.43 (2H, d br, $J = 13.5$ Hz), 3.52 (1H, m), 3.41 (2H, d
br, $J = 11.5$ Hz), 3.23 (2H, t br), 2.94 (2H, m, $J = 12.0$ Hz),
2.25 (2H, br), 1.88 (2H, br), 1.86 (4H, m), 1.71 (1H, m, $J =$
14.0 Hz), 1.40 (1H, m)

化合物83 (MP: 259-261 (分解))。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 148.8, 144.8, 132.5, 129.8, 125.7, 119.7, 113.6,
51.9, 43.3, 42

^1H : 11.59 (1H, s br), 8.22 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.96 (1H,
d, $J = 8.3$ Hz), 7.73 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.56 (1H, t, $J = 7.6$
Hz), 4.47 (2H, m), 3.71 (2H, m), 3.52 (2H, m), 3.29 (2H, m),
2.81 (3H, s)

化合物84 (MP: 92)。NMR溶劑： CDCl_3

^{13}C : 155.9, 150.4, 148.7, 145.2, 138.4, 132.6, 129.5,
125.3, 121.8, 119.9, 119.5, 113.5, 37.8

^1H : 8.32 (1H, d d, $J = 1.6, 5.0$ Hz), 8.12 (1H, d, $J = 8.3$
Hz), 8.02 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.69 (1H, d t, $J = 1.9, 7.9$ Hz),
7.63 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.45 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.18 (1H, d,

$J = 8.1$ Hz), 7.15 (1H, d d, $J = 5.0, 7.5$ Hz), 3.74 (3H, s)

化合物85 (MP: 66) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.2, 146.2, 141.8, 131.6, 129.9, 128.4 (2 sig.),
125.9, 125.4, 120, 113.9, 40.3, 35.4, 29.1, 28.5

^1H : 8.29 (1H, m, $J = 8.3$ Hz), 8.10 (1H, m, $J = 8.4$ Hz),
7.63 (1H, m, $J = 1.0, 7.1$ Hz), 7.47 (1H, m, $J = 1.0, 7.1$ Hz),
7.33 (1H, br), 7.30 (2H, m), 7.20 (2H, m), 7.19 (1H, m), 3.58
(2H, m), 2.71 (2H, m, $J = 7.0$ Hz), 1.77 (4H, m)

化合物86 (MP: 60) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.2, 146.3, 131.6, 129.9, 125.3, 119.9, 114, 40.5,
31.9, 29.6, 29.6, 29.5, 29.5, 29.3, 29.2, 26.8, 22.7, 14.1

^1H : 8.29 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 8.10 (1H, d, $J = 8.4$ Hz),
7.63 (1H, m, $J = 1.0, 7.1$ Hz), 7.47 (1H, m, $J = 1.0, 7.1$ Hz),
7.33 (1H, t br, $J = 5.0$ Hz), 3.55 (2H, m), 1.71 (2H, m),
1.50-1.15 (18H, m), 0.88 (3H, t, $J = 7.1$ Hz)

化合物87 (MP: 73) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 148.4, 146.3, 131.7, 129.8, 125.3, 119.9, 114, 49.8,
33, 25.3, 24.7

^1H : 8.28 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 8.09 (1H, d, $J = 8.4$ Hz),
7.63 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.47 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.21 (1H, d,
 $J = 7.5$ Hz), 3.95 (1H, m), 2.11 (2H, m), 1.83 (2H, m), 1.69
(1H, m), 1.43 (4H, m), 1.29 (1H, m)

化合物88 (MP: 186-188) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 146.5, 146.4, 140.2, 138.2, 135.3, 131.6, 130.3,

128.8, 128, 127.4, 126.9, 125.8, 120.3, 120.2, 114

^1H : 9.24 (1H, s), 8.37 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 8.16 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.78 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.69 (1H, m), 7.68 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.62 (2H, d, $J = 7.7$ Hz), 7.53 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.47 (2H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.37 (1H, t, $J = 7.6$ Hz)

化合物89 (MP: 167 (分解))。NMR溶劑： CDCl_3

^{13}C : 148.1, 146.8, 129.3, 129, 128.8, 125.9, 120.9, 66.6, 48.5, 45.8

^1H : 8.38 (1H, s), 7.88 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.47 (2H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.39 (1H, m, $J = 7.5$ Hz), 4.04 (2H, m br), 3.84 (6H, m)

化合物90 (MP: 230-231 (分解))。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 148.6, 144.7, 132.5, 129.6, 125.6, 119.7, 113.4, 63.3, 61.9, 48.3, 45.6, 43.6, 25.8

^1H : 11.53 (1H, s br), 8.20 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.93 (1H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.71 (1H, m, $J = 7.5$ Hz), 7.55 (1H, m, $J = 7.6$ Hz), 4.44 (2H, d br, $J = 12.5$ Hz), 3.98 (2H, d br, $J = 11.5$ Hz), 3.90 (2H, t, $J = 12.0$ Hz), 3.54 (1H, m), 3.45 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 3.22 (2H, br), 3.11 (2H, m), 2.28 (2H, br), 1.90 (2H, m, $J = 4.0, 12.3$ Hz)

化合物91 (MP: 143)。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 152.5, 148.7, 145.1, 144.7, 137.5, 132.6, 129.6, 128.4, 127.8, 127.6, 125.5, 119.7, 118, 115.4, 113.4, 69.4, 49.8, 47.5, 44.9

^1H : 8.21 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.96 (1H, d, $J = 8.4$ Hz),
7.71 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.55 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.43 (2H, d,
 $J = 8.0$ Hz), 7.38 (2H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.31 (1H, m, $J = 7.1$ Hz),
6.94 (4H, m), 5.03 (2H, s), 3.90 (4H, m), 3.19 (4H, br)

化合物92 (MP: 218-220 (分解))。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 148.7, 144.8, 132.5, 129.6, 125.5, 119.7, 113.4,
60.2, 50.5, 45.7, 43.2, 27.9, 22.7

^1H : 11.24 (1H, s), 8.20 (1H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.93 (1H, d,
 $J = 8.3$ Hz), 7.70 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.54 (1H, t, $J = 7.4$ Hz),
4.40 (2H, d br, $J = 13.0$ Hz), 3.49 (2H, br), 3.45 (1H, m),
3.22 (2H, m br), 3.08 (2H, br), 2.20 (2H, br), 1.96 (4H, m),
1.89 (2H, m)

化合物93 (MP: 254-256 (分解))。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 148.8, 144.8, 132.5, 131.5, 129.8, 129.6, 129.4,
128.8, 125.7, 119.7, 113.6, 58.6, 50.1, 43.6, 42.1

^1H : 11.97 (1H, s br), 8.21 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.95 (1H,
d, $J = 8.3$ Hz), 7.67 (2H, m), 7.56 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.47
(3H, m), 7.33 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 4.47 (2H, d br, $J = 15.0$ Hz),
4.39 (2H, s), 3.79 (2H, m), 3.43 (2H, m), 3.28 (2H, m)

化合物94 (MP: 109-111)。NMR溶劑： CDCl_3

^{13}C : 149.4, 145.4, 144.7, 133.2, 129.3, 128.6, 126.8,
126.6, 125.2, 119.8, 113.5, 48.8, 46.1, 42.6, 33.2

^1H : 8.12 (1H, m, $J = 8.3$ Hz), 8.02 (1H, m, $J = 8.4$ Hz),
7.63 (1H, m, $J = 1.0, 7.1$ Hz), 7.47 (1H, m, $J = 1.0, 7.1$ Hz),

7.35 (2H, m, $J = 7.7$ Hz), 7.27 (2H, m), 7.25 (1H, m), 4.70 (2H, d br, $J = 13.5$ Hz), 3.29 (2H, br), 2.89 (1H, m), 2.01 (4H, m)

化合物95 (MP: 157) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.2, 145.9, 141.5, 136.4, 133.2, 131.8, 131.1, 131, 129.9, 128.7, 118.6, 118, 114.4, 113.2, 58.6, 57.2, 32.6, 30.8, 29.7, 25.5, 25.3

^1H : 8.25 (1H, br), 8.09 (1H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.90 (1H, d br, $J = 7.9$ Hz), 7.80 (1H, d d, $J = 1.6, 8.7$ Hz), 7.70 (1H, d, $J = 7.6$ Hz), 7.62 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 4.29 (1H, m br), 3.21 (3H, s), 2.02 (2H, m br), 1.90 (2H, m br), 1.73 (1H, br), 1.64 (2H, m), 1.46 (2H, m), 1.17 (1H, m)

化合物96 (MP: 146-147) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.6 (d, $J = 247.0$ Hz), 150.3, 146, 137.9, 136.3 (d, $J = 3.0$ Hz), 132.7, 129.1 (d, $J = 8.4$ Hz), 129.0, 117.4, 115.9 (d, $J = 22.0$ Hz), 113.8, 58.6, 57.2, 32.7, 30.4, 29.6, 25.5, 25.3

^1H : 8.21 (1H, br), 8.03 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.80 (1H, d d, $J = 1.5, 8.5$ Hz), 7.62 (2H, m d, $J = 5.3, 8.7$ Hz), 7.19 (2H, t, $J = 8.5$ Hz), 4.27 (1H, m br), 3.20 (3H, s br), 2.01 (2H, m), 1.89 (2H, m), 1.73 (1H, m), 1.64 (2H, m), 1.44 (2H, m), 1.17 (1H, m)

化合物97 (MP: 158) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.9, 146.3, 132.4, 132.3, 122.4, 118.3, 114.9,

58.8, 57.1, 32.6, 30.9, 29.5, 25.5, 25.3

^1H : 8.25 (1H, br, $J = 2.0$ Hz), 7.89 (1H, d, $J = 8.8$ Hz),
7.68 (1H, d d, $J = 2.0, 8.8$ Hz), 4.27 (1H, m br), 3.18 (3H, s),
1.98 (2H, m), 1.89 (2H, m), 1.70 (1H, m), 1.61 (2H, m), 1.45
(2H, m), 1.17 (1H, m)

化合物98 (MP: 93-94) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 148.8, 145.1, 133, 129.2, 125.2, 119.7, 114.3, 50.3,
48.5, 26.6, 24

^1H : 8.18 (1H, m, $J = 8.4$ Hz), 8.09 (1H, m, $J = 8.3$ Hz),
7.60 (1H, m, $J = 1.0, 7.0$ Hz), 7.46 (1H, m, $J = 1.0, 7.0$ Hz),
4.08 (2H, m), 3.81 (2H, m), 2.04 (4H, m)

化合物99 (MP: 139-141) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 154.7, 149.4, 145.4, 133.2, 130.7, 130.1, 129.3,
125.2, 119.8, 116.2, 113.5, 70.9, 44.4, 41.9, 30.4, 20.5

^1H : 8.11 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 8.0 (1H, d, $J = 8.4$ Hz),
7.62 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.46 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.12 (2H, m,
 $J = 8.5$ Hz), 6.87 (2H, m, $J = 8.5$ Hz), 4.66 (1H, m), 4.0 (4H,
m), 2.31 (3H, s), 2.10 (4H, m)

化合物100 (MP: 80) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.3, 145.3, 142.1, 133.2, 129.2, 128.4, 128.3,
125.8, 125.1, 119.8, 113.4, 48.4, 45.8, 38, 35.4, 32.8, 32.2

^1H : 8.10 (1H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.98 (1H, d, $J = 8.3$ Hz),
7.61 (1H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.46 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.31 (2H, t,
 $J = 7.1$ Hz), 7.21 (1H, m), 7.20 (2H, d, $J = 7.9$ Hz), 4.53 (2H,

d br, $J = 12.0$ Hz), 3.15 (2H, br), 2.69 (2H, m, $J = 7.5$ Hz), 1.93 (2H, br), 1.49 (2H, br), 1.67 (3H, m)

化合物101 (MP: 134) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.7, 150.5, 142.6, 137, 132.8, 129.3, 128.7, 127.7, 125.2, 121.1, 116.9, 112.9, 49.5, 46.5

^1H : 7.91 (1H, s), 7.82 (2H, d, $J = 7.9$ Hz), 7.51 (1H, s), 7.42 (2H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.32 (3H, m), 6.96 (3H, m), 3.83 (4H, m, $J = 5.0$ Hz), 3.29 (4H, m, $J = 5.0$ Hz)

化合物102 (MP: 122) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.6, 142.4, 137.1, 137, 132.8, 129.1, 128.7, 128.4, 127.6, 127.4, 125.1, 113, 62.7, 52.5, 46.5

^1H : 7.91 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.80 (2H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.47 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.41 (2H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.34 (4H, m), 7.32 (1H, m), 7.29 (1H, m), 3.67 (4H, m, $J = 5.0$ Hz), 3.58 (2H, s), 2.55 (4H, m, $J = 5.0$ Hz)

化合物103 (MP: 154) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.3, 142.1, 136.9, 133, 128.7, 127.5, 125.1, 113.2, 57.5, 31.3, 30, 25.4, 25.2

^1H : 7.92 (1H, d, $J = 1.0$ Hz), 7.81 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.50 (1H, d, $J = 1.0$ Hz), 7.41 (2H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.29 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 3.96 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d br, $J = 13.5$ Hz), 1.58 (2H, m, $J = 3.5, 13.1$ Hz), 1.38 (2H, m), 1.13 (1H, t q, $J = 3.5, 13.0$ Hz)

化合物104 (MP: 83) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150, 145.2, 133.3, 129, 125, 119.7, 113.5, 58.9, 40, 31.2, 25.7, 25.3, 15.1

^1H : 8.10 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.97 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.59 (1H, m, $J = 1.0, 7.1$ Hz), 7.45 (1H, m, $J = 1.0, 7.1$ Hz), 4.17 (1H, m), 3.63 (2H, m, $J = 6.6$ Hz), 2.02 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.85 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.69 (3H, br), 1.31 (5H, br), 1.17 (1H, m)

化合物105 (MP: 204) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.2, 145.3, 133, 129.3, 125.2, 119.7, 113.4, 53.5, 53.1, 48, 45.4, 33.5, 31.7 (2 sig.), 23.3

^1H : 12.38 (1H, s br), 8.07 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.94 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.59 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.44 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 4.52 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 3.79 (2H, br), 3.15 (2H, br), 3.12 (2H, m), 2.79 (2H, m br), 2.24 (2H, m br), 2.08 (2H, m br), 1.90 (5H, m br), 1.50 (2H, m br)

化合物106 (MP: 油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.9 (d, $J = 248$ Hz), 150.5, 144.6, 141.7, 136.3 (d, $J = 3$ Hz), 133.9, 129.4 (d, $J = 8$ Hz), 125.1, 119.9, 115.8 (d, $J = 21.5$ Hz), 111.5, 58.9 (br), 57.0 (br), 32.6 (br), 30.6 (br), 29.7 (br), 25.5, 25.3

^1H : 8.12 (2H, m), 7.66-7.62 (3H, m), 7.17 (2H, m, $J = 8.7$ Hz), 4.28 (1H, br), 3.19 (3H, s br), 2.0 (2H, m br), 1.88 (2H, br), 1.76-1.56 (3H, br), 1.44 (2H, br), 1.18 (1H, m br)

化合物107 (MP: 232-233) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 167.2, 149.6, 145.5, 139.7, 136.9, 132.3, 131.8, 131.7, 129.5, 128.9, 128.6, 127.9, 117.3, 113.9, 56.9, 32.5, 25 30.2, 29, 25.2, 24.8

¹H: 13.19 (1H, s br), 8.49 (1H, s), 8.29 (1H, s), 8.06 (1H, m), 7.98 (3H, m), 7.65 (1H, t, J = 7.8 Hz), 4.09 (1H, m br), 3.08 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.80 (2H, m), 1.67 (2H, m), 1.60 (1H, m), 1.33 (2H, m), 1.16 (1H, br)

化合物108 (MP: 183) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 169.2, 150.3, 145.9, 140.8, 137.7, 134.1, 132.9, 131, 129.3, 129, 126.7, 126.3, 117.7, 114, 58.8, 57.1, 32.6, 30.7, 29.6, 25.5, 25.3

¹H: 8.27 (1H, s br), 8.15 (1H, s br), 8.04 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.85 (1H, br), 7.83 (1H, m), 7.81 (1H, m), 7.56 (1H, t, J = 7.8 Hz), 6.42 (1H, s br), 6.12 (1H, s b), 4.30 (1H, br), 3.22 (3H, s), 2.03 (2H, m), 1.91 (2H, m), 1.76 (1H, m), 1.67 (2H, m), 1.47 (2H, m), 1.20 (1H, m)

化合物109 (MP: 209-210) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 167.7, 149.7, 144.2, 140.9, 139.3, 135.2, 133.4, 130.3, 129.3, 127.4, 126.5, 125.2, 120, 111, 58.3, 57.2, 32.3, 29.6, 28.8, 25.2, 24.8

¹H: 8.28 (1H, d, J = 8.6 Hz), 8.26 (1H, s br), 8.22 (1H, s br), 8.17 (1H, br), 7.94 (2H, m), 7.91 (1H, m), 7.61 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.53 (1H, s br), 4.03 (1H, br), 3.09 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.80 (2H, m), 1.60 (1H, m), 1.36 (2H, m), 1.67 (2H,

m), 1.16 (1H, m)

化合物110 (MP: 66-67) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 149.3, 145.3, 142.3, 133.1, 129.2, 128.3, 128.3, 125.7, 125.1, 119.8, 113.4, 48.4, 45.8, 36, 35.9, 35.8, 32.2, 28.5

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.97 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.60 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.30 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.20 (1H, m), 7.19 (2H, d, J = 7.8 Hz), 4.51 (2H, m, br), 3.14 (2H, br), 2.64 (2H, t, J = 7.6 Hz), 1.86 (2H, m), 1.69 (2H, m), 1.64 (1H, m), 1.43 (2H, m), 1.38 (2H, m)

化合物111 (MP: 83) 。 NMR溶劑：DMSO

¹³C: 161.4, 150.6, 148.4, 148.1, 130.2, 129.7, 129.1, 129, 126.4, 119.5, 115.9, 48.2, 45.7

¹H: 9.17 (1H, s), 8.09 (2H, m, J = 1.5, 7.2 Hz), 7.53 (3H, m), 7.25 (2H, t, J = 7.6 Hz), 6.99 (2H, d, J = 8.1 Hz), 6.83 (1H, t, J = 7.2 Hz), 3.90 (4H, br), 3.30 (4H, m)

化合物112 (MP: 203) 。 NMR溶劑：DMSO

¹³C: 167.6, 149.9, 140.1, 137.9, 137.7, 136, 132.6, 128.9, 128.3, 128, 127.1, 124.4, 115.6, 61.7, 52.1, 45.9

¹H: 8.13 (1H, d, J = 1.2 Hz), 8.09 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.98 (1H, s br), 7.91 (4H, m br), 7.36 (1H, s br), 7.33 (4H, m), 7.26 (1H, m), 3.56 (4H, m, J = 5.5 Hz), 3.53 (2H, s), 2.47 (4H, m, J = 5.5 Hz)

化合物113 (MP: 231-233 (分解)) 。 NMR溶劑：DMSO

¹³C: 167.6, 149.7, 142.8, 139.3, 138, 135.7, 132.6, 129.9, 128, 127.7, 126.2, 124.2, 115.6, 39.6

¹H: 7.95 (1H, s br), 7.84 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.74 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.72 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.60 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.41 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.35 (1H, s br), 7.35 (2H, m), 7.31 (1H, t, J = 7.1 Hz), 3.43 (3H, s)

化合物114 (MP: 135-136) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 153.8, 149.8, 148.7, 144.7, 132.6, 129.5, 125.4, 122.4, 119.6, 113.3, 47.7, 45.2, 40.5, 31.8

¹H: 8.50 (2H, m, J = 5.0 Hz), 8.20 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.95 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.71 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.54 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.34 (2H, m, J = 5.0 Hz), 4.39 (2H, br), 3.32 (2H, br), 2.96 (1H, m), 1.95 (2H, br), 1.82 (2H, m, J = 4.0, 12.3 Hz)

化合物115 (MP:油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.5, 145.2, 138.1, 133.2, 129.1, 128.7, 128.6, 126.6, 125.1, 119.7, 113.8, 53.1 (br), 38.2 (非常寬), 34.3 35 (br)

¹H: 8.08 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.91 (1H, br), 7.57 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.44 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.23 (5H, br), 3.96 (2H, br), 3.31 (3H, s), 3.10 (2H, m, J = 7.2 Hz)

化合物116 (MP: 147) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 181.1, 166.4, 152.1, 149.4, 148.6, 145.4, 134.7, 133.1, 129.5, 125.3, 123.7, 122.9, 119.9, 113.5, 46.9, 44.8,

34, 29.2

¹H: 9.32 (1H, d, J = 1.7 Hz), 8.76 (1H, d d, J = 1.6, 4.9 Hz), 8.37 (1H, d t, J = 2.0, 8.0 Hz), 8.12 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.45 (1H, d d, J = 4.9, 8.0 Hz), 4.56 (2H, d br), 3.57 (2H, br), 3.46 (1H, m), 2.37 (2H, m), 2.27 (2H, m)

化合物117 (MP: 138-139) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 155.4, 149.4, 145.4, 133.1, 129.6, 129.4, 126.2, 125.2, 119.9, 117.4, 113.5, 71.2, 44.4, 42, 30.4

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.99 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.47 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.27 (2H, m, J = 9.0 Hz), 6.89 (2H, m, J = 9.0 Hz), 4.67 (1H, m), 4.01 (4H, s br), 2.15 (2H, m), 2.06 (2H, m)

化合物118 (MP:油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.5, 142.5, 141.0, 133.2, 129.2, 128.5, 128.2, 126.1, 125.1, 119.8, 113.6, 51.4, 50.4, 38.1, 35.8, 32.9, 29.6, 28.6

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.01 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.61 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.46 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.24 (5H, br), 3.71 (2H, m, J = 7.2 Hz), 3.31 (3H, br), 2.71 (2H, br), 2.15 (2H, m, J = 7.5 Hz)

化合物119 (MP:油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 160.1, 151.0, 145.3, 137.4, 133.3, 129.9, 129.3, 125.2, 120.3, 119.9, 113.7 (2 sig.), 113.4, 55.3, 54.2, 37.5

^1H : 8.11 (1H, d, $J = 8.2$ Hz), 8.06 (1H, d, $J = 8.3$ Hz),
7.62 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.47 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.30 (1H, t,
 $J = 7.7$ Hz), 6.96 (2H, br), 6.87 (1H, d, $J = 8.2$), 4.89 (2H, br),
3.81 (3H, s), 3.29 (3H, br)

化合物 120 (MP: 70-71) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 156.9, 149.4, 145.4, 133.2, 129.7, 129.3, 125.2,
121.3, 119.8, 116.1, 113.5, 70.6, 44.4, 42, 30.4

^1H : 8.11 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 8.0 (1H, d, $J = 8.3$ Hz),
7.62 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.47 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.33 (2H, m,
 $J = 8.0$ Hz), 7.0 (1H, t, $J = 7.4$ Hz), 6.97 (2H, d, $J = 8.3$ Hz),
4.72 (1H, m), 4.01 (4H, s br), 2.16 (2H, m), 2.10 (2H, m)

化合物 121 (MP: 115) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.1 (d, $J = 245.0$ Hz), 149.3, 145.3, 133.1, 133.1,
130.6 (d, $J = 8.0$ Hz), 129.4, 125.2, 119.8, 115.2 (d, $J = 21.0$
Hz), 113.5, 61.9, 52.7, 48.1, 45.2

^1H : 8.10 (1H, m, $J = 8.3$ Hz), 7.99 (1H, m, $J = 8.4$ Hz),
7.61 (1H, m, $J = 1.0, 7.0, 8.2$ Hz), 7.46 (1H, m, $J = 1.0, 7.0,$
8.2 Hz), 7.32 (2H, m d, $J = 5.6, 8.7$ Hz), 7.06 (2H, m t, $J =$
8.3 Hz), 3.93 (4H, s br), 3.56 (2H, s), 2.63 (4H, s br)

化合物 122 (MP: 188 (分解)) 。 NMR 溶劑 : DMSO

^{13}C : 148.6, 144.7, 132.5, 129.5, 125.4, 119.6, 113.3,
59.7, 52.9, 46.5, 45.6, 44.1, 42.1, 27.9

^1H : 10.72 (1H, br), 8.19 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.91 (1H, d,
 $J = 8.3$ Hz), 7.70 (1H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.53 (1H, t, $J = 7.8$ Hz),

4.28 (2H, s br), 3.21 (4H, m br), 2.96 (4H, m br), 2.68 (6H, m), 1.90 (2H, m br), 1.57 (2H, m br)

化合物123 (MP: 油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.0, 145.2, 137.9, 134.7, 133.2, 130.1, 129.5, 128.2, 127.9, 126.2, 125.3, 119.9, 113.7, 54.8, 53.4, 37.8

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.07 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.63 (1H, d d d, J = 1, 7.1, 8.2 Hz), 7.48 (1H, d d d, J = 1, 7.0, 8.2 Hz), 7.42 (1H, br), 7.32 (3H, br), 4.90 (2H, br), 3.28 (3H, br)

化合物124 (MP: 258-259 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 161.6, 148.4, 148.3, 131.5, 130.3, 129.6, 129.5, 129.1, 129, 128.8, 126.5, 58.6, 50, 42.6

¹H: 12.03 (1H, s br), 9.16 (1H, s), 8.07 (2H, m), 7.67 (2H, m), 7.51 (3H, m), 7.45 (3H, m), 4.55 (2H, m), 4.38 (2H, s), 3.73 (2H, m, J = 12.0 Hz), 3.41 (2H, br, J = 11.7 Hz), 3.24 (2H, m)

化合物125 (MP: 232 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 161.4, 159.9, 148.4, 148.2, 136.8, 131.5, 129.6, 129.5, 128.8, 128.5, 128.1, 128, 127.9, 122.2, 115.2, 69.4, 58.6, 50, 42.6

¹H: 11.97 (1H, s), 9.12 (1H, s), 8.0 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.66 (2H, m), 7.45 (5H, m), 7.40 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.33 (1H, t, J = 7.2 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.6 Hz), 5.17 (2H, s), 4.55 (2H, m), 4.37 (2H, s), 3.70 (2H, m, J = 12.0 Hz), 3.41

(2H, m), 3.24 (2H, m)

化合物126 (MP: 135) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 147.3, 146.3, 131.6, 129.7, 125.2, 119.9, 114.1, 52.8, 41.6, 36.1, 29.4

¹H: 8.27 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.09 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, m, J = 1.0, 7.0, 8.0 Hz), 7.45 (1H, m, J = 1.0, 7.0, 8.0 Hz), 7.17 (1H, s), 2.20 (9H, s), 1.76 (6H, s)

化合物127 (MP: 101) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 148.6, 144.7, 132.5, 129.5, 125.5, 119.7, 113.3, 62.6, 48.4, 45.2, 28.3, 25.9, 25.4

¹H: 8.18 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.91 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.69 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.56 (1H, t, J = 7.6 Hz), 3.71 (4H, m), 2.63 (4H, s br), 2.30 (1H, m), 1.76 (2H, m), 1.73 (2H, m), 1.56 (1H, d, J = 12.4 Hz), 1.20 (4H, m), 1.07 (1H, m)

化合物128 (MP:油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 149.4, 145.3, 138.4, 133.1, 129.3, 128.5, 127.7, 127.4, 125.1, 119.8, 113.5, 72.5, 70.1, 44.9, 42.3, 30.9

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 1, 7.1, 8.2 Hz), 7.46 (1H, d d d, J = 1, 7.1, 8.2 Hz), 7.40-7.28 (5H, m), 4.62 (2H, s), 4.06 (2H, m), 3.81 (3H, m), 2.08 (2H, m), 1.94 (2H, br)

化合物129 (MP:油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.5, 145.2, 142.3, 133.2, 129.2, 128.4, 128.3, 125.7, 125.1, 119.7, 113.6, 51.8, 50.6, 38.0, 35.8, 31.1, 28.0,

26.8, 26.2

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 1.0, 7.0, 8.2 Hz), 7.46 (1H, d d d, J = 1.0, 7.0, 8.2 Hz), 7.27 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.17 (3H, m), 3.66 (2H, m), 3.31 (3H, br), 2.64 (2H, br), 1.82 (2H, m, J = 7.7 Hz), 1.71 (2H, br), 1.47-1.31 (2H, 非常寬)

化合物130 (MP:油狀) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 162.4 (d, J = 247 Hz), 150.9, 145.2, 133.2, 131.5 (d, J = 3 Hz), 129.9, 129.4, 125.3, 119.9, 115.8 (d, J = 22 Hz), 113.6, 54.5, 53.2, 37.6

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.05 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.63 (1H, d d d, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 7.48 (1H, d d d, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 7.41 (2H, br), 7.08 (2H, t, J = 8.1 Hz), 4.88 (2H, br), 3.24 (3H, br)

化合物131 (MP:油狀) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 150.9, 145.2, 133.9, 133.2, 130.9, 129.4, 128.9, 126.8, 126.1, 125.3 (2 signa Hzs), 123.1, 119.9, 113.6, 53.1, 51.7, 37.5

¹H: 8.24-8.06 (3H, m), 7.98-7.82 (2H, m), 7.65 (1H, d d d, J = 1.1, 7.0, 8.0 Hz), 7.60-7.45 (4H, m, br), 7.48 (1H, d d d, J = 1.0, 7.0, 8.0 Hz), 5.38 (2H, m br), 3.28 (3H, s br)

化合物132 (MP: 129-130 (分解)) 。 NMR溶劑：DMSO

¹³C: 161.3, 154.6, 150.6, 148.5, 147.6, 130, 129.6, 127.4, 120.8, 115.9, 115.5, 71.1, 51.8, 44.7, 43, 41.9, 30.3,

20.1

^1H : 11.17 (1H, s), 9.05 (1H, s), 7.92 (2H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.11 (2H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.08 (2H, d, $J = 7.6$ Hz), 6.89 (2H, d, $J = 7.6$ Hz), 4.64 (1H, m br), 3.95 (2H, m), 3.93 (2H, m), 3.61 (2H, m), 3.48 (2H, m), 3.17 (4H, m), 2.79 (3H, s), 2.22 (3H, s), 2.05 (2H, s br), 1.74 (2H, br)

化合物 133 (MP: 140) 。 NMR 溶劑 : DMSO

^{13}C : 161.7, 152.1, 148.6, 147.7, 138, 129, 128.3, 127.4, 127.1, 119.5, 114.7, 65.9, 62, 52.4, 47.4, 46.2

^1H : 9.04 (1H, s), 7.88 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.33 (4H, br), 7.27 (1H, br), 7.02 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 3.75 (4H, m br), 3.70 (4H, m br), 3.52 (2H, br), 3.23 (4H, br), 2.50 (4H, br)

化合物 134 (MP: 油狀) 。 NMR 溶劑 : DMSO

^{13}C : 163.1 (d d, $J = 13.5, 251.5$ Hz), 160.1 (d d, $J = 13.0, 257.5$ Hz), 157.1 (d, $J = 6$ Hz), 154.6, 148.2, 147.4, 131.6 (d d, $J = 4.5, 10.5$ Hz), 130.0, 129.6, 116.0, 114.6 (d d, $J = 4.0, 11.5$ Hz), 112.3 (d d, $J = 4.0, 22.0$ Hz), 105.3 (t, $J = 25.5$ Hz), 71.1, 43.1 (br), 30.3, 20.1

^1H : 9.17 (1H, s), 8.12 (1H, d t, $J = 6.7, 8.6$ Hz), 7.43 (1H, d d d, $J = 2.5, 9.4, 11.5$ Hz), 7.26 (1H, d t, $J = 2.5, 8.5$ Hz), 7.08 (2H, d, $J = 8.4$ Hz), 6.89 (2H, d, $J = 8.4$ Hz), 4.64 (1H, m, $J = 3.7$ Hz), 3.93 (2H, m br), 3.61 (2H, m br), 2.22 (3H, s br), 2.05 (2H, m), 1.73 (2H, m)

化合物 135 (MP: 油狀) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.4, 145.3, 141.8, 133.1, 129.3, 128.4, 128.3, 125.8, 125.1, 119.8, 113.4, 73.0, 67.3, 45.0, 42.4, 32.3, 31.5, 30.9

^1H : 8.11 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.98 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.61 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.46 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.30 (2H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.21 (3H, m), 4.04 (2H, m), 3.77 (2H, m), 3.66 (1H, m, $J = 3.4$ Hz), 3.50 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 2.74 (2H, t, $J = 7.9$ Hz), 2.02 (2H, m), 1.94 (2H, m), 1.85 (2H, m)

化合物136 (MP: 197-198) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.5, 148.7, 144.7, 143.7, 132.6, 129.6, 125.5, 119.7, 118.6, 115.6, 113.4, 50.3, 47.4, 45.2

^1H : 8.95 (1H, s), 8.20 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.95 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.71 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.55 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 6.85 (2H, m, $J = 9.0$ Hz), 6.68 (2H, m, $J = 9.0$ Hz), 3.89 (4H, m br), 3.12 (4H, m)

化合物137 (MP: 100-101) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 154.4, 150.8, 149.4, 145.4, 133.1, 129.3, 125.2, 119.8, 117.8, 114.8, 113.5, 72, 55.7, 44.5, 41.9, 30.5

^1H : 8.11 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 8.0 (1H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.62 (1H, d, $J = 7.6$ Hz), 7.47 (1H, m, $J = 7.8$ Hz), 6.92 (2H, m, $J = 9.2$ Hz), 6.86 (2H, m, $J = 9.2$ Hz), 4.57 (1H, m), 3.99 (4H, m br), 3.79 (3H, s), 2.09 (4H, m)

化合物138 (MP: 187-188) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 161.5, 151.9, 150.9, 149.8, 147.4, 129, 127.4, 120,

119.3, 115.7, 115, 48.2, 47.5, 37.8

^1H : 9.02 (1H, s), 7.92 (2H, m, $J = 9.0$ Hz), 7.25 (2H, d d, $J = 7.3, 8.5$ Hz), 7.11 (2H, m, $J = 9.0$ Hz), 7.0 (2H, d, $J = 8.5$ Hz), 6.81 (1H, t, $J = 7.3$ Hz), 3.38 (4H, m), 3.29 (4H, m), 3.16 (6H, s br)

化合物139 (MP: 161-162) ◦ NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 161.7, 152, 148.6, 147.7, 127.4, 119.5, 114.7, 65.9, 54.4, 47.2, 46.3, 45.7

^1H : 9.04 (1H, s), 7.89 (2H, m, $J = 9.0$ Hz), 7.03 (2H, m, $J = 9.0$ Hz), 3.75 (4H, br), 3.70 (4H, m), 3.23 (4H, m, $J = 5.0$ Hz), 2.47 (4H, m, $J = 5.0$ Hz), 2.23 (3H, s)

化合物140 (MP: 167-168) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 161.8, 161, 156.4, 149.8, 147.2, 134.2, 128.8, 126.9, 120.3, 118.7, 118.4, 106.3, 39.3, 38.6

^1H : 8.84 (1H, s), 8.19 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.64 (2H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.15 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.08 (2H, d, $J = 9.0$ Hz), 3.41 (3H, s), 3.23 (3H, s)

化合物141 (MP: 144-145) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162, 160.9, 156.6, 148.6, 147.6, 134.2, 128.9, 126.5, 120.3, 118.7, 118.4, 106.4, 66.6, 46.6

^1H : 8.85 (1H, s), 8.17 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.64 (2H, d, $J = 8.9$ Hz), 7.15 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.08 (2H, d, $J = 8.9$ Hz), 4.0 (8H, s br)

化合物142 (MP: 202-203) ◦ NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 149, 145.5, 131.4, 130.2, 125.8, 119.9, 113.6, 49.6, 45.7, 45.4, 45, 24.7, 21.4, 17.2

¹H: 10.72 (1H, s br), 9.55 (1H, d, J = 6.8 Hz), 8.23 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.18 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.74 (1H, m, J = 8.0 Hz), 7.57 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.41 (1H, m), 3.66 (1H, t, J = 11.5 Hz), 3.40 (1H, m), 3.20 (4H, m), 2.30 (1H, m), 2.12 (1H, m), 1.94 (1H, m), 1.74 (1H, m)

化合物143 (MP: 108-109) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.6, 145.2, 133.2, 129.2, 125.1, 119.8, 113.5, 96.3, 70.3, 70, 57.9, 55.8, 32.6, 31, 30.2, 26.1, 24.8, 22.6

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.46 (1H, t, J = 7.6 Hz), 4.37 (1H, br), 3.53 (4H, s), 3.18 (3H, s), 2.41 (2H, br), 1.91 (4H, m), 1.53 (2H, br), 0.99 (6H, s)

化合物144 (MP: 67-68) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 153.8, 152.9, 149.3, 145.3, 133.1, 129.2, 125.1, 119.8, 115.3, 114.6, 113.4, 65.6, 55.7, 48.4, 45.8, 35.6, 32.9, 32.1

¹H: 8.11 (1H, m, J = 8.4 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.1 Hz), 7.46 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.1 Hz), 6.85 (4H, s), 4.55 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 4.01 (2H, t, J = 6.2 Hz), 3.78 (3H, s), 3.19 (2H, s br), 1.96 (3H, m), 1.81 (2H, q, J = 6.2 Hz), 1.52 (2H, m)

化合物145 (MP: 179-180 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 160.8, 160.4, 156.2, 148.3, 148.2, 147.9, 134.8, 129.4, 128.6, 126.3, 122.8, 120.4, 118.7, 117.7 (2 sig.), 105.7, 50, 44.9

¹H: 9.19 (1H, s), 8.15 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.88 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.35 (2H, t, J = 7.3 Hz), 7.29 (2H, br), 7.28 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.19 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.05 (1H, t, J = 7.0 Hz), 4.05 (4H, br), 3.46 (4H, m br)

化合物146 (MP: 192-193) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 167.1, 160.8, 158.8, 157.4, 149.7, 147.7, 129.9, 129.6, 128.4, 125.6, 119.5, 118.1, 37.8

¹H: 9.10 (1H, s), 8.10 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.97 (1H, s br), 7.93 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.35 (1H, s br), 7.20 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.9 Hz), 3.16 (6H, s br)

化合物147 (MP: 220-221) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 167.1, 160.9, 158.7, 157.5, 148.5, 148.1, 129.9, 129.6, 128.5, 125.5, 119.5, 118, 65.9, 46.2

¹H: 9.13 (1H, s), 8.10 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.98 (1H, s br), 7.93 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.36 (1H, s br), 7.20 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.9 Hz), 3.75-3.70 (8H, m)

化合物148 (MP: 187-188) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 167.1, 161, 158.7, 157.5, 150.6, 148.4, 148.1, 129.9, 129.6, 129.1, 128.5, 125.5, 119.5, 119.5, 118.1, 115.9, 48.2, 45.6

¹H: 9.16 (1H, s), 8.12 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.98 (1H, s



br), 7.94 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.36 (1H, s br), 7.25 (2H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.21 (2H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.11 (2H, d, $J = 8.5$ Hz), 6.98 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 6.82 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 3.90 (4H, m), 3.29 (4H, m)

化合物149 (MP: 191-192) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 167.1, 160.3, 158.6, 157.4, 148.7, 147.4, 143.2, 129.8, 129.6, 129.3, 128.1, 127.3, 126.1, 125.4, 119.2, 118.2, 39.9

^1H : 8.95 (1H, s), 7.97 (1H, s br), 7.92 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.75 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.37 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.35 (1H, s br), 7.32 (2H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.28 (1H, t, $J = 7.0$ Hz), 7.08 (2H, d, $J = 8.7$ Hz), 7.07 (2H, d, $J = 8.7$ Hz), 3.49 (3H, s)

化合物150 (MP: 91-92) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.3 (d, $J = 246.5$ Hz), 151.8, 141.5, 137, 135.2, 129.1, 129.0 (d, $J = 3.3$ Hz), 128.2, 127.5, 126.8 (d, $J = 8.0$ Hz), 115.6 (d, $J = 21.5$ Hz), 112.8, 54.1, 36.5

^1H : 7.96 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.73 (2H, d d, $J = 5.3, 8.9$ Hz), 7.49 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.43 (2H, m, $J = 7.5$ Hz), 7.37 (1H, m, $J = 7.2$ Hz), 7.32 (2H, m, $J = 8.1$ Hz), 7.08 (2H, m t, $J = 8.9$ Hz), 4.69 (2H, s), 3.09 (3H, s)

化合物151 (MP: 143-144) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 167, 160.9, 158.6, 157.3, 149.7, 147.7, 136.2, 129.6, 129.6, 128.5, 128.2, 127.5, 127.4, 125.4, 119.2, 117.9,

53.3, 36.3

^1H : 9.14 (1H, s), 8.05 (2H, d br, $J = 8.0$ Hz), 7.93 (2H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.87 (1H, s br), 7.40 (4H, m), 7.33 (1H, m), 7.21 (1H, s br), 7.17 (2H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.10 (2H, d, $J = 8.5$ Hz), 4.82 (2H, s), 3.14 (3H, s)

化合物152 (MP: 95-96) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.5, 145.2, 138.7, 133.2, 129.2, 128.4, 127.5, 127.5, 125.1, 119.8, 113.5, 76.1, 70.1, 56.3, 32.6, 31, 27.5

^1H : 8.10 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.98 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.60 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.46 (1H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.40-7.33 (4H, m), 7.30 (1H, m), 4.58 (2H, s), 4.30 (1H, m), 3.36 (1H, m), 3.16 (3H, s), 2.24 (2H, d br, $J = 10.0$ Hz), 2.06 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.72 (2H, m, $J = 1.8, 13.0$ Hz), 1.51 (2H, s br)

化合物153 (MP: 75) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 160.8, 160, 149.4, 145.4, 133.2, 129.9, 129.3, 125.2, 119.8, 113.5, 106.5, 106.4, 100.9, 71.8, 55.3, 48.1, 45.4, 36.1, 29

^1H : 8.11 (1H, m, $J = 1.0, 8.3$ Hz), 7.99 (1H, m, $J = 1.0, 8.3$ Hz), 7.61 (1H, m, $J = 1.0, 7.1$ Hz), 7.47 (1H, m, $J = 1.0, 7.1$ Hz), 7.20 (1H, t, $J = 8.3$ Hz), 6.55-6.49 (2H, m), 6.48 (1H, t, $J = 2.5$ Hz), 4.62 (2H, m br, $J = 13.5$ Hz), 3.88 (2H, d, $J = 6.5$ Hz), 3.81 (3H, s), 3.24 (2H, br), 2.20 (1H, m), 2.04 (2H, br), 1.66 (2H, m)

化合物154 (MP: 129-130) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 148.6, 144.7, 132.5, 129.6, 125.5, 119.7, 113.3, 66.4, 51.4, 47.7, 44.9, 29.8, 23.7

^1H : 8.19 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.91 (1H, m, $J = 8.4$ Hz), 7.69 (1H, m, $J = 1.0, 7.0, 8.0$ Hz), 7.53 (1H, m, $J = 1.0, 7.0, 8.0$ Hz), 3.73 (4H, m), 2.51 (1H, m), 2.50 (4H, m), 1.79 (2H, m), 1.61 (2H, m), 1.49 (2H, m), 1.34 (2H, m)

化合物 155 (MP: 108) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 158.9, 150.7, 148.4, 147.4, 132.4, 129.3, 127.9, 127.8, 127.7, 120.8, 116.7, 49.4, 46.4

^1H : 8.83 (1H, s), 7.79 (1H d d, $J = 1.2, 3.7$ Hz), 7.44 (1H, d d, $J = 1.2, 5.1$ Hz), 7.33 (2H, d d, $J = 7.3, 8.8$ Hz), 7.15 (1H, d d, $J = 3.7, 5.1$ Hz), 6.98 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 6.95 (1H, m, $J = 7.3$ Hz), 4.11 (4H, br), 3.34 (4H, m, $J = 5.2$ Hz)

化合物 156 (MP: 66-67) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.9, 145.2, 137.8, 133.2, 129.2, 128.4, 127.7, 127.5, 125.1, 119.7, 113.6, 73.2, 68.2, 51.5, 51, 39.7, 37.1

^1H : 8.10 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.96 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.58 (1H, t, $J = 8.2$ Hz), 7.45 (1H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.30 (5H, m), 4.53 (2H, s br), 3.93 (2H, s br), 3.85 (2H, s br), 3.41 (3H, s br)

化合物 157 (MP: 油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 154.1, 152.3, 150.9, 150.8, 145.2, 133.2, 129.3, 125.2, 119.8, 115.3, 114.6, 113.7, 66.9, 55.7, 50.9, 40, 37.3

^1H : 8.10 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 8.03 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.61 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.3$ Hz), 7.47 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.3$ Hz), 6.81 (4H, m br), 4.33 (2H, t br, $J = 5.2$ Hz), 4.10 (2H, br), 3.76 (3H, s), 3.55-3.42 (3H, m br)

化合物158 (MP: 257-259 (分解))。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 157.8, 148.2 (2 sig.), 132, 131.5, 129.6, 129.4, 128.8 (2 sig.), 128.3, 127.7, 58.6, 49.9, 42.6

^1H : 11.94 (1H, s br), 9.13 (1H, s), 7.73 (2H, d, $J = 4.0$ Hz), 7.65 (2H, m), 7.46 (3H, m), 7.20 (1H, t, $J = 4.2$ Hz), 4.47 (2H, br), 4.37 (2H, s), 3.70 (2H, m, $J = 12.5$ Hz), 3.40 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 3.22 (2H, m)

化合物159 (MP: 143)。NMR溶劑：CDCl₃

^{13}C : 149.4, 145.3, 133.1, 129.3, 125.2, 119.8, 113.5, 66.4, 44.9, 42.4, 34

^1H : 8.10 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.98 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.61 (1H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.46 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 4.16 (2H, m), 4.12 (1H, m), 3.69 (2H, m), 2.10 (2H, m), 1.80 (2H, m), 1.86 (1H, d, $J = 3.8$ Hz)

化合物160 (MP: 78-80)。NMR溶劑：CDCl₃

^{13}C : 163.6, 149.2, 146.1, 143.3, 136.8, 129.5, 128.7, 128.3, 127.4, 126.5, 125.8, 40.3, 34.4

^1H : 8.52 (1H, s), 7.33 (3H, m), 7.21 (2H, m), 7.20 (1H, m), 7.11 (2H, d br, $J = 8.0$ Hz), 7.0 (2H, d br, $J = 7.0$ Hz), 3.86 (2H, s), 3.53 (3H, s)

化合物161 (MP: 89) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 146.5, 142.6, 136.2, 132.7, 128.7, 127.7, 125.2, 112, 81.1, 80.3, 61.8, 22.8

¹H: 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (2H, m, J = 8.3 Hz), 7.52 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, m, J = 7.9 Hz), 7.30 (1H, m, J = 7.3 Hz), 5.13 (2H, s), 3.88 (2H, s), 1.62 (6H, s)

化合物162 (MP: 119-121) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 145.7, 144.1, 133.7, 129.3, 124.2, 120.8, 117.5, 82.4, 79.5, 62.4, 22.9

¹H: 8.48 (1H, s br), 7.96 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.59 (1H, d d, J = 1.5, 8.7 Hz), 5.53 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.68 (6H, s)

化合物163 (MP: 231-232) 。 NMR溶劑：DMSO

¹³C: 167.6, 145.6, 144.3, 141.2, 139.3, 135.2, 133, 130.3, 129.3, 127.5, 126.5, 125.6, 120.2, 111.7, 81.8, 78.7, 61.6, 22.6

¹H: 8.37 (1H, br), 8.30 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.26 (1H, br), 8.22 (1H, s br), 7.94 (2H, m), 7.93 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.52 (1H, s br), 5.46 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.60 (6H, s)

化合物164 (MP: 102) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 153.5, 150.9, 149.4, 145.3, 137.1, 133.1, 129.3, 128.6, 127.9, 127.5, 125.2, 119.8, 117.7, 115.8, 113.5, 71.8, 70.5, 44.5, 42, 30.5

¹H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.3 Hz),

7.62 (1H, m, $J = 1.0, 7.2, 8.2$ Hz), 7.47 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.2$ Hz), 7.44 (2H, d, $J = 7.0$ Hz), 7.40 (2H, m, $J = 7.4$ Hz), 7.34 (1H, m, $J = 7.1$ Hz), 6.93 (4H, m), 5.04 (2H, s), 4.58 (1H, m), 3.99 (4H, br), 2.10 (4H, m br)

化合物 165 (MP: 131) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 153.8, 152.9, 149.4, 145.3, 133.1, 129.3, 125.1, 119.8, 115.3, 114.6, 113.4, 72.5, 55.7, 48.1, 45.5, 36.2, 29.1

^1H : 8.11 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.99 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.61 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.46 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 6.85 (4H, s), 4.61 (2H, d br, $J = 13.0$ Hz), 3.85 (2H, d, $J = 6.4$ Hz), 3.78 (3H, s), 3.23 (2H, s br), 2.18 (1H, m), 2.03 (2H, m), 1.62 (2H, m)

化合物 166 (MP: 87) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 160.9, 158.1, 149.4, 145.4, 133.1, 130.1, 129.4, 125.2, 119.8, 113.5, 108, 106.6, 102.6, 70.6, 55.3, 44.5, 41.9, 30.4

^1H : 8.11 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 8.0 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.62 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.2$ Hz), 7.47 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.1$ Hz), 7.22 (1H, t, $J = 8.2$ Hz), 6.58-6.54 (2H, m), 6.52 (1H, t, $J = 2.2$ Hz), 4.70 (1H, m), 4.01 (4H, m), 3.81 (3H, s), 2.12 (4H, m)

化合物 167 (MP: 162 (分解)) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 無數據

^1H : 8.15 (2H, m), 7.69 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.2$ Hz),

7.55 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.2$ Hz), 5.09 (2H, s br), 4.46 (2H, s br), 3.45 (2H, t, $J = 7.1$ Hz)

化合物 168 (MP: 72) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 153.9, 150.6, 149.4, 145.3, 133.1, 129.3, 125.2, 119.8, 117.8, 115.4, 113.5, 71.9, 68.2, 44.5, 41.8, 31.4, 30.5, 19.2, 13.9

^1H : 8.11 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 8.0 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.62 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.3$ Hz), 7.47 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.2$ Hz), 6.90 (2H, m, $J = 9.3$ Hz), 6.85 (2H, m, $J = 9.3$ Hz), 4.57 (1H, m), 3.99 (4H, br), 3.93 (2H, t, $J = 6.5$ Hz), 2.11 (2H, m), 2.05 (2H, m), 1.76 (2H, m), 1.49 (2H, m), 0.98 (3H, t, $J = 7.4$ Hz)

化合物 169 (MP: 90) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151, 145.1, 132.9, 129.6, 125.4, 119.9, 113.5, 62.2, 36.4

^1H : 8.11 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 8.05 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.62 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.3$ Hz), 7.47 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.2$ Hz), 3.99 (3H, s), 3.55 (3H, s)

化合物 170 (MP: 51) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 148.4, 145.2, 132.9, 129.6, 125.6, 119.9, 114.1, 51.8, 51, 31.7, 29.2

^1H : 8.14 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 8.11 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.63 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.49 (1H, t, $J = 7.4$ Hz), 5.0 (2H, s br), 4.28 (2H, s br), 3.19 (2H, t, $J = 6.3$ Hz)

化合物171 (MP: 81) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.1, 145.1, 133.1, 129.1, 125, 119.7, 113.4, 51.5, 49.8, 26.9, 26.7, 25.8, 25.2, 24.1

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.59 (1H, m, J = 1.1, 7.1, 8.1 Hz), 7.45 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 3.86 (2H, m, J = 5.3 Hz), 3.79 (2H, m, J = 5.3 Hz), 1.95 (2H, m), 1.79 (2H, m), 1.67 (6H, m)

化合物172 (MP: 37-38) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.5, 145.1, 133.2, 129.1, 125, 119.7, 113.5, 50.4, 49, 29.1, 27.4, 27.3, 26.6

¹H: 8.09 (1H, m d, J = 8.3 Hz), 8.01 (1H, m d, J = 8.5 Hz), 7.59 (1H, m, J = 1.0, 7.0, 8.2 Hz), 7.45 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 3.87 (2H, t, J = 6.0 Hz), 3.79 (2H, t, J = 6.0 Hz), 1.94 (2H, m), 1.90 (2H, m), 1.71 (2H, m), 1.68 (2H, m)

化合物173 (MP: 油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.2, 145.1, 133.3, 129, 124.9, 119.7, 113.1, 49, 30.1, 21.4, 13.8

¹H: 8.10 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.92 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.59 (1H, m, J = 7.9 Hz), 7.45 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.78 (2H, m), 1.94 (1H, m), 1.87 (2H, m), 1.69 (2H, d br, J = 13.5 Hz), 1.61 (1H, m), 1.45 (6H, d, J = 7.1 Hz)

化合物174 (MP: 193) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 148.9, 145.1, 136.6, 134.4, 133.1, 129.5, 127.9, 127.9, 125.5, 122.6, 122.6, 119.8, 114.5, 56, 54.8

^1H : 8.28 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 8.14 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.64 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.50 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.36 (4H, m), 5.53 (2H, s), 5.19 (2H, s)

化合物175 (MP: 油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.1, 149.2, 145.4, 133.3, 129.1, 125, 125, 119.8, 113.5, 113.4, 54.4, 52.6, 42.3, 39.2, 31.6, 27.4, 18.8, 18

^1H : 8.10 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.97 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.59 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.44 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 4.45 (1.4H, d, $J = 12.0$ Hz), 3.88 (0.6H, br), 3.50 (0.6H, br), 2.63 (1.4H, br), 2.15 (0.6H, m), 1.89 (1.4H, m), 1.0-0.96 (6H, m br), 1.93, 1.57, 0.9 (2H, m)

化合物176 (MP: 48) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 173.9, 149.4, 145.3, 133.1, 129.4, 125.2, 119.8, 113.5, 60.8, 47.4, 44.9, 40.7, 28, 14.2

^1H : 8.10 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.98 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.61 (1H, m, $J = 7.8$ Hz), 7.46 (1H, m, $J = 7.8$ Hz), 4.41 (2H, d t, $J = 4.0, 13.5$ Hz), 4.19 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 3.39 (2H, s br), 2.11 (2H, d br, $J = 12.9$ Hz), 1.98 (2H, m), 1.29 (3H, t, $J = 7.1$ Hz)

化合物177 (MP: 75) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 155.3, 149.5, 145.3, 133.1, 129.6, 125.4, 119.9, 113.6, 61.9, 47.8, 45.1, 43.5, 14.6

^1H : 8.11 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 8.0 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.63 (1H, m, $J = 8.2$ Hz), 7.48 (1H, m, $J = 7.6$ Hz), 4.20 (2H,

q, $J = 7.2$ Hz), 3.92 (4H, s br), 3.71 (4H, m), 1.30 (3H, t, $J = 7.2$ Hz)

化合物178 (MP: 143)。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 169.2, 149.5, 145.3, 133.1, 129.7, 125.5, 120, 113.6, 47.8, 46.3, 46, 41.2, 21.4

¹H: 8.11 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 8.0 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.63 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.2$ Hz), 7.48 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.2$ Hz), 3.94 (4H, s br), 3.85 (2H, m), 3.71 (2H, m), 2.18 (3H, s)

化合物179 (MP: 197 (分解))。NMR溶劑：DMSO

¹³C: 175.7, 148.7, 144.7, 132.5, 129.5, 125.4, 119.6, 113.2, 47.1, 44.5, 41, 28.4

¹H: 8.19 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.91 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.70 (1H, m, $J = 7.8$ Hz), 7.53 (1H, m, $J = 7.7$ Hz), 7.38 (1H, s br), 6.90 (1H, s br), 4.23 (2H, s br), 3.24 (2H, s br), 2.47 (1H, m), 1.85 (2H, s br), 1.69 (2H, m, $J = 4.2, 12.0$ Hz)

化合物180 (MP:油狀)。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 158.2, 148.8, 146.4, 143.2, 132.5, 129.5, 127.7, 127.7, 127.5, 127.3, 126.1, 40.5

¹H: 8.63 (1H, s), 7.47 (1H, d br, $J = 3.6$ Hz), 7.39 (2H, m, $J = 8.0$ Hz), 7.33 (1H, m, $J = 7.3$ Hz), 7.31 (1H, d d, $J = 1.2, 5.0$ Hz), 7.19 (2H, m, $J = 8.3$ Hz), 7.02 (1H, d d, $J = 3.6, 5.0$ Hz), 3.58 (3H, s)

化合物181 (MP: 79)。NMR溶劑：CDCl₃

^{13}C : 158.8, 149.9, 147.3, 135.8, 132.5, 128.8, 128,
127.8, 127.6, 127.6, 54.4, 36.9, 36.2

^1H : 8.86 (1H, s), 7.46-7.30 (6H, m), 7.73 (1H, br), 7.11
(1H, t, $J = 4.0$ Hz), 4.93 (2H, br), 3.24 (3H, br)

化合物182 (MP: 87) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 164.3, 150.7, 148.6, 147.3, 137, 129.3, 128.8,
128.6, 126.8, 120.7, 116.7, 49.4, 46.5, 34.7

^1H : 8.73 (1H, s), 7.37-7.21 (5H, m), 7.32 (2H, m), 6.95
(2H, m), 6.93 (1H, m), 4.11 (2H, s), 4.03 (4H, br), 3.27 (4H,
m)

化合物183 (MP: 144) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 163.8 (d d, $J = 12.0, 253.0$ Hz), 160.8 (d d, $J =$
14.0, 261.0 Hz), 158.5 (d, $J = 6.0$ Hz), 145.6, 144.7, 131.4 (d
d, $J = 4.2, 10.0$ Hz), 114.4 (d d, $J = 4.0, 11.5$ Hz), 111.8 (d d,
 $J = 4.0, 22.0$ Hz), 105.0 (t, $J = 25.0$ Hz), 82.1, 79.2, 62.2,
22.8

^1H : 8.96 (1H, s), 8.12 (1H, m, $J = 7.0, 8.4$ Hz), 7.0 (1H,
m), 6.95 (1H, m), 5.53 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.62 (6H, s)

化合物184 (MP: 126) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151, 142.5, 136.9, 133.7, 132.8, 131.7, 128.9,
128.7, 127.6, 127.3, 126.8, 126.3, 125.2, 112.9, 48.5, 44.6,
28.5

^1H : 7.99 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.82 (2H, m, $J = 8.2$ Hz),
7.55 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.42 (2H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.31 (1H,

m, $J = 7.4$ Hz), 7.27-7.19 (3H, m), 7.12 (1H, m), 4.80 (2H, br), 3.88 (2H, t, $J = 5.8$ Hz), 3.05 (2H, t, $J = 5.8$ Hz)

化合物185 (MP: 125) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 160.4, 148.6, 147.8, 134.7, 134.2, 132.4, 129, 128.6, 128.4, 128, 126.7, 126.3, 126.2, 47.3, 44.2, 28

^1H : 9.14 (1H, s), 8.10 (2H, m, $J = 8.6$ Hz), 7.59 (2H, m, $J = 8.6$ Hz), 7.23 (4H, br), 4.88 (2H, br), 3.93 (2H, t, $J = 5.8$ Hz), 3.02 (2H, t, $J = 5.8$ Hz)

化合物186 (MP: 136) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 146.3, 141.6, 136.2, 133.3, 131.3, 128.9, 126.4, 112.3, 81.1, 80.4, 61.9, 22.8

^1H : 7.94 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.72 (2H, m, $J = 8.7$ Hz), 7.51 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.37 (2H, m, $J = 8.7$ Hz), 5.13 (2H, s), 3.89 (2H, s), 1.62 (6H, s)

化合物187 (MP: 176-177) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 167.1, 161.1, 158.7, 157.5, 147.1, 144.6, 129.8, 129.6, 128.5, 125.5, 119.5, 118, 81.4, 78.4, 61.4, 22.4

^1H : 9.21 (1H, s), 8.11 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.98 (1H, s br), 7.93 (2H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.36 (1H, s br), 7.20 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.11 (2H, d, $J = 8.4$ Hz), 5.44 (2H, s), 3.85 (2H, s), 1.52 (6H, s)

化合物188 (MP: 88) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.8, 161.1, 146, 145, 128.2, 122.4, 114.1, 82, 79.3, 62.1, 55.3, 22.8

^1H : 8.90 (1H, s), 8.05 (2H, m, $J = 9.0$ Hz), 6.98 (2H, m, $J = 9.0$ Hz), 5.56 (2H, s), 3.87 (3H, s), 3.84 (2H, s), 1.62 (6H, s)

化合物189 (MP: 132) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.1, 146.3, 144.7, 136.1, 129, 128.3, 128, 81.9, 79.3, 62.3, 22.8

^1H : 8.93 (1H, s), 8.05 (2H, m, $J = 8.6$ Hz), 7.44 (2H, m, $J = 8.6$ Hz), 5.55 (2H, s), 3.85 (2H, s), 1.62 (6H, s)

化合物190 (MP: 82) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.7, 150.1, 147.4, 136, 134.1, 133.1, 128.8, 128.7, 128.4, 128, 127.8, 127.1, 126.9, 126.7, 126.5, 123.7, 54.5, 36.7

^1H : 8.96 (1H, s), 8.64 (1H, br), 8.15 (1H, br), 7.90 (3H, m), 7.53 (2H, m), 7.47-7.31 (5H, m), 5.0 (2H, br), 3.28 (3H, br)

化合物191 (MP: 107) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 161.7, 150, 147.3, 136.3, 133.6, 130.6, 128.7, 128.6, 128.5, 127.6, 127.1, 126.1, 125.8, 125.4, 53.6, 37.3, 35.8

^1H : 9.34 (1H, s), 8.87 (1H, br), 8.27 (1H, d, $J = 7.2$ Hz), 8.06 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 8.0 (1H, br), 7.63 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.55 (1H, br), 7.46-7.26 (6H, m), 4.90 (2H, br), 3.16 (3H, s)

化合物192 (MP: 121-123 (dec.)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 161, 148.7, 146.9, 143.5, 133.4, 130.5, 129.6,

129.5, 128.4, 128.3, 127.2, 127, 126 (2 sig.), 125.8, 125.2, 40.1

^1H : 9.21 (1H, s), 8.10 (1H, d d, $J = J = 1.2, 7.2$ Hz), 7.98 (1H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.93 (2H, m), 7.60-7.30 (8H, m), 3.52 (3H, s)

化合物193 (MP: 142) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.2, 145.3, 133.1, 129.5, 125.3, 119.9, 113.5, 71.8, 53.3, 50.2, 18.6

^1H : 8.11 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 8.0 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.62 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.1$ Hz), 7.47 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.1$ Hz), 4.42 (2H, d br, $J = 13.0$ Hz), 3.83 (2H, m), 3.03-2.90 (2H, m br), 1.26 (6H, s br)

化合物194 (MP: 75) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150, 145.3, 133.1, 129.5, 125.4, 119.9, 113.6, 66.1, 52.8, 49.7, 17.5

^1H : 8.11 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 8.01 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.63 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.48 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 4.22 (2H, s br), 4.06-3.90 (2H, m br), 3.66 (2H, s br), 1.31 (6H, s br)

化合物195 (MP: 油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.9, 145.3, 139.1, 133.3, 129.3, 128.7, 127.9, 127.3, 125.2, 119.8, 113.6, 55, 32.2, 16

^1H : 8.12 (1H, m, $J = 8.3$ Hz), 8.07 (1H, m, $J = 8.4$ Hz), 7.63 (1H, m, $J = 1.0, 7.0, 8.0$ Hz), 7.48 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.3$ Hz), 7.45 (2H, br), 7.41 (2H, m, $J = 7.4$ Hz), 7.34 (1H, m

$J = 8.0$ Hz), 5.95 (1H, q, $J = 6.8$ Hz), 3.0 (3H, s), 1.78 (3H, d, $J = 7.1$ Hz)

化合物 196 (MP: 140)。NMR 溶劑：CDCl₃

¹³C: 150.7, 150.5, 142.6, 141.7, 140.9, 137.1, 133.2, 129.3, 129.2, 128.7, 127.4, 127.2, 126.5, 124.1, 124, 121.1, 116.9, 113.2, 49.5, 46.5

¹H: 8.07 (1H, t, $J = 1.7$ Hz), 7.99 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.80 (1H, d t, $J = 1.5, 7.6$ Hz), 7.67 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.56 (1H, d t, $J = 1.5, 7.7$ Hz), 7.49 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.47 (2H, m, $J = 7.7$ Hz), 7.37 (1H, m, $J = 7.2$ Hz), 7.32 (2H, m, $J = 8.2$ Hz), 6.96 (3H, m), 3.85 (4H, m, $J = 5.0$ Hz), 3.30 (4H, m, $J = 5.0$ Hz)

化合物 197 (MP: 113)。NMR 溶劑：CDCl₃

¹³C: 150.5, 142.2, 141.3, 137, 133.1, 131.5, 128.8, 128.3 (2 sig.), 126.4, 125.8, 113.3, 47, 35.9, 35.8, 35.7, 32.1, 28.4

¹H: 7.88 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.73 (2H, m), 7.45 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.37 (2H, m), 7.30 (2H, m, $J = 7.5$ Hz), 7.20 (1H, m, $J = 7.6$ Hz), 7.19 (2H, m, $J = 8.0$ Hz), 4.14 (2H, d br, $J = 13.2$ Hz), 3.04 (2H, d t, $J = 2.3, 13.0$ Hz), 2.63 (2H, t, $J = 7.7$ Hz), 1.83 (2H, d br, $J = 13.5$ Hz), 1.67 (2H, m), 1.58 (1H, m), 1.36 (2H, m), 1.25 (2H, d q, $J = 4.2, 13.1$ Hz)

化合物 198 (MP: 178)。NMR 溶劑：CDCl₃

¹³C: 150.3, 140.3, 137.2, 133, 132.8, 131.2, 130.6, 127,

124.3, 113.9, 106.1, 64.6, 44.8, 35

^1H : 7.90 (1H, d, $J = 2.0$ Hz), 7.89 (1H, d, $J = 1.4$ Hz),
7.61 (1H, d d, $J = 2.1, 8.4$ Hz), 7.49 (1H, d, $J = 1.4$ Hz), 7.46
(1H, d, $J = 8.4$ Hz), 4.01 (4H, s), 3.73 (4H, m, $J = 5.5$ Hz),
1.82 (4H, m, $J = 5.5$ Hz)

化合物199 (MP: 174) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.2, 145.8, 143, 141.7, 137.5, 130.3, 128, 126.2,
125.9, 123.5, 115.1, 111.7, 40.1

^1H : 7.49 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.41 (2H, m, $J = 8.4$ Hz),
7.40 (2H, m, $J = 7.5$ Hz), 7.33 (1H, m, $J = 7.4$ Hz), 7.17 (2H,
m, $J = 8.4$ Hz), 7.04 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 6.65 (2H, m, $J = 8.4$
Hz), 3.69 (2H, s), 3.51 (3H, s)

化合物200 (MP: 吸濕的) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 157.8, 149, 142.4, 137.5, 130, 129.9, 127.9, 126.2,
118, 115.4, 114.4, 111, 62.3, 54.4, 48.4, 39.7

^1H : 12.25 (1H, s br), 9.94 (2H, s), 8.04 (1H, s), 7.82
(1H, s), 7.42 (2H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.39 (1H, s), 7.36 (2H, m),
7.32 (1H, m), 7.30 (2H, m), 6.92 (1H, m), 4.46 (2H, m), 3.63
(6H, m), 3.48 (4H, m), 3.45 (3H, s)

化合物201 (MP: 119) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.8 (d d, $J = 13.0, 244.5$ Hz), 149.8, 148.5 (d d,
 $J = 12.5, 245.0$ Hz), 138.9, 137.9, 131.1 (d d, $J = 4.0, 7.0$ Hz),
121.4 (d d, $J = 3.0, 6.5$ Hz), 117.8 (d, $J = 17.3$ Hz), 115.2,
113.5 (d, $J = 18.7$ Hz), 62.7, 48.1, 46.5, 28.3, 25.8, 25.3

^1H : 8.12 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.87 (1H, d d d, $J = 2.0$, 7.8, 12.0 Hz), 7.70 (1H, m), 7.46 (1H, d t, $J = 8.7$, 10.7 Hz), 3.51 (4H, m), 2.57 (4H, m), 2.29 (1H, br), 1.74 (4H, m), 1.57 (1H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.20 (4H, m), 1.07 (1H, t br, $J = 10.0$ Hz)

化合物 202 (MP: 油狀) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.4, 145.1, 137.8, 133.2, 129.2, 128.4, 127.7, 127.6, 125.1, 119.7, 113.7, 73.3, 69.4, 68.3, 48.7, 45.1, 13.9, 12.6

^1H : 8.09 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.98 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.58 (1H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.45 (1H, m, $J = 1.0$, 7.2, 8.2 Hz), 7.31 (5H, m), 4.53 (2H, br), 3.95-3.75 (6H, m), 1.38 (3H, t, $J = 6.9$ Hz)

化合物 203 (MP: 132) 。 NMR 溶劑 : DMSO

^{13}C : 157.4, 148.6, 142.2, 137.3, 136.6, 129.9, 128, 126.5, 126.3, 123.2, 115.2, 114.3, 62.4, 54.4, 48.4, 39.7 (2 sig.)

^1H : 11.97 (1H, s br), 9.68 (2H, s), 7.88 (1H, s), 7.62 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.57 (1H, s), 7.42 (2H, t, $J = 7.4$ Hz), 7.36 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.32 (1H, t, $J = 7.4$ Hz), 7.0 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 4.42 (2H, m), 3.61 (6H, m), 3.47 (4H, m), 3.43 (3H, s)

化合物 204 (MP: 141) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 161.7, 148.5, 147.3, 136.1, 128.9, 128.4, 128,

106.5, 64.6, 44.7, 35.1

^1H : 8.80 (1H, s), 8.07 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.43 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 4.02 (4H, s), 3.95 (4H, br), 1.89 (4H, m)

化合物205 (MP: 74-75) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.3, 161, 148.8, 147, 142.3, 128.3 (2 sig.), 128.2, 125.7, 122.6, 114, 55.3, 47, 36, 35.8 (2 sig.), 32.1, 28.5

^1H : 8.75 (1H, s), 8.07 (2H, d, $J = 7.7$ Hz), 7.28 (2H, m), 7.19 (3H, m), 6.98 (2H, d, $J = 7.7$ Hz), 4.61 (2H, br), 3.03 (2H, br), 3.86 (3H, s), 2.62 (2H, m), 1.84 (2H, m), 1.67 (2H, m), 1.59 (1H, m), 1.30 (4H, m)

化合物206 (MP: 131) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 161.8, 150.6, 148.5, 147.3, 133.6, 130.7, 130, 129.1, 128.7, 128.4, 127.3, 126.4, 126.3, 125.8, 125.4, 119.5, 115.9, 48.2, 45.8

^1H : 9.29 (1H, s), 9.03 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 8.28 (1H, d d, $J = 1.0, 7.3$ Hz), 8.10 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 8.05 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.72-7.57 (3H, m), 7.25 (2H, t, $J = 7.8$ Hz), 6.99 (2H, d, $J = 8.3$ Hz), 6.82 (1H, t, $J = 7.3$ Hz), 3.94 (4H, s br), 3.32 (4H, m, $J = 5.0$ Hz)

化合物207 (MP: 181) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 167.1, 160.7, 158.8, 156.6, 148.7, 148, 134.2, 132.6, 131.7, 131.1, 129.9, 129.7, 128.6, 126.8, 126.4, 126.3, 121.8, 120.8, 118.2, 116.1, 46.9, 44.9, 28.2

^1H : 9.15 (1H, s), 7.98 (1H, s br), 7.96 (2H, d, $J = 8.8$

Hz), 7.90 (1H, d, $J = 7.7$ Hz), 7.66 (1H, m br), 7.59 (1H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.37 (1H, s br), 7.24 (1H, d d, $J = 2.4, 8.2$ Hz), 7.21 (4H, m br), 7.13 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 4.83 (2H, m br), 3.88 (2H, m br), 2.96 (2H, t, $J = 5.3$ Hz)

化合物208 (MP: 217-218) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 167.2, 160.7, 159, 156.4, 150.6, 148.3, 148.1, 131.7, 131.1, 129.8, 129.6, 129.1, 122, 121, 119.5, 117.9, 116.6, 115.9, 48.2, 45.8

^1H : 9.15 (1H, s), 7.98 (1H, s br), 7.94 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.91 (1H, m), 7.69 (1H, m br), 7.59 (1H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.36 (1H, s br), 7.24 (2H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.23 (1H, m), 7.11 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 6.97 (2H, d, $J = 8.0$ Hz), 6.82 (1H, t, $J = 7.0$ Hz), 3.88 (4H, br), 3.27 (4H, br)

化合物209 (MP: 192-193) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 167.1, 160.8, 159, 156.3, 147.2, 144.5, 131.7, 131.1, 129.8, 129.5, 122.1, 121, 117.8, 116.8, 81.3, 78.3, 61.4, 22.3

^1H : 9.20 (1H, s), 7.96 (1H, s br), 7.93 (2H, m, $J = 8.8$ Hz), 7.90 (1H, m), 7.69 (1H, d d, $J = 1.8, 2.4$ Hz), 7.57 (1H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.35 (1H, s br), 7.22 (1H, d d d, $J = 0.9, 2.5, 8.2$ Hz), 7.09 (2H, m, $J = 8.8$ Hz), 5.39 (2H, s), 3.82 (2H, s), 1.50 (6H, s)

化合物210 (MP: 185) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 167.1, 160.7, 158.9, 156.5, 148.3, 148.1, 131.7,

131.1, 129.8, 129.6, 122, 120.9, 118, 116.5, 65.8, 46.2

^1H : 9.13 (1H, s), 7.97 (1H, s br), 7.93 (2H, d, $J = 8.7$ Hz), 7.88 (1H, d, $J = 7.7$ Hz), 7.65 (1H, m br), 7.58 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.35 (1H, s br), 7.22 (1H, d d, $J = 1.9, 7.9$ Hz), 7.10 (2H, d, $J = 8.7$ Hz), 3.80-3.63 (8H, m)

化合物211 (MP: 116) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.6, 161.2, 157.7 (d, $J = 240.0$ Hz), 148.7, 147.4 (d, $J = 2.0$ Hz), 147.3, 128.3, 122.3, 118.7 (d, $J = 7.8$ Hz), 115.8 (d, $J = 22.0$ Hz), 114.1, 55.3, 50.5, 46.4

^1H : 8.83 (1H, s), 8.08 (2H, m), 7.01 (2H, t, $J = 9.4$ Hz), 7.0 (2H, m), 6.93 (2H, m), 4.12 (4H, br), 3.88 (3H, s), 3.25 (4H, m)

化合物212 (MP: 281 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 160.6, 148.5, 148.1, 135, 129.2, 128.4, 128.2, 64.3, 47.3, 42.9, 26.1, 24.7, 24.5

^1H : 11.29 (1H, s), 9.20 (1H, s), 8.10 (2H, m, $J = 8.8$ Hz), 7.60 (2H, m, $J = 8.8$ Hz), 4.55 (2H, m br), 3.75 (2H, t br, $J = 12.0$ Hz), 3.55 (2H, d br, $J = 11.5$ Hz), 3.23 (3H, m), 2.13 (2H, d br, $J = 10.5$ Hz), 1.82 (2H, d br, $J = 12.8$ Hz), 1.61 (1H, d br, $J = 12.5$ Hz), 1.43 (2H, m, $J = 11.5$ Hz), 1.26 (2H, m, $J = 12.8$ Hz), 1.10 (1H, m, $J = 12.5$ Hz)

化合物213 (MP: 99) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159, 146.2, 144.7, 132.4, 127.9, 127.7, 127.6, 82, 79.2, 62.2, 22.8

¹H: 8.89 (1H, s), 7.74 (1H, d, J = 3.0 Hz), 7.41 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.13 (1H, m), 5.51 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.61 (6H, s)

化合物214 (MP: 121) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 162.1, 147.0 (2 sig.), 136.2, 129, 128.2, 128.1, 51.8, 51.1, 32, 28.9

¹H: 8.93 (1H, s), 8.07 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.44 (2H, m, J = 8.8 Hz), 4.97 (2H, m br), 4.23 (2H, m br), 3.14 (2H, br)

化合物215 (MP: 129) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.6 (d d, J = 13.0, 248.0 Hz), 149.9 (d d, J = 13.0, 249.0 Hz), 149.4, 140.9, 137, 129.9 (d d, J = 4.0, 7.0 Hz), 121.2 (d d, J = 4.0, 6.5 Hz), 117.6 (d, J = 17.7 Hz), 114.3 (d, J = 19.0 Hz), 113, 51.3, 50.9, 30.5

¹H: 8.02 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 2.0, 7.7, 11.5 Hz), 7.55 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.50 (1H, m), 7.19 (1H, d t, J = 8.3, 10.0 Hz), 4.71 (2H, s), 3.98 (2H, t, J = 6.3 Hz), 3.14 (2H, t, J = 6.3 Hz)

化合物216 (MP: 115) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 149.3, 149, 144.2, 136.4, 135.8, 121, 118, 114, 112, 109.1, 80.7, 79.3, 61.4, 55.8, 55.6, 22.2

¹H: 9.22 (1H, s), 8.36 (1H, s), 7.55 (1H, d, J = 1.8 Hz), 7.49 (1H, d d, J = 1.8, 8.4 Hz), 7.05 (1H, d, J = 8.4 Hz), 5.22 (2H, s), 3.87 (2H, s), 3.83 (3H, s), 3.79 (3H, s), 1.52 (6H, s)

化合物217 (MP: 154-155) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.3, 149.1, 148.5, 141.9, 136.7, 126.1, 117.4, 112.4, 111.2, 108.4, 57.5, 55.9 (2 sig.), 31.4, 30, 25.4, 25.2

¹H: 7.90 (1H, s), 7.43 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.31 (1H, d br, J = 8.6 Hz), 6.91 (1H, d, J = 8.3 Hz), 3.97 (3H, s), 3.97 (1H, m), 3.91 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.58 (2H, m), 1.38 (2H, m), 1.13 (1H, m)

化合物218 (MP: 140-141) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 149.2, 139.9, 137, 133.1, 132.8, 131.1, 130.6, 126.9, 124.3, 113.6, 48.9, 25.3

¹H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.90 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.65 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d d, J = 2.0, 8.5 Hz), 7.46 (1H, d, J = 8.5 Hz), 3.68 (4H, m), 2.03 (4H, m)

化合物219 (MP: 106) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 147, 143.1, 139.8, 131.8, 124.8, 124, 120.7, 113, 81, 80.6, 61.5, 23.1

¹H: 8.11 (1H, s), 7.82 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.70 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.40 (1H, d t, J = 1.5, 7.4 Hz), 7.36 (1H, d t, J = 1.5, 7.4 Hz), 5.04 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.67 (6H, s)

化合物220 (MP: 114-115) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 146.9, 142.2, 136.6, 132.8, 128.7, 127.6, 125.1, 112.5, 96.3, 63.5, 48.2, 24.1

¹H: 8.06 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.80 (2H, m, J = 8.2 Hz), 7.62 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.41 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.30 (1H, m, J = 7.4 Hz), 4.10 (2H, t, J = 6.0 Hz), 3.84 (2H, t, J = 6.0

Hz), 1.73 (6H, s)

化合物221 (MP: 120) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.4, 142.2, 136.7, 133, 128.7, 127.4, 125.1, 113.2, 49.1, 30, 21.2, 13.6

¹H: 7.87 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.80 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.46 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.41 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.29 (1H, m, J = 7.5 Hz), 4.41 (2H, m), 1.90 (1H, m), 1.77 (2H, m), 1.66 (2H, m), 1.62 (1H, m), 1.39 (6H, d, J = 7.2 Hz)

化合物222 (MP: 116) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.7, 143.3, 141.4, 132.1, 124.5, 123.6, 120.6, 112.6, 57.4, 31.3, 30, 25.4, 25.3

¹H: 8.16 (1H, s), 7.82 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.55 (1H, m), 7.38 (1H, d t, J = 1.5, 7.3 Hz), 7.35 (1H, d t, J = 1.5, 7.3 Hz), 4.0 (1H, m, J = 3.4, 12.1 Hz), 2.96 (3H, s), 1.89 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.61 (2H, d q, J = 4.0, 12.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 4.0, 13.5 Hz), 1.14 (1H, t q, J = 3.5, 13.5 Hz)

化合物223 (MP: 155) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 157.9 (d, J = 241.0 Hz), 150.5, 147.1 (d, J = 2.5 Hz), 141.6, 137, 133.3, 131.3, 128.9, 126.4, 118.9 (d, J = 7.7 Hz), 115.8 (d, J = 22.0 Hz), 113.2, 50.5, 46.5

¹H: 7.94 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.74 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.38 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.01 (2H, m), 6.91 (2H, m), 3.82 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.19 (4H, m, J =

5.0 Hz)

化合物224 (MP: 201-202) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 156.8, 149.8, 143, 139.8, 137.7, 129.9, 127.7, 126.5, 126.3, 126, 114.9, 113.3, 62.2, 54.9, 52.8, 39.6, 22.5, 21.2

^1H : 9.28 (1H, s br), 7.60 (2H, d, $J = 8.9$ Hz), 7.55 (1H, d, $J = 1.0$ Hz), 7.48 (1H, d, $J = 1.0$ Hz), 7.41 (2H, t, $J = 7.4$ Hz), 7.34 (2H, d, $J = 7.3$ Hz), 7.32 (1H, m, $J = 7.2$ Hz), 6.98 (2H, d, $J = 8.9$ Hz), 4.32 (2H, t, $J = 5.0$ Hz), 3.50 (2H, br), 3.48 (2H, m), 3.42 (3H, s), 3.0 (2H, br), 1.79 (2H, br), 1.69 (3H, br), 1.39 (1H, br)

化合物225 (MP: 109) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.8, 147.8, 146.5, 142.5, 137, 136, 128.5, 127.8, 127.2, 126.4, 117.4, 114.1, 111.3, 108.9, 81.1, 80.4, 71, 61.8, 56, 22.9

^1H : 7.93 (1H, d, $J = 1.5$ Hz), 7.46 (2H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.42 (1H, d, $J = 1.5$ Hz), 7.41 (1H, d, $J = 2.0$ Hz), 7.38 (2H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.31 (1H, m), 7.21 (1H, d d, $J = 2.0, 8.3$ Hz), 6.91 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 5.20 (2H, s), 5.12 (2H, s), 3.97 (3H, s), 3.88 (2H, s), 1.61 (6H, s)

化合物226 (MP: 230-232 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 145.4, 140.5, 139.7, 138.3, 137.6, 134.8, 132.6, 127.5, 117.7, 80.7, 79.3, 61.1, 22.4

^1H : 9.34 (1H, d, $J = 1.8$ Hz), 8.97 (1H, t d, $J = 1.5, 8.2$

Hz), 8.81 (1H, d br, $J = 5.2$ Hz), 8.59 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 8.41 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 8.11 (1H, d d, $J = 5.2, 8.2$ Hz), 5.20 (2H, s), 3.86 (2H, s), 1.50 (6H, s)

化合物227 (MP: 118-119) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 148.7, 142.6, 136.7, 132.7, 128.7, 127.7, 125.2, 112.3, 88, 66.4, 48, 19.2

¹H: 8.08 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.81 (2H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.62 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.42 (2H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.31 (1H, m, $J = 7.4$ Hz), 5.49 (1H, q, $J = 5.2$ Hz), 4.27 (1H, m), 3.89 (1H, m), 3.80 (2H, m), 1.57 (3H, d, $J = 5.2$ Hz)

化合物228 (MP: 204-205) 。 NMR溶劑：DMSO

¹³C: 147.7, 146.3, 145.9, 141.3, 136.6, 124.8, 117.5, 115.6, 111.9, 109, 80.6, 79.3, 60.8, 55.6, 22.4

¹H: 9.03 (1H, s), 8.09 (1H, d, $J = 1.0$ Hz), 7.87 (1H, d, $J = 1.0$ Hz), 7.38 (1H, d, $J = 1.7$ Hz), 7.26 (1H, d d, $J = 1.7, 8.1$ Hz), 6.77 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 5.17 (2H, s), 3.84 (2H, s), 3.81 (3H, s), 1.50 (6H, s)

化合物229 (MP: 152) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 151.2, 142.1, 137.2, 133.1, 128.6, 127.4, 125.1, 113, 58.4, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 7.92 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.80 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.48 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.40 (2H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.29 (1H, t, $J = 7.3$ Hz), 2.99 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

化合物230 (MP: 67-68) 。 NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 157.4, 148.7, 142.3, 137.4, 136.8, 129.9, 127.9, 126.5, 126.3, 123.4, 115.1, 114.2, 63.1, 62.3, 54.7, 51.6, 39.7

^1H : 11.54 (1H, s br), 8.28 (1H, s), 7.70 (1H, s), 7.66 (2H, d, $J = 8.9$ Hz), 7.43 (2H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.40 (2H, d, $J = 7.7$ Hz), 7.34 (1H, m, $J = 6.9$ Hz), 7.03 (2H, d, $J = 8.9$ Hz), 4.46 (2H, m), 3.95 (2H, d br, $J = 13.0$ Hz), 3.85 (2H, t br, $J = 11.70$ Hz), 3.54 (2H, m), 3.48 (2H, m), 3.46 (3H, s), 3.19 (2H, m)

化合物231 (MP: 46-47) 。 NMR溶劑： CDCl_3

^{13}C : 146.5, 142.5, 141.7, 140.9, 136.3, 133.2, 129.1, 128.7, 127.4, 127.2, 126.5, 124.1, 124, 112.2, 81.1, 80.4, 61.8, 22.9

^1H : 8.05 (1H, t, $J = 1.6$ Hz), 7.99 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.77 (1H, t d, $J = 1.3, 7.6$ Hz), 7.66 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.58 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.54 (1H, t d, $J = 1.3, 7.7$ Hz), 7.48 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.46 (2H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.37 (1H, m, $J = 7.4$ Hz), 5.15 (2H, s), 3.89 (2H, s), 1.63 (6H, s)

化合物232 (MP: 191-192) 。 NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 167.9, 146.2, 140.7, 140.1, 140, 137.1, 135, 134, 129.6, 129.4, 129, 126.7, 125.8, 125.7, 124.2, 123.2, 114, 80.6, 79.3, 60.8, 22.4

^1H : 8.23-8.17 (4H, m), 8.15 (1H, s br), 7.88 (3H, m), 7.63 (1H, m, $J = 8.1$ Hz), 7.57 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.52 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.49 (1H, s br), 5.20 (2H, s), 3.86 (2H, s), 1.51

(6H, s)

化合物233 (MP: 130-131) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 146.5, 141.2, 136.7, 133.3, 131.4, 128.9, 126.4, 112.8, 98.6, 63.6, 48.8, 29.2, 22.3, 7.6

^1H : 8.05 (1H, d, $J = 1.3 \text{ Hz}$), 7.73 (2H, m, $J = 8.6 \text{ Hz}$), 7.61 (1H, d, $J = 1.3 \text{ Hz}$), 7.38 (2H, m, $J = 8.6 \text{ Hz}$), 4.16 (1H, m), 4.06 (1H, m), 3.83 (2H, m), 2.21 (1H, m), 2.06 (1H, m), 1.70 (3H, s), 0.95 (3H, t, $J = 7.4 \text{ Hz}$)

化合物234 (MP: 135-136 (分解)) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.1, 148.4, 143.6, 142.3, 142.2, 137.1, 137, 132.6, 132.3, 128.8, 128.7, 128, 127.7, 125.3, 125.2, 125.1, 112.8, 111.6, 65.2, 48.9, 32.8, 30.2, 22.1

^1H : 8.18 (1H, d, $J = 1.4 \text{ Hz}$), 7.98 (1H, d, $J = 1.4 \text{ Hz}$), 7.81 (2H, m, $J = 8.5 \text{ Hz}$), 7.77 (2H, m, $J = 8.5 \text{ Hz}$), 7.67 (1H, d, $J = 1.4 \text{ Hz}$), 7.57 (1H, d, $J = 1.4 \text{ Hz}$), 7.42 (2H, t, $J = 7.5 \text{ Hz}$), 7.40 (2H, t, $J = 7.5 \text{ Hz}$), 7.33 (1H, m), 7.30 (1H, m), 5.61 (1H, m), 4.73 (2H, t, $J = 5.3 \text{ Hz}$), 4.12 (2H, t, $J = 5.3 \text{ Hz}$), 2.34 (2H, m), 2.30 (2H, m), 1.91 (2H, qt, $J = 7.6 \text{ Hz}$)

化合物235 (MP: 154-155) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 147.3, 141.7, 136.1, 133.3, 131.3, 128.9, 126.4, 112.3, 88.8, 78.6, 62.5, 24.8, 22, 20.7

^1H : 7.92 (1H, d, $J = 1.2 \text{ Hz}$), 7.74 (2H, d, $J = 8.6 \text{ Hz}$), 7.50 (1H, d, $J = 1.2 \text{ Hz}$), 7.38 (2H, d, $J = 8.6 \text{ Hz}$), 5.48 (1H, q, $J = 5.2 \text{ Hz}$), 3.93 (1H, d, $J = 8.6 \text{ Hz}$), 3.72 (1H, d, $J = 8.6 \text{ Hz}$),

1.62 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.20 (3H, d, $J = 5.2$ Hz)

化合物236 (MP: 114-115) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.9, 146.5, 142.5 (2 sig.), 141.6, 136.3, 133.2, 129.7, 129.1, 126.6, 124.2, 124, 119.7, 112.8, 112.8, 112.3, 81.1, 80.4, 61.9, 55.3, 22.9

^1H : 8.02 (1H, t, $J = 1.8$ Hz), 7.99 (1H, d, $J = 1.5$ Hz), 7.78 (1H, t d, $J = 1.5, 7.6$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 1.5$ Hz), 7.53 (1H, t d, $J = 1.5, 7.7$ Hz), 7.48 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.38 (1H, t, $J = 8.1$ Hz), 7.25 (1H, d d d, $J = 1.0, 1.5, 7.6$ Hz), 7.19 (1H, d d, $J = 1.8, 2.6$ Hz), 6.92 (1H, d d d, $J = 1.0, 2.6, 8.2$ Hz), 5.15 (2H, s), 3.89 (5H, s), 1.63 (6H, s)

化合物237 (MP: 148-149) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 146.8, 143.2, 135.9, 132.9, 128.7, 127.6, 125.2, 110.7, 53.2, 41.5, 36.1, 29.4

^1H : 8.10 (1H, s), 7.79 (2H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.52 (1H, s), 7.40 (2H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.30 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 5.39 (1H, s), 2.17 (3H, s), 2.11 (6H, s), 1.74 (6H, s)

化合物238 (MP: 175) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 169.3, 151.3, 141.8, 141.5, 140.6, 137, 133.8, 133.7, 130.7, 129.3, 129, 126.3, 126.3, 126.1, 124.5, 124, 113.6, 57.5, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

^1H : 8.11 (1H, t, $J = 1.8$ Hz), 8.08 (1H, t, $J = 1.6$ Hz), 7.94 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.81 (2H, m), 7.78 (1H, m), 7.57 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.52 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.51 (1H, m),

7.48 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 6.43 (1H, s br), 5.93 (1H, s br), 3.97 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.70 (1H, d br, $J = 13.5$ Hz), 1.58 (2H, d q, $J = 3.5, 12.5$ Hz), 1.38 (2H, t q, $J = 3.0, 13.0$ Hz), 1.13 (1H, t q, $J = 3.3, 13.0$ Hz)

化合物239 (MP: 129) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 151.3, 142.1, 141.7, 141, 137, 133.5, 129.1, 128.7, 127.3, 127.2, 126.3, 124, 124, 113.4, 57.5, 31.3, 30, 25.4, 25.2

¹H: 8.07 (1H, t, $J = 1.8$ Hz), 7.95 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.78 (1H, t d, $J = 1.7, 7.7$ Hz), 7.67 (2H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.56 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.54 (1H, d t, $J = 1.8, 7.9$ Hz), 7.48 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.46 (2H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.37 (1H, m), 3.97 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.71 (1H, d br, $J = 13.0$ Hz), 1.59 (2H, d q, $J = 3.5, 12.5$ Hz), 1.38 (2H, t q, $J = 3.0, 13.0$ Hz), 1.13 (1H, t q, $J = 3.5, 13.0$ Hz)

化合物240 (MP: 129-130) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 159.9, 151.3, 142.6, 142, 141.5, 137, 133.5, 129.7, 129.1, 126.4, 124.2, 124, 119.8, 113.4, 112.8, 112.8, 57.5, 55.3, 31.3, 30, 25.4, 25.2

¹H: 8.04 (1H, t, $J = 1.6$ Hz), 7.94 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.79 (1H, t t, $J = 1.5, 7.5$ Hz), 7.56 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.52 (1H, d t, $J = 2.0, 7.9$ Hz), 7.48 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.38 (1H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.25 (1H, d d d, $J = 1.0, 1.7, 7.7$ Hz), 7.19 (1H, d d, $J = 1.8, 2.5$ Hz), 6.92 (1H, d d d, $J = 1.0, 2.6, 8.2$), 3.97

(1H, m), 3.89 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.71 (1H, d br, $J = 13.0$ Hz), 1.59 (2H, d q, $J = 3.5, 12.3$ Hz), 1.39 (2H, t q, $J = 3.0, 13.0$ Hz), 1.13 (1H, t q, $J = 3.3, 13.0$ Hz)

化合物241 (MP: 173-174) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.1, 141.7, 136.7 (2 sig.), 133.4, 131.2, 129.7, 128.9, 128.8, 126.9, 126.4, 112.5, 91, 66.2, 47.9

^1H : 8.01 (1H, br), 7.68 (2H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.54 (1H, br), 7.51 (2H, m), 7.42 (3H, m), 7.36 (2H, d, $J = 8.3$ Hz), 6.39 (1H, s), 4.32 (1H, br), 4.12 (1H, m), 4.04 (1H, m), 3.94 (1H, m)

化合物242 (MP: 173-174) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 158.9, 151.8, 140.2, 134.6, 120.8, 117, 97.4, 59.7, 57.3, 33.2, 30.9, 29.6, 25.4, 25.3

^1H : 8.61 (1H, s br), 7.94 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.53 (1H, d, $J = 2.0$ Hz), 7.06 (1H, d d, $J = 2.0, 9.0$ Hz), 3.21 (3H, s), 2.0 (2H, m), 1.89 (2H, m), 1.70 (2H, m), 1.61 (3H, m), 1.18 (1H, m)

化合物243 (MP: 165-166) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 167.7, 145.6, 145.5, 139, 137.4, 135.1, 131.9, 130, 129.2, 129.1, 127.1, 126.1, 117.3, 114.5, 81.8, 78.7, 61.6, 22.6

^1H : 8.57 (1H, d d, $J = 0.7, 1.6$ Hz), 8.31 (1H, t, $J = 1.7$ Hz), 8.21 (1H, d d, $J = 0.7, 8.8$ Hz), 8.18 (1H, s br), 8.11 (1H,

d d, $J = 1.6, 8.8$ Hz), 7.98 (1H, d t, $J = 1.5, 7.8$ Hz), 7.91 (1H, d t, $J = 1.4, 7.8$ Hz), 7.60 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.51 (1H, s br), 5.46 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.60 (6H, s)

化合物 244 (MP: 148) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.5, 141.1, 137, 133.1, 131.5, 128.8, 126.4, 113.5, 59.3, 31.2, 28.9, 24.4

^1H : 7.91 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.73 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.50 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.37 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 4.44 (1H, qt, $J = 8.2$ Hz), 3.0 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.78 (2H, m), 1.68 (2H, m), 1.63 (2H, m)

化合物 245 (MP: 213-215) 。 NMR 溶劑 : DMSO

^{13}C : 167.6, 150.9, 142.7, 140.4, 139.6, 137.7, 134.2, 133.2, 129.4, 128.2, 126.6, 125.6, 124.4, 123.1, 115, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.9

^1H : 8.20 (1H, t, $J = 1.8$ Hz), 8.18 (1H, d, $J = 1.1$ Hz), 8.15 (1H, d, $J = 1.1$ Hz), 8.07 (1H, s br), 8.0 (2H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.90 (1H, t d, $J = 1.4, 7.7$ Hz), 7.83 (2H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.62 (1H, t d, $J = 1.6, 8.0$ Hz), 7.51 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.44 (1H, s br), 3.84 (1H, m), 2.95 (3H, s), 1.80 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.57 (2H, m), 1.30 (2H, m, $J = 12.7$ Hz), 1.11 (1H, m, $J = 13$ Hz)

化合物 246 (MP: 118-119) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 163.1 (d, $J = 245.0$ Hz), 151.3, 143.3 (d, $J = 8.0$ Hz), 141.8, 140.4 (d, $J = 2.0$ Hz), 137, 133.7, 130.1 (d, $J =$

8.5 Hz), 129.2, 126.2, 124.5, 123.9, 122.8 (d, $J =$), 114.1 (d, $J = 22.0$ Hz), 114.1 (d, $J = 21.0$ Hz), 113.5, 57.6, 31.4, 30, 25.4, 25.2

^1H : 8.05 (1H, m), 7.94 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.79 (1H, t d, $J = 2.0, 6.7$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.50 (2H, m), 7.44 (2H, m), 7.37 (1H, d d d, $J = 1.7, 2.5, 10.5$ Hz), 7.06 (1H, m), 3.98 (1H, m), 3.02 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.87 (2H, m), 1.71 (1H, d br, $J = 11.5$ Hz), 1.59 (2H, d q, $J = 3.6, 12.5$ Hz), 1.39 (2H, t q, $J = 3.2, 13.2$ Hz), 1.13 (1H, t q, $J = 3.3, 13.0$ Hz)

化合物247 (MP: 208-209) ◦ NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 157.9, 150.9, 141.6, 140.7, 140.5, 137.7, 134, 130, 129.2, 125.3, 123.8, 122.9, 117.6, 114.8, 114.5, 113.6, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.9

^1H : 9.56 (1H, s, br), 8.14 (2H, s), 8.08 (1H, s), 7.83 (1H, t d, $J = 2.0, 6.6$ Hz), 7.47 (1H, m), 7.45 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.27 (1H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.13 (1H, d d d, $J = 1.0, 1.7, 7.6$ Hz), 7.08 (1H, t, $J = 1.9$ Hz), 6.78 (1H, d d d, 1.0, 2.4, 8.0 Hz), 3.84 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.57 (2H, m), 1.30 (2H, q, $J = 12.7$ Hz), 1.13 (1H, m, $J = 13.0$ Hz)

化合物248 (MP: 131-132) ◦ NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 150.9, 149 (m, $J = 2.0$ Hz), 142.5, 140.3, 138.8, 137.7, 134.3, 130.9, 129.5, 126.0, 125.6, 124.6, 123.1, 120.2 (q, $J = 256.0$ Hz), 119.9, 119.4, 115.1, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.9

^1H : 8.20 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 8.17 (1H, t, $J = 1.6$ Hz),
 8.15 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.91 (1H, t d, $J = 1.4, 7.8$ Hz), 7.79
 (1H, d, $J = 7.9$ Hz), 7.71 (1H, br), 7.62 (1H, t, $J = 8.1$ Hz),
 7.61 (1H, m), 7.51 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.39 (1H, d, $J = 8.2$
 Hz), 2.94 (3H, s), 3.84 (1H, m), 1.78 (4H, m), 1.60 (1H, m),
 1.56 (2H, m), 1.30 (2H, m, $J = 12.8$ Hz), 1.11 (1H, m)

化合物249 (MP: 162-163) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.5, 141.2, 136.9, 136.8, 133.1, 131.4, 128.9,
 128.8, 127.7, 126.6, 126.3, 113.1, 51.7, 48.6, 20.4

^1H : 7.91 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.46 (1H, d, $J = 1.3$ Hz),
 7.64 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.39 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.34 (2H, d,
 $J = 8.6$ Hz), 7.32 (1H, m), 7.31 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 4.61 (2H,
 s), 4.20 (1H, m, $J = 6.8$ Hz), 1.37 (6H, d, $J = 6.8$ Hz)

化合物250 (MP: 111) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.7, 142.3, 137, 136.7, 132.9, 128.9, 128.6,
 127.7, 127.5, 126.6, 125.1, 112.9, 51.7, 48.5, 20.4

^1H : 7.93 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.72 (2H, d, $J = 8.2$ Hz),
 7.48 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.39 (2H, m), 7.37 (2H, m), 7.31
 (3H, m), 7.27 (1H, m), 4.62 (2H, s), 4.21 (1H, m, $J = 6.7$ Hz),
 1.37 (6H, d, $J = 6.7$ Hz)

化合物251 (MP: 132-133) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 152.2, 142, 138.4, 136.8, 133, 129, 128.6, 127.6,
 127.3, 126.1, 125, 113, 59.4, 51.3, 28.1

^1H : 7.91 (1H, d, $J = 1.4$ Hz), 7.65 (2H, d, $J = 8.5$ Hz),

7.46 (1H, d, $J = 1.4$ Hz), 7.38 (2H, t, $J = 7.1$ Hz), 7.35 (2H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.31 (1H, m, $J = 7.4$ Hz), 7.26 (2H, m), 7.25 (1H, m), 4.69 (2H, s), 1.52 (9H, s)

化合物252 (MP: 129-130) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 152.1, 141, 138.4, 136.9, 133, 131.5, 129, 128.8, 127.6, 126.2, 126.1, 113.2, 59.5, 51.3, 28.1

^1H : 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.57 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.43 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.38 (2H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.31 (1H, m), 7.31 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.24 (2H, d, $J = 8.0$ Hz), 4.68 (2H, s), 1.52 (9H, s)

化合物253 (MP: 147-148) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.9, 147.5, 147.3, 136.8, 129.1, 128.2, 127.5, 64.6, 47.3, 44.2

^1H : 8.95 (1H, s), 8.07 (2H, d, $J = 8.7$ Hz), 7.47 (2H, d, $J = 8.7$ Hz), 5.15 (2H, br), 4.36 (2H, br), 3.40 (2H, t, $J = 6.8$ Hz)

化合物254 (MP: 141-142) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.5, 138.3, 134.2, 133.9, 128.4, 127.1, 126.8, 122.9, 57.2, 30.8, 30.1, 25.4, 25.2, 10.5

^1H : 7.68 (2H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.62 (1H, s), 7.43 (2H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.30 (1H, t, $J = 7.4$ Hz), 3.91 (1H, m), 2.91 (3H, s), 2.46 (3H, s), 1.86 (2H, m), 1.81 (2H, m), 1.70 (1H, d br, $J = 13.0$ Hz), 1.57 (2H, m), 1.36 (2H, m), 1.12 (1H, m)

化合物255 (MP: 油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

¹³C: 159.9, 151.6, 142.1, 137, 136.7, 134.3, 129.7, 128.9, 127.7, 126.6, 117.5, 113.7, 113.2, 110, 55.3, 51.7, 48.6, 20.4

¹H: 7.92 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.47 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.2 Hz), 7.31 (4H, m), 7.28 (2H, m), 6.84 (1H, m), 4.61 (2H, s), 4.21 (1H, m, J = 6.8 Hz), 3.85 (3H, s), 1.37 (6H, d, J = 6.8 Hz)

化合物256 (MP:油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 159.8, 152.2, 141.8, 138.5, 136.8, 134.4, 129.6, 129, 127.6, 126.1, 117.4, 113.8, 113.3, 109.7, 59.4, 55.2, 51.2, 28.1

¹H: 7.91 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.45 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.30 (1H, m, J = 7.3 Hz), 7.26 (2H, m), 7.24 (2H, m), 7.19 (1H, m), 6.81 (1H, d d d, J = 1.2, 2.6, 8.0 Hz), 4.69 (2H, s), 3.82 (3H, s), 1.53 (9H, s)

化合物257 (MP: 138-139) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.3, 142.8, 141.8, 140.2, 137, 134.6, 133.7, 129.9, 129.2, 127.3, 127.3, 126.2, 125.4, 124.5, 123.9, 113.6, 57.6, 31.4, 30, 25.4, 25.2

¹H: 8.04 (1H, m), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (1H, m), 7.66 (1H, t, J = 1.7 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.54 (1H, t d, J = 1.5, 7.6 Hz), 7.49 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.48 (1H, m), 7.39 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 1.5, 2.2, 8.1 Hz), 3.98 (1H, m), 3.02 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.87 (2H, m), 1.71

(1H, d br, $J = 13.3$ Hz), 1.60 (2H, m), 1.39 (2H, t q, $J = 3.0$, 12.7 Hz), 1.14 (1H, t q, $J = 3.3$, 13.0 Hz)

化合物258 (MP: 115-118) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.2, 151.3, 142.5, 142, 141.6, 137, 133.5, 129.7, 129.1, 126.4, 124.1, 124, 119.6, 113.4 (2 sig.), 113.3, 63.5, 57.5, 31.4, 30, 25.4, 25.2, 14.9

^1H : 8.04 (1H, m, $J = 1.7$ Hz), 7.94 (1H, d, $J = 1.4$ Hz), 7.78 (1H, t d, $J = 1.7$, 7.5 Hz), 7.55 (1H, d, $J = 1.4$ Hz), 7.52 (1H, d t, $J = 1.5$, 7.9 Hz), 7.47 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.36 (1H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.24 (1H, d d d, $J = 1.0$, 1.7, 7.7 Hz), 7.19 (1H, d d, $J = 1.7$, 2.5 Hz), 6.91 (1H, d d d, $J = 1.0$, 2.5, 8.2 Hz), 4.11 (2H, q, $J = 7.0$ Hz), 3.97 (1H, m), 3.01 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.86 (2H, m), 1.71 (1H, d br, $J = 12.5$ Hz), 1.59 (2H, qd, $J = 3.5$, 12.5 Hz), 1.46 (3H, t, $J = 7.0$ Hz), 1.39 (2H, t q, $J = 3.0$, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, $J = 3.5$, 13.0 Hz)

化合物259 (MP: 137-139) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 158.3 (d, $J = 248.0$ Hz), 151.3, 141.7, 137.0, 135.0 (d, $J = 1.3$ Hz), 133.5, 130.5 (d, $J = 3.5$ Hz), 130.4 (m, $J = 14.0$ Hz), 129.3 (d, $J = 3.3$ Hz), 128.9, 128.7 (d, $J = 8.5$ Hz), 128.0, 125.6 (d, $J = 2.5$ Hz), 124.9, 117.4 (d, $J = 25.0$ Hz), 113.6, 57.5, 31.4, 30, 25.4, 25.2

^1H : 7.97 (1H, s br), 7.93 (1H, d, $J = 1.1$ Hz), 7.82 (1H, t d, $J = 1.7$, 7.2 Hz), 7.56 (1H, d, $J = 1.1$ Hz), 7.52-7.43 (3H, m), 7.29 (1H, m), 7.11 (1H, t, $J = 9.5$ Hz), 3.96 (1H, m), 3.0

(3H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.71 (1H, d br, $J = 13.0$ Hz), 1.59 (2H, d q, $J = 3.5, 12.5$ Hz), 1.39 (2H, t q, $J = 3.0, 13.0$ Hz), 1.13 (1H, t q, $J = 3.5, 13.0$ Hz)

化合物260 (MP: 190-191) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 156.8, 146.3, 141.3, 136.7, 126.2, 124.4, 115.4, 111.6, 80.6, 79.3, 60.8, 22.5

^1H : 9.48 (1H, s), 8.09 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.80 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.64 (2H, m d, $J = 8.5$ Hz), 6.76 (2H, m d, $J = 8.5$ Hz), 5.14 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.49 (6H, s)

化合物261 (MP: 197-199) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 156.7, 151, 140.9, 137.3, 126.1, 124.4, 115.4, 112.5, 56.8, 31.3, 29.1, 25.2, 24.9

^1H : 9.48 (1H, s), 8.05 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.77 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.64 (2H, m, $J = 8.3$ Hz), 6.77 (2H, m, $J = 8.3$ Hz), 3.80 (1H, m), 2.91 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.59 (1H, m), 1.55 (2H, m), 1.28 (2H, m), 1.10 (1H, m)

化合物262 (MP: 170 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 157.9, 149, 137.3, 135.3, 130.2, 129.5, 116.3, 116, 115.9, 112.3, 58.7, 31.5, 28.2, 24

^1H : 9.70 (1H, s), 9.24 (1H, s), 8.32 (1H, s), 7.29 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.27 (1H, m), 7.24 (1H, m), 6.83 (1H, m, $J = 2.2, 6.7$ Hz), 4.39 (1H, m), 2.97 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.70 (4H, m), 1.53 (2H, m)

化合物263 (MP: 89-91) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

¹³C: 146.8, 138.7, 134, 133.1, 128.4, 127.2, 126.9, 122.8, 81.2, 80.7, 61, 23, 10.6

¹H: 7.66 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, s), 7.43 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.31 (1H, t, J = 7.4 Hz), 4.93 (2H, s), 3.90 (2H, s), 2.49 (3H, s), 1.61 (6H, s)

化合物264 (MP: 118-119) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 152.1, 138.7, 135.3, 134.2, 134.1, 129.1, 128.4, 128.2, 127.7, 127.2, 126.9, 123.2, 53.9, 36, 10.6

¹H: 7.69 (1H, s), 7.67 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.43 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.31 (1H, t, J = 7.4 Hz), 7.40-7.27 (5H, m), 4.66 (2H, s), 3.01 (3H, s), 2.49 (3H, s)

化合物265 (MP: 178-180 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 157.9, 149.1, 137.3, 136.8, 135.8, 130.2, 129.5, 128.5, 127.2, 126.8, 116.3, 116.1, 115.4, 112.4, 51.4, 47.1, 20.1

¹H: 9.73 (1H, s), 9.18 (1H, s), 8.29 (1H, s), 7.36-7.28 (5H, m), 7.27 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.21 (1H, m), 7.18 (1H, m), 6.82 (1H, m, J = 2.5, 8.1 Hz), 4.65 (2H, s), 4.16 (1H, m), 1.28 (6H, d, J = 6.7 Hz)

化合物266 (MP: 油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.7, 145.2, 133.2, 129.1, 125.1, 119.7, 113.5, 59.3, 28.8, 24.3

¹H: 8.09 (1H, m d, J = 8.3 Hz), 7.98 (1H, m d, J = 8.3 Hz), 7.59 (1H, m, J = 7.7 Hz), 7.45 (1H, m, J = 7.7 Hz), 4.78

(1H, m), 3.17 (3H, s), 2.07 (2H, m), 1.75 (4H, m), 1.63 (2H, m)

化合物267 (MP: 142-143) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 146.6, 141.2, 136.7, 133.2, 131.4, 128.9, 126.4, 112.8, 96.5, 75.9, 53.4, 25.6, 25.4, 23.7, 9.8

¹H: 8.03 (1H, br), 7.73 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.59 (1H, br), 7.37 (2H, d, J = 8.5 Hz), 4.10 (1H, m), 3.81 (1H, d d, J = 5.3, 9.0 Hz), 3.43 (1H, t, J = 9.2 Hz), 1.74 (3H, s), 1.72 (2H, m), 1.66 (3H, s), 1.0 (3H, t, J = 7.5 Hz)

化合物268 (MP: 117-118) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 144.9, 136.5, 133.6, 131.7, 128.5, 127.8, 126.4, 110.8, 95.7, 63.1, 47.7, 23.9

¹H: 7.96 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.78 (1H, s), 7.45 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.35 (1H, t, J = 7.5 Hz), 4.07 (2H, t, J = 6.2 Hz), 3.58 (2H, t, J = 6.2 Hz), 1.74 (6H, s)

化合物269 (MP: 92-93) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 141.6, 135.3, 133.9, 129.4, 128.8, 128.1, 127.5, 111.0, 80.6, 61.3, 29.7, 22.7, 22.5

¹H: 7.85 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.40 (2H, d, J = 8.8 Hz), 4.81 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.65 (6H, s)

化合物270 (MP: 油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 146.7, 142.2, 136.6, 132.9, 128.7, 127.6, 125.2, 112.5, 96.4, 75.9, 53.4, 25.6, 25.4, 23.7, 9.8

¹H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, d, J = 8.5 Hz),

7.61 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.41 (2H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.30 (1H, t, $J = 7.4$ Hz), 4.11 (1H, m), 3.81 (1H, d d, $J = 5.2, 9.0$ Hz), 3.44 (1H, t, $J = 9.5$ Hz), 1.75 (3H, s), 1.73 (3H, s), 1.72 (2H, m), 1.0 (3H, t, $J = 7.7$ Hz)

化合物271 (MP: 113-114) ◦ NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 156, 151.7, 137.4, 136, 128, 127.6, 121.7, 120.9, 117.2, 110.6, 57.5, 55.2, 31.1, 30.1, 25.4, 25.2

¹H: 8.23 (1H, d d, $J = 1.8, 7.7$ Hz), 7.94 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.82 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.28 (1H, d t, $J = 2.0, 7.6$ Hz), 7.07 (1H, $J = 1.1, 7.6$ Hz), 6.97 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 3.95 (3H, s), 3.95 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.69 (1H, d br, $J = 12.3$ Hz), 1.59 (2H, d q, $J = 3.5, 12.5$ Hz), 1.37 (2H, t q, $J = 3.0, 13.0$ Hz), 1.13 (1H, t q, $J = 3.3, 13.1$ Hz)

化合物272 (MP: 178-181) ◦ NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.0, 150.5 (d d, $J = 12.7, 247$ Hz), 149.7 (d d, $J = 13.0, 248.0$ Hz), 140.3, 137, 130.3 (d d, $J = 3.7, 6.6$ Hz), 121.0 (d d, $J = 3.5, 6.3$ Hz), 117.5 (d, $J = 17.5$ Hz), 114.1 (d, $J = 18.5$ Hz), 113.5 (d, $J = 1.0$ Hz), 57.6, 31.3, 29.9, 25.4, 25.2

¹H: 7.88 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.61 (1H, d d d, $J = 2.2, 7.7, 11.6$ Hz), 7.49 (1H, m), 7.45 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.17 (1H, d t, $J = 8.4, 10.5$ Hz), 3.93 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d br), 1.58 (2H, d q, $J = 3.5, 12.3$ Hz), 1.37 (2H, t q, 3.0, 13.0 Hz), 1.12 (1H, t q, $J = 3.5, 13.0$ Hz)

化合物273 (MP: 142-143) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 162.3 (d, J = 246 Hz), 151.3, 141.3, 136.9, 129.2 (d, J = 3.2 Hz), 126.8 (d, J = 8.0 Hz), 115.6 (d, J = 22.0 Hz), 112.9, 57.5, 31.3, 30, 25.4, 25.2

¹H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.76 (2H, m, J = 5.4, 8.9 Hz), 7.74 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.09 (2H, m, J = 8.8 Hz), 3.95 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.2 Hz), 1.37 (2H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

化合物274 (MP: 156-158) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151, 140, 137.1, 133.2, 132.8, 131.1, 130.6, 126.9, 124.3, 114, 57.6, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

¹H: 7.91 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.90 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.61 (1H, d d, J = 2.0, 8.4 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.45 (1H, d, J = 8.4 Hz), 3.94 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.71 (1H, m), 1.58 (2H, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

化合物275 (MP: 160-162) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.9, 148.6, 140, 137.3, 134.9, 130.9, 129.7, 122, 119.9, 114.6, 57.6, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

¹H: 8.61 (1H, t, J = 2 Hz), 8.14 (2H, m), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.57 (1H, t, J = 8.0 Hz), 3.96 (1H, m, J = 12.0 Hz), 3.02 (3H, s), 1.88 (4H, m), 1.72 (1H, m), 1.60 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.39 (2H, t q, J =

3.0, 13.0 Hz), 1.14 (1H, t q, $J = 3.5, 13.0$ Hz)

化合物276 (MP: 130-131) ° NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.2, 150.5 (t, $J = 2.7$ Hz), 141.1, 137, 130.5, 126.5, 119.7, 115.9 (t, $J = 259.5$ Hz), 113.2, 57.6, 31.3, 30, 25.4, 25.2

^1H : 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.79 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.47 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.15 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 6.54 (1H, t, $J = 7.4$ Hz), 3.95 (1H, m, $J = 11.0$ Hz), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, dbr, $J = 14.0$ Hz), 1.58 (2H, d q, $J = 3.6, 12.2$ Hz), 1.37 (2H, $J = 3.2, 13.0$ Hz), 1.13 (1H, $J = 3.5, 13.0$ Hz)

化合物277 (MP: 168-169) ° NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.2, 141.1, 137, 133.1, 131.6, 128.8, 126.4, 113.4, 57.6, 31.3, 30, 25.4, 25.2

^1H : 7.90 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.73 (2H, d, $J = 8.7$ Hz), 7.49 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.37 (2H, $J = 8.7$ Hz), 3.95 (1H, m, $J = 11.8$ Hz), 2.99 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d, $J = 13.5$ Hz), 1.58 (2H, d q, $J = 3.5, 12.3$ Hz), 1.38 (2H, t q, $J = 3.0, 13.0$ Hz), 1.13 (1H, t q, $J = 3.5, 13$ Hz)

化合物278 (MP: 160) ° NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.5, 142.3, 136.9, 132.8, 128.7, 127.6, 125.1, 113.1, 67, 54.4, 31.8, 29.5

^1H : 7.94 (1H, s), 7.80 (2H, d, $J = 7.6$ Hz), 7.51 (1H, s), 7.41 (2H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.30 (1H, t, $J = 7.3$ Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d, $J = 4.0, 11.5$ Hz), 3.50 (2H, t, $J = 11.5$ Hz),

3.04 (3H, s), 1.94 (2H, d q, $J = 4.5, 12.3$ Hz), 1.77 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物279 (MP: 157-159) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{25}C : 152.2, 145.6, 140.7, 133.3, 128.6, 127.1, 125, 112.4, 57, 30.7, 30.1, 25.4, 25.2, 14

^1H : 7.76 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.38 (2H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.26 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.21 (1H, s), 3.90 (1H, m br), 2.88 (3H, s), 2.52 (3H, s), 1.81 (4H, m), 1.68 (1H, d br, $J = 13.0$ Hz), 1.55 (2H, d q, $J = 3.3, 12.2$ Hz), 1.35 (2H, q br, $J = 12.5$ Hz), 1.11 (1H, t q, $J = 3.0, 13.0$ Hz)

化合物280 (MP: 137) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 143.9, 135.7, 133.7, 133.7, 130.1, 128.7, 127.7, 111.2, 80.9, 80.6, 61.3, 22.9

^1H : 7.90 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.73 (1H, s), 7.41 (2H, s, $J = 8.6$ Hz), 4.88 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.62 (6H, s)

化合物281 (MP: 132-134) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.7, 149.1, 148.5, 142, 136.7, 126.1, 117.4, 112.4, 111.2, 108.4, 59.3, 55.9, 55.9, 31.2, 28.8, 24.3

^1H : 7.91 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.44 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.40 (1H, d, $J = 2.0$ Hz), 7.30 (1H, d d, $J = 2.0, 8.3$ Hz), 6.90 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 4.44 (1H, m, $J = 8.2$ Hz), 3.96 (3H, s), 3.91 (3H, s), 2.99 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.73 (4H, m), 1.62 (2H, m)

化合物282 (MP: 189-191) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.5, 142.2, 138.1, 137, 132.9, 129.1, 128.7, 128.3, 127.6, 127.2, 125.1, 113.1, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

^1H : 7.92 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.80 (2H, m, $J = 8.0$ Hz), 7.50 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.41 (2H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.37-7.25 (6H, m), 4.03 (1H, m), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br, $J = 11.2$ Hz), 1.90 (2H, q br, $J = 12.0$ Hz), 1.79 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物283 (MP: 128) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.3, 149.8, 147.2, 130.1, 129.9, 128.7, 126.7, 57.6, 30.2 (2 sig.), 25.5, 25.3

^1H : 8.82 (1H, s), 8.15 (2H, m), 7.48 (3H, m), 4.32 (1H, m br), 3.14 (3H, s), 1.93 (4H, m), 1.71 (1H, d br, $J = 13.3$ Hz), 1.59 (2H, m), 1.40 (2H, m), 1.15 (1H, t q, $J = 3.5, 13.0$ Hz)

化合物284 (MP: 151-153) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 160.3, 153.3, 151, 130.3, 129.6, 128.6, 126.5, 58.7, 30.8, 29.5, 25.5, 25.2, 13.8

^1H : 8.10 (2H, m, $J = 7.5$ Hz), 7.45 (3H, m), 4.21+3.80 (1H, m), 3.03-2.99 (3H, m), 2.69 (3H, s), 1.88 (4H, m), 1.72 (1H, m), 1.58 (2H, m), 1.54 (2H, m), 1.12 (1H, m)

化合物285 (MP: 135-138) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.9, 146.2, 144.9, 130.1, 129.8, 128.7, 126.7, 82, 79.3, 62.2, 22.8

^1H : 8.94 (1H, s), 8.12 (2H, m), 7.47 (3H, m), 5.57 (2H,

s), 3.86 (2H, s), 1.63 (6H, s)

化合物286 (MP: 125-127) ◦ NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 160, 157.7, 146.4, 129.9, 129.9, 128.6, 126.6, 82.2, 79.6, 61.7, 22.8, 15.1

¹H: 8.08 (2H, m), 7.45 (3H, m), 5.40 (2H, s), 3.85 (2H, s), 2.80 (3H, s), 1.62 (6H, s)

化合物287 (MP: 222-224) ◦ NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 167.8, 150.7, 140.5, 140.2, 140, 137.8, 135, 134.2, 129.6, 129.3, 129, 126.7, 125.8, 125.6, 124.1, 123.1, 114.7, 57.5, 37.9, 35.9, 33.8, 29.2

¹H: 8.21 (1H, m, J = 1.6 Hz), 8.17 (1H, m, J = 1.6 Hz), 8.15 (1H, s br), 8.14 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d d, J = 1.6, 7.8 Hz), 7.88 (2H, m), 7.62 (1H, m), 7.57 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.51 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.48 (1H, s br), 2.94 (3H, s), 2.16 (6H, s), 2.11 (3H, s), 1.66 (6H, s)

化合物288 (MP: 138-139) ◦ NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 159.2, 151.2, 141.9, 137.2, 137, 134.6, 129.7, 128.5, 127.9, 127.5, 117.8, 114.3, 113.3, 111.2, 69.9, 58.4, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (1H, m), 7.47 (2H, m), 7.46 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (2H, m), 7.38 (1H, m), 7.34 (1H, m), 7.31 (1H, t, J = 7.9 Hz), 6.92 (1H, d d d, J = 1.0, 2.5, 8.2 Hz), 5.14 (2H, s), 2.99 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.74 (6H, s)

化合物289 (MP: 165-169 (分解))。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 150.9, 148.4, 146.7, 139.1, 137.6, 132.4, 129.1, 123.6, 113.8, 58.5, 38.5, 36.2, 34.1, 29.6

¹H: 9.0 (1H, d, J = 1.5 Hz), 8.52 (1H, d d, J = 1.3, 4.7 Hz), 8.11 (1H, d t, J = 1.8, 7.8 Hz), 7.94 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.33 (1H, d d, J = 4.9, 7.7 Hz), 2.99 (3H, s), 2.19 (9H, s), 1.73 (6H, s)

化合物290 (MP: 149)。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 151.2, 142, 141.6, 141, 137.3, 133.6, 129.1, 128.7, 127.3, 127.2, 126.3, 124, 123.9, 113.2, 58.4, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 8.05 (1H, t br, J = 1.8 Hz), 7.95 (1H, d, J = .13 Hz), 7.78 (1H, d t, J = 1.5, 7.5 Hz), 7.67 (2H, m, J = 8.5 Hz), 7.53 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.53 (1H, m), 7.48 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.46 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.37 (1H, m, J = 7.5 Hz), 3.0 (3H, s), 2.21 (9H, s), 1.74 (6H, s)

化合物291 (MP: 208-210)。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 151.1, 150.2, 148.2, 141.5, 138.6, 137.4, 134.1, 129.4, 126, 125.7, 123.8, 121.7, 113.5, 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 8.67 (2H, m, J = 5.0 Hz), 8.11 (1H, m, J = 2.0 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.84 (1H, d t, J = 1.7, 7.5 Hz), 7.58 (2H, m), 7.55 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.55 (1H, m), 7.51 (1H, t, J = 7.6 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

化合物292 (MP: 75-77) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 146.4, 141.3, 136.9, 136.3, 133.2, 131.3, 129, 128.9, 128.8, 126.4, 126.2, 112.5, 97, 76.3, 55.5, 25.4, 24

¹H: 8.05 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.70 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.46-7.38 (5H, m), 7.35 (2H, d, J = 8.5 Hz), 5.21 (1H, d d, J = 5.5, 9.8 Hz), 4.10 (1H, d d, J = 5.5, 9.3 Hz), 3.68 (1H, t, J = 9.5 Hz), 1.88 (3H, s), 1.87 (3H, s)

化合物293 (MP: 164-165) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 161.4, 146.5, 140.5, 134.4, 120.3, 117.9, 94.7, 82.6, 79.6, 62.1, 56, 23

¹H: 7.92 (1H, d d, J = 0.5, 9.0 Hz), 7.58 (1H, d, J = 2.5 Hz), 7.08 (1H, d d, J = 2.5, 9.0 Hz), 5.53 (1H, s), 3.94 (3H, s), 3.90 (2H, s), 1.69 (6H, s)

化合物294 (MP: 190-193 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 156.9, 151, 140.3, 137.2, 126.2, 123.8, 115.4, 112.7, 58.4, 31.2, 28.2, 24

¹H: 9.53 (1H, s), 8.18 (1H, s), 7.81 (1H, s), 7.65 (2H, d, J = 8.7 Hz), 6.79 (2H, d, J = 8.7 Hz), 4.36 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.86 (2H, m), 1.67 (4H, m), 1.53 (2H, m)

化合物295 (MP: 91-93) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 144.0, 136.6, 133.6, 131.6, 128.5, 127.9, 126.5, 110.9, 81.0, 80.6, 61.3, 22.9

¹H: 7.96 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.74 (1H, s), 7.45 (2H, m, J = 7.8 Hz), 7.35 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.88 (2H, s), 3.91 (2H,

s), 1.62 (6H, s)

化合物296 (MP: 106-110) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 156.9, 150.9, 141.6, 137.3, 134, 130, 117.1, 115.1, 113.5, 112.6, 58.5, 38.5, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 7.95 (1H, s), 7.46 (1H, m), 7.42 (1H, s), 7.24 (1H, m), 7.23 (1H, m), 6.91 (1H, m), 2.96 (3H, s), 2.18 (9H, s), 1.72 (6H, s)

化合物297 (MP: 119-121) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 149.8, 144.6, 132.6, 129.3, 125.3, 119.6, 113.3, 67.9, 57.6, 56.1, 34.2, 27.2

¹H: 8.18 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.90 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.68 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.52 (1H, t, J = 7.6 Hz), 4.64 (1H, s br), 4.03 (1H, s br), 3.40 (1H, s br), 3.03 (3H, s), 1.90 (2H, s br), 1.82 (2H, s br), 1.75 (2H, s br), 1.26 (2H, s br)

化合物298 (MP: 94-95) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 146.6, 142.4, 136.9, 136.3, 132.8, 129, 128.9, 128.7, 127.6, 126.2, 125.2, 112.3, 96.9, 76.3, 55.5, 25.4, 24

¹H: 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (2H, m, J = 8.3 Hz), 7.58 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (5H, m), 7.39 (2H, m, J = 7.8 Hz), 7.29 (1H, m, J = 7.4 Hz), 5.21 (1H, d d, J = 5.5, 9.8 Hz), 4.11 (1H, d d, J = 5.5, 9.3 Hz), 3.69 (1H, t, J = 9.5 Hz), 1.89 (3H, s), 1.87 (3H, s)

化合物299 (MP: 140-142) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 146.7, 141.2, 136.7, 133.3, 131.4, 128.9, 126.4,

112.8, 96.4, 63.6, 48.3, 24.1

¹H: 8.06 (1H, br), 7.73 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.61 (1H, br), 7.38 (2H, m, J = 8.6 Hz), 4.12 (2H, t, J = 6.0 Hz), 3.85 (2H, t, J = 6.0 Hz), 1.74 (6H, s)

化合物300 (MP: 149-150) ◦ NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 149.1, 136.3, 134.3, 131.9, 128.5, 127.7, 126.4, 111.6, 57, 30.6, 29.8, 25.3, 25.2

¹H: 7.98 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.72 (1H, br), 7.45 (2H, m, J = 7.6 Hz), 7.34 (1H, m, J = 7.5 Hz), 4.24 (1H, m br), 2.88 (3H, br), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, m), 1.56 (2H, m), 1.40 (2H, m), 1.13 (1H, m)

化合物301 (MP: 136-137) ◦ NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 144.3, 138.8, 135.2, 133.8, 130.5, 128.6, 128.1, 96.1, 81.1, 80.7, 61.3, 22.9

¹H: 7.91 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.82 (1H, s), 7.41 (2H, d, J = 8.5 Hz), 4.84 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.63 (6H, s)

化合物302 (MP: 108) ◦ NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 149.4, 143.0, 136.4, 132.6, 128.7, 127.8, 125.2, 112.2, 80.7, 71.4, 57.8, 24.9, 9.8

¹H: 7.98 (1H, br), 7.81 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.54 (1H, br), 7.42 (2H, t, J = 7.4 Hz), 7.31 (1H, t, J = 7.3 Hz), 5.13 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.0 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.32 (2H, m), 3.73 (1H, m), 1.91 (1H, m), 1.64 (1H, m), 0.98 (3H, t, J = 7.5 Hz)

化合物303 (MP: 80-81) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.6 (d d, J = 13.0, 247.5 Hz), 149.9 (d d, J = 13.0, 249.0 Hz), 149.1, 141.1, 136.5, 129.9 (d d, J = 3.8, 7.0 Hz), 121.2 (d d, J = 3.5, 6.2 Hz), 117.6 (d, J = 17.5 Hz), 114.3 (d, J = 18.6 Hz), 112.5, 80.7, 71.5, 57.8, 24.9, 9.8

¹H: 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.62 (1H, d d d, J = 2.0, 7.5, 11.5 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, m), 7.19 (1H, d t, J = 8.4, 10.2 Hz), 5.12 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.99 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.33 (2H, m), 3.74 (1H, m), 1.90 (1H, m), 1.64 (1H, m), 0.98 (3H, t, J = 7.4 Hz)

化合物304 (MP: 100-101) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 159.9, 149.3, 142.8, 136.4, 134, 129.7, 117.6, 113.9, 112.4, 110.3, 80.7, 71.4, 57.8, 55.3, 24.9, 9.8

¹H: 7.98 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.52 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.39 (1H, m), 7.36 (1H, d t, J = 1.5, 7.7 Hz), 7.31 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.88 (1H, d d d, J = 1.4, 2.6, 8.0 Hz), 5.13 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.0 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.32 (2H, m), 3.88 (3H, s), 3.73 (1H, m), 1.90 (1H, m), 1.63 (1H, m), 0.98 (3H, t, J = 7.5 Hz)

化合物305 (MP: 131-132) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.1, 148.5, 148.3, 141.6, 138.3, 137.3, 136.5, 134.5, 134, 129.4, 126.2, 124.8, 123.9, 123.5, 113.4, 58.4, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 8.91 (1H, d, J = 2.5 Hz), 8.61 (1H, d d, J = 1.7, 4.8

Hz), 8.05 (1H, m), 7.95 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.95 (1H, m), 7.82 (1H, m), 7.55 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.51 (1H, m), 7.50 (1H, m), 7.38 (1H, d d d, $J = 0.8, 4.8, 7.9$ Hz), 3.0 (3H, s), 2.10 (9H, s), 1.73 (6H, s)

化合物306 (MP: 195-196) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 157.5, 155, 151, 141.2, 137.4, 134.7, 134.4, 134.2, 129.7, 125.9, 125.6, 123.7, 113.6, 58.5, 38.5, 36.2, 34.1, 29.6

^1H : 9.22 (1H, s), 9.01 (2H, s), 8.05 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.85 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 7.56 (1H, s), 7.54 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.48 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 3.0 (3H, s), 2.19 (9H, s), 1.73 (6H, s)

化合物307 (MP: 150-151) ◦ NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 157.6, 150.8, 140.7, 137.5, 134.6, 129.6, 115.7, 114.3, 114.1, 111.7, 56.8, 31.3, 29.1, 25.2, 24.9

^1H : 9.43 (1H, s), 8.09 (1H, d, $J = 1.0$ Hz), 7.90 (1H, d, $J = 1.0$ Hz), 7.26 (2H, m), 7.16 (1H, t, $J = 8.0$ Hz), 6.65 (1H, d d d, $J = 1.0, 2.2, 8.0$ Hz), 3.80 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.59 (1H, m), 1.55 (2H, m), 1.29 (2H, m, $J = 11.5$ Hz), 1.10 (1H, q, $J = 13.0$ Hz)

化合物308 (MP: 139-140) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.6 (d d, $J = 13.0, 248.0$ Hz), 149.9 (d d, $J = 13.0, 249.0$ Hz), 148.1, 141.1, 136.7, 136.1, 129.8 (d d, $J = 3.9, 6.5$ Hz), 129.1, 128.9, 126.1, 121.2 (d d, $J = 3.5, 6.2$ Hz), 117.6 (d, $J = 17.8$ Hz), 114.3 (d, $J = 18.5$ Hz), 112.4, 80.4,

80.1, 53.0

¹H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.62 (1H, d d d, J = 2.0, 7.6, 11.5 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.45 (1H, m), 7.42-7.37 (5H, m), 7.18 (1H, d t, J = 8.3, 10.0 Hz), 5.44 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.26 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.18 (1H, d d, J = 6.1, 8.8 Hz), 4.16 (1H, d d, J = 6.1, 10.0 Hz), 3.68 (1H, d d, J = 9.0, 10.0 Hz)

化合物309 (MP: 155-157) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 148.4, 142.9, 136.6, 136.2, 132.5, 129.0, 128.9, 128.7, 127.8, 126.1, 125.2, 112.1, 80.4, 80.0, 53.0

¹H: 8.08 (1H, br), 7.80 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.60 (1H, br), 7.42 (7H, m), 7.31 (1H, t, J = 7.5 Hz), 5.44 (1H, d, J = 4.8 Hz), 5.27 (1H, d, J = 4.8 Hz), 5.16 (1H, d d, J = 6.3, 8.8 Hz), 4.16 (1H, d d, J = 6.3, 10.1 Hz), 3.68 (1H, t, J = 9.6 Hz)

化合物310 (MP: 126-127) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 148.9, 142.9, 136.4, 132.6, 128.7, 127.8, 125.2, 112.1, 80.4, 73.4, 52.9, 17

¹H: 7.99 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, m d, J = 8.4 Hz), 7.54 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42 (2H, m t, J = 7.8 Hz), 7.31 (1H, m t, J = 7.5 Hz), 5.14 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.04 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.39 (1H, m), 4.36 (1H, m), 3.63 (1H, d d, J = 6.9, 8.4 Hz), 1.37 (3H, d, J = 6.0 Hz)

化合物311 (MP: 127) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.6 (d d, J = 12.5, 247.5 Hz), 149.9 (d d, J =

13.0, 248.5 Hz), 148.6, 141.1, 136.4, 129.9 (d d, $J = 3.5, 7.0$ Hz), 121.2 (d d, $J = 3.5, 6.3$ Hz), 117.6 (d, $J = 17.5$ Hz), 114.3 (d, $J = 18.6$ Hz), 112.5, 80.4, 73.4, 53, 17.0

^1H : 7.96 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.62 (1H, d d d, $J = 2.1, 7.7, 11.5$ Hz), 7.51 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.49 (1H, m), 7.19 (1H, d t, $J = 8.3, 10.1$ Hz), 5.13 (1H, d, $J = 4.5$ Hz), 5.04 (1H, d, $J = 4.5$ Hz), 4.39 (1H, m), 4.36 (1H, m), 3.65 (1H, m), 1.37 (3H, d, $J = 6.0$ Hz)

化合物312 (MP: 118) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.9, 142.2, 136.5, 133, 128.7, 127.4, 125.1, 113, 58.9, 39.4, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

^1H : 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.81 (2H, m d, $J = 8.3$ Hz), 7.48 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.41 (2H, m t, $J = 7.9$ Hz), 7.30 (1H, m t, $J = 7.5$ Hz), 3.77 (1H, t t, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 3.43 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 1.82 (4H, m), 1.66 (3H, m), 1.30 (2H, m), 1.25 (3H, t, $J = 7.1$ Hz), 1.13 (1H, m)

化合物313 (MP: 121-122) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.9, 149.1, 148.5, 142, 136.2, 126.2, 117.3, 112.3, 111.2, 108.4, 58.9, 55.9, 55.9, 39.4, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

^1H : 7.86 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.41 (1H, s), 7.41 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 6.91 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.30 (1H, d d, $J = 2.0, 8.4$ Hz), 3.96 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.77 (1H, t t, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 3.43 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 1.84 (4H, m), 1.68 (3H, m),

1.29 (2H, m), 1.25 (3H, t, $J = 7.1$ Hz), 1.12 (1H, m)

化合物314 (MP: 208) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.6 (d, $J = 243.0$ Hz), 150.6, 146.1 (d, $J = 11.0$ Hz), 139.5 (d, $J = 2.5$ Hz), 137.2, 126.8 (d, $J = 7.0$ Hz), 120.8 (d, $J = 3.4$ Hz), 114.1 (d, $J = 2.0$ Hz), 113.7, 112.1 (d, $J = 19.5$ Hz), 56.8, 56, 31, 28.9, 25, 24.6

^1H : 8.04 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.90 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.64 (1H, d d, $J = 2.0, 8.3$ Hz), 7.61 (1H, m), 7.18 (1H, t, $J = 9.3$ Hz), 3.86 (3H, s), 3.80 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.62 (1H, m), 1.59 (2H, m), 1.30 (2H, m), 1.12 (1H, m)

化合物315 (MP: 162-163) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.6 (d, $J = 242.5$ Hz), 150.7, 146.4 (d, $J = 10.5$ Hz), 138.5, 137.5, 125.7 (d, $J = 7.6$ Hz), 121.2 (d, $J = 3.0$ Hz), 114.3, 114.1 (d, $J = 2.0$ Hz), 112.4 (d, $J = 19.5$ Hz), 58.5, 56.1, 31.3, 28.2, 24

^1H : 8.31 (1H, s br), 8.03 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.69 (1H, d d, $J = 2.0, 12.5$ Hz), 7.65 (1H, m), 7.21 (1H, t, $J = 8.8$ Hz), 4.37 (1H, m), 3.86 (3H, s), 2.93 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.68 (4H, m), 1.53 (2H, m)

化合物316 (MP: 205) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.6 (d, $J = 243.5$ Hz), 147.2 (d, $J = 10.5$ Hz), 144.6, 136.8, 136, 122.9, 121.8 (d, $J = 3.3$ Hz), 114.3, 114.3, 112.9 (d, $J = 20.0$ Hz), 80.7, 79.3, 61.3, 56.1, 22.3

^1H : 9.05 (1H, s br), 8.31 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.82 (1H,

d d, $J = 2.2, 12.7$ Hz), 7.74 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.28 (1H, t, $J = 8.7$ Hz), 5.21 (2H, s), 3.87 (3H, s), 3.86 (2H, s), 1.51 (6H, s)

化合物317 (MP: 173-174) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.3, 150, 142.3, 141.5, 137.2, 133.4, 129 (2 sig.), 127.7, 125.4, 123, 122.8, 113.1, 112.7, 58.3, 40.6, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

^1H : 8.01 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.69 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 7.59 (2H, m, $J = 8.8$ Hz), 7.51 (1H, s), 7.50 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.43 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 6.82 (2H, m, $J = 8.8$ Hz), 3.01 (6H, s), 3.0 (3H, s), 2.21 (9H, s), 1.74 (6H, s)

化合物318 (MP: 181-182) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 168.1, 164.5, 157.6, 151.1, 141.7, 137.2, 133.7, 133.4, 128.7, 128, 125.5, 124.4, 116.1, 113.3, 58.4, 54.8, 54.2, 38.5, 36.2, 34.1, 29.6

^1H : 8.31 (1H, s), 7.93 (1H, s), 7.91 (1H, s), 7.78 (1H, d, $J = 7.6$ Hz), 7.50 (1H, s), 7.46 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.40 (1H, d, $J = 7.5$ Hz), 4.04 (3H, s), 4.03 (3H, s), 2.99 (3H, s), 2.19 (9H, s), 1.73 (6H, s)

化合物319 (MP: 109-111) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.9 (d, $J = 246.0$ Hz), 151.2, 147.8 (d, $J = 11.0$ Hz), 141.3, 136.8, 129.6 (d, $J = 3.5$ Hz), 117.3 (d, $J = 7.0$ Hz), 116.1 (d, $J = 19.0$ Hz), 113.1, 110.3 (d, $J = 1.5$ Hz), 57.6, 56.2, 31.3, 30, 25.4, 25.2

^1H : 7.89 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.50 (1H, d d, $J = 2.0, 8.2$ Hz), 7.45 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.24 (1H, d d d, $J = 2.0, 4.3, 8.3$ Hz), 7.09 (1H, d d, $J = 8.3, 11.0$ Hz), 3.96 (3H, s), 3.95 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d br, $J = 13.0$ Hz), 1.58 (2H, d q, $J = 4.5, 13.5$ Hz), 1.37 (2H, t q, $J = 3.0, 13.0$ Hz), 1.13 (1H, t q, $J = 3.4, 13.0$ Hz)

化合物320 (MP: 170-171) • NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 163.1 (d, $J = 240.0$ Hz), 151.1, 145.9 (d, $J = 15.0$ Hz), 141.5, 139.9 (d, $J = 8.0$ Hz), 137.4, 137.2, 134.7 (d, $J = 4.5$ Hz), 134.1, 129.5, 126.1, 124.8, 123.8, 113.5, 109.4 (d, $J = 37.5$ Hz), , 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

^1H : 8.49 (1H, m, $J = 2.5$ Hz), 8.05 (1H, m, $J = 2.5, 7.5$ Hz), 8.02 (1H, m, $J = 1.6$ Hz), 7.95 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.81 (1H, d t, $J = 1.5, 7.5$ Hz), 7.55 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.51 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.46 (1H, d t, $J = 1.5, 7.8$ Hz), 7.03 (1H, m, $J = 3.0, 8.5$ Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.74 (6H, s)

化合物321 (MP: 100-103) • NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.9 (d, $J = 246.0$ Hz), 151.5, 147.8 (d, $J = 11.0$ Hz), 141.3, 136.8, 129.5 (d, $J = 3.5$ Hz), 117.3 (d, $J = 7.0$ Hz), 116.2 (d, $J = 19.0$ Hz), 113.2, 110.3, 59.3, 56.2, 31.2, 28.9, 24.3

^1H : 7.94 (1H, d, $J = 1.0$ Hz), 7.50 (1H, d d, $J = 2.0, 7.50$ Hz), 7.47 (1H, d, $J = 1.0$ Hz), 7.24 (1H, d d d, $J = 2.0, 4.3, 8.3$ Hz), 7.09 (1H, d d, $J = 8.3, 11.0$ Hz), 4.44 (1H, qt, $J = 8.0$

Hz), 3.97 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.96 (2H, m), 1.75 (4H, m), 1.63 (2H, m)

化合物322 (MP: 216-217) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 156.9, 151, 142.4, 141.9, 141.4, 137.3, 132.9, 129.7, 129, 126.3, 124.2, 124.1, 118.8, 114.7, 114.5, 113.4, 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 8.07 (1H, br), 8.03 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.90 (1H, s br), 7.70 (1H, d t, J = 1.7, 7.4 Hz), 7.52 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (1H, d t, J = 1.8, 7.8 Hz), 7.40 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.24 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.17 (1H, s br), 7.13 (1H, m), 6.85 (1H, d d, J = 0.9, 2.5, 8.0 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.74 (6H, s)

化合物323 (MP: 184-185) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 163.6, 151.2, 145, 141.8, 138.3, 137.6, 137.3, 133.8, 130, 129.3, 125.7, 124, 123.5, 113.3, 110.7, 58.4, 53.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 8.44 (1H, d d, J = 0.6, 2.5 Hz), 7.98 (1H, m), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.87 (1H, d d, J = 2.5, 8.6 Hz), 7.77 (1H, d t, J = 1.8, 7.0 Hz), 7.53 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.45 (1H, m), 6.83 (1H, d d, J = 0.6, 8.6 Hz), 3.99 (3H, s), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

化合物324 (MP: 138-140) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 168.4, 151.2, 142, 140.9, 137.3, 137.3, 136.8, 133.5, 129.1, 127.6, 126, 123.8, 123.6, 120, 113.3, 58.4, 38.6,

36.2, 34.1, 29.7, 24.6

^1H : 8.01 (1H, t, $J = 1.7$ Hz), 7.95 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.74 (1H, d t, $J = 1.7, 7.3$ Hz), 7.60 (4H, br), 7.52 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.49 (1H, d t, $J = 1.9, 7.8$ Hz), 7.44 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 2.19 (3H, s), 1.73 (6H, s)

化合物325 (MP: 150-152) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.1, 143.6, 141.8, 138.7, 137.2, 133.6, 132.8, 129.1, 126.3, 124.9, 123.7, 122.5, 113.2, 108.9, 58.4, 38.5, 36.2, 34.1, 29.6

^1H : 7.96 (1H, s), 7.94 (1H, s), 7.81 (1H, s), 7.66 (1H, m), 7.51 (1H, s), 7.49 (1H, m), 7.40 (2H, m), 6.78 (1H, m), 2.99 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

化合物326 (MP: 105-107) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.1, 151.8, 142, 136.8, 126.4, 125.8, 114, 112.1, 59.3, 55.3, 31.1, 28.8, 24.3

^1H : 7.91 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.73 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.41 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 6.95 (2H, d, $J = 8.8$ Hz), 4.45 (1H, qt, $J = 8.0$ Hz), 3.85 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.76 (2H, m), 1.67 (2H, m), 1.63 (2H, m)

化合物327 (MP: 92-94) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.9, 151.6, 142, 136.9, 134.4, 129.7, 117.5, 113.6, 113.5, 110.1, 59.3, 55.3, 31.2, 28.9, 24.3

^1H : 7.93 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.51 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.40 (1H, d d, $J = 1.4, 2.4$ Hz), 7.36 (1H, td, $J = 1.2, 7.6$ Hz),

7.32 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 6.86 (1H, d d d, $J = 1.3, 2.7, 8.0$ Hz),
4.45 (1H, m), 3.88 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.96 (2H, m), 1.78
(2H, m), 1.68 (2H, m), 1.60 (2H, m)

化合物328 (MP: 153-154) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.2, 146.6, 142.5, 136.1, 126.4, 125.5, 114.1,
110.9, 81.1, 80.3, 61.8, 55.3, 22.9

^1H : 7.93 (1H, d, $J = 1.5$ Hz), 7.71 (2H, d, $J = 8.9$ Hz),
7.41 (1H, d, $J = 1.5$ Hz), 6.94 (2H, d, $J = 8.9$ Hz), 5.13 (2H,
s), 3.88 (2H, s), 3.84 (3H, s), 1.61 (6H, s)

化合物329 (MP: 100-101) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.9, 146.4, 142.4, 136.1, 134.1, 129.7, 117.5,
113.8, 112.3, 110.2, 81, 80.3, 61.8, 55.3, 22.8

^1H : 7.95 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.51 (1H, d, $J = 1.3$ Hz),
7.40 (1H, d d, $J = 1.5, 2.5$ Hz), 7.34 (1H, t d, $J = 1.5, 7.6$ Hz),
7.30 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 6.85 (1H, d d d, $J = 1.5, 2.7, 7.9$ Hz),
5.12 (2H, s), 3.87 (2H, s), 3.86 (3H, s), 1.61 (6H, s)

化合物330 (MP: 164-166) ◦ NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.2 (d, $J = 240.0$ Hz), 150.8, 144.0 (d, $J = 12.3$
Hz), 139.9 (d, $J = 2.0$ Hz), 137.4, 125.4 (d, $J = 7.0$ Hz), 121.0
(d, $J = 3.0$ Hz), 117.9 (d, $J = 3.2$ Hz), 113.5, 112.5 (d, $J =$
19.5 Hz), 56.8, 31.3, 29, 25.1, 24.8

^1H : 9.89 (1H, s), 8.06 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.88 (1H, d, J
 $= 1.3$ Hz), 7.58 (1H, d d, $J = 2.0, 12.7$ Hz), 7.48 (1H, m, $J =$
2.0, 8.4 Hz), 6.95 (1H, d d, $J = 8.4, 9.0$ Hz), 3.80 (1H, m),

2.91 (3H, s), 1.76 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.55 (2H, m), 1.29 (2H, m), 1.10 (1H, m)

化合物331 (MP: 170-171) ° NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.2 (d, $J = 240.0$ Hz), 151.2, 144.0 (d, $J = 12.5$ Hz), 139.9 (d, $J = 2.6$ Hz), 137.4, 125.4 (d, $J = 6.9$ Hz), 121.0 (d, $J = 3.0$ Hz), 117.9 (d, $J = 3.3$ Hz), 113.5, 112.5 (d, $J = 19.5$ Hz), 58.4, 31.2, 28.2, 24

^1H : 9.89 (1H, s), 8.06 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.88 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.58 (1H, d d, $J = 2.0, 12.7$ Hz), 7.48 (1H, d d d, $J = 1.0, 2.0, 8.4$ Hz), 6.95 (1H, d d, $J = 8.4, 9.1$ Hz), 4.35 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.87 (2H, m), 1.67 (4H, m), 1.53 (2H, m)

化合物332 (MP: 194-196) ° NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.2 (d, $J = 240.0$ Hz), 146.2, 144.1 (d, $J = 12.0$ Hz), 140.2 (d, $J = 2.3$ Hz), 136.9, 125.3 (d, $J = 6.8$ Hz), 121.1 (d, $J = 3.0$ Hz), 117.9 (d, $J = 3.7$ Hz), 112.5 (d, $J = 20.0$ Hz), 112.5, 80.6, 79.3, 60.8, 22.4

^1H : 9.91 (1H, s), 8.11 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.91 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.59 (1H, d d, $J = 2.1, 12.5$ Hz), 7.48 (1H, m, $J = 2.1, 8.6$ Hz), 6.95 (1H, d d, $J = 8.6, 9.1$ Hz), 5.16 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.49 (6H, s)

化合物333 (MP: 173-176) ° NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 150.4 (d, $J = 240.0$ Hz), 146.1, 145.0 (d, $J = 12.5$ Hz), 140.2, 136.9, 130.1 (d, $J = 3.0$ Hz), 116.2 (d, $J = 18.5$ Hz), 115.9 (d, $J = 6.3$ Hz), 114.3 (d, $J = 2.7$ Hz), 113.1, 80.6,

79.3, 60.8, 22.4

^1H : 9.93 (1H, s), 8.13 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.92 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.46 (1H, d d, $J = 2.1, 8.8$ Hz), 7.24 (1H, d d d, $J = 2.1, 4.4, 8.5$ Hz), 7.13 (1H, d d, $J = 8.5, 11.2$ Hz), 5.16 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.49 (6H, s)

化合物334 (MP: 154-155) ° NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 154.6, 150.9, 150.7, 137.8, 134.3, 128.9, 124.2, 122.9, 121, 114.6, 110.9, 101.9, 57.6, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

^1H : 7.97 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.61 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.60 (1H, m), 7.49 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.28 (1H, d t, $J = 1.5, 7.5$ Hz), 7.24 (1H, d t, $J = 1.1, 7.3$ Hz), 7.10 (1H, s), 3.97 (1H, m), 3.01 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.71 (1H, d br, $J = 13.0$ Hz), 1.59 (2H, d q, $J = 3.5, 12.5$ Hz), 1.39 (2H, q, $J = 13.0$ Hz), 1.14 (1H, t q, $J = 3.5, 13.0$ Hz)

化合物335 (MP: 161-163) ° NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151, 148.5, 146.7, 139.2, 137.3, 132.4, 129, 123.6, 114, 57.6, 31.4, 30, 25.4, 25.2

^1H : 9.01 (1H, d d, $J = 0.8, 2.3$ Hz), 8.53 (1H, d d, $J = 1.7, 4.8$ Hz), 8.12 (1H, d d d, $J = 1.8, 2.2, 8.0$ Hz), 7.94 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.58 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.34 (1H, d d d, $J = 0.8, 4.9, 8.0$ Hz), 3.95 (1H, m), 3.01 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.71 (1H, d br, $J = 13.5$ Hz), 1.59 (2H, d q, $J = 3.5, 12.5$ Hz), 1.38 (2H, t q, $J = 3.5, 13.0$ Hz), 1.13 (1H, t q, $J = 3.5, 13.5$ Hz)

化合物336 (MP: 211-213) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151, 150.4, 148, 141.4, 137.4, 137.3, 137, 135.5, 134.2, 129.5, 126, 125.1, 124.2, 123.8, 113.6, 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

¹H: 8.66 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.02 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.92 (1H, d d, J = 2.5, 8.3 Hz), 7.81 (1H, d, J = 7.3 Hz), 7.55 (1H, s), 7.51 (1H, t, J = 7.51 Hz), 7.46 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.41 (1H, d, J = 8.3 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

化合物337 (MP: 油狀) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 147.5, 145.8, 140.9, 133, 128.6, 127.3, 125, 111.1, 81, 80.6, 61, 22.9, 14.3

¹H: 7.74 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.27 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.20 (1H, s), 4.90 (2H, s), 3.88 (2H, s), 2.56 (3H, s), 1.61 (6H, s)

化合物338 (MP: 129-130) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 154.6, 150.4, 146.1, 137.3, 134.9, 128.8, 124.3, 123, 121.1, 113.2, 110.9, 102.3, 81.1, 80.3, 62, 22.8

¹H: 8.04 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d, 1.3 Hz), 7.60 (1H, m), 7.48 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.30 (1H, d t, J = 1.5, 7.3 Hz), 7.24 (1H, d t, J = 1.2, 7.4 Hz), 7.10 (1H, s), 5.16 (2H, s), 3.89 (2H, s), 1.62 (6H, s)

化合物339 (MP: 154-155) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 148.6, 142.8, 136.5, 132.6, 128.7, 127.8, 125.2,

112.2, 80.3, 67.1, 46.0

^1H : 8.05 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.80 (2H, m d, $J = 8.4$ Hz), 7.60 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.41 (2H, m t, $J = 7.5$ Hz), 7.31 (1H, m t, $J = 7.3$ Hz), 5.12 (2H, s), 4.15 (2H, t, $J = 6.5$ Hz), 3.80 (2H, t, $J = 6.5$ Hz)

化合物340 (MP: 122-123) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.9, 148.4, 142.8, 136.6, 136.2, 133.9, 129.7, 129, 128.9, 126.1, 117.6, 113.9, 112.3, 110.3, 80.4, 80, 55.3, 53

^1H : 8.97 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.59 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.47-7.37 (5H, m), 7.40 (1H, m), 7.36 (1H, m), 7.31 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 6.87 (1H, d d d, $J = 1.3, 2.6, 7.9$ Hz), 5.43 (1H, d, $J = 4.5$ Hz), 5.26 (1H, d, $J = 4.5$ Hz), 5.16 (1H, d d, $J = 6.1, 8.8$ Hz), 4.16 (1H, d d, $J = 6.2, 10.0$ Hz), 3.87 (3H, s), 3.68 (1H, t, $J = 9.5$ Hz)

化合物341 (MP: 164-165) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.1, 151.4, 142, 136.8, 126.4, 125.8, 114, 112.1, 57.5, 55.3, 31.3, 30, 25.4, 25.2

^1H : 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.40 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.33 (2H, m d, $J = 9.0$ Hz), 6.95 (2H, m d, $J = 9.0$ Hz), 3.95 (1H, m), 3.84 (3H, s), 2.99 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d br, $J = 13.0$ Hz), 1.58 (2H, d q, $J = 3.5, 12.5$ Hz), 1.37 (2H, t q, $J = 3.2, 13.0$ Hz), 1.12 (1H, t q, $J = 3.5, 13.0$ Hz)

化合物342 (MP: 122-123) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.9, 151.3, 141.9, 136.8, 134.4, 129.7, 117.5, 113.6, 113.5, 110.1, 57.5, 55.3, 31.3, 30, 25.4, 25.2

^1H : 7.92 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.49 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.40 (1H, d d, $J = 1.4, 2.5$ Hz), 7.36 (1H, t d, $J = 1.4, 7.7$ Hz), 7.31 (1H, 1H, t, $J = 8.0$ Hz), 6.85 (1H, d d d, $J = 1.2, 2.5, 7.9$ Hz), 3.95 (1H, m), 3.88 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.86 (2H, m), 1.84 (2H, m), 1.70 (1H, d br, $J = 13.0$ Hz), 1.58 (2H, d q, $J = 4.5, 13.3$ Hz), 1.38 (2H, t q, $J = 3.2, 13.0$ Hz), 1.13 (1H, t q, $J = 3.5, 13.0$ Hz)

化合物343 (MP: 150-152) ◦ NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 150.3 (d, $J = 240.0$ Hz), 150.8, 144.9 (d, $J = 12.5$ Hz), 139.9, 137.5, 130.2 (d, $J = 3.5$ Hz), 116.2 (d, $J = 18.7$ Hz), 115.9 (d, $J = 6.3$ Hz), 114.2 (d, $J = 3.0$ Hz), 114.1, 56.8, 31.3, 29, 25.1, 24.8

^1H : 9.89 (1H, s br), 8.08 (1H, s), 7.89 (1H, s), 7.45 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.24 (1H, s br), 7.13 (1H, m, $J = 9.0, 11.0$ Hz), 3.79 (1H, s br), 2.91 (3H, s), 1.76 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, m), 1.10 (1H, m)

化合物344 (MP: 144-145) ◦ NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.1, 150.3 (d, $J = 241.0$ Hz), 144.9 (d, $J = 12.5$ Hz), 140.0, 137.5, 130.2 (d, $J = 3.2$ Hz), 116.3 (d, $J = 18.5$ Hz), 115.9 (d, $J = 6.5$ Hz), 114.2 (d, $J = 3.0$ Hz), 114.1, 58.4, 31.2, 28.2, 24.0

^1H : 9.91 (1H, s), 8.08 (1H, s), 7.88 (1H, d, $J = 1.3$ Hz),

7.45 (1H, d d, $J = 2.0, 8.7$ Hz), 7.24 (1H, m), 7.13 (1H, d d, $J = 8.6, 11.2$ Hz), 4.35 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.87 (2H, m), 1.68 (4H, m), 1.53 (2H, m)

化合物 345 (MP: 113-114) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.8, 150.5 (t, $J = 3.0$ Hz), 141.2, 136.6, 130.5, 126.5, 119.7, 115.9 (t, $J = 259.5$ Hz), 113.1, 58.9, 39.4, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

^1H : 7.87 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.80 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 7.45 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.16 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 6.54 (1H, t, $J = 7.4$ Hz), 3.75 (1H, t t, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 3.43 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 1.85 (4H, m), 1.68 (2H, m), 1.64 (1H, m), 1.29 (2H, m), 1.25 (3H, t, $J = 7.1$ Hz), 1.12 (1H, m)

化合物 346 (MP: 129-131) 。 NMR 溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.6 (d d, $J = 13.0, 247.5$ Hz), 150.6, 149.7 (d d, $J = 12.5, 248.0$ Hz), 140.4 (d, $J = 2.0$ Hz), 136.6, 130.3 (d d, $J = 3.5, 7.0$ Hz), 121.0 (d d, $J = 3.6, 6.1$ Hz), 117.5 (d, $J = 17.5$ Hz), 114.1 (d, $J = 18.5$ Hz), 113.4, 59, 39.5, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

^1H : 7.85 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.61 (1H, d d d, $J = 2.2, 7.6, 11.6$ Hz), 7.49 (1H, m), 7.44 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.18 (1H, d t, $J = 8.4, 10.2$ Hz), 3.74 (1H, t t, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 3.43 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 1.85 (4H, m), 1.67 (2H, m), 1.64 (1H, m), 1.30 (2H, m), 1.25 (3H, t, $J = 7.1$ Hz), 1.13 (1H, m)

化合物 347 (MP: 144-145) 。 NMR 溶劑 : DMSO

¹³C: 157.6, 146.2, 141, 136.9, 134.6, 129.6, 115.7, 114.2, 113.4, 111.7, 80.6, 79.3, 60.8, 22.4

¹H: 9.43 (1H, s), 8.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.26 (2H, m), 7.16 (1H, t, J = 7.8 Hz), 6.66 (1H, d d, J = 1.5, 2.0, 8.0 Hz), 5.17 (2H, s), 3.83 (2H, s), 1.50 (6H, s)

化合物348 (MP: 129-130) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 146.4, 141.8, 136.4, 132.9, 130.6, 128.7, 128.5, 125, 123.1, 112.4, 94, 81.9, 81.1, 80.3, 65.5, 61.9, 31.5, 22.8

¹H: 7.97 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (1H, br), 7.74 (1H, m), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (2H, m), 5.12 (2H, s), 3.88 (2H, s), 1.63 (6H, s), 1.61 (6H, s)

化合物349 (MP: 129-131) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 150.3, 138.4, 137.5, 134.2, 131.5, 130.9, 129.1, 126.3, 124.8, 115.7, 58.3, 39.1, 30.2, 25.3, 24.7, 14.7

¹H: 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.11 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.09 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.84 (1H, d d, J = 2.0, 8.4 Hz), 7.65 (1H, d, J = 8.4 Hz), 3.57 (1H, t br, J = 10.5 Hz), 3.38 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.79 (2H, m), 1.75 (2H, m), 1.64 (2H, m), 1.55 (1H, m), 1.17 (2H, m), 1.1 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.10 (1H, m)

化合物350 (MP: 92-93) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 159.1, 151, 142, 136.4, 126.4, 125.8, 114.1, 111.9, 58.9, 55.3, 39.3, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

¹H: 7.87 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m d, J = 8.8 Hz),

7.38 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 6.85 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 3.84 (3H, s), 3.77 (1H, t t, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 3.43 (2H, t, $J = 7.1$ Hz), 1.85 (4H, m), 1.68 (2H, m), 1.64 (1H, m), 1.30 (2H, m), 1.25 (3H, t, $J = 7.1$ Hz), 1.12 (1H, m)

化合物351 (MP: 100-101) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 152.0 (d, $J = 246.5$ Hz), 147.8 (d, $J = 11.0$ Hz), 146.4, 141.8, 136.1, 129.4 (d, $J = 3.5$ Hz), 117.4 (d, $J = 7.0$ Hz), 116.2 (d, $J = 18.5$ Hz), 112, 110.4 (d, $J = 1.5$ Hz), 81.1, 80.3, 61.9, 56.2, 22.8

^1H : 7.94 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.48 (1H, d d, $J = 2.0, 8.2$ Hz), 7.47 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.23 (1H, d d d, $J = 2.0, 4.3, 8.3$ Hz), 7.09 (1H, d d, $J = 8.3, 11.0$ Hz), 5.13 (2H, s), 3.96 (3H, s), 3.89 (2H, s), 1.61 (6H, s)

化合物352 (MP: 113-114) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 146.5, 143.1, 142.6, 136.2, 132.8, 128.8, 127.8, 125.2, 122.6, 112, 81.1, 80.4, 70.9, 61.8, 45.7, 30.7, 29.3, 22.9

^1H : 7.97 (1H, d, $J = , 1.3$ Hz), 7.68 (1H, t br, $J = 2.0$ Hz), 7.58 (1H, m d, $J = 7.7$ Hz), 7.50 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.32 (1H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.15 (1H, m d, $J = 7.7$ Hz), 5.13 (2H, s), 3.89 (2H, s), 2.75 (2H, m), 1.84 (2H, m), 1.62 (6H, s), 1.30 (6H, s)

化合物353 (MP: 192 (dec.)) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.4, 137.9, 137.5, 136.7, 136, 132.9, 125.9,

122.7, 115.2, 58.7, 38.5, 36.1, 34.1, 29.6

^1H : 8.68 (1H, s), 8.13 (1H, d, $J = 6.3$ Hz), 7.92 (1H, d, $J = 0.9$ Hz), 7.70 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.56 (1H, d, $J = 0.9$ Hz), 7.30 (1H, d d, $J = 6.3, 8.1$ Hz), 2.98 (3H, s), 2.18 (9H, m), 1.72 (6H, m)

化合物354 (MP: 217 (分解))。NMR溶劑： CDCl_3

^{13}C : 151, 141.1, 140.2, 137.6, 137.6, 137.5, 135.5, 134.4, 129.7, 125.9, 125.8, 125.7, 124.8, 123.7, 113.6, 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.6

^1H : 8.54 (1H, t, $J = 1.5$ Hz), 8.21 (1H, d d d, $J = 1.0, 1.6, 6.4$ Hz), 8.0 (1H, t, $J = 1.8$ Hz), 7.95 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.86 (1H, td, $J = 1.5, 7.8$ Hz), 7.56 (1H, d d d, $J = 1.0, 1.5, 8.0$ Hz), 7.55 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.52 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.44 (1H, d d d, $J = 1.5, 1.8, 7.8$ Hz), 7.36 (1H, d d, $J = 6.5, 8.0$ Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

化合物355 (MP: 144-147)。NMR溶劑： CDCl_3

^{13}C : 160, 149.9, 140.6, 135.9, 132.5, 129.9, 117.6, 114.5, 113.5, 110.3, 59.2, 55.5, 39.7, 31.3, 25.5, 25, 14.9

^1H : 8.13 (1H, br), 7.50 (1H, m), 7.50 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.38 (1H, m, $J = 7.7$ Hz), 7.34 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 6.90 (1H, d d d, $J = 1.3, 2.6, 8.0$ Hz), 3.90 (3H, s), 3.72 (1H, t t, $J = 3.5, 12$ Hz), 3.44 (2H, q, $J = 7.1$ Hz), 1.86 (4H, m), 1.69 (2H, m), 1.65 (1H, m), 1.30 (2H, m), 1.27 (3H, t, $J = 7.1$ Hz), 1.13 (1H, m)

化合物356 (MP: 120-121) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 146.3, 145.9, 141.7, 137.5, 136.5, 126.1, 113.2, 111.7, 110.7, 110.6, 80.6, 79.3, 60.8, 55.3, 22.5

¹H: 8.07 (1H, d, 1.3 Hz), 7.71 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.14 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.0 (1H, d d, J = 2.0, 8.5 Hz), 6.79 (1H, d, J = 8.5 Hz), 5.16 (2H, s), 4.72 (2H, s), 3.83 (2H, s), 3.77 (3H, s), 1.49 (6H, s)

化合物357 (MP: 176 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 150.8, 149.5, 137.3, 136.7, 126.1, 122, 121, 119.7, 116.6, 114.3, 57, 31.4, 28.9, 25, 24.8

¹H: 11.13 (1H, s), 10.0 (3H, br), 8.75 (1H, s br), 8.05 (1H, s br), 7.81 (1H, s br), 7.70 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.13 (1H, d, J = 7.7 Hz), 3.85 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.55 (3H, m), 1.30 (2H, m), 1.16 (1H, m)

化合物358 (MP: 209 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 150.7, 145.2, 137.8, 136.9, 126.1, 122.8, 121, 119.6, 116.6, 113.3, 80.6, 79.3, 61.1, 22.4

¹H: 11.08 (1H, s), 9.98 (3H, s br), 8.62 (1H, s br), 8.04 (1H, s br), 7.81 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.70 (1H, d d, J = 2.0, 8.5 Hz), 7.11 (1H, d, J = 8.5 Hz), 5.18 (2H, s), 3.85 (2H, s), 1.50 (6H, s)

化合物359 (MP: 97-98) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 145.9, 145.6, 131.5, 131.3, 130.3, 119.2, 115.4, 82.4, 79.5, 62.4, 22.9

^1H : 8.18 (1H, d, $J = 8.8$ Hz), 8.08 (1H, d, $J = 1.4$ Hz),
7.58 (1H, d d, $J = 1.4, 8.8$ Hz), 5.53 (2H, s), 3.90 (2H, s),
1.68 (6H, s)

化合物360 (MP: 138-140) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 163.3 (d d, $J = 10.0, 252.0$ Hz), 152.9 (d d, $J = 15.0, 262.5$ Hz), 145.3, 135.1 (d d, $J = 7.2, 16.8$ Hz), 132.7 (d, $J = 19.0$ Hz), 101.7 (d d, $J = 20.0, 30.0$ Hz), 97.2 (d d, $J = 5.5, 29.5$ Hz), 82.4, 79.5, 62.5, 22.9

^1H : 7.75 (1H, d d d, $J = 0.9, 2.1, 8.0$ Hz), 6.97 (1H, d t, $J = 2.1, 9.4$ Hz), 5.52 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.67 (6H, s)

化合物361 (MP: 146-147) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 146.2, 144.7, 143.1, 140.2, 133.5, 128.9, 128.1, 127.9, 125.7, 119.9, 112.4, 82.5, 79.6, 62.2, 23

^1H : 8.44 (1H, d d, $J = 1.7, 1.6$ Hz), 8.14 (1H, d d, $J = 0.7, 8.7$ Hz), 7.74 (1H, d d, $J = 1.6, 8.7$ Hz), 7.71 (2H, m, $J = 8.2$ Hz), 7.50 (2H, m, $J = 7.9$ Hz), 7.42 (1H, m, $J = 7.5$ Hz), 5.57 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.70 (6H, s)

化合物362 (MP: 225 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 150.4, 138.3, 137.1, 135.7, 134.7, 132.8, 126.7, 121.2, 117, 56.8, 31.4, 29, 25.1, 24.8

^1H : 8.70 (1H, t, $J = 1.5$ Hz), 8.28 (1H, s), 8.20 (1H, s), 8.11 (1H, d, $J = 6.5$ Hz), 7.78 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.45 (1H, d d, $J = 6.5, 8.1$ Hz), 3.80 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.56 (3H, m), 1.30 (2H, m), 1.11 (1H, m)

化合物363 (MP: 171) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 161.6, 155.2, 151.1, 141, 137, 135.5, 134.1, 130.5, 121.8, 119.3, 118.9, 117.9, 117, 113.9, 105.7, 57.6, 31.3, 29.9, 25.4, 25.2

¹H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (1H, t d, J = 1.2, 7.9 Hz), 7.60 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.53 (1H, t br, J = 2.0 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.43 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.05 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.0 (1H, d d d, J = 1.0, 2.5, 7.9 Hz), 3.94 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.87 (2H, m), 1.84 (2H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.4, 12.3 Hz), 1.37 (2H, t q, J = 3.0, 12.7 Hz), 1.12 (1H, t q, J = 3.2, 13.2 Hz)

化合物364 (MP: 173) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 161.6, 155.3, 146.2, 141.5, 136.2, 135.2, 134.1, 130.5, 121.8, 119.5, 118.9, 118, 117.1, 112.8, 105.8, 81, 80.3, 61.9, 22.8

¹H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (1H, m), 7.61 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 7.53 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.52 (1H, t br, J = 2.0 Hz), 7.44 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.05 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 7.0 (1H, d d d, J = 1.0, 2.5, 8.0 Hz), 5.11 (2H, s), 3.88 (2H, s), 1.61 (6H, s)

化合物365 (MP: 154 (分解)) 。 NMR溶劑：DMSO

¹³C: 150.6, 148.4, 139.9, 137.4, 130, 125.9, 118.8, 114.9, 113.4, 111.6, 56.8, 55.8, 31.3, 29, 25.2, 24.8

¹H: 8.19 (1H, s br), 7.84 (1H, s br), 7.44 (1H, d, J = 2.0

Hz), 7.38 (1H, dd, $J = 2.0, 8.6$ Hz), 7.01 (1H, d, $J = 8.6$ Hz), 3.84 (3H, s), 3.80 (1H, br), 2.92 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.57 (3H, m br), 1.29 (2H, q br, $J = 13.0$ Hz), 1.11 (1H, q bbr, $J = 13.0$ Hz)

化合物366 (MP: 135-136) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 156.8, 149.5, 145.4, 125.7, 124, 123.6, 82.4, 79.4, 62.5, 22.9

^1H : 8.82 (1H, d d, $J = 1.6, 4.5$ Hz), 8.60 (1H, d d, $J = 1.6, 8.4$ Hz), 7.57 (1H, d d, $J = 4.5, 8.4$ Hz), 5.58 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.68 (6H, s)

化合物367 (MP: 67-68) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 146.1, 144, 140.4, 133.3, 127.6, 119.1, 113.7, 82.5, 79.6, 62.1, 23, 22

^1H : 8.02 (1H, br), 7.95 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.29 (1H, d d, $J = 1.0, 8.5$ Hz), 5.53 (2H, s), 3.89 (2H, s), 2.55 (3H, s), 1.68 (6H, s)

化合物368 (MP: 111-112) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 152.2, 145.9, 144.3, 136.8, 129, 121, 81.9, 80, 62.1, 22.9

^1H : 8.88 (1H, d d, $J = 1.0, 4.4$ Hz), 8.46 (1H, d d, $J = 1.0, 8.3$ Hz), 7.48 (1H, d d, $J = 4.4, 8.3$ Hz), 5.37 (2H, s), 3.93 (2H, s), 1.72 (6H, s)

化合物369 (MP: 84-85) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 147.4, 145.4, 132.6, 129.7, 125.6, 119.8, 114.3,

81.3, 80.5, 68.5, 65.8, 47.7, 45.7

¹H: 8.24 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.11 (1H, m, J = 1.0, 8.3 Hz), 7.63 (1H, m, J = 1.0, 7.2, 8.3 Hz), 7.49 (1H, m, J = 1.2, 7.2, 8.3 Hz), 5.50-5.30 (2H, 2 s), 4.20-3.91 (4H, 2 s)

化合物370 (MP: 121-123) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 156.4, 146.2, 144.4, 140.7, 133, 131.2, 129.6, 129.5, 128.1, 120.9, 118.7, 114.6, 111.1, 82.5, 79.6, 62.1, 55.6, 23

¹H: 8.33 (1H, m), 8.09 (1H, d d, J = 0.7, 8.5 Hz), 7.67 (1H, d d, J = 1.5, 8.5 Hz), 7.39 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.38 (1H, m), 7.06 (1H, d t, J = 1.0, 7.5 Hz), 7.02 (1H, d, J = 8.4 Hz), 5.54 (2H, s), 3.90 (2H, s), 3.83 (3H, s), 1.68 (6H, s)

化合物371 (MP: 134-136) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 145.5, 144.6, 134.4, 128.2 (q, J = 33.0 Hz), 126.0 (q, J = 3.3 Hz), 123.7 (q, J = 273.0 Hz), 117.9 (q, J = 5.0 Hz), 115.5, 82.5, 79.6, 62.5, 22.9

¹H: 8.42 (1H, m), 8.38 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.85 (1H, d d, J = 1.5, 8.8 Hz), 5.55 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.69 (6H, s)

化合物372 (MP: 157-159) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 162.9, 151.6, 146.5, 135.7, 133, 97.8, 87.1, 82.6, 79.6, 62.1, 56.2, 56.1, 23

¹H: 7.14 (1H, s), 6.42 (1H, s), 5.50 (2H, s), 4.05 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.88 (2H, s), 1.67 (6H, s)

化合物373 (MP: 118-119) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

^{13}C : 146.5, 145.1, 133.1, 129.4, 125.4, 119.8, 114.3, 96.5, 64, 49, 24.2

^1H : 8.18 (1H, m, $J = 8.3$ Hz), 8.11 (1H, m, $J = 8.3$ Hz), 7.62 (1H, m, $J = 7.7$ Hz), 7.48 (1H, m, $J = 7.7$ Hz), 4.29 (2H, m, $J = 6.2$ Hz), 4.15 (2H, m, $J = 6.2$ Hz), 1.81 (6H, s)

化合物374 (MP: 143-144) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 149.8, 144.5, 134.9, 127.8 (q, $J = 33.0$ Hz), 125.7 (q, $J = 3.3$ Hz), 123.8 (q, $J = 272.5$ Hz), 117.9 (q, $J = 4.5$ Hz), 114.7, 58.9, 57.2, 32.5, 30.7, 30.2, 29.5, 25.5, 25.3

^1H : 8.41 (1H, m), 8.12 (1H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.83 (1H, d, $J = 1.5, 8.8$ Hz), 4.28 (1H, m), 3.19 (3H, s), 2.0 (2H, d, br), 1.90 (2H, br), 1.73 (1H, br), 1.64 (2H, m), 1.46 (2H, br), 1.18 (1H, br)

化合物375 (MP: 102-104) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.7, 144.4, 139.6, 134.8, 132.2, 118.8, 113, 57.6, 32.4, 29.9, 25.5, 25.3, 20.9, 20.4

^1H : 7.81 (1H, s), 7.75 (1H, s), 4.24 (1H, m), 3.15 (3H, s), 2.43 (3H, s), 2.41 (3H, s), 1.98 (2H, d br, $J = 11.5$ Hz), 1.87 (2H, br), 1.70 (1H, m), 1.61 (2H, d q, $J = 3.7, 12.5$ Hz), 1.40 (2H, br), 1.16 (1H, m)

化合物376 (MP: 220-221 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 150.6, 142.3, 139.3, 138.1, 136.7, 126.2, 124.9, 116.2, 56.9, 31.4, 29, 25.2, 24.9

^1H : 8.19 (2H, s), 8.04 (2H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.83 (2H, d, J

= 8.5 Hz), 7.37 (2H, s), 3.83 (1H, m br), 2.95 (3H, s), 1.80 (4H, m), 1.60 (3H, m), 1.31 (2H, m), 1.14 (1H, m)

化合物377 (MP: 93-95) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 162.6, 151.6, 150.9, 136.1, 132.9, 97.3, 86.2, 58.9, 56.8, 56.2, 56, 32.7, 30.8, 29.5, 25.5, 25.3

¹H: 6.89 (1H, d, J = 2.0 Hz), 6.39 (1H, d, J = 2.0 Hz), 4.25 (1H, m), 4.05 (3H, s), 3.88 (3H, s), 3.15 (3H, s), 1.98 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.87 (2H, br), 1.69 (1H, br), 1.60 (2H, d q, J = 3.4, 12.2 Hz), 1.43 (2H, br), 1.15 (1H, m)

化合物378 (MP: 118-119) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 145.4, 143.8, 139.8, 117.1, 82.4, 79.6, 62.3, 22.6, 21.1

¹H: 7.61 (2H, s), 5.41 (2H, s), 3.88 (2H, s), 2.40 (6H, s), 1.67 (6H, s)

化合物379 (MP: 175) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 150.9, 140.6, 139.2, 137.7, 133.4, 128.6, 128.3, 127.4, 127.3, 127.1, 124.7, 114.4, 75.6, 69.1, 56.1, 31.5, 30.8, 26.6

¹H: 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.35-7.29 (4H, m), 7.27 (1H, m), 7.25 (1H, m t, J = 7.3 Hz), 4.51 (2H, s), 3.86 (1H, m), 3.33 (1H, m), 2.91 (3H, s), 2.13 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 1.81 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 1.68 (2H, d q, J = 2.5, 12.5 Hz), 1.30 (2H, q br, J = 12.5 Hz)

化合物380 (MP: 207) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 155.1, 150.7, 139.6, 138, 136.2, 127.4, 125.5, 122.4, 115.9, 56.9, 31.4, 29, 25.2, 24.8

¹H: 16.76 (1H, br), 8.18 (2H, m), 8.07 (4H, m), 3.83 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.58 (2H, m), 1.30 (2H, q br, J = 13.0 Hz), 1.11 (1H, m, J = 12.9 Hz)

化合物381 (MP: 102-103) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 146.4, 144.5, 140.1, 135.3, 131.7, 118.9, 113.8, 82.5, 79.6, 62.1, 23, 20.9, 20.4

¹H: 7.99 (1H, s), 7.82 (1H, s), 5.53 (2H, s), 3.89 (2H, s), 2.44 (3H, s), 2.42 (3H, s), 1.68 (6H, s)

化合物382 (MP: 112-114) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 152.5, 149.2, 146.4, 139.7, 128.4, 98.6, 94.7, 82.6, 79.5, 62.1, 56.6, 56.2, 23

¹H: 7.63 (1H, s), 7.39 (1H, s), 5.55 (2H, s), 4.04 (3H, s), 4.0 (3H, s), 3.89 (2H, s), 1.68 (6H, s)

化合物383 (MP: 139) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.4, 142.2, 137, 132.8, 128.7, 127.6, 125.1, 113.1, 69.6, 56.4, 34.1, 31.7, 27.4

¹H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, m d, J = 8.0 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, m t, J = 7.9 Hz), 7.30 (1H, m t, J = 7.5 Hz), 4.01 (1H, m), 3.62 (1H, m), 2.99 (3H, s), 2.11 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 1.90 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 1.71 (2H, d q, J = 3.0, 12.5 Hz), 1.46 (2H, d q, J = 3.5, 13.0

Hz)

化合物384 (MP: 158-160) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 163.3, 151.7, 149.2, 134.4, 133.9, 97.6, 86.7, 69.5, 56.3, 56.2, 56.1, 24.3

¹H: 7.43 (1H, s), 7.13 (1H, d, J = 2.0 Hz), 6.40 (1H, d, J = 2.0 Hz), 4.05 (3H, s), 3.90 (3H, s), 3.82 (2H, d, J = 5.5 Hz), 3.34 (1H, t, J = 5.5 Hz), 1.51 (6H, s)

化合物385 (MP: 224-226) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 167.6, 146.1, 140.1, 137.3, 136, 132.6, 128, 124.4, 114.7, 80.6, 79.3, 60.9, 22.4

¹H: 8.20 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.98 (1H, s br), 7.91 (4H, m), 7.36 (1H, s br), 5.19 (2H, s), 3.85 (2H, s), 1.50 (6H, s)

化合物386 (MP: 183-185) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 157.8, 144.5, 136.6, 136.3, 126.9, 122.5, 115.2, 113.8, 80.7, 79.3, 62.5, 61.3, 54.6, 52.6, 22.3, 22.3, 21.3

¹H: 10.83 (1H, s), 9.05 (1H, s br), 8.27 (1H, s), 7.89 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.10 (2H, d, J = 8.6 Hz), 5.21 (2H, s), 4.48 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.87 (2H, s), 3.49 (2H, m), 3.45 (2H, m), 2.99 (2H, m), 1.80 (4H, m), 1.69 (1H, d, J = 15.0 Hz), 1.51 (6H, s), 1.38 (1H, m)

化合物387 (MP: 172-175) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 157.9, 144.2, 136.6, 135.7, 127, 122, 115.2, 114, 80.7, 79.3, 63.2, 62.4, 61.3, 54.7, 51.7, 22.3

¹H: 11.69 (1H, s), 9.18 (1H, s), 8.31 (1H, s), 7.91 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.12 (2H, d, J = 8.6 Hz), 5.22 (2H, s), 4.51 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.96 (2H, d br, J = 12.6 Hz), 3.87 (2H, m), 3.87 (2H, s), 3.56 (2H, m), 3.49 (2H, d br, J = 12.4 Hz), 3.20 (2H, m), 1.51 (6H, s)

化合物388 (MP: 218-220) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 157.6, 144.6, 136.6, 136.6, 126.8, 122.9, 115.3, 113.7, 80.7, 79.3, 62.4, 61.3, 54.5, 48.5, 39.5, 22.3

¹H: 12.18 (1H, br), 9.89 (2H, s), 8.98 (1H, s), 8.24 (1H, s), 7.88 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.9 Hz), 5.20 (2H, s), 4.48 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.86 (2H, s), 3.64 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.75 (4H, m), 2.50 (4H, br), 1.50 (6H, s)

化合物389 (MP: 216-218) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 166.9, 145.4, 144.6, 133.7, 131.9, 129.1, 119, 113.9, 81.7, 78.7, 61.7, 22.5

¹H: 8.71 (1H, d d, J = 0.8, 1.3 Hz), 8.26 (1H, s br), 8.21 (1H, d, J = 1.3, 8.6 Hz), 8.16 (1H, d d, J = 0.8, 8.6 Hz), 7.63 (1H, s br), 5.43 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.58 (6H, s)

化合物390 (MP: 245-247) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 167.6, 150.7, 139.8, 137.9, 136.1, 132.5, 128, 124.3, 115.6, 56.8, 31.3, 29, 25.1, 24.8

¹H: 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.97 (1H, s), 7.92 (2H, m), 7.89 (2H, m), 7.35 (1H, s), 3.82 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.59 (3H, m), 1.30 (2H,

q br, $J = 12.7$ Hz), 1.11 (1H, q br, $J = 13.0$ Hz)

化合物391 (MP: 165 (分解))。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 155.9, 154.1, 144.5, 137.7, 137.1, 136.9, 129.4, 128.9, 127.7, 124.7, 82.5, 79.6, 62.8, 22.6

¹H: 9.21 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 8.40 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 7.68 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.56 (2H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.50 (1H, t, $J = 7.3$ Hz), 5.50 (2H, s), 3.93 (2H, s), 1.71 (6H, s)

化合物392 (MP: 120)。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 156.2, 149.4, 145.6, 137.8, 136.8, 129.3, 128.9, 127.9, 126.1, 121, 82.5, 79.4, 62.6, 22.9

¹H: 9.07 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 8.75 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 7.71 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.54 (2H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.49 (1H, t, $J = 7.4$ Hz), 5.61 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.70 (6H, s)

化合物393 (MP: 179-180)。NMR溶劑：DMSO

¹³C: 158.9, 144.2, 136.5, 135.9, 127, 121.3, 115, 113.7, 80.7, 79.3, 71.4, 61.3, 42.6, 33.1, 25.1, 22.2

¹H: 9.25 (1H, d, $J = 11.0$ Hz), 9.17 (1H, s), 8.93 (1H, q, $J = 9.5$ Hz), 8.29 (1H, s), 7.88 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.06 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 5.22 (2H, s), 3.91 (2H, d, $J = 6.2$ Hz), 3.88 (2H, s), 3.28 (2H, d, $J = 12.0$ Hz), 2.89 (2H, q, $J = 11.5$ Hz), 2.08 (1H, m), 1.92 (2H, d, $J = 13.0$ Hz), 1.54 (2H, q, $J = 12.5$ Hz), 1.52 (6H, s)

化合物394 (MP: 189-190)。NMR溶劑：DMSO

¹³C: 157.9, 148.9, 137, 135.5, 127, 122, 115.2, 114.7,

62.5, 57.2, 54.6, 52.6, 31.5, 28.8, 25, 24.8, 22.3, 21.2

^1H : 10.86 (1H, br), 9.14 (1H, s), 8.28 (1H, s), 7.91 (2H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.11 (2H, d, $J = 9.0$ Hz), 4.49 (2H, t, $J = 5.2$ Hz), 3.84 (1H, m), 3.48 (2H, m), 3.46 (2H, m), 2.99 (2H, m), 2.96 (3H, s), 1.80 (8H, m), 1.69 (1H, m), 1.58 (3H, m), 1.39 (1H, m), 1.30 (2H, m), 1.12 (1H, m)

化合物395 (MP: 74-76) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 158, 148.7, 136.9, 134.8, 127.1, 121.3, 115.3, 115, 63.2, 62.5, 57.2, 54.7, 51.7, 31.5, 28.8, 25, 24.8

^1H : 11.72 (1H, br), 9.32 (1H, s), 8.35 (1H, s), 7.94 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.15 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 4.53 (2H, t, $J = 5.0$ Hz), 3.97 (2H, d br, $J = 13.0$ Hz), 3.90 (1H, m), 3.88 (2H, t br, $J = 11.8$ Hz), 3.57 (2H, m), 3.50 (2H, d br, $J = 12.4$ Hz), 3.21 (2H, m), 2.98 (3H, s), 1.80 (4H, m), 1.61 (3H, m), 1.33 (2H, m, $J = 12.5$ Hz), 1.14 (1H, m)

化合物396 (MP: 180-181) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 159, 144.3, 136.5, 136, 127, 121.3, 115, 113.6, 80.7, 79.4, 65.3, 61.4, 43, 34.7, 30.4, 28.3, 22.3

^1H : 9.13 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 9.04 (1H, m), 8.82 (1H, m), 8.25 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.85 (2H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.03 (2H, d, $J = 9.0$ Hz), 5.21 (2H, s), 4.06 (2H, t, $J = 6.1$ Hz), 3.87 (2H, s), 3.22 (2H, d br, $J = 12.5$ Hz), 2.83 (2H, q br, $J = 11.5$ Hz), 1.85 (2H, d br, $J = 14.0$ Hz), 1.76 (1H, m), 1.68 (2H, m), 1.51 (6H, s), 1.41 (2H, d q, $J = 4.0, 13.8$ Hz)

化合物397 (MP: 205-207) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 157.8, 148.8, 137, 135.3, 127, 121.9, 115.3, 114.8, 62.4, 57.2, 54.4, 48.4, 39.7, 31.5, 28.8, 25, 24.8

¹H: 12.35 (1H, s br), 10.02 (2H, s), 9.21 (1H, s), 8.31 (1H, s), 7.92 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.14 (2H, d, J = 8.6 Hz), 4.50 (2H, t, J = 4.8 Hz), 3.81 (1H, m), 3.65 (2H, t, J = 4.8 Hz), 3.50 (8H, s br), 2.96 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.59 (3H, m), 1.31 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.12 (1H, q, J = 13.0 Hz)

化合物398 (MP: 201 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 156.7, 151.2, 141, 137.3, 126.1, 124.5, 115.3, 112.5, 66.3, 54.1, 31.5, 29.1

¹H: 9.46 (1H, s), 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 6.77 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 4.09 (1H, m), 3.93 (2H, d d, J = 4.3, 11.1 Hz), 3.73 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 2.94 (3H, s), 1.85 (2H, d q, J = 4.5, 12.2 Hz), 1.69 (2H, m d, J = 12.3 Hz)

化合物399 (MP: 176-178) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 157.9, 144.9, 137.4, 136.9, 131.9, 130.2, 118.2, 114.9, 114.8, 111.1, 80.7, 79.3, 62.5, 61.2, 54.6, 52.6, 22.3, 22.3, 21.2

¹H: 10.80 (1H, s), 8.83 (1H, s), 8.35 (1H, s), 7.59 (1H, br), 7.54 (1H, d br, J = 7.5 Hz), 7.39 (1H, t, J = 7.9 Hz), 6.96 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 5.21 (2H, s), 4.50 (2H, t, J = 5.2 Hz), 3.87 (2H, s), 3.46 (4H, m), 3.0 (2H, m), 1.80 (4H, m),

1.69 (1H, m), 1.51 (6H, s), 1.38 (1H, m)

化合物400 (MP: 200-202) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 159, 148.8, 136.9, 135.3, 127, 121, 115, 114.6, 71.4, 57.2, 42.6, 33.1, 31.5, 28.8, 25.1, 25, 24.8

¹H: 9.24 (1H, m), 9.22 (1H, s), 8.93 (1H, m), 8.29 (1H, s), 7.88 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.06 (2H, d, J = 8.9 Hz), 3.91 (2H, d, J = 6.3 Hz), 3.85 (1H, m), 3.27 (2H, d br, J = 12.4 Hz), 2.96 (3H, s), 2.88 (2H, q, J = 11.0 Hz), 2.07 (1H, m), 1.91 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 1.79 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.55 (2H, m), 1.31 (2H, m, J = 13.0 Hz), 1.12 (1H, m, J = 13.0 Hz)

化合物401 (MP: 160-162) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 157.8, 145.1, 138.1, 136.9, 132.5, 130.1, 118.2, 114.7, 114.6, 111.1, 80.6, 79.3, 62.4, 61.1, 54.4, 48.5, 25.5, 22.3

¹H: 12.23 (1H, s br), 9.84 (2H, s), 8.69 (1H, br), 8.29 (1H, s), 7.58 (1H, br), 7.53 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.38 (1H, t, J = 7.9 Hz), 6.97 (1H, d d, J = 1.8, 8.0 Hz), 5.20 (2H, s), 4.50 (2H, m), 3.86 (2H, s), 3.66 (2H, m), 3.50 (8H, br), 1.51 (6H, s)

化合物402 (MP: 137-140) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 157.9, 144.6, 136.8, 136.6, 131.1, 130.2, 118.3, 115.2, 115.1, 111.2, 80.7, 79.3, 63.2, 62.5, 61.3, 54.7, 51.7, 22.3

¹H: 11.70 (1H, s), 9.0 (1H, s), 8.41 (1H, s), 7.62 (1H, br), 7.56 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.40 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.0 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 5.22 (2H, s), 4.54 (2H, t, J = 4.7 Hz), 3.96 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.87 (2H, s), 3.87 (2H, m), 3.57 (2H, m), 3.51 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.22 (2H, m), 1.51 (6H, s)

化合物403 (MP: 204-206) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 167.9, 150.8, 140.1, 137.7, 134.7, 133.5, 128.6, 127.3, 126.1, 123.9, 114.9, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.8

¹H: 8.35 (1H, t, J = 1.5 Hz), 8.15 (1H, d, J = 1.2 Hz), 8.06 (1H, d, J = 1.2 Hz), 8.03 (1H, s br), 7.98 (1H, d t, J = 1.5, 7.9 Hz), 7.75 (1H, d t, J = 1.5, 7.9 Hz), 7.47 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.42 (1H, s br), 3.83 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, m), 1.11 (1H, m)

化合物404 (MP: 198-200) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.9, 140.3, 137.9, 137.3, 133.3, 128.4, 125.5, 115.2, 66.1, 57.7, 46, 31.4, 30, 25.4, 25.2

¹H: 7.97 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.64 (1H, d, J = 1.3 Hz), 3.95 (1H, m, J = 11.5 Hz), 3.75 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.02 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.01 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.72 (1H, m), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.3 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.3, 13.0 Hz), 1.14 (1H, t q, J = 3.5, 13.2 Hz)

化合物405 (MP: 152-154) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 159, 144.7, 137.2, 136.8, 131.5, 130.1, 117.6, 114.9, 114.9, 110.9, 80.7, 79.3, 71.4, 61.2, 42.6, 33.2, 25.2, 22.3

^1H : 9.14 (1H, m), 8.89 (1H, s), 8.85 (1H, m), 8.34 (1H, s), 7.52 (1H, br), 7.49 (1H, m), 7.35 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 6.91 (1H, d d, $J = 2.0, 8.3$ Hz), 5.20 (2H, s), 3.92 (2H, d, $J = 6.5$ Hz), 3.86 (2H, s), 3.28 (2H, d br, $J = 12.2$ Hz), 2.89 (2H, q br, $J = 11.5$ Hz), 2.08 (1H, m), 1.93 (2H, d br, $J = 13.0$ Hz), 1.52 (2H, m), 1.51 (6H, s)

化合物406 (MP: 190-191) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 150.8, 150.6, 140.2, 137.7, 133.9, 131.8, 125.6, 124.4, 114.8, 56.8, 31.3, 29, 25.2, 24.8

^1H : 9.64 (1H, s), 8.12 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 8.04 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.84 (2H, m d, $J = 8.5$ Hz), 7.69 (2H, m d, $J = 8.5$ Hz), 5.82 (2H, s), 3.81 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.59 (2H, m), 1.57 (1H, m), 1.29 (2H, q br, $J = 12.8$ Hz), 1.11 (1H, q br, $J = 12.9$ Hz)

化合物407 (MP: 吸濕的) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 157.9, 149.3, 137.4, 136.4, 131.1, 130.3, 118.4, 116, 115.2, 111.4, 62.6, 57.2, 54.5, 48.5, 39.7, 31.6, 28.9, 25.1, 24.8

^1H : 12.09 (1H, br), 9.87 (2H, s), 8.97 (1H, s), 8.37 (1H, s), 7.62 (1H, br), 7.55 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.41 (1H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.01 (1H, d d, $J = 2.0, 8.2$ Hz), 4.50 (2H, m), 3.90

(1H, m), 3.70 (4H, br), 3.67 (2H, m), 3.50 (4H, m), 2.96 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.31 (2H, m), 1.14 (1H, m)

化合物408 (MP: 124-127) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 158, 148.8, 137.3, 135.4, 130.3, 130.2, 118.4, 116.3, 115.5, 111.4, 63.2, 62.6, 57.2, 54.7, 51.7, 31.6, 28.8, 25, 24.8

¹H: 11.80 (1H, s), 9.21 (1H, s br), 8.48 (1H, s), 7.67 (1H, br), 7.58 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.42 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.02 (1H, d d, J = 1.5, 8.1 Hz), 4.55 (2H, m), 3.96 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 3.90 (1H, m), 3.87 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 3.58 (2H, m), 3.51 (2H, d br, J = 12.1 Hz), 3.22 (2H, m), 2.97 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.59 (3H, m), 1.32 (2H, m), 1.12 (1H, m)

化合物409 (MP: 183) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 164, 151.1, 140.7, 137.8, 133.3, 132.4, 130.6, 128.8, 128.7, 128.7, 127.1, 124.8, 114.4, 59.5, 53.1, 50.8, 31.6, 25.8

¹H: 8.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.49-7.40 (5H, m), 7.39 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.26 (1H, m t, J = 7.5 Hz), 4.05 (2H, s), 4.05 (1H, m), 3.26 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 2.94 (3H, s), 2.81 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 2.08 (2H, d q, J = 3.3, 12.7 Hz), 1.90 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物410 (MP: 177-178) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 149.6, 137.6, 136.6, 131.4, 129.9, 129.6, 129.5,

129, 128.8, 128.5, 125.3, 115.6, 58.7, 52.3, 50.2, 31.6, 24.6

¹H: 11.36 (1H, s br), 9.0 (1H, s), 8.31 (1H, s), 7.92 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.64 (2H, m), 7.50-7.43 (5H, m), 7.37 (1H, m t, J = 7.7 Hz), 4.26 (2H, d, J = 5.0 Hz), 4.20 (1H, m), 3.39 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.09 (2H, q br, J = 12.0 Hz), 2.97 (3H, s), 2.43 (2H, d q, J = 3.3, 13.0 Hz), 1.95 (2H, d br, J = 13.0 Hz)

化合物411 (MP: 191-192) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 151.2, 140.7, 137.8, 133.3, 131.3, 129.7, 129, 128.7, 127.2, 124.8, 114.4, 59.2, 52.2, 50.7, 39.8, 31.8, 25.2

¹H: 9.42 (1H, s br), 8.14 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (2H, m d, J = 8.3 Hz), 7.50 (5H, m), 7.39 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.26 (1H, m t, J = 7.3 Hz), 4.29 (1H, m), 4.29 (2H, s br), 3.44 (2H, m, J = 12.3 Hz), 3.13 (2H, m), 2.93 (3H, s), 2.35 (3H, s), 2.12 (2H, q br, J = 13.5 Hz), 2.0 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

化合物412 (MP: 178) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 175.7, 171.4, 151.1, 140.7, 137.7, 135.7, 133.4, 129.7, 128.7, 128.5, 127.9, 127.2, 124.8, 114.4, 72, 60.8, 54.5, 51.7, 43.4, 31.6, 27.2

¹H: 8.13 (1H, s br), 8.00 (1H, s, br), 7.84 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.43-7.30 (7H, m), 7.26 (1H, t, J = 7.5 Hz), 3.93 (1H, m), 3.73 (2H, s), 3.07 (2H, d br, J = 11.0 Hz), 2.93 (3H, s), 2.68 (2H, d br, J = 15.3 Hz), 2.58 (2H, d, J = 15.3 Hz), 2.37

(2H, t br, $J = 12.5$ Hz), 1.92 (2H, q br, $J = 12.5$ Hz), 1.80 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物413 (MP: 195)。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 173.4, 151, 140.6, 137.7, 137.3, 133.4, 129.2, 128.6, 128.3, 127.3, 127.1, 124.7, 114.4, 72.1, 61.4, 55, 52, 31.5, 27.8

^1H : 8.12 (1H, s), 8.0 (1H, s), 7.84 (2H, d br, $J = 7.7$ Hz), 7.38 (2H, t, $J = 7.6$ Hz), 7.35-7.28 (5H, m), 7.25 (1H, m t, $J = 7.5$ Hz), 4.24 (2H, s), 3.87 (1H, m), 3.58 (2H, s), 2.96 (2H, m), 2.94 (3H, s), 2.15 (2H, t br, $J = 11.0$ Hz), 1.87 (2H, q br, $J = 12.3$ Hz), 1.76 (2H, d br, $J = 11.0$ Hz)

化合物414 (MP: 192)。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 151, 140.6, 137.7, 136.8, 133.4, 129.3, 128.6, 128.4, 127.5, 127.1, 124.8, 114.4, 61.2, 54.9, 51.8, 31.5, 27.6

^1H : 8.12 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 8.0 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.85 (2H, m d, $J = 8.3$ Hz), 7.39 (2H, t, $J = 7.5$ Hz), 7.36-7.27 (5H, m), 7.23 (1H, m t, $J = 7.4$ Hz), 3.89 (1H, m), 3.62 (2H, s), 2.99 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 2.94 (3H, s), 2.21 (2H, t br, $J = 12.0$ Hz), 1.91 (2H, d q, $J = 3.3, 12.2$ Hz), 1.77 (2H, d br, $J = 11.8$ Hz)

化合物415 (MP: 175)。NMR溶劑： CDCl_3

^{13}C : 151, 140.5, 138.3, 137.4, 137.3, 134.5, 128.4, 128.2, 127.6, 127.4, 125.4, 115, 71.9, 69.8, 57.7, 43.3, 31.4, 30.2, 30, 25.4, 25.2

^1H : 7.95 (2H, m, $J = 8.0$ Hz), 7.93 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.78 (2H, m, $J = 8.0$ Hz), 7.62 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.34-7.21 (5H, m), 4.46 (2H, s), 3.95 (1H, m), 3.46 (1H, m), 3.29 (2H, m), 3.0 (3H, s), 2.96 (2H, m), 1.90 (2H, m), 1.87 (4H, m), 1.80 (2H, m), 1.71 (1H, d br, $J = 13.3$ Hz), 1.60 (2H, d q, $J = 3.5, 13.5$ Hz), 1.38 (2H, t q, $J = 3.5, 13.3$ Hz), 1.14 (1H, t q, $J = 3.5, 13.2$ Hz)

化合物416 (MP: 176-177) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.2, 148.6, 146.7, 139.3, 138, 137.3, 132.4, 129.1, 129, 128.3, 127.2, 123.6, 113.9, 62.8, 55.9, 52.5, 31.7, 28.9

^1H : 9.0 (1H, d d, $J = 0.7, 2.2$ Hz), 8.53 (1H, d d, $J = 1.7, 4.9$ Hz), 8.12 (1H, d t, $J = 1.7, 7.9$ Hz), 7.94 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.58 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.35 (1H, m), 7.34-7.24 (5H, m), 4.02 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.11 (2H, t br, $J = 12.0$ Hz), 1.94 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 1.79 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物417 (MP: 112-113) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.4, 148.5, 146.6, 139.2, 137.3, 132.4, 129, 123.6, 114, 59.4, 31.2, 28.9, 24.3

^1H : 9.01 (1H, d, $J = 1.7$ Hz), 8.53 (1H, d d, $J = 1.5, 4.8$ Hz), 8.12 (1H, t d, $J = 2.0, 7.9$ Hz), 7.96 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.59 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.34 (1H, d d, $J = 4.8, 7.9$ Hz), 4.44 (1H, qt, $J = 8.2$ Hz), 3.0 (3H, s), 1.96 (2H, m), 1.77 (2H, m),

1.70 (2H, m), 1.63 (2H, m)

化合物418 (MP: 138-140) ° NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 159.9, 151.5, 142.1, 138, 136.9, 134.3, 129.7, 129.1, 128.3, 127.2, 117.5, 113.7, 113.4, 110.1, 62.8, 55.8, 55.3, 52.5, 31.6, 28.9

¹H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d d, J = 1.4, 2.4 Hz), 7.38-7.24 (6H, m), 7.31 (1H, t, J = 7.6 Hz), 6.86 (1H, d d d, J = 1.2, 2.5, 7.9 Hz), 4.02 (1H, m), 3.88 (3H, s), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.3, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物419 (MP: 190-191) ° NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 159.2, 151.6, 142.1, 138, 136.8, 129.1, 128.3, 127.2, 126.4, 125.8, 114.1, 112, 62.8, 55.8, 55.3, 52.5, 31.6, 28.9

¹H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 7.39 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.23 (5H, m), 6.85 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 4.03 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.6, 12.0 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 13.0 Hz)

化合物420 (MP: 190-191) ° NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 158.4, 151.6, 142.1, 138, 136.9, 136.8, 129.1, 128.6, 128.3, 128, 127.5, 127.2, 126.4, 126, 115, 112.1, 70, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

^1H : 7.89 (1H, s), 7.72 (2H, m d, $J = 8.6$ Hz), 7.45 (2H, d, $J = 7.5$ Hz), 7.40 (2H, m), 7.38 (1H, s), 7.37-7.23 (6H, m), 7.02 (2H, m d, $J = 8.6$ Hz), 5.10 (2H, s), 4.01 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.01 (3H, s), 2.99 (2H, m), 2.09 (2H, t br, $J = 10.7$ Hz), 1.93 (2H, q br, $J = 12.5$ Hz), 1.78 (2H, d br, $J = 12.5$ Hz)

化合物421 (MP: 165-166) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.9, 137.6, 137.6, 136.9, 136, 132.8, 125.9, 122.6, 115.3, 59.4, 31.2, 28.9, 24.3

^1H : 8.67 (1H, t br, $J = 1.5$ Hz), 8.13 (1H, d d d, $J = 1.7$, 6.5 Hz), 7.98 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.71 (1H, t d, $J = 1.2$, 8.0 Hz), 7.59 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.31 (1H, d d, $J = 6.5$, 8.0 Hz), 4.40 (1H, qt, $J = 8.0$ Hz), 3.0 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.77 (2H, m), 1.69 (2H, m), 1.63 (2H, m)

化合物422 (MP: 197) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 150.6, 139.0, 138.8, 138.4, 138.2, 127.5, 125.2, 116.8, 56.8, 43.6, 31.3, 29.0, 25.1, 24.8

^1H : 8.26 (1H, s), 8.20 (1H, s), 8.11 (2H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.93 (2H, d, $J = 8.5$ Hz), 3.81 (1H, m), 3.22 (3H, s), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q br, $J = 12.7$ Hz), 1.12 (1H, m)

化合物423 (MP: 179) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 164.1, 150.9, 140.1, 138.5, 137.8, 133.6, 133.5, 128.8, 128.7, 128.2, 127, 127, 125.4, 123.2, 114.9, 61.9, 55.5,

52.2, 31.5, 28.2

¹H: 11.20 (1H, br), 9.15 (1H, br), 8.23 (1H, br), 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.95 (1H, m d, J = 7.8 Hz), 7.62 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.36-7.21 (5H, m), 3.83 (1H, m), 3.47 (2H, s), 2.95 (3H, s), 2.90 (2H, d br, J = 11.2 Hz), 2.0 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.83 (2H, d q, J = 3.3, 11.9 Hz), 1.73 (2H, d br, J = 12.3 Hz)

化合物424 (MP: 176) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 163.8, 149.2, 137.8, 136.1, 133.6, 130, 129.2, 127.8, 126.6, 124, 116.1, 57.1, 31.5, 28.8, 25.1, 24.8

¹H: 11.31 (1H, br), 9.0 (1H, s), 8.37 (1H, s), 8.27 (1H, t br, J = 1.5 Hz), 8.0 (1H, t d, J = 1.5, 7.7 Hz), 7.73 (1H, t d, J = 1.4, 7.8 Hz), 7.56 (1H, t, J = 7.7 Hz), 3.86 (1H, m), 2.98 (3H, s), 1.81 (4H, m), 1.60 (3H, m), 1.32 (2H, q br, J = 12.8 Hz), 1.13 (1H, q br, J = 13.0 Hz)

化合物425 (MP: 140-142) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.1, 144.6, 140.2, 137.2, 137, 133.6, 132.1, 129, 127.8, 127.1, 122.9, 121.2, 114.7, 112.5, 57.6, 47.2, 31.5, 30, 25.4, 25.2

¹H: 8.61 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.50 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.89 (1H, d d, J = 2.2, 9.0 Hz), 7.43 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42-7.29 (5H, m), 6.89 (1H, d, J = 9.0 Hz), 4.61 (2H, d, J = 5.7 Hz), 3.96 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.60 (2H, m), 1.39 (2H,

q br, $J = 13.0$ Hz), 1.13 (1H, m, $J = 3.5, 13.2$ Hz)

化合物426 (MP: 261) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 155.4, 151.1, 141.6, 137.1, 136.2, 130, 128.8, 128.4, 127.7, 127.3, 126.8, 118.5, 112.6, 108.6, 106.4, 57.6, 44.5, 31.5, 29.9, 25.4, 25.2

^1H : 9.87 (1H, s), 8.17 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.74 (1H, d, $J = 1.4$ Hz), 7.45 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.39 (1H, d d, $J = 1.4, 8.2$ Hz), 7.36-7.25 (5H, m), 6.87 (1H, d, $J = 8.2$ Hz), 5.10 (2H, s), 3.97 (1H, m), 3.02 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.70 (1H, m), 1.58 (2H, q br, $J = 13.0$ Hz), 1.38 (2H, q br, $J = 13.0$ Hz), 1.13 (1H, q br, $J = 12.8$ Hz)

化合物427 (MP: 204-205) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.6 (d d, $J = 13.0, 247.5$ Hz), 151.2, 149.8 (d d, $J = 12.0, 248.0$ Hz), 140.4, 138, 137, 130.2 (d d, $J = 4.0, 6.5$ Hz), 129.1, 128.3, 127.2, 121.0 (d d, $J = 3.5, 6.2$ Hz), 117.5 (d, $J = 17.5$ Hz), 114.2 (d, $J = 19.0$ Hz), 113.5, 62.8, 55.9, 52.5, 31.7, 28.9

^1H : 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.61 (1H, d d d, $J = 2.2, 7.2, 11.5$ Hz), 7.50 (1H, m), 7.46 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.37-7.25 (5H, m), 7.18 (1H, d t, $J = 8.4, 10.2$ Hz), 4.02 (1H, m), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br, $J = 12.0$ Hz), 1.93 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 1.78 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物428 (MP: 222-223) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.3, 141.2, 138, 137, 133.1, 131.5, 129.1, 128.8, 128.3, 127.2, 126.4, 113.4, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

^1H : 7.91 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.49 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.73 (2H, m d, $J = 8.5$ Hz), 7.37 (2H, m d, $J = 8.5$ Hz), 7.35-7.25 (5H, m), 4.02 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, $J = 11.5$ Hz), 1.93 (2H, $J = 3.5$, 12.0 Hz), 1.78 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物429 (MP: 203-204) • NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.4, 150.5, 141.2, 138, 137, 130.4, 129.1, 128.3, 127.2, 126.6, 119.7, 115.9, 113.2, 62.8, 55.9, 52.5, 31.6, 28.9

^1H : 7.91 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.79 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 7.47 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.37-7.25 (5H, m), 7.16 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 6.54 (1H, t, $J = 74.0$ Hz), 4.03 (1H, m), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br, $J = 12.0$ Hz), 1.93 (2H, d q, $J = 3.5$, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, $J = 12.5$ Hz)

化合物430 (MP: 211-212) • NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.3 (d, $J = 247.0$ Hz), 151.4, 141.4, 138, 136.9, 129.2 (d, $J = 3.5$ Hz), 129.1, 128.3, 127.2, 126.8 (d, $J = 8.0$ Hz), 115.6 (d, $J = 21.5$ Hz), 112.9, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

^1H : 7.90 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.76 (2H, m, $J = 5.3$, 8.8 Hz), 7.45 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.37-7.25 (5H, m), 7.10 (2H, m t, $J = 8.9$ Hz), 4.03 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, $J = 12.0$ Hz), 1.93 (2H, d q, $J = 3.5$,

12.0 Hz), 1.78 (2H, d br, $J = 10.5$ Hz)

化合物431 (MP: 190-191) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.3, 151.2, 148.5, 146.7, 139.2, 137.2, 132.4, 129, 128.7, 123.6, 114, 113.7, 103.8, 56.2, 55.8, 52.1, 48.9, 31.5, 29.1

^1H : 9.0 (1H, d, $J = 1.8$ Hz), 8.53 (1H, d d, $J = 1.5, 4.8$ Hz), 8.11 (1H, t d, $J = 1.8, 7.9$ Hz), 7.92 (1H, d, $J = 1.0$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 1.0$ Hz), 7.34 (1H, d d, $J = 4.8, 7.9$ Hz), 7.22 (1H, t, $J = 8.3$ Hz), 6.57 (2H, d, $J = 8.3$ Hz), 3.91 (1H, m), 3.81 (6H, s), 3.71 (2H, s), 3.09 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (2H, t br, $J = 11.6$ Hz), 1.94 (2H, d q, $J = 3.2, 12.0$ Hz), 1.72 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物432 (MP: 190 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 150.4, 139.1, 137.9, 137.7, 133.4, 127.8, 125, 116.3, 63.8, 56.7, 43.1, 32.8, 31.2, 29, 25.1, 24.8

^1H : 8.24 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 8.19 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 8.09 (2H, m d, $J = 8.5$ Hz), 7.73 (2H, m d, $J = 8.5$ Hz), 4.68 (1H, d, $J = 4.0$ Hz), 3.81 (1H, m br), 3.51 (1H, m), 3.16 (2H, m), 2.93 (3H, s), 2.71 (2H, m), 1.78 (4H, m), 1.73 (2H, m), 1.58 (3H, m), 1.42 (2H, m), 1.30 (2H, q br, $J = 12.8$ Hz), 1.12 (1H, q br, $J = 12.5$ Hz)

化合物433 (MP: 161-162) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.6, 149.1, 148.6, 142.1, 138, 136.7, 129.1, 128.3, 127.2, 126.1, 117.4, 112.3, 111.3, 108.4, 62.8, 55.9,

55.9, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

^1H : 7.90 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.42 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.40 (1H, d, $J = 1.9$ Hz), 7.37-7.24 (5H, m), 7.30 (1H, d d, $J = 1.9, 8.3$ Hz), 6.91 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 4.03 (1H, m), 3.97 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br, $J = 11.5$ Hz), 1.94 (2H, d q, $J = 3.2, 11.8$ Hz), 1.79 (2H, d br, $J = 11.8$ Hz)

化合物434 (MP: 126-128) $\circ$ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.7, 142.2, 136.8, 133, 128.7, 127.5, 125.1, 113.1, 56.2, 42.2, 35.3, 31, 25.9, 25.4, 24.4, 23.7, 19.9

^1H : 7.88 (1H, s), 7.81 (2H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.46 (1H, s), 7.41 (2H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.30 (1H, t, $J = 7.4$ Hz), 4.19 (1H, s br), 3.91 (1H, s br), 3.14 (1H, t, $J = 12.7$ Hz), 2.10-1.20 (13H, m)

化合物435 (MP: 127-128) $\circ$ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.2, 145.3, 140.4, 139.1, 137, 130, 123.4, 123.2, 118.3, 112.6, 57.5, 42.5, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

^1H : 8.18 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.85 (1H, d d, $J = 2.2, 8.8$ Hz), 7.43 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.06 (1H, d, $J = 8.8$ Hz), 3.95 (1H, m), 3.0 (3H, s), 2.93 (6H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.70 (1H, d br, $J = 13.0$ Hz), 1.58 (2H, d q, $J = 3.4, 12.2$ Hz), 1.38 (2H, t q, $J = 3.0, 13.0$ Hz), 1.13 (1H, t q, $J = 3.5, 13.2$ Hz)

化合物436 (MP: 215-217) $\circ$ NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 166.6, 145.3, 144.6, 134.6, 130, 128.6, 121.5, 114.3, 81.7, 78.7, 61.7, 22.5

¹H: 13.38 (1H, br), 8.70 (1H, s), 8.24 (1H, d, J = 9.0 Hz), 8.19 (1H, d, J = 9.0 Hz), 5.43 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.58 (6H, s)

化合物437 (MP: 181) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 163.6, 144.4, 144.3, 142.8, 135.9, 132.7, 129.1, 128.4, 128.4, 127.3, 119.5, 118.7, 81.6, 78.7, 77.1, 61.8, 22.2

¹H: 12.06 (1H, br), 8.39 (1H, s), 8.11 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.87 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.49 (2H, d, J = 7.0 Hz), 7.41 (3H, m), 5.29 (2H, s), 4.98 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.57 (6H, s)

化合物438 (MP: 194) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 155.6, 151.2, 150.8, 139.6, 137.7, 129.3, 126.7, 125.6, 114, 112.5, 112.4, 56.8, 56, 31.4, 29, 25.2, 24.9

¹H: 16.04 (1H, br), 8.58 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.04 (1H, d d, J = 2.2, 8.9 Hz), 7.31 (1H, d, J = 8.9 Hz), 3.99 (3H, s), 3.82 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.11 (1H, q, J = 13.0 Hz)

化合物439 (MP: 226-228 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 154.5, 151.9, 150.9, 139.9, 137.6, 129.1, 125.4, 125.2, 116.7, 113.4, 110.8, 56.8, 31.3, 29, 25.2, 24.9

¹H: 16.0 (1H, br), 11.14 (1H, br), 8.48 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.95 (1H, s br), 7.87 (1H, d d,

$J = 2.2, 8.5 \text{ Hz}$), 7.09 (1H, d, $J = 8.5 \text{ Hz}$), 3.82 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.57 (3H, m), 1.30 (2H, q, $J = 12.5 \text{ Hz}$), 1.11 (1H, q, $J = 13.0 \text{ Hz}$)

化合物440 (MP: 104-105) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 163.3, 144.4, 144.2, 142.9, 133.2, 127.4, 119.3, 118.1, 81.6, 78.7, 61.8, 22.2

^1H : 11.56 (1H, br), 9.27 (1H, s br), 8.39 (1H, s), 8.10 (1H, d, $J = 9.1 \text{ Hz}$), 7.89 (1H, d, $J = 9.1 \text{ Hz}$), 5.29 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.57 (6H, s)

化合物441 (MP: 169-170) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 152.2, 151.2, 139.9, 139.6, 138, 137.2, 130.7, 129.1, 128.3, 127.2, 126, 122.3, 113.8, 113.3, 62.8, 56.6, 55.9, 52.5, 31.7, 28.8

^1H : 8.24 (1H, d, $J = 2.2 \text{ Hz}$), 8.0 (1H, d d, $J = 2.2, 8.8 \text{ Hz}$), 7.91 (1H, d, $J = 1.3 \text{ Hz}$), 7.49 (1H, d, $J = 1.3 \text{ Hz}$), 7.37-7.25 (5H, m), 7.13 (1H, d, $J = 8.8 \text{ Hz}$), 4.03 (1H, m), 4.0 (3H, s), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br, $J = 11.5 \text{ Hz}$), 1.93 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0 \text{ Hz}$), 1.79 (2H, d br, $J = 12.0 \text{ Hz}$)

化合物442 (MP: 162) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.9 (d, $J = 246.0 \text{ Hz}$), 151.4, 147.8 (d, $J = 11.2 \text{ Hz}$), 141.5, 138, 136.8, 129.6 (d, $J = 4.0 \text{ Hz}$), 129.1, 128.3, 127.2, 117.3 (d, $J = 7.0 \text{ Hz}$), 116.2 (d, $J = 18.5 \text{ Hz}$), 113.1, 110.4 (d, $J = 1.7 \text{ Hz}$), 62.8, 56.2, 55.9, 52.5, 31.7, 28.9

^1H : 7.90 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.50 (1H, d d, $J = 1.8, 8.3$ Hz), 7.46 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.37-7.27 (5H, m), 7.24 (1H, m), 7.09 (1H, d d, $J = 8.5, 11.0$ Hz), 4.03 (1H, m), 3.97 (3H, s), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.10 (2H, t br, $J = 11.8$ Hz), 1.94 (2H, d q, $J = 3.0, 12.0$ Hz), 1.79 (2H, d br, $J = 11.5$ Hz)

化合物443 (MP: 188-189) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 152.5 (d, $J = 245.0$ Hz), 151.4, 147.1 (d, $J = 11.0$ Hz), 141.1 (d, $J = 2.5$ Hz), 138, 136.9, 129.1, 128.3, 127.2, 126.5 (d, $J = 7.2$ Hz), 120.9 (d, $J = 3.5$ Hz), 113.5 (d, $J = 2.5$ Hz), 113.1 (d, $J = 19.7$ Hz), 112.6, 62.8, 56.3, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

^1H : 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.53 (1H, m), 7.50 (1H, d d, $J = 2.5, 8.5$ Hz), 7.40 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.37-7.23 (5H, m), 6.99 (1H, t, $J = 8.4$ Hz), 4.02 (1H, m), 3.92 (3H, s), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, $J = 11.8$ Hz), 1.93 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 1.78 (2H, m)

化合物444 (MP: 168) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 157.6, 153.8, 151.1, 140.6, 137.5, 137.1, 128.5, 127.9, 127.8, 126.3, 126.1, 114.9, 113.2, 78.8, 69.2, 55.1, 43, 42.2, 31.7, 28.1(2 sig.)

^1H : 8.09 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.88 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.77 (2H, m d, $J = 8.7$ Hz), 7.46 (2H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.40 (2H, t, $J = 7.4$ Hz), 7.33 (1H, t, $J = 7.3$ Hz), 7.03 (2H, m d, $J = 8.7$

Hz), 5.12 (2H, s), 4.03 (3H, m), 2.92 (3H, s), 2.79 (2H, br),
1.76 (2H, d br, $J = 11.5$ Hz), 1.66 (2H, d q, $J = 4.3, 12.1$ Hz),
1.41 (9H, s)

化合物445 (MP: 170-171) ° NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 160.4, 151.1, 140, 137.1, 131.1, 130.3, 126.5,
116.3, 113, 111.6, 102, 57.6, 56.2, 31.4, 30, 25.4, 25.2

^1H : 7.98 (1H, d d, $J = 2.2, 8.5$ Hz), 7.97 (1H, d, $J = 2.2$
Hz), 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.44 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.02
(1H, d, $J = 8.5$ Hz), 3.96 (3H, s), 3.95 (1H, m), 3.0 (3H, s),
1.87 (4H, m), 1.71 (1H, m), 1.58 (2H, d q, $J = 3.5, 12.5$ Hz),
1.38 (2H, t q, $J = 3.0, 13.0$ Hz), 1.13 (1H, t q, $J = 3.5, 13$ Hz)

化合物446 (MP: 176-177) ° NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 160.5, 151.2, 140.1, 138, 137.1, 131.1, 130.3,
129.1, 128.3, 127.2, 126.4, 116.3, 112.9, 111.6, 102, 62.8,
56.2, 55.9, 52.5, 31.7, 28.9

^1H : 7.98 (1H, d d, $J = 2.2, 8.5$ Hz), 7.97 (1H, d, $J = 2.2$
Hz), 7.90 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.44 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.37-
7.23 (5H, m), 7.01 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 4.01 (1H, m), 3.96
(3H, s), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.10 (2H, t
br, $J = 12.0$ Hz), 1.94 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 1.79 (2H, d
br, $J = 12.0$ Hz)

化合物447 (MP: 103-105) ° NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.5, 142.3, 141.4, 140.3, 136.8, 128.9, 119.4,
115.4, 112.4, 112, 57.5, 43.6, 31.3, 30, 25.4, 25.2

^1H : 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.38 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.22 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 7.15 (1H, d d, $J = 2.2, 8.1$ Hz), 7.03 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 4.03 (2H, br), 3.94 (1H, m), 2.99 (3H, s), 2.69 (6H, s), 1.85 (4H, m), 1.70 (1H, d br, $J = 14.0$ Hz), 1.58 (2H, d q, $J = 3.5, 12.5$ Hz), 1.37 (2H, m q, $J = 13.0$ Hz), 1.13 (1H, m q, $J = 13.0$ Hz)

化合物448 (MP: 180-182) · NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 155.1, 150.2, 137.9, 137.6, 137.5, 136.2, 132.5, 126, 122.7, 115, 62.1, 46.4, 43.3, 14.6

^1H : 8.68 (1H, s br), 8.15 (1H, d, $J = 6.3$ Hz), 7.94 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.71 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.33 (1H, d d, $J = 6.3, 8.0$ Hz), 4.20 (2H, q, $J = 7.2$ Hz), 3.64 (8H, m), 1.30 (3H, t, $J = 7.2$ Hz)

化合物449 (MP: 110-112) · NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.8, 137.6, 137.6, 136.9, 136, 132.7, 125.9, 122.7, 115.3, 50.6, 36.4, 29.3, 19.8, 13.7

^1H : 8.67 (1H, t, $J = 1.5$ Hz), 8.14 (1H, d d d, $J = 1.0, 1.6, 6.4$ Hz), 7.94 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.71 (1H, t d, $J = 1.3, 8.1$ Hz), 7.58 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.32 (1H, d d, $J = 6.4, 8.1$ Hz), 3.46 (2H, t, $J = 7.6$ Hz), 3.13 (3H, s), 1.68 (2H, m), 1.37 (2H, m), 0.97 (3H, t, $J = 7.4$ Hz)

化合物450 (MP: 122-123) · NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.1, 145.9, 141.4, 137.6, 137.2, 126.2, 113.2, 112.6, 110.7, 110.6, 55.7, 55.4, 45.4, 31.4, 29.5

¹H: 8.03 (1H, s), 7.68 (1H, s), 7.14 (1H, d, J = 1.8 Hz), 7.0 (1H, d d, J = 1.8, 8.2 Hz), 6.79 (1H, d, J = 8.2 Hz), 4.73 (2H, s br), 3.88 (1H, m), 3.76 (3H, s), 3.01 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 2.93 (3H, s), 2.47 (2H, m), 1.67 (4H, m)

化合物451 (MP: 170-172) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 157.6, 150.2, 138.3, 137.3, 131.4, 129.7, 129.7, 129, 126.7, 121.6, 115.7, 113.3, 59.1, 52.3, 50.6, 31.9, 25

¹H: 9.62 (2H, m br), 8.67 (1H, s), 8.0 (1H, s), 7.65 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.55 (2H, m), 7.49 (3H, m), 6.82 (2H, d, J = 8.2 Hz), 4.32 (2H, m), 4.18 (1H, m), 3.45 (2H, m), 3.16 (2H, m), 2.94 (3H, s), 2.19 (2H, q br, J = 12.0 Hz), 2.0 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物452 (MP: 74-76) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.3, 137.6, 137.3, 136.9, 136, 132.7, 125.9, 122.8, 115.1, 42.8, 13.2

¹H: 8.67 (1H, t br, J = 1.3 Hz), 8.14 (1H, d, J = 6.4 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.32 (1H, d d, J = 6.4, 8.0 Hz), 3.49 (4H, q, J = 7.2 Hz), 1.31 (6H, t, J = 7.2 Hz)

化合物453 (MP: 130-132) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 149.6, 147.8, 145.7, 142.8, 138.2, 137.1, 132.2, 129.9, 129, 127.7, 126.3, 124, 115.6, 39.6

¹H: 8.87 (1H, d d, J = 0.8, 2.2 Hz), 8.43 (1H, d d, J = 1.7, 4.9 Hz), 8.04 (1H, t d, J = 1.9, 8.0 Hz), 7.81 (1H, d, J =

1.3 Hz), 7.61 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.45-7.28 (6H, m), 3.43 (3H, s)

化合物454 (MP: 170-172) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.2 (d, $J = 240.0$ Hz), 151.1, 144.0 (d, $J = 12.2$ Hz), 140.0 (d, $J = 2.5$ Hz), 137.6, 131.4, 129.7 (2 sig.), 128.9, 125.2 (d, $J = 7.0$ Hz), 121.1 (d, $J = 2.5$ Hz), 117.9 (d, $J = 3.0$ Hz), 113.5, 112.5 (d, $J = 20.0$ Hz), 59.0, 52.1, 50.6, 31.7, 25.1

^1H : 9.91 (1H, s), 9.57 (1H, m), 8.10 (1H, s), 7.90 (1H, s), 7.58 (1H, m), 7.55 (2H, m), 7.48 (4H, m), 6.96 (1H, t, $J = 8.8$ Hz), 4.31 (2H, s br), 4.16 (1H, m), 3.45 (2H, m), 3.15 (2H, m), 2.92 (3H, s), 2.17 (2H, q, $J = 12.5$ Hz), 1.98 (2H, d br, $J = 12.5$ Hz)

化合物455 (MP: 171-173) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 145.8, 137.7, 137.2, 136.8, 136.1, 132.6, 126, 122.7, 114.3, 81, 80.3, 62.1, 22.8

^1H : 8.69 (1H, t br, $J = 1.5$ Hz), 8.14 (1H, d d d, $J = 1.0, 1.5, 6.4$ Hz), 7.96 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.70 (1H, t d, $J = 1.2, 8.2$ Hz), 7.63 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.31 (1H, d d, $J = 6.4, 8.2$ Hz), 5.12 (2H, s), 3.90 (2H, d), 1.62 (6H, s)

化合物456 (MP: 181-182) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 149.4, 142.6, 138.3, 137.1, 135.2, 134.6, 132.4, 129.9, 127.7, 126.6, 126.2, 121.1, 117.1, 39.6

^1H : 8.50 (1H, t br, $J = 1.5$ Hz), 8.08 (1H, d d d, $J = 1.0,$

1.8, 6.4 Hz), 7.96 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.61 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.60 (1H, m), 7.38 (1H, m), 7.50-7.29 (5H, m), 3.43 (3H, s)

化合物457 (MP: 179 (分解))。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 151.4, 150.6, 137.9, 137.7, 137, 131.7, 131.4, 129.7, 129.1, 128.9, 123.9, 121, 119.6, 114.7, 59, 52.2, 50.5, 31.9, 25

^1H : 11.13 (1H, s br), 9.59 (1H, s), 8.39 (1H, s), 8.33 (1H, d, $J = 2.0$ Hz), 8.14 (1H, s), 8.02 (1H, d d, $J = 2.0, 8.6$ Hz), 7.55 (2H, m), 7.49 (3H, m), 7.19 (1H, d, $J = 8.6$ Hz), 4.32 (2H, d, $J = 4.9$ Hz), 4.18 (1H, m), 3.46 (2H, d br, $J = 11.5$ Hz), 3.16 (2H, m), 2.93 (3H, s), 2.18 (2H, q br, $J = 12.5$ Hz), 1.99 (2H, d br, $J = 12.3$ Hz)

化合物458 (MP: 163-164)。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 148.1, 147.7, 146.1, 138.3, 136.8, 131.9, 129.1, 123.9, 113.6, 50, 32.2, 25.1, 24.8

^1H : 9.02 (1H, d d, $J = 0.8, 2.2$ Hz), 8.46 (1H, d d, $J = 1.7, 4.7$ Hz), 8.38 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 8.33 (1H, d br, $J = 7.3$ Hz), 8.30 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 8.15 (1H, t d, $J = 1.9, 7.9$ Hz), 7.42 (1H, d d d, $J = 0.8, 4.7, 7.9$ Hz), 3.63 (1H, m), 1.90 (2H, m), 1.75 (2H, m), 1.61 (1H, d br, $J = 12.7$ Hz), 1.32 (4H, m), 1.14 (1H, m)

化合物459 (MP: 199-201)。NMR溶劑： CDCl_3

^{13}C : 150.8, 137.9, 137.6, 137.6, 136.9, 136, 132.7,

129.1, 128.3, 127.2, 125.9, 122.6, 115.3, 62.8, 56, 52.4, 31.7, 28.9

^1H : 8.66 (1H, s br), 8.13 (1H, d, $J = 6.3$ Hz), 7.93 (1H, s br), 7.70 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.58 (1H, s br), 7.30 (6H, m), 3.99 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.10 (2H, t br, $J = 10.9$ Hz), 1.93 (2H, m), 1.78 (2H, d br, $J = 10.9$ Hz)

化合物460 (MP: 148) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 165.8, 147.2, 145.6, 132.6, 131.5, 126.5, 119.6, 116.6, 82.4, 79.6, 62.4, 61.7, 23, 14.3

^1H : 8.91 (1H, d d, $J = 0.8, 1.4$ Hz), 8.17 (1H, d d, $J = 1.4, 8.7$ Hz), 8.12 (1H, d d, $J = 0.8, 8.7$ Hz), 5.53 (2H, s), 4.45 (2H, q, $J = 7.2$ Hz), 3.91 (2H, s), 1.70 (6H, s), 1.44 (3H, t, $J = 7.2$ Hz)

化合物461 (MP: 186) 。 NMR溶劑 : MeOD

^{13}C : 149.5, 138.8, 138.8, 137.7, 136.9, 135, 128.4, 127.1, 116.7, 52.2, 33.8, 26.7, 26.5

^1H : 8.75 (1H, br), 8.36 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 8.25 (1H, m), 8.24 (1H, m), 7.98 (1H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.58 (1H, d d, $J = 6.6, 8.2$ Hz), 3.73 (1H, m), 2.02 (2H, m), 1.87 (2H, m), 1.70 (1H, d br, $J = 13.5$ Hz), 1.45 (2H, m), 1.38 (2H, m), 1.24 (1H, m)

化合物462 (MP: 125 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 167.1, 145.8, 145.4, 135.3, 132.2, 124.9, 119.4, 113.9, 81.7, 78.7, 61.6, 22.5

¹H: 8.63 (1H, s), 8.34 (1H, s br), 8.25 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.01 (1H, d d, J = 1.5, 8.7 Hz), 7.65 (1H, s br), 5.43 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.60 (6H, s)

化合物463 (MP: 181-183) ° NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.2, 148.6, 146.7, 139.4, 137.3, 132.5, 128.9, 123.6, 113.9, 66.9, 54.5, 31.8, 29.5

¹H: 9.00 (1H, d d, J = 1.0, 2.2 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.7, 4.8 Hz), 8.11 (1H, d d d, J = 1.8, 2.3, 7.9 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 1.0, 4.8, 7.9 Hz), 4.29 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.6, 11.5 Hz), 3.50 (2H, d t, J = 2.2, 12.0 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.78 (2H, m)

化合物464 (MP: 143-144) ° NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.6, 148.5, 146.7, 139.3, 136.9, 132.4, 129.1, 123.6, 113.8, 59, 39.5, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

¹H: 9.01 (1H, d, J = 2.3 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.7, 4.8 Hz), 8.12 (1H, t d, J = 2.0, 8.0 Hz), 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 0.8, 4.8, 8.0 Hz), 3.75 (1H, m), 3.44 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.84 (4H, m), 1.66 (3H, m), 1.30 (2H, m, J = 13.0 Hz), 1.26 (3H, t, J = 7.0 Hz), 1.13 (1H, m, J = 13.0 Hz)

化合物465 (MP: 184-185) ° NMR溶劑 : MeOD

¹³C: 151.9, 147.7, 147.1, 140.6, 138.4, 132.6, 131.6, 130.6, 130.4, 123, 118.8, 116.9, 114.7, 114.1, 61.8, 54.7,

52.8, 33.5, 26.8

¹H: 8.64 (1H, s br), 7.82 (1H, s br), 7.58 (2H, m), 7.52 (3H, m), 7.18 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.11 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 6.83 (1H, d, J = 8.3 Hz), 4.36 (2H, s), 4.28 (1H, m), 3.63 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 3.24 (2H, m, J = 12.5 Hz), 3.06 (3H, s), 2.30 (2H, m, J = 13.0 Hz), 2.17 (2H, d br, J = 13.0 Hz)

化合物466 (MP: 221-222) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 151.7 (d, J = 242.5 Hz), 151.0, 146.2 (d, J = 10.8 Hz), 139.6 (d, J = 2.5 Hz), 137.7, 126.7 (d, J = 7.5 Hz), 120.9 (d, J = 3.5 Hz), 114.1 (2 sig.), 112.3 (d, J = 19.7 Hz), 66.3, 56.0, 54.2, 31.6, 29.1

¹H: 8.11 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.98 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.66 (1H, m), 7.63 (1H, m), 7.19 (1H, t, J = 8.7 Hz), 4.09 (1H, m), 3.93 (2H, d d, J = 4.5, 12.3 Hz), 3.85 (3H, s), 3.38 (2H, m), 2.94 (3H, s), 1.85 (2H, d q, J = 4.5, 12.3 Hz), 1.69 (2H, d br, J = 12.3 Hz)

化合物467 (MP: 177) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.5, 142.3, 140, 137, 132.9, 128.7, 128.6, 128.4, 127.6, 126.1, 125.1, 113.1, 60.2, 55.7, 52.6, 33.8, 31.6, 28.9

¹H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.81 (2H, m d, J = 8.2 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.30 (3H, t, J = 7.4 Hz), 7.22 (1H, m), 7.21 (2H, d, J = 7.4 Hz), 4.06 (1H, m), 3.13 (2H, d br, J = 11.8 Hz), 3.04 (3H, s), 2.82 (2H, m),



2.63 (2H, m), 2.17 (2H, d t, $J = 2.4, 12.0$ Hz), 1.96 (2H, d q, $J = 3.6, 12.1$ Hz), 1.85 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物468 (MP: 186-187) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.2, 145.9, 141.4, 137.5, 137.2, 126.2, 113.2, 112.6, 110.7, 110.6, 66.3, 55.3, 54.1, 31.6, 29.1

^1H : 8.05 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.69 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.15 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 7.0 (1H, d d, $J = 2.2, 8.4$ Hz), 6.79 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 4.73 (2H, s), 4.09 (1H, m), 3.93 (2H, d d, $J = 4.3, 11.3$ Hz), 3.77 (3H, s), 3.38 (2H, d t, $J = 1.5, 12.0$ Hz), 2.94 (3H, s), 1.84 (2H, d q, $J = 4.5, 12.3$ Hz), 1.69 (2H, d d, $J = 2.8, 12.3$ Hz)

化合物469 (MP: 111 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 156.7, 153.8, 151.1, 141, 137.3, 126.1, 124.4, 115.3, 112.5, 78.8, 55, 43, 42.2, 31.7, 28.1, 28.1

^1H : 9.46 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.78 (1H, s), 7.64 (2H, d, $J = 8.7$ Hz), 6.77 (2H, d, $J = 8.7$ Hz), 4.03 (3H, m), 2.91 (3H, s), 2.79 (2H, s br), 1.75 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.66 (2H, d q, $J = 4.1, 12.2$ Hz), 1.41 (9H, s)

化合物470 (MP: 217 (分解)) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.8, 137.7, 137.6, 137, 136.1, 132.7, 126, 122.8, 115.3, 66.9, 54.6, 31.9, 29.5

^1H : 8.68 (1H, t, $J = 1.3$ Hz), 8.15 (1H, d d d, $J = 1.0, 1.6, 6.4$ Hz), 7.95 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.73 (1H, t d, $J = 1.2, 8.1$ Hz), 7.60 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.33 (1H, d d, $J = 6.4, 8.1$ Hz),

4.28 (1H, m), 4.10 (2H, d d, $J = 4.5, 11.6$ Hz), 3.51 (2H, d t, $J = 1.8, 12.0$ Hz), 3.04 (3H, s), 1.96 (2H, d q, $J = 4.4, 12.2$ Hz), 1.79 (2H, m)

化合物471 (MP: 205-207) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.1, 137.6, 137.2, 136.9, 136, 132.8, 125.9, 122.8, 115.1, 59.1, 39.6, 31.3, 25.5, 25, 14.9

^1H : 8.67 (1H, t, $J = 1.6$ Hz), 8.14 (1H, d d d, $J = 1.0, 1.6, 6.4$ Hz), 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.72 (1H, t d, $J = 1.3, 8.1$ Hz), 7.55 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.31 (1H, d d, $J = 6.4, 8.1$ Hz), 3.69 (1H, m), 3.42 (2H, q, $J = 7.0$ Hz), 1.84 (4H, m), 1.68 (3H, m), 1.27 (2H, m, $J = 13.0$ Hz), 1.25 (3H, t, $J = 7.0$ Hz), 1.12 (1H, m, $J = 12.8$ Hz)

化合物472 (MP: 153-154) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 162.3 (d, $J = 246.7$ Hz), 151.4, 141.5, 136.9, 129.1 (d, $J = 3.6$ Hz), 126.8 (d, $J = 8.5$ Hz), 115.6 (d, $J = 21.7$ Hz), 112.8, 67, 54.4, 31.8, 29.5

^1H : 7.91 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.76 (2H, m, $J = 5.5, 8.9$ Hz), 7.46 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.10 (2H, m t, $J = 8.8$ Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d, $J = 4.6, 11.6$ Hz), 3.50 (2H, d t, $J = 1.7, 11.9$ Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, $J = 4.6, 12.3$ Hz), 1.77 (2H, d br, $J = 11.0$ Hz)

化合物473 (MP: 146-147) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.2, 150.6 (d d, $J = 13.1, 247.3$ Hz), 149.8 (d d, $J = 12.8, 248.2$ Hz), 140.5, 137.0, 130.1 (d d, $J = 4.0, 6.5$ Hz),

121.1 (d d, $J = 3.8, 6.3$ Hz), 117.5 (d, $J = 17.6$ Hz), 114.2 (d, $J = 18.8$ Hz), 113.4, 67.0, 54.5, 31.8, 29.5

^1H : 7.91 (1H, d, $J = 1.1$ Hz), 7.61 (1H, d d d, $J = 2.1, 7.8, 11.6$ Hz), 7.50 (1H, m), 7.46 (1H, s), 7.18 (1H, d t, $J = 8.5, 10.0$ Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d, $J = 4.5, 11.5$ Hz), 3.50 (2H, d t, $J = 1.3, 12.0$ Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, $J = 4.4, 12.2$ Hz), 1.77 (2H, d br, $J = 13.5$ Hz)

化合物474 (MP: 148-149) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.4, 150.6 (t, $J = 2.7$ Hz), 141.3, 137, 130.3, 126.6, 119.7, 115.9 (t, $J = 260.0$ Hz), 113.1, 67, 54.4, 31.8, 29.5

^1H : 7.92 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.79 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 7.48 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.16 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 6.54 (1H, t, $J = 74.0$ Hz), 4.29 (1H, m), 4.09 (2H, d d, $J = 4.5, 11.5$ Hz), 3.50 (2H, d t, $J = 2.0, 12.0$ Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, $J = 4.5, 12.3$ Hz), 1.78 (2H, m)

化合物475 (MP: 183-184) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.2, 151.6, 142.2, 136.8, 126.4, 125.6, 114.1, 112, 67, 55.3, 54.3, 31.8, 29.5

^1H : 7.91 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.72 (2H, m d, $J = 8.9$ Hz), 7.40 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 6.94 (2H, m d, $J = 8.9$ Hz), 4.28 (1H, m), 4.08 (2H, d d, $J = 4.4, 11.5$ Hz), 3.84 (3H, s), 3.50 (2H, d t, $J = 1.9, 11.8$ Hz), 3.03 (3H, s), 1.94 (2H, d q, $J = 4.5, 12.2$ Hz), 1.76 (2H, m d, $J = 12.3$ Hz)

化合物476 (MP: 130) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 151.5, 149.1, 148.6, 142.2, 136.7, 125.9, 117.4, 112.3, 111.2, 108.4, 67, 55.9, 55.9, 54.4, 31.8, 29.5

¹H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.43 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.39 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.30 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 6.90 (1H, d, J = 8.3 Hz), 4.29 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.3, 11.6 Hz), 3.96 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.50 (2H, d t, J = 1.7, 12.0 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.5, 12.4 Hz), 1.77 (2H, d br, J = 12.3 Hz)

化合物477 (MP: 174-176) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 151.3, 141.3, 137, 133.2, 131.4, 128.9, 126.4, 113.3, 67, 54.4, 31.8, 29.5

¹H: 7.92 (1H, s), 7.73 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.50 (1H, s), 7.37 (2H, d, J = 8.5 Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.5, 11.5 Hz), 3.50 (2H, t, J = 11.5 Hz), 3.03 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.5, 12.2 Hz), 1.77 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

化合物478 (MP: 222-225) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 166.1, 146.3, 145.9, 137.5, 132.5, 125.2, 120, 112.4, 82.5, 79.5, 62.4, 52.1, 28.8, 23

¹H: 8.46 (1H, d d, J = 0.8, 1.5 Hz), 8.10 (1H, d d, J = 0.8, 8.7 Hz), 7.91 (1H, d d, J = 1.5, 8.7 Hz), 6.12 (1H, s), 5.53 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.69 (6H, s), 1.51 (9H, s)

化合物479 (MP: 193-195) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 170.3, 145.7, 145.3, 137.7, 132.4, 124.7, 120.2,

113.2, 82.4, 79.6, 62.3, 39.6, 35.4, 22.9

¹H: 8.30 (1H, s br), 8.14 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.53 (1H, d d, J = 1.4, 8.6 Hz), 5.53 (2H, s), 3.91 (2H, s), 3.16 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.68 (6H, s)

化合物480 (MP: 233-234) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 167, 149.8, 144.5, 134, 131.6, 128.8, 119, 113.1, 59, 31.9, 28.4, 24

¹H: 8.71 (1H, s), 8.25 (1H, s br), 8.18 (1H, d d, J = 1.4, 8.3 Hz), 7.94 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.61 (1H, s br), 4.57 (1H, br), 3.07 (3H, s), 1.93 (2H, m), 1.78 (2H, m), 1.72 (2H, m), 1.54 (2H, m)

化合物481 (MP: 171-172) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 165, 145, 144.6, 143.5, 137.6, 135.9, 129.1, 127.5, 124.9, 120.4, 119.9, 118.7, 82.4, 79.6, 62.7, 22.6

¹H: 8.39 (1H, s), 8.21 (1H, s br), 7.95 (2H, m), 7.69 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.19 (1H, t, J = 7.3 Hz), 5.40 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.69 (6H, s)

化合物482 (MP: 185-186) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 166.4, 156.3, 150.9, 140, 137.6, 128.6, 127.1, 126, 123, 113.6, 112.3, 56.7, 56, 31.3, 29, 25.2, 24.9

¹H: 8.25 (1H, d, J = 2.3 Hz), 8.09 (1H, s br), 7.95 (1H, s br), 7.92 (1H, d d, J = 2.3, 8.7 Hz), 7.67 (1H, s br), 7.56 (1H, s br), 7.16 (1H, d, J = 8.7 Hz), 3.90 (3H, s), 3.81 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.56 (2H, m), 1.30

(2H, m, $J = 13.0$ Hz), 1.11 (1H, m)

化合物483 (MP: 117) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.6, 145.3, 133.2, 129.3, 125.2, 119.8, 113.6, 67.1, 54.6, 29.9 (2 sig.)

^1H : 8.10 (1H, m d, $J = 8.4$ Hz), 7.99 (1H, m d, $J = 8.4$ Hz), 7.61 (1H, m, $J = 1.0, 7.0, 8.2$ Hz), 7.47 (1H, m, $J = 1.0, 7.1, 8.2$ Hz), 4.54 (1H, m), 4.10 (2H, d br, $J = 11.5$ Hz), 3.51 (2H, s br), 3.21 (3H, s), 2.03 (2H, d q, $J = 4.6, 12.3$ Hz), 1.91 (2H, d br, $J = 11.5$ Hz)

化合物484 (MP: 119-120) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.9 (d, $J = 246.5$ Hz), 151.4, 147.8 (d, $J = 11.2$ Hz), 141.5, 136.8, 129.5 (d, $J = 3.8$ Hz), 117.3 (d, $J = 6.9$ Hz), 116.2 (d, $J = 18.7$ Hz), 113, 110.3 (d, $J = 2.0$ Hz), 67, 56.2, 54.4, 31.8, 29.5

^1H : 7.92 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.50 (1H, d d, $J = 2.0, 8.3$ Hz), 7.47 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.24 (1H, m), 7.09 (1H, d d, $J = 8.3, 11.0$ Hz), 4.29 (1H, m), 4.10 (2H, d d, $J = 4.5, 11.5$ Hz), 3.96 (3H, s), 3.50 (2H, d t, $J = 1.8, 12.0$ Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, $J = 4.6, 12.4$ Hz), 1.78 (2H, d br, $J = 12.5$ Hz)

化合物485 (MP: 181) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 153.2, 148.8, 137.1, 135, 126.4, 124.2, 123.2, 121.1, 115, 112.4, 57.2, 56.1, 40.7, 31.5, 28.8, 25, 24.8

^1H : 9.20 (1H, s br), 9.10 (1H, s), 8.31 (1H, s), 7.77 (1H,

d d, $J = 2.3, 8.2$ Hz), 7.76 (1H, s), 7.20 (1H, d, $J = 8.2$ Hz), 3.87 (3H, s), 3.84 (1H, br), 3.03 (3H, s), 2.96 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.61 (1H, m), 1.57 (2H, m), 1.32 (2H, m), 1.12 (1H, m)

化合物486 (MP: 200-203 (分解))。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 164.7, 145.6, 145, 137.7, 134.5, 132.8, 129.2, 128.6, 124.9, 120.4, 118.8, 115, 82.4, 79.5, 62.5, 23

¹H: 8.61 (1H, s), 8.30 (1H, d, $J = 8.6$ Hz), 8.19 (1H, s br), 8.15 (1H, d d, $J = 1.3, 8.6$ Hz), 7.70 (2H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.41 (2H, t, $J = 8.3$ Hz), 7.20 (1H, t, $J = 7.5$ Hz), 5.53 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.70 (6H, s)

化合物487 (MP: 175-177)。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 165.7, 145.7, 145.1, 134.2, 133.8, 128.4, 118.3, 114.6, 82.5, 79.5, 62.4, 52, 28.8, 23

¹H: 8.42 (1H, d d, $J = 0.5, 1.6$ Hz), 8.25 (1H, d d, $J = 0.5, 8.7$ Hz), 8.03 (1H, d d, $J = 1.6, 8.7$ Hz), 6.09 (1H, s br), 5.54 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.69 (6H, s), 1.53 (9H, s)

化合物488 (MP: 175)。NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 151.2, 148.6, 146.7, 140, 139.3, 137.3, 132.4, 128.9, 128.6, 128.4, 126.1, 123.6, 113.9, 60.2, 55.8, 52.6, 33.8, 31.7, 28.8

¹H: 9.01 (1H, d d, $J = 0.7, 2.2$ Hz), 8.53 (1H, d d, $J = 1.6, 4.8$ Hz), 8.12 (1H, d d d, $J = 1.7, 2.6, 8.0$ Hz), 7.96 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.59 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.34 (1H, d d d, $J =$

1.0, 4.8, 8.0 Hz), 7.30 (2H, m, $J = 7.5$ Hz), 7.21 (1H, m), 7.20 (2H, m, $J = 7.1$ Hz), 4.05 (1H, m), 3.14 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 3.05 (3H, s), 2.81 (2H, m), 2.63 (2H, m), 2.17 (2H, d t, $J = 2.0, 11.6$ Hz), 1.97 (2H, d q, $J = 3.7, 12.0$ Hz), 1.85 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物489 (MP: 197) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 164.3, 145.4, 144.5, 133.6, 132.4, 129, 118.7, 113.9, 81.7, 78.7, 61.7, 48.7, 32.5, 25.3, 25, 22.5

^1H : 8.68 (1H, s), 8.49 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 8.18 (1H, d d, $J = 1.4, 8.7$ Hz), 8.15 (1H, d, $J = 8.7$ Hz), 5.44 (2H, s), 3.90 (2H, s), 3.80 (1H, m), 1.86 (2H, m), 1.75 (2H, m), 1.61 (1H, m), 1.58 (6H, s), 1.35 (2H, m), 1.30 (2H, m), 1.15 (1H, m)

化合物490 (MP: 194-196) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 164.6, 144.4, 144.2, 143, 135.2, 128, 118.9, 118.4, 81.7, 78.7, 61.8, 48.7, 32.4, 25.3, 25, 22.2

^1H : 8.52 (1H, s), 8.50 (1H, m), 8.07 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.97 (1H, d d, $J = 1.4, 9.0$ Hz), 5.31 (2H, s), 3.92 (2H, s), 3.79 (1H, m), 1.85 (2H, m), 1.75 (2H, m), 1.62 (1H, m), 1.58 (6H, s), 1.34 (2H, m), 1.31 (2H, m), 1.15 (1H, m)

化合物491 (MP: 254-256) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 167, 149.5, 144.5, 134.1, 131.6, 128.8, 119, 113.1, 58.4, 56.8, 32.3, 30.1, 28.9, 25.1, 24.8

^1H : 8.71 (1H, s), 8.24 (1H, s), 8.18 (1H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.93 (1H, d, $J = 8.8$ Hz), 7.60 (1H, s), 4.0 (1H, m br), 3.06



(3H, s), 1.97-1.00 (10H, m)

化合物492 (MP: 223-224) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 150, 144.7, 132.6, 131.4, 129.9, 129.5, 129.5, 128.8, 125.5, 119.6, 113.5, 58.7, 52.8, 50.3, 32.5, 25.4

¹H: 11.21(1H, s br), 8.19 (1H, m, J = 8.3 Hz), 7.91 (1H, m d, J = 8.3 Hz), 7.70 (1H, m, J = 1.0, 7.0 Hz), 7.63 (2H, m), 7.54 (1H, m, J = 1.0, 7.0 Hz), 7.45 (3H, m), 4.39 (1H, m br), 4.26 (2H, m br), 3.40 (2H, m), 3.06 (3H, s), 3.05 (2H, m br), 2.47 (2H, m), 2.05 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物493 (MP: 140) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 150.8, 150.2, 140.4, 139.6, 137.3, 119.4, 115.7, 57.7, 31.4, 30, 25.4, 25.2

¹H: 8.62 (2H, m), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.68 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.67 (2H, m), 3.94 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.4, 12.3 Hz), 1.38 (2H, m q, J = 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.4, 13.0 Hz)

化合物494 (MP: 193-194) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 154.4, 151.2, 139.9, 137.2, 134.5, 133.7, 126, 121, 120.3, 113.4, 67, 54.5, 31.9, 29.5

¹H: 10.61 (1H, s), 8.51 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.02 (1H, d, J = 2.2, 8.7 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.52 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.21 (1H, d, J = 8.7 Hz), 4.29 (1H, m), 4.10 (2H, d d, J = 4.5, 11.5 Hz), 3.51 (2H, d t, J = 1.8, 12.0 Hz), 3.05 (3H,

s), 1.95 (2H, d q, $J = 4.6, 12.4$ Hz), 1.78 (2H, d br, $J = 12.5$ Hz)

40 化合物495 (MP: 185-187) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.1 (d, $J = 241.0$ Hz), 149.2, 145.5 (d, $J = 12.2$ Hz), 137.2, 135.3, 122.0 (d, $J = 3.0$ Hz), 120.5, 118.2 (d, $J = 3.5$ Hz), 114.8, 113.4 (d, $J = 20.5$ Hz), 66.2, 54.5, 31.7, 28.9

^1H : 10.36 (1H, s br), 9.08 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.74 (1H, d d, $J = 2.0, 12.4$ Hz), 7.56 (1H, d d, $J = 1.5, 8.3$ Hz), 7.07 (1H, t, $J = 8.7$ Hz), 4.11 (1H, m), 3.94 (2H, d d, $J = 4.0, 11.5$ Hz), 3.39 (2H, t, $J = 11.5$ Hz), 2.97 (3H, s), 1.86 (2H, d q, $J = 4.2, 12.2$ Hz), 1.70 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物496 (MP: 116-118) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 166.2, 145.6, 145.1, 137.8, 134.4, 132.2, 128.9, 128.4, 128, 127.8, 118.8, 114.8, 82.5, 79.5, 62.4, 44.5, 23

^1H : 8.52 (1H, s), 8.28 (1H, d, $J = 8.8$ Hz), 8.09 (1H, d d, $J = 1.5, 8.7$ Hz), 7.40-7.30 (5H, m), 6.56 (1H, t, $J = 5.3$ Hz), 5.54 (2H, s), 4.72 (2H, d, $J = 5.3$ Hz), 3.91 (2H, s), 1.69 (6H, s)

化合物497 (MP: 173 (分解)) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.6, 139.3, 138.2, 137.5, 131.5, 121.8, 115.4, 57.7, 31.4, 29.9, 25.4, 25.1

^1H : 8.22 (2H, d, $J = 7.0$ Hz), 7.90 (1H, s), 7.68 (2H, d, $J = 7.0$ Hz), 7.61 (1H, s), 3.93 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.71 (1H, d, $J = 13.0$ Hz), 1.59 (2H, d q, $J = 2.8, 12.2$



Hz), 1.38 (2H, q, $J = 13.0$ Hz), 1.13 (1H, q, $J = 13.0$ Hz)

化合物498 (MP: 109-110) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.6, 151.1, 141.7, 136.5, 133.9, 129.4, 117.2, 113.3, 113, 109.8, 60, 55.4, 54.9, 52.3, 31.2, 28.4, 19.8, 11.6

^1H : 7.92 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.49 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.39 (1H, d d, $J = 1.4, 2.6$ Hz), 7.35 (1H, d t, $J = 1.4, 7.7$ Hz), 7.31 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 6.85 (1H, d d d, $J = 1.4, 2.6, 8.0$ Hz), 4.02 (1H, m), 3.87 (3H, s), 3.06 (2H, d br, $J = 11.7$ Hz), 3.02 (3H, s), 2.32 (2H, m), 2.06 (2H, t br, $J = 11.5$ Hz), 1.95 (2H, d q, $J = 3.4, 12.2$ Hz), 1.80 (2H, d' br, $J = 12.0$ Hz), 1.52 (2H, m), 0.91 (3H, t, $J = 7.4$ Hz)

化合物499 (MP: 170-171) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 171.2, 160.9, 149, 137.2, 135.4, 130.8, 125.9, 119.6, 118, 115.2, 114.7, 57.2, 31.6, 28.8, 25, 24.8

^1H : 12.99 (1H, s br), 9.11 (1H, s), 8.42 (1H, s), 8.40 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 8.19 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.87 (1H, d d, $J = 2.0, 8.6$ Hz), 7.02 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 3.86 (1H, m), 2.98 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.60 (3H, m), 1.33 (2H, q, $J = 12.8$ Hz), 1.12 (1H, q, $J = 13.0$ Hz)

化合物500 (MP: 191-193 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.0, 150.3 (d, $J = 240.0$ Hz), 144.9 (d, $J = 12.5$ Hz), 140.0, 137.6, 130.1, 116.2 (d, $J = 18.0$ Hz), 115.9 (d, $J = 6.3$ Hz), 114.2 (d, $J = 1.5$ Hz), 114.1, 66.3, 54.2, 31.6, 29.1
 ^1H : 9.89 (1H, s), 8.10 (1H, s), 7.90 (1H, s), 7.46 (1H, d, $J =$

8.5 Hz), 7.24 (1H, m), 7.13 (1H, m, $J = 9.2$ Hz), 4.08 (1H, m), 3.93 (2H, d br, $J = 10.0$ Hz), 3.36 (2H, m), 2.94 (3H, s), 1.84 (2H, d q, $J = 12.0$ Hz), 1.69 (2H, d br, $J = 11.0$ Hz)

化合物501 (MP: 138-140) ° NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 158.5, 151, 140.6, 137.4, 126.1, 126, 114, 113.1, 55.1, 55.1, 44.9, 31.5, 28.7

^1H : 8.08 (1H, s), 7.87 (1H, s), 7.77 (2H, d, $J = 8.3$ Hz), 6.96 (2H, d, $J = 8.3$ Hz), 3.95 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.07 (2H, d, $J = 12.0$ Hz), 2.93 (3H, s), 2.56 (2H, m), 1.73 (4H, m)

化合物502 (MP: 120-121) ° NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.9, 151.5, 142.1, 136.9, 134.3, 129.7, 117.5, 113.7, 113.4, 110.2, 55.7, 55.3, 52.2, 52.1, 31.6, 28.8, 12.1

^1H : 7.92 (1H, s), 7.49 (1H, s), 7.39 (1H, t br), 7.36 (1H, d, $J = 7.6$ Hz), 7.30 (1H, t, $J = 7.9$ Hz), 6.85 (1H, d br, $J = 8.1$ Hz), 4.03 (1H, m), 3.87 (3H, s), 3.08 (2H, d br, $J = 11.0$ Hz), 3.02 (3H, s), 2.45 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 2.05 (2H, t br, $J = 11.4$ Hz), 1.96 (2H, d q, $J = 2.5, 11.8$ Hz), 1.85 (2H, d br, $J = 11.0$ Hz), 1.11 (3H, t, $J = 7.3$ Hz)

化合物503 (MP: 158-159) ° NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 152.5 (d, $J = 245.0$ Hz), 151.4, 147.1 (d, $J = 11.0$ Hz), 141.1 (d, $J = 2.5$ Hz), 136.9, 126.4 (d, $J = 7.0$ Hz), 120.9 (d, $J = 3.6$ Hz), 113.5 (d, $J = 2.5$ Hz), 113.0 (d, $J = 20.0$ Hz), 112.6, 56.3, 55.7, 52.2, 52.1, 31.6, 28.7, 12.1

^1H : 7.88 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.50 (2H, m), 7.40 (1H, d,

$J = 1.3$ Hz), 6.99 (1H, t, $J = 8.3$ Hz), 4.03 (1H, m), 3.91 (3H, s), 3.09 (2H, d br, $J = 11.5$ Hz), 3.02 (3H, s), 2.45 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 2.06 (2H, t, $J = 12.0$ Hz), 1.96 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 1.83 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.11 (3H, t, $J = 7.3$ Hz)

化合物504 (MP: 183-184) ◦ NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 149.3, 137.5, 136.1, 129.1, 129, 128.7, 125.4, 115.8, 52.6, 42.3, 31.8, 24.6

^1H : 9.33 (1H, q br, $J = 10.0$ Hz), 9.20 (1H, d br, $J = 10.0$ Hz), 9.13 (1H, s), 8.37 (1H, s), 7.94 (2H, d, $J = 8.2$ Hz), 7.48 (2H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.39 (1H, t, $J = 7.3$ Hz), 4.23 (1H, m), 3.34 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 3.0 (2H, m), 2.98 (3H, s), 2.19 (2H, d q, $J = 3.5, 12.8$ Hz), 1.92 (2H, d br, $J = 12.4$ Hz)

化合物505 (MP: 143-144) ◦ NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 167.9, 163.8, 144.4, 143.5, 142.8, 135.5, 128, 119.7, 118, 81.6, 78.7, 63.9, 61.8, 47.7, 45.2, 26.8, 25.1, 24.8, 22.2

^1H : 8.16 (1H, s br), 8.11 (1H, d, $J = 9.0$ Hz), 7.59 (1H, d, $J = 1.2, 8.9$ Hz), 5.29 (2H, s), 3.92 (2H, m), 3.84 (2H, br), 3.59 (2H, br), 3.08 (4H, br), 2.93 (1H, m), 1.96 (2H, d br, $J = 10.8$ Hz), 1.80 (2H, d, $J = 12.4$ Hz), 1.58 (1H, m), 1.57 (6H, s), 1.29 (4H, m), 1.09 (1H, m)

化合物506 (MP: 133-135) ◦ NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 168, 162.4, 147.4, 147, 144.4, 143.4, 142.8, 135.9,

128.5, 127.9, 123.3, 119.7, 117.7, 109.8, 108.1, 101.1, 81.6, 78.7, 61.8, 60.6, 51.6, 46.1, 40.7, 22.2

^1H : 8.10 (1H, d, $J = 9.3$ Hz), 8.09 (1H, s), 7.54 (1H, d, $J = 9.3$ Hz), 6.94 (1H, s), 6.90 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 6.83 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 6.01 (2H, s), 5.29 (2H, s), 3.92 (2H, s), 3.75 (2H, m), 3.72 (2H, s), 3.47 (2H, m), 2.69 (4H, m), 1.57 (6H, s)

化合物507 (MP: 213-214) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 156.3, 150.9, 150.7, 140.2, 137.5, 126.5, 126.3, 125.7, 122.9, 113.3, 111.9, 56.7, 55.7, 31.3, 29, 25.2, 24.8

^1H : 9.38 (1H, s), 8.07 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.91 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.84 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 7.82 (1H, d d, $J = 2.2, 8.6$ Hz), 7.08 (1H, d, $J = 8.6$ Hz), 5.63 (2H, s), 3.81 (1H, m), 3.81 (3H, s), 2.92 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, q, $J = 12.7$ Hz), 1.11 (1H, q, $J = 13.0$ Hz)

化合物508 (MP: 172-173) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 150.7, 147.4, 145.5, 138.1, 137.5, 132.5, 129.4, 124.1, 115.7, 67.9, 56.3, 34.2, 31.4, 26.8

^1H : 9.08 (1H, s), 8.49 (1H, d, $J = 4.8$ Hz), 8.24 (1H, t d, $J = 1.7, 8.0$ Hz), 8.19 (1H, s), 8.18 (1H, s), 7.47 (1H, d d, $J = 5.0, 8.0$ Hz), 4.62 (1H, br), 3.79 (1H, m), 3.38 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.89 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.80-1.60 (4H, m), 1.23 (2H, q, $J = 11.3$ Hz)

化合物509 (MP: 137-139 (dec.)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 150.7, 148.4, 138.5, 138.2, 135.2, 131, 130.3,

121.6, 118.9, 116.3, 55.6, 51.9, 51.4, 31.5, 28.1, 12.2

¹H: 8.66 (1H, t, J = 1.8 Hz), 8.31 (1H, s), 8.29 (1H, d t, J = 1.8, 8.0 Hz), 8.20 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.10 (1H, d br, J = 8.0 Hz), 7.69 (1H, t, J = 8.0 Hz), 3.83 (1H, m), 2.96 (2H, m), 2.95 (3H, s), 2.32 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.93 (2H, t br, J = 10.5 Hz), 1.82 (2H, d q, J = 3.0, 12.0 Hz), 1.73 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 0.99 (3H, t, J = 10.5 Hz)

化合物510 (MP: 133-134) ° NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.5, 149.1, 148.6, 142.1, 136.7, 126, 117.4, 112.3, 111.2, 108.4, 55.9, 55.9, 55.6, 52.2, 52.1, 31.6, 28.7, 12.1

¹H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.39 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.30 (1H, d d, J = 2.0, 8.4 Hz), 6.90 (1H, d, J = 8.4 Hz), 4.04 (1H, m), 3.96 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.08 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.02 (3H, s), 2.44 (2H, q, J = 7.4 Hz), 2.05 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.96 (2H, d q, J = 3.0, 11.8 Hz), 1.82 (2H, d br, J = 11.8 Hz), 1.10 (3H, t, J = 7.4 Hz)

化合物511 (MP: 142-144) ° NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 151.6, 146.7, 142.3, 136.8, 133.9, 129.6, 115.5, 114.4, 113.1, 111.9, 55.7, 52.2, 52.1, 31.6, 28.7, 12.1

¹H: 7.90 (1H, s), 7.45 (1H, s), 7.20 (1H, s), 7.16 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.13 (1H, d, J = 7.8 Hz), 6.63 (1H, d, J = 7.0 Hz), 4.03 (1H, m), 3.73 (2H, s br), 3.08 (2H, d br, J = 11.0 Hz),

3.01 (3H, s), 2.45 (2H, t, $J = 7.1$ Hz), 2.05 (2H, t br, $J = 11.5$ Hz), 1.96 (2H, q, $J = 12.0$ Hz), 1.82 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.11 (3H, t, $J = 7.1$ Hz)

化合物512 (MP: 153-154) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.5, 149.1, 148.6, 142.1, 136.7, 126.1, 117.4, 112.3, 111.3, 108.4, 60.4, 55.9, 55.9, 55.8, 52.6, 31.6, 28.9, 20.3, 11.9

^1H : 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.42 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.40 (1H, d, $J = 2.0$ Hz), 7.30 (1H, d d, $J = 2.0, 8.3$ Hz), 6.90 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 4.02 (1H, m), 3.96 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.04 (2H, d, $J = 11.0$ Hz), 3.02 (3H, s), 2.31 (2H, m), 2.05 (2H, d t, $J = 1.8, 11.8$ Hz), 1.93 (2H, d q, $J = 3.7, 12.0$ Hz), 1.80 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.51 (2H, m), 0.9 (3H, t, $J = 7.3$ Hz)

化合物513 (MP: 215-216 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 172.1, 160.3, 151, 140.2, 137.5, 130.5, 124.4, 124.2, 117.7, 114.4, 113.3, 66.3, 54.2, 31.7, 29.1

^1H : 13.02 (1H, s), 8.48 (1H, s), 8.32 (1H, d, $J = 2.0$ Hz), 8.14 (1H, s), 7.96 (1H, s), 7.89 (1H, d d, $J = 2.2, 8.5$ Hz), 7.86 (1H, s), 6.92 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 4.11 (1H, m), 3.94 (2H, d d, $J = 3.5, 11.0$ Hz), 3.38 (2H, m), 2.96 (3H, s), 1.96 (2H, d q, $J = 4.6, 12.4$ Hz), 1.70 (2H, d br, $J = 12.3$ Hz)

化合物514 (MP: 185-186) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 152.5 (d, $J = 245.0$ Hz), 151.4, 147.0 (d, $J = 11.0$

Hz), 141.1 (d, $J = 2.6$ Hz), 136.9, 126.4 (d, $J = 7.3$ Hz), 120.9 (d, $J = 3.5$ Hz), 113.4 (d, $J = 2.0$ Hz), 113.0 (d, $J = 20.0$ Hz), 112.6, 60.4, 56.2, 55.8, 52.6, 31.6, 28.9, 20.3, 11.9

^1H : 7.88 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.50 (2H, m), 7.40 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 6.99 (1H, t, $J = 8.4$ Hz), 4.0 (1H, m), 3.91 (3H, s), 3.04 (2H, d br, $J = 11.7$ Hz), 3.01 (3H, s), 2.31 (2H, m), 2.05 (2H, d t, $J = 2.0, 12.0$ Hz), 1.93 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 1.80 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.51 (2H, m), 0.9 (3H, t, $J = 7.5$ Hz)

化合物515 (MP: 171-172) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 154.5, 151.2, 148.6, 146.7, 139.4, 137.4, 132.5, 128.9, 123.6, 113.9, 80, 55.7, 42.9, 31.9, 28.7, 28.4

^1H : 9.01 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 8.54 (1H, d d, $J = 1.7, 4.8$ Hz), 8.12 (1H, d d d, $J = 1.7, 2.2, 8.0$ Hz), 7.96 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.59 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.35 (1H, d d d, $J = 0.9, 4.8, 8.0$ Hz), 4.28 (2H, br), 4.20 (1H, m), 3.02 (3H, s), 2.81 (2H, br), 1.88-1.69 (4H, m), 1.48 (9H, s)

化合物516 (MP: 吸濕的) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{2013}C : 150.1, 138.7, 137.4, 135.1, 134.4, 133, 127.6, 127.4, 118.1, 67.9, 56.4, 34.2, 31.5, 26.8

^1H : 9.0 (1H, t, $J = 1.5$ Hz), 8.47 (1H, m d, $J = 6.3$ Hz), 8.42 (1H, s), 8.40 (1H, s), 8.19 (1H, m d, $J = 8.1$ Hz), 7.74 (1H, d d, $J = 6.3, 8.1$ Hz), 3.79 (1H, m br), 3.40 (1H, m), 2.91 (3H, s), 1.88 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.70 (4H, m), 1.23

(2H, q br, $J = 12.0$ Hz)

化合物517 (MP: 130-132) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 168, 162.4, 145.4, 144.2, 135.1, 133, 132.7, 129.7, 128.8, 128.5, 128, 118.4, 114.5, 81.7, 78.7, 61.6, 61, 51.8, 46.3, 40.8, 22.5

^1H : 8.21 (1H, s), 8.16 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.71 (1H, d d, $J = 1.5, 8.5$ Hz), 7.40-7.25 (5H, m), 5.42 (2H, s), 3.91 (2H, s), 3.65 (2H, s br), 3.43 (4H, m), 2.55 (4H, m), 1.60 (6H, s)

化合物518 (MP: 122) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 152.2, 151.2, 149.3, 142.3, 137.5, 136.8, 122.2, 119.7, 115.9, 57.4, 31.4, 29.8, 25.4, 25.2

^1H : 8.56 (1H, d d d, $J = 1.0, 1.8, 4.8$ Hz), 8.0 (1H, t d, $J = 1.1, 8.0$ Hz), 7.97 (1H, d, $J = 1.5$ Hz), 7.88 (1H, d, $J = 1.5$ Hz), 7.75 (1H, d t, $J = 1.9, 7.7$ Hz), 7.19 (1H, d d d, $J = 1.2, 4.8, 7.6$ Hz), 3.98 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.69 (1H, d, $J = 13.0$ Hz), 1.56 (2H, d q, $J = 3.7, 12.2$ Hz), 1.38 (2H, t q, $J = 3.0, 13.0$ Hz), 1.12 (1H, t q, $J = 3.5, 13.0$ Hz)

化合物519 (MP: 158-159) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.8, 137.6, 137.6, 136.9, 136, 132.7, 125.9, 122.8, 115.3, 60.4, 56, 52.6, 31.7, 28.8, 20.2, 11.9

^1H : 8.66 (1H, t, $J = 1.6$ Hz), 8.13 (1H, d d d, $J = 1.0, 1.7, 6.4$ Hz), 7.93 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.71 (1H, t d, $J = 1.2, 7.9$ Hz), 7.59 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.31 (1H, d d, $J = 6.4, 7.9$ Hz),

3.98 (1H, m), 3.04 (2H, m d, $J = 12.0$ Hz), 3.01 (3H, s), 2.30 (2H, m), 2.04 (2H, d t, $J = 2.0, 12.0$ Hz), 1.93 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 1.80 (2H, d br, $J = 11.5$ Hz), 1.50 (2H, m), 0.9 (3H, t, $J = 7.4$ Hz)

化合物520 (MP: 170) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.2, 151.6, 142.1, 136.8, 126.4, 125.7, 114.1, 112, 60.4, 55.8, 55.3, 52.6, 31.5, 28.9, 20.2, 11.9

^1H : 7.90 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.72 (2H, m d, $J = 8.9$ Hz), 7.40 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 6.94 (2H, m d, $J = 8.9$ Hz), 4.01 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.04 (2H, m), 3.01 (3H, s), 2.30 (2H, m), 2.04 (2H, d t, $J = 2.0, 12.0$ Hz), 1.94 (2H, d q, $J = 103.7, 12.0$ Hz), 1.80 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.50 (2H, m), 0.9 (3H, t, $J = 7.4$ Hz)

化合物521 (MP: 163-164) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.1, 151.6, 142.1, 136.8, 126.4, 125.7, 114.1, 112, 55.7, 55.3, 52.2, 52.1, 31.5, 28.8, 12.2

^1H : 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.72 (2H, m d, $J = 8.9$ Hz), 7.39 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 6.94 (2H, m d, $J = 8.9$ Hz), 4.02 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.07 (2H, m d, $J = 11.7$ Hz), 3.01 (3H, s), 2.43 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 2.03 (2H, d t, $J = 2.0, 12.0$ Hz), 1.93 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 1.82 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.09 (3H, t, $J = 7.2$ Hz)

化合物522 (MP: 127) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 150.7, 148.4, 138.5, 138.2, 135.2, 131, 130.3,

121.6, 118.9, 116.4, 59.6, 55.6, 52.4, 31.6, 28.2, 19.8, 11.9

¹H: 8.66 (1H, t, J = 1.8 Hz), 8.32 (1H, s), 8.30 (1H, d br, J = 7.9 Hz), 8.20 (1H, s), 8.11 (1H, d d, J = 2.2, 8.1 Hz), 7.69 (1H, t, J = 8.1 Hz), 3.82 (1H, m), 2.95 (3H, s), 2.93 (2H, m), 2.21 (2H, t br, J = 7.5 Hz), 1.91 (2H, t br, J = 11.2 Hz), 1.81 (2H, d q, J = 3.0, 11.7 Hz), 1.72 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.41 (2H, m), 0.84 (3H, t, J = 7.5 Hz)

化合物523 (MP: 163-164 (分解))。NMR溶劑：DMSO

¹³C: 151, 150.4 (d, J = 240.5 Hz), 144.9 (d, J = 12.5 Hz), 140, 138.5, 137.6, 130.2 (d, J = 3.2 Hz), 128.9, 128.3, 127, 116.3 (d, J = 19.0 Hz), 115.9 (d, J = 6.5 Hz), 114.2 (d, J = 2.5 Hz), 114.1, 61.8, 55.4, 52.2, 31.5, 28.2

¹H: 9.20 (1H, s), 8.08 (1H, s), 7.89 (1H, s), 7.45 (1H, d d, J = 1.7, 8.7 Hz), 7.39-7.19 (6H, m), 7.13 (1H, d d, J = 8.7, 11.2 Hz), 3.82 (1H, m br), 3.47 (2H, s), 2.93 (3H, s), 2.90 (2H, m br), 2.0 (2H, m br), 1.83 (2H, m br), 1.72 (2H, m br)

化合物524 (MP: 124-125)。NMR溶劑：DMSO

¹³C: 151.1, 148.8, 141.4, 137.3, 133.8, 129.1, 113.7, 113, 112.8, 110.4, 59.6, 55.6, 52.4, 31.4, 28.2, 19.8, 11.9

¹H: 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.08 (1H, t, J = 2.0 Hz), 7.0 (1H, t, J = 7.6 Hz), 6.95 (1H, t d, J = 1.2, 7.5 Hz), 6.45 (1H, d d d, J = 1.4, 2.4, 7.8 Hz), 5.08 (2H, s), 3.79 (1H, m), 2.95 (2H, m), 2.92 (3H, s), 2.23 (2H, t, br, J = 7.5 Hz), 1.92 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.81 (2H, d q, J

= 3.0, 11.7 Hz), 1.71 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.42 (2H, m), 0.84 (3H, t, $J = 7.3$ Hz)

化合物525 (MP: 167-168) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.2, 148.6, 146.7, 139.3, 137.3, 132.4, 128.9, 123.6, 113.9, 55.9, 52.2, 52.1, 31.6, 28.8, 12.2

^1H : 9.0 (1H, d d, $J = 1.0, 2.3$ Hz), 8.52 (1H, d d, $J = 1.7, 4.9$ Hz), 8.11 (1H, d d d, $J = 1.7, 2.2, 7.9$ Hz), 7.94 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.58 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.34 (1H, d d d, $J = 1.0, 4.9, 8.0$ Hz), 4.03 (1H, m), 3.07 (2H, m d, $J = 11.5$ Hz), 3.03 (3H, s), 2.43 (2H, q, $J = 7.3$ Hz), 2.03 (2H, d t, $J = 2.0, 11.7$ Hz), 1.94 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 1.83 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 1.09 (3H, t, $J = 7.3$ Hz)

化合物526 (MP: 117) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 167.9, 151, 140.5, 140.2, 140, 137.7, 135, 134.1, 129.6, 129.4, 129, 126.8, 125.8, 125.7, 124.2, 123.1, 115, 59.3, 55.2, 52.2, 31.6, 27.9, 19.5, 11.8

^1H : 8.21 (1H, t, $J = 1.7$ Hz), 8.19 (1H, t, $J = 1.7$ Hz), 8.16 (3H, m), 7.88 (3H, m), 7.63 (1H, d d d, $J = 1.2, 2.0, 7.8$ Hz), 7.57 (1H, t, $J = 7.7$ Hz), 7.52 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.49 (1H, s br), 3.87 (1H, m br), 3.0 (2H, m br), 2.96 (3H, s), 2.31 (2H, m br), 2.05 (2H, m br), 1.86 (2H, q br, $J = 12.0$ Hz), 1.46 (2H, d br, $J = 10.5$ Hz), 1.45 (2H, m), 0.85 (3H, t, $J = 7.4$ Hz)

化合物527 (MP: 85-87) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{15}C : 154.4, 150.3, 148.9, 132.3, 129, 126.2, 123, 58.8, 56.6, 31.1, 30.6, 29.4, 25.4, 25.3

^1H : 7.90 (2H, m d, $J = 8.4$ Hz), 7.56 (1H, m t, $J = 7.3$ Hz), 7.49 (2H, m t, $J = 7.8$ Hz), 4.13, 3.70 (1H, 2 s br), 3.0 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.68 (1H, d, $J = 12.0$ Hz), 1.52 (2H, q, $J = 12.0$ Hz), 1.40 (2H, s br), 1.12 (1H, t q, $J =$, 3.2, 13.0 Hz)

化合物528 (MP: 138-140) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 153.3, 149.8, 144.2, 132.5, 129.1, 126.2, 122.7, 81, 79.8, 61.8, 22.8

^1H : 7.87 (2H, m d, $J = 8.7$ Hz), 7.57 (1H, m t, $J = 7.3$ Hz), 7.50 (2H, m t, $J = 7.2$ Hz), 5.23 (2H, s), 3.83 (2H, s), 1.59 (6H, s)

化合物529 (MP: 154-155) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.2, 148.6, 146.7, 139.3, 137.3, 132.4, 128.9, 123.6, 113.9, 60.4, 55.9, 52.6, 31.6, 28.9, 20.3, 11.9

^1H : 9.0 (1H, d, $J = 2.0$ Hz), 8.52 (1H, d d, $J = 1.6, 4.8$ Hz), 8.11 (1H, t d, $J = 2.0, 8.1$ Hz), 7.94 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.33 (1H, d d, $J = 4.8, 8.1$ Hz), 4.01 (1H, m), 3.05 (2H, m), 3.02 (3H, s), 2.30 (2H, m), 2.04 (2H, t br, $J = 11.5$ Hz), 1.93 (2H, d q, $J = 3.1, 12.0$ Hz), 1.81 (2H, d br, $J = 11.2$ Hz), 1.50 (2H, m), 0.9 (3H, t, $J = 7.4$ Hz)

化合物530 (MP: 185-186 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151, 143.1, 140, 137.5, 132.9, 125.7, 124.2, 122.8,

121.8, 57.4, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

^1H : 8.87 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 3.37 (1H, d d, $J = 2.0, 8.3$ Hz), 8.31 (1H, d, $J = 6.0$ Hz), 8.06 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.37 (1H, d t, $J = 1.2, 8.4$ Hz), 7.17 (1H, d t, $J = 2.2, 7.1$ Hz), 4.0 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.69 (1H, d, $J = 13.0$ Hz), 1.57 (2H, d q, $J = 3.5, 13.0$ Hz), 1.39 (2H, m q, $J = 13.0$ Hz), 1.12 (1H, m q, $J = 13.0$ Hz)

化合物531 (MP: 慢慢分解 >160)。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 150.4, 140.2, 139.9, 139, 137.9, 134.8, 132.6, 127.4, 118.6, 52.4, 42.4, 31.8, 24.7

^1H : 9.33 (1H, s), 9.25 (1H, q, $J = 10.0$ Hz), 9.10 (1H, d, $J = 10.0$ Hz), 8.94 (1H, d, $J = 8.2$ Hz), 8.80 (1H, d, $J = 5.3$ Hz), 8.55 (1H, s), 8.38 (1H, s), 8.08 (1H, d d, $J = 5.3, 8.2$ Hz), 4.22 (1H, m), 3.34 (2H, d, $J = 12.0$ Hz), 3.01 (2H, q, $J = 13.0$ Hz), 2.96 (3H, s), 2.17 (2H, q, $J = 13.2$ Hz), 1.92 (2H, d, $J = 12.0$ Hz)

化合物532 (MP: 245-246 (分解))。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 158.5, 151.2, 140.6, 137.5, 126.1, 126, 114, 113.1, 55.1, 54.5, 44.9, 34.3, 31.6, 27.7

^1H : 8.10 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.88 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.77 (2H, m d, $J = 8.9$ Hz), 6.96 (2H, m d, $J = 8.9$ Hz), 3.98 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.66 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 2.95 (3H, s), 2.88 (3H, s), 2.84 (2H, m), 1.87 (4H, m)

化合物533 (MP: 259-260)。NMR溶劑：DMSO

¹³C: 150.9, 148.1, 146.2, 138.2, 137.8, 131.9, 129.1, 123.8, 115.5, 54.5, 44.9, 34.4, 31.7, 27.7

¹H: 9.07 (1H, s), 8.46 (1H, s), 8.19 (3H, m), 7.42 (1H, s br), 3.98 (1H, m br), 3.66 (2H, m d, J = 10.0 Hz), 2.96 (3H, s), 2.88 (3H, s), 2.85 (2H, m br), 1.88 (4H, m br)

化合物534 (MP: 162) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 151.5 (d, J = 243.0 Hz), 149.4, 147.3 (d, J = 10.6 Hz), 137.4, 135.4, 122.4 (m), 121.9 (d, J = 2.8 Hz), 115.2, 114.3 (d, J = 1.5 Hz), 113.0 (d, J = 20.2 Hz), 56.2, 52.5, 42.3, 31.7, 24.6

¹H: 8.91 (2H, m), 8.49 (1H, s), 8.11 (1H, s), 7.71 (1H, d d, J = 2.0, 12.7 Hz), 7.67 (1H, m d, J = 8.8 Hz), 7.23 (1H, t, J = 8.8 Hz), 4.21 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.36 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 3.02 (2H, m br), 2.95 (3H, s), 2.11 (2H, d q, J = 4.0, 12.8 Hz), 1.92 (2H, d br, J = 12.8 Hz)

化合物535 (MP: 141-142) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 149.6, 144.4, 137.9, 135.2, 131.4, 129.1, 128.3, 127.2, 125.6, 118.1, 115.3, 109.1, 62.8, 57.6, 55.6, 52.5, 32.8, 29.8, 28.5

¹H: 8.49 (1H, d d, J = 1.0, 1.4 Hz), 8.12 (1H, d d, J = 1.0, 8.7 Hz), 7.82 (1H, d d, J = 1.4, 8.7 Hz), 7.43-7.20 (5H, m), 4.32 -4.20 (1H, 2s br), 3.54 (2H, s), 3.21 (3H, s), 3.03 (2H, s br), 2.18 (2H, s br), 2.01 (2H, m br), 1.94 (2H, m br)

化合物536 (MP: 173-174) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.2 (d, $J = 240.0$ Hz), 151, 144 (d, $J = 12.5$ Hz), 139.9 (d, $J = 2.4$ Hz), 137.5, 125.4 (d, $J = 7.0$ Hz), 121 (d, $J = 3.0$ Hz), 117.9 (d, $J = 3.5$ Hz), 113.4, 112.5 (d, $J = 19.4$ Hz), 55.2, 51.7, 51.3, 31.5, 27.8, 12

^1H : 9.88 (1H, s), 8.08 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.59 (1H, d d, $J = 2.0, 12.5$ Hz), 7.48 (1H, d d d, $J = 1.0, 2.0, 8.5$ Hz), 6.95 (1H, d d, $J = 8.5, 9.2$ Hz), 3.85 (1H, m br), 3.02 (2H, m br), 2.93 (3H, s), 2.40 (2H, m br), 1.98 (2H, m br), 1.85 (2H, m br), 1.77 (2H, m br), 1.02 (3H, m br)

化合物537 (MP: 144-146) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.9 (d, $J = 246.2$ Hz), 151.4, 147.8 (d, $J = 11.0$ Hz), 141.5, 136.8, 129.6 (d, $J = 3.8$ Hz), 117.3 (d, $J = 6.8$ Hz), 116.1 (d, $J = 19.0$ Hz), 113.1, 110.3 (d, $J = 1.5$ Hz), 56.2, 55.8, 52.2, 52.1, 31.6, 28.8, 12.2

^1H : 7.90 (1H, s), 7.49 (1H, d d, $J = 1.7, 8.5$ Hz), 7.45 (1H, s), 7.24 (1H, m), 7.08 (1H, d d, $J = 8.6, 11.1$ Hz), 4.03 (1H, m), 3.96 (3H, s), 3.08 (2H, d br, $J = 11.2$ Hz), 3.02 (3H, s), 2.44 (2H, q, $J = 7.4$ Hz), 2.05 (2H, t br, $J = 11.0$ Hz), 1.95 (2H, d q, $J = 2.6, 11.9$ Hz), 1.83 (2H, d br, $J = 10.5$ Hz), 1.10 (3H, t, $J = 7.4$ Hz)

化合物538 (MP: 44-46) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.7, 145.2, 133.1, 129.3, 125.2, 119.8, 113.6, 40, 38

^1H : 8.11 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 8.0 (1H, d, $J = 8.4$ Hz),

7.60 (1H, m t, $J = 7.6$ Hz), 7.46 (1H, m t, $J = 7.7$ Hz), 3.34 (6H, 2 s br)

化合物539 (MP: 90-91) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 156.8, 149.9, 149.2, 126, 123.9, 123, 40, 38.3

^1H : 8.82 (1H, d d, $J = 1.6, 4.4$ Hz), 8.42 (1H, d d, $J = 1.6, 8.5$ Hz), 7.57 (1H, d d, $J = 4.4, 8.5$ Hz), 3.49, 3.31 (6H, 2s)

化合物540 (MP: 164) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.7 (d, $J = 242.5$ Hz), 151, 146.2 (d, $J = 10.5$ Hz), 139.5 (d, $J = 2.5$ Hz), 137.6, 126.7 (d, $J = 7.3$ Hz), 120.9 (d, $J = 3.0$ Hz), 114 (2 C), 112.2 (d, $J = 9.4$ Hz), 60, 58.8, 56, 55.5, 52.8, 31.5, 28.2

^1H : 8.09 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.96 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.66 (1H, d d, $J = 2.0, 13.5$ Hz), 7.63 (1H, m), 7.19 (1H, t, $J = 8.7$ Hz), 4.41 (1H, t, $J = 5.3$ Hz), 3.85 (3H, s), 3.80 (1H, m), 3.48 (2H, m), 2.95 (2H, d br, $J = 11.5$ Hz), 2.93 (3H, s), 2.38 (2H, t, $J = 6.4$ Hz), 2.01 (2H, t br, $J = 11.5$ Hz), 1.81 (2H, d q, $J = 3.6, 12.1$ Hz), 1.69 (2H, d br, 12.0 Hz)

化合物541 (MP: 220-221) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 152.5 (d, $J = 245.0$ Hz), 151.5, 147.1 (d, $J = 10.0$ Hz), 141.2 (d, $J = 3.0$ Hz), 136.9, 126.4 (d, $J = 7.0$ Hz), 120.9 (d, $J = 3.5$ Hz), 118.7, 113.5 (d, $J = 2.0$ Hz), 113.1 (d, $J = 19.0$ Hz), 112.6, 56.3, 55.3, 53, 52.2, 31.7, 28.7, 16.3

^1H : 7.90 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.50 (2H, m), 7.40 (1H, d,

$J = 1.3$ Hz), 7.0 (1H, t, $J = 8.5$ Hz), 4.04 (1H, m), 3.93 (3H, s), 3.03 (3H, s), 3.02 (2H, m), 2.71 (2H, t, $J = 7.0$ Hz), 2.52 (2H, t, $J = 7.0$ Hz), 2.22 (2H, d t, $J = 2.0, 11.5$ Hz), 1.94 (2H, d q, $J = 3.5, 12.2$ Hz), 1.83 (2H, d br, $J = 12.2$ Hz)

化合物542 (MP: 175) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151, 150.3, 140.2, 139.8, 137.3, 119.4, 115.6, 66.9, 54.5, 31.9, 29.5

^1H : 8.63 (2H, m d, $J = 4.6$ Hz), 7.95 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.69 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.67 (2H, m d, $J = 4.6$ Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d, $J = 4.7, 11.5$ Hz), 3.50 (2H, d t, $J = 2.1, 12.0$ Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, $J = 4.9, 12.5$ Hz), 1.78 (2H, m d, $J = 12.3$ Hz)

化合物543 (MP: 173-174 (分解)) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 150.8, 139.3, 138.5, 137.5, 131.3, 121.8, 115.3, 66.9, 54.6, 31.9, 29.5

^1H : 8.22 (2H, d, $J = 6.8$ Hz), 7.93 (1H, s), 7.68 (2H, d, $J = 6.8$ Hz), 7.62 (1H, s), 4.28 (1H, m), 4.10 (2H, d d, $J = 4.0, 11.7$ Hz), 3.51 (2H, t, $J = 11.7$ Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, $J = 4.5, 12.2$ Hz), 1.78 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物544 (MP: 163-164) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.1, 158.2, 151.6, 149.4, 142.1, 136.8, 136.4, 126.4, 125.7, 123.2, 122.1, 114.1, 112, 64.3, 55.6, 55.3, 52.8, 31.6, 28.8

^1H : 8.59 (1H, m d, $J = 4.9$ Hz), 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz),

7.72 (2H, m d, $J = 8.9$ Hz), 7.66 (1H, d t, $J = 1.8, 7.7$ Hz),
 7.39 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.36 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.18 (1H, d
 d d, $J = 1.0, 4.9, 7.4$ Hz), 6.94 (2H, m d, $J = 8.9$ Hz), 4.04
 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.66 (2H, s), 3.02 (2H, m), 3.01 (3H,
 s), 2.20 (2H, d t, $J = 1.8, 12.0$ Hz), 1.97 (2H, d q, $J = 3.8,$
 12.2 Hz), 1.78 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物545 (MP: 127-128) · NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 151.9 (d, $J = 246.5$ Hz), 151.4, 147.8 (d, $J = 11.0$
 Hz), 141.4, 136.8, 129.6 (d, $J = 4.0$ Hz), 117.3 (d, $J = 7.0$ Hz),
 116.1 (d, $J = 18.8$ Hz), 113.1, 110.3 (d, $J = 2.0$ Hz), 60.4,
 56.2, 55.8, 52.6, 31.6, 28.8, 20.2, 11.9

^1H : 7.89 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.49 (1H, d d, $J = 2.0, 8.2$
 Hz), 7.45 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.24 (1H, m), 7.09 (1H, d d, J
 $= 8.3, 11.0$ Hz), 4.02 (1H, m), 3.96 (3H, s), 3.05 (2H, d br, J
 $= 12.0$ Hz), 3.02 (3H, s), 2.31 (2H, m), 2.05 (2H, d t, $J = 2.0,$
 12.0 Hz), 1.94 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 1.80 (2H, d br, $J =$
 12.0 Hz), 1.51 (2H, m), 0.91 (3H, t, $J = 7.5$ Hz)

化合物546 (MP: 240-241) · NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 163.6, 161.9, 158.5, 151.3, 151.1, 151, 147.1,
 140.6, 137.5, 133.9, 128.6, 126.1, 126, 125, 124.4, 114,
 113.1, 55.1, 55, 45.9, 41.3, 31.8, 28.9, 28.1

^1H : 9.18 (1H, d, $J = 2.0$ Hz), 8.71 (1H, d d, $J = 1.6, 4.9$
 Hz), 8.35 (1H, t d, $J = 1.8, 7.9$ Hz), 8.27 (1H, s), 8.11 (1H, d,
 $J = 1.0$ Hz), 7.90 (1H, d, $J = 1.0$ Hz), 7.77 (2H, m d, $J = 8.8$

Hz), 7.58 (1H, d d, $J = 4.9, 7.9$ Hz), 6.96 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 4.64 (1H, d br, $J = 12.0$ Hz), 4.37 (1H, d br, $J = 12.0$ Hz), 4.22 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.25 (1H, m), 2.97 (3H, s), 2.92 (1H, m), 1.88 (4H, m)

化合物547 (MP: 204-205) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 168.8, 159.2, 151.6, 142.3, 136.9, 126.4, 125.6, 114.1, 111.9, 55.3 (2 sig.), 45.5, 40.7, 31.9, 29.1, 28.4, 21.4

^1H : 7.91 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.72 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 7.40 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 6.94 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 4.82 (1H, m d, $J = 13.5$ Hz), 4.27 (1H, m), 3.95 (1H, m d, $J = 14.0$ Hz), 3.84 (3H, s), 3.18 (1H, d t, $J = 2.5, 13.5$ Hz), 3.0 (3H, s), 2.61 (1H, d t, $J = 2.5, 13.0$ Hz), 2.13 (3H, s), 1.93 (1H, m), 1.88 (1H, m), 1.74 (2H, m)

化合物548 (MP: 196-197) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 168.8, 151.2, 148.6, 146.7, 139.4, 137.4, 132.5, 128.8, 123.6, 113.8, 55.4, 45.4, 40.6, 32, 29.1, 28.3, 21.4

^1H : 9.0 (1H, d, $J = 2.0$ Hz), 8.53 (1H, d d, $J = 1.6, 4.9$ Hz), 8.11 (1H, d d d, $J = 1.8, 2.2, 7.9$ Hz), 7.96 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.59 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.34 (1H, d d d, $J = 0.9, 4.9, 8.0$ Hz), 4.83 (1H, m d, $J = 13.5$ Hz), 4.28 (1H, m), 3.96 (1H, m d, $J = 14.0$ Hz), 3.19 (1H, m t, $J = 2.7, 13.5$ Hz), 3.01 (3H, s), 2.61 (1H, d t, $J = 2.8, 13.2$ Hz), 2.13 (3H, s), 1.94 (1H, m), 1.89 (1H, m), 1.75 (2H, m)

化合物549 (MP: 206-207) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.2, 151.6, 142.3, 137.3, 136.8, 132.0 (q, $J = 34.0$ Hz), 130.7, 130.1, 129.7 (q, $J = 3.8$ Hz), 126.4, 125.5, 124.5 (q, $J = 3.8$ Hz), 123.1 (q, $J = 273.0$ Hz), 114.1, 111.9, 55.3, 54.2, 45.6, 31.9, 28.0

^1H : 8.03 (1H, t br), 7.97 (1H, d, $J = 7.9$ Hz), 7.90 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.87 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.73 (1H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.70 (2H, m d, $J = 8.9$ Hz), 7.36 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 6.93 (2H, m d, $J = 8.9$ Hz), 4.01 (3H, m), 3.84 (3H, s), 3.02 (3H, s), 2.42 (2H, d t, $J = 2.8, 11.8$ Hz), 2.0 (2H, d q, $J = 4.0, 12.3$ Hz), 1.93 (2H, d br)

化合物550 (MP: 89-101 (分解))。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 167.9, 151, 140.5, 140.1, 140, 138.5, 137.7, 135, 134.1, 129.6, 129.4, 129, 128.8, 128.2, 127, 126.7, 125.8, 125.6, 124.2, 123.1, 114.9, 61.9, 55.5, 52.2, 31.6, 28.2

^1H : 8.20 (1H, t, $J = 1.6$ Hz), 8.18 (1H, t, $J = 1.7$ Hz), 8.15 (2H, s), 8.14 (1H, s br), 7.88 (3H, m), 7.62 (1H, d d d, $J = 1.2, 1.8, 7.8$ Hz), 7.57 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.51 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.47 (1H, s br), 7.37-7.20 (5H, m), 3.85 (1H, m), 3.47 (2H, s), 2.96 (3H, s), 2.90 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 2.01 (2H, t br, $J = 12.0$ Hz), 1.84 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 1.73 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物551 (MP: 258-260 (分解))。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 160.1, 157.3, 150.6, 139.4, 138.1, 137.1, 126.5, 125.3, 121.5, 116.2, 56.9, 31.4, 29, 25.2, 24.8

¹H: 12.94 (1H, s br), 8.19 (1H, s), 8.18 (1H, s), 8.04 (2H, m d, J = 8.4 Hz), 7.83 (2H, m d, J = 8.4 Hz), 3.82 (1H, m br), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q, J = 13.0 Hz), 1.11 (1H, q, J = 13.0 Hz)

化合物552 (MP: 126 (分解))。NMR溶劑：DMSO

¹³C: 164.2, 150.9, 140, 137.8, 133.6, 133.3, 128.7, 127.3, 125.4, 123.3, 115, 59.6, 55.6, 52.4, 31.5, 28.2, 19.8, 11.9

¹H: 11.25 (1H, s br), 9.09 (1H, s br), 8.23 (1H, t, J = 1.7 Hz), 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.97 (1H, m d, J = 7.9 Hz), 7.62 (1H, m d, J = 7.8 Hz), 7.46 (1H, t, J = 7.7 Hz), 3.81 (1H, m), 2.94 (3H, s), 2.93 (2H, m), 2.22 (2H, m), 1.91 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.81 (2H, d q, J = 3.2, 11.7 Hz), 1.72 (2H, d br, J = 11.7 Hz), 1.42 (2H, m), 0.84 (3H, t, J = 7.5 Hz)

化合物553 (MP: 271-272)。NMR溶劑：DMSO

¹³C: 156.2, 150.7, 139.7, 137.8, 135.7, 134.9, 130, 123.1, 122.8, 120.7, 115.2, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.8

¹H: 10.12 (1H, s), 8.16 (1H, s), 8.10 (1H, s), 7.77 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.71 (1H, t br), 7.60 (4H, s br), 7.45 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.11 (1H, d d, J = 1.3, 7.9 Hz), 3.81 (1H, m br), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.11 (1H, q, J = 13.0 Hz)

化合物554 (MP: 187-188)。NMR溶劑：DMSO

¹³C: 172.1, 160.3, 151, 140.2, 137.4, 130.5, 124.4, 124.2, 117.7, 114.4, 113.3, 59.5, 55.4, 52.3, 31.6, 28, 19.7, 11.9

¹H: 13.03 (1H, s), 8.50 (1H, s br), 8.32 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.97 (1H, s br), 7.88 (1H, d d, J = 2.0, 8.5 Hz), 7.86 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.91 (1H, d, J = 8.5 Hz), 3.84 (1H, m), 2.98 (2H, m), 2.95 (3H, s), 2.26 (2H, m), 1.97 (2H, br), 1.84 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.73 (2H, d, J = 11.5 Hz), 1.44 (2H, m), 0.84 (3H, t, J = 7.3 Hz)

化合物555 (MP: 219-222) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 158.4, 149, 137, 135.4, 127.2, 118.7, 115.9, 114.2, 52.7, 42.5, 32, 24.8

¹H: 9.89 (1H, br), 9.3 (1H, s), 8.7 (1H, d, J = 10.5 Hz), 8.42 (1H, q, J = 10.5 Hz), 8.24 (1H, s), 7.68 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 6.88 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 4.22 (1H, m), 3.40 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.06 (2H, q br, J = 11.5 Hz), 2.97 (3H, s), 2.09 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.96 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

化合物556 (MP: 141) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.7, 142.4, 141.4, 140.3, 138.1, 136.8, 129.1, 128.8, 128.3, 127.1, 119.4, 115.4, 112.3, 111.9, 62.8, 55.8, 52.5, 43.5, 31.6, 28.9

¹H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.38 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.36-7.23 (5H, m), 7.21 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.15 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 7.03 (1H, d, J = 8.2 Hz), 4.01 (3H, m), 3.52

(2H, s), 3.0 (3H, s), 2.99 (2H, m), 2.69 (6H, s), 2.09 (2H, t br, $J = 12.0$ Hz), 1.92 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 1.77 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物557 (MP: 183-184) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 170.5, 163.9, 159.3, 151.7, 142.4, 136.9, 126.5, 125.5, 114.1, 111.9, 55.3, 54.9, 43.4, 32.1, 28.3

^1H : 7.93 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.72 (2H, m d, $J = 8.9$ Hz), 7.41 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 6.95 (2H, m d, $J = 8.9$ Hz), 4.97 (2H, m d, $J = 13.5$ Hz), 4.38 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.05 (2H, d t, $J = 2.7, 13.5$ Hz), 3.02 (3H, s), 2.02 (2H, d br, $J = 13.0$ Hz), 1.82 (2H, d q, $J = 4.5, 12.5$ Hz)

化合物558 (MP: 179 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 169.4, 150.9, 148.1, 146.2, 138.2, 137.8, 131.9, 129.1, 123.8, 115.5, 58.1, 54.1, 51.5, 31.5, 26.9

^1H : 9.07 (1H, s), 8.46 (1H, m), 8.18 (3H, m), 7.43 (1H, m), 3.95 (1H, m), 3.31 (2H, s), 3.18 (2H, m), 2.96 (3H, s), 2.58 (2H, m), 2.0 (2H, q br, $J = 12.0$ Hz), 1.81 (2H, d br, $J = 11.0$ Hz)

化合物559 (MP: 194-195) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.1, 156.1, 151.2, 148.6, 146.7, 144, 139.3, 137.3, 132.4, 128.9, 123.6, 118.8, 113.9, 110.9, 55.4, 54.5, 52.2, 51.9, 31.7, 28.6

^1H : 9.0 (1H, d, $J = 1.8$ Hz), 8.52 (1H, d d, $J = 1.5, 4.7$ Hz), 8.10 (1H, t d, $J = 1.8, 7.9$ Hz), 7.93 (1H, d, $J = 1.3$ Hz),

7.57 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.33 (1H, d d, $J = 4.9, 7.9$ Hz), 7.14 (1H, d, $J = 3.5$ Hz), 6.35 (1H, d, $J = 3.5$ Hz), 4.0 (1H, m), 3.88 (3H, s), 3.64 (2H, s), 3.04 (2H, m), 3.02 (3H, s), 2.21 (2H, t br, $J = 12.0$ Hz), 1.96 (2H, d q, $J = 3.6, 12.0$ Hz), 1.81 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物560 (MP: 165) 。 NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 152.1, 151.5, 149.3, 142.6, 137.6, 136.9, 122.4, 119.8, 115.8, 67, 54.4, 31.8, 29.5

^1H : 8.57 (1H, d d d, $J = 1.0, 2.0, 4.8$ Hz), 8.01 (1H, t d, $J = 1.1, 8.1$ Hz), 8.0 (1H, d, $J = 1.5$ Hz), 7.89 (1H, d, $J = 1.5$ Hz), 7.76 (1H, t d, $J = 1.8, 7.7$ Hz), 7.20 (1H, d d d, $J = 1.1, 4.8, 7.4$ Hz), 4.31 (1H, m), 4.09 (2H, d d, $J = 4.7, 11.6$ Hz), 3.51 (2H, d t, $J = 2.1, 12.0$ Hz), 3.05 (3H, s), 1.94 (2H, d q, $J = 4.5, 12.0$ Hz), 1.78 (2H, m d, $J = 12.3$ Hz)

化合物561 (MP: 201-202) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 151.1, 150.4 (d, $J = 240.5$ Hz), 144.9 (d, $J = 12.5$ Hz), 140, 137.7, 130.1 (d, $J = 3.5$ Hz), 116.3 (d, $J = 18.5$ Hz), 116.0 (d, $J = 6.5$ Hz), 114.3 (d, $J = 2.5$ Hz), 114.1, 52.1, 50.9, 50.2, 31.8, 25.3, 9.2

^1H : 9.90 (1H, s), 9.36 (1H, s br), 8.13 (1H, s), 7.92 (1H, s), 7.46 (1H, d d, $J = 2.0, 8.7$ Hz), 7.25 (1H, m), 7.14 (1H, d d, $J = 8.5, 11.3$ Hz), 4.19 (1H, m), 3.58 (2H, m d, $J = 11.5$ Hz), 3.10 (4H, m), 2.94 (3H, s), 2.18 (2H, m q, $J = 12.5$ Hz), 2.0 (2H, d br, $J = 12.5$ Hz), 1.24 (3H, t, $J = 7.2$ Hz)

化合物562 (MP: 190-192 (分解))。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 151.3, 149.5, 137.2, 135.8, 126.5, 121.4, 121, 119.7, 116.7, 114.6, 58.7, 31.4, 28.2, 24.1

^1H : 11.26 (1H, s br), 10.14 (3H, br), 8.96 (1H, s), 8.10 (1H, s), 7.84 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 7.74 (1H, d d, $J = 2.2, 8.5$ Hz), 7.19 (1H, d, $J = 8.6$ Hz), 4.36 (1H, m), 2.95 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.69 (4H, m), 1.53 (2H, m)

化合物563 (MP: 250-252)。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 155.3, 150.8, 140.1, 138.9, 137.7, 134.8, 129.8, 122.9, 121.7, 120.5, 114.9, 56.8, 31.3, 29, 25.2, 24.8

^1H : 8.12 (1H, s), 8.03 (1H, s), 7.63 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.57 (1H, t br), 7.37 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.0 (3H, br), 6.98 (1H, d, $J = 8.2$ Hz), 3.8 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, m q, $J = 12.5$ Hz), 1.11 (1H, m q, $J = 12.5$ Hz)

化合物564 (MP: 250)。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 154.7, 151.1, 142.6, 140.3, 137.6, 130.8, 129.6, 118.6, 114.2, 109.6, 106, 58.4, 31.3, 28.2, 24

^1H : 11.71 (1H, br), 8.10 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 8.0 (1H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.59 (1H, d d, $J = 1.7, 8.3$ Hz), 7.53 (1H, d, $J = 1.7$ Hz), 7.29 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 4.36 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.87 (2H, m), 1.68 (4H, m), 1.53 (2H, m)

化合物565 (MP: 188-189)。NMR溶劑： CDCl_3

^{13}C : 151.5, 146.7, 142.2, 138, 136.8, 133.9, 129.6,

129.1, 128.3, 127.2, 115.5, 114.4, 113.1, 111.9, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

^1H : 7.90 (1H, s), 7.45 (1H, s), 7.38-7.24 (5H, m), 7.21 (1H, t br), 7.17 (1H, m), 7.16 (1H, m), 6.63 (1H, m d, $J = 7.5$ Hz), 4.02 (1H, m), 3.74 (2H, s), 3.52 (2H, s), 3.01 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, $J = 11.5$ Hz), 1.93 (2H, d q, $J = 3.3, 12.0$ Hz), 1.78 (2H, d br, $J = 11.0$ Hz)

化合物566 (MP: 196) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 163.9, 149.6, 137.8, 136.9, 133.5, 130.7, 129.1, 127.7, 126.4, 123.9, 115.9, 67.9, 56.5, 34.1, 31.5, 26.7

^1H : 11.30 (1H, br), 8.81 (1H, s), 8.29 (1H, s), 8.25 (1H, s), 7.98 (1H, t d, $J = 1.4, 7.9$ Hz), 7.70 (1H, t d, $J = 1.2, 7.9$ Hz), 7.54 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 3.85 (1H, m), 3.41 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.90 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 7.71 (4H, m), 1.25 (2H, q br, $J = 12.3$ Hz)

化合物567 (MP: 219-220) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 150.7, 139, 138.8, 138.5, 138.4, 138.3, 128.8, 128.2, 127.6, 127, 125.2, 116.8, 61.9, 55.6, 52.2, 43.7, 31.6, 28.2

^1H : 8.25 (1H, d, $J = 1.1$ Hz), 8.20 (1H, d, $J = 1.1$ Hz), 8.10 (2H, m d, $J = 8.7$ Hz), 7.93 (2H, m d, $J = 8.7$ Hz), 7.36-7.20 (5H, m), 3.83 (1H, m), 3.46 (2H, s), 3.22 (3H, s), 2.95 (3H, s), 2.90 (2H, m d, $J = 11.0$ Hz), 2.0 (2H, t br, $J = 11.0$ Hz), 1.83 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 1.72 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

Hz)

化合物568 (MP: 193-194) 。 NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 158.3, 148.9, 137.0, 136.9, 135.3, 131.6, 131.3, 130.1 (q, $J = 33.0$ Hz), 130.0 (q, $J = 3.5$ Hz), 127.1, 123.8 (q, $J = 4.2$ Hz), 123.4 (q, $J = 273.0$ Hz), 118.8, 115.9, 114.2, 54.3, 45.2, 31.9, 27.3

^1H : 9.88 (1H, br), 9.21 (1H, s), 8.17 (1H, s), 8.14 (1H, d br, $J = 7.8$ Hz), 8.10 (1H, d br, $J = 8.0$ Hz), 7.99 (1H, t br), 7.92 (1H, t, $J = 7.9$ Hz), 7.64 (2H, m d, $J = 8.7$ Hz), 6.86 (2H, m d, $J = 8.7$ Hz), 3.91 (1H, m), 3.84 (2H, m), 2.94 (3H, s), 2.48 (2H, m), 1.86 (4H, m)

化合物569 (MP: 157-158) 。 NMR溶劑： CDCl_3

^{13}C : 157.9, 151.2, 149.5, 148.5, 146.7, 139.3, 137.3, 136.4, 132.4, 128.9, 123.6, 123.3, 122.2, 113.9, 64.2, 55.7, 52.7, 31.7, 28.7

^1H : 9.0 (1H, d, $J = 2.2$ Hz), 8.59 (1H, d d d, $J = 1.0, 1.8, 4.9$ Hz), 8.53 (1H, d d, $J = 1.6, 4.8$ Hz), 8.11 (1H, d d d, $J = 1.8, 2.2, 7.9$ Hz), 7.94 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.67 (1H, d t, $J = 1.9, 7.7$ Hz), 7.57 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.37 (1H, d, $J = 7.7$ Hz), 7.34 (1H, d d d, $J = 0.8, 4.8, 7.9$ Hz), 7.19 (1H, d d d, $J = 1.0, 4.9, 7.7$ Hz), 4.05 (1H, m), 3.68 (2H, s), 3.04 (2H, m d, $J = 12.0$ Hz), 3.03 (3H, s), 2.23 (2H, t br, $J = 11.5$ Hz), 2.01 (2H, d q, $J = 3.5, 12.0$ Hz), 1.79 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物570 (MP: 206-207) 。 NMR溶劑：MeOD

^{13}C : 153.2, 152.8 (d, $J = 241.0$ Hz), 146.6 (d, $J = 13.5$ Hz), 142.5, 139.2, 131.0 (d, $J = 3.5$ Hz), 118.0 (d, $J = 6.5$ Hz), 117.3 (d, $J = 19.3$ Hz), 116.0 (d, $J = 3.0$ Hz), 115.1, 60.0, 55.2, 53.3, 33.3, 27.4, 19.5, 11.6

^1H : 8.12 (1H, d, $J = 1.4$ Hz), 7.75 (1H, d, $J = 1.4$ Hz), 7.36 (1H, d d, $J = 2.3, 8.5$ Hz), 7.22 (1H, m), 7.06 (1H, d d, $J = 8.4, 11.0$ Hz), 4.22 (1H, m), 3.60 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 3.07 (3H, s), 2.98 (4H, m), 2.25 (2H, d q, $J = 3.0, 13.0$ Hz), 2.12 (2H, d br, $J = 13.0$ Hz), 1.76 (2H, m), 1.02 (3H, t, $J = 7.5$ Hz)

化合物571 (MP: 182) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 163.7, 150.3, 138.1, 138, 134.1, 131.7, 131.4, 129.7, 129.7, 129, 127.5, 124.8, 116.1, 59, 52.3, 50.5, 31.9, 25

^1H : 11.29 (1H, br), 9.65 (1H, s br), 8.59 (1H, s), 8.27 (1H, s), 7.93 (2H, m d, $J = 8.5$ Hz), 7.81 (2H, m d, $J = 8.6$ Hz), 7.56 (2H, m), 7.48 (3H, m), 4.32 (2H, d, $J = 5.0$ Hz), 4.19 (1H, m), 3.46 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 3.17 (2H, m), 3.95 (3H, s), 2.21 (2H, q br, $J = 13.0$ Hz), 2.0 (2H, d br, $J = 12.5$ Hz)

化合物572 (MP: 223) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 171.3, 160.9, 149.5, 137.4, 136, 131.5, 130.8, 129.7, 129.7, 128.9, 125.9, 120, 118, 115.1, 114.7, 59, 52.4, 50.5, 32, 24.9

^1H : 13.0 (1H, br), 9.77 (1H, s), 9.06 (1H, s), 8.47 (1H,

s), 8.44 (1H, s), 8.23 (1H, s), 8.08 (1H, s), 7.89 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.59 (2H, m), 7.49 (3H, m), 7.02 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 4.35 (2H, d, $J = 4.0$ Hz), 4.26 (1H, m), 3.48 (2H, d br, $J = 11.0$ Hz), 3.18 (2H, m), 3.0 (3H, s), 2.26 (2H, q br, $J = 12.0$ Hz), 2.02 (2H, d br, $J = 12.5$ Hz)

化合物573 (MP: 173-174) 。 NMR溶劑：CDCl₃

¹³C: 165.1, 164.9, 159.2, 151.7, 151.6, 150.4, 150.2, 147.1, 146.8, 142.3, 142.3, 136.9, 136.9, 136.8, 132, 131.8, 126.4, 125.5, 125.5, 122.8, 122.8, 114.1, 111.9, 111.8, 55.3, 55.2, 54.9, 46.4, 45.6, 41, 40.9, 32.3, 32, 28.9, 28.9, 28.3, 28.2

¹H: 8.48 (1H, d d, $J = 1.8, 4.8$ Hz), 7.91 (1H, m), 7.71 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 7.71以及7.64 (1H, 2 m), 7.40 (1H, m), 7.35 (1H, d d, $J = 4.9, 7.5$ Hz), 6.94 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 4.98 (1H, m), 4.32 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.54 (1H, m), 3.34 以及3.15 (1H, 2 m), 3.04 and 3.03 (3H, 2 s), 2.89 (1H, m), 2.11-1.58 (4H, m)

化合物574 (MP: 242-243) 。 NMR溶劑：DMSO

¹³C: 168.1, 156.7, 151.2, 141, 137.4, 126.1, 124.5, 115.4, 112.5, 55.1, 44.9, 40, 31.6, 28.6, 28, 21.4

¹H: 9.46 (1H, s), 8.07 (1H, s), 7.79 (1H, s), 7.64 (2H, d, $J = 8.0$ Hz), 6.77 (2H, d, $J = 8.0$ Hz), 4.50 (1H, d, $J = 12.5$ Hz), 4.09 (1H, m br), 3.90 (1H, d, $J = 12.5$ Hz), 3.10 (1H, m), 2.91 (3H, s), 2.50 (1H, m), 2.01 (3H, s), 1.78 (3H, m), 1.61

(1H, m)

化合物575 (MP: 233-234). NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 156.2, 153.3, 150.9, 139.8, 137.6, 126.6, 125.2, 124.2, 123.1, 113.8, 112.8, 56.8, 55.9, 31.3, 29, 25.2, 24.8

¹H: 9.13 (1H, s), 8.10 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.97 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.83 (1H, d d, J = 2.3, 8.6 Hz), 7.69 (1H, d, J = 2.3 Hz), 7.21 (3H, s br), 7.19 (1H, d, J = 8.6 Hz), 3.85 (3H, s), 3.80 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.59 (3H, m), 1.29 (2H, q br, J = 12.5 Hz), 1.11 (1H, q br, J = 12.5 Hz)

化合物576 (MP: 137-138) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 155.8, 150.7, 139.7, 137.9, 134.5, 129.7, 127.1, 125.4, 125.2, 123.1, 115.3, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.9

¹H: 8.56 (1H, s br), 8.19 (1H, s), 8.13 (1H, s), 8.02 (1H, m d, J = 7.9 Hz), 7.91 (1H, m d, J = 7.8 Hz), 7.61 (1H, t, J = 7.9 Hz), 3.83 (1H, m), 2.95 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q br, J = 13.0 Hz), 1.12 (1H, q br, J = 13.0 Hz)

化合物 : 577 (MP: 146-147). NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 151.3, 148, 141.7, 138.5, 137.1, 128.8, 128.2, 127, 125.8, 121.2, 113.9, 111.4, 61.9, 55.5, 52.3, 31.4, 28.3

¹H: 8.0 (1H, s), 7.65 (1H, s), 7.49 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.36-7.21 (5H, m), 6.56 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 5.13 (2H, s), 3.80 (1H, m), 3.46 (2H, s), 2.92 (3H, s), 2.88 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 1.99 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.81 (2H, d q, J = 3.0, 12.0 Hz), 1.70 (2H, d br, J = 11.5 Hz)

化合物578 (MP: 167-168) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 150.8, 142.3, 139.3, 138.1, 136.6, 129, 128.7, 128.3, 127.1, 126.2, 124.9, 116.2, 61.8, 55.4, 52.1, 31.6, 28

¹H: 8.18 (2H, 2 s), 8.03 (2H, m d, J = 8.6 Hz), 7.83 (2H, m d, J = 8.6 Hz), 7.40-7.20 (5H, m), 7.28 (2H, s br), 3.86 (1H, m br), 3.49 (2H, br), 2.95 (5H, m), 2.02 (2H, br), 1.87 (2H, br), 1.76 (2H, br)

化合物579 (MP: 168) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 151.1, 148, 141.7, 137, 125.8, 121.3, 113.9, 111.4, 56.8, 31.3, 29.1, 25.2, 24.9

¹H: 8.0 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.48 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 6.56 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 5.13 (2H, s), 3.80 (1H, m), 2.91 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, m, J = 12.6 Hz), 1.11 (1H, m, J = 12.6 Hz)

化合物580 (MP: 183-184) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 150.9, 140.6, 138.5, 137.4, 127.3, 125.3, 118, 113.4, 56.8, 31.3, 29, 25.2, 24.9

¹H: 9.55 (1H, s br), 8.07 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.16 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.13 (2H, s br), 3.81 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.57 (3H, m), 1.29 (2H, q br, J = 12.7 Hz), 1.11 (1H, m q, J = 12.5 Hz)

化合物581 (MP: 182 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 155.7, 153, 151, 140.1, 138.5, 137.5, 128.8, 128.2,

127, 126.5, 123.6 (2 sig.), 113.5, 112.6, 61.9, 55.7, 55.5, 52.2, 31.5, 28.2

^1H : 8.09 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.93 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.72 (1H, d d, $J = 1.7, 8.6$ Hz), 7.59 (1H, s br), 7.36-7.21 (5H, m), 7.12 (1H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.01 (4H, br), 3.81 (1H, m), 3.81 (3H, s), 3.47 (2H, s), 2.93 (3H, s), 2.90 (2H, d br, $J = 11.5$ Hz), 1.99 (2H, t br, $J = 11.2$ Hz), 1.83 (2H, d q, $J = 3.5, 12.1$ Hz), 1.71 (2H, d br, $J = 12.5$ Hz)

化合物582 (MP: 199-200) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.3, 151.7, 142.4, 136.9, 126.5, 125.5, 117.4, 114.1, 111.8, 55.3, 53.8, 49, 32.2, 27.7

^1H : 7.91 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.72 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 7.39 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 6.95 (2H, m d, $J = 8.8$ Hz), 4.19 (1H, m), 3.85 (3H, s), 3.59 (2H, m d, $J = 13.5$ Hz), 3.19 (2H, d t, $J = 2.9, 12.9$ Hz), 3.06 (3H, s), 2.0 (2H, d q, $J = 4.4, 12.3$ Hz), 1.91 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物583 (MP: 166-167) ◦ NMR溶劑 : CDCl_3

^{13}C : 159.2, 151.6, 142.2, 136.8, 126.5, 125.6, 114.5, 114.1, 112, 55.3, 54.5, 51.5, 46, 31.9, 28.3

^1H : 7.90 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.72 (2H, m d, $J = 9.0$ Hz), 7.40 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 6.94 (2H, m d, $J = 9.0$ Hz), 4.07 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.54 (2H, s), 3.03 (3H, s), 2.94 (2H, m d, $J = 11.5$ Hz), 2.51 (2H, d t, $J = 3.0, 11.5$ Hz), 1.97 (2H, d q, $J = 4.0, 12.0$ Hz), 1.90 (2H, m)

化合物584 (MP: 189-191) 。 NMR溶劑 : CDCl₃

¹³C: 151.2, 148.6, 146.7, 139.4, 137.3, 132.5, 128.9, 123.6, 114.5, 113.8, 54.7, 51.4, 45.9, 32, 28.3

¹H: 9.02 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.55 (1H, d d, J = 1.7, 4.9 Hz), 8.13 (1H, t d, J = 1.9, 8.0 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.35 (1H, d d, J = 4.9, 8.0 Hz), 4.08 (1H, m), 3.55 (2H, s), 3.05 (3H, s), 2.96 (2H, d br, J = 11.4 Hz), 2.53 (2H, d t, J = 3.0, 11.5 Hz), 1.98 (2H, d q, J = 3.9, 12.0 Hz), 1.92 (2H, m)

化合物585 (MP: 197-198 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 157.8, 149.8, 137.6, 137.1, 131.1, 130, 116.1, 115.4, 115.3, 112.1, 57.3, 52.3, 50.7, 31.9, 25.1, 17, 11

¹H: 9.39 (1H, s), 8.90 (1H, s), 8.21 (1H, s), 7.26 (3H, m), 6.78 (1H, m), 4.22 (1H, m), 3.59 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.12 (2H, q br, J = 11.5 Hz), 3.0 (2H, m), 2.97 (3H, s), 2.23 (2H, d q, J = 3.0, 13.0 Hz), 2.0 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 1.70 (2H, m), 0.91 (3H, t, J = 7.5 Hz)

化合物586 (MP: 183 (分解)) 。 NMR溶劑 : MeOD

¹³C: 150.1, 149.1, 147.6, 137.9, 136.6, 119.3, 118.8, 117.1, 116, 114.4, 59.8, 55.1, 53, 33.7, 26.9, 18.9, 11.4

¹H: 9.31 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.09 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.17 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.10 (1H, d d, J = 2.2, 8.2 Hz), 6.90 (1H, d, J = 8.2 Hz), 4.33 (1H, m), 3.74 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 3.19 (2H, d t, J = 2.8, 13.0 Hz), 3.11 (3H, s), 3.11 (2H,

m), 2.36 (2H, d q, $J = 3.2, 12.8$ Hz), 2.23 (2H, d br, $J = 13.5$ Hz), 1.82 (2H, m), 1.04 (3H, t, $J = 7.5$ Hz)

化合物587 (MP: 153-156 (分解))。NMR溶劑：MeOD

^{13}C : 158.7, 153.4, 152.4, 151.1, 143.5, 139.3, 139, 127.9, 125.6, 125.6, 125.5, 116.6, 113.8, 61.5, 54.8, 53.6, 33.3, 26.9

^1H : 8.69 (1H, d, $J = 5.0$ Hz), 8.11 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.92 (1H, d t, $J = 1.7, 7.6$ Hz), 7.67 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.61 (2H, m d, $J = 8.7$ Hz), 7.52 (1H, d, $J = 7.9$ Hz), 7.47 (1H, d d, $J = 5.0, 7.6$ Hz), 6.81 (2H, m d, $J = 8.7$ Hz), 4.45 (2H, s), 4.28 (1H, m), 3.65 (2H, d br, $J = 11.5$ Hz), 3.25 (2H, m), 3.09 (3H, s), 2.31 (2H, q br, $J = 13.0$ Hz), 2.14 (2H, d br, $J = 12.5$ Hz),

化合物588 (MP: 184)。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 151.1, 140.6, 138.5, 138.5, 137.4, 128.8, 128.2, 127.3, 127, 125.3, 118, 113.3, 61.9, 55.5, 52.2, 31.5, 28.2

^1H : 9.55 (1H, s br), 8.08 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.88 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.73 (2H, m d, $J = 8.7$ Hz), 7.36-7.20 (5H, m), 7.16 (2H, m d, $J = 8.7$ Hz), 7.13 (2H, s br), 3.81 (1H, m), 3.46 (2H, s), 2.94 (3H, s), 2.89 (2H, m d, $J = 11.0$ Hz), 2.0 (2H, t br, $J = 11.0$ Hz), 1.83 (2H, d q, $J = 3.0, 12.0$ Hz), 1.71 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz)

化合物589 (MP: 126-129 (分解))。NMR溶劑：DMSO

^{13}C : 152.8, 151.1, 148.9, 141.1, 138.5, 137.5, 134,

129.1, 128.8, 128.2, 127, 122, 119.6, 117.8, 114.1, 61.9, 55.5, 52.2, 31.5, 28.3

¹H: 8.08 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37 (1H, t d, J = 1.3, 7.8 Hz), 7.33-7.23 (6H, m), 7.21 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.72 (1H, d, J = 7.9 Hz), 5.58 (4H, s br), 3.81 (1H, m), 3.46 (2H, s), 2.93 (3H, s), 2.89 (2H, m d, J = 11.5 Hz), 2.0 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.82 (2H, d q, J = 3.3, 12.0 Hz), 1.71 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物590 (MP: 179-180) ◦ NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 155.6, 150.9, 139.7, 138, 134.5, 129.8, 127.2, 125.5, 125, 123.1, 115.3, 66.3, 54.2, 31.7, 29.1

¹H: 8.57 (1H, s), 8.22 (1H, s), 8.16 (1H, s), 8.04 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.92 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.6 Hz), 4.12 (1H, m), 3.94 (2H, d d, J = 3.7, 11.2 Hz), 3.39 (2H, t, J = 11.5 Hz), 2.98 (3H, s), 1.87 (2H, d q, J = 4.3, 12.2 Hz), 1.71 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物591 (MP: 187-188) ◦ NMR溶劑 : DMSO

¹³C: 160.1, 157.5, 150.7, 139.4, 138, 134.5, 129.7, 128.2, 124.5, 123.8, 122.2, 115.5, 56.8, 31.4, 29, 25.1, 24.8

¹H: 13.0 (1H, s br), 8.32 (1H, t, J = 1.5 Hz), 8.19 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.11 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.06 (1H, t d, J = 1.5, 7.8 Hz), 7.68 (1H, t d, J = 1.5, 7.8 Hz), 7.59 (1H, t, J = 7.8 Hz), 3.83 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q br, J = 13.5 Hz), 1.58 (1H, m)

化合物592 (MP: 148-149) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 158.5, 155.6, 151, 140.6, 137.5, 126.1, 126, 114, 113.1, 55.5, 55.1, 45.7, 31.6, 27.6

^1H : 8.31 (1H, s), 8.09 (1H, s), 7.88 (1H, s), 7.77 (2H, m d, $J = 8.5$ Hz), 6.95 (2H, m d, $J = 8.5$ Hz), 5.20 (2H, s), 3.95 (1H, m br), 3.78 (3H, s), 3.69 (2H, d br, $J = 12.0$ Hz), 2.92 (3H, s), 2.53 (2H, m), 1.78 (2H, q br, $J = 12.5$ Hz), 1.70 (2H, m)

化合物593 (MP: 100-103 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 150.9, 140.2, 138.8, 138.4, 137.7, 134.5, 129.6, 128.9, 128.2, 127, 120.5, 118.6, 116.2, 114.8, 61.8, 55.5, 52.2, 39.2, 31.5, 28.1

^1H : 9.78 (1H, s), 8.12 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.96 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.73 (1H, t br, $J = 1.8$ Hz), 7.56 (1H, m d, $J = 8.0$ Hz), 7.33 (1H, t, $J = 8.0$ Hz), 7.38-7.20 (5H, m), 7.11 (1H, m d, $J = 8.0$ Hz), 3.83 (1H, m br), 3.48 (2H, br), 3.0 (3H, s), 2.94 (3H, s), 2.90 (2H, m br), 2.01 (2H, m br), 1.84 (2H, q br, $J = 11.0$ Hz), 1.73 (2H, d br, $J = 11.0$ Hz)

化合物594 (MP: 138-140) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 160.1, 157.6, 151, 139.4, 138, 134.4, 129.7, 128.2, 124.5, 123.9, 122.2, 115.4, 58.4, 31.3, 28.2, 24

^1H : 13.02 (1H, s br), 8.32 (1H, t br, $J = 1.6$ Hz), 8.19 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 8.10 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 8.08 (1H, m d, $J = 8.0$ Hz), 7.69 (1H, m d, $J = 8.0$ Hz), 7.60 (1H, t, $J = 8.0$

Hz), 4.38 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.69 (4H, m),
1.54 (2H, m)

化合物595 (MP: 228-229) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C : 159.1, 158.5, 151.1, 140.6, 137.5, 126.1, 126.0,
114.0, 113.1, 55.1, 54.6, 46.4, 31.7, 27.2

^1H : 14.96 (1H, br), 8.10 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.89 (1H, d,
 $J = 1.3$ Hz), 7.77 (2H, m d, $J = 9.0$ Hz), 6.96 (2H, m d, $J =$
9.0 Hz), 4.12 (1H, m br), 3.95 (2H, m d, $J = 13.0$ Hz), 3.77
(3H, s), 3.13 (2H, d t, $J = 3.5, 12.5$ Hz), 2.93 (3H, s), 1.90
(2H, m), 1.86 (2H, m)

化合物596 (MP: 178-180 (分解)) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C :無數據

^1H : 8.09 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.88 (1H, d, $J = 1.3$ Hz),
7.77 (2H, m d, $J = 9.0$ Hz), 6.95 (2H, m d, $J = 9.0$ Hz), 5.99
(2H, s), 4.06 (2H, d br, $J = 13.5$ Hz), 4.02 (1H, m), 3.77 (3H,
s), 2.91 (3H, s), 2.71 (2H, t br, $J = 12.0$ Hz), 1.71 (2H, m),
1.64 (2H, d q, $J = 4.0, 12.0$ Hz)

化合物597 (MP: 162-163) 。 NMR溶劑 : DMSO

^{13}C :無數據

^1H : 8.08 (1H, d, $J = 1.3$ Hz), 7.87 (1H, d, $J = 1.3$ Hz),
7.76 (2H, m d, $J = 9.0$ Hz), 6.95 (2H, m d, $J = 9.0$ Hz), 4.51
(1H, s br), 3.85 (1H, m br), 3.77 (3H, s), 3.51 (2H, s br), 3.05
(2H, br), 2.93 (3H, s), 2.48 (2H, m), 2.10 (2H, br), 1.88 (2H,
s br), 1.75 (2H, s br)

3.本發明化合物之生物效力

試管中之測試依照如下所述之操作步驟進行。於試管中以及活體內二者中之對照組係反應混合物減去試驗化合物。因此，於以下針對該測試化合物之表1中，小的值指示為強的抑制劑。值100指示無可測量的抑制作用發生。

活體內測試依照如下所述之操作步驟進行。BRh指示於中樞神經組織中之抑制作用，而LVh指示在周邊組織中之抑制作用，此案例係在肝中。

試管中之操作步驟

依照下列方法測定試管中藥學FAAH活性：

使用從Wistar大鼠中取得之冷凍腦(無小腦)，將每一個腦於15 ml 1 mM MgCl₂、20nM HEPES pH 7.0中，以Potter Elvehjem (8抽，500 rpm)均質化。均質物在36000g，4°C下離心20分鐘(Beckman，70Ti轉子)。將沈澱物重新懸浮於15 ml相同的緩衝液中，在相同條件下離心。將沈澱物重新懸浮於15 ml相同的緩衝液中，於37°C下培育15分鐘，之後其等在36000g，4°C下離心20分鐘。之後將各沈澱物重新懸浮於15 ml之3 mM MgCl₂、1 mM EDTA、50 mM Tris pH 7.4中，利用BioRad蛋白質分析法(BioRad)，使用BSA (50-250 µg/ml)之標準曲線測定蛋白質。等分該膜狀懸浮物，貯存在-80°C下。

FAAH活性之測定係使用AEA (在該分子之乙醇胺部分中標記有³H)作為基質，然後測量所形成之³H-乙醇胺。反應混合物(總體積200 µl)含有：2 µM AEA (2 µM AEA + 5

nM 3H-AEA)、0.1%無脂肪酸之BSA、5 μ g蛋白配製於1 mM EDTA中、10 mM Tris pH 7.6以及10 μ M或0.1 μ M化合物。測試化合物原液(10mM)係配製於100% DMSO中，在分析時，DMSO濃度為0.1%。在37°C下15分鐘之預培育期間後，藉由添加基質溶液(冷EAE +放射標記的EAE + BSA)使反應開始。反應在添加400 μ l之活性碳懸浮液(8 g碳配製於32 ml之0.5 M HCl中，連續攪動)終止之前，進行10分鐘。在室溫攪動下培育30分鐘之後，利用於微量高度離心機中離心(13000 rpm下，10分鐘)，使碳沈積下來。將200 μ l之上清液中加至800 μ l先前已經分配於24井培養盤中之Optiphaser Supermix閃爍液中。於Microbeta TriLux閃爍計數器(10分鐘計數或直到s=2)中測定每分鐘計數數(cpm)。

於每一分析中，存在空白組(無蛋白質，通常低於200 cpm)以及對照組(無化合物)。結果以減去空白組後，對照組之%報告於表1中。

活體內之操作步驟

動物之處理

用於實驗之動物係從Interfauna Ibérica (Spain)取得之雄性NMRI小鼠(重量27-44g)。在受控制的環境條件下(12小時亮/暗周期，室溫22 $\pm$ 1°C)，每個籠子中關5隻小鼠。食物以及自來水隨意提供，實驗全部在光亮時間期間進行。

使用動物餵食不鏽鋼彎針(Perfectum, U.S.A.)，經由口服途徑對動物投與30 mg/kg或3 mg/kg本發明之化合物(8 ml/kg；化合物懸浮於0.5%羧甲基纖維素(CMC)中或溶於水

中)或載體(對照組)。在犧牲之前15分鐘，於腹膜內投與戊巴比妥(pentobarbital) 60 mg/kg將動物麻醉。移出肝、左肺葉以及沒有小腦之腦部分，然後置於含有膜緩衝液(3 mM MgCl_2 ，1 mM EDTA，50 mM Tris HCl pH 7.4)之塑膠小瓶中。組織貯存在 -30°C 下直到分析時。

在投與化合物之前，動物一直禁食一整夜，時間點>18小時除外，此時食物會在投與當天之早上移開，而在同一天的下午投與化合物。之後只給動物水。

所有的動物操作程序均嚴守歐洲實驗用及其它科學研究用脊椎動物之保護指令(86/609CEE)以及葡萄牙法律(Decreto-Lei 129/92，Portarias 1005/92 e 1131/97)。所使用之動物的數目依照現行規章以及科研誠信，使用最低可能的數目。

試劑以及溶液

大麻素[乙醇胺- $1\text{-}^3\text{H}$] (40-60Ci/mmol)從 American Radiochemicals取得。全部的試劑均從Sigma-Aldrich取得。Optiphase Supermix從Perkin Elmer取得以及活性碳從Sigma-Aldrich取得。

組織之製備

組織在冰上解凍，且在配製於10體積的膜緩衝液(3 mM MgCl_2 ，1 mM EDTA，50 mM Tris HCl pH 7.4)中，用Potter-Elvehjem (腦-500 rpm下8抽)或Heidolph Diax (肝-2抽，定點20秒(5)，30秒間歇)均質化。

用BioRad蛋白質分析法(BioRad)，使用BSA之標準曲線

(50-250 $\mu\text{g/ml}$)，測定組織中之總蛋白。

酵素分析

反應混合物(總體積200 μl)含有：2 μM AEA (2 μM AEA + 5 nM ^3H -AEA)、0.1%無脂肪酸之BSA、15 μg (腦)、5 μg (肝)或50 μg (肺)蛋白配製於1 mM EDTA中、10 mM Tris pH 7.6。在37°C下預培育15分鐘後，藉由添加基質溶液(冷AEA+放射標記的AEA+BSA)使反應開始。在藉由添加400 μl 活性碳懸浮液(8 g碳配製於32 ml 0.5 M HCl中，連續攪動)終止之前，反應進行10分鐘(腦與肺)或7分鐘(肝)。在室溫下培育30分鐘後，利用於微量高度離心機中離心(13000 rpm下，10分鐘)，使碳沈積下來。將200 μl 之上清液加至800 μl 先前已經分配於24井培養盤中之Optiphasc Supermix閃爍液中。於Microbeta TriLux閃爍計數器中測定每分鐘計數數(cpm)。

於每一分析中，製備空白組(無蛋白質)。

計算減去空白組之後，相對於對照組之酵素活性之百分比。

表 1

	名稱	類型	試管中			活體內			
			10 uM	100 nM	BRh 30mg.kg.1h	LVh 30mg.kg.1h	BRh 3mg.kg.8h	LVh 3mg.kg.8h	
1	(1H-咪唑-1-基)(嗎咻基)甲酮	咪唑類	62.6						
2	N-甲基-N-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	11.7						
3	嗎咻基(4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類	4.8						
4	N-甲基-N-4-二苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	0.1	83.6	14.3	10.6			
5	N,3-二苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	91.3						
6	N-(4-甲氧基苯基)-3-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	91.1						
7	N-甲基-N-苯基-1H-1,2,4-三唑-1-氣甲鹽	1,2,4-三唑類	0	17					
8	N-甲基-N-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	13.2						
9	N-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	78.6						
10	N-(4-苯氧基苯基)-3-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	55						
11	N-(4-(苯甲氧基)苯基)-3-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	82.6						
12	N-甲基-N,3-二苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	86						
13	嗎咻基(3-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類	89.7						
14	N-甲基-4-(蔡-2-基)-N-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	0	68.3	96.7	77.3			
15	N-(二苯基-4-基)-3-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	66.9	103.8					
16	N-(4-甲氧基苯基)-N-甲基-4-(蔡-2-基)-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	24.7						
17	N-(4-甲氧基苯基)-N-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	65						
18	N-甲基-N-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	67.9						
19	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(嗎咻基)甲酮	苯并三唑類	0.1	3.1	46.6	41.1			
20	3-(二苯基-4-基)-N-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	97.3						
21	嗎咻基(3-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-基)甲酮氮氣化合物	咪唑類	79.1						
22	3-(二苯基-4-基)-N-(3-甲氧基苯基)-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	95.8						
23	3-(二苯基-4-基)-N-(4-甲氧基苯基)-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	93						
24	N-甲基-N-苯基-3-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	22.9						
25	3-(二苯基-4-基)-N-甲基-N-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	99						
26	N-甲基-N,2-二苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	92.6						
27	4-(4-氧基苯基)-N-甲基-N-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	0.2	71.4					
28	4-(4-甲氧基苯基)-N-甲基-N-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	0.7	85.1					
29	4-(4-氧基苯基)-N-甲基-N-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類	0	52.5	10.7	17.2			

30	4-(2-氟苯基)-N-甲基-N-苯基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類	0.1	72.5				
31	4-(3-甲氧苯基)-N-甲基-N-苯基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類	0	69				
32	6-氟基-N-甲基-N-苯基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑類	0	0.1	85.9		64.9	
33	5-氟基-N-甲基-N-苯基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑類	0	6.2	82.3		76.7	
34	N-甲基-N-苯基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑類	0	0.6	33.6		34.3	
35	4-(二苯基-4-基)-N-甲基-N-苯基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類	103.1					
36	N-(4-氟苯基)-4-(4-甲氧苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類	5					
37	(3,4-二氫喹啉-1(2H)-基)(4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類	51.7					
38	4-(4-羥苯基)-N-甲基-N-苯基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類	0	83.9				
39	(3,4-二氫喹啉-1(2H)-基)(4-(3-甲氧苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類	16			120.6	101.1	
40	4-(3-羥苯基)-N-甲基-N-苯基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類	0.1	88.8	81.5	4.5	102.8	25.6
41	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-苯基吸噁-1-基)甲酮	苯并三唑類	0	0	87.6	30		
42	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-苯基吸噁-1-基)甲酮	苯并三唑類	0	0	8.4	6.4		
43	4-(4-氟苯基)-N-(4-氟苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類	0.1	88				
44	(3,4-二氫喹啉-1(2H)-基)(4-(4-氟苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類		97.8				
45	4-(2-氟苯基)-N-(4-氟苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類		83				
46	(5-氟基-1H-吡啶-1-基)(嗎咻基)甲酮	吡啶類		104.3				
47	(5-甲氧基-1H-吡啶-1-基)(嗎咻基)甲酮	吡啶類		97.2				
48	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(苯并[d][1,3]二噁茂5-基)噻吩-1-基)甲酮草酸酯	苯并三唑類		0.1	21.8	20.1		
49	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(吡啶-2-基)噻吩-1-基)甲酮	苯并三唑類		0.1	16.9	14.9		
50	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(3,4-二氫異喹啉-2(1H)-基)甲酮	苯并三唑類		0	32.6	7.8		
51	(3,4-二氫喹啉-1(2H)-基)(4-(3-羥苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類		100.8		130.4	132.3	
52	(5-羥基-1H-吡啶-1-基)(嗎咻基)甲酮	吡啶類		102.7				
53	N-苯基-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑類		0	1.4	6.3		
54	N-(4-氟苯基)-4-(4-羥苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類		91				
55	1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基(1,4-二噁-8-氮雜螺[4.5]癸-8-基)甲酮	苯并三唑類		0.2	2.2	2.5	42.6	37.8
56	N-(4-苯基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑類		90.7				
57	N-(4-甲氧苯基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑類		96.9				
58	N-環己基-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑類		1	0.3	0.9	0.5	0.3
59	N-(2,4-二氟苯基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑類		100.4				
60	N-苯基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑類		93.8				
61	N-苯基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑類		2.2	87.5	83.9		
62	N-(4-氟苯基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑類		93.7				



63	N-(4-氟苯基)-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類	12.6	57	49.7		
64	3-(4-甲氧苯基)-N-甲基-1H-1,2,4-三唑-1-基甲酯	1,2,4-三唑類	67.9				
65	3-(4-甲氧苯基)-1H-1,2,4-三唑-1-基(嗎啡基)甲酯	1,2,4-三唑類	86.5				
66	N-(4-氟苯基)-3-(4-甲氧苯基)-N-甲基-1H-1,2,4-三唑-1-基甲酯	1,2,4-三唑類	80.9				
67	3-(4-氟苯基)-N-甲基-N-苯基-1H-1,2,4-三唑-1-基甲酯	1,2,4-三唑類	61				
68	3-(4-氟苯基)-1H-1,2,4-三唑-1-基(嗎啡基)甲酯	1,2,4-三唑類	73.5				
69	3-(4-氟苯基)-N-(4-氟苯基)-N-甲基-1H-1,2,4-三唑-1-基甲酯	1,2,4-三唑類	80.8				
70	N-(2,4-二氟苯基)-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類	1.9	52	42.5		
71	1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酯	苯并三唑類	2.3	0.3	2.2	1.8	2.5
72	3-氟基-1H-噁唑-1-基(嗎啡基)甲酯	噁唑	87.6				
73	嗎啡基(3-苯基-1H-1,2,4-三唑-1-基)甲酯	1,2,4-三唑類	85.8				
74	N-(2,4-二氟苯基)-N-甲基-3-苯基-1H-1,2,4-三唑-1-基甲酯	1,2,4-三唑類	73.2				
75	N-丁基-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類	0	0.4	2.7		
76	N-甲基-N-(4-嗎啡基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類	97.1				
77	N-(3,5-二甲氧苯基)-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類	76.3				
78	3-(2,4-二氟苯基)-1H-1,2,4-三唑-1-基(嗎啡基)甲酯	1,2,4-三唑類	81.9				
79	(4-苯基噁唑-1-基)(3-(2,4-二氟苯基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)甲酯	1,2,4-三唑類	0.8	10.3	9.8	70	45.2
80	N,3-雙(2,4-二氟苯基)-N-甲基-1H-1,2,4-三唑-1-基甲酯	1,2,4-三唑類	89.5				
81	N-(4-(二甲胺基)苯基)-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類	49.2				
82	1,4'-二噁唑-1'-基(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)甲酮氮氣化物	苯并三唑類	69.3				
83	1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基(4-甲基噁唑-1-基)甲酮氮氣化物	苯并三唑類	2.5				
84	N-甲基-N-(吡啶-2-基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類	62.5				
85	N-(4-苯基丁基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類	0.1				
86	N-十二烷基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類	0				
87	N-環己基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類	0			3.4	4
88	N-(二苯基-4-基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類	105.4				
89	嗎啡基(4-苯基-1H-1,2,3-三唑-1-基)甲酯	1,2,3-三唑類	4.5				
90	1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基(4-嗎啡基噁唑-1-基)甲酮氮氣化物	苯并三唑類	38.6				
91	1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基(4-(苯基噁唑-1-基)甲酯)	苯并三唑類	0				
92	1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基(4-(吡咯烷-1-基)噁唑-1-基)甲酮氮氣化物	苯并三唑類	96				
93	1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基(4-苯基噁唑-1-基)甲酮氮氣化物	苯并三唑類	0				
94	1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基(4-苯基噁唑-1-基)甲酯	苯并三唑類	0				
95	5-(3-氟苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類	0.7				
96	N-環己基-5-(4-氟苯基)-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類	14.3				



97	5-溴基-N-環己基-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲鹽	苯并三唑類	0				
98	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(吡咯烷-1-基)甲酮	苯并三唑類	0.6				
99	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(對-甲氧基)吡啶-1-基)甲酮	苯并三唑類	0.2			99.1	71.4
100	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-苯乙基吡啶-1-基)甲酮	苯并三唑類	0.2			68.1	40.5
101	(4-苯基-1H-咪唑-1-基)(4-苯基吡啶-1-基)甲酮	咪唑類	0.5				
102	(4-苯基吡啶-1-基)(4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類	0.9				
103	N-環己基-N-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-基甲鹽	咪唑類	0	37.5			
104	N-環己基-N-乙基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲鹽	苯并三唑類	94.2				
105	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(2-(吡咯烷-1-基)乙基)吡啶-1-基)甲酮 氮氣化物	苯并三唑類	64.7				
106	N-環己基-6-(4-氟苯基)-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲鹽	苯并三唑類	2.3				
107	3-(1-(環己基(甲基)氨基)噻吩-1-基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-基)苯酸	苯并三唑類	13.5				
108	5-(3-氨基甲噻吩基)-N-環己基-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基 甲鹽	苯并三唑類	7.4				
109	6-(3-氨基甲噻吩基)-N-環己基-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基 甲鹽	苯并三唑類	0				
110	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(3-苯基丙基)吡啶-1-基)甲酮	苯并三唑類	0.1			51.7	10.2
111	(3-苯基-1H-1,2,4-三唑-1-基)(4-苯基吡啶-1-基)甲酮	1,2,4-三唑類	1.5				
112	4-(1-(4-苯基吡啶-1-基)-1H-咪唑-4-基)苯甲酰胺	咪唑類	7.2				
113	4-(4-氨基甲噻吩基)-N-甲基-N-苯基-1H-咪唑-1-基甲鹽	咪唑類	90.3			84.1	32.3
114	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(吡啶-4-基)吡啶-1-基)甲酮	苯并三唑類	0.1			102.9	109.9
115	N-甲基-N-乙基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲鹽	苯并三唑類	0				
116	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(3-(吡啶-3-基)-1,2,4-噁二唑-5-基)吡啶-1-基)甲酮	苯并三唑類	0.5			126.2	113.2
117	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(4-氨基苯氧基)吡啶-1-基)甲酮	苯并三唑類	0.1				
118	N-甲基-N-(3-苯基丙基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲鹽	苯并三唑類	0				
119	N-(3-甲氧基苯基)-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲鹽	苯并三唑類	0				
120	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-苯氧基吡啶-1-基)甲酮	苯并三唑類	0.1				
121	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(4-氟苯基)吡啶-1-基)甲酮	苯并三唑類	0			118.6	116.1
122	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(4-甲氧基吡啶-1-基)甲酮)氮氣 化物	苯并三唑類	93				
123	N-(3-氨基苯基)-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲鹽	苯并三唑類	0				
124	(4-苯基吡啶-1-基)(3-苯基-1H-1,2,4-三唑-1-基)甲酮氮氣化物	1,2,4-三唑類	1.5				
125	(3-(4-(苯基)氨基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)(4-苯基吡啶-1-基)甲酮 氮氣化物	1,2,4-三唑類	53.5				



126	N-金刚烷基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑类		0		0.2	2.2
127	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-羧基苯基)甲酮	苯并三唑类		0.1		111.5	107.3
128	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-羧基苯基)甲酮	苯并三唑类		0			
129	N-甲基-N-(5-羧基苯基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑类		0		2.5	2
130	N-(4-羧基苯基)-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑类		0			
131	N-甲基-N-(2-羧基苯基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑类		0			
132	(3-(4-(4-甲基苯基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(对-甲基苯基)吡啶-1-基)甲酮氮氧化物	1,2,4-三唑类		85.1			
133	(3-(4-(4-甲基苯基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(咪唑基)甲酮	1,2,4-三唑类		90.7			
134	(3-(2,4-二羧基苯基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)(4-(对-甲基苯基)吡啶-1-基)甲酮	1,2,4-三唑类		34.5			
135	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(3-羧基丙基)吡啶-1-基)甲酮	苯并三唑类		0.1		26.5	30.1
136	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(4-羧基苯基)吡啶-1-基)甲酮	苯并三唑类		0.2			
137	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(4-羧基苯基)吡啶-1-基)甲酮	苯并三唑类		0.1			
138	N,N-二甲基-3-(4-(4-羧基苯基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)甲酯	1,2,4-三唑类		83.8			
139	(3-(4-(4-甲基苯基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)(4-(咪唑基)甲酮	1,2,4-三唑类		80.2		97.1	105.7
140	3-(4-(4-羧基苯基)-N,N-二甲基-1H-1,2,4-三唑-1-基)甲酯	1,2,4-三唑类		58.6			
141	4-(4-(1-(咪唑-4-羧基)-1H-1,2,4-三唑-3-基)苯基)苯并亚硝酸酯	1,2,4-三唑类		15.9			
142	(R)-N-(奎宁-3-基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯氮氧化物	苯并三唑类		101.8			
143	N-(3,3-二甲基-1,5-二噁螺[5.5]十一烷-9-基)-N-甲基-1H-苯并三唑-1-氧甲酯	苯并三唑类		2.5		0.4	0.7
144	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(2-(4-羧基苯基)乙基)吡啶-1-基)甲酮	苯并三唑类		0.1		68.2	17.6
145	4-(4-(1-(4-羧基苯基)-1H-1,2,4-三唑-3-基)苯基)苯并亚硝酸酯氮氧化物	1,2,4-三唑类		0.3		89.9	116.5
146	3-(4-(4-羧基苯基)甲酯)苯基)-N,N-二甲基-1H-1,2,4-三唑-1-氧甲酯	1,2,4-三唑类		77.1			
147	4-(4-(1-(咪唑-4-羧基)-1H-1,2,4-三唑-3-基)苯基)苯甲酯	1,2,4-三唑类		55.1		124.4	103
148	4-(4-(1-(4-羧基苯基)-1H-1,2,4-三唑-3-基)苯基)苯甲酯	1,2,4-三唑类		0.3		113.7	87.6
149	3-(4-(4-羧基苯基)甲酯)苯基)-N-甲基-1H-1,2,4-三唑-1-氧甲酯	1,2,4-三唑类		49.9			
150	N-甲基-4-(4-羧基苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑类		1.2		5.6	3.8
151	N-甲基-3-(4-(4-羧基苯基)甲酯)苯基)-N-甲基-1H-1,2,4-三唑-1-氧甲酯	1,2,4-三唑类		0.4		116.7	65.8
152	N-((1,4-二羧基苯基)乙基)-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑类		1.3			
153	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(3-羧基苯基)吡啶-1-基)甲酮	苯并三唑类		0			
154	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-羧基苯基)甲酮	苯并三唑类		0.2			
155	(4-羧基苯基)-1-基(3-(羧基-2-基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)甲酮	1,2,4-三唑类		0.4		144.1	108.2

156	N-(2-(苯甲氧基)乙基)-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑类		0.1		67.2	24.4
157	N-(2-(4-甲氧基苯氧基)乙基)-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑类		0		5.2	3.5
158	(4-苯甲氧基咪唑-1-基)(3-(苯硫-2-基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)甲酮氮氧化物	1,2,4-三唑类		0.3		92	85.6
159	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-糠基咪唑-1-基)甲酮	苯并三唑类		4.8			
160	3-苯甲基-N-甲基-N-苯基-1H-1,2,4-三唑-1-氧甲酯	1,2,4-三唑类		18.8			
161	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑类	3.3	93.6			
162	(6-溴基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	苯并三唑类		0		0.9	3.1
163	3-(3-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-3H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-基)苯甲酰胺	苯并三唑类		0.6		6.3	2.4
164	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(4-(苯甲氧基)咪唑-1-基)甲酮	苯并三唑类		0.3			
165	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(4-甲氧基苯氧基)咪唑-1-基)甲酮	苯并三唑类		0			
166	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(3-甲氧基苯氧基)咪唑-1-基)甲酮	苯并三唑类		0			
167	1-[(1,1-二氧撑-1,3-噁唑烷-3-基)羧基]-1H-苯并三唑	苯并三唑类		96.2		99.9	104
168	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4-(4-丁氧基苯氧基)咪唑-1-基)甲酮	苯并三唑类		0			
169	N-甲氧基-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑类		73.6			
170	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(噁唑烷-3-基)甲酮	苯并三唑类		2.1			
171	氮杂环烷辛-1-基(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)甲酮	苯并三唑类		15.2			
172	氮杂环庚烷-1-基(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)甲酮	苯并三唑类		0.3			
173	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)((2R,6S)-2,6-二甲基咪唑-1-基)甲酮	苯并三唑类		70.6			
174	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(异噁咪唑-2-基)甲酮	苯并三唑类		0.7			
175	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(3,5-二甲基咪唑-1-基)甲酮	苯并三唑类		21			
176	乙基1-(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-羧基)咪唑-4-羧酸酯	苯并三唑类		0.2			
177	乙基4-(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-羧基)咪唑-1-羧酸酯	苯并三唑类		6.9			
178	1-(4-(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-羧基)咪唑-1-基)乙酮	苯并三唑类		94.5			
179	1-(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-羧基)咪唑-4-氧甲酯	苯并三唑类		49			
180	N-甲基-N-苯基-3-(苯硫-2-基)-1H-1,2,4-三唑-1-氧甲酯	1,2,4-三唑类		57.5			
181	N-苯甲基-N-甲基-3-(苯硫-2-基)-1H-1,2,4-三唑-1-氧甲酯	1,2,4-三唑类		0.9			
182	(3-苯甲基-1H-1,2,4-三唑-1-基)(4-苯基咪唑-1-基)甲酮	1,2,4-三唑类		0.6		90.6	111
183	(3-(2,4-二氧基苯基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	1,2,4-三唑类		102		2.4	78.1
184	(3,4-二氧基咪唑-2(1H)-基)(4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑类		30.2			
185	(3-(4-氧基苯基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)(3,4-二氧基咪唑-2(1H)-基)甲酮	1,2,4-三唑类		71.8			
186	(4-(4-氧基苯基)-1H-咪唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑类		96.5		78.7	37.7
187	4-(4-(1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-1H-1,2,4-三唑-3-基)苯氧基)苯甲酰胺	1,2,4-三唑类		92.8		85.6	108.6
188	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(3-(4-甲氧基苯基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)甲酮	1,2,4-三唑类		103.3		78.7	89



189	(3-(4-氣苯基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	1,2,4-三唑類	98.5			105.9	87.6
190	N-苯甲基-N-甲基-3-(蔡-2-基)-1H-1,2,4-三唑-1-氣甲酯	1,2,4-三唑類	20.7				
191	N-苯甲基-N-甲基-3-(蔡-1-基)-1H-1,2,4-三唑-1-氣甲酯	1,2,4-三唑類	21			60	20.8
192	N-甲基-3-(蔡-1-基)-N-苯基-1H-1,2,4-三唑-1-氣甲酯	1,2,4-三唑類	64.6				
193	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)((2R,6R)-2,6-二甲基嗎咭基)甲酮	苯并三唑類	110.2				
194	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)((2S,6R)-2,6-二甲基嗎咭基)甲酮	苯并三唑類	64.2				
195	(S)-N-甲基-N-(1-苯基乙基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氣甲酯	苯并三唑類	15.7			9.1	5.7
196	(4-(二苯基-3-基)-1H-咪唑-1-基)(4-苯基哌啶-1-基)甲酮	咪唑類	2.5			88.1	78.3
197	(4-(4-氣苯基)-1H-咪唑-1-基)(4-(3-苯基丙基)哌啶-1-基)甲酮	咪唑類	0.3				
198	(4-(3,4-二氣基苯基)-1H-咪唑-1-基)(1,4-二噁-8-氣雜螺[4.5]癸-8-基)甲酮	咪唑類	33				
199	4-(4-胺基苯基)-N-甲基-N-苯基-1H-咪唑-1-氣甲酯	咪唑類	89			45.9	19.7
200	N-甲基-N-苯基-4-(3-(2-(哌啶-1-基)乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-氣甲酯二氣氧化物	咪唑類	100.1				
201	(4-環己基哌啶-1-基)(4-(3,4-二氣基)-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類	0.3				
202	N-(2-(苯甲氧基)乙基)-N-乙基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氣甲酯	苯并三唑類	0.1				
203	N-甲基-N-苯基-4-(4-(2-(哌啶-1-基)乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-氣甲酯二氣氧化物	咪唑類	93.5			101.8	64.3
204	(3-(4-氣苯基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)(1,4-二噁-8-氣雜螺[4.5]癸-8-基)甲酮	1,2,4-三唑類	15.8				
205	(3-(4-甲氧基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)(4-(3-苯基丙基)哌啶-1-基)甲酮	1,2,4-三唑類	0.2				
206	(3-(蔡-1-基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)(4-苯基哌啶-1-基)甲酮	1,2,4-三唑類	3.3				
207	4-(3-(1-(1,2,3,4-四氣異噻唑-2-羧基)-1H-1,2,4-三唑-3-基)苯氧基)苯甲酯	1,2,4-三唑類	31.6				
208	4-(3-(1-(4-苯基哌啶-1-羧基)-1H-1,2,4-三唑-3-基)苯氧基)苯甲酯	1,2,4-三唑類	0.2			97.2	96.7
209	4-(3-(1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-1H-1,2,4-三唑-3-基)苯氧基)苯甲酯	1,2,4-三唑類	101.5			99.8	70.1
210	4-(3-(1-(嗎咭-4-羧基)-1H-1,2,4-三唑-3-基)苯氧基)苯甲酯	1,2,4-三唑類	73.3				
211	(4-(4-氣苯基)哌啶-1-基)(3-(4-甲氧基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)甲酮	1,2,4-三唑類	1.9				
212	(3-(4-氣苯基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)(4-環己基哌啶-1-基)甲酮 氣氧化物	1,2,4-三唑類	0.8				
213	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(3-(苯硫-2-基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)甲酮	1,2,4-三唑類	105.6			53.7	6.9
214	(3-(4-氣苯基)-1H-1,2,4-三唑-1-基)(噁唑烷-3-基)甲酮	1,2,4-三唑類	23.7				
215	(4-(3,4-二氣基)-1H-咪唑-1-基)(噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類	16.7				
216	(4-(3,4-二甲氧基)-1H-咪唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類	108.6	38.3		29.3	13.3
217	N-環己基-4-(3,4-二甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲酯	咪唑類	80.5	0		6	4.2
218	(4-(3,4-二氣基)-1H-咪唑-1-基)(吡咯烷-1-基)甲酮	咪唑類	31.6				
219	(1H-苯并[d]咪唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類	111.6	50.6		86.8	89

220	(2,2-二甲基噁唑烷-3-基)(4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類			103.7		31.5	20
221	((2R,6S)-2,6-二甲基吡啶-1-基)(4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類			105.8		104.5	44.9
222	N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-基[d]-咪唑--1-氣甲醯	咪唑類			102.9		111.5	59.2
223	(4-(4-氣苯基)-1H-咪唑-1-基)(4-(4-氣苯基)吡啶-1-基)甲酮	咪唑類			1.1			
224	N-甲基-N-苯基-4-(4-(2-(吡啶-1-基)乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-氣甲醯 沒化物	咪唑類			90			
225	(4-(4-(苯甲氧基)-3-甲氧基)-1H-咪唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基) 甲酮	咪唑類			79			
226	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-基)甲酮二氮氯化物	咪唑類			76.6		8.4	5.1
227	(2-甲基噁唑烷-3-基)(4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類			64.7			
228	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(4-羥基-3-甲氧基)-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類			78.1		56.4	31.9
229	N-金剛烷基-N-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類			99.2			
230	N-甲基-4-(4-(2-嗎啡乙氧基)苯基)-N-苯基-1H-咪唑-1-氣甲醯 氮氯化物	咪唑類			96.1			
231	(4-(二苯基-3-基)-1H-咪唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類			54.2		3.9	3.6
232	3'-(1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羥基)-1H-咪唑-4-基)二苯基-3-氣甲醯	咪唑類	0		84.7		82.8	6.5
233	(4-(4-氣苯基)-1H-咪唑-1-基)(2-乙基-2-甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類			74.1		33.5	21.1
234	2-(N-環戊烯基-4-苯基-1H-咪唑-1-甲醯胺基)乙基-4-苯基-1H-咪唑-1- 羧酸酯	咪唑類			78.2			
235	(4-(4-氣苯基)-1H-咪唑-1-基)(2,4,4-三甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類			76.2		108.5	80.1
236	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(3'-甲氧基二苯基-3-基)-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類			75.4		67.7	37.7
237	N-金剛烷基-4-苯基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類			91.6			
238	4-(3'-脛基甲醯基二苯基-3-基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類			1.2		67.9	2.8
239	4-(二苯基-3-基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類			4		16.4	4.6
240	N-環己基-4-(3'-甲氧基二苯基-3-基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類			22.4		99	39.5
241	(4-(4-氣苯基)-1H-咪唑-1-基)(2-苯基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類			76.5			
242	N-環己基-6-脛基-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氣甲醯	苯并咪唑類			0			
243	3-(1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羥基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-基)苯甲醯胺	苯并咪唑類			39.7			
244	4-(4-氣苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類			5.4			
245	4-(4-脛基甲醯基二苯基-3-基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類			0.4		90.6	15.8
246	N-環己基-4-(3'-氣二苯基-3-基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類			2.9			
247	N-環己基-4-(3'-脛二苯基-3-基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類			0.5		131.7	85.5
248	N-環己基-N-甲基-4-(3'-(三氣甲氧基)二苯基-3-基)-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類			68.9		104.2	57
249	N-苯甲基-4-(4-氣苯基)-N-異丙基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類			95.8			
250	N-苯甲基-N-異丙基-4-苯基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類			90.5		102.1	52.6
251	N-苯甲基-N-叔丁基-4-苯基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類			91.7			



252	N-苯甲基-N-叔-丁基-4-(4-氟苯基)-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			83.6			
253	3-(4-氟苯基)-1-[(1,1-二氧雜-1,3-噻唑烷-3-基)羧基]-1H-1,2,4-三唑	1,2,4-三唑類			107.7			
254	N-環己基-N,5-二甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類	109		81		98.3	89.9
255	N-苯甲基-N-異丙基-4-(3-甲氧基)-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			96.7			
256	N-苯甲基-N-叔-丁基-4-(3-甲氧基)-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			105.6			
257	4-(3-氟二苯基-3-基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			65.6		60.1	12.2
258	N-環己基-4-(3'-乙氧二苯基-3-基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			39.9			
259	4-(5-氟基-2-氟二苯基-3-基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			33.7			
260	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(4-羥苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類	37.3		95.3		8.1	7.8
261	N-環己基-4-(4-羥苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類	0		54.1		1.2	1.2
262	N-環戊基-4-(3-羥苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			7.5			
263	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(5-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類			92.1		98.1	98.8
264	N-苯甲基-N,5-二甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			88		115	76.6
265	N-苯甲基-4-(3-羥苯基)-N-異丙基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			99.6			
266	N-環戊基-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲醚	苯并三唑類			0.2			
267	(4-(4-氟苯基)-1H-咪唑-1-基)(5-乙基-2,2-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類			84.1		79.4	83.7
268	(5-氟基-4-苯基-1H-咪唑-1-基)(2,2-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類			104.1			
269	(2,5-二氟基-4-(4-氟苯基)-1H-咪唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類			106.2			
270	(5-乙基-2,2-二甲基噁唑烷-3-基)(4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類			113.1			
271	N-環己基-4-(2-甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			55.8			
272	N-環己基-4-(3,4-二氟基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			63.6		19	7.1
273	N-環己基-4-(4-氟基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			65.1		3.4	2.6
274	N-環己基-4-(3,4-二氟基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			85			
275	N-環己基-N-甲基-4-(3-硝基)-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			43.8		12.8	2.4
276	N-環己基-4-(4-(二氧甲氧基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			71.5		1.4	2
277	4-(4-氟基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			72.1			
278	N-甲基-4-苯基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			103.5		1.6	1.8
279	N-環己基-N,2-二甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			87.3		91.6	94.1
280	(5-氟基-4-(4-氟基)-1H-咪唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類			111.8			
281	N-環戊基-4-(3,4-二甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			25.5			
282	N-(1-苯甲基哌啶-4-基)-N-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-基甲醚	咪唑類			40.9		0.5	1.6
283	N-環己基-N-甲基-3-苯基-1H-1,2,4-三唑-1-基甲醚	1,2,4-三唑類			75.1			
284	N-環己基-N,5-二甲基-3-苯基-1H-1,2,4-三唑-1-基甲醚	1,2,4-三唑類			146.2		130.7	145.6
285	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(3-苯基-1H-1,2,4-三唑-1-基)甲酮	1,2,4-三唑類			85.4			

286	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(5-甲基-3-苯基-1H-1,2,4-三唑-1-基)甲酮	1,2,4-三唑類				104	93
287	4-(3'-巰基甲醯基-2-苯基-3-基)-N-甲基-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醯-丙-2-醇(1:1)	咪唑類				105.8	85.7
288	4-[3-(苯甲氧基)苯基]-N-甲基-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類					
289	N-甲基-4-吡啶-3-基-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類				113.2	96.1
290	4-二苯基-3-基-N-甲基-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類				115	112.4
291	N-甲基-4-(3-吡啶-4-基苯基)-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類					
292	(4-(4-氣苯基)-1H-咪唑-1-基)(2,2-二甲基-5-苯基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類					
293	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(6-甲氧基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)甲酮	苯并三唑類				3.5	1.7
294	N-環戊基-4-(4-羥苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類				1.4	1.4
295	(5-氣基-4-苯基-1H-咪唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類				77.9	32.4
296	4-(3-羥苯基)-N-甲基-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類					
297	N-((1r,4r)-4-羥環己基)-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氣甲醯	苯并三唑類					
298	(2,2-二甲基-5-苯基噁唑烷-3-基)(4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類				74.4	59.2
299	(4-(4-氣苯基)-1H-咪唑-1-基)(2,2-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類					
300	5-氣基-N-環己基-N-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類					
301	(5-溴基-4-(4-氣苯基)-1H-咪唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類					
302	(4-乙基噁唑烷-3-基)(4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類					
303	(4-(3,4-二氣苯基)-1H-咪唑-1-基)(4-乙基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類					
304	(4-乙基噁唑烷-3-基)(4-(3-甲氧基)-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類					
305	N-甲基-4-(3-吡啶-3-基苯基)-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類					
306	N-甲基-4-(3-噻吩-5-基苯基)-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類					
307	N-環己基-4-(3-羥苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類				137.6	10.1
308	(4-(3,4-二氣苯基)-1H-咪唑-1-基)(5-苯基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類					
309	(4-苯基-1H-咪唑-1-基)(5-苯基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類					
310	(4-甲基噁唑烷-3-基)(4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類					
311	(4-(3,4-二氣苯基)-1H-咪唑-1-基)(4-甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類					
312	N-環己基-N-乙基-4-苯基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類					
313	N-環己基-4-(3,4-二甲氧基)-N-乙基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類					
314	N-環己基-4-(3-氣基-4-甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類				84.3	48
315	N-環戊基-4-(3-氣基-4-甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類					
316	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(3-氣基-4-甲氧基)-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類					

317	4-[4'-(二甲胺基)二苯基-3-基]-N-甲基-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類						
318	4-[3-(2,4-二甲氧基噻吩-5-基)苯基]-N-甲基-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類						
319	N-環己基-4-(4-氣基-3-甲氧苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類	19.2			5.9	2	
320	4-[3-(6-氣吡啶-3-基)苯基]-N-甲基-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類						
321	N-環戊基-4-(4-氣基-3-甲氧苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類				1.4	1.2	
322	4-(3'-羥基二苯基-3-基)-N-甲基-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類						
323	4-[3-(6-甲氧基吡啶-3-基)苯基]-N-甲基-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類						
324	4-[4'-(乙醯胺基)二苯基-3-基]-N-甲基-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類						
325	4-(3-呋喃-3-基苯基)-N-甲基-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類						
326	N-環戊基-4-(4-甲氧苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類						
327	N-環戊基-4-(3-甲氧苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類						
328	(4,4'-二甲基噻吩-3-基)(4-(4-甲氧苯基)-1H-咪唑-1-基)甲醴	咪唑類						
329	(4,4'-二甲基噻吩-3-基)(4-(3-甲氧苯基)-1H-咪唑-1-基)甲醴	咪唑類	99.5			83.3	18.5	
330	N-環己基-4-(3-氣基-4-羥苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類	29.7			22.8	11.1	
331	N-環戊基-4-(3-氣基-4-羥苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類	3.6			4	4.9	
332	(4,4'-二甲基噻吩-3-基)(4-(3-氣基-4-羥苯基)-1H-咪唑-1-基)甲醴	咪唑類	88.5			60	19.5	
333	(4,4'-二甲基噻吩-3-基)(4-(4-氣基-3-羥苯基)-1H-咪唑-1-基)甲醴	咪唑類	81.9			119	81.5	
334	4-(苯并呋喃-2-基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類	58.2			9.9	5.1	
335	N-環己基-N-甲基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類	75.4			3.1	1	
336	4-[3-(6-氣基吡啶-3-基)苯基]-N-甲基-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類						
337	(4,4'-二甲基噻吩-3-基)(2-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲醴	咪唑類						
338	(4-(苯并呋喃-2-基)-1H-咪唑-1-基)(4,4'-二甲基噻吩-3-基)甲醴	咪唑類						
339	噻吩-3-基(4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲醴	咪唑類						
340	(4-(3-甲氧苯基)-1H-咪唑-1-基)(5-苯基噻吩-3-基)甲醴	咪唑類						
341	N-環己基-4-(4-甲氧苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類						
342	N-環己基-4-(3-甲氧苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類						
343	N-環己基-4-(4-氣基-3-羥苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類	44.7			95.5	19.7	
344	N-環戊基-4-(4-氣基-3-羥苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類	1.7			121.1	2.1	
345	N-環己基-4-(4-(二氣甲氧基)苯基)-N-乙基-1H-咪唑-1-氣甲醴	咪唑類						



346	N-環己基-4-(3,4-二氧苯基)-N-乙基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類					
347	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(3-羥苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類	109.6			76.6	24.5
348	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(3-(3-羥基-3-甲基丁-1-炔基)苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類					
349	N-環己基-4-(3,4-二氧苯基)-N-乙基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類					
350	N-環己基-N-乙基-4-(4-甲氧苯基)-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類					
351	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(4-氧基-3-甲氧苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類	95.6			7.1	11.7
352	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(3-(3-羥基-3-甲基丁基)苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類					
353	N-甲基-4-(1-氧噻吩-3-基)-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類					
354	N-甲基-4-[3-(1-氧噻吩-3-基)苯基]-N-三環[3.3.1.1 ^{3,7}]癸-1-基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類					
355	N-環己基-N-乙基-4-(3-甲氧苯基)-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類					
356	(4-(3-胺基-4-甲氧苯基)-1H-咪唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	咪唑類				6.5	9.4
357	4-(3-胺基-4-羥苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲酯氮氧化物	咪唑類	93.9			111.9	10.4
358	(4-(3-胺基-4-羥苯基)-1H-咪唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮氮氧化物	咪唑類				117.1	81.2
359	(5-氧基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	苯并三唑類	1.4			2.5	1.7
360	(4,6-二氧-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	苯并三唑類	1.6			3.1	3.7
361	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(6-苯基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)甲酮	苯并三唑類	1.3			6.3	1.4
362	3-(1-(環己基(甲基)氨基)噻吩-1-基)-1H-咪唑-4-基)吡啶1-氮氧化物	咪唑類	78.2			1.6	1.7
363	4-(3-(4-氧苯基)苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類					
364	4-(3-(1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-1H-咪唑-4-基)苯基)苯并亞硝酸酯	咪唑類					
365	4-(3-胺基-4-甲氧苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲酯	咪唑類					
366	(1H-[1,2,3]三唑[4,5-b]吡啶-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	三唑吡啶					
367	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(6-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)甲酮	苯并三唑類					
368	(3H-[1,2,3]三唑[4,5-b]吡啶-3-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	三唑吡啶基				4.9	9.6
369	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(噁唑烷-3-基)甲酮	苯并三唑類					
370	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(6-(2-甲氧苯基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)甲酮	苯并三唑類					
371	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(5-(三氧甲基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)甲酮	苯并三唑類					
372	(4,6-二甲氧基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	苯并三唑類					
373	(1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(2,2-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	苯并三唑類					
374	N-環己基-N-甲基-5-(三氧甲基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑類					
375	N-環己基-N,5,6-三甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯	苯并三唑類					



376	N-環己基-N-甲基-4-(4-脞噻嗪基苯基)-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類							
377	N-環己基-4,6-二甲氧基-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氣甲鹽	苯并三唑類						95.3	5.7
378	(5,6-二甲基-2H-苯并[d][1,2,3]三唑-2-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	苯并三唑類							
379	N-((1r,4r)-4-(苯甲氧基)環己基)-N-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類							
380	4-(4-(2H-四唑-5-基)-5-基)苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類						77.3	51.3
381	(5,6-二甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	苯并三唑類							
382	(5,6-二甲氧基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基)(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)甲酮	苯并三唑類							
383	N-((1r,4r)-4-羥基環己基)-N-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類							
384	N-(1-羥基-2-甲基丙烷-2-基)-4,6-二甲氧基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氣甲鹽	苯并三唑類							
385	4-(1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羥基)-1H-咪唑-4-基)苯甲鹽胺	咪唑類							
386	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(4-(2-(咪唑-1-基)乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮氫氣化物	咪唑類							
387	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(4-(2-嗎啉乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮氫氣化物	咪唑類							
388	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(4-(2-(咪唑-1-基)乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮二氫氣化物	咪唑類							
389	1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羥基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-氣甲鹽	苯并三唑類							
390	4-(4-氣基甲鹽基苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類							
391	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(6-苯基-3H-[1,2,3]三唑[4,5-b]吡啶-3-基)甲酮	三唑吡啶							
392	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(6-苯基-1H-[1,2,3]三唑[4,5-b]吡啶-1-基)甲酮	三唑吡啶							
393	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(4-(咪唑-4-基甲氧基)苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮氫氣化物	咪唑類							
394	N-環己基-N-甲基-4-(4-(2-(咪唑-1-基)乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-氣甲鹽氫氣化物	咪唑類							
395	N-環己基-N-甲基-4-(4-(2-嗎啉乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-氣甲鹽氫氣化物	咪唑類							
396	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(4-(2-(咪唑-4-基)乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮氫氣化物	咪唑類							
397	N-環己基-N-甲基-4-(4-(2-(咪唑-1-基)乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-氣甲鹽二氫氣化物	咪唑類							
398	4-(4-羥基)-N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氣甲鹽	咪唑類							
399	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(3-(2-(咪唑-1-基)乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮氫氣化物	咪唑類							
400	N-環己基-N-甲基-4-(4-(咪唑-4-基甲氧基)苯基)-1H-咪唑-1-氣甲鹽氫氣化物	咪唑類							
401	(4,4-二甲基噁唑烷-3-基)(4-(3-(2-(咪唑-1-基)乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-基)甲酮二氫氣化物	咪唑類							

402	(4,4-二甲基噁啉-3-基)(4-(3-(2-吗啉乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-基)甲 酮肟氯化物	咪唑類							
403	4-(3-氧基甲醚基苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲醚	咪唑類							
404	N-環己基-N-甲基-4-(4-(嗎啉磺基)苯基)-1H-咪唑-1-氧甲醚	咪唑類							
405	(4,4-二甲基噁啉-3-基)(4-(3-(吡啶-4-基甲氧基)苯基)-1H-咪唑-1-基) 甲酮肟氯化物	咪唑類							
406	(Z)-N-環己基-4-(4-(N'-羥基甲醚基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲醚	咪唑類					66.8		16.3
407	N-環己基-N-甲基-4-(3-(2-(吡啶-1-基)乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-氧甲醚 二肟氯化物	咪唑類							
408	N-環己基-N-甲基-4-(3-(2-嗎啉乙氧基)苯基)-1H-咪唑-1-氧甲醚肟肟 化物	咪唑類							
409	N-(1-苯甲基吡啶-4-基)-N-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-氧甲醚草酸酯	咪唑類							
410	N-(1-苯甲基吡啶-4-基)-N-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-氧甲醚肟氯化物	咪唑類							
411	N-(1-苯甲基吡啶-4-基)-N-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-氧甲醚甲磺酸酯	咪唑類							
412	N-(1-苯甲基吡啶-4-基)-N-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-氧甲醚2-羧基丙烷 -1,2,3-三羧酸酯	咪唑類							
413	N-(1-苯甲基吡啶-4-基)-N-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-氧甲醚(2R,3R)-2,3- 二羧丁二酸酯	咪唑類							
414	N-(1-苯甲基吡啶-4-基)-N-甲基-4-苯基-1H-咪唑-1-氧甲醚磷酸酯	咪唑類							
415	4-(4-(4-(苯甲氧基)吡啶-1-基磺基)苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑 -1-氧甲醚	咪唑類					109.1		95.4
416	N-(1-苯甲基吡啶-4-基)-N-甲基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-氧甲醚	咪唑類							
417	N-環己基-N-甲基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-氧甲醚	咪唑類							
418	N-(1-苯甲基吡啶-4-基)-4-(3-甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲醚	咪唑類							
419	N-(1-苯甲基吡啶-4-基)-4-(4-甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲醚	咪唑類					0.8		1
420	4-(4-(苯甲氧基)苯基)-N-(1-苯甲基吡啶-4-基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲醚	咪唑類							
421	3-(1-(環戊基(甲基)肟基甲醚基)-1H-咪唑-4-基)吡啶基-1-氯化物	咪唑類							
422	N-環己基-N-甲基-4-(4-(甲磺基)苯基)-1H-咪唑-1-氧甲醚	咪唑類					1.7		2.7
423	N-(1-苯甲基吡啶-4-基)-4-(3-(羥基肟基甲醚基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑 -1-氧甲醚	咪唑類					90		2.1
424	N-環己基-4-(3-(羥基肟基甲醚基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲醚	咪唑類					1		0.5
425	4-(4-(苯甲胺基)-3-硝基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲醚	咪唑類					111.4		104.6
426	4-(1-苯甲基-2-側氧基-2,3-二肟-1H-苯并[d]咪唑-5-基)-N-環己基-N-甲基 -1H-咪唑-1-氧甲醚	咪唑類					96.9		115.8
427	N-(1-苯甲基吡啶-4-基)-4-(3,4-二肟基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲醚	咪唑類							
428	N-(1-苯甲基吡啶-4-基)-4-(4-肟基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲醚	咪唑類							
429	N-(1-苯甲基吡啶-4-基)-4-(4-(二肟基)肟基)-N-甲基-1H-咪唑-1-肟 甲醚	咪唑類							



430	N-(1-苯甲基哌啶-4-基)-4-(4-氟苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類					
431	N-(1-(2,6-二甲氧基苯基)哌啶-4-基)-N-甲基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類					
432	N-環己基-4-(4-(4-羥基哌啶-1-基磺酰基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類				96.1	65.5
433	N-(1-苯甲基哌啶-4-基)-4-(3,4-二甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類					
434	(辛基異喹啉-2(1H)-基)(4-苯基-1H-咪唑-1-基)甲酮	咪唑類					
435	N-環己基-4-(2-二甲胺基)-3-硝基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類				4.3	4.9
436	1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-羧酸	苯并三唑類					
437	N-(苯甲氧基)-1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-基甲酯	苯并三唑類					
438	N-環己基-4-(4-甲氧基-3-(2H-四唑-5-基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類				92.4	6.1
439	N-環己基-4-(4-羥基-3-(2H-四唑-5-基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類				94.4	58.6
440	1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-N-羥基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-基甲酯	苯并三唑類				23.2	3.3
441	N-(1-苯甲基哌啶-4-基)-4-(4-甲氧基-3-硝基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類					
442	N-(1-苯甲基哌啶-4-基)-4-(4-氟基-3-甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類					
443	N-(1-苯甲基哌啶-4-基)-4-(3-氟基-4-甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類					
444	叔-丁基4-(4-(4-(苯甲氧基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯)哌啶-1-羧酸酯	咪唑類					
445	4-(3-氟基-4-甲氧基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類					
446	N-(1-苯甲基哌啶-4-基)-4-(3-氟基-4-甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類					
447	4-(3-胺基)-4-(二甲胺基)苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類				11.8	6.5
448	3-(1-(4-(乙氧基羰基)哌啶-1-羧基)-1H-咪唑-4-基)吡啶-1-氧化物	咪唑類					
449	3-(1-(丁基(甲氧基)羰基)哌啶-1-羧基)-1H-咪唑-4-基)吡啶-1-氧化物	咪唑類					
450	4-(3-胺基-4-甲氧基)-N-甲基-N-(哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類				114.2	65.4
451	N-(1-苯甲基哌啶-4-基)-4-(4-羥基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類				1.1	0.3
452	3-(1-(二乙基羰基)哌啶-1-羧基)-1H-咪唑-4-基)吡啶-1-氧化物	咪唑類					
453	N-甲基-N-苯基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類					
454	N-(1-苯甲基哌啶-4-基)-4-(3-氟基-4-羥基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類				3.1	3
455	3-(1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-1H-咪唑-4-基)吡啶-1-氧化物	咪唑類					
456	3-(1-(甲基(羰基)哌啶-1-羧基)-1H-咪唑-4-基)吡啶-1-氧化物	咪唑類					

457	N-(1-苯甲基哌啶-4-基)-4-(4-羧基-3-硝苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氧 噻氮杂化物	咪唑類						28.1	10.6
458	N-環己基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-氧甲鹽	咪唑類							
459	3-(1-((1-苯甲基哌啶-4-基)(甲基)氨基)噻氮杂化物)-1H-咪唑-4-基)吡啶1-氧 化物	咪唑類						1.3	1.9
460	乙基 1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-6-羧酸酯	苯并三唑類							
461	3-(1-(環己基噻氮杂化物)-1H-咪唑-4-基)吡啶1-氧化物	咪唑類							
462	1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-6-氧甲鹽	苯并三唑類							
463	N-甲基-4-(吡啶-3-基)-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氧甲鹽	咪唑類							
464	N-環己基-N-乙基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-氧甲鹽	咪唑類							
465	N-(1-苯甲基哌啶-4-基)-4-(3,4-二羧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲鹽 氮化物	咪唑類						3.8	3.1
466	4-(3-氨基-4-甲氧基)-N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氧 甲鹽	咪唑類							
467	N-甲基-N-(1-苯乙基哌啶-4-基)-4-羧基-1H-咪唑-1-氧甲鹽	咪唑類							
468	4-(3-胺基-4-甲氧基)-N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氧 甲鹽	咪唑類						4.7	4.3
469	叔-丁基-4-(4-(4-羧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-甲噻胺基)哌啶-1-羧酸酯	咪唑類						1.4	0.7
470	3-(1-(甲基(四氫-2H-吡喃-4-基)氨基)噻氮杂化物)-1H-咪唑-4-基)吡啶1-氧 化物	咪唑類							
471	3-(1-(環己基噻氮杂化物)-1H-咪唑-4-基)吡啶1-氧化物	咪唑類							
472	4-(4-氨基)-N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氧甲鹽	咪唑類							
473	4-(3,4-二氨基)-N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氧甲鹽	咪唑類							
474	4-(4-(二氨基噻氮杂化物)-N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氧 甲鹽	咪唑類							
475	4-(4-甲氧基)-N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氧甲鹽	咪唑類							
476	4-(3,4-二甲氧基)-N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氧甲鹽	咪唑類							
477	4-(4-氨基)-N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氧甲鹽	咪唑類							
478	N-叔-丁基-1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-6-氧 甲鹽	苯并三唑類							
479	1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-N,N-二甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-6-氧 甲鹽	苯并三唑類							
480	N1-環戊基-N1-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1,5-二氧甲鹽	苯并三唑類							
481	1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-N-羧基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-6-氧甲鹽	苯并三唑類							
482	4-(3-氨基噻氮杂化物)-4-甲氧基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氧甲鹽	咪唑類						83.2	16.7
483	N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲鹽	苯并三唑類							
484	4-(4-氨基-3-甲氧基)-N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氧 甲鹽	咪唑類							



485	N-環己基-4-(4-甲氧基-3-(甲磺醯胺基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類								92.1	15.1
486	1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-N-苯基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-氣甲醯	苯并三唑類									
487	N-叔-丁基-1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-氣甲醯	苯并三唑類									
488	N-甲基-N-(1-苯乙基哌啶-4-基)-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類								3.8	2
489	N-環己基-1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-氣甲醯	苯并三唑類									
490	N-環己基-1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-6-氣甲醯	苯并三唑類									
491	N1-環己基-N1-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1,5-二氣甲醯	苯并三唑類									
492	N-(1-苯甲基哌啶-4-基)-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氣甲醯氮氣化物	苯并三唑類								0.9	0.7
493	N-環己基-N-甲基-4-(吡啶-4-基)-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類									
494	4-(4-羥基-3-硝基苯基)-N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類								48.9	22.9
495	4-(3-氟基-4-羥基苯基)-N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類								2.1	2.3
496	N-苯甲基-1-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-氣甲醯	苯并三唑類									
497	4-(1-(環己基(甲基)氨基)甲醯基)-1H-咪唑-4-基)吡啶1-氣氧化物	咪唑類									
498	4-(3-甲氧基苯基)-N-甲基-N-(1-丙基哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類								21.4	12.6
499	4-(3-氨基甲醯基-4-羥基苯基)-N-環己基-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類								120.6	44.1
500	4-(4-氟基-3-羥基苯基)-N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類								75.1	21.8
501	4-(4-甲氧基苯基)-N-甲基-N-(哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類								108.5	67.4
502	N-(1-乙基哌啶-4-基)-4-(3-甲氧基苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類								50.2	11.5
503	N-(1-乙基哌啶-4-基)-4-(3-氟基-4-甲氧基苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類								78.8	25.1
504	N-甲基-4-苯基-N-(哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-氣甲醯氮氣氧化物	咪唑類								112.5	51.2
505	(4-環己基哌啶-1-基)(2-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-2H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-基)甲酮草酸酯	苯并三唑類									
506	(4-(苯并[d][1,3]二噁茂-5-基(甲基)哌啶-1-基)(2-(4,4-二甲基噁唑烷-3-羧基)-2H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-基)甲酮草酸酯	苯并三唑類									
507	(E)-N-環己基-4-(3-(N'-羥基甲脒基)-4-甲氧基苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類								101.7	34
508	N-((1r,4r)-4-羥基環己基)-N-甲基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類									
509	N-(1-乙基哌啶-4-基)-N-甲基-4-(3-硝基苯基)-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類								78.3	17.2
510	4-(3,4-二甲氧基苯基)-N-(1-乙基哌啶-4-基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類									
511	4-(3-胺基苯基)-N-(1-乙基哌啶-4-基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類									
512	4-(3,4-二甲氧基苯基)-N-甲基-N-(1-丙基哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類									
513	4-(3-氨基甲醯基-4-羥基苯基)-N-甲基-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類								90.3	14.4
514	4-(3-氟基-4-甲氧基苯基)-N-甲基-N-(1-丙基哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-氣甲醯	咪唑類									



515	叔-丁基4-(N-甲基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-基)噻吩-1-羧酸酯	咪唑類							
516	3-(1-(((1r,4r)-4-羥基環己基)(甲基)氨基甲酯基)-1H-咪唑-4-基)吡啶基1-氧化物	咪唑類							
517	(4-苯基噻吩-1-基)(1-(4,4-二甲基噻吩-3-羧基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-5-基)甲酮羧酸酯	苯并三唑							
518	N-環己基-N-甲基-4-(吡啶-2-基)-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							
519	3-(1-(甲基(1-丙基噻吩-4-基)氨基甲酯基)-1H-咪唑-4-基)吡啶基1-氧化物	咪唑類					82		4.4
520	4-(4-甲氧基苯基)-N-甲基-N-(1-丙基噻吩-4-基)-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							
521	N-(1-乙基噻吩-4-基)-4-(4-甲氧基苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							
522	N-甲基-4-(3-硝基苯基)-N-(1-丙基噻吩-4-基)-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							
523	N-(1-苯基噻吩-4-基)-4-(4-羧基-3-羥基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							
524	4-(3-胺基苯基)-N-甲基-N-(1-丙基噻吩-4-基)-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							
525	N-(1-乙基噻吩-4-基)-N-甲基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							
526	4-(3'-氨基甲酯基二苯基-3-基)-N-甲基-N-(1-丙基噻吩-4-基)-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							
527	N-環己基-N-甲基-2-側氧-5-苯基-1,3,4-噁二唑-3(2H)-基甲酯	噁二唑							
528	3-(4,4-二甲基噻吩-3-羧基)-5-苯基-1,3,4-噁二唑-2(3H)-噁二嗪酮	噁二唑							
529	N-甲基-N-(1-丙基噻吩-4-基)-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							
530	2-(1-(環己基)氨基甲酯基)-1H-咪唑-4-基)吡啶1-氧化物	咪唑類							
531	N-甲基-N-(噻吩-4-基)-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-基甲酯二氮氣化合物	咪唑類							
532	4-(4-甲氧基苯基)-N-甲基-N-(1-(甲磺基)噻吩-4-基)-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							
533	N-甲基-N-(1-(甲磺基)噻吩-4-基)-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類					12		0.2
534	4-(3-羧基-4-甲氧基苯基)-N-甲基-N-(噻吩-4-基)-1H-咪唑-1-基甲酯氮氣化合物	咪唑類							
535	N-(1-苯基噻吩-4-基)-5-羧基-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類							
536	N-(1-乙基噻吩-4-基)-4-(3-羧基-4-羥基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類					74.6		18.3
537	N-(1-乙基噻吩-4-基)-4-(4-羧基-3-甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							
538	N,N-二甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-基甲酯	苯并三唑類							
539	N,N-二甲基-1H-[1,2,3]三唑[4,5-b]吡啶-1-基甲酯	苯并三唑類							
540	4-(3-羧基-4-甲氧基)-N-(1-(2-羥乙基)噻吩-4-基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類					89.7		33.7
541	N-(1-(2-羧乙基)噻吩-4-基)-4-(3-羧基-4-甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							
542	N-甲基-4-(吡啶-4-基)-N-(四氫-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							
543	4-(1-(甲基(四氫-2H-吡喃-4-基)氨基甲酯基)-1H-咪唑-4-基)吡啶1-氧化物	咪唑類							



544	4-(4-甲氧苄基)-N-甲基-N-(1-(吡啶-2-基甲基)哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
545	4-(4-氟基-3-甲氧苄基)-N-甲基-N-(1-丙基哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-氮甲酯	咪唑類							
546	4-(4-甲氧苄基)-N-甲基-N-(1-(2-(吡啶-3-基)噻唑-4-羧基)哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-氮甲酯	咪唑類							
547	N-(1-乙酯哌啶-4-基)-4-(4-甲氧苄基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮甲酯	咪唑類							
548	N-(1-乙酯哌啶-4-基)-N-甲基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-氮甲酯	咪唑類							
549	4-(4-甲氧苄基)-N-甲基-N-(1-(3-(三氟甲基)哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-氮甲酯	咪唑類							
550	N-(1-苯基哌啶-4-基)-4-(3'-氟基甲酯基二苯基-3-基)-N-甲基-1H-咪 唑-1-氮甲酯	咪唑類					94.3	5.7	
551	N-環己基-N-甲基-4-(4-(5-側氧-4,5-二氮-1,2,4-噁二唑-3-基)苄基)-1H- 咪唑-1-氮甲酯	咪唑類					85.2	3.8	
552	4-(3-(煙基氧基甲酯基)苄基)-N-甲基-N-(1-丙基哌啶-4-基)-1H-咪唑-1- 氮甲酯	咪唑類					90.2	45	
553	N-環己基-4-(3-氟苄基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮甲酯氮氧化物	咪唑類					72.3	15.4	
554	4-(3-氟基甲酯基-4-煙基)-N-甲基-N-(1-丙基哌啶-4-基)-1H-咪唑-1- 氮甲酯	咪唑類					102.2	85.6	
555	4-(4-煙基)-N-甲基-N-(哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-氮甲酯氮氧化物	咪唑類							
556	4-(3-胺基-4-(二甲胺基)苄基)-N-(1-苯基哌啶-4-基)-N-甲基- 1H-咪唑-1-氮甲酯	咪唑類							
557	N-(1-(4,6-二氮基-1,3,5-三嗪-2-基)哌啶-4-基)-4-(4-甲氧苄基)-N-甲基 -1H-咪唑-1-氮甲酯	咪唑類							
558	2-(4-(N-甲基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-甲酯胺基)哌啶-1-基)醋酸	咪唑類					83.1	91.1	
559	甲基5-(4-(N-甲基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-甲酯胺基)哌啶-1-基)甲 基)吡喃-2-羧酸酯	咪唑類							
560	N-甲基-4-(吡啶-2-基)-N-(四氮-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1-氮甲酯	咪唑類							
561	N-(1-乙基哌啶-4-基)-4-(4-氟基-3-煙基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮甲酯 氮氧化物	咪唑類					82.2	78.6	
562	4-(3-胺基-4-煙基)-N-環戊基-N-甲基-1H-咪唑-1-氮甲酯氮氧化物	咪唑類							
563	N-環己基-4-(3-氟苄基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮甲酯	咪唑類							
564	N-環戊基-N-甲基-4-(2-側氧-2,3-二氮苯并[d]噻唑-5-基)-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類					37.6	2.3	
565	4-(3-胺基苄基)-N-(1-苯基哌啶-4-基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮甲酯	咪唑類							
566	4-(3-(煙基氧基甲酯基)苄基)-N-(1-(4-煙基環己基)-N-甲基-1H-咪 唑-1-氮甲酯	咪唑類					88.5	69.8	
567	N-(1-苯基哌啶-4-基)-N-甲基-4-(4-(甲酯胺基)苄基)-1H-咪唑-1-氮甲酯	咪唑類					87.8	6.3	
568	4-(4-煙基)-N-甲基-N-(1-(3-(三氟甲基)哌啶-4-基)-1H-咪 唑-1-氮甲酯	咪唑類							



569	N-甲基-N-(1-(吡啶-2-基甲基)哌啶-4-基)-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
570	4-(4-氟基-3-羥苯基)-N-甲基-N-(1-丙基哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-氮 甲酯 氮氧化物	咪唑類							
571	N-(1-苯基哌啶-4-基)-4-(4-(羥基氨基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑 -1-氮 甲酯氮氧化物	咪唑類							
572	N-(1-苯基哌啶-4-基)-4-(3-氨基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑 -1-氮 甲酯氮氧化物	咪唑類							
573	N-(1-(2-氨基煙鹼基)哌啶-4-基)-4-(4-甲氧基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
574	N-(1-乙基哌啶-4-基)-4-(4-羥基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
575	N-環己基-4-(3-胍基)-4-甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮 甲酯 氮氧化物	咪唑類							
576	4-(3-(2H-四唑-5-基)苯基)-N-環己基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
577	4-(4-胺基)苯基)-N-(1-苯基哌啶-4-基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
578	N-(1-苯基哌啶-4-基)-N-甲基-4-(4-胺基)苯基)-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
579	4-(4-胺基)苯基)-N-環己基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
580	N-環己基)-N-甲基-4-(4-(胺基)苯基)-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
581	N-(1-苯基哌啶-4-基)-4-(3-胍基)-4-甲氧基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
582	N-(1-氨基)哌啶-4-基)-4-(4-甲氧基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
583	N-(1-(氨基)哌啶-4-基)-4-(4-甲氧基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
584	N-(1-(氨基)哌啶-4-基)-N-甲基-4-(吡啶-3-基)-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
585	4-(3-羥基)苯基)-N-甲基-N-(1-丙基哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-氮 甲酯 氮氧化物	咪唑類							
586	4-(3,4-二羥基)苯基)-N-甲基-N-(1-丙基哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-氮 甲酯 氮氧化物	咪唑類							
587	4-(4-羥基)苯基)-N-甲基-N-(1-(吡啶-2-基)哌啶-4-基)-1H-咪唑-1-氮 甲 酯氮氧化物	咪唑類							
588	N-(1-苯基哌啶-4-基)-N-甲基-4-(4-(胺基)苯基)-1H-咪唑-1- 氮 甲酯	咪唑類							
589	N-(1-苯基哌啶-4-基)-4-(3-胍基)-N-甲基-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
590	4-(3-(2H-四唑-5-基)苯基)-N-甲基-N-(四氮-2H-吡喃-4-基)-1H-咪唑-1- 氮 甲酯	咪唑類							
591	N-環己基)-N-甲基-4-(3-(5-側基)-4,5-二氮-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基)-1H- 咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
592	(E)-N-(1-(N'-羥基)哌啶-4-基)-4-(4-甲氧基)苯基)-N-甲基-1H-咪唑 -1-氮 甲酯	咪唑類							
593	N-(1-苯基哌啶-4-基)-N-甲基-4-(3-(甲胺基)苯基)-1H-咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							
594	N-環戊基)-N-甲基-4-(3-(5-側基)-4,5-二氮-1,2,4-噁二唑-3-基)苯基)-1H- 咪唑-1-氮 甲酯	咪唑類							





595	N-(1-(2H-四唑-5-基)哌啶-4-基)-4-(4-甲氧苄基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							
596	4-(4-(4-甲氧苄基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基)哌啶-1-基甲酯	咪唑類							
597	N-(1-(2-羥乙基)哌啶-4-基)-4-(4-甲氧苄基)-N-甲基-1H-咪唑-1-基甲酯	咪唑類							

4. 本發明化合物之生物選擇性

FAAH之抑制作用以如上所述之方法測定。單醯基甘油脂肪酶(MAGL)以及羧酸酯酶(CE)之抑制作用依照如下所述之操作步驟進行。試管中與活體內二者之對照組係反應混合物減去測試化合物。因此，於以下針對該測試化合物之表2中，小的值指示為強的抑制劑。值100指示無可測量的抑制作用發生。

MAGL

MAGL之活性測量值以作為基質之 $[^3\text{H}]$ 2-OG (標記甘油)水解的速率為基礎。簡言之，將之前從成年WISTAR大鼠中取得之小腦細胞溶質(CRBcyt)碎片，於含有1 mM EDTA之Tris-HCl緩衝液(10 mM, pH 7.2)中稀釋成適當的分析蛋白濃度，加至含有測試化合物之分析管中。空白組含分析緩衝液，改為含細胞溶質之樣本作為對照組。之後加入基質(最後濃度2 μM OG)，使樣本在37°C下培育10分鐘。最後分析含有0.125% w v⁻¹無脂肪酸之BSA。培育階段後，藉由添加400 μL 氯仿：甲醇(1/1 v v⁻¹)使反應停止，渦旋混合分析管二次，將其等置於冰上。利用離心將相分開來，取200 μL 試樣量之甲醇/緩衝液相，用液態閃爍光譜法，以抑制修正分析氬含量。

CE

CE之活性測量值係以對硝基酚從醋酸對硝基苯酯之形成為基礎。簡言之，在96井培養皿中，用10 μM FAAH抑制劑培育8 $\mu\text{g}/\text{ml}$ 之大鼠或小鼠肝微粒體(LVms) 15分鐘，之後

加入基質醋酸對硝基苯酯至最後濃度為1mM。在基質添加出現對硝基酚後，使用分光光度計在405 nm下讀取該培養皿10分鐘。沒有添加抑制劑之微粒體萃出物中之羧酸酯酶活性設定為對照組100%，以抑制劑培育之剩餘的CE活性係相對於該對照組計算。

表 2

	名稱	試管 中		活 體 內		試 管 中		
		FAAH 10uM	FAAH 100nM	FAAH BRh 3mg.kg.8h	FAAH LVh 3mg.kg.8h	CE Mou LVms 10uM 10min	CE大 鼠 LVms 10uM 10min	MAGL大 鼠 CRBcyto 12.5uM 8min
16	N-(4-甲氧苯基)-N-甲基-4-(羰-2-基)-1H-咪唑-1-氧 甲酯	24.7				95.4	87.5	
39	(3,4-二氫喹啉-1(2H)-基)(4-(3-甲氧苯基)-1H-咪唑 -1-基)甲酮	16		120.6	101.1	84.3	94.7	87
85	N-(4-苯基丁基)-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1-氧甲酯		0.1			31	33	
97	5-溴基-N-環己基-N-甲基-1H-苯并[d][1,2,3]三唑-1- 氧甲酯		0			50.7	41.1	
564	N-環戊基-N-甲基-4-(2-側氧-2,3-二氫苯并[d]噁唑 -5-基)-1H-咪唑-1-氧甲酯			37.6	2.3	87.4	96.1	91.6
567	N-(1-苯甲基哌啶-4-基)-N-甲基-4-(4-(甲磺基)苯 基)-1H-咪唑-1-氧甲酯			87.8	6.3	88.6	97.8	94.2



【圖式簡單說明】

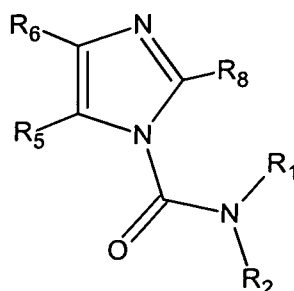
(無)

【主要元件符號說明】

(無)

七、申請專利範圍：

1. 一種具有下式之化合物，



其中：

R1為C₁₋₄烷基；

R2係擇自於H、C₁₋₂₀烷基、C₁₋₆烷氧基、芳基、雜芳基、部分或完全飽和的雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基、經取代的C₁₋₆烷基、鹵素、OH、OR1a、OCOR1a、SH、SR1a、SCOR1a、NH₂、NHR1a、NH₂SO₂NH₂、NH₂SO₂R1a、NR1aCOR1b、NHCOR1a、NR1aR1b、COR1a、CSR1a、CN、COOH、COOR1a、CONH₂、CONHOH、CONHR1a、CONHOR1a、SO₂R1a、SO₃H、SO₂NH₂、CONR1aR1b、SO₂NR1aR1b，其中R1a與R1b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、經取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R1a與R1b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R2為C₁₋₂₀烷基、烷氧基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₁₀環烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₁₀環烷基C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基，或為含有此等部分之一或多者的基團時，此等

部分中之每一個可任擇地經一或多個擇自於下列之基團取代：經取代的C₁₋₆烷基、鹵素、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆烷胺基、C₁₋₆二烷胺基、C₁₋₁₀烷基、OH、OR_{1c}、OCOR_{1c}、SH、SR_{1c}、SCOR_{1c}、NH₂、NO₂、NHR_{1c}、NHSO₂NH₂、NHSO₂R_{1c}、NR_{1c}COR_{1d}、NHC(NH)NH₂、NHCOR_{1c}、NR_{1c}R_{1d}、COR_{1c}、CSR_{1c}、CN、COOH、COOR_{1c}、CONH₂、CONHOH、CONHR_{1c}、CONHOR_{1c}、C(NOH)NH₂、CONR_{1c}R_{1d}、SO₂R_{1c}、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR_{1c}R_{1d}，其中R_{1c}與R_{1d}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、經取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R_{1c}與R_{1d}可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當R₂之取代基係C₁₋₁₀烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆烷胺基、C₁₋₆二烷胺基、C₃₋₈環烷基，或為含有此等部分之一或多者的基團時，此等部分中之每一個可任擇地經一或多個擇自於下列之基團取代：鹵素、C₁₋₁₀烷基、經取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基、雜環基、OH、OR_{1e}、OCOR_{1e}、SH、SR_{1e}、SCOR_{1e}、NH₂、NO₂、

NHR1e、NHSO₂NH₂、NHSO₂R1e、NR1eCOR1f、NHC(NH)NH₂、NHCOR1e、NR1eR1f、COR1e、CSR1e、CN、COOH、COOR1e、CONH₂、CONHOH、CONHR1e、CONHOR1e、C(NO₂)NH₂、CONR1eR1f、SO₂R1e、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR1eR1f，其中R1e與R1f係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、經取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R1e與R1f可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

但是，R1與R2不能均為H或均為甲基，

或，

R1與R2可與其等附接之N一起形成雜芳基或雜環基基團，其等中之每一個可任擇地經一或多個氧原子或一或多個擇自於下列之基團取代：芳基、雜芳基、部分或全部飽和的雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷基、經取代的C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、鹵素、OH、OR2a、OCOR2a、SH、SR2a、SCOR2a、NH₂、NO₂、NHR2a、NHSO₂NH₂、NHSO₂R2a、NR2aCOR2b、NHC(NH)NH₂、NHCOR2a、NR2aR2b、COR2a、CSR2a、CN、COOH、COOR2a、CONH₂、CONHOH、CONHR2a、CONHOR2a、C(NO₂)NH₂、CONR2aR2b、SO₂R2a、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR2aR2b，其中R2a與R2b係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、經取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及

雜環基，或R2a與R2b可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當由R1與R2一起形成之雜芳基或雜環基之取代基為芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、C₃₋₈環烷基C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基，或為含有此等部分之一或多者的基團時，此等部分中之每一個可任擇地經一或多個擇自於下列之基團取代：鹵素、羥基、C₁₋₆烷基、經取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₄烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、C₃₋₈環烷基氧基、芳基C₁₋₄烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₄烷氧基、C₃₋₈環烷基C₁₋₄烷氧基、OR_{2c}、OCOR_{2c}、SH、SR_{2c}、SCOR_{2c}、NH₂、NO₂、NHR_{2c}、NHSO₂NH₂、NHSO₂R_{2c}、NR_{2c}COR_{2d}、NHC(NH)NH₂、NHCOR_{2c}、NR_{2c}R_{2d}、COR_{2c}、CSR_{2c}、CN、COOH、COOR_{2c}、CONH₂、CONHOH、CONHR_{2c}、CONHOR_{2c}、C(NO₂)NH₂、CONR_{2c}R_{2d}、SO₂R_{2c}、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR_{2c}R_{2d}，其中R_{2c}與R_{2d}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、經取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R_{2c}與R_{2d}可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當由R1與R2一起形成之雜芳基或雜環基之取代基之取代基為C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、

C₃₋₈環烷氧基、芳基C₁₋₄烷氧基、雜芳基C₁₋₄烷氧基、雜環基C₁₋₄烷氧基、C₃₋₈環烷基C₁₋₄烷氧基，或為含有此等部分之一或多者的基團時，此等部分中之每一個可任擇地經一或多個擇自於下列之基團取代：C₁₋₄烷氧基、R_{2e}、鹵素、OH、OR_{2e}、OCOR_{2e}、SH、SR_{2e}、SCOR_{2e}、NH₂、NO₂、NHR_{2e}、NHSO₂NH₂、NHSO₂R_{2e}、NR_{2e}COR_{2f}、NHC(NH)NH₂、NR_{2e}R_{2f}、NHCOR_{2e}、COR_{2e}、CSR_{2e}、CN、COOH、COOR_{2e}、CONH₂、CONHOH、CONHR_{2e}、CONHOR_{2e}、C(NO₂)NH₂、CONR_{2e}R_{2f}、SO₂R_{2e}、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR_{2e}R_{2f}，其中R_{2e}與R_{2f}係獨立地擇自於C₁₋₆烷基、經取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R_{2e}與R_{2f}可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

R₅係擇自於H、C₁₋₂烷基及鹵素；

R₆係擇自於芳基及雜芳基，

其中，當R₆係雜芳基時，此部分可任擇地經一或多個氧原子取代，而當R₆係芳基或雜芳基時，此等部分中之每一個可任擇地經一或多個擇自於下列之基團取代：鹵素、C₁₋₆烷基、經取代的C₁₋₆烷基、C₁₋₆炔基、芳基、雜芳基、雜環基、C₃₋₈環烷基、C₁₋₆烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基C₁₋₆烷基、雜芳基C₁₋₆烷基、雜環基C₁₋₆烷基、芳基C₁₋₆烷氧基、雜芳基C₁₋₆烷氧基、雜環基C₁₋₆烷氧基、OH、OR_{6c}、OCOR_{6c}、SH、SR_{6c}、SCOR_{6c}、NH₂、NO₂、NHR_{6c}、NHC(NH)NH₂、

NHSO₂NH₂、NHSO₂R_{6c}、NR_{6c}COR_{6d}、NHCOR_{6c}、NR_{6c}R_{6d}、COR_{6c}、CSR_{6c}、CN、COOH、COOR_{6c}、CONH₂、CONHR_{6c}、CONHOR_{6c}、CONHOH、C(NO₂)NH₂、CONR_{6c}R_{6d}、SO₂R_{6c}、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR_{6c}R_{6d}，其中 R_{6c} 與 R_{6d} 係獨立地擇自於 C₁₋₆ 烷基、經取代的 C₁₋₆ 烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈ 環烷基以及雜環基，或 R_{6c} 與 R_{6d} 可與其等連接之雜原子一起形成雜環基，

其中，當 R₆ 之取代基為雜芳基或雜環基時，此等部分中之每一個可任擇地經一或多個氧原子取代，或當 R₆ 之取代基為 C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 炔基、芳基、雜芳基、雜環基、C₁₋₆ 烷氧基、芳氧基、雜芳氧基、雜環氧基、芳基 C₁₋₆ 烷基、雜芳基 C₁₋₆ 烷基、雜環基 C₁₋₆ 烷基、芳基 C₁₋₆ 烷氧基、雜芳基 C₁₋₆ 烷氧基、雜環基 C₁₋₆ 烷氧基、C₃₋₈ 環烷基，或為含有此等部分之一或多者的基團時，此等部分中之每一個可任擇地經一或多個擇自於下列之基團取代：鹵素、C₁₋₆ 烷基、經取代的 C₁₋₆ 烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈ 環烷基、雜環基、C₁₋₄ 烷氧基、OH、OR_{6e}、OCOR_{6e}、SH、SR_{6e}、SCOR_{6e}、NH₂、NO₂、NHR_{6e}、NHSO₂NH₂、NHC(NH)NH₂、NHSO₂R_{6e}、NR_{6e}COR_{6f}、NHCOR_{6e}、NR_{6e}R_{6f}、COR_{6e}、CSR_{6e}、CN、COOH、COOR_{6e}、CONH₂、CONHOH、CONHR_{6e}、CONHOR_{6e}、C(NO₂)NH₂、CONR_{6e}R_{6f}、SO₂R_{6e}、SO₃H、SO₂NH₂、SO₂NR_{6e}R_{6f}，其中 R_{6e} 與 R_{6f} 係獨立地擇自於 C₁₋₆ 烷基、

經取代的C₁₋₆烷基、芳基、雜芳基、C₃₋₈環烷基以及雜環基，或R6e與R6f可與其等連接之雜原子一起形成雜環基；

R8係氫，

或其藥學上可接受的鹽或酯類；

有條件的是，當R1或R2係甲基時，其它的R1或R2不是4-氯丁基、4-疊氮丁基或4-異氰硫基丁基(4-isothiocyanatobutyl)，以及

有條件的是，該化合物不為(4-苯基-1H-咪唑-1-基)(4-(喹啉-2-基甲基)哌嗪-1-基)甲酮：
(4-phenyl-1H-imidazol-1-yl)(4-(quinolin-2-ylmethyl)piperazin-1-yl)methanone。

2. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中R1以及R2和其等所附接的N一起形成可任擇地經取代之雜環基基團。
3. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中R5是H。
4. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中R1係甲基；

R2係選擇自單環C₅₋₈環烷基或單環六員飽和雜環基，其含有單一的氮或氧雜原子，其中該雜原子係位於相對於該雜環基基團R2附接至尿素氮之位置的4號位置，其中當該雜原子是氮原子時，該氮原子係任擇地經以苄基取代；

R5是H；

R6係選自於苯基或吡啶基，其中該吡啶基基團之氮原子可經以氧原子取代，且其中該苯基可任擇地經以一或多

個選自於鹵素、甲氧基、OH、CONH₂、NH₂及苯基之基團取代；及

R8是H。

5. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中R1係甲基；

R2係選擇自單環C₅₋₈環烷基、四氫哌喃基及哌啶基，其中該四氫哌喃基及哌啶基基團中之雜原子係位於相對於該雜環基基團R2附接至尿素氮之位置的4號位置，且其中該哌啶基基團之氮原子係經以苄基取代；

R5是H；

R6係選自於苯基或吡啶基，其中該吡啶基基團之氮原子係經以氧原子取代，且其中該苯基可任擇地經以一或多個選自於鹵素、甲氧基、CONH₂、NH₂及苯基之基團取代；及

R8是H。

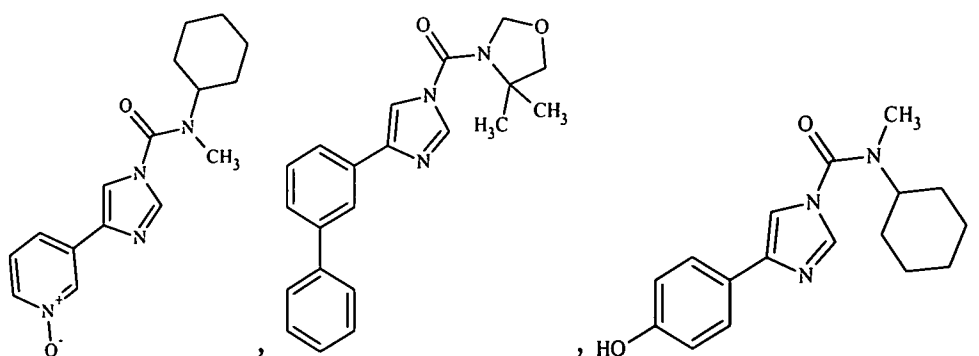
6. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中R1係甲基且R2係含有單一氮雜原子之單環飽和雜環基，其中該氮雜原子係經以CONR1cR1d基團取代。

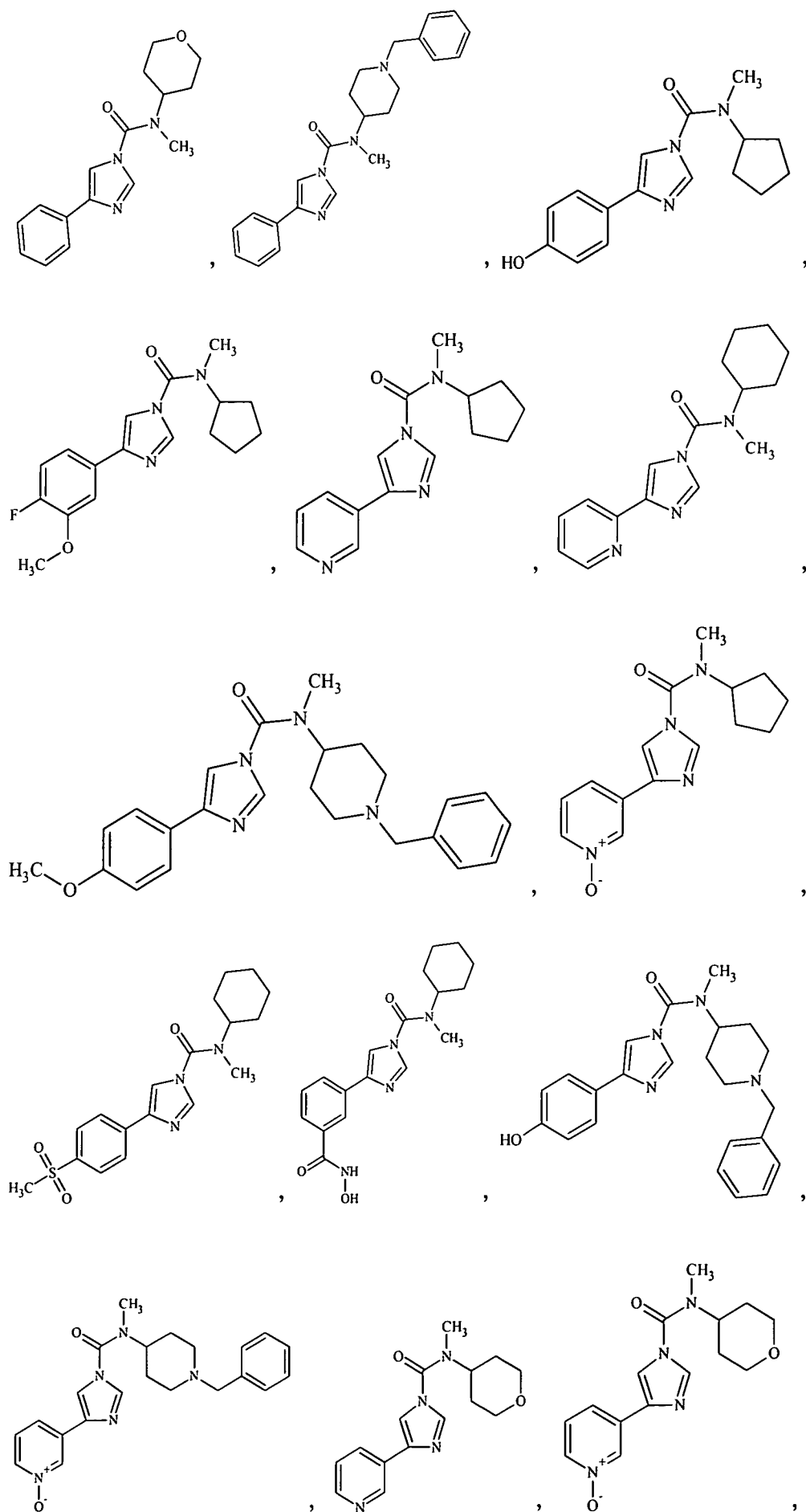
7. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中R6係經以多於一個選自於OH及C₁₋₆烷基之基團取代的苯基。

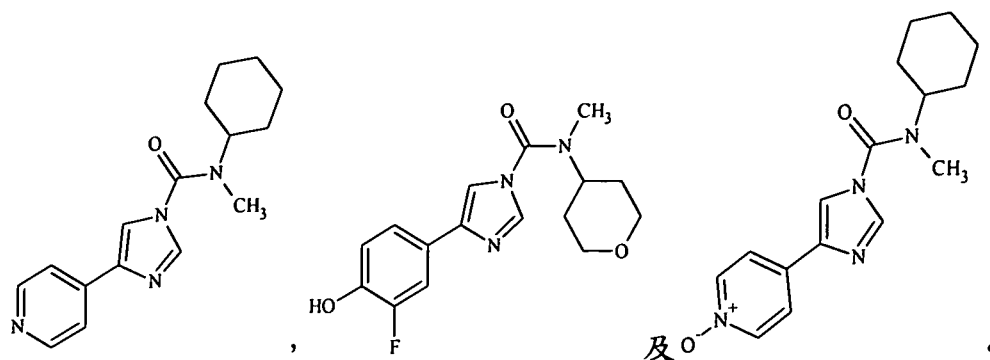
8. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中R6係經以NH₂SO₂NH₂取代之苯基。

9. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中R1係甲基且R2係含有單一氮雜原子之單環飽和雜環基，其中該氮雜原子係經以選擇自芳基及SO₂R1c之基團取代。

10. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中R6係經以選自於NHR6c、NR6cR6d、NHSO₂NH₂、NHCOR6c及NHSO₂R6c之基團取代之吡啶基。
11. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中R6係吡嗪基或嘧啶基。
12. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中R1c係C₁₋₆烷基。
13. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中R1c係C₃₋₈環烷基。
14. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中R1係甲基且R2係含有單一氮雜原子之單環飽和六員雜環基，該氮雜原子係經以芳基C₁₋₄烷基取代，該芳基C₁₋₄烷基可經取代或未經取代。
15. 如申請專利範圍第14項之化合物，其中該氮雜原子係經以苯基C₁₋₂烷基取代，該苯基C₁₋₂烷基可經取代或未經取代。
16. 如申請專利範圍第1項之化合物，其係選自於以下化合物之一：







17. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中R1係擇自於甲基以及乙基。
18. 如申請專利範圍第17項之化合物，其中R2係擇自於芳基、雜芳基、雜環基以及C₃₋₁₀環烷基，其等中之每一個可經取代或未經取代。
19. 一種藥學組成物，其包含如申請專利範圍第1至18項中任一項之化合物以及一或多種藥學上可接受之賦形劑。
20. 如申請專利範圍第19項之藥學組成物，其進一步包含一或多種額外的活性藥學成份。
21. 如申請專利範圍第1至18項中任一項之化合物，其供用於治療。
22. 一種如申請專利範圍第1至18項中任一項之化合物於製備一藥物之用途，該藥物係用於治療或預防一進展或病狀與FAAH酵素受質有關聯之病況，其中施用之唯一但書是，i)當R1或R2為甲基時，其它的R1或R2不為4-氯丁基、4-疊氮丁基或4-異氰硫基丁基，以及ii)該化合物不為(4-苯基-1H-咪唑-1-基)(4-(喹啉-2-基甲基)哌嗪-1-基)甲酮。
23. 如申請專利範圍第22項之用途，其中該病況係一種與內

生性大麻系統有關聯之病症。

24. 如申請專利範圍第23項之用途，其中該病症係擇自於食慾調節、肥胖、代謝失調、惡病質、厭食症、疼痛、發炎、神經毒性、神經創傷、中風、多發性硬化症、脊髓損傷、帕金森氏症(Parkinson's disease)、左旋多巴藥劑引起的運動障礙(levodopa-induced dyskinesia)、杭丁頓氏舞蹈症(Huntington's disease)、妥瑞症(Gilles de la Tourette's syndrome)、遲發性運動障礙、肌張力不全(dystonia)、肌萎縮性脊髓側索硬化症、阿滋海默症(Alzheimer's disease)、癲癇、精神分裂症、焦慮症、憂鬱症、失眠、噁心、嘔吐、酒精疾患、藥物成癮、高血壓、循環性休克、心肌再灌注損傷、動脈硬化(atherosclerosis)、氣喘、青光眼、視網膜病變、癌症、發炎性腸道疾病、急性以及慢性肝疾病、關節炎以及骨質疏鬆。
25. 如申請專利範圍第24項之用途，其中該藥物成癮包含對於鴉片、尼古丁、古柯鹼、酒及/或精神興奮劑(psychostimulants)之成癮。
26. 如申請專利範圍第24項之用途，其中該急性以及慢性肝疾病包含肝炎與肝硬化。