



(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 I503323 B

(45)公告日：中華民國 104 (2015) 年 10 月 11 日

(21)申請案號：100110555

(51)Int. Cl. : C07D495/04 (2006.01)  
A61K31/4738 (2006.01)

(30)優先權：2010/03/29 美國

(71)申請人：腫瘤療法 科學股份有限公司 (日本) ONCOTHERAPY SCIENCE, INC. (JP)  
日本

(72)發明人：中村祐輔 NAKAMURA, YUSUKE (JP)；松尾洋 MATSUO, YO (JP)；久田昇二 HISADA, SHOJI (JP)；艾梅德 菲洋 AHMED, FERYAN (PK)；杭特利 雷蒙 HUNTER, RAYMOND (AU)；沙加地 哈敘彌 沙瑞 SAJJADI-HASHEMI, ZOHREH (CA)；傑金斯 大衛 M JENKINS, DAVID M. (US)；卡格柏 羅柏特 B KARGBO, ROBERT B. (US)；邱文傑 CUI, WENGE (US)；關 波麗維那 裘莉西亞 F GAUAN, POLIVINA JOLICIA F. (US)；渥克 喬 R WALKER, JOEL R. (US)；戴克那茲 海倫妮 DECORNEZ, HELENE (FR)；葛倫 瑪漢德 GURRAM, MAHENDER (IN)

(74)代理人：洪澄文

(56)參考文獻：

US 5189055

US 2009/0239859A1

WO 2004/026864A1

WO 2008/028168A2

Temciuca E, et al. "An Unexpected [2+2]-Cycloaddition Reaction of 1-Methyldithieno-[3,4-b;3',2'-d]pyridinium Iodide with Dimethyl Acetylenedicarboxylate", Terrahedron Vol. 51, No. 48, pp. 13185-13196, 1995.

Ferraccioli R, et al. "Synthesis of 6-Phenanthridinones and Their Heterocyclic Analogues through Palladium-Catalyzed Sequential Aryl-Aryl and N-Aryl Coupling", Org. Lett., Vol. 6, No. 25, 2004, Published on Web 11/05/2004.

審查人員：吳祖漢

申請專利範圍項數：17 項 圖式數：0 共 744 頁

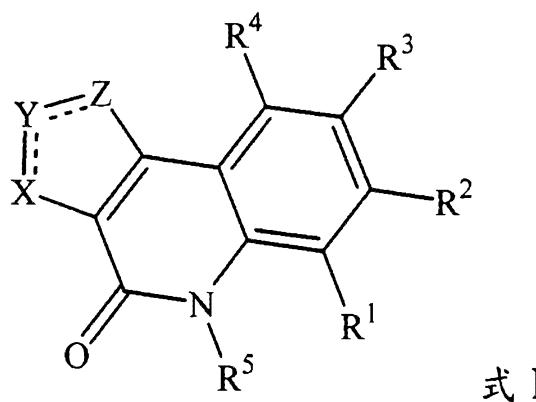
(54)名稱

三環化合物以及含此化合物之 PBK 抑制劑

TRICYCLIC COMPOUNDS AND PBK INHIBITORS CONTAINING THE SAME

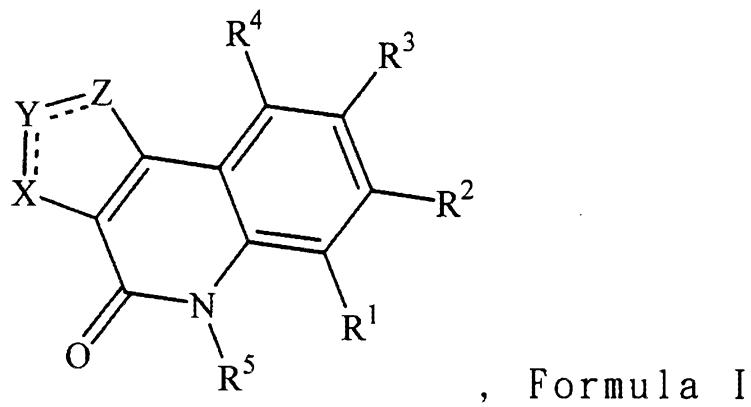
(57)摘要

本發明提供式 I 之三環化合物。此化合物為 PBK 抑制劑，有用於治療 PBK 相關疾病，包括癌症。

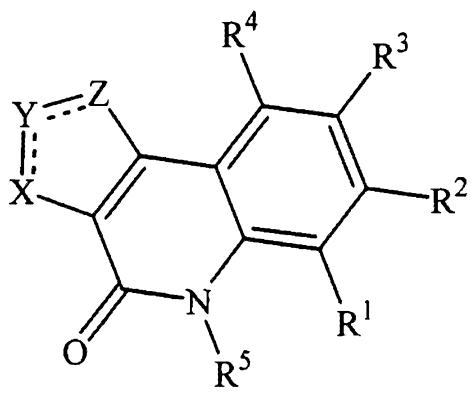


式 I

Tricyclic compounds of formula I are provided. These compounds are PBK inhibitors, and are useful for the treatment of PBK related diseases, including cancer.



, Formula I



式 I

## 六、發明說明：

### 【發明所屬之技術領域】

本發明係關於一種抑制 PBK 活性的化合物、一種製備該化合物的方法，及含有該化合物當做活性成分的醫藥組合物。

### 【先前技術】

先前的研究顯示 PDZ 結合激酶(PBK)為一絲氨酸/蘇氨酸激酶，其係關於雙專一性絲裂原活化的蛋白質激酶激酶(MAPKK)家族(Abe Y, et al., J Biol Chem. 275: 21525 - 21531, 2000, Gaudet S, et al., Proc Natl Acad Sci. 97: 5167 - 5172, 2000 and Matsumoto S, et al., Biochem Biophys Res Commun. 325: 997 - 1004, 2004)。PBK 由於其在高度增殖的精母細胞中的重要角色，亦指出其涉及有絲分裂(Gaudet S, et al., Proc Natl Acad Sci. 97: 5167 - 5172, 2000 and Fujibuchi T, et al., Dev Growth Differ. 47: 637 - 44, 2005)。事實上，在睾丸觀察到大量的 PBK 表現，而在其他正常器官幾乎未偵測到 PBK 表現(Park JH, et al., Cancer Res. 66: 9186-95, 2006)。PBK 調節細胞周期進行。依此，其顯著的過度表現在臨床上的乳癌樣本(Park JH, et al., Cancer Res. 66: 9186-95, 2006)、Burkitt 氏淋巴瘤(Simons-Evelyn M, et al., Blood Cells Mol Dis. 27: 825 - 829, 2001)及許多惡性血液病中觀察到(Nandi A, et al., Blood Cells Mol Dis. 32: 240-5, 2004)。

對於睪丸的免疫組織化學分析顯示在曲精小管的外部區周圍有 PBK 蛋白質表現，於此處係發生精子生殖細胞的重複有絲分裂接著發生減數分裂 (Fujibuchi T, et al., Dev Growth Differ. 47: 637 - 44, 2005)。尤其，在前期與中期，在乳癌細胞的凝聚的染色體周圍偵測到有 PBK 的次要細胞的定位 (Park JH, et al., Cancer Res. 66: 9186-95, 2006)。再者，利用基因專一性 siRNA 將 PBK 表現擊低 (knockdown) 造成胞質分裂的障礙，且接著造成癌細胞的細胞凋亡 (Park JH, et al., Cancer Res. 66: 9186-95, 2006)。此等顯示 PBK 在有絲分裂、睪丸細胞及癌細胞中的關鍵功能。

歸結起來，PBK 專一性抑制劑可用於當做廣譜系癌症的藥物。PBK 對於癌症治療為優異標靶的理由如下：i) 在正常器官幾乎不表現(除了睪丸以外); ii) 在臨床癌症樣本中時常過度表現; iii) 其為一相關於細胞有絲分裂的必要功能的絲氨酸/蘇氨酸激酶。

本案發明人等已發現到三環化合物可選擇性地抑制 PBK 的活性。

### 【發明內容】

本發明的一目的在於提供一種 PBK 抑制劑，其對於 PBK 有高抑制活性。

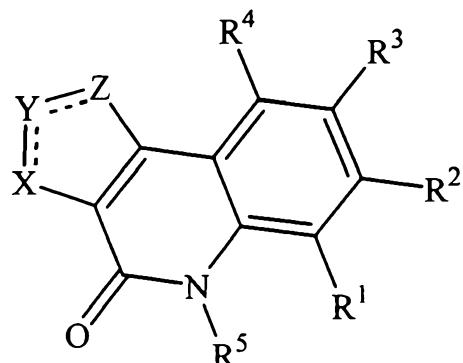
本發明的另一目的在於提供一種製備此種抑制劑的方法。

本發明的又一目的在於提供一種醫藥組合物，其包括

此化合物、其在醫藥上可接受的鹽、水合物、溶劑合物或異構物。

依照本發明之一態樣，提供一種式(I)的化合物、其在醫藥上可接受的鹽、水合物、溶劑合物或異構物。

一種以通式 I 表示的化合物：



I

或其在醫藥上可接受的鹽，

其中  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及  $R^4$  各自獨立地為選自由以下構成的群組的基團：

氫原子、

羥基、

鹵素、

氰基、

硝基、

胺基、

$C_1-C_6$  烷基、

$C_2-C_6$  烯基、

$C_2-C_6$  炙基、

$C_3-C_{10}$  環烷基、

$C_3-C_{10}$  環烯基、

$C_1-C_6$  烷氧基、

$C_6-C_{10}$  芳基、

二氫茚基、

雜芳基、

3 至 8 員雜環烷基、

$-OSO_2CH_3$ 、

$-OSO_2CF_3$ 、及

$-CONH_2$ ，

其中  $R^1$  至  $R^4$  的各基團選擇性經選自由以下取代基 A 所構成群組的取代基取代：

取代基 A:

羥基；

側氨基 ( $=O$ )；

氰基；

鹵素；

$C_1-C_6$  烷基 (其中  $C_1-C_6$  烷基選擇性經選自由以下取代基 B 所構成群組的取代基取代)；

$C_3-C_{10}$  環烷基 [其中  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經氰基、或經  $-NR^{31}R^{32}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基所取代 (其中  $R^{31}$  與  $R^{32}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]；

$-NR^{21}R^{22}$  [其中  $R^{21}$  與  $R^{22}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基 (其中  $C_1-C_6$  烷基選擇性經二( $C_1-C_6$  烷基)胺基、 $C_1-C_6$  烷基磺醯基 ( $-SO_2(C_1-C_6$  烷基))或 3 至 8 員雜環烷基取代)]；

$C_1-C_6$  烷氧基 {其中  $C_1-C_6$  烷氧基選擇性經鹵素、3至8員雜環烷基(其中該3至8員雜環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代)或  $-NR^{33}R^{34}$  [其中  $R^{33}$  與  $R^{34}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基(其中  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基磺醯基或二( $C_1-C_6$  烷基)胺基取代)、或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基]取代};

$-SO_2NR^{23}R^{24}$  {其中  $R^{23}$  與  $R^{24}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基[其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基、 $C_1-C_6$  烷氧基、鹵素、 $C_3-C_{10}$  環烷基、或  $-NR^{35}R^{36}$  取代(其中  $R^{35}$  與  $R^{36}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]、 $C_3-C_{10}$  環烷基(其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  羥基烷基取代)、或3至8員雜環烷基;或  $R^{23}$  與  $R^{24}$  可一起形成3至8員雜環烷基,其中該3至8員雜環烷基選擇性經胺基取代};

$C_1-C_6$  烷基磺醯基(其中該  $C_1-C_6$  烷基部分選擇性經羥基取代);

$C_1-C_6$  烷基磺醯基胺基( $-NHSO_2(C_1-C_6$  烷基)) [其中該  $C_1-C_6$  烷基部分選擇性經  $-NR^{37}R^{38}$  取代(其中  $R^{37}$  與  $R^{38}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)];

3至8員雜環烷基 {其中該3至8員雜環烷基選擇性經  $-NR^{39}R^{40}$ (其中  $R^{39}$  與  $R^{40}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基)、 $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $-NR^{41}R^{42}$  取代(其中  $R^{41}$  與  $R^{42}$  各自獨立而代表氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]、羥基、或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基取代};

雜芳基;

$-COOR^{11}$ (其中  $R^{11}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基);及

$-COR^{12}$  [其中  $R^{12}$  表示  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、氰基甲基、 $-NR^{25}R^{26}$  {其中  $R^{25}$  與  $R^{26}$  各自獨立地表示氫原子、或  $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基或  $-NR^{43}R^{44}$  取代 (其中  $R^{43}$  與  $R^{44}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]}、或 3 至 8 員雜環烷基，其選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代]、取代基 B:

鹵素；

羥基；

氰基；

3 至 8 員雜環烷基 (其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基、羥基、胺基、 $C_1-C_6$  胺基烷基、或經  $C_2-C_7$  烷基氧羰基胺基取代的  $C_1-C_6$  烷基所取代)；

$-NR^{51}R^{52}$  {其中  $R^{51}$  與  $R^{52}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基礦醯基、或選擇性經  $-COOR^{53}$  取代的 3 至 8 員雜環烷基取代 (其中  $R^{53}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]、3 至 8 員雜環烷基、 $C_1-C_6$  烷基礦醯基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、 $-COR^{55}$  (其中  $R^{55}$  表示  $C_1-C_6$  烷基)、 $-COOR^{56}$  (其中  $R^{56}$  表示  $C_1-C_6$  烷基)、或  $-CONR^{57}R^{58}$  (其中  $R^{57}$  與  $R^{58}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]}；及

$-COOR^{54}$  (其中  $R^{54}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]；

其中  $R^5$  為氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；且

其中  $\text{---X---Y---Z---}$  為選自由以下構成的群組的構造：

(i)  $-S-CR^7=CR^6-$ 、

(ii)  $-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、

(iii)  $-\text{NH}-\text{CH}=\text{CCH}_3-$ 、及

(iv)  $-\text{N}=\text{CH}-\text{S}-$ ，

其中  $\text{R}^6$  為

氫原子、

羥基、

$\text{C}_1-\text{C}_6$  烷基、

$\text{C}_6-\text{C}_{10}$  芳基(其中該  $\text{C}_6-\text{C}_{10}$  芳基選擇性經羥基取代)、或  
3至8員雜環烷基[其中該3至8員雜環烷基選擇性經  
 $-\text{NR}^{61}\text{R}^{62}$  取代(其中  $\text{R}^{61}$  與  $\text{R}^{62}$  各自獨立地表示氫原子或  $\text{C}_1-\text{C}_6$   
烷基)]，及

其中  $\text{R}^7$  為

氫原子、

$\text{C}_1-\text{C}_6$  烷基 {其中該  $\text{C}_1-\text{C}_6$  烷基選擇性經羥基、 $-\text{NR}^{71}\text{R}^{72}$  [其  
中  $\text{R}^{71}$  與  $\text{R}^{72}$  各自獨立地表示氫原子、 $\text{C}_1-\text{C}_6$  烷基(其中該  
 $\text{C}_1-\text{C}_6$  烷基選擇性經二甲基胺基取代)、 $\text{C}_3-\text{C}_{10}$  環烷基(其中該  
 $\text{C}_3-\text{C}_{10}$  環烷基選擇性經胺基取代)、或3至8員雜環烷  
基]、或3至8員雜環烷基(其中該3至8員雜環烷基選擇  
性經  $\text{C}_1-\text{C}_6$  胺基烷基取代)取代}、

$\text{C}_6-\text{C}_{10}$  芳基(其中該  $\text{C}_6-\text{C}_{10}$  芳基選擇性經羥基取代)、或  
 $-\text{COR}^{73}$  {其中  $\text{R}^{73}$  表示3至8員雜環烷基(其中該3至8  
員雜環烷基選擇性經胺基取代)、或  $-\text{NR}^{74}\text{R}^{75}$  [其中  $\text{R}^{74}$  與  
 $\text{R}^{75}$  各自獨立地表示氫原子、3至8員雜環烷基、或  $\text{C}_3-\text{C}_{10}$  環  
烷基(其中該  $\text{C}_3-\text{C}_{10}$  環烷基選擇性經胺基取代)]}。

需注意在本說明書及附帶的申請專利範圍中使用的單

數形「一」及「該」，除非在上下文有明確指出，否則包括複數參照。因此，對實施例而言，參照「一基團」，係參照於一或更多基團。

### 【實施方式】

#### (具體例之敘述)

於本發明中，「烷基」意指直鏈或分支鏈的烴基，其不包括任何雜原子或不飽和碳碳鍵。「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基」意指具有1-6個碳原子的烷基。「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基」意指具有1-4個碳原子的烷基。

「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基」例如包括但不限於：甲基、乙基、1-丙基、2-丙基、2-甲基-1-丙基、2-甲基-2-丙基（第三丁基（1,1-二甲基-乙基），1-丁基、2-丁基、1-戊基、2-戊基、3-戊基、2-甲基-1-丁基、3-甲基-1-丁基、2-甲基-2-丁基、3-甲基-2-丁基、2,2-二甲基-1-丙基、1-己基、2-己基、3-己基、2-甲基-1-戊基、3-甲基-1-戊基、4-甲基-1-戊基、2-甲基-2-戊基、3-甲基-2-戊基、4-甲基-2-戊基、2-甲基-3-戊基、3-甲基-3-戊基、2,3-二甲基-1-丁基、3,3-二甲基-1-丁基、2,2-二甲基-1-丁基、2-乙基-1-丁基、3,3-二甲基-2-丁基，及2,3-二甲基-2-丁基。

本發明中，「烯基」代表直鏈或分支鏈烴基，其包括1或更多不飽和碳碳鍵，且不包括任何雜原子。「C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基」意指有2-6個碳原子的烯基。

「C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基」例如包括但不限於：乙烯基(ethenyl)、1-丙烯基、2-丙烯基、3-丙烯基、2-甲基-丙-1-烯-1-基(2-

甲基 -1-丙烯基), 2-甲基 -丙 -1- 烯 -3- 基 (2- 甲基 -2- 丙烯基)、丁 -1- 烯 -1- 基、丁 -1- 烯 -2- 基、丁 -1- 烯 -3- 基、丁 -2- 烯 -1- 基、丁 -2- 烯 -2- 基、戊 -1- 烯 -1- 基、戊 -1- 烯 -2- 基、戊 -1- 烯 -3- 基、戊 -1- 烯 -4- 基、戊 -1- 烯 -5- 基、戊 -2- 烯 -1- 基、戊 -2- 烯 -2- 基、戊 -2- 烯 -3- 基 (1- 乙基 -1- 丙烯基)、戊 -2- 烯 -4- 基、戊 -2- 烯 -5- 基、2- 甲基 -丁 -1- 烯 -1- 基、2- 甲基 -丁 -1- 烯 -2- 基、2- 甲基 -丁 -1- 烯 -3- 基、2- 甲基 -丁 -1- 烯 -4- 基、2- 甲基 -丁 -2- 烯 -1- 基、2- 甲基 -丁 -2- 烯 -3- 基、2- 甲基 -丁 -2- 烯 -4- 基、3- 甲基 -丁 -1- 烯 -1- 基、3- 甲基 -丁 -1- 烯 -2- 基、3- 甲基 -丁 -1- 烯 -3- 基、3- 甲基 -丁 -1- 烯 -4- 基、2, 2- 二甲基 -丙 -1- 烯 -1- 基、2, 2- 二甲基 -丙 -1- 烯 -2- 基、己 -1- 烯 -1- 基、己 -1- 烯 -2- 基、己 -1- 烯 -3- 基、己 -1- 烯 -4- 基、己 -1- 烯 -5- 基、己 -1- 烯 -6- 基、己 -2- 烯 -1- 基、己 -2- 烯 -2- 基、己 -2- 烯 -3- 基、己 -2- 烯 -4- 基、己 -2- 烯 -5- 基、己 -2- 烯 -6- 基、己 -3- 烯 -1- 基、己 -3- 烯 -2- 基、己 -3- 烯 -3- 基、2- 甲基 -戊 -1- 烯 -1- 基、2- 甲基 -戊 -1- 烯 -3- 基、2- 甲基 -戊 -1- 烯 -4- 基、2- 甲基 -戊 -1- 烯 -5- 基、2- 甲基 -戊 -1- 烯 -5- 基、2- 甲基 -戊 -2- 烯 -3- 基、2- 甲基 -戊 -2- 烯 -4- 基、2- 甲基 -戊 -2- 烯 -5- 基、3- 甲基 -戊 -1- 烯 -1- 基、3- 甲基 -戊 -1- 烯 -2- 基、3- 甲基 -戊 -1- 烯 -3- 基、3- 甲基 -戊 -1- 烯 -4- 基、3- 甲基 -戊 -1- 烯 -5- 基、3- 甲基 -戊 -2- 烯 -1- 基、3- 甲基 -戊 -2- 烯 -2- 基、3- 甲基 -戊 -2- 烯 -3- 基、3- 甲基 -戊 -2- 烯 -4- 基、3- 甲基 -戊 -2- 烯 -5- 基、4- 甲基 -戊 -1- 烯 -1- 基、4- 甲基 -戊 -1- 烯 -2- 基、4- 甲基 -戊 -1- 烯 -3- 基、4- 甲基 -戊 -1- 烯 -4- 基、4- 甲

基 - 戊 - 1 - 烯 - 5 - 基、4 - 甲 基 - 戊 - 2 - 烯 - 1 - 基、4 - 甲 基 - 戊 - 2 - 烯 - 2 - 基、4 - 甲 基 - 戊 - 2 - 烯 - 3 - 基、4 - 甲 基 - 戊 - 2 - 烯 - 4 - 基、4 - 甲 基 - 戊 - 2 - 烯 - 5 - 基、2, 3 - 二 甲 基 - 丁 - 1 - 烯 - 1 - 基、2, 3 - 二 甲 基 - 丁 - 1 - 烯 - 3 - 基、2, 3 - 二 甲 基 - 丁 - 1 - 烯 - 4 - 基、2, 3 - 二 甲 基 - 丁 - 2 - 烯 - 1 - 基、3, 3 - 二 甲 基 - 丁 - 1 - 烯 - 1 - 基、3, 3 - 二 甲 基 - 丁 - 1 - 烯 - 2 - 基、3, 3 - 二 甲 基 - 丁 - 1 - 烯 - 4 - 基、2 - 乙 基 - 丁 - 1 - 烯 - 1 - 基、2 - 乙 基 - 丁 - 1 - 烯 - 3 - 基、2 - 乙 基 - 丁 - 1 - 烯 - 4 - 基、3 - 乙 基 - 丁 - 1 - 烯 - 1 - 基、3 - 乙 基 - 丁 - 1 - 烯 - 2 - 基、3 - 乙 基 - 丁 - 1 - 烯 - 3 - 基、3 - 乙 基 - 丁 - 1 - 烯 - 4 - 基、2 - 乙 基 - 丁 - 2 - 烯 - 1 - 基、2 - 乙 基 - 丁 - 2 - 烯 - 3 - 基，及 2 - 乙 基 - 丁 - 2 - 烯 - 4 - 基。

本發明中，「炔基」係指直鏈或分支鏈烴基，其包括至少 1 個碳碳參鍵且不包括任何雜原子。「C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基」意指具有 2-6 個碳原子的炔基。

「C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基」例如包括但不限於：乙炔基，1-丙炔基，2-丙炔基，3-丙炔基，2-甲基-丙-1-炔-1-基、2-甲基-丙-1-炔-3-基、丁-1-炔-1-基、丁-1-炔-2-基、丁-1-炔-3-基、丁-2-炔-1-基、丁-2-炔-2-基、戊-1-炔-1-基、戊-1-炔-2-基、戊-1-炔-3-基、戊-1-炔-4-基、戊-1-炔-5-基、戊-2-炔-1-基、戊-2-炔-2-基、戊-2-炔-3-基、戊-2-炔-4-基、戊-2-炔-5-基、2-甲基-丁-1-炔-1-基、2-甲基-丁-1-炔-2-基、2-甲基-丁-1-炔-3-基、2-甲基-丁-1-炔-4-基、2-甲基-丁-2-炔-1-基、2-甲基-丁-2-炔-3-基、2-甲基-丁-2-炔-4-基、3-甲基-丁-1-炔-1-基、3-甲基-丁-1-炔-2-

基、3-甲基-丁-1-炔-3-基、3-甲基-丁-1-炔-4-基、2,2-二甲基-丙-1-炔-1-基、2,2-二甲基-丙-1-炔-2-基、己-1-炔-1-基、己-1-炔-2-基、己-1-炔-3-基、己-1-炔-4-基、己-1-炔-5-基、己-1-炔-6-基、己-2-炔-1-基、己-2-炔-2-基、己-2-炔-3-基、己-2-炔-4-基、己-2-炔-5-基、己-2-炔-6-基、己-3-炔-1-基、己-3-炔-2-基、己-3-炔-3-基、2-甲基-戊-1-炔-1-基、2-甲基-戊-1-炔-3-基、2-甲基-戊-1-炔-4-基、2-甲基-戊-1-炔-5-基、2-甲基-戊-2-炔-1-基、2-甲基-戊-2-炔-3-基、2-甲基-戊-2-炔-4-基、2-甲基-戊-2-炔-5-基、3-甲基-戊-1-炔-1-基、3-甲基-戊-1-炔-2-基、3-甲基-戊-1-炔-3-基、3-甲基-戊-1-炔-4-基、3-甲基-戊-1-炔-5-基、3-甲基-戊-2-炔-1-基、3-甲基-戊-2-炔-2-基、3-甲基-戊-2-炔-4-基、3-甲基-戊-2-炔-5-基、4-甲基-戊-1-炔-1-基、4-甲基-戊-1-炔-2-基、4-甲基-戊-1-炔-3-基、4-甲基-戊-1-炔-4-基、4-甲基-戊-1-炔-5-基、4-甲基-戊-2-炔-1-基、4-甲基-戊-2-炔-2-基、4-甲基-戊-2-炔-3-基、4-甲基-戊-2-炔-4-基、4-甲基-戊-2-炔-5-基、2,3-二甲基-丁-1-炔-1-基、2,3-二甲基-丁-1-炔-3-基、2,3-二甲基-丁-1-炔-4-基、2,3-二甲基-丁-2-炔-1-基、3,3-二甲基-丁-1-炔-1-基、3,3-二甲基-丁-1-炔-2-基、3,3-二甲基-丁-1-炔-4-基、2-乙基-丁-1-炔-1-基、2-乙基-丁-1-炔-3-基、2-乙基-丁-1-炔-4-基、3-乙基-丁-1-炔-1-基、3-乙基-丁-1-炔-2-基、3-乙基-丁-1-炔-3-基、3-乙基-丁-1-炔-4-基、2-乙基-丁-2-炔-1-

基、2-乙基-丁-2-炔-3-基，及2-乙基-丁-2-炔-4-基。

本發明中，「烷氧基」係指以-OR代表的基團，其中R為烷基。

「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基」意指有1-6個碳原子的烷氧基。「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基」係指有1-4個碳原子的烷氧基。

「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基」例如包括但不限於：甲氧基、乙氧基，1-丙氧基、2-丙氧基、2-甲基-1-丙氧基、2-甲基-2-丙氧基、1-丁氧基，及2-丁氧基。

本發明中「環烷基」係指飽和碳環系。「C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基」係指3-10員環烷基。

「C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基」例如包括但不限於：環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、環辛基、及金剛基。例如，3-8員環烷基也包括在「C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基」。

本發明中「C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烯基」係指具有至少1個雙鍵(兩相鄰的SP<sup>2</sup>碳原子)之3至10個碳原子的環狀不飽和脂肪族烴基。

「C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烯基」之特定例包括環丙烯基、環丁烯基、環戊烯基、環己烯基、環庚烯基，及環辛烯基。

本發明中「C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 芳基」係指6至10個碳原子的芳香族環狀烴基。

「C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 芳基」之特定例包括苯基、1-萘基及2-萘基。

本發明中「鹵素」係指氟原子、氯原子、溴原子或碘原子。

此處使用的用語「雜原子」意指硫原子、氧原子或氮

原子。

本發明中，「胺基」係指以 $-NH_2$ 表示的基團，其氫原子可各選擇性以取代基取代。

本發明中「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺基」係指鍵結於該C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基的胺基。

「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺基」例如包括但不限於：甲基胺基、乙基胺基、丙基胺基、異丙基胺基、正丁基胺基、第二丁基胺基、第三丁基胺基，及2-乙基丁基胺基。

本發明中「二(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)胺基」，係指鍵結於2個上述定義的「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基」的胺基。

「二(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)胺基」之特定例，包括二甲基胺基、二乙基胺基、二丙基胺基、二異丙基胺基、二正丁基胺基、二第二丁基胺基、二第三丁基胺基、及二-2-乙基丁基胺基。

本發明中「C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>烷基氧羰基胺基」，係指以(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)-O-C=O-NH-表示的基團，或如上定義的「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基」鍵結於-OCONH-的基團。

本發明中「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>氨基烷基」，係指胺基鍵結於上述定義之「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基」的基團。

本發明中「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>羥基烷基」，係指1或多個羥基鍵結於上述定義的「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基」的基團。

本發明中，「礦醯基」係以-SO<sub>2</sub>-表示的基團。

本發明中，「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基礦醯基」係指R-SO<sub>2</sub>-其中R為該C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基。「C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基礦醯基」係指R-SO<sub>2</sub>-其中R為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基。

「 $C_1-C_6$  烷基磺醯基」例如包括但不限於：甲基磺醯基、乙基磺醯基、丙基磺醯基、異丙基磺醯基、正丁基磺醯基、第二丁基磺醯基、第三丁基磺醯基，及 2-乙基丁基磺醯基。

本發明中，「 $C_6-C_{10}$  芳基磺醯基」係指  $R-SO_2-$ ，其中 R 為該  $C_6-C_{10}$  芳基。

「 $C_6-C_{10}$  芳基磺醯基」例如包括但不限於苯基磺醯基。

本發明中「 $C_1-C_6$  烷基磺醯基胺基」係指  $R-SO_2-NH-$ ，其中 R 為「 $C_1-C_6$  烷基」。

「 $C_1-C_4$  烷基磺醯基胺基」係指  $R-SO_2-NH-$ ，其中 R 為  $R-SO_2-NH-$ 、其中 R 為「 $C_1-C_4$  烷基」。

「 $C_1-C_6$  烷基磺醯基胺基」例如包括但不限於甲基磺醯基胺基、乙基磺醯基胺基、丙基磺醯基胺基、異丙基磺醯基胺基、正丁基磺醯基胺基、第二丁基磺醯基胺基、第三丁基磺醯基胺基、及 2-乙基丁基磺醯基胺基。

本發明中，「亞磺醯基」係以  $-SO-$  表示之基團。

本發明中，「 $C_1-C_6$  烷基亞磺醯基」係指  $R-SO-$ ，其中 R 為該  $C_1-C_6$  烷基。「 $C_1-C_4$  烷基亞磺醯基」係指  $R-SO-$  其中 R 為  $C_1-C_4$  烷基。

「 $C_1-C_6$  烷基亞磺醯基」例如包括但不限於甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、丙基亞磺醯基、異丙基亞磺醯基、正丁基亞磺醯基、第二丁基亞磺醯基、第三丁基亞磺醯基，及 2-乙基丁基亞磺醯基。

本發明中「雜芳基」係指包括選自 O、S 及 N 當中至少 1 種雜原子的單環或稠合雜環基。當該芳香族雜環基為稠

合環時，包括部分氫化的環者也包括在「雜芳基」。

此種雜芳基例如：吡唑基、噻唑基、異噻唑基、噻二唑基、咪唑基、呋喃基、噁吩基、𫫇唑基、異𫫇唑基、吡咯基、咪唑基、(1, 2, 3)- 及 (1, 2, 4)-三唑基、四唑基、哌喃基、吡啶基、嘧啶基、吡阱基、嗒阱基、喹啉基、異喹啉基、四氫異喹啉基、苯并呋喃基、異苯并呋喃基、吲哚啉基、吲哚基、異吲哚基、吲唑基、苯并咪唑基、苯并三唑基、苯并𫫇唑基、苯并噻唑基、苯并 [b] 噻吩基、(1, 2)-及 (1, 3)-苯并𫫇硫醇、噠烯基、2-側氧基噠烯基、苯并噻二唑基、喹阱基、酞阱基、嚓啶基、喹𫫇啉基、喹唑啉基、辛啉基、咔唑基、四氫異喹啉基、四唑基、[1, 2, 4]三氮基 [1. 5-a] 吡啶基、1*H*-吡咯并 [2, 3-*b*] 吡啶基，及 2, 3-二氫苯并𫫇唑基。

較佳例包括：吡唑基、呋喃基、噁吩基、吡啶基、嘧啶基、四氫異喹啉基、吲哚啉基、吲唑基、苯并咪唑基、苯并𫫇唑基、四氫異喹啉基、四唑基、[1, 2, 4]三氮基 [1. 5-a] 吡啶基、1*H*-吡咯并 [2, 3-*b*] 吡啶基、及 2, 3-二氫苯并𫫇唑基。

本發明中「3 至 8 葓雜環烷基」係指非芳香族單價 3 至 8 葓環，其在形成環的原子中包括 1 至 3 個雜原子，且可在該環中具有 1 個雙鍵。

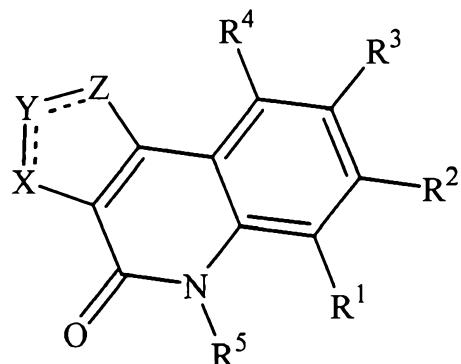
「3 至 8 葓雜環烷基」例如包括：氮丙啶基 (aziridinyl)、三亞甲亞胺基 (azetidinyl)、吡咯啶基、咪唑啶基、哌啶基、哌阱基、氮雜環庚烷基 (azepanyl)、嗎啉基、環氧化丙

烷基(oxetanyl)，及1,2,5,6-四氫吡啶基。

鹽係定義為由酸與鹼的中和反應形成的產物。鹽為離子化合物，由陽離子(帶正電的離子)與陰離子(負離子)組成，使得該產物為電中性。此等成分離子可為無機或有機。

水合物係用在無機化學與有機化學的用語，用於指出該物質包括水。溶劑合物係指於溶液中的分子與溶劑分子錯合。異構物為有相同分子式但不同結構式的化合物。尤其，異構物包括該化合物的幾何異構物、光學異構物、鏡像異構物、互變異構物，及其混合物。

於一較佳具體例，本發明提供[1]一種以式(I)表示的化合物或其在醫藥上可接受的鹽：



I

其中R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及R<sup>4</sup>各自獨立地為選自由以下構成的群組的基團：

氫原子、

羥基、

齒素、

氰基、

硝基、

胺基、

$C_1-C_6$  烷基、

$C_2-C_6$  烯基、

$C_2-C_6$  炔基、

$C_3-C_{10}$  環烷基、

$C_3-C_{10}$  環烯基、

$C_1-C_6$  烷氨基、

$C_6-C_{10}$  芳基、

二氫節基、

雜芳基、

3 至 8 員雜環烷基、

- $OSO_2CH_3$ 、

- $OSO_2CF_3$ 、

- $CONH_2$ 、

- $OCONR^{101}R^{102}$ ，其中  $R^{101}$  與  $R^{102}$  各自獨立地為氫原子、

$C_1-C_6$  烷基，或  $R^{101}$  與  $R^{102}$  一起形成嗎啉基，

- $OCOR^{103}$ ，其中  $R^{103}$  表示  $C_1-C_6$  烷基，及

- $OCOOR^{104}$ ，其中  $R^{104}$  表示  $C_1-C_6$  烷基、

其中  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及  $R^4$  選擇性可經由選自取代基 A 構成的群組的取代基獨立地取代；

其中取代基 A 獨立地選自由以下構成的群組：

羥基；

側氧基 (=O)；

氰基；

鹵素；

$C_1-C_6$  烷基，選擇性以取代基 B 取代；

$C_3-C_{10}$  環烷基，選擇性經氯基或經  $-NR^{31}R^{32}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基取代，其中  $R^{31}$  與  $R^{32}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；

$-NR^{21}R^{22}$ ，其中  $R^{21}$  與  $R^{22}$  各自獨立地表示氫原子； $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基、胺基、二( $C_1-C_6$  烷基)胺基、 $-SO_2(C_1-C_6$  烷基)、3 至 8 員雜環烷基、或氯基取代；或 3 至 8 員雜環烷基，選擇性經  $-COOR^{105}$  取代，其中  $R^{105}$  表示  $C_1-C_6$  烷基；

$C_1-C_6$  烷氧基選擇性經鹵素、3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代、或  $-NR^{33}R^{34}$  取代，其中  $R^{33}$  與  $R^{34}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基磺醯基、或選擇性經  $C_1-C_6$  烷基磺醯基或二( $C_1-C_6$  烷基)胺基取代的  $C_1-C_6$  烷基；

$-SO_2NR^{23}R^{24}$ ，其中  $R^{23}$  與  $R^{24}$  各自獨立地表示氫原子； $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基、 $C_1-C_6$  烷氧基、鹵素、 $C_3-C_{10}$  環烷基、雜芳基、或  $-NR^{35}R^{36}$  取代，其中  $R^{35}$  與  $R^{36}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基； $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  羅基烷基取代；3 至 8 員雜環烷基；或  $R^{23}$  與  $R^{24}$  一起形成選擇性經胺基或鹵素取代的 3 至 8 員雜環烷基；

$C_1-C_6$  烷基磺醯基，選擇性經羥基取代；

$-NHSO_2(C_1-C_6$  烷基)，其中該碳原子選擇性經  $-NR^{37}R^{38}$

取代，其中  $R^{37}$  與  $R^{38}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；

3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $-NR^{39}R^{40}$  取代，其中  $R^{39}$  與  $R^{40}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $C_1-C_6$  烷基礦醯基； $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $-NR^{41}R^{42}$  取代，其中  $R^{41}$  與  $R^{42}$  各自獨立而代表氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；羥基；或  $C_1-C_6$  烷基礦醯基；

芳基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代，該  $C_1-C_6$  烷基選擇性以氯基或胺基取代；

雜芳基；

$-COOR^{11}$ ，其中  $R^{11}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；及  
 $-COR^{12}$ ，其中  $R^{12}$  表示  $C_1-C_6$  烷基； $C_3-C_{10}$  環烷基；氯基甲基；胺基甲基； $-NR^{25}R^{26}$ ，其中  $R^{25}$  與  $R^{26}$  各自獨立地表示氫原子或選擇性經羥基或  $-NR^{43}R^{44}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基，其中  $R^{43}$  與  $R^{44}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；或 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代；

其中取代基 B 獨立地選自由以下構成的群組：

鹵素；

羥基；

$C_1-C_6$  烷氧基；

氯基；

環烷基；

$C_6-C_{10}$  芳基，選擇性經氯基取代；

雜芳基；

3 至 8 員雜環烷基，選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、羥基、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 胺基烷基、或經 C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> 烷基氧羰基胺基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基所取代；

-NR<sup>51</sup>R<sup>52</sup>，其中 R<sup>51</sup> 與 R<sup>52</sup> 各自獨立地表示氫原子；C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基磺醯基或選擇性經 -COOR<sup>53</sup> 取代的 3 至 8 員雜環烷基所取代，其中 R<sup>53</sup> 表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基；3 至 8 員雜環烷基；C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基磺醯基；C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基；-COR<sup>55</sup> 其中 R<sup>55</sup> 表示 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基；-COOR<sup>56</sup> 其中 R<sup>56</sup> 表示 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基；或 -CONR<sup>57</sup>R<sup>58</sup>，其中 R<sup>57</sup> 與 R<sup>58</sup> 各自獨立地表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基；

-COOR<sup>54</sup>，其中 R<sup>54</sup> 表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基；

-CONH<sub>2</sub>；

-SO<sub>2</sub>NR<sup>106</sup>R<sup>107</sup>，其中 R<sup>106</sup> 與 R<sup>107</sup> 各自獨立地表示氫原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、或 C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基；

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基亞磺醯基；及

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基磺醯基；

其中 R<sup>5</sup> 為氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基；且

其中 —X—Y—Z— 為選自由以下構成的群組的構造

(i) -S-CR<sup>7</sup>=CR<sup>6</sup>-、

(ii) -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-、

(iii) -NR<sup>108</sup>-CH=CR<sup>109</sup>-，其中 R<sup>108</sup> 表示氫原子、或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基，選擇性經羥基取代，R<sup>109</sup> 表示氫原子、CH<sub>3</sub>、或經烷基胺基取代之苯基，

(iv) -N=CH-S-，

其中  $R^6$  選自由以下構成的群組：

氫原子、

羥基、

$C_1-C_6$  烷基、

$C_6-C_{10}$  芳基，選擇性經羥基取代，

3至8員雜環烷基，選擇性經 $-NR^{61}R^{62}$ 取代，其中  $R^{61}$  與  $R^{62}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；

其中  $R^7$  選自由以下構成的群組：

氫原子；

鹵素；

$C_1-C_6$  烷基，選擇性經羥基、 $-NR^{71}R^{72}$ ，其中  $R^{71}$  與  $R^{72}$  各自獨立地表示氫原子；選擇性經二甲基胺基取代之  $C_1-C_6$  烷基；選擇性經胺基取代之  $C_3-C_{10}$  環烷基或3至8員雜環烷基；或選擇性經  $C_1-C_6$  胺基烷基取代之3至8員雜環烷基所取代；

選擇性經羥基取代之  $C_6-C_{10}$  芳基；

$C_6-C_{10}$  芳基磺醯基；及

$-COR^{73}$ ，其中  $R^{73}$  表示選擇性經胺基取代之3至8員雜環烷基；或 $-NR^{74}R^{75}$ ，其中  $R^{74}$  與  $R^{75}$  各自獨立地表示氫原子、3至8員雜環烷基、或選擇性經胺基取代之  $C_3-C_{10}$  環烷基。

[2] 如[1]之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  
 $\text{---X---Y---Z---}$  為 $-S-CR^7=CR^6-$ 。

[3] 如[2]之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^1$

為氫原子、氰基、選擇性經羥基或鹵素取代之 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炫基、或鹵素。

[4] 如[2]之化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中 R<sup>2</sup> 為  
氫原子、羥基、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、或選擇性經羥基  
取代之 C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 芳基。

[5] 如[2]之化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中 R<sup>2</sup> 為  
氫原子、羥基、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、或二羥基苯基。

[6] 如[2]之化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中 R<sup>3</sup> 選  
自由以下構成的群組：氫原子； 羅基； C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基選擇性  
經羥基、鹵素、或羥基乙基胺基取代； 鹵素； 選擇性  
經二甲基胺基或嗎啉基取代之 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基； C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷  
基苯基，其中該等脂肪族碳選擇性經 -NR<sup>51</sup>R<sup>52</sup> 取代； 氟  
基； 硝基； 胺基； 3 至 8 員雜環烷基，選擇性經胺基取  
代； 雜芳基； -OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>； -OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>； -OCOR<sup>103</sup>，其中 R<sup>103</sup>  
表示 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基； -OCOOR<sup>104</sup>，其中 R<sup>104</sup> 表示 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基；  
-OCOCONR<sup>101</sup>R<sup>102</sup>，其中 R<sup>101</sup> 與 R<sup>102</sup> 各自獨立地代表氫原子  
或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基，或 R<sup>101</sup> 與 R<sup>102</sup> 一起形成嗎啉基； 及  
-CONH<sub>2</sub>。

[7] 如[6]之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中當  
R<sup>3</sup> 為 3 至 8 員雜環烷基，該 3 至 8 員雜環烷基選自由以  
下構成的群組：哌啶基、吡咯啶基、嗎啉基，或哌啶基，  
並選擇性經胺基取代； 且當 R<sup>3</sup> 為雜芳基，該雜芳基為吡  
啶基。

[8]. 如[2]之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中 R<sup>4</sup>

選自由以下構成的群組：氫原子、羥基、鹵素、胺基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、 $C_3-C_{10}$  環烯基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_6-C_{10}$  芳基、二氫茚基、雜芳基，及 3 至 8 聲雜環烷基，且  $R^4$  選擇性經取代基 A 取代。

[9] 如 [8] 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中當  $R^4$  為雜芳基，該雜芳基選自由以下構成的群組：吡啶基、 $1H$ -吲唑基、 $1H$ -四唑基、[1, 2, 4]三唑并[1, 5-a]吡啶基、苯并咪唑基、2, 3-二氫苯并噁唑基、吡唑基、吡咯并[2, 3-b]吡啶基、嘧啶基、吲哚啉基、呋喃基、噻吩基、及四氫異喹啉基)；且其中該 3 至 8 聲雜環烷基選自由以下構成的群組：氮丙啶基、三亞甲亞胺基、吡咯啶基、咪唑啶基、哌啶基、哌阱基、氮雜環庚烷基、嗎啉基，及 1, 2, 3, 6-四氫吡啶基；其中  $R^4$  的各基團選擇性經取代基 A-1 取代；

其中取代基 A-1 選自由以下構成的群組：

羥基；

側氧基；

氯基；

鹵素；

$C_1-C_6$  烷基選擇性經選自由取代基 B-1 構成的群組的取代基取代；

$C_3-C_{10}$  環烷基，選擇性經氯基取代之  $C_3-C_{10}$  環烷基，或經  $-NR^{31}R^{32}$  取代；

$-NR^{21A}R^{22A}$ ，其中  $R^{21A}$  與  $R^{22A}$  各自獨立地表示氫原子；

選擇性經胺基、二( $C_1-C_6$  烷基) 胺基、 $-SO_2(C_1-C_6$  烷基)、哌啶基、或氰基取代之  $C_1-C_6$  烷基；或選擇性經  $-COOR^{105}$  取代之哌啶基；

$C_1-C_6$  烷氧基，選擇性經鹵素；3至8員雜環烷基，選自哌啶基及哌啶基，其中之一選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代；或  $-NR^{33}R^{34}$  取代；

$-SO_2NR^{23A}R^{24A}$ ，其中  $R^{23A}$  與  $R^{24A}$  各自獨立地表示氫原子、選擇性經羥基、 $C_1-C_6$  烷氧基、鹵素、 $C_3-C_{10}$  環烷基、吡唑基、咪唑基、或  $-NR^{35}R^{36}$  取代之  $C_1-C_6$  烷基；選擇性經  $C_1-C_6$  羥基烷基取代之  $C_3-C_{10}$  環烷基；三亞甲亞胺基；吡咯啶基，或  $R^{23A}$  與  $R^{24A}$  一起形成選擇性經胺基或鹵素取代之吡咯啶基；

選擇性經羥基取代之  $C_1-C_6$  烷基磺醯基；

$-NHSO_2(C_1-C_6$  烷基)，其中該碳原子選擇性經  $-NR^{37}R^{38}$  取代；

3至8員雜環烷基，選自由以下構成之群組：三亞甲亞胺基、吡咯啶基、哌啶基、哌啶基，及四氫吡啶基，其中任一者選擇性經  $-NR^{39}R^{40}$  取代；選擇性經  $-NR^{41}R^{42}$  取代之  $C_1-C_6$  烷基；羥基；或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基；

$1H$ -四唑基；

芳基，選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代，其中  $C_1-C_6$  的脂肪族碳選擇性取代為氰基或胺基；

$-COOR^{11}$ ；及

$-COR^{12A}$ ，其中  $R^{12A}$  表示選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代之哌啶

基； $C_3-C_{10}$  環烷基；氰基甲基；胺基甲基； $-NR^{25}R^{26}$  其中 $R^{25}$  與 $R^{26}$  各自獨立地表示氫原子或經選擇性羥基或 $NR^{43}R^{44}$  取代之 $C_1-C_6$  烷基；或 $C_1-C_6$  烷基磺醯基；

其中取代基 B-1 選自由以下構成的群組：

鹵素；

羥基；

$C_1-C_6$  烷氧基；

氰基；

環烷基；

苯基，選擇性經氰基取代；

雜芳基，選自由以下構成之群組：咪唑基、吡唑基、及噁唑基；

3 至 8 員雜環烷基，選自由以下構成的群組：吡咯啶基、哌啶基、哌嗪基、嗎啉基，及環氧丙烷基，其中任一者選擇性經羥基、胺基、 $C_1-C_6$  胺基烷基、或選擇性經 $C_2-C_7$  烷基氧羰基胺基取代之 $C_1-C_6$  烷基所取代；

$-NR^{51A}R^{52A}$ ，其中 $R^{51A}$  與 $R^{52A}$  各自獨立地表示氫原子；選擇性經 $C_1-C_6$  烷基磺醯基取代之 $C_1-C_6$  烷基或選擇性經 $-COOR^{53}$  取代之哌啶基；哌啶基； $C_1-C_6$  烷基磺醯基； $C_3-C_{10}$  環烷基； $-COR^{55}$ ， $-COOR^{56}$ 、或 $-CONR^{57}R^{58}$ ；

$-COOR^{54}$ ；

$-CONH_2$ ；

$-SO_2NR^{106}R^{107}$ ；

$C_1-C_6$  烷基亞磺醯基；及

$C_1-C_6$  烷基 磺 鹽 基。

[10] 如 [9] 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^4$  選自基團 (p)：

其中基團 (p) 獨立地選自由以下構成的群組：

氫原子、

羥基、

鹵素、

胺基，選擇性經選自由取代基 (g) 構成的群組的取代基取代，

$C_1-C_6$  烷基，選擇性經選自由取代基 (a) 構成的群組的取代基取代，

$C_2-C_6$  烯基，選擇性經選自由取代基 (b) 構成的群組的取代基取代，

$C_3-C_{10}$  環烷基、

$C_3-C_{10}$  環烯基、

$C_1-C_6$  烷氧基、

$C_6-C_{10}$  芳基，選擇性經選自由取代基 (c) 構成的群組的取代基取代，

二氫節基，選擇性經選自由取代基 (d) 構成的群組的取代基取代，

雜芳基，選自由以下構成之群組：吡啶基、 $1H$ -吲唑基、 $1H$ -四唑基、[1, 2, 4]三唑并[1, 5-a]吡啶基、苯并咪唑基、2, 3-二氫苯并𫫇唑基、吡唑基、吡咯并[2, 3-b]吡啶基、嘧啶基、吲哚啉基、呋喃基、噻吩基、及四氫

異喹啉基，其中任一者選擇性經選自由取代基(e)構成的群組的取代基取代；及

3至8員雜環烷基，選自由以下構成之群組：吡咯啶基、哌啶基、哌嗪基、嗎啉基、及1,2,3,6-四氫吡啶基，其中任一者選擇性經選自由取代基(f)構成的群組的取代基取代；

其中取代基(a)選自由以下構成的群組：

$-NR^{21A}R^{22A}$ ，其中 $R^{21A}$ 與 $R^{22A}$ 各自獨立地表示氫原子；選擇性經哌啶基取代之C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基；或選擇性經-COOR<sup>105</sup>取代之哌啶基；

3至8員雜環烷基，選自由以下構成之群組：吡咯啶基及哌啶基，其中任一者選擇性經選擇性有-NR<sup>41</sup>R<sup>42</sup>或-NR<sup>39</sup>R<sup>40</sup>取代之C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基取代，其中R<sup>39</sup>與R<sup>40</sup>各自獨立地表示氫原子或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基；及

-NHSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)；

其中取代基(b)選自由以下構成的群組：

-COOR<sup>11</sup>；

$-NR^{21a}R^{22a}$ ，其中 $R^{21a}$ 與 $R^{22a}$ 各自獨立地表示氫原子、或選擇性經二(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)胺基或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基礦醯基取代之C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基；

3至8員雜環烷基，選自由以下構成之群組：三亞甲亞胺基、吡咯啶基、及哌啶基，其中任一者選擇性經-NR<sup>39</sup>R<sup>40</sup>、選擇性有-NR<sup>41</sup>R<sup>42</sup>、羥基、或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基礦醯基取代的C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基取代；

氯基；及

$C_1-C_6$  烷氧基；

其中取代基(c)選自由以下構成的群組：

羥基；

氯基；

鹵素；

$C_1-C_6$  烷基選擇性經選自以下取代基 B-c 構成的群組的取代基取代；

選擇性經氯基取代之  $C_3-C_{10}$  環烷基，或經  $-NR^{31}R^{32}$  取代之  $C_1-C_6$  烷基；

$-NR^{21c}R^{22c}$ ，其中  $R^{21c}$  與  $R^{22c}$  各自獨立地表示氫原子或選擇性經胺基或氯基取代之  $C_1-C_6$  烷基；

$C_1-C_6$  烷氧基，選擇性經鹵素、選自由哌啶基及哌啶基構成之群組的 3 至 8 員雜環烷基，其中任一者選擇性經  $C_1-C_6$  烷基、或  $-NR^{33}R^{34}$  取代；

$-SO_2NR^{23c}R^{24c}$ ，其中  $R^{23c}$  與  $R^{24c}$  各自獨立地表示氫原子、選擇性經羥基、 $C_1-C_6$  烷氧基、鹵素、 $C_3-C_{10}$  環烷基、吡唑基、咪唑基、或  $-NR^{35}R^{36}$  取代之  $C_1-C_6$  烷基；選擇性經  $C_1-C_6$  羣基烷基取代之  $C_3-C_{10}$  環烷基；三亞甲亞胺基、吡咯啶基，或其中  $R^{23c}$  與  $R^{24c}$  一起形成吡咯啶基，其選擇性經胺基或鹵素取代；

$C_1-C_6$  烷基磺醯基，選擇性經羥基取代；

$-NHSO_2(C_1-C_6$  烷基)，其中碳原子選擇性經  $-NR^{37}R^{38}$  取代；

哌啶基，選擇性經  $C_1-C_6$  烷基或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基取代；

哌啶基，選擇性經羥基取代；

$1H$ -四唑基；

1, 2, 3, 6-四氫吡啶基；及

$-COR^{12c}$ ，其中  $R^{12c}$  表示哌啶基，其選擇性經  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、氟基甲基、胺基甲基、 $-NR^{25}R^{26}$ 、或  $C_1-C_6$  烷基取代；及

其中取代基 B-C 選自由以下構成的群組：

鹵素；

羥基；

甲氧基；

氟基；

$C_3-C_{10}$  環烷基；

3 至 8 員雜環烷基，選自由以下構成之群組：吡咯啶基、哌啶基、哌嗪基、嗎啉基、及環氧丙烷基，其中任一者選擇性經  $C_1-C_6$  烷基、羥基、胺基、 $C_1-C_6$  胺基烷基、或經  $C_2-C_7$  烷基氧羰基胺基取代之  $C_1-C_6$  烷基取代；

$-NR^{51c}R^{52c}$ ，其中  $R^{51c}$  與  $R^{52c}$  各自獨立地表示氫原子；

選擇性經  $C_1-C_6$  烷基磺醯基取代之  $C_1-C_6$  烷基、或選擇性經  $-COOR^{53}$  取代之哌啶基； 哌啶基；  $C_1-C_6$  烷基磺醯基；  $C_3-C_{10}$  環烷基；  $-COR^{55}$ ； 或  $-CONR^{57}R^{58}$ ；

雜芳基，選自由以下構成的群組：咪唑基、吡唑基、及噻唑基；

$-COOR^{54}$ ;

$-CONH_2$ ;

$-SO_2NR^{106}R^{107}$ ;

$C_1-C_6$  烷基亞礦醯基；及

$C_1-C_6$  烷基礦醯基；

其中取代基(d)選自由以下構成的群組：

$-NR^{21d}R^{22d}$ ，其中  $R^{21d}$  與  $R^{22d}$  各自獨立地表示氫原子或

$C_1-C_6$  烷基；

其中取代基(e)選自由以下構成的群組：

羥基；

側氨基；

氰基；

$C_3-C_{10}$  環烷基，選擇性經氰基取代；

$-NR^{21e}R^{22e}$ ，其中  $R^{21e}$  與  $R^{22e}$  各自獨立地表示氫原子

或選擇性經胺基取代之  $C_1-C_6$  烷基；

哌啶基；

$C_1-C_6$  烷氨基，選擇性經  $-NR^{33}R^{34}$  取代；

$C_1-C_6$  烷基，選擇性經氰基取代； $-NR^{51e}R^{52e}$ ，其中  $R^{51e}$  與  $R^{52e}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $-COOR^{56}$ ；

嗎啉基；或氰基苯基；

$-CONH_2$ ；

其中取代基(f)選自由以下構成的群組：

$C_1-C_6$  烷基選擇性經  $-NR^{51f}R^{52f}$  取代，其中  $R^{51f}$  與  $R^{52f}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $-COOR^{56}$ ；及

$C_1-C_6$  烷基礦鹽基；

其中取代基(g) 為選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代之芳基，該  $C_1-C_6$  烷基具有的脂肪族碳選擇性取代為氨基或胺基。

[11] 如[2]之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^6$  為氫原子； 羥基；  $C_1-C_6$  烷基； 選擇性經 1 至 3 個羟基取代之苯基； 選擇性經胺基取代之哌啶基； 或哌啶基。

[12] 如[11]之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^7$  為氫原子； 選擇性經羟基或哌啶基取代之  $C_1-C_6$  烷基； 或鹵素。

[13] 如[2]之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^7$  為

氫原子；

選擇性經羟基取代之  $C_1-C_6$  烷基；  $-NR^{71A}R^{72A}$ ，其中  $R^{71A}$  與  $R^{72A}$  各自獨立而代表氫原子、選擇性經二甲基胺基取代之  $C_1-C_6$  烷基、選擇性經胺基取代之  $C_3-C_{10}$  環烷基、或哌啶基； 或 3 至 8 聲雜環烷基，選自由哌啶基與嗎啉基構成的群組，其中任一者選擇性經  $C_1-C_6$  胺基烷基取代；

選擇性經 1 至 2 個羟基取代之苯基；

苯基礦鹽基；或

$-COR^{73A}$ ，其中  $R^{73A}$  表示選擇性經胺基取代之哌啶基、或  $-NR^{74A}R^{75A}$ ，其中  $R^{74A}$  與  $R^{75A}$  各自獨立地表示氫原子、哌啶基、或選擇性經胺基取代之  $C_3-C_{10}$  環烷基。

[14] 如[1]之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中

—X---Y---Z— 為  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 。

[15] 如 [14] 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $\text{R}^1$  與  $\text{R}^2$  為氫原子。

[16] 如 [14] 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $\text{R}^3$  為羥基或甲氧基。

[17] 如 [14] 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $\text{R}^4$  為氫原子；經有  $-\text{NR}^{51A}\text{R}^{52A}$  取代之  $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基取代的苯基，其中  $\text{R}^{51A}$  與  $\text{R}^{52A}$  各自獨立地表示氫原子或  $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基、或  $-\text{SO}_2\text{NR}^{53A}\text{R}^{54A}$ ，其中  $\text{R}^{53A}$  與  $\text{R}^{54A}$  各自獨立地表示氫原子或選擇性經鹵素或羥基取代之  $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基； $1, 2, 3, 6$ -四氫吡啶基；羥基吡啶基；或甲氧基吡啶基。

[18] 如 [1] 之該化合物，或其在醫藥上可接受的鹽，其中  
—X---Y---Z— 為  $-\text{NR}^{108}-\text{CH}=\text{CR}^{109}-$ ，

$\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$  及  $\text{R}^4$  為氫原子，且

$\text{R}^3$  為氫原子、羥基或  $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷氧基。

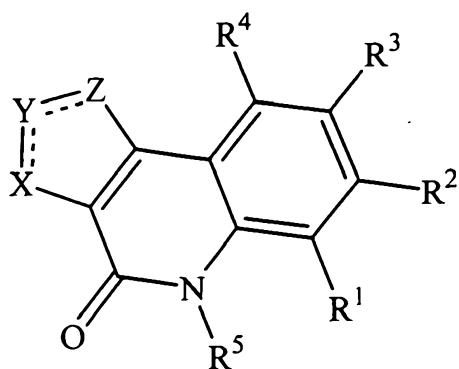
[19] 如 [1] 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  
—X---Y---Z— 為  $-\text{N}=\text{CH}-\text{S}-$ 、

$\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$  及  $\text{R}^4$  為氫原子，且

$\text{R}^3$  為甲氧基。

或者，於一些具體例中，本發明也提供以式(I)表示的化合物或其在醫藥上可接受的鹽：

1. 一種以通式 I 表示之化合物：



I

或其在醫藥上可接受的鹽，

其中 R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup> 及 R<sup>4</sup> 各自獨立地為選自由以下構成的群組的基團：

氫原子、

羥基、

鹵素、

氰基、

硝基、

胺基、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炫基、

C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基、

C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烯基、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氨基、

C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 芳基、

二氫茚基、

雜芳基、

3 至 8 員雜環烷基、

-OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、

-OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、

-CONH<sub>2</sub>

-OCO NR<sup>101</sup>R<sup>102</sup> (其中 R<sup>101</sup> 與 R<sup>102</sup> 各自獨立地表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、或 R<sup>101</sup> 與 R<sup>102</sup> 一起形成嗎啉基)、

-OCOR<sup>103</sup> (其中 R<sup>103</sup> 表示 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)，及

-OCOOR<sup>104</sup> (其中 R<sup>104</sup> 表示 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)

其中 R<sup>1</sup> 至 R<sup>4</sup> 的各基團選擇性經選自以下取代基 A 構成的群組的取代基取代：

取代基 A：

羥基；

側氧基 (=O)；

氯基；

鹵素；

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基 (其中該 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基選擇性經選自以下取代基 B 構成的群組的取代基取代)；

C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基 [其中該 C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基選擇性經氯基取代、或經有 -NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup> 取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基取代 (其中 R<sup>31</sup> 與 R<sup>32</sup> 各自獨立地表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)]；

-NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup> [其中 R<sup>21</sup> 與 R<sup>22</sup> 各自獨立地表示氫原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基 (其中該 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基選擇性經羥基、胺基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基磺醯基 (-SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)))、3 至 8 員雜環烷基、或氯基取代)、或 3 至 8 員雜環烷基 (其中

該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經 -COOR<sup>105</sup> 取代(其中 R<sup>105</sup> 表示 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)取代];

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基 {其中該 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基選擇性經鹵素、3 至 8 員雜環烷基(其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基取代)、或 -NR<sup>33</sup>R<sup>34</sup> [其中 R<sup>33</sup> 與 R<sup>34</sup> 各自獨立地表示氫原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基(其中該 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基礦醯基或二(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)胺基)、或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基礦醯基取代]取代];

-SO<sub>2</sub>NR<sup>23</sup>R<sup>24</sup> {其中 R<sup>23</sup> 與 R<sup>24</sup> 各自獨立地表示氫原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基 [其中該 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基選擇性經羥基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、鹵素、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基、雜芳基、或 -NR<sup>35</sup>R<sup>36</sup>(其中 R<sup>35</sup> 與 R<sup>36</sup> 各自獨立地表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)]、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基(其中該 C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 羥基烷基取代)、或 3 至 8 員雜環烷基取代;或 R<sup>23</sup> 與 R<sup>24</sup> 可一起形成 3 至 8 員雜環烷基，其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經胺基或鹵素取代];

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基礦醯基(其中該 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基部分選擇性經羥基取代);

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基礦醯基胺基 (-NHSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)) [其中該 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基部分選擇性經 -NR<sup>37</sup>R<sup>38</sup> 取代(其中 R<sup>37</sup> 與 R<sup>38</sup> 各自獨立地表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)];

3 至 8 員雜環烷基 {其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經 -NR<sup>39</sup>R<sup>40</sup>(其中 R<sup>39</sup> 與 R<sup>40</sup> 各自獨立地表示氫原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基礦醯基)、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基 [其中該

$C_1-C_6$  烷基選擇性經  $-NR^{41}R^{42}$  取代 (其中  $R^{41}$  與  $R^{42}$  各自獨立而代表氫原子或  $C_1-C_6$  烷基) ]、羥基、或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基取代 };

芳基 (其中該芳基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代 [其中  $C_1-C_6$  烷基選擇性經氟基或胺基取代 ]);

雜芳基;

$-COOR^{11}$  (其中  $R^{11}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基); 及

$-COR^{12}$  [其中  $R^{12}$  表示  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、氟基甲基、胺基甲基、 $-NR^{25}R^{26}$  {其中  $R^{25}$  與  $R^{26}$  各自獨立地表示氫原子、或  $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基或  $-NR^{43}R^{44}$  取代 (其中  $R^{43}$  與  $R^{44}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)] }、或選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代之 3 至 8 員雜環烷基] ]、或選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代之 3 至 8 員雜環烷基 ] 、

取代基 B:

鹵素;

羥基;

$C_1-C_6$  烷氧基;

氟基;

環烷基;

$C_6-C_{10}$  芳基 (其中  $C_6-C_{10}$  芳基選擇性經氟基取代)

雜芳基;

3 至 8 員雜環烷基 (其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基、羥基、胺基、 $C_1-C_6$  胺基烷基、或有  $C_2-C_7$  烷基氧羰基胺基取代之  $C_1-C_6$  烷基取代 );

$-NR^{51}R^{52}$  {其中  $R^{51}$  與  $R^{52}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基礦醯基、或選擇性經  $-COOR^{53}$  取代之 3 至 8 聲雜環烷基 (其中  $R^{53}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基) 取代]、3 至 8 聲雜環烷基、 $C_1-C_6$  烷基礦醯基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、 $-COR^{55}$  (其中  $R^{55}$  表示  $C_1-C_6$  烷基)、 $-COOR^{56}$  (其中  $R^{56}$  表示  $C_1-C_6$  烷基)、或 $-CONR^{57}R^{58}$  (其中  $R^{57}$  與  $R^{58}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)}；

$-COOR^{54}$  (其中  $R^{54}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基) 取代]；

$-CONH_2$ ；

$-SO_2NR^{106}R^{107}$  {其中  $R^{106}$  與  $R^{107}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $C_3-C_{10}$  環烷基}

$C_1-C_6$  烷基亞礦醯基；及

$C_1-C_6$  烷基礦醯基；

其中  $R^5$  為氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；且

其中  $\text{---X---Y---Z---}$  為選自由以下構成的群組的構造：

(i)  $-S-CR^7=CR^6-$ 、

(ii)  $-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、

(iii)  $-NR^{108}-CH=CR^{109}-$  (其中  $R^{108}$  表示氫原子，或  $C_1-C_6$  烷基其選擇性經羥基取代， $R^{109}$  表示氫原子、 $CH_3$ ，或有  $C_1-C_6$  氨基烷基取代之苯基，及

(iv)  $-N=CH-S-$ 、

其中  $R^6$  為

氫原子、

羥基、

$C_1-C_6$  烷基、

$C_6-C_{10}$  芳基（其中該  $C_6-C_{10}$  芳基選擇性經羥基取代），或

3 至 8 員雜環烷基 [其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $-NR^{61}R^{62}$  取代（其中  $R^{61}$  與  $R^{62}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基）]；

其中  $R^7$  為

氫原子；

鹵素；

$C_1-C_6$  烷基 {其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基、 $-NR^{71}R^{72}$  [其中  $R^{71}$  與  $R^{72}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基（其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經二甲基胺基取代）、 $C_3-C_{10}$  環烷基（其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經胺基取代）、或 3 至 8 員雜環烷基]、或 3 至 8 員雜環烷基（其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  胺基烷基取代）取代}，

$C_6-C_{10}$  芳基（其中該  $C_6-C_{10}$  芳基選擇性經羥基取代）；

$C_6-C_{10}$  芳基礦醯基；或

$-COR^{73}$  {其中  $R^{73}$  表示 3 至 8 員雜環烷基（其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經胺基取代）或  $-NR^{74}R^{75}$  [其中  $R^{74}$  與  $R^{75}$  各自獨立地表示氫原子、3 至 8 員雜環烷基、或  $C_3-C_{10}$  環烷基（其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經胺基取代）]}。

2. 如 1. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中

—X---Y---Z— 為  $-S-CR^7=CR^6-$ 。

3. 如 2. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^1$  為氫原子、氰基、 $C_1-C_6$  烷基（其中  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基或鹵素取代）、 $C_3-C_{10}$  環烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基、或鹵素。
4. 如 2. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^2$  為氫原子、羥基、鹵素、 $C_1-C_6$  烷氧基、或選擇性經羥基取代之  $C_6-C_{10}$  芳基。
5. 如 2. 之該化合物或其在醫藥上可接受之鹽，其中  $R^2$  為氫原子、羥基、鹵素、 $C_1-C_6$  烷氧基、或二羥基苯基。
6. 如 2. 該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^3$  為氫原子；羥基； $C_1-C_6$  烷基（其中烷基選擇性經羥基、鹵素，或羥基乙基氨基取代）；鹵素； $C_1-C_6$  烷氧基，選擇性經二甲基氨基或嗎啉基取代； $C_1-C_6$  烷基苯基[其中該  $C_1-C_6$  烷基苯基之  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $-NR^{51}R^{52}$  取代{其中  $R^{51}$  與  $R^{52}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $-COOR^{56}$ （其中  $R^{56}$  表示  $C_1-C_6$  烷基）}]；氰基；硝基；氨基；3 至 8 員雜環烷基，其選擇性經氨基取代；雜芳基； $-OSO_2CH_3$ ； $-OSO_2CF_3$ ； $-OCOR^{103}$ （ $R^{103}$  表示  $C_1-C_6$  烷基）； $-OCOOR^{104}$ （其中  $R^{104}$  表示  $C_1-C_6$  烷基）； $-OCONR^{101}R^{102}$ （其中  $R^{101}$ 、 $R^{102}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基、或  $R^{101}$  與  $R^{102}$  一起形成嗎啉基）；或  $-CONH_2$ 。
7. 如 2. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^3$  為氫原子；羥基； $C_1-C_6$  烷基（其中烷基選擇性經羥基、鹵

素、或羥基乙基胺基取代)；鹵素；C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基，其選擇性經二甲基胺基或嗎啉基取代；C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基苯基(其中該 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基苯基之 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基選擇性經 -NR<sup>51</sup>R<sup>52</sup> 取代{其中 R<sup>51</sup> 與 R<sup>52</sup> 各自獨立地表示氫原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、或 -COOR<sup>56</sup>(其中 R<sup>56</sup> 表示 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)氯基；硝基；胺基；3 至 8 員雜環烷基，其選擇性經胺基取代(其中該 3 至 8 員雜環烷基為哌啶基、吡咯啶基、嗎啉基、或哌啶基)；吡啶基；-OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>；-OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>；-OCOR<sup>103</sup>(R<sup>103</sup> 表示 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)；-OCOOR<sup>104</sup>(其中 R<sup>104</sup> 表示 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)；-OCONR<sup>101</sup>R<sup>102</sup>(其中 R<sup>101</sup>、R<sup>102</sup> 各自獨立地表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、或 R<sup>101</sup> 與 R<sup>102</sup> 一起形成嗎啉基)；或 -CONH<sub>2</sub>。

8. 如 2. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中 R<sup>4</sup> 選自由以下構成的群組：氫原子、羥基、鹵素、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 芳基、二氫茚基、雜芳基、及 3 至 8 員雜環烷基，其中 R<sup>4</sup> 的各基團選擇性經由以上取代基 A 構成的群組的取代基取代。
9. 如 2. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中 R<sup>4</sup> 選自由以下構成之群組：氫原子、羥基、鹵素、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 芳基、二氫茚基、雜芳基(其中該雜芳基選自由以下構成的群組：吡啶基、1H-吲唑基、1H-四唑基、[1, 2, 4]三唑并[1, 5-a]吡啶基、苯并咪唑基、2, 3-二氫苯并𫫇唑基、吡唑基、吡咯并[2, 3-b]吡啶基、嘧

啶基、吲哚啉基、呋喃基、噻吩基、及四氫異噁啉基)，及 3 至 8 員雜環烷基(其中該 3 至 8 員雜環烷基選自由以下構成的群組：氮丙啶基、三亞甲亞胺基、吡咯啶基、咪唑啶基、哌啶基、哌阱基、氮雜環庚烷基、嗎啉基、及 1, 2, 3, 6-四氫吡啶基)，其中  $R^4$  的各基團選擇性經選自以下取代基 A-1 構成的群組的取代基取代：

取代基 A-1：

羥基；

側氨基；

氰基；

鹵素；

$C_1-C_6$  烷基(其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經選自以下取代基 B-1 構成的群組的取代基取代)；

$C_3-C_{10}$  環烷基 [其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經氰基、或有  $-NR^{31}R^{32}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基取代(其中  $R^{31}$  與  $R^{32}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]；

$-NR^{21A}R^{22A}$  [其中  $R^{21A}$  與  $R^{22A}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基{其中  $C_1-C_6$  烷基選擇性經胺基、二( $C_1-C_6$  烷基)胺基、 $C_1-C_6$  烷基磺醯基( $-SO_2(C_1-C_6$  烷基))、哌啶基、或氰基}、或哌啶基取代 {其中哌啶基選擇性經  $-COOR^{105}$  取代(其中  $R^{105}$  表示  $C_1-C_6$  烷基)}]；

$C_1-C_6$  烷氧基 {其中該  $C_1-C_6$  烷氧基選擇性經選自鹵素、哌啶基、及哌阱基的 3 至 8 員雜環烷基取代(其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代)}、或

$-NR^{33}R^{34}$  [其中  $R^{33}$  與  $R^{34}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基(其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基礦醯基或二( $C_1-C_6$  烷基)胺基取代)、或  $C_1-C_6$  烷基礦醯基];

$-SO_2NR^{23A}R^{24A}$  {其中  $R^{23A}$  與  $R^{24A}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基、 $C_1-C_6$  烷氧基、鹵素、 $C_3-C_{10}$  環烷基、吡唑基、咪唑基、或  $-NR^{35}R^{36}$  取代(其中  $R^{35}$  與  $R^{36}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]、 $C_3-C_{10}$  環烷基(其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  羥基烷基取代)、三亞甲亞胺基、或吡咯啶基、或可一起形成吡咯啶基，其中該吡咯啶基選擇性經胺基或鹵素取代};

$C_1-C_6$  烷基礦醯基(其中該  $C_1-C_6$  烷基部分選擇性經羥基取代);

$C_1-C_6$  烷基礦醯基胺基( $-NHSO_2(C_1-C_6$  烷基)) [其中該  $C_1-C_6$  烷基部分選擇性經  $-NR^{37}R^{38}$  取代(其中  $R^{37}$  與  $R^{38}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)];

3至8員雜環烷基，選自由以下構成的群組:三亞甲亞胺基、吡咯啶基、哌啶基、哌嗪基、及四氫吡啶基 {其中該3至8員雜環烷基選擇性經  $-NR^{39}R^{40}$  取代(其中  $R^{39}$  與  $R^{40}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $C_1-C_6$  烷基礦醯基)、 $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $-NR^{41}R^{42}$  取代(其中  $R^{41}$  與  $R^{42}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]、羥基、或  $C_1-C_6$  烷基礦醯基};

1H-四唑基；

芳基(其中芳基選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基取代[其中 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基選擇性經氟基或胺基取代])

-COOR<sup>11</sup>(其中 R<sup>11</sup> 表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基);且  
 -COR<sup>12A</sup> [其中 R<sup>12A</sup> 表示哌啶基，其選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基、氟基甲基、胺基甲基、-NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup> {其中 R<sup>25</sup> 與 R<sup>26</sup> 各自獨立地表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基 [其中該 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基選擇性經羥基或 -NR<sup>43</sup>R<sup>44</sup> 取代(其中 R<sup>43</sup> 與 R<sup>44</sup> 各自獨立地表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)]}、或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基取代];

取代基 B-1:

鹵素;

羥基;

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基;

氟基;

環烷基;

苯基(其中苯基選擇性經氟基取代);

雜芳基，選自由以下構成的群組：咪唑基、吡唑基、及噁唑基

3 至 8 葓雜環烷基，選自由以下構成的群組：吡咯啶基、哌啶基、哌啶基、嗎啉基、及環氧化丙烷基(其中該 3 至 8 葓雜環烷基選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、羥基、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 胺基烷基、或有 C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> 烷基氧羰基胺基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基取代);

-NR<sup>51A</sup>R<sup>52A</sup> {其中 R<sup>51A</sup> 與 R<sup>52A</sup> 各自獨立地表示氫原子、

$C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基礦醯基、或選擇性有  $-COOR^{53}$  取代的哌啶基取代 (其中  $R^{53}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]、哌啶基、 $C_1-C_6$  烷基礦醯基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、 $-COR^{55}$  (其中  $R^{55}$  表示  $C_1-C_6$  烷基)、 $-COOR^{56}$  (其中  $R^{56}$  表示  $C_1-C_6$  烷基)、或  $-CONR^{57}R^{58}$  (其中  $R^{57}$  與  $R^{58}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)；

$-COOR^{54}$  (其中  $R^{54}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)；

$-CONH_2$ ；

$-SO_2NR^{106}R^{107}$  {其中  $R^{106}$  與  $R^{107}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $C_3-C_{10}$  環烷基}；

$C_1-C_6$  烷基亞礦醯基；及

$C_1-C_6$  烷基礦醯基。

10. 如 9. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^4$  選自由以下 (p) 構成的群組：

(p)：

氫原子、

羥基、

鹵素、

胺基，其選擇性經選自以下取代基 (g) 構成的群組的取代基取代、

$C_1-C_6$  烷基，其選擇性經選自以下取代基 (a) 構成的群組的取代基取代、

$C_2-C_6$  烯基，其選擇性經選自以下取代基 (b) 構成的群組的取代基取代、

C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基、

C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烯基、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、

C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 芳基，其選擇性經選自以下取代基(c)構成的群組的取代基取代、

二氫節基，其選擇性經選自以下取代基(d)構成的群組的取代基取代、

雜芳基，其選擇性經選自以下取代基(e)構成的群組的取代基取代，及

3至8員雜環烷基，其選擇性經選自以下取代基(f)構成的群組的取代基取代，

其中，於基團(p)中，

該雜芳基選自由以下構成的群組：吡啶基、1H-吲唑基、1H-四唑基、[1, 2, 4]三唑并[1, 5-a]吡啶基、苯并咪唑基、2, 3-二氫苯并噁唑基、吡唑基、吡咯并[2, 3-b]吡啶基、嘧啶基、吲哚啉基、呋喃基、噻吩基、及四氫異喹啉基；

該3至8員雜環烷基選自由以下構成的群組：吡咯啶基、哌啶基、哌阱基、嗎啉基、及1, 2, 3, 6-四氫吡啶基；

取代基(a)：

-NR<sup>21A</sup>R<sup>22A</sup>[其中R<sup>21A</sup>與R<sup>22A</sup>各自獨立地表示氫原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基{其中C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基選擇性經哌啶基取代}、或哌啶基{其中哌啶基選擇性經-COOR<sup>105</sup>取代(其中R<sup>105</sup>表示C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)}]；

3 至 8 員雜環烷基，選自由以下構成之群組：吡咯啶基及哌啶基 { 其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $-NR^{39}R^{40}$  (其中  $R^{39}$  與  $R^{40}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)、或  $C_1-C_6$  烷基取代 [ 其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $-NR^{41}R^{42}$  取代 (其中  $R^{41}$  與  $R^{42}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基) ] } ；及

$C_1-C_6$  烷基磺醯基胺基 ( $-NHSO_2(C_1-C_6$  烷基))；

取代基 (b)：

$-COOR^{11}$  (其中  $R^{11}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)；

$-NR^{21a}R^{22a}$  [ 其中  $R^{21a}$  與  $R^{22a}$  各自獨立地表示氫原子、或  $C_1-C_6$  烷基 (其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經二 ( $C_1-C_6$  烷基) 胺基或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基取代) ] ；

3 至 8 員雜環烷基，選自由以下構成之群組：三亞甲亞胺基、吡咯啶基、及哌啶基 { 其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $-NR^{39}R^{40}$  (其中  $R^{39}$  與  $R^{40}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基)、 $C_1-C_6$  烷基 [ 其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $-NR^{41}R^{42}$  取代 (其中  $R^{41}$  與  $R^{42}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基) ] 、羥基、或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基取代 } ；

氰基；及

$C_1-C_6$  烷氧基；

取代基 (c)：

羥基；

氰基；

鹵素；

$C_1-C_6$  烷基(其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經選自以下取代基 B-C 構成的群組的取代基取代)；

$C_3-C_{10}$  環烷基 [其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經氨基、或有  $-NR^{31}R^{32}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基取代(其中  $R^{31}$  與  $R^{32}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]；

$-NR^{21c}R^{22c}$  [其中  $R^{21c}$  與  $R^{22c}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基(其中  $C_1-C_6$  烷基選擇性經胺基、或氨基取代)]；

$C_1-C_6$  烷氧基 {其中該  $C_1-C_6$  烷氧基選擇性經選自鹵素、哌啶基、及哌啶基之 3 至 8 員雜環烷基取代(其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代)、或  $-NR^{33}R^{34}$  [其中  $R^{33}$  與  $R^{34}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基(其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經二( $C_1-C_6$  烷基)胺基取代)、或  $C_1-C_6$  烷基礦鹽基]}；

$-SO_2NR^{23c}R^{24c}$  {其中  $R^{23c}$  與  $R^{24c}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基、 $C_1-C_6$  烷氧基、鹵素、 $C_3-C_{10}$  環烷基、吡唑基、咪唑基、或  $-NR^{35}R^{36}$  取代(其中  $R^{35}$  與  $R^{36}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]、 $C_3-C_{10}$  環烷基(其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  羥基烷基取代)、三亞甲亞胺基、或吡咯啶基，或其中  $R^{23c}$  與  $R^{24c}$  可一起形成選擇性經胺基或鹵素取代之吡咯啶基)}；

$C_1-C_6$  烷基礦鹽基(其中該  $C_1-C_6$  烷基部分選擇性經

羥基取代)；

$C_1-C_6$  烷基磺醯基胺基 ( $-NHSO_2(C_1-C_6$  烷基)) [其中該  $C_1-C_6$  烷基部分選擇性經  $-NR^{37}R^{38}$  取代 (其中  $R^{37}$  與  $R^{38}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]；

哌啶基 {其中該哌啶基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基取代}；

哌啶基 (其中哌啶基選擇性經羥基取代)；

$1H$ -四唑基；

1, 2, 3, 6-四氫吡啶基；及

$-COR^{12c}$  [其中  $R^{12c}$  表示哌啶基，其選擇性經  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、氰基甲基、胺基甲基、 $-NR^{25}R^{26}$  取代 {其中  $R^{25}$  與  $R^{26}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基、或  $-NR^{43}R^{44}$  取代 (其中  $R^{43}$  與  $R^{44}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]}、或  $C_1-C_6$  烷基]；及

取代基  $B-c$ ：

鹵素；

羥基；

甲氨基；

氰基；

$C_3-C_{10}$  環烷基

3至8員雜環烷基，選自由以下構成之群組：吡咯啶基、哌啶基、哌啶基、嗎啉基及環氧丙烷基 (其中該3至8員雜環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基、羥基、胺基、 $C_1-C_6$

胺基烷基、或有 C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> 烷基氧羧基氨基取代之 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基取代)；及

-NR<sup>51c</sup>R<sup>52c</sup> {其中 R<sup>51c</sup> 與 R<sup>52c</sup> 各自獨立地表示氫原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基 [其中該 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基礦醯基、或選擇性經 -COOR<sup>53</sup> 取代之哌啶基取代(其中 R<sup>53</sup> 表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)]、哌啶基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基礦醯基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基、-COR<sup>55</sup>(其中 R<sup>55</sup> 表示 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)、或 -CONR<sup>57</sup>R<sup>58</sup>(其中 R<sup>57</sup> 與 R<sup>58</sup> 各自獨立地表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)}]；

雜芳基，選自以下的群組：咪唑基、吡唑基、及噻唑基；

-COOR<sup>54</sup>(其中 R<sup>54</sup> 表示氫原子、或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)  
 -CONH<sub>2</sub>；  
 -SO<sub>2</sub>NR<sup>106</sup>R<sup>107</sup> {其中 R<sup>106</sup> 與 R<sup>107</sup> 各自獨立地表示氫原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、或 C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基}；  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基亞礦醯基；及  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基礦醯基；

取代基(d)：

-NR<sup>21d</sup>R<sup>22d</sup>(其中 R<sup>21d</sup> 與 R<sup>22d</sup> 各自獨立地表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基)；

取代基(e)：

羥基；

側氨基；

氰基；

$C_3-C_{10}$  環烷基 [其中  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經氟基取代]；

$-NR^{21}R^{22}$  [其中  $R^{21}$  與  $R^{22}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基 (其中  $C_1-C_6$  烷基選擇性經胺基取代)]；

哌啶基；

$C_1-C_6$  烷氧基 (其中  $C_1-C_6$  烷氧基選擇性經  $-NR^{33}R^{34}$  取代 [其中  $R^{33}$  與  $R^{34}$  各自獨立地表示氫原子、或  $C_1-C_6$  烷基])；及

$C_1-C_6$  烷基 {其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經氟基、 $-NR^{51e}R^{52e}$  取代 [其中  $R^{51e}$  與  $R^{52e}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $-COOR^{56}$  (其中  $R^{56}$  表示  $C_1-C_6$  烷基)]、嗎啉基、或氟基苯基}；

$-CONH_2$ ；

取代基(f)：

$C_1-C_6$  烷基 {其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $-NR^{51f}R^{52f}$  取代 [其中  $R^{51f}$  與  $R^{52f}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $-COOR^{56}$  (其中  $R^{56}$  表示  $C_1-C_6$  烷基)]}；及

$C_1-C_6$  烷基礦鹽基；

取代基(g)：

芳基 (其中芳基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代 [其中  $C_1-C_6$  烷基選擇性經氟基或胺基取代])。

11. 如 2. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^6$  為氫原子；羥基； $C_1-C_6$  烷基；選擇性經 1 至 3 個羥基取

代的苯基；選擇性經胺基取代之哌啶基；或哌啶基。

12. 如 11. 該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^7$  為氫原子、 $C_1-C_6$  烷基（其中  $C_1-C_6$  烷基選擇性經選自包含羥基與哌啶基的群組的取代基取代）、或鹵素。

13. 如 2. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^7$  為

氫原子；

$C_1-C_6$  烷基 {其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基、 $-NR^{71A}R^{72A}$  取代[其中  $R^{71A}$  與  $R^{72A}$  各自獨立而代表氫原子、 $C_1-C_6$  烷基（其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經二甲基胺基取代）、 $C_3-C_{10}$  環烷基（其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經胺基取代）、或哌啶基]、或選自由哌啶基與嗎啉基構成的 3 至 8 員雜環烷基（其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  胺基烷基取代）}；

苯基，其選擇性經 1 至 2 個羥基取代；

苯基磺醯基；或

$-COR^{73A}$  {其中  $R^{73A}$  表示哌啶基（其中該哌啶基選擇性經胺基取代）、或  $-NR^{74A}R^{75A}$  [其中  $R^{74A}$  與  $R^{75A}$  各自獨立地表示氫原子、哌啶基、或  $C_3-C_{10}$  環烷基（其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經胺基取代）]}。

14. 如 1. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  
 $\text{---X---Y---Z---}$  為  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 。

15. 如 14. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^1$  與  $R^2$  為氫原子。

16. 如 14. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^3$  為羥基或甲氧基。

17. 如 14. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^4$  為氫原子、苯基 [其中該苯基經有  $-NR^{51A}R^{52A}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基取代 (其中  $R^{51A}$  與  $R^{52A}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)、或  $-SO_2NR^{53A}R^{54A}$  (其中  $R^{53A}$  與  $R^{54A}$  各自獨立地表示氫原子、或選擇性經鹵素或羥基取代之  $C_1-C_6$  烷基)]、1, 2, 3, 6-四氫吡啶基、羥基吡啶基、或甲氧基吡啶基。

18. 如 1. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中

$\text{---X---Y---Z---}$  為  $-NR^{108}-\text{CH}=\text{CR}^{109}-$  (其中  $R^{108}$  表示氫原子、或選擇性經羥基取代之  $C_1-C_6$  烷基， $R^{109}$  表示氫原子、 $\text{CH}_3$ 、或有  $C_1-C_6$  氨基烷基取代的苯基)、

$R^1$ 、 $R^2$  及  $R^4$  為氫原子，

$R^3$  為氫原子、羥基或  $C_1-C_6$  烷氧基。

19. 如 1. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中

$\text{---X---Y---Z---}$  為  $-\text{N}=\text{CH}-\text{S}-$ ，

$R^1$ 、 $R^2$  及  $R^4$  為氫原子，且

$R^3$  為甲氧基。

20. 一種係選自由以下構成之群組的化合物或其在醫藥上可接受的鹽：

(1): 8-甲氧基-5-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(2): 8-羥基-5-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(3): 7, 8-二羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (4): 7, 8-二甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (5): 8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (6): 7, 9-二甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (7): 7, 9-二羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (8): 7, 8, 9-三甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (9): 8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (10): 7, 8, 9-三羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (11): 9-(3-(2-氨基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (12): 8-氯噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (13): 4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-8-腈；
- (14): 噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (15): 8-氟噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (16): 8-硝基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (17): 8-(3-氨基哌啶-1-基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (18): 1-(4-羟基苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (19): 1, 8-二羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (20): 8-羟基-1-(4-羟基苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (21):(R)-8-(3-氨基吡咯啶-1-基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (22):(S)-8-(3-氨基吡咯啶-1-基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (23): 8-(吡啶-3-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (24): 8-(4-羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (25): 1-(3,4-二羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (26): 1-(3-氨基哌啶-1-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (27): 8-N-吗啉基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (28): 8-羟基-2-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (29): 8-羟基-2-(羟基甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (30): 8-羟基-4-侧氧基-N-(哌啶-3-基)-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-2-羧酰胺；
- (31): 8-羟基-2-(4-羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (32): 8-羟基-1-(哌啶-1-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (33): N-((1r,4r)-4-氨基环己基)-8-羟基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-2-羧酰胺；
- (34): 2-(3-氨基哌啶-1-羧基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (35): 2-(3,4-二羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (36): 2-(((1r,4r)-4-氨基环己基氨基)甲基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (37): 8-(哌啶-1-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (38): 8-羟基-1-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (39): 2-((2-(二甲基胺基)乙基胺基)甲基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (40): 8-羟基-2-((哌啶-3-基胺基)甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (41): 7-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (42): 9-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (43): 9-(3,4-二羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (44): 1-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-8-腈；
- (45): 7-(3,4-二羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (46): 8-羟基-1-甲基-3H-吡咯并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (47): 9-(3,5-二羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (48): 8-羟基-9-(3-羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (49): 8-羟基-9-(4-羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (50): 9-(3,4-二氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (51): (S)-8-(3-胺基吡咯啶-1-基)-2-(4-羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (52): 5-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)2-氟吡啶；
- (53): 9-(6-胺基吡啶-3-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (54): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲酰胺；
- (55): 9-(3-氟-4-羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (56): 8-羟基-2-(3-羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (57): (R)-8-(3-胺基吡咯啶-1-基)-2-(3,4-二羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (58): 9-(3,4-二氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (59): 9-(4-氟-3-羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (60): 8-羟基-9-(3-羟基-5-(三氟甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (61): 8-羟基-9-(1H-吲唑-6-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (62): 8-羟基-9-(3,4,5-三羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (63): 9-(4-羟基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (64): 9-(4-(1H-四唑-5-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (65): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (66): 9-(3-氯-4-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (67): 9-(4-氯-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (68): 9-(3,4-二氯苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (69): 9-(4-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (70): 8-羟基-9-苯基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (71): 9-(4-(二氟甲氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (72): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (73): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (74): 9-(3-胺基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (75): 3-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹

啉 -9- 基 ) 苯 磺 鹽 肽 ;

(76) : 8- 細 基 -9-(3, 4, 5- 三 氟 苯 基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 嘉  
-4(5H)- 酮 ;

(77) : N-(4-(8- 細 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c]  
喹 嘉 -9- 基 ) 苯 基 ) 甲 烷 磺 鹽 肽 ;

(78) : 8- 甲 氧 基 -9- 苯 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 嘉 -4(5H)- 酮 ;

(79) : 8- 細 基 -9-( 萍 -2- 基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 嘉 -4(5H)-  
酮 ;

(80) : 8- 細 基 -9-(4-( 細 基 甲 基 ) 苟 基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹  
啉 -4(5H)- 酮 ;

(81) : 2-(4-(8- 細 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c]  
喹 嘉 -9- 基 ) 苟 基 ) 乙 脂 ;

(82) : 8- 細 基 -9-(4-( 甲 基 磺 鹽 基 ) 苟 基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c]  
喹 嘉 -4(5H)- 酮 ;

(83) : 8- 細 基 -9-( 吡 呪 -4- 基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 嘉  
-4(5H)- 酮 ;

(84) : 8- 細 基 -9-(1, 2, 3, 6- 四 氢 吡 呪 -4- 基 ) 噻 吩 并  
[2, 3-c] 喹 嘬 -4(5H)- 酮 ;

(85) : 8- 細 基 -9-(4- 細 基 -3- 甲 氧 基 苟 基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c]  
喹 嘬 -4(5H)- 酮 ;

(86) : 9-(3- 氟 -4-(N- 嘧 嘌 基 甲 基 ) 苟 基 ) -8- 細 基 噻 吩 并  
[2, 3-c] 喹 嘬 -4(5H)- 酮 ;

(87) : 9-(3-( 胺 基 甲 基 ) 苟 基 ) -8- 細 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹  
啉 -4(5H)- 酮 ;

10/10 555

- (88): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (89): 9-(3-(二氟甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (90): 9-(3-(胺基甲基)苯基)-8-羟基-2-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (91): 9-环己烯基-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (92): 9-(3,5-二氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (93): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (94): 9-(3-(胺基甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (95): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基-2-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (96): 9-环丙基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (97): 9-([1,2,4]三唑并[1,5-a]吡啶-6-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (98): 8-甲氧基-9-(1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (99): 9-环己烯基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (100): 8-甲氧基-9-(4-(2-(哌啶-1-基)乙基胺基)苯基)

噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(113): 8-羟基-9-(4-((哌啶-3-基胺基)甲基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(114): N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯甲酰胺；

(115): 9-(4-(3-(二甲基胺基)丙氧基)苯基)-8-甲氨基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(116): 8-甲氨基-9-(1-(哌啶-4-基)-1H-吡唑-4-基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(117): 8-羟基-9-(1-(哌啶-4-基)-1H-吡唑-4-基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(118): 8-甲氨基噻唑并4, 5-c]喹啉-4(5H)-酮；

(119): 2-((4-(胺基甲基)哌啶-1-基)甲基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(120): N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-甲氨基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯甲酰胺；

(121): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基-2, 3-二氢-1H-环戊[c]喹啉-4(5H)-酮；

(122): (E)-丁基 3-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)丙烯酸酯；

(123): 8-甲氨基-9-(1H-吡咯并[2, 3-b]吡啶-15-基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(124): 8-羟基-9-(1H-吡咯并[2, 3-b]吡啶-15-基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(149): 9-(4-(3-(二甲基胺基)丙氧基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(150): 8-羟基-9-(4-(2-(哌啶-1-基)乙氧基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(151): 9-(4-(2-(乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(152):(E)-9-(3-(4-氨基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(153): 9-(1-(2-氨基乙基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(154): 9-(4-(2-(乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(155): 9-(4-(2-(二乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(156): 9-(4-(2-(二乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(157): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙氧基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(158): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(159): 8-甲氧基-9-(4-(2-(哌啶-1-基)乙氧基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(160): 8-甲氧基-9-(3-(4-甲基哌啶-1-基)乙氧基)

并 [2, 3-c] 噻啉-4(5H)-酮；

(184): 9-(4-((二乙基胺基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c] 噻啉-4(5H)-酮；

(185): 9-(3-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c] 噻啉-4(5H)-酮；

(186): 9-(3-(2-氨基乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c] 噻啉-4(5H)-酮；

(187): 8-羟基-9-(4-((甲基胺基)甲基)苯基)噻吩并[2, 3-c] 噻啉-4(5H)-酮；

(188): 8-甲氧基-9-(4-((甲基胺基)甲基)苯基)噻吩并[2, 3-c] 噻啉-4(5H)-酮；

(189): 9-(4-氨基-3-甲氧基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c] 噻啉-4(5H)-酮；

(190): 3-(8-羟基-4-侧氧基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c] 噻啉-9-基)苯甲腈；

(191): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c] 噻啉-4(5H)-酮；

(192): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c] 噻啉-4(5H)-酮；

(193): N-(1-(4-(8-羟基-4-侧氧基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c] 噻啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺酰胺；

(194): 8-羟基-9-(4-(1-(吡咯啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2, 3-c] 噻啉-4(5H)-酮；

(195): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]

喹啉-4(5H)-酮；

(196): 9-(4-(1-(二乙基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩

并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(197): N-(2-胺基乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-  
二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(198): N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-  
二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(199): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]  
喹啉-9-基)-N-(吡咯啶-3-基)苯磺酰胺；

(200): N-(三亚甲亚胺-3-基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-  
二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(201): 9-(4-(2-(二乙基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(202): 2-胺基-N-(3-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻  
吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺酰胺；

(203): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]  
喹啉-9-基)苯甲腈；

(204): 4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]  
喹啉-9-基)苯甲腈；

(205):(E)-9-(3-(3-胺基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)-8-  
甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(206): N-(2-羟基乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-  
二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(207): 8-甲氧基-9-(5-甲氧基吡啶-3-基)噻吩并

[2, 3-c] 噻啉-4(5H)-酮；

(220): N-(2-羟基-4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]噻啉-9-基)苯基)甲烷磺酰胺；

(221): 9-(4-((4-(氨基甲基)哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]噻啉-4(5H)-酮；

(222): 9-(4-(2-(二甲基氨基)乙基)苯基)-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]噻啉-4(5H)-酮；

(223): 9-(3, 5-二氟-4-羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]噻啉-4(5H)-酮；

(224): 6-氟-8-甲氧基-9-(1, 2, 3, 6-四氢吡啶-4-基)噻吩并[2, 3-c]噻啉-4(5H)-酮；

(225): 9-(4-(1-(二甲基氨基)乙基)苯基)-6-氟-8-羟基噻吩并[2, 3-c]噻啉-4(5H)-酮；

(226): 9-(4-((二乙基氨基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]噻啉-4(5H)-酮；

(227): (E)-9-(3-(3-羟基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]噻啉-4(5H)-酮；

(228): (E)-8-羟基-9-(3-(3-羟基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)噻吩并[2, 3-c]噻啉-4(5H)-酮；

(229): 8-羟基-9-(4-((异丙基氨基)甲基)苯基)噻吩并[2, 3-c]噻啉-4(5H)-酮；

(230): (E)-9-(3-(3-氨基三亚甲亚胺-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]噻啉-4(5H)-酮；

(231): (E)-8-甲氧基-9-(3-(2-(甲基磺酰基)乙基氨基)

丙-1-烯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(232):(S)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(233):(S)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(234): 8-羟基-9-(5-羟基吡啶-3-基)-2,3-二氢-1H-环戊[c]喹啉-4(5H)-酮；

(235): 9-(4-((4-(氨基甲基)哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(236): 8-甲氧基-9-(4-(1-(2-(甲基磺酰基)乙基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(237): 9-(4-((3-氨基吡咯啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(238):(E)-9-(3-(3-氨基三亚甲亚胺-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(239):(E)-9-(3-(乙基胺基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(240): 9-(4-((3-氨基哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(241): 9-(4-((3-氨基吡咯啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(242): 9-(4-((3-氨基哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(243): 8-羟基-9-(4-(1-(2-(甲基磺酰基)乙基胺基)乙

- 基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (244):(E)-9-(3-(3-氨基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (245):(E)-9-(3-(3-氨基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (246):(E)-9-(3-(3-氨基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (247):(E)-8-羟基-9-(3-(2-(甲基磺醯基)乙基氨基)丙-1-烯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (248):8-甲氧基-9-(4-(2-(2-(甲基磺醯基)乙基氨基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (249):2-(2-氟-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙腈；
- (250):(E)-N-(1-(3-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)丙基)三亚甲亚胺-3-基)甲烷磺酰胺；
- (251):4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N,N-二甲基苯磺酰胺；
- (252):4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-甲基苯磺酰胺；
- (253):第三丁基(5-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)呋喃-2-基)甲基氨基甲酸酯；
- (254):N-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-甲基苯基)甲烷磺酰胺；

- (255): N-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-甲基苯基)甲烷磺醯胺；
- (256): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-6-氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (257): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (258): 6-氟-8-羟基-9-(1,2,3,6-四氳吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (259): 9-(4-((二乙基胺基)甲基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (260): 8-甲氧基-9-(4-(1-(哌啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (261): 2-(2-氟-4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙腈；
- (262): 8-羟基-9-(4-(1-(哌啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (263):(E)-9-(3-(3-(二甲基胺基)哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (264):(E)-9-(3-(3-(二甲基胺基)吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (265): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (266): 9-(5-(胺基甲基)噻吩-2-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (267): 9-(4-((乙基胺基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (268):(E)-9-(3-(4-氨基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (269): 9-(4-((乙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (270): 9-(4-(氨基甲基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (271): 9-(3-氯-4-((二乙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (272):(R)-9-(4-(1-(二甲基氨基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (273): 9-(4-(3-氨基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (274):(R)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (275):(R)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (276): 9-(4-(2-氨基乙基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (277): 9-(4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (278): 9-(3-氟-4-((3-羟基吡咯啶-1-基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (279): 9-(3-氟-4-((3-羟基吡咯啶-1-基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (280): 4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2,2,2-三氟乙基)苯磺酰胺；
- (281): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2,2,2-三氟乙基)苯磺酰胺；
- (282): N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (283): 8-羟基-9-(4-((2-(甲基磺酰基)乙基胺基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (284): 9-(3-(3-(二甲基胺基)吡咯啶-1-基)丙基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (285): 9-(1-(2-胺基乙基)-1H-吡唑-4-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (286): 9-(3-氯-4-((二乙基胺基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (287): 4-(7-氟-8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺酰胺；
- (288): 9-(3-乙酰基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (289): 2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯甲酰胺；
- (290): 3-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈；

- 氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-8-基甲烷磺酸酯；
- (303): 2-氟-N-(2-羟基乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (304): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)-N, N-二甲基苯磺酰胺；
- (305): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-7-氟-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (306): N-(2-溴乙基)-4-(7-氟-8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (307): 4-(7-氟-8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺酰胺；
- (308): 9-(4-(1-(二甲基胺基)-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (309): N-(2-氯-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苄基)-N-甲基甲烷磺酰胺；
- (310): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)-N-(2-甲氧基乙基)苯磺酰胺；
- (311): (E)-3-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)-2-甲基丙烯腈；
- (312): N-(2-氟-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯乙基)甲烷磺酰胺；
- (313): 8-羟基-9-(4-(1-羟基乙基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (314): 9-(4-(1-(环戊基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩

并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(315): 9-(4-(1-(环戊基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(316): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺酰胺；

(317): 9-(5-(氨基甲基)呋喃-2-基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(318): 9-(3-氯-4-((甲基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(319): 9-(4-(2-氨基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(320): N-(3-羟基丙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(321): 2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺酰胺；

(322): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)-N-(3-羟基丙基)苯磺酰胺；

(323): N-(3-溴丙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(324): 2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)-N-(2-甲氧基乙基)苯磺酰胺；

(325): 9-(3-氯-4-((甲基胺基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(326): 9-(4-(氨基甲基)苯基)-4-侧氨基-4, 5-二氢噻

吩并[2,3-c]喹啉-8-腈；

(327): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(328): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-6,7-二氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(329): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-6-氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(330): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-4-侧氨基-4,5-二氟噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基三氟甲烷磺酸酯；

(331): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(332): N-(2-氟乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氟噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(333): N-(2-氟乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氟噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(334): 9-(4-(2-胺基丙-2-基)苯基)-6-氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(335):(S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(336): 9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(337): 9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(338): 9-(4-(1-(二乙基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩

并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(339): 9-(4-(1-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩

并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(340): 9-氨基-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(341): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-6, 7-二氟-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(342): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-6, 7-二氟-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(343): N-环丙基-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氟噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(344): N-环丙基-4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氟噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(345): 9-(2-氨基-2, 3-二氟-1H-茚-5-基)-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(346): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(347): (S)-N-(1-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氟噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺酰胺；

(348): 9-(4-(1-(氨基甲基)环丙基)苯基)-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(349): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(350): N-(1-(羟基甲基)环戊基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基

- 基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (351): 9-(2-(二乙基胺基)-2,3-二氫-1H-茚-5-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (352): 9-(2-(二甲基胺基)-2,3-二氫-1H-茚-5-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (353): 8-羥基-9-(1,2,3,4-四氫異喹啉-7-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (354): 8-甲氧基-9-(1,2,3,4-四氫異喹啉-7-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (355): 3-(3-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈；
- (356): 9-(4-(1-(二乙基胺基)乙基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (357): 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)環丙腈；
- (358): 9-(2-乙基-1,2,3,4-四氫異喹啉-7-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (359): 9-(4-(1-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (360): 3-(3-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈；
- (361): 1-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)環丙腈；
- (362): 9-(2-胺基-2,3-二氫-1H-茚-5-基)-8-甲氧基噻

吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(363): N-異戊基-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻

吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

(364): 9-(2-(二甲基胺基)-2,3-二氫-1H-茚-5-基)-8-  
甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(365): 9-(4-(1-(乙基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(366): 6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(367): 9-(4-(環丙烷羧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(368): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氫噻  
吩并[2,3-c]喹啉-8-羧醯胺；

(369): 9-(2-胺基乙基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉  
-4(5H)-酮；

(370): 8-羥基-9-(4-(2-羥基乙基磺醯基)苯基)噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(371): 9-(4-(2-羥基乙基磺醯基)苯基)-8-甲氧基噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(372): 9-(1-乙基吲哚啉-5-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]  
喹啉-4(5H)-酮；

(373): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(374): 8-羥基-9-(2-甲基-1,2,3,4-四氫異喹啉-7-基)

噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(375): 9-(4-(1-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(376): 8-羟基-9-(1-甲基吲哚啉-5-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(377): 8-羟基-9-(吲哚啉-5-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(378): 9-(吲哚啉-5-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(379): 9-(4-(1-((二甲基胺基)甲基)环丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(380): 4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-丙基苯磺酰胺；

(381): N-(环丙基甲基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(382): N-(3,3-二甲基丁基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(383): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-异戊基苯磺酰胺；

(384): N-(3,3-二甲基丁基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(385): 9-(4-(1-(乙基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(386): 3-(4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并

[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-3-侧氨基丙腈；

(387):(E)-9-(2-乙氧基乙烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(388): N-(1-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)乙酰胺；

(389): 4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(3,3,3-三氟丙基)苯磺酰胺；

(390): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(1-(羟基甲基)环戊基)苯磺酰胺；

(391): N-(2,2-二氟乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(1031): 8-甲氧基-9-(4-(1-甲氧基乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1032): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1033): 8-甲氧基-9-(2-((哌啶-3-基甲基)氨基)乙基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1034): 9-(2-(4-((二甲基氨基)甲基)哌啶-1-基)乙基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1035): 第三丁基 4-((2-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)乙基)氨基)哌啶-1-羧酸酯；

(1036): 8-甲氧基-9-(2-(哌啶-4-基氨基)乙基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1037): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(3,3,3-三氟丙基)苯磺酰胺；
- (1038): 3H-吡咯并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1039): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-环丙基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1040): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-6-腈；
- (1041): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1042): 8-羟基-9-(2-(4-((甲基氨基)甲基)哌啶-1-基)乙基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1043): 8-甲氧基-9-(2-(4-((甲基氨基)甲基)哌啶-1-基)乙基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1044): 9-(2-(4-((二甲基氨基)甲基)哌啶-1-基)乙基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1045): 9-(4-(1-羟基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1046):(R)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基氨基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1047):(R)-8-(4-(1-氨基乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1048):(R)-第三丁基(1-(4-(4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基)苯基)乙基)氨基甲酸酯；
- (1049): 9-(4-(4-羟基哌啶-4-基)苯基)-8-甲氧基噻吩

并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1050): (R)-8-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1051): 8-羟基-9-(4-(1, 2, 3, 6-四氢吡啶-4-基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1052): (R)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1053): 8-羟基-9-(4-(1-羟基丙基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1054): (R)-8-羟基-9-(4-(1-羟基乙基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1055): 8-羟基-9-(4-(4-羟基哌啶-4-基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1056): (S)-8-羟基-9-(4-(1-羟基乙基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1057): N-(1-羟基丙-2-基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(1058): 9-(4-(羟基(噻唑-2-基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1059): 9-(6-(1-胺基乙基)吡啶-3-基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1060): 9-(4-(4-羟基丁基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1061): 2-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并

[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙酰胺；

(1062): N-(1-溴丙-2-基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(1063): 8-羟基-9-(4-(羟基(噻唑-2-基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1064):(S)-8-甲氨基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1065): 9-(6-(1-(二乙基胺基)乙基)吡啶-3-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1066): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1067): 9-(6-(1-氨基乙基)吡啶-3-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1068): 8-羟基-9-(4-(4-羟基丁基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1069): 9-(4-(3-氨基-1-羟基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1070): 9-(6-(1-(二甲基胺基)乙基)吡啶-3-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1071): 9-(6-(1-(二甲基胺基)乙基)吡啶-3-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1072): 4-((4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-1H-吡唑-1-基)甲基)苯甲腈；

(1073): 8-氨基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1074): 9-((4-((1H-吡唑-1-基)甲基)苯基)-8-甲氧基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1075): 9-(6-(1-氨基乙基)吡啶-3-基)-8-甲氧基噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1076): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-4-侧氨基-4,5-二氢  
噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基二甲基氨基甲酸酯；
- (1077): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-4-侧氨基-4,5-二氢  
噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基异丙基碳酸酯；
- (1078): 9-((4-((1H-咪唑-1-基)甲基)苯基)-8-甲氧基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1079): N-(2-溴丙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (1080):(R)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6,7-二氯-8-羟  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1081):(R)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1082):(S)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基氨基)乙基)苯基)  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1083): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-4-侧氨基-4,5-二氢  
噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基二乙基氨基甲酸酯；
- (1084): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]  
喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)-N-甲基苯磺酰胺；
- (1085): N-(2-羟基乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-  
二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-甲基苯磺酰胺；

- (1086): 9-((4-((1H-吡唑-1-基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1087):(S)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(氨基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1088): 9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1089): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基吗啉-4-羧酸酯；
- (1090): N-(2-羟基乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-2,3,4,5-四氢-1H-环戊[c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (1091): 8-溴噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1092): 9-(4-(2-(二甲基氨基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1093): 9-(4-(2-氨基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1094): N-(2-溴乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-2,3,4,5-四氢-1H-环戊[c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (1095): 9-(4-(2-氨基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1096): 8-甲氧基-9-(1-(2-N-吗啉基乙基)-1H-吡唑-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1097): 9-(4-(2-(二乙基氨基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1098): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-羟基-6-(羟基甲

基) 噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1099): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-4-侧氨基-4,5-二氢  
噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基乙酸酯；

(1100): 9-(1-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-1H-吡唑-4-  
基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1101): 9-(4-((1H-咪唑-1-基)甲基)苯基)-8-羟基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1102): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-(2-N-吗啉基乙氧基)  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1103): 8-羟基-9-(1-(2-N-吗啉基乙基)-1H-吡唑-4-  
基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1104): N-(2-(1H-吡唑-1-基)乙基)-4-(8-羟基-4-侧  
氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(1105): 8-羟基-9-(4-(2,2,2-三氟-1-羟基乙基)苯基)  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1106): 9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1107): N-(2-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并  
[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙基)甲烷磺酰胺；

(1108): 9-(4-(2-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-甲氧基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1109): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉  
-4(5H)-酮；

(1110): 9-(1-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-1H-吡唑-4-

基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1111): 9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1112): 9-(4-(1-(二甲基氨基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1113): 8-甲氧基-9-(4-(2,2,2-三氟-1-羟基乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1114): N-(2-溴乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-甲基苯磺酰胺；

(1115): N-(2-(1H-咪唑-1-基)乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(1116): 9-(4-(1-(氨基甲基)环丙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1117): 3-(4-(8-(2-(二甲基氨基)乙氧基)-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈；

(1118):(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1119): N-(2-氯乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-甲基苯磺酰胺；

(1120):(S)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1121):(S)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1122):(R)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基

噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1123):(R)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1124): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-8-腈；

(1125): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-(羟基甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1126):(R)-6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1127):(S)-9-(4-(1-(乙基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1128):(S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1129): 6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1130): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-乙炔基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1131):(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1132):(R)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1133): 9-(4-(2-氨基乙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1134): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-(二氟甲基)噻吩

并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1135): (R)-6-溴-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1136): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1137): 9-(4-丁基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1138): 9-(4-丁基苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1139): N-(2-氯乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(1140): 9-(4-((3-溴吡咯啶-1-基)磺酰基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1141): (S)-9-(4-(1-(甲基磺酰胺基)丙基)苯基)-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-8-基甲烷磺酸酯；

(1142): 9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1143): 9-(4-(3-(二甲基胺基)-1-羟基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1144): N-(2-溴乙基)-4-(6-氯-8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(1145): N-(2-氯乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-2, 3, 4, 5-四氢-1H-环戊[c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

- (1146): N-(2-溴乙基)-4-(5-乙基-8-羟基-4-侧氨基  
-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (1147):(S)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基氨基)丙基)苯基)  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1148):(S)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基氨基)丙基)苯基)  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1149): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-(((2-羟基乙基)  
氨基)甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1150):(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1151):(R)-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙基)苯基)-8-羟  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1152): 8-羟基-9-(4-戊基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉  
-4(5H)-酮；
- (1153): 9-(4-(2-氨基乙酰基)苯基)-8-羟基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1154):(S)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(甲基氨基)丙基)  
苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1155): 8-羟基-9-(4-(2-(甲基氨基)乙基)苯基)噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1156): 8-甲氧基-9-(4-(2-(甲基氨基)乙基)苯基)噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1157):(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1158):(R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1159):(R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1160):(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1161):(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1162): 2-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氟噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丁腈；
- (1163):(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1164):(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1165): 6-氯-8-羟基-9-(4-(2-(甲基氨基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1166):(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1167): 9-(4-(2-氨基乙基)-3,5-二氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1168):(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1169):(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1170): 6-氯-8-甲氧基-9-(4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1171): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1172):(S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1173): 6-溴-8-甲氧基-9-(4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1174): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1175):(R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-6-氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1176):(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1177): 9-(4-(2-胺基乙基)-3,5-二氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1178): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)-3,5-二氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1179): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1180):(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6,7-二氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1181):(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1182): (S)-6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1183): 6-溴-8-羟基-9-(4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1185): N-(2-羟基乙基)-4-(8-甲氧基-5-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (1186): 甲基 3-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙酸酯；
- (1187): (R)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1188): (R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1189): (R)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1190): 9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1191): 9-(4-(2-氨基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1192): 9-(4-(2-氨基乙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1193): 9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1194): (S)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1195):(S)-6-氯-9-(4-(1-(二乙基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1196):(S)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1197):(S)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1198):4-(8-羟基-5-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺酰胺；
- (1199):N-(2-溴乙基)-4-(8-羟基-5-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (1200):(R)-6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1201):(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1202):9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1203):9-(4-(2-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-2-(苯基磺酰基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1204):N-(1-氯丙-2-基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (1205):N-(1-氯丙-2-基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (1206):9-(4-(2-胺基乙基)-3-羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1207): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-甲氧基苯基)-8-甲氧基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1208): 9-(4-(2-胺基乙基)-2-氯-5-甲氧基苯基)-8-  
甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1209): 9-(4-(3-(胺基甲基)戊-3-基)苯基)-8-羟基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1210):(R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-羟基-5,6-二  
甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1211): 9-(4-(2-胺基乙基)-2-氯-5-羟基苯基)-6-氯  
-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1212): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1213): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-溴-8-羟基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1214): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-溴-8-甲氧  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1215):(S)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙  
-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1216): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-  
甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1217): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1218): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-氯-8-甲氧  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1219): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-氟-8-羟基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1220): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-环丙基-8-  
甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1221): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-环丙基-8-  
羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1222):(S)-8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙  
-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1223):(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1224): 9-(4-(2-胺基乙基)-2-溴-5-羟基苯基)-8-羟  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1225):(S)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1226): 3-(4-(8-羟基-6-甲基-4-侧氧基-4,5-二氢噻  
吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈；
- (1227): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-甲氧  
基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1228): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羟基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1229): 2-(2-氟-4-(8-羟基-6-甲基-4-侧氧基-4,5-二  
氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈；
- (1230): 6-环丙基-9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)-3-氟  
苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1231): 6-環丙基-9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1232):(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1233):(S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1234): 9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1235): 9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1236): 9-(4-(2-胺基-1-环戊基乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1237): 9-(4-(2-胺基-1,1-二环戊基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1238): 3-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈；
- (1239): 9-(4-(2-胺基-1-环戊基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1240): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-环丙基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1241): 9-(4-(3-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1242): 9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1243): 9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1244): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-环丙基-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1245): 6-溴-9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1246): 6-溴-9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1247): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1248): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1249):(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-8-腈；
- (1250):(R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羟基-6-乙烯基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1251): 9-(4-(1-(胺基甲基)环丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1252): 9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1253): 9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1254): 9-(4-(1-(胺基甲基)环丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1255):(R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-乙基-8-羟基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1256):(R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-(二氟甲基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1257):9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1258):9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1259):6-溴-9-(4-(1-(二甲基胺基)-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1260):9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1261):9-(4-(3-胺基丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1262):(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1263):9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1264):9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1265):(R)-8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1266):9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-6-乙基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1267): (R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-丁基-8-羟基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1268): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯基)-6-氯-8-羟基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1269): 9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-6-乙基-8-甲氧基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1270): 2-(4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氯噻吩并  
[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-(环氧丙烷-3-基)乙腈；
- (1271): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-  
羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1272): (R)-6-乙基-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)  
苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1273): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-甲氧基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1274): 9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-羟基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1275): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-甲氧基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1276): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-甲氧基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1277): 9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1278): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-  
羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1279): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1280): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1281): 9-(4-(2-胺基-2-甲基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1282): 9-(4-(2-胺基-2-甲基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1283): 9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)-3-氯苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1284): 8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(3-甲基-1-(甲基胺基)丁-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1285): 8-羟基-6-甲基-9-(4-(3-甲基-1-(甲基胺基)丁-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1286): 9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1287): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1288): 9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)-3-氯苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1289): 9-(4-(2-胺基-2-甲基丙基)苯基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1290): 9-(4-(1-(胺基甲基)环丁基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1291): 9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1292): 9-(4-(2-胺基-2-甲基丙基)苯基)-6-溴-8-羟  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1293): 9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-  
羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1294): 9-(3-氟-4-(3-甲基-1-(甲基胺基)丁-2-基)苯  
基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1295): 9-(4-(1-(二甲基胺基)-3-甲基丁-2-基)苯  
基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1296): 9-(4-(1-(二甲基胺基)-3-甲基丁-2-基)-3-氟  
苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1297): 9-(4-(1-(胺基甲基)环丁基)苯基)-8-甲氧基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1298): (R)-8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙  
-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1299): 9-(4-(1-(胺基甲基)环丁基)苯基)-8-甲氧基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1300): 9-(4-(1-(胺基甲基)环丁基)苯基)-8-羟基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1301): 8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(哌啶-3-基)苯基)噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1302): 8-羟基-6-甲基-9-(4-(哌啶-3-基)苯基)噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1303):(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1304):(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1305):(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1306):(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1307):(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1308): 8-甲氧基-3-甲基-3H-吡咯并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1309): 9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1310):(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1311):(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1312): 9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1313): 8-羟基-3-甲基-3H-吡咯并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1314): 9-胺基-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1315):(R)-9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1316):(R)-9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1317):(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1318):(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1319):(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1320): 9-((4-(2-胺基乙基)苯基)氨基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1321): 9-(4-(1-(胺基甲基)环丁基)苯基)-6-氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1322):(R)-1-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-3-甲基-3H-吡咯并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1323): 8-羟基-3-(羟基甲基)-3H-吡咯并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1324):(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1325): 9-((4-(胺基甲基)苯基)氨基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1326): 9-((4-(胺基甲基)苯基)氨基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1327): 9-((4-(1-胺基丙-2-基)苯基)胺基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1328): 9-((4-(1-胺基丙-2-基)苯基)胺基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1329): 9-(4-(2-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1330): 9-(4-(2-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1331): 9-(4-(3-(胺基甲基)戊-3-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1332): 9-(4-((R)-1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-2-(1-羟基乙基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1333): 9-(4-((R)-1-胺基丙-2-基)苯基)-2-(1-羟基乙基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1334): 3-(4-((8-甲氧基-6-甲基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)胺基)苯基)丙腈；
- (1335): 9-((3-(2-胺基乙基)苯基)胺基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1336): 9-((4-(2-胺基乙基)苯基)胺基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1337): 9-(4-(2-(乙基胺基)丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1338): 9-(4-(3-(胺基甲基)戊-3-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1339): 9-(4-(3-(胺基甲基)戊-3-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1340):(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-2,6-二甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1341):(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-2,6-二甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1342): 9-(4-((R)-1-胺基丙-2-基)苯基)-2-(1-羟基乙基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1343): 2-((4-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)氨基)乙腈；
- (1344):(R)-9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1345): 9-(3-氯-4-(2-(乙基氨基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1346): 9-(4-(3-((二甲基氨基)甲基)戊-3-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1347):(R)-6-氯-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1348): 9-(4-(2-(乙基氨基)乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1349): 9-(4-(2-(乙基氨基)乙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1350): 9-(4-(2-(乙基(甲基)氨基)丙基)苯基)-8-羟

基 -6- 甲 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 咪 -4(5H)- 酮 ;

(1351) : 2-( 羟 基 ( 氨 呋 -4- 基 ) 甲 基 ) -8- 甲 氧 基 -6- 甲 基  
噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 咪 -4(5H)- 酮 ;

(1352) : (R)-9-(4-(1- 氨 基 丁 -2- 基 ) 苯 基 ) -8- 羟 基 -6-  
甲 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 咪 -4(5H)- 酮 ;

(1353) : (R)-9-(4-(1- 氨 基 丙 -2- 基 ) 苯 基 ) -2- 氯 -8- 羟  
基 -6- 甲 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 咪 -4(5H)- 酮 ;

(1354) : (R)-9-(4-(1- 氨 基 丙 -2- 基 ) 苯 基 ) -2- 氯 -8- 甲  
氧 基 -6- 甲 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 咪 -4(5H)- 酮 ;

(1355) : 8- 甲 氧 基 -6- 甲 基 -9-(4-(2-( 甲 基 氨 基 ) 乙 基 )  
苯 基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 咪 -4(5H)- 酮 ;

(1356) : 9-(4-(2-( 乙 基 ( 甲 基 ) 氨 基 ) 乙 基 ) 苯 基 ) -8- 羟  
基 -6- 甲 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 咪 -4(5H)- 酮 ;

(1357) : 9-(4-(3-( 氨 基 甲 基 ) 戊 -3- 基 ) 苯 基 ) -6- 氯 -8-  
甲 氧 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 咪 -4(5H)- 酮 ;

(1358) : 9-(4-(3-(( 二 甲 基 氨 基 ) 甲 基 ) 戊 -3- 基 ) 苯 基 ) -8-  
羟 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 咪 -4(5H)- 酮 ;

(1359) : 9-(6-( 二 甲 基 氨 基 ) 吡 呋 -3- 基 ) -8- 甲 氧 基 -6-  
甲 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 咪 -4(5H)- 酮 ;

(1360) : (R)-9-(4-(1-( 二 甲 基 氨 基 ) 丁 -2- 基 ) 苯 基 ) -8-  
羟 基 -6- 甲 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 咪 -4(5H)- 酮 ;

(1361) : (R)-8- 甲 氧 基 -6- 甲 基 -9-(4-(1-( 甲 基 氨 基 ) 丁  
-2- 基 ) 苯 基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 咪 -4(5H)- 酮 ;

(1362) : 9-(4-(3-(( 二 乙 基 氨 基 ) 甲 基 ) 戊 -3- 基 ) 苯

- 基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1363): 9-(3-氯-4-(2-(乙基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1364): 8-羟基-6-甲基-9-(4-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1365):(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1366):(R)-9-(4-(1-(乙基(甲基)胺基)丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1367):(R)-9-(4-(1-(二乙基胺基)丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1368):(R)-9-(4-(1-(乙基(甲基)胺基)丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1369): 2-((4-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)(甲基)胺基)乙腈；
- (1370): 2-((4-(8-羟基-6-甲基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)(甲基)胺基)乙腈；
- (1371): 9-(3-氯-4-(2-(乙基(甲基)胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1372): 9-(4-(1-((二甲基胺基)甲基)环丁基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1373):(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1374): 9-(6-(2-氨基乙氧基)吡啶-3-基)-8-羟基-6-

- 甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1375):(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-2-氟-8-甲  
氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1376): 9-(6-(2-氨基乙氧基)吡啶-3-基)-8-甲氧基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1377): 9-(4-(1-氨基-2,2,2-三氟乙基)苯基)-8-羟基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1378): 9-(4-(1-氨基-2,2,2-三氟乙基)苯基)-8-甲氧  
基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1379):(R)-9-(4-(1-(乙基(甲基)氨基)丙-2-基)苯  
基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1380):(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(甲基氨基)丁  
-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1381): 9-(4-(1-氨基-2,2,2-三氟乙基)苯基)-8-甲  
氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1382):(R)-1-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-羟基-3-  
甲基-3H-吡咯并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1383):(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-2-氟-8-羟  
基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1384): 9-(6-((2-氨基乙基)氨基)吡啶-3-基)-8-羟基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1385): 9-(6-((2-氨基乙基)氨基)吡啶-3-基)-8-甲  
氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1386):(S)-6-氯-9-(4-(1-(乙基(甲基)氨基)丙-2-基)

- 苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1387):(S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1388):(R)-9-(4-(1-(二乙基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1389):9-(4-(1-氨基-2,2,2-三氟乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1390):9-(4-(1-氨基-2,2,2-三氟乙基)苯基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1391):9-(4-(1-(氨基甲基)环丙基)苯基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1392):(4-(8-羟基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺酰胺；  
 (1393):8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(2-(甲基亚磺酰基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1394):8-羟基-6-甲基-9-(4-((甲基磺酰基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1395):(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺酰胺；  
 (1396):9-(4-((2-氨基乙基)(甲基)氨基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；  
 (1397):(R)-N-(2-(2-氟-4-(8-羟基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺酰胺；

(1398):(R)-N-(2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺酰胺；

(1399):(S)-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1400): 9-(4-((2-氨基乙基)(甲基)氨基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1401): 9-(4-(1-(氨基甲基)环丙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1402): 2-(6-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-3-基)乙腈；

(1403): 8-羟基-6-甲基-9-(4-(2-(甲基亚磺酰基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1404): 8-甲氧基-6-甲基-9-(4-((甲基磺酰基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1405): 5-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)菸鹼酰胺；

(1406): 2-(5-(8-羟基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-12-基)丙腈；

(1407): 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙酰胺；

(1408): 9-(6-(1-氨基丙-2-基)吡啶-3-基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1409): 2-(5-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氧基-4,5-二氢

- 噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-12-基)-2-甲基丙腈；
- (1410): 2-羟基-2-(4-(8-羟基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙烷-1-磺酰胺；
- (1411): N-(第三丁基)-2-羟基-2-(4-(8-甲氧基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙烷-1-磺酰胺；
- (1412): 2-(4-(8-羟基-6-甲基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙酰胺；
- (1413): 2-(4-(8-羟基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙烷-1-磺酰胺；
- (1414): 9-(4-(2-氨基-1-氟乙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1415): 9-(6-(1-氨基丙-2-基)吡啶-3-基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1416): 2-(5-(8-羟基-6-甲基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-12-基)-2-甲基丙腈；
- (1417): 2-(5-(8-羟基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-12-基)-2-甲基丙腈；
- (1418): 2-(5-(8-甲氧基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-12-基)-2-甲基丙腈；
- (1419): 2-(4-(8-羟基-6-甲基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙烷-1-磺酰胺；
- (1420): 9-(4-(2-氨基-1-羟基乙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1421): 9-(6-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)吡啶-3-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1422): N-環丙基-1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；

(1423): 2-(5-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-12-基)丙腈；

(1424):(R)-N-(2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺；

(1425): N-乙基-1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；

(1426): 9-(6-(1-胺基丙-2-基)吡啶-3-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1427): N-環丙基-1-(4-(8-羥基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；

(1428): 1-(5-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-12-基)環丙腈；

(1429): N-乙基-1-(4-(8-羥基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；

(1430): 1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺；

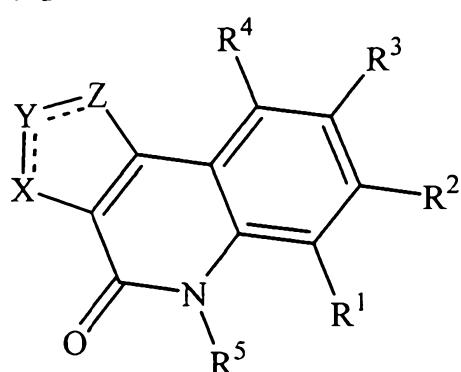
- (1431): 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺；
- (1432):(R)-N-(2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺；
- (1433):(R)-N-(2-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)-N-甲基甲烷磺醯胺；
- (1434):(R)-N-(2-(4-(8-羥基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺；
- (1435):(R)-N-(2-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺；
- (1436):(R)-N-(2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)-N-甲基甲烷磺醯胺；
- (1437):(R)-N-(2-(4-(8-羥基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)-N-甲基甲烷磺醯胺；
- (1438):(R)-N-(2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)-N-甲基甲烷磺醯胺。

21. 一種醫藥組合物，包含：1. 或 2. 之化合物至少其中之一或其在醫藥上可接受的鹽；及在醫藥上可接受之擔體。

22. 如 21. 之醫藥組合物，其能用於預防或治療 PBK 依存性疾病。
23. 如 22. 之醫藥組合物，其中該 PBK 依存性疾病為癌症。
24. 一種 PBK 抑制劑，包含 1. 或 2. 之化合物至少其中之一或其在醫藥上可接受的鹽。
25. 一種治療於個體中的 PBK 依存性疾病的方法，包含對於該個體投予有效量的 1. 或 2. 之化合物或其在醫藥上可接受的鹽。
26. 一種 1. 或 2. 之化合物或其在醫藥上可接受的鹽的用途，係用於治療 PBK 依存性疾病。
27. 一種 1. 或 2. 之化合物或其在醫藥上可接受的鹽用於製造治療 PBK 依存性疾病的醫藥組合物的用途。

或者，本發明也提供以下具體例：

101. 本發明提供由式(I)表示之化合物或其在醫藥上可接受的鹽：



I

其中 R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup> 及 R<sup>4</sup> 各自獨立地為選自由以下構成的群組的基團：

氫原子、  
 羥基、  
 鹵素、  
 氟基、  
 硝基、  
 胺基、  
 $C_1-C_6$  烷基、  
 $C_2-C_6$  烯基、  
 $C_2-C_6$  炔基、  
 $C_3-C_{10}$  環烷基、  
 $C_3-C_{10}$  環烯基、  
 $C_1-C_6$  烷氧基、  
 $C_6-C_{10}$  芳基、

二氫節基、

雜芳基、

3 至 8 員雜環烷基、

$-OSO_2CH_3$ 、

$-OSO_2CF_3$ ，及

$-CONH_2$

其中  $R^1$  至  $R^4$  之各基團選擇性經選自以下取代基 A 構成的群組的取代基取代：

取代基 A：

羟基；

側氧基( $=O$ )；

氯基；

鹵素；

$C_1-C_6$  烷基(其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經選自以下取代基 B 構成的群組的取代基取代)；

$C_3-C_{10}$  環烷基 [其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經氯基、或有  $-NR^{31}R^{32}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基取代(其中  $R^{31}$  與  $R^{32}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]；

$-NR^{21}R^{22}$  [其中  $R^{21}$  與  $R^{22}$  各自獨立地表示氫原子、或  $C_1-C_6$  烷基(其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經二( $C_1-C_6$  烷基)胺基、 $C_1-C_6$  烷基磺醯基( $-SO_2(C_1-C_6$  烷基))、或 3 至 8 員雜環烷基取代)]；

$C_1-C_6$  烷氧基 {其中該  $C_1-C_6$  烷氧基選擇性經鹵素、3 至 8 員雜環烷基(其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代)、或  $-NR^{33}R^{34}$  [其中  $R^{33}$  與  $R^{34}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基(其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基磺醯基或二( $C_1-C_6$  烷基)胺基取代)、或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基]取代}；

$-SO_2NR^{23}R^{24}$  {其中  $R^{23}$  與  $R^{24}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基、 $C_1-C_6$  烷氧基、鹵素、 $C_3-C_{10}$  環烷基、或  $-NR^{35}R^{36}$ (其中  $R^{35}$  與  $R^{36}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)取代]、 $C_3-C_{10}$  環烷基(其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  羥基烷基取代)、或 3 至 8 員雜環烷基；或  $R^{23}$  與  $R^{24}$  可一起形成 3 至 8 員雜環烷基 其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經胺

基取代}；

$C_1-C_6$  烷基磺醯基(其中該  $C_1-C_6$  烷基部分選擇性經羥基取代)；

$C_1-C_6$  烷基磺醯基胺基( $-NHSO_2(C_1-C_6$  烷基)) [其中該  $C_1-C_6$  烷基部分選擇性經 $-NR^{37}R^{38}$  取代(其中  $R^{37}$  與  $R^{38}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]；

3 至 8 員雜環烷基 {其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經 $-NR^{39}R^{40}$ (其中  $R^{39}$  與  $R^{40}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基)、 $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經 $-NR^{41}R^{42}$  取代(其中  $R^{41}$  與  $R^{42}$  各自獨立而代表氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]、羥基、或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基取代}；

雜芳基；

$-COOR^{11}$ (其中  $R^{11}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)；及

$-COR^{12}$  [其中  $R^{12}$  表示  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、氰基甲基、 $-NR^{25}R^{26}$  {其中  $R^{25}$  與  $R^{26}$  各自獨立地表示氫原子、或  $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基或 $-NR^{43}R^{44}$  取代(其中  $R^{43}$  與  $R^{44}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]}、或選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代之 3 至 8 員雜環烷基]，

取代基 B：

鹵素；

羥基；

氰基；

3至8員雜環烷基(其中該3至8員雜環烷基選擇性經C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、羥基、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>胺基烷基、或有C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>烷基氧羰基胺基取代之C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基取代);

-NR<sup>51</sup>R<sup>52</sup>{其中R<sup>51</sup>與R<sup>52</sup>各自獨立地表示氫原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基[其中該C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基選擇性經C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺醯基、或選擇性經-COOR<sup>53</sup>取代之3至8員雜環烷基取代(其中R<sup>53</sup>表示氫原子或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)]、3至8員雜環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺醯基、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>環烷基、-COR<sup>55</sup>(其中R<sup>55</sup>表示C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)、-COOR<sup>56</sup>(其中R<sup>56</sup>表示C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)、或-CONR<sup>57</sup>R<sup>58</sup>(其中R<sup>57</sup>與R<sup>58</sup>各自獨立地表示氫原子或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)};及

-COOR<sup>54</sup>(其中R<sup>54</sup>表示氫原子或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)];

其中R<sup>5</sup>為氫原子或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基;及

其中—X—Y—Z—為選自由以下構成的群組的構造:

(i) -S-CR<sup>7</sup>=CR<sup>6</sup>-、

(ii) -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-、

(iii) -NH-CH=CCH<sub>3</sub>-，及

(iv) -N=CH-S-

其中R<sup>6</sup>為

氫原子、

羥基、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、

C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>芳基(其中該C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>芳基選擇性經羥基取代)、或

3 至 8 員雜環烷基 [其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性  
經  $-NR^{61}R^{62}$  取代 (其中  $R^{61}$  與  $R^{62}$  各自獨立地表示氫原子  
或  $C_1-C_6$  烷基)]，且

其中  $R^7$  為

氫原子、

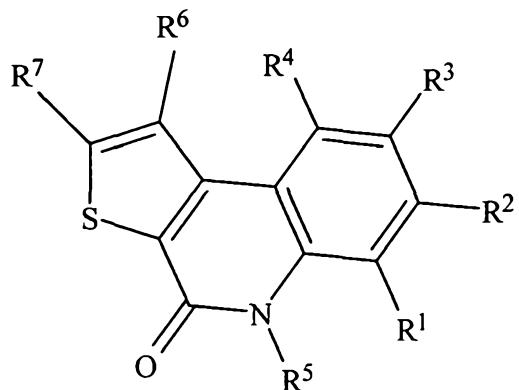
$C_1-C_6$  烷基 {其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基、 $-NR^{71}R^{72}$   
[其中  $R^{71}$  與  $R^{72}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基 (其  
中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經二甲基胺基取代)、 $C_3-C_{10}$  環烷  
基 (其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經胺基取代)、或 3 至 8  
員雜環烷基]、或 3 至 8 員雜環烷基 (其中該 3 至 8 員雜  
環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  胺基烷基取代) 取代}，

$C_6-C_{10}$  芳基 (其中該  $C_6-C_{10}$  芳基選擇性經羥基取  
代)、或

$-COR^{73}$  {其中  $R^{73}$  表示 3 至 8 員雜環烷基 (其中該 3 至  
8 員雜環烷基選擇性經胺基取代)、或  $-NR^{74}R^{75}$  [其中  $R^{74}$   
與  $R^{75}$  各自獨立地表示氫原子、3 至 8 員雜環烷基、或  
 $C_3-C_{10}$  環烷基 (其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經胺基取  
代)]}。

102. 如 101. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  
—X---Y---Z— 為  $-S-CR^7=CR^6-$ 。

具體而言，如 1. 之該化合物為具有下式 II 或其在醫藥上  
可接受的鹽：



103. 如 102. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中 R<sup>1</sup> 為氫原子或鹵素。

104. 如 102. 或 103. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中 R<sup>2</sup> 為氫原子、羥基、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、或選擇性經羥基取代之 C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 芳基。

105. 如 102. 至 104. 中任一項之該化合物或其在醫藥上可接受之鹽，其中 R<sup>2</sup> 為氫原子、羥基、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、或二羥基苯基。

106. 如 102. 至 105. 中任一項之該化合物或其在醫藥上可接受之鹽，其中 R<sup>3</sup> 為氫原子； 羥基； 鹵素； C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基； 氰基； 硝基； 選擇性經胺基取代之 3 至 8 員雜環烷基； 雜芳基； -OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>； -OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>； 或 -CONH<sub>2</sub>。

107. 如 102. 至 106. 中任一項之該化合物或其在醫藥上可接受之鹽，其中 R<sup>3</sup> 為氫原子； 羥基； 鹵素； C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基； 氰基； 硝基； 選擇性經胺基取代之 3 至 8 員雜環烷基（其中該 3 至 8 員雜環烷基為哌啶基、吡咯啶基、嗎啉基、或哌啶基）； 吡啶基； -OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>； -OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>； 或 -CONH<sub>2</sub>。

108. 如 102. 至 107. 中任一項之該化合物或其在醫藥上可接受之鹽，其中  $R^4$  為選自以下構成的群組的基團：氫原子、羥基、鹵素、胺基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、 $C_3-C_{10}$  環烯基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_6-C_{10}$  芳基、二氫節基、雜芳基、及 3 至 8 員雜環烷基，其中  $R^4$  的各基團選擇性經以上取代基 A 構成的群組的取代基取代。

109. 如 102. 至 108. 中任一項之該化合物或其在醫藥上可接受之鹽，其中  $R^4$  係選自由以下構成之群組：氫原子、羥基、鹵素、胺基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、 $C_3-C_{10}$  環烯基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_6-C_{10}$  芳基、二氫節基、雜芳基(其中該雜芳基選自由以下構成的群組 吡啶基、 $1H$ -吲唑基、 $1H$ -四唑基、[1, 2, 4]三唑并 [1, 5-a] 吡啶基、苯并咪唑基、2, 3-二氫苯并𫫇唑基、吡唑基、吡咯并[2, 3-b]吡啶基、嘧啶基、吲哚啉基、呋喃基、噻吩基及四氫異喹啉基)，及 3 至 8 員雜環烷基(其中該 3 至 8 員雜環烷基選自由以下構成的群組 氨丙啶基，三亞甲亞胺基、吡咯啶基、咪唑啶基、哌啶基、哌嗪基、氮雜環庚烷基、嗎啉基、及 1, 2, 3, 6-四氫吡啶基)，其中  $R^4$  的各基團選擇性經選自以下取代基 A-1 構成之群組的取代基取代：

取代基 A-1：

羥基；

側氧基；

氰基；

鹵素；

$C_1-C_6$  烷基 (其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經選自以下取代基 B-1 構成之群組的取代基取代);

$C_3-C_{10}$  環烷基 [其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經氨基、或有  $-NR^{31}R^{32}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基取代 (其中  $R^{31}$  與  $R^{32}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)];

$-NR^{21A}R^{22A}$  [其中  $R^{21A}$  與  $R^{22A}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基 (其中  $C_1-C_6$  烷基選擇性經二 ( $C_1-C_6$  烷基) 胺基、 $C_1-C_6$  烷基磺醯基 ( $-SO_2(C_1-C_6$  烷基))、或哌啶基取代)];

$C_1-C_6$  烷氧基 {其中該  $C_1-C_6$  烷氧基選擇性經選自鹵素、哌啶基及哌啶基的 3 至 8 員雜環烷基 (其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代)、或  $-NR^{33}R^{34}$  [其中  $R^{33}$  與  $R^{34}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基 (其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基磺醯基或二 ( $C_1-C_6$  烷基) 胺基取代)、或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基] 取代};

$-SO_2NR^{23A}R^{24A}$  {其中  $R^{23A}$  與  $R^{24A}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基、 $C_1-C_6$  烷氧基、鹵素、 $C_3-C_{10}$  環烷基、或  $-NR^{35}R^{36}$  取代 (其中  $R^{35}$  與  $R^{36}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]、 $C_3-C_{10}$  環烷基 (其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  羥基烷基取代)、三亞甲亞胺基、或吡咯啶基，或可一起形成吡咯啶基，其中該吡咯啶基選擇性經胺基取代};

$C_1-C_6$  烷基磺醯基 (其中該  $C_1-C_6$  烷基部分選擇性經羥基取代);

$C_1-C_6$  烷基磺醯基胺基 ( $-NHSO_2(C_1-C_6$  烷基)) [其中該  $C_1-C_6$  烷基部分選擇性經  $-NR^{37}R^{38}$  取代 (其中  $R^{37}$  與  $R^{38}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)];

3 至 8 員雜環烷基，係選自由三亞甲亞胺基、吡咯啶基、哌啶基及哌嗪基構成的群組 {其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $-NR^{39}R^{40}$  (其中  $R^{39}$  與  $R^{40}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基)、 $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $-NR^{41}R^{42}$  取代 (其中  $R^{41}$  與  $R^{42}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)取代]、羥基、或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基取代};

$1H$ -四唑基；

$-COOR^{11}$  (其中  $R^{11}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基); 及  
 $-COR^{12A}$  [其中  $R^{12A}$  表示選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代之哌嗪基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、氰基甲基、 $-NR^{25}R^{26}$  {其中  $R^{25}$  與  $R^{26}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基或  $-NR^{43}R^{44}$  取代 (其中  $R^{43}$  與  $R^{44}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]}、或  $C_1-C_6$  烷基];

取代基 B-1:

鹵素；

羥基；

氰基；

3 至 8 員雜環烷基，係選自由吡咯啶基、哌啶基、哌嗪基、及嗎啉基構成之群組 (其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇

性經  $C_1-C_6$  烷基、羥基、胺基、 $C_1-C_6$  胺基烷基、或有  $C_2-C_7$  烷基氧羧基胺基取代之  $C_1-C_6$  烷基取代)；

$-NR^{51A}R^{52A}$  {其中  $R^{51A}$  與  $R^{52A}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基磺醯基、或選擇性經  $-COOR^{53}$  取代的哌啶基所取代 (其中  $R^{53}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]、哌啶基、 $C_1-C_6$  烷基磺醯基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、 $-COR^{55}$  (其中  $R^{55}$  表示  $C_1-C_6$  烷基)、 $-COOR^{56}$  (其中  $R^{56}$  表示  $C_1-C_6$  烷基)、或  $-CONR^{57}R^{58}$  (其中  $R^{57}$  與  $R^{58}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)}；及  
 $-COOR^{54}$  (其中  $R^{54}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)。

1010. 如 102. 至 109. 中任一項之該化合物或其在醫藥上可接受之鹽，其中  $R^4$  選自由以下(p)構成的群組的基團：

(p)：

氫原子、

羥基、

鹵素、

胺基、

$C_1-C_6$  烷基，其選擇性經以下取代基(a)構成的群組的取代基取代，

$C_2-C_6$  烯基，其選擇性經以下取代基(b)構成的群組的取代基取代，

$C_3-C_{10}$  環烷基、

$C_3-C_{10}$  環烯基、

$C_1-C_6$  烷基、

$C_6-C_{10}$  芳基，其選擇性經以下取代基(c)構成的群組的取代基取代，

二氫節基，其選擇性經以下取代基(d)構成的群組的取代基取代，

雜芳基，其選擇性經以下取代基(e)構成的群組的取代基取代，及

3至8員雜環烷基，其選擇性經以下取代基(f)構成的群組的取代基取代，

其中，基團(p)中，

該雜芳基選自由以下構成的群組：吡啶基、 $1H$ -吲唑基、 $1H$ -四唑基、[1, 2, 4]三唑并[1, 5-a]吡啶基、苯并咪唑基、2, 3-二氫苯并噁唑基、吡唑基、吡咯并[2, 3-b]吡啶基、嘧啶基、吲哚啉基、呋喃基、噻吩基、及四氫異喹啉基；

該3至8員雜環烷基選自由以下構成的群組：吡咯啶基、哌啶基、哌阱基、嗎啉基、及1, 2, 3, 6-四氫吡啶基；

取代基(a)：

3至8員雜環烷基，係選自由吡咯啶基與哌啶基構成之群組{其中該3至8員雜環烷基選擇性經 $-NR^{39}R^{40}$ (其中 $R^{39}$ 與 $R^{40}$ 各自獨立地表示氫原子或 $C_1-C_6$ 烷基)、或 $C_1-C_6$ 烷基[其中該 $C_1-C_6$ 烷基選擇性經 $-NR^{41}R^{42}$ 取代(其中 $R^{41}$ 與 $R^{42}$ 各自獨立地表示氫原子或 $C_1-C_6$ 烷基)]取代}；及

$C_1-C_6$ 烷基磺醯基胺基( $-NHSO_2(C_1-C_6$ 烷基))；

取代基(b)：

$-COOR^{11}$  (其中  $R^{11}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基);

$-NR^{21a}R^{22a}$  [其中  $R^{21a}$  與  $R^{22a}$  各自獨立地表示氫原子、或  $C_1-C_6$  烷基 (其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經二 ( $C_1-C_6$  烷基) 氨基或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基) 取代];

3 至 8 員雜環烷基，係選自由三亞甲亞氨基、吡咯啶基、及哌啶基構成之群組 {其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $-NR^{39}R^{40}$  (其中  $R^{39}$  與  $R^{40}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基)、 $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $-NR^{41}R^{42}$  取代 (其中  $R^{41}$  與  $R^{42}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)]、羥基、或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基取代};

氰基；及

$C_1-C_6$  烷氧基；

取代基 (c)：

羥基；

氰基；

鹵素；

$C_1-C_6$  烷基 (其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經選自由以下取代基 B-C 構成之群組的取代基取代)；

$C_3-C_{10}$  環烷基 [其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經氰基、或有  $-NR^{31}R^{32}$  取代之  $C_1-C_6$  烷基取代 (其中  $R^{31}$  與  $R^{32}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)];

$-NR^{21c}R^{22c}$  [其中  $R^{21c}$  與  $R^{22c}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基];

$C_1-C_6$  烷基 {其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經選自  
鹵素、哌啶基、及哌啶基之 3 至 8 員雜環烷基取代(其中  
該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基)、或  $-NR^{33}R^{34}$  取  
代[其中  $R^{33}$  與  $R^{34}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基(其  
中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經二( $C_1-C_6$  烷基)胺基取代)、或  
 $C_1-C_6$  烷基磺醯基]};

$-SO_2NR^{23c}R^{24c}$  {其中  $R^{23c}$  與  $R^{24c}$  各自獨立地表示氫原  
子、 $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基、 $C_1-C_6$  烷  
基、鹵素、 $C_3-C_{10}$  環烷基、或  $-NR^{35}R^{36}$ (其中  $R^{35}$  與  $R^{36}$   
各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)取代]、 $C_3-C_{10}$  環烷  
基(其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經  $C_1-C_6$  羥基烷基取代)、  
三亞甲亞胺基、或吡咯啶基、或其中  $R^{23c}$  與  $R^{24c}$  可一起  
形成選擇性經胺基取代之吡咯啶基];

$C_1-C_6$  烷基磺醯基(其中該  $C_1-C_6$  烷基部分選擇性經羥  
基取代);

$C_1-C_6$  烷基磺醯基胺基( $-NHSO_2(C_1-C_6$  烷基)) [其中該  
 $C_1-C_6$  烷基部分選擇性經  $-NR^{37}R^{38}$  取代(其中  $R^{37}$  與  $R^{38}$  各  
自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)];

哌啶基 {其中該哌啶基選擇性經  $C_1-C_6$  烷基或  $C_1-C_6$   
烷基磺醯基取代};

$1H$ -四唑基；及

$-COR^{12c}$  [其中  $R^{12c}$  表示選擇性經  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_{10}$   
環烷基、氰基甲基、 $-NR^{25}R^{26}$  取代之哌啶基{其中  $R^{25}$  與  
 $R^{26}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基 [其中該  $C_1-C_6$  烷

基選擇性經羥基、或 $-NR^{43}R^{44}$ (其中 $R^{43}$ 與 $R^{44}$ 各自獨立地表示氫原子或 $C_1-C_6$ 烷基)取代]};或 $C_1-C_6$ 烷基];及

取代基B-c:

鹵素;

羥基;

氯基;

3至8員雜環烷基，係選自由吡咯啶基、哌啶基、哌啶基、及嗎啉基構成的群組(其中該3至8員雜環烷基選擇性經 $C_1-C_6$ 烷基、羥基、胺基、 $C_1-C_6$ 胺基烷基、或有 $C_2-C_7$ 烷基氧羰基胺基取代之 $C_1-C_6$ 烷基取代);及

$-NR^{51c}R^{52c}$  {其中 $R^{51c}$ 與 $R^{52c}$ 各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$ 烷基[其中該 $C_1-C_6$ 烷基選擇性經 $C_1-C_6$ 烷基磺醯基、或選擇性經 $-COOR^{53}$ 取代之哌啶基取代(其中 $R^{53}$ 表示氫原子或 $C_1-C_6$ 烷基)]、哌啶基、 $C_1-C_6$ 烷基磺醯基、 $C_3-C_{10}$ 環烷基、 $-COR^{55}$ (其中 $R^{55}$ 表示 $C_1-C_6$ 烷基)、或 $-CONR^{57}R^{58}$ (其中 $R^{57}$ 與 $R^{58}$ 各自獨立地表示氫原子或 $C_1-C_6$ 烷基)}];

取代基(d):

$-NR^{21d}R^{22d}$ (其中 $R^{21d}$ 與 $R^{22d}$ 各自獨立地表示氫原子或 $C_1-C_6$ 烷基);

取代基(e):

羥基;

側氨基;

氯基;

$-NR^{21}R^{22}$  [其中 $R^{21}$ 與 $R^{22}$ 各自獨立地表示氫原子或

$C_1-C_6$  烷基]；

哌啶基；

$C_1-C_6$  烷氨基；及

$C_1-C_6$  烷基 {其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $-NR^{51e}R^{52e}$  取代 [其中  $R^{51e}$  與  $R^{52e}$  各自獨立地表示氫原子或  $-COOR^{56}$  (其中  $R^{56}$  表示  $C_1-C_6$  烷基)]}；及

取代基(f)：

$C_1-C_6$  烷基 {其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經  $-NR^{51f}R^{52f}$  取代 [其中  $R^{51f}$  與  $R^{52f}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $-COOR^{56}$  (其中  $R^{56}$  表示  $C_1-C_6$  烷基)]}；及

$C_1-C_6$  烷基磺醯基。

111. 如 102-110. 中任一項之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^6$  為氫原子；羥基； $C_1-C_6$  烷基；選擇性經 1 至 3 個羥基取代之苯基；選擇性經胺基取代之哌啶基；或哌啶基。

112. 如 111. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^7$  為氫原子。

113. 如 102-111. 中任一項之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^7$  為

氫原子；

$C_1-C_6$  烷基 {其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經羥基、 $-NR^{71A}R^{72A}$  [其中  $R^{71A}$  與  $R^{72A}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基 (其中該  $C_1-C_6$  烷基選擇性經二甲基胺基取代)、 $C_3-C_{10}$  環烷基 (其中該  $C_3-C_{10}$  環烷基選擇性經胺基

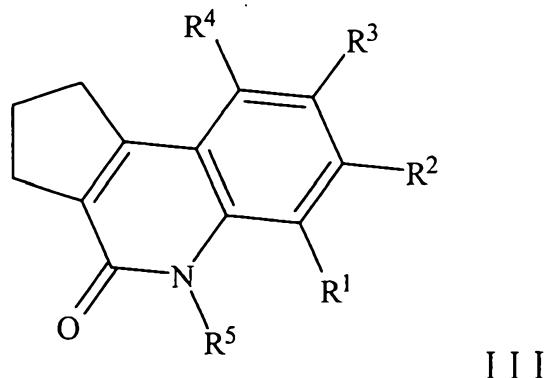
取代)、或哌啶基]、或選自由哌啶基與嗎啉基構成的 3 至 8 員雜環烷基(其中該 3 至 8 員雜環烷基選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 胺基烷基取代);

選擇性經 1 至 2 個羥基取代之苯基;或

-COR<sup>73A</sup> {其中 R<sup>73A</sup> 表示哌啶基(其中該哌啶基選擇性經胺基取代)、或-NR<sup>74A</sup>R<sup>75A</sup> [其中 R<sup>74A</sup> 與 R<sup>75A</sup> 各自獨立地表示氫原子、哌啶基、或 C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基(其中該 C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基選擇性經胺基取代)]}。

114. 如 101. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  
—X---Y---Z— 為 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-。

具體而言，如 1. 之該化合物具有下式 III 或其在醫藥上可接受的鹽：



115. 如 114. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中 R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> 與 R<sup>5</sup> 為氫原子。

116. 如 114. 或 115. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中 R<sup>3</sup> 為羥基或甲氧基。

117. 如 114. 至 116. 中任一項之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中 R<sup>4</sup> 為氫原子、苯基 [其中該苯基經有 -NR<sup>51A</sup>R<sup>52A</sup> 取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基取代(其中 R<sup>51A</sup> 與 R<sup>52A</sup> 各自

獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基)、或  $-SO_2NH_2$ ]、1, 2, 3, 6-四氫吡啶基、羥基吡啶基、或甲氧基吡啶基。

118. 如 101. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  
 $\text{---X---Y---Z---}$  為  $-\text{NH}-\text{CH}=\text{CCH}_3-$ ，  
 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$  與  $R^5$  為氫原子，且  
 $R^3$  為羥基。

119. 如 101. 之該化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  
 $\text{---X---Y---Z---}$  為  $-\text{N}=\text{CH}-\text{S}-$ ，  
 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$  與  $R^5$  為氫原子，且  
 $R^3$  為甲氧基。

120. 一種選自由以下構成的群組的化合物或其在醫藥上可接受的鹽：

- (1): 8-甲氧基-5-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (2): 8-羥基-5-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (3): 7, 8-二羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (4): 7, 8-二甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (5): 8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (6): 7, 9-二甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (7): 7, 9-二羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (8): 7, 8, 9-三甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (9): 8-羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (10): 7, 8, 9-三羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (11): 9-(3-(2-胺基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (12): 8-氯 嘧 吩 并 [2, 3-c] 噩 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (13): 4-側 氧 基 -4, 5-二 氢 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -8- 膦 ;
- (14): 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (15): 8-氟 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (16): 8-硝 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (17): 8-(3- 胺 基 挥 定 -1- 基 ) 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (18): 1-(4- 羧 基 苯 基 ) 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (19): 1, 8- 二 羧 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (20): 8- 羧 基 -1-(4- 羧 基 苯 基 ) 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (21): (R)-8-(3- 胺 基 吡 啶 定 -1- 基 ) 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (22): (S)-8-(3- 胺 基 吡 啶 定 -1- 基 ) 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (23): 8-( 吡 啶 -3- 基 ) 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (24): 8-(4- 羧 基 苯 基 ) 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (25): 1-(3, 4- 二 羧 基 苯 基 )-8- 羧 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (26): 1-(3- 胺 基 挥 定 -1- 基 )-8- 羧 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (27): 8-N- 鴨 吻 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (28): 8- 羧 基 -2- 甲 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼 -4(5H)- 酮 ;
- (29): 8- 羧 基 -2-( 羧 基 甲 基 ) 嘙 吩 并 [2, 3-c] 噬 吼

-4(5H)-酮；

(30): 8-羟基-4-侧氨基-N-(哌啶-3-基)-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-2-羧酰胺；

(31): 8-羟基-2-(4-羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(32): 8-羟基-1-(哌啶-1-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(33): N-((1r,4r)-4-氨基环己基)-8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-2-羧酰胺；

(34): 2-(3-氨基哌啶-1-羧基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(35): 2-(3,4-二羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(36): 2-(((1r,4r)-4-氨基环己基氨基)甲基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(37): 8-(哌啶-1-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(38): 8-羟基-1-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(39): 2-((2-(二甲基氨基)乙基氨基)甲基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(40): 8-羟基-2-((哌啶-3-基氨基)甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(41): 7-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(42): 9-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(43): 9-(3,4-二羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉

-4(5H)-酮；

(44): 1-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-8-腈；

(45): 7-(3,4-二羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(46): 8-羟基-1-甲基-3H-吡咯并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(47): 9-(3,5-二羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(48): 8-羟基-9-(3-羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(49): 8-羟基-9-(4-羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(50): 9-(3,4-二氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(51):(S)-8-(3-氨基吡咯啶-1-基)-2-(4-羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(52): 5-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)2-氯吡啶；

(53): 9-(6-氨基吡啶-3-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(54): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲酰胺；

(55): 9-(3-氟-4-羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹

啉 -4(5H)- 酮；

(56)：8- 羧 基 -2-(3- 羧 基 苯 基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 带  
-4(5H)- 酮；

(57)：(R)-8-(3- 氨 基 吡 啉 呀 -1- 基 )-2-(3, 4- 二 羧 基 苯  
基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 带 -4(5H)- 酮；

(58)：9-(3, 4- 二 氟 苯 基 )-8- 羧 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 带  
-4(5H)- 酮；

(59)：9-(4- 氟 -3- 羧 基 苯 基 )-8- 羧 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹  
带 -4(5H)- 酮；

(60)：8- 羧 基 -9-(3- 羧 基 -5-(三 氟 甲 基 ) 苯 基 ) 噻 吩 并  
[2, 3-c] 喹 带 -4(5H)- 酮；

(61)：8- 羧 基 -9-(1H- 吲 咤 -6- 基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 带  
-4(5H)- 酮；

(62)：8- 羧 基 -9-(3, 4, 5- 三 羧 基 苯 基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹  
带 -4(5H)- 酮；

(63)：9-(4- 羧 基 苯 基 )-8- 甲 氧 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 带  
-4(5H)- 酮；

(64)：9-(4-(1H- 四 咤 -5- 基 ) 苟 基 )-8- 羧 基 噻 吩 并  
[2, 3-c] 喹 带 -4(5H)- 酮；

(65)：4-(8- 羧 基 -4- 侧 氧 基 -4, 5- 二 氟 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹  
带 -9- 基 ) 苟 磺 酰 胺；

(66)：9-(3- 氯 -4- 氟 苟 基 )-8- 羧 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 带  
-4(5H)- 酮；

(67)：9-(4- 氯 -3- 氟 苟 基 )-8- 羧 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 带

-4(5H)-酮；

(68): 9-(3, 4-二氯苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉  
-4(5H)-酮；

(69): 9-(4-氯苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉  
-4(5H)-酮；

(70): 8-羟基-9-苯基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(71): 9-(4-(二氟甲氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(72): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(73): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(74): 9-(3-胺基苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉  
-4(5H)-酮；

(75): 3-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(76): 8-羟基-9-(3, 4, 5-三氟苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉  
-4(5H)-酮；

(77): N-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺酰胺；

(78): 8-甲氧基-9-苯基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(79): 8-羟基-9-(萘-2-基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-  
酮；

(80): 8-羟基-9-(4-(羟基甲基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹

啉 -4(5H)- 酮；

(81)：2-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙腈；

(82)：8-羟基-9-(4-(甲基磺酰基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(83)：8-羟基-9-(吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(84)：8-羟基-9-(1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(85)：8-羟基-9-(4-羟基-3-甲氧基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(86)：9-(3-氟-4-(N-吗啉基甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(87)：9-(3-(胺基甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(88)：9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(89)：9-(3-(二氟甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(90)：9-(3-(胺基甲基)苯基)-8-羟基-2-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(91)：9-环己烯基-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(92)：9-(3,5-二氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉

-4(5H)-酮；

(93): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(94): 9-(3-(胺基甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(95): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基-2-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(96): 9-环丙基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(97): 9-([1,2,4]三唑并[1,5-a]吡啶-6-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(98): 8-甲氧基-9-(1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(99): 9-环己烯基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(100): 8-甲氧基-9-(4-(2-(哌啶-1-基)乙基胺基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(101): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基-2-(N-吗啉基甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(102): 9-(1H-苯并[d]咪唑-5-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(103): 9-(4-(二氟甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(104): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-甲氧基-2-(N-吗啉基甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (141): 8-甲氧基-9-(4-(4-甲基哌啶-1-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (142): 8-甲氧基-9-(1-(甲基磺醯基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (143):(E)-9-(3-(二乙基氨基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (144): 9-(3-(4-(胺基甲基)哌啶-1-基)丙基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (145): 9-(4-(3-(2-(二乙基氨基)乙基氨基)丙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (146): 9-(4-(3-(二乙基氨基)丙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (147): 9-(4-(3-(2-(二乙基氨基)乙基氨基)丙氧基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (148):(E)-9-(3-(4-(胺基甲基)哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (149): 9-(4-(3-(二甲基氨基)丙氧基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (150): 8-羟基-9-(4-(2-(哌啶-1-基)乙氧基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (151): 9-(4-(2-(乙基氨基)乙氧基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (152):(E)-9-(3-(4-胺基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (153): 9-(1-(2-胺基乙基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (154): 9-(4-(2-(乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (155): 9-(4-(2-(二乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (156): 9-(4-(2-(二乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (157): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙氧基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (158): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (159): 8-甲氧基-9-(4-(2-(哌啶-1-基)乙氧基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (160): 8-甲氧基-9-(3-(2-(4-甲基哌啶-1-基)乙氧基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (161): 9-(3-(2-(二乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (162): 9-(3-(3-(二乙基胺基)丙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (163): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (164): 9-(4-((二甲基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (188): 8-甲氧基-9-(4-((甲基胺基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (189): 9-(4-胺基-3-甲氧基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (190): 3-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲腈；
- (191): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (192): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (193): N-(1-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺酰胺；
- (194): 8-羟基-9-(4-(1-(吡咯啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (195): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (196): 9-(4-(1-(二乙基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (197): N-(2-胺基乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (198): N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (199): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(吡咯啶-3-基)苯磺酰胺；

- (200): N-(三亞甲亞胺-3-基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (201): 9-(4-(2-(二乙基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (202): 2-胺基-N-(3-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺；
- (203): 4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲腈；
- (204): 4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲腈；
- (205):(E)-9-(3-(3-胺基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (206): N-(2-羥基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (207): 8-甲氧基-9-(5-甲氧基吡啶-3-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (208): 8-甲氧基-9-(5-甲氧基吡啶-3-基)-2,3-二氫-1H-環戊[c]喹啉-4(5H)-酮；
- (209): 9-(4-(3-胺基吡咯啶-1-基磺醯基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (210): N-(2-溴乙基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (211): 9-(4-((二異丙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (224): 6-氟-8-甲氧基-9-(1, 2, 3, 6-四氢吡啶-4-基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (225): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-6-氟-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (226): 9-(4-((二乙基胺基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (227): (E)-9-(3-(3-羟基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (228): (E)-8-羟基-9-(3-(3-羟基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (229): 8-羟基-9-(4-((异丙基胺基)甲基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (230): (E)-9-(3-(3-氨基三亚甲亚胺-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (231): (E)-8-甲氧基-9-(3-(2-(甲基磺酰基)乙基胺基)丙-1-烯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (232): (S)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (233): (S)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (234): 8-羟基-9-(5-羟基吡啶-3-基)-2, 3-二氢-1H-环戊[c]喹啉-4(5H)-酮；
- (235): 9-(4-((4-(氨基甲基)哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (236): 8-甲氧基-9-(4-(1-(2-(甲基磺醯基)乙基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (237): 9-(4-((3-氨基吡咯啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (238):(E)-9-(3-(3-氨基三亞甲亞胺-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (239):(E)-9-(3-(乙基胺基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (240): 9-(4-((3-氨基哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (241): 9-(4-((3-氨基吡咯啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (242): 9-(4-((3-氨基哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (243): 8-羟基-9-(4-(1-(2-(甲基磺醯基)乙基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (244):(E)-9-(3-(3-氨基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (245):(E)-9-(3-(3-氨基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (246):(E)-9-(3-(3-氨基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (247):(E)-8-羟基-9-(3-(2-(甲基磺醯基)乙基胺基)丙-1-烯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (248): 8-甲氧基-9-(4-(2-(甲基磺醯基)乙基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (249): 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙腈；
- (250):(E)-N-(1-(3-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)烯丙基)三亚甲亚胺-3-基)甲烷磺酰胺；
- (251): 4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N,N-二甲基苯磺酰胺；
- (252): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-甲基苯磺酰胺；
- (253): 第三丁基(5-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)呋喃-2-基)甲基胺基甲酸酯；
- (254): N-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-甲基苯基)甲烷磺酰胺；
- (255): N-(4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-甲基苯基)甲烷磺酰胺；
- (256): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-6-氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (257): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (258): 6-氟-8-羟基-9-(1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (259): 9-(4-((二乙基胺基)甲基)-3-氟苯基)-8-羟基

噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(260): 8-甲氧基-9-(4-(1-(哌啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(261): 2-(2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙腈；

(262): 8-羟基-9-(4-(1-(哌啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(263):(E)-9-(3-(3-(二甲基胺基)哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(264):(E)-9-(3-(3-(二甲基胺基)吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(265): 9-(4-(2-氨基乙基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(266): 9-(5-(氨基甲基)噻吩-2-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(267): 9-(4-((乙基胺基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(268):(E)-9-(3-(4-氨基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(269): 9-(4-((乙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(270): 9-(4-(氨基甲基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(271): 9-(3-氯-4-((二乙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧

- 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 噻 吩 -4(5H)- 酮 ;
- (272) : (R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基  
噻吩并[2, 3-c]噻吩-4(5H)-酮 ;
- (273) : 9-(4-(3-胺基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]  
噻吩-4(5H)-酮 ;
- (274) : (R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并  
[2, 3-c] 噻 吩 -4(5H)- 酮 ;
- (275) : (R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羟基噻吩并  
[2, 3-c] 噻 吩 -4(5H)- 酮 ;
- (276) : 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并  
[2, 3-c] 噻 吩 -4(5H)- 酮 ;
- (277) : 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻  
吩并[2, 3-c]噻吩-4(5H)-酮 ;
- (278) : 9-(3-氟-4-((3-羟基吡咯啶-1-基)甲基)苯  
基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]噻吩-4(5H)-酮 ;
- (279) : 9-(3-氟-4-((3-羟基吡咯啶-1-基)甲基)苯  
基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]噻吩-4(5H)-酮 ;
- (280) : 4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]  
噻吩-9-基)-N-(2, 2, 2-三氟乙基)苯磺酰胺 ;
- (281) : 4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]  
噻吩-9-基)-N-(2, 2, 2-三氟乙基)苯磺酰胺 ;
- (282) : N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基  
-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]噻吩-9-基)苯磺酰胺 ;
- (283) : 8-羟基-9-(4-((2-(甲基磺酰基)乙基胺基)甲基)

- 二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲醯胺；
- (296): 9-(4-乙醯基苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (297): N-(2-溴乙基)-2-氟-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (298): 9-(3-(3-(二甲基胺基)哌啶-1-基)丙基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (299): N-(2-氟-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基)甲烷磺醯胺；
- (300): 9-(3-氟-4-(2-(甲基磺醯胺基)乙基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基甲烷磺酸酯；
- (301):(R)-N-(1-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺醯胺；
- (302):(R)-9-(4-(1-(甲基磺醯胺基)乙基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基甲烷磺酸酯；
- (303): 2-氟-N-(2-羥基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (304): 4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N,N-二甲基苯磺醯胺；
- (305): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-7-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (306): N-(2-溴乙基)-4-(7-氟-8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

- (307): 4-(7-氯-8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺酰胺；
- (308): 9-(4-(1-(二甲基胺基)-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (309): N-(2-氯-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基)-N-甲基甲烷磺酰胺；
- (310): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-甲氧基乙基)苯磺酰胺；
- (311):(E)-3-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-甲基丙烯腈；
- (312): N-(2-氯-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基)甲烷磺酰胺；
- (313): 8-羟基-9-(4-(1-羟基乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (314): 9-(4-(1-(环戊基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (315): 9-(4-(1-(环戊基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (316): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺酰胺；
- (317): 9-(5-(氨基甲基)呋喃-2-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (318): 9-(3-氯-4-((甲基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (319): 9-(4-(2-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (320): N-(3-羟基丙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (321): 2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺酰胺；
- (322): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(3-羟基丙基)苯磺酰胺；
- (323): N-(3-溴丙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (324): 2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-甲氧基乙基)苯磺酰胺；
- (325): 9-(3-氯-4-((甲基胺基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (326): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-8-睛；
- (327): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)-3-氯苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (328): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-6,7-二氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (329): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (330): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基三氟甲烷磺酸酯；

- (331): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (332): N-(2-氯乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (333): N-(2-氟乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (334): 9-(4-(2-氨基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (335):(S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (336): 9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (337): 9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (338): 9-(4-(1-(二乙基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (339): 9-(4-(1-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (340): 9-氨基-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (341): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-6,7-二氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (342): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-6,7-二氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (343): N-環丙基-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (344): N-環丙基-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (345): 9-(2-胺基-2,3-二氫-1H-茚-5-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (346): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (347):(S)-N-(1-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺醯胺；
- (348): 9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (349): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (350): N-(1-(羥基甲基)環戊基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (351): 9-(2-(二乙基胺基)-2,3-二氫-1H-茚-5-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (352): 9-(2-(二甲基胺基)-2,3-二氫-1H-茚-5-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (353): 8-羥基-9-(1,2,3,4-四氫異喹啉-7-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (354): 8-甲氧基-9-(1,2,3,4-四氫異喹啉-7-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (355): 3-(3-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈；
- (356): 9-(4-(1-(二乙基胺基)乙基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (357): 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)環丙腈；
- (358): 9-(2-乙基-1,2,3,4-四氳異喹啉-7-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (359): 9-(4-(1-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (360): 3-(3-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈；
- (361): 1-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)環丙腈；
- (362): 9-(2-胺基-2,3-二氳-1H-茚-5-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (363): N-異戊基-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (364): 9-(2-(二甲基胺基)-2,3-二氳-1H-茚-5-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (365): 9-(4-(1-(乙基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (366): 6-氟-9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (367): 9-(4-(環丙烷羧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (368): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8-羧醯胺；
- (369): 9-(2-胺基乙基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (370): 8-羥基-9-(4-(2-羥基乙基磺醯基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (371): 9-(4-(2-羥基乙基磺醯基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (372): 9-(1-乙基吲哚啉-5-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (373): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (374): 8-羥基-9-(2-甲基-1,2,3,4-四氫異喹啉-7-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (375): 9-(4-(1-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (376): 8-羥基-9-(1-甲基吲哚啉-5-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (377): 8-羥基-9-(吲哚啉-5-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (378): 9-(吲哚啉-5-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (379): 9-(4-(1-((二甲基胺基)甲基)環丙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (380): 4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-丙基苯磺醯胺；
- (381): N-(環丙基甲基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (382): N-(3,3-二甲基丁基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (383): 4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-異戊基苯磺醯胺；
- (384): N-(3,3-二甲基丁基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (385): 9-(4-(1-(乙基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (386): 3-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-3-側氧基丙腈；
- (387):(E)-9-(2-乙氧基乙烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (388): N-(1-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)乙醯胺；
- (389): 4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(3,3,3-三氟丙基)苯磺醯胺；
- (390): 4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(1-(羥基甲基)環戊基)苯磺醯胺；

(391): N-(2, 2-二氟乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺。

121. 一種醫藥組合物，其包含：如 101. 至 120. 中任一項的化合物至少其中之一或其在醫藥上可接受的鹽，以及醫藥上可接受的擔體。

122. 如 121. 之醫藥組合物，其能用於預防或治療 PBK 依存性疾病。

123. 如 122. 之醫藥組合物，其中該 PBK 依存性疾病為癌症。

124. 一種 PBK 抑制劑，包含 101 至 120. 中任一項之化合物至少其中之一或其在醫藥上可接受的鹽。

125. 一種治療於個體中的 PBK 依存性疾病的方法，包含對於該個體投予有效量的 101 至 120. 中任一項之化合物或其在醫藥上可接受的鹽。

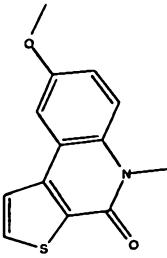
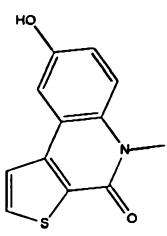
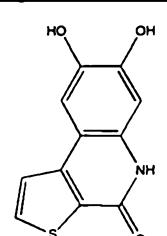
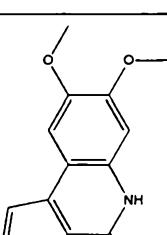
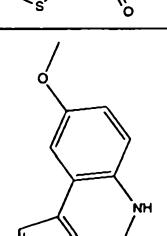
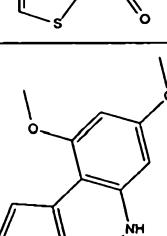
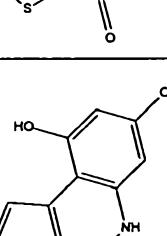
126. 一種 101 至 120. 中任一項之化合物或其在醫藥上可接受的鹽用於治療 PBK 依存性疾病的作用。

127. 一種 101 至 120. 中任一項之化合物或其在醫藥上可接受的鹽之作用，係使用於製造治療 PBK 依存性疾病的醫藥組合物。

較佳的化合物包括由列在下表 1 中實施例編號 -391 構成的群組的化合物；及上述化合物在醫藥上可接受之鹽、前驅藥、水合物及溶劑合物。

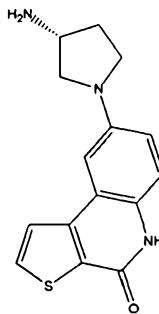
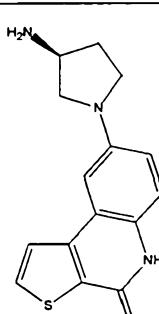
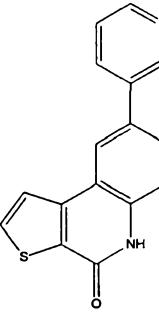
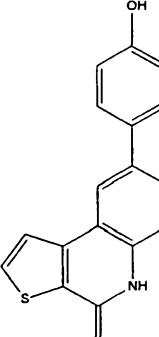
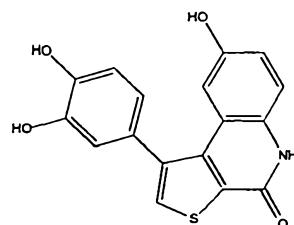
表 1-1(實施例 1-391)

實施例	結構	名稱
-----	----	----

1		8-甲氧基-5-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
2		8-羟基-5-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
3		7,8-二羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
4		7,8-二甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
5		8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
6		7,9-二甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
7		7,9-二羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

8		7, 8, 9-三甲氧基噻吩并[2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮
9		8-羟基噻吩并[2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮
10		7, 8, 9-三羟基噻吩并[2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮
11		9-(3-(2-氨基乙基)苯基)-8- 甲氧基噻吩并[2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮
12		8-氯噻吩并[2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮
13		4-侧氨基-4, 5-二氮噻 吩并[2, 3-c] 喹啉-8-腈
14		噻吩并[2, 3-c]喹啉 -4(5H)-酮

15		8-氟 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
16		8-硝基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
17		8-(3-氨基哌啶-1-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
18		1-(4-羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
19		1,8-二羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
20		8-羟基-1-(4-羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

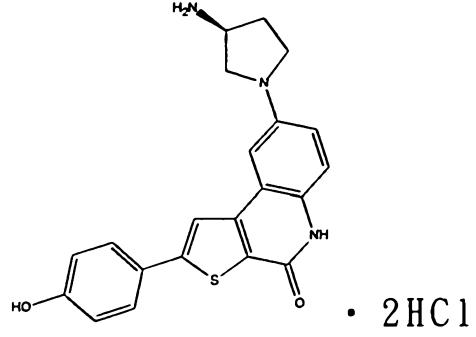
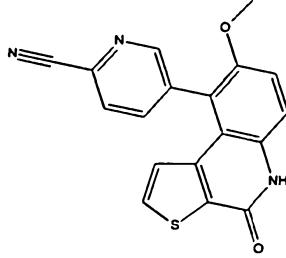
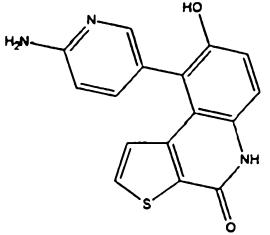
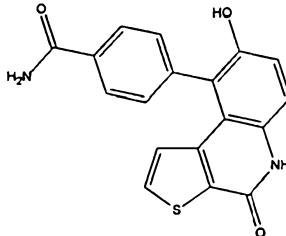
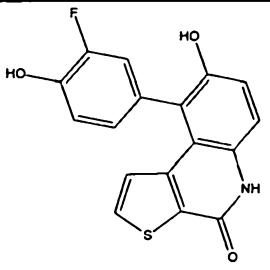
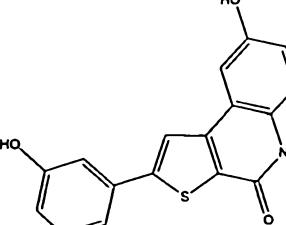
21		(R)-8-(3-氨基吡咯啶-1-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
22		(S)-8-(3-氨基吡咯啶-1-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
23		8-(吡啶-3-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
24		8-(4-羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
25		1-(3,4-二羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

26		1-(3-氨基哌啶-1-基)-8-羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
27		8-N-嗎啉基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
28		8-羟基-2-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
29		8-羟基-2-(羟基甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
30		8-羟基-4-側氧基-N-(哌啶-3-基)-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-2-羧醯胺
31		8-羟基-2-(4-羟基苯基) 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

32		8-羟基-1-(哌啶-1-基) 噻吩并 [2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
33		N-((1R,4R)-4-氨基环己基)-8-羟基-4-侧羟基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-2-羧酰胺
34		2-(3-氨基哌啶-1-羰基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
35		2-(3,4-二羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
36		2-(((1R,4R)-4-氨基环己基氨基)甲基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
37		8-(哌啶-1-基)噻吩并 [2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二盐酸盐

38		8-羟基-1-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
39		2-((2-(二甲基氨基)乙基氨基)甲基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
40		8-羟基-2-((哌啶-3-基氨基)甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
41		7-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
42		9-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
43		9-(3,4-二羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
44		1-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-8-腈

45		7-(3,4-二羥基苯基)-8-羥基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
46		8-羥基-1-甲基-2H-吡咯并 [2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
47		9-(3,5-二羥基苯基)-8-羥基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
48		8-羥基-9-(3-羥基苯基) 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
49		8-羥基-9-(4-羥基苯基) 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
50		9-(3,4-二氟苯基)-8- 甲氧基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

51		(S)-8-(3-胺基吡咯啶 -1-基)-2-(4- 羟基苯基) 噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 二鹽酸鹽
52		5-(8-甲氧基-4-側氨基 -4, 5-二氫 噻吩并[2, 3-c]喹啉-9- 基) 2-氰吡啶
53		9-(6-胺基吡啶-3- 基)-8-羟基 噻吩并[2, 3-c]喹啉 -4(5H)-酮
54		4-(8-羟基-4-側氨基 -4, 5-二氫 噻吩并[2, 3-c]喹啉-9- 基)苯甲醯胺
55		9-(3-氟-4-羟基苯 基)-8- 羟基噻吩并[2, 3-c]喹 啉- 4(5H)-酮
56		8-羟基-2-(3-羟基苯 基) 噻吩并[2, 3-c]喹啉 -4(5H)-酮

57	<p>• 2 HCl</p>	(R)-8-(3-胺基吡咯啶-1-基)-2-(3,4-二羥基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽
58		9-(3,4-二氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
59		9-(4-氟-3-羥基苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
60		8-羥基-9-(3-羥基-5-(三氟甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
61		8-羥基-9-(1H-吲唑-6-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
62		8-羥基-9-(3,4,5-三羥基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

63		9-(4-羟基苯基)-8-甲氧基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
64		9-(4-(1H-四唑-5-基)苯基)-8- 羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
65		4-(8-羟基-4-侧氨基- -4,5-二氢 噻吩并[2,3-c]喹啉-9- 基) 苯磺酰胺
66		9-(3-氯-4-氟苯基)-8- 羟基噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮
67		9-(4-氯-3-氟苯基)-8- 羟基噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮
68		9-(3,4-二氯苯基)-8- 羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

69		9-(4-氟苯基)-8-羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
70		8-羟基-9-苯基噻吩并 [2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮
71		9-(4-(二氟甲氧基)苯基)-8- 甲氧基噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮
72		9-(4-(胺基甲基)苯基)-8- 羟基噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮
73		9-(4-(胺基甲基)苯基)-8- 羟基噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
74		9-(3-胺基苯基)-8-羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

75		<p>3-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳 噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基) 苯磺醯胺</p>
76		<p>8-羥基-9-(3,4,5-三氟 苯基) 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮</p>
77		<p>N-(4-(8-羥基-4-側氧 基-4,5-二氳 噻吩并[2,3-c]喹啉-9- 基)苯基) 甲烷磺醯胺</p>
78		<p>8-甲氧基-9-苯基噻吩 并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮</p>
79		<p>8-羥基-9-(萘-2-基)噻 吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮</p>
80		<p>8-羥基-9-(4-(羥基甲 基) 苯基)噻吩并[2,3-c]喹 啉-4(5H)-酮</p>

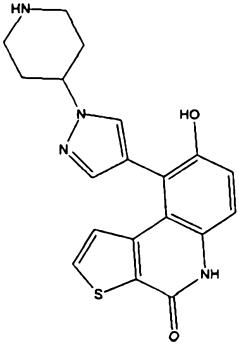
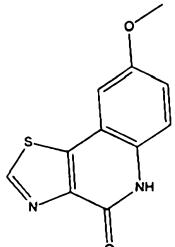
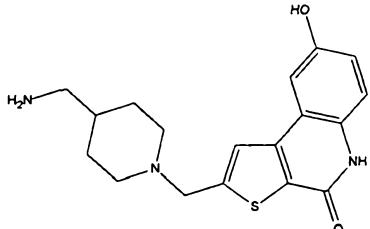
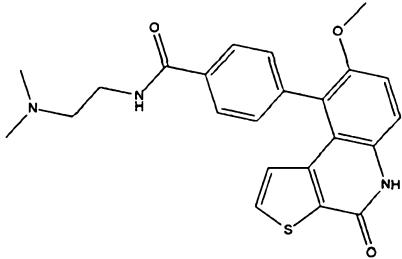
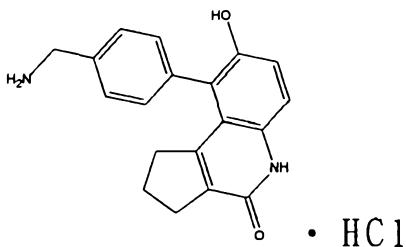
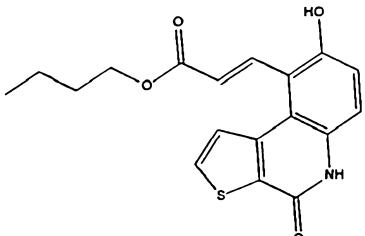
81		2-(4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)苯基)乙腈
82		8-羟基-9-(4-(甲基磺醯基)苯基)噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
83		8-羟基-9-(吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
84		8-羟基-9-(1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
85		8-羟基-9-(4-羟基-3-甲氧基苯基)噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
86		9-(3-氟-4-(N-吗啉基甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮

87		9-(3-(胺基甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
88		9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
89		9-(3-(二氟甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
90		9-(3-(胺基甲基)苯基)-8-羟基-2-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
91		9-環己烯基-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
92		9-(3,5-二氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

93		9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]噻吩-4(5H)-酮)
94		9-(3-(氨基甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噻吩-4(5H)-酮
95		9-(4-(氨基甲基)苯基)-8-羟基-2-甲基噻吩并[2,3-c]噻吩-4(5H)-酮
96		9-環丙基-8-羟基噻吩并[2,3-c]噻吩-4(5H)-酮
97		9-([1,2,4]三唑并[1,5-a]吡啶-6-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]噻吩-4(5H)-酮
98		8-甲氧基-9-(1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]噻吩-4(5H)-酮
99		9-環己烯基-8-羟基噻吩并[2,3-c]噻吩-4(5H)-酮

100		8-甲氧基-9-(4-(2-(哌啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
101		9-(4-(氨基甲基)苯基)-8-羟基-2-(N-吗啉基甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
102		9-(1H-苯并[d]咪唑-5-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
103		9-(4-(二氟甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
104		9-(4-(氨基甲基)苯基)-8-甲氧基-2-(N-吗啉基甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
105		8-羟基-9-(4-(2-(哌啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

112		8-羟基-9-(4-(甲基磺酰基) 哌啶-1-基)苯基)噻吩 并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
113		8-羟基-9-(4-((哌啶-3-基 氨基)甲基)苯基)噻吩 并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
114		N-(2-(二甲基胺基)乙 基)-4-(8- 羟基-4-侧氨基-4,5-二 氢噻吩并 [2,3-c]喹啉-9-基)苯 甲醯胺
115		9-(4-(3-(二甲基胺基) 丙氧基) 苯基)-8-甲氧基噻吩并 [2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
116		8-甲氧基-9-(1-(哌啶-4-基)-1H-吡唑-4-基) 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

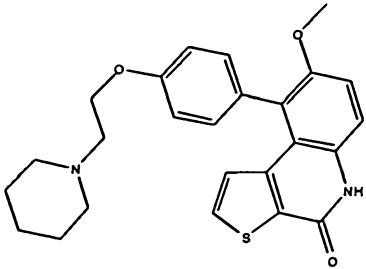
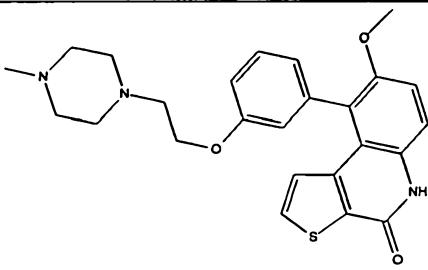
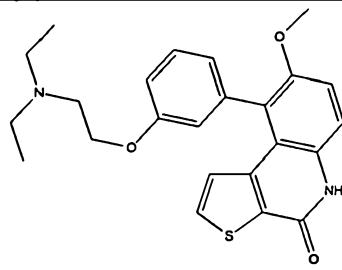
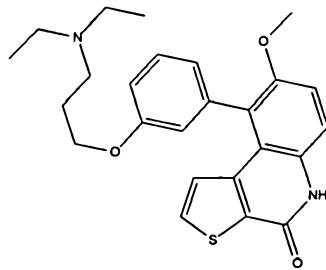
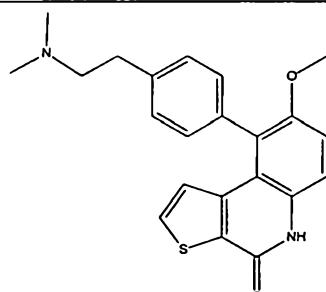
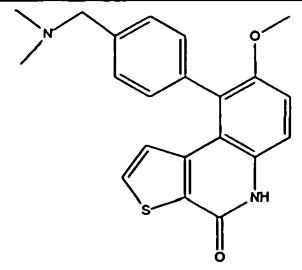
117		8-羟基-9-(1-(哌啶-4-基)-1H-吡唑-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
118		8-甲氧基噻唑并[4,5-c]喹啉-4(5H)-酮
119		2-((4-(氨基甲基)哌啶-1-基)甲基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
120		N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲酰胺
121		9-(4-(氨基甲基)苯基)-8-羟基-2,3-二氢-1H-环戊[c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐
122		(E)-丁基-3-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)丙烯酸酯

129		4-(8-羟基 -4- 側 氧 基 -2,3,4,5-四 氫-1H-環戊[c]喹啉- 9-基)苯磺醯胺
130		8-羟基 -9-(4-(4-甲基 哌啶-1-羰基)苯基)噻 吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮
131		8-甲 氧 基 -9-(4-(4-甲 基 哌 啶-1-羰 基)苯 基) 噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮
132		8-羟基 -9-(4-((4-甲基 哌啶-1-基)甲基)苯基) 噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮
133		8-甲 氧 基 -9-(4-((4-甲 基 哌 啶-1-基)甲基)苯 基)噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮
134		(E)-9-(3-(二乙基 氨基)丙-1-烯基)-8-甲 氧 基 噻吩并[2,3-c]喹啉- 4(5H)-酮

141		8-甲氧基-9-(4-(4-甲基哌啶-1-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽
142		8-甲氧基-9-(1-(甲基磺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
143		(E)-9-(3-(二乙基胺基)丙-1-烯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
144		9-(3-(4-(胺基甲基)哌啶-1-基)丙基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
145		9-(4-(3-(2-(二乙基胺基)乙基胺基)丙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
146		9-(4-(3-(二乙基胺基)丙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

147		9-(4-(3-(2-(二乙基胺基)乙基胺基)丙氧基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
148		(E)-9-(3-(4-(氨基甲基)哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
149		9-(4-(3-(二甲基胺基)丙氧基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
150		8-羟基-9-(4-(2-(哌啶-1-基)乙氧基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
151		9-(4-(2-(乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
152		(E)-9-(3-(4-(氨基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

153		9-(1-(2-胺基乙基)-1,2,3,6-四 氫吡啶-4-基)-8-甲氧基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
154		9-(4-(2-(乙基氨基)乙基)苯基)-8-甲氧基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
155		9-(4-(2-(二乙基氨基)乙基)苯基)-8-羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
156		9-(4-(2-(二乙基氨基)乙基)苯基)-8-甲氧基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
157		9-(4-(2-(二甲基氨基)乙基)苯基)-8-羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
158		9-(4-(2-(二甲基氨基)乙基)苯基)-8-甲氧基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

159		8-甲氧基-9-(4-(2-(哌啶-1-基) 乙氧基)苯基)噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮
160		8-甲氧基-9-(3-(2-(4- 甲基 哌啶-1-基)乙氧基)苯 基) 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
161		9-(3-(2-(二乙基胺基) 乙氧基)苯基)-8-甲氧 基噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
162		9-(3-(3-(二乙基胺基) 丙氧基)苯基)-8-甲氧 基噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
163		9-(4-(2-(二甲基胺基) 乙基)苯基)-8-甲氧 基噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
164		9-(4-((二甲基胺基) 甲基)苯基)-8-甲氧基 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮

183		9-(4-((二乙基氨基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
184		9-(4-((二乙基氨基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
185		9-(3-(2-(二甲基氨基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
186		9-(3-(2-氨基乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
187		8-羟基-9-(4-((甲基氨基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
188		8-甲氧基-9-(4-((甲基氨基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

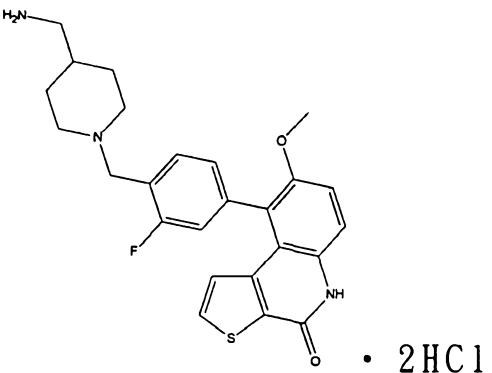
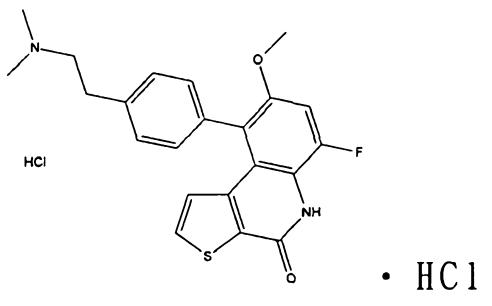
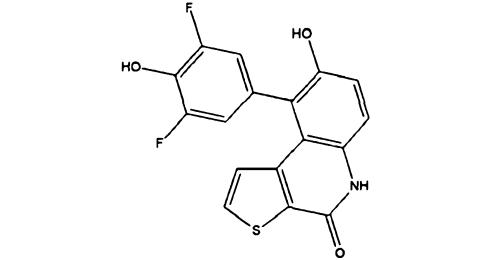
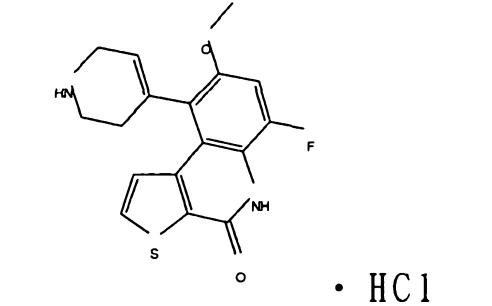
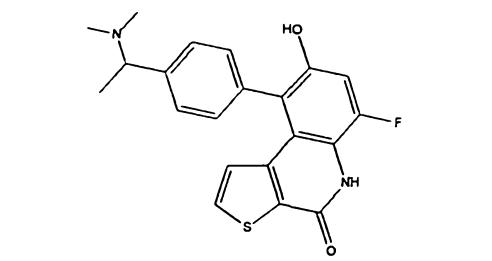
189		9-(4-氨基-3-甲氧基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮鹽酸鹽
190		3-(8-羥基-4-側氧化基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)-苯甲腈
191		9-(4-(1-(二甲基氨基)乙基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
192		9-(4-(1-(二甲基氨基)乙基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮鹽酸鹽
193		N-(1-(4-(8-羥基-4-側氧化基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)-苯基)乙基)甲烷磺醯胺
194		8-羥基-9-(4-(1-(吡咯啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮鹽酸鹽

195	<p>• HCl</p>	<p>9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽</p>
196	<p>• HCl</p>	<p>9-(4-(1-(二乙基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽</p>
197	<p>• HCl</p>	<p>N-(2-胺基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺鹽酸鹽</p>
198	<p>• HCl</p>	<p>N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺鹽酸鹽</p>
199	<p>• HCl</p>	<p>4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(吡咯啶-3-基)苯磺醯胺鹽酸鹽</p>

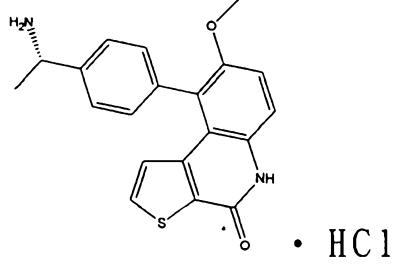
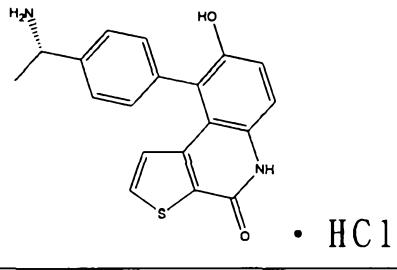
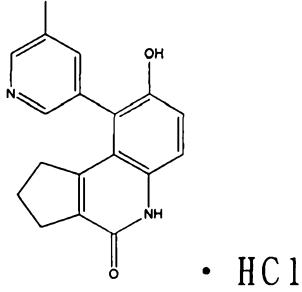
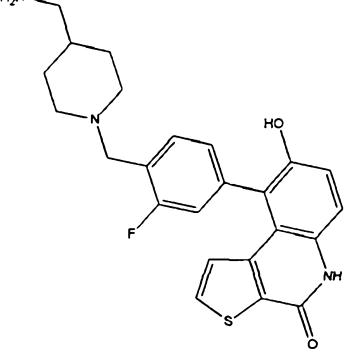
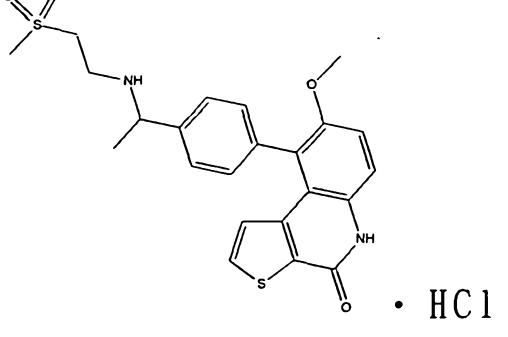
200	 • HCl	N-(三亞甲亞胺-3-基)-4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺鹽酸鹽
201	 • HCl	9-(4-(2-(二乙基氨基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
202	 • HCl	2-氨基-N-(3-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)乙烷磺醯胺鹽酸鹽
203		4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲腈
204		4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲腈

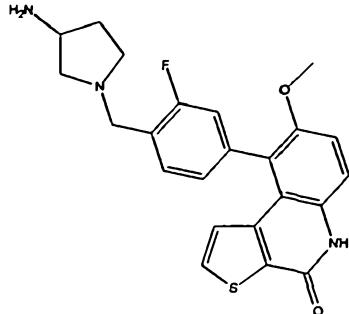
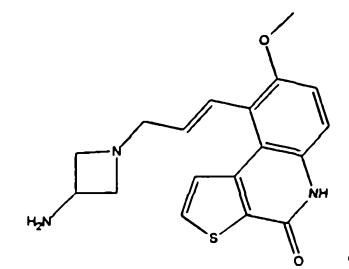
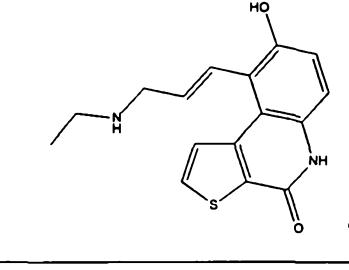
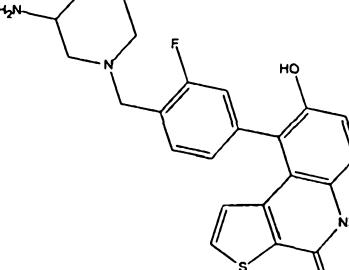
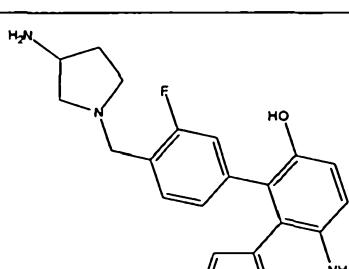
205		(E)-9-(3-(3-胺基吡咯啶-1-基)-丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮二鹽酸鹽
206		N-(2-羥基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側羥基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)苯磺醯胺
207		8-甲氧基-9-(5-甲氧基吡啶-3-基)噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮鹽酸鹽
208		8-甲氧基-9-(5-甲氧基吡啶-3-基)-2,3-二氫-1H-環戊[c]噁唑-4(5H)-酮鹽酸鹽
209		9-(4-(3-胺基吡咯啶-1-基磺醯基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮鹽酸鹽

215		<p>2- 氨 基 -N-(3-(8- 細 基 -4-側 氧 基 -4,5-二 氧 嘍 吩 并 [2,3-c] 喹 吡 -9- 基 ) 苯 基 ) 乙 烷 磺 鹼 肽 鹼 酸 鹽</p>
216		<p>8- 甲 氧 基 -9-(4-(1-(吡 咯 啶 -1- 基 ) 乙 基 ) 苯 基 ) 嘧 吩 并 [2,3-c] 喹 吡 - 4(5H)-酮 鹼 酸 鹼</p>
217		<p>9-(4- 氨 基 -3- 細 基 苯 基 )-8- 羟 基 嘧 吩 并 [2,3-c] 喹 吡 - 4(5H)-酮 鹼 酸 鹼</p>
218		<p>N-(2- 甲 氧 基 -4-(8- 甲 氧 基 -4-側 氧 基 -4,5-二 氧 嘍 吩 并 [2,3-c] 喹 吡 -9- 基 ) 苟 基 ) 甲 烷 磺 鹼 肽</p>
219		<p>9-(3,5- 二 氟 -4- 細 基 苟 基 )-8- 甲 氧 基 嘧 吩 并 [2,3-c] 喹 吡 - 4(5H)-酮</p>
220		<p>N-(2- 細 基 -4-(8- 細 基 -4-側 氧 基 -4,5-二 氧 嘍 吩 并 [2,3-c] 喹 吡 -9- 基 ) 苟 基 ) 甲 烷 磺 鹼 肽</p>

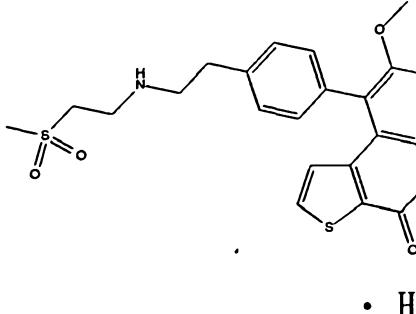
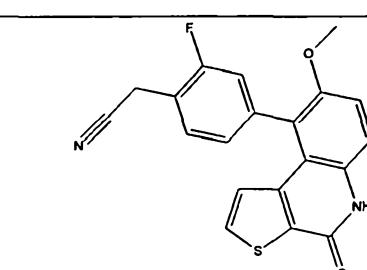
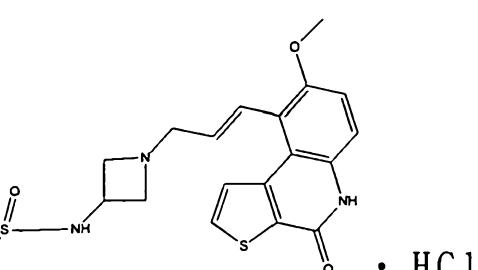
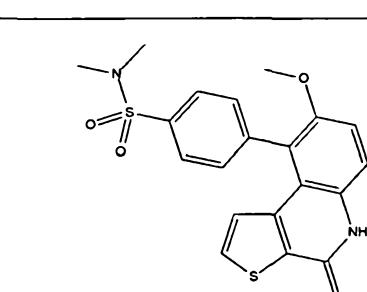
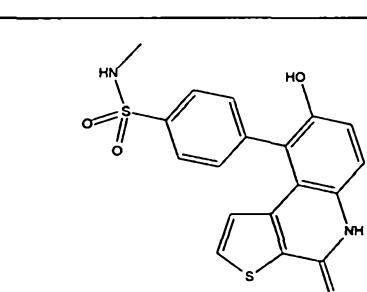
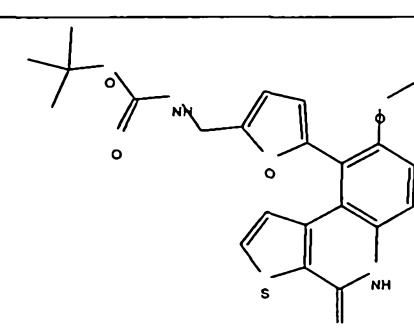
221		9-((4-((4-(胺基甲基)哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽
222		9-((4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
223		9-(3,5-二氟-4-羥基苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
224		6-氟-8-甲氧基-9-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
225		9-((4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-6-氟-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

226		9-((4-((二乙基胺基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
227.		(E)-9-(3-(3-羥基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
228		(E)-8-羥基-9-(3-(3-羥基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
229		8-羥基-9-((4-((異丙基胺基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
230		(E)-9-(3-(3-胺基三亞甲亞胺-1-基)丙-1-烯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽
231		(E)-8-甲氧基-9-(3-(2-(甲基磺醯基)乙基胺基)丙-1-烯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

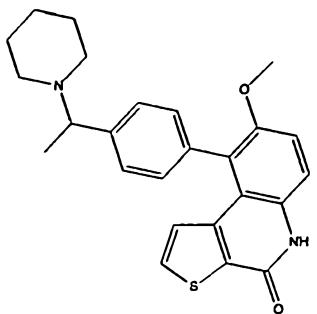
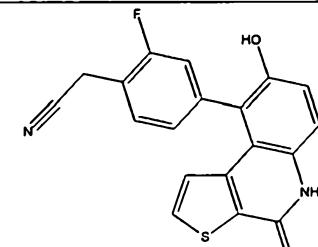
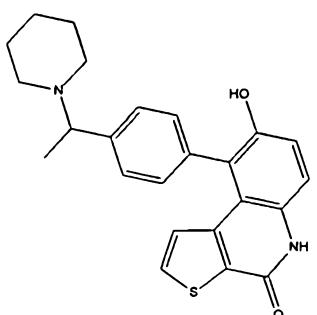
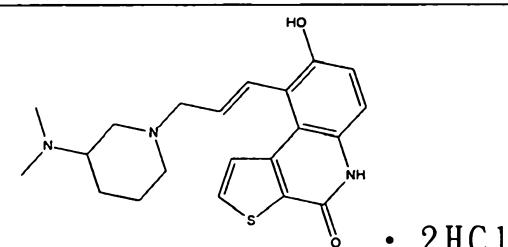
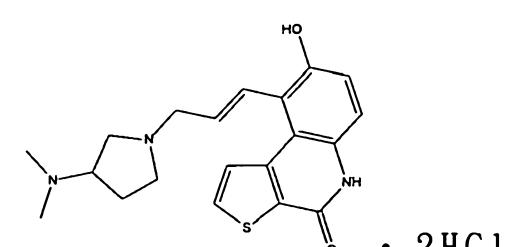
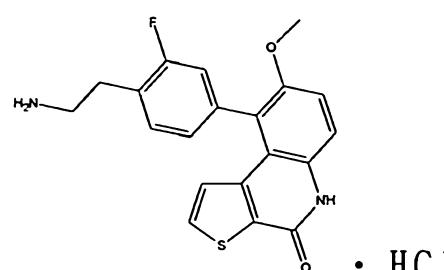
232	 • HCl	(S)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮鹽酸鹽
233	 • HCl	(S)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮鹽酸鹽
234	 • HCl	8-羥基-9-(5-羥基-2-甲基-1H-環戊[c]噁唑-4(5H)-酮鹽酸鹽
235		9-(4-((4-(4-胺基甲基)哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
236	 • HCl	8-甲基-9-(4-(1-(2-(甲基磺醯基)乙基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮鹽酸鹽

237		9-((4-((3-胺基吡咯啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽
238		(E)-9-((3-(3-胺基三亞甲亞胺-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽
239		(E)-9-((3-(乙基胺基)丙-1-烯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
240		9-((4-((3-胺基哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽
241		9-((4-((3-胺基吡咯啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽

242		9-((4-((3-胺基哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽 • 2HCl
243		8-羥基-9-((4-(1-(2-(甲基磺醯基)乙基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽 • HCl
244		(E)-9-(3-(3-胺基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽 • 2HCl
245		(E)-9-(3-(3-胺基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽 • 2HCl
246		(E)-9-(3-(3-胺基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽 • 2HCl
247		(E)-8-羥基-9-((3-(2-(甲基磺醯基)乙基胺基)丙-1-烯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽 • HCl

248		8-甲氧基 -9-(4-(2-(2-(甲基 磺醯基)乙基胺基)乙 基)苯基) 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮鹽酸鹽
249		2-(2-氟-4-(8-甲 氧基-4,5-二氫 噻吩并[2,3-c]喹啉-9- 基) 苯基)乙腈
250		(E)-N-(1-(3-(8-甲 氧基-4-側 氫-4,5-二氫 噻吩并[2,3-c]喹啉-9- 基)all基)三亞甲亞胺 -3-基)甲烷磺醯胺鹽酸 鹽
251		4-(8-甲 氧基-4-側 氫-4,5-二氫 噻吩并[2,3-c]喹啉-9- 基)-N,N- 二甲基苯磺醯胺
252		4-(8-羟基-4-側 氫-4,5-二氫 噻吩并[2,3-c]喹啉-9- 基)-N-甲基苯磺醯胺
253		第三丁基(5-(8-甲 氧基-4-側 氫-4,5-二氫 噻吩并[2,3-c]喹啉-9- 基)呋喃-2-基)甲基胺 基甲酸酯

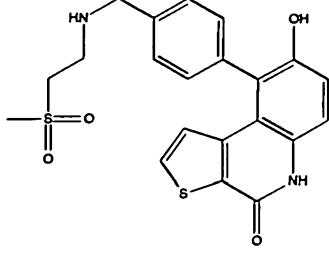
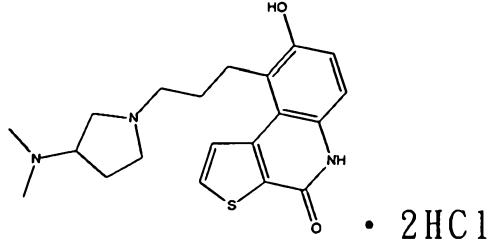
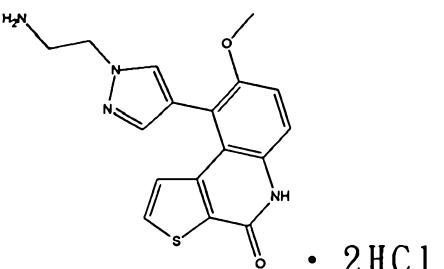
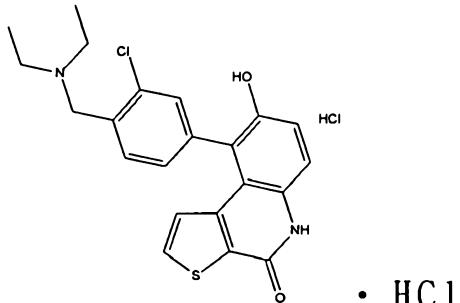
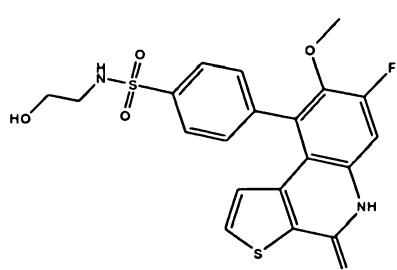
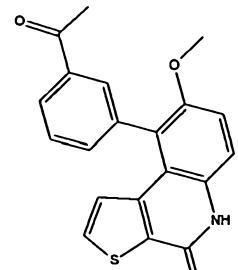
254		N-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-甲基苯基)甲烷磺醯胺
255		N-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-甲基苯基)甲烷磺醯胺
256		9-(4-(胺基甲基)苯基)-6-氟-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
257		9-(4-(胺基甲基)苯基)-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
258		6-氟-8-羥基-9-(1,2,3,6-四氫吡啶-1-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
259		9-(4-((二乙基胺基)甲基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

260		8-甲氧基-9-(4-(1-(哌啶-1-基) 乙基)苯基)噻吩并 [2,3-c]噁唑- 4(5H)-酮鹽酸鹽
261		2-(2-氟-4-(8-羟基-4- 側氨基-4,5- 二氢噻吩并[2,3-c]噁 唑-9-基) 苯基)乙腈
262		8-羟基-9-(4-(1-(哌啶-1-基) 乙基)苯基)噻吩并 [2,3-c]噁唑- 4(5H)-酮鹽酸鹽
263		(E)-9-(3-(3-(二甲基 氨基)哌啶-1-基)丙-1- 烯基)-8-羟基噻吩并 [2,3-c]噁唑-4(5H)-酮 二鹽酸鹽
264		(E)-9-(3-(3-(二甲基 氨基)哌啶-1-基)丙-1- 烯基)-8- 羟基噻吩并[2,3-c]噁 唑- 4(5H)-酮二鹽酸鹽
265		9-(4-(2-氨基乙基)-3- 氟苯基)-8-甲氧基噻吩 并[2,3-c]噁唑- 4(5H)-酮鹽酸鹽

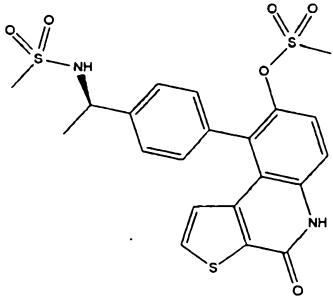
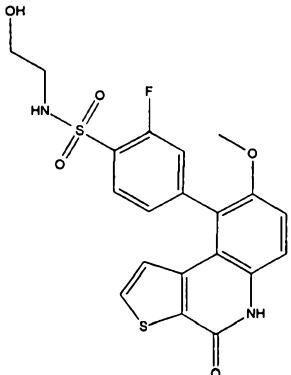
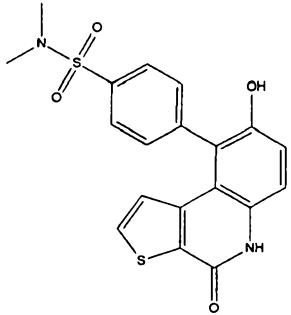
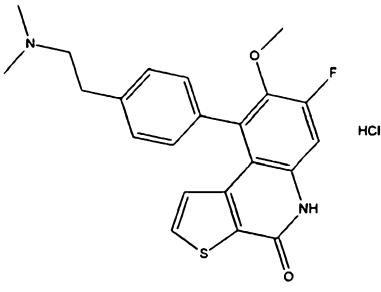
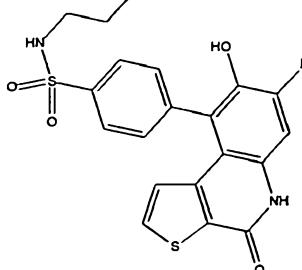
266		9-(5-(胺基甲基)噻吩-2-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
267		9-(4-((乙基氨基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
268		(E)-9-(3-(4-氨基哌啶-1-基)-丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽
269		9-(4-((乙基氨基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
270		9-(4-(胺基甲基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
271		9-(3-氯-4-((二乙基氨基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

272		(R)-9-(4-(1-(二甲基 胺基)乙基) 苯基)-8-羟基噻吩并 [2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
273		9-(4-(3-氨基丙基) 苯基)-8- 羟基噻吩并[2,3-c]喹 啉- 4(5H)-酮鹽酸鹽
274		(R)-9-(4-(1-胺基乙 基)苯基)-8- 甲氧基噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
275		(R)-9-(4-(1-胺基乙 基)苯基)-8- 羟基噻吩并[2,3-c]喹 啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
276		9-(4-(2-胺基乙基)-3- 氟苯基)-8-羟基噻吩并 [2,3-c]喹啉- 4(5H)-酮鹽酸鹽
277		9-(4-(1-胺基-2-甲基 丙-2-基) 苯基)-8-羟基噻吩并 [2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

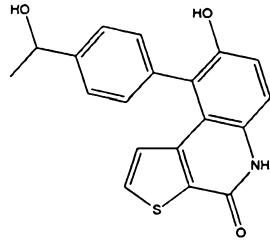
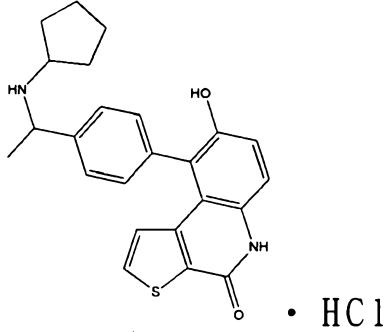
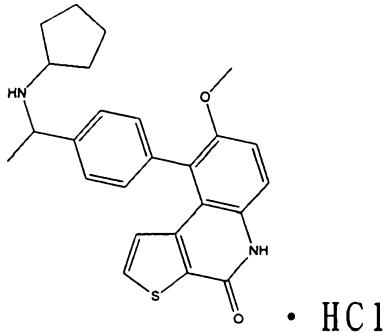
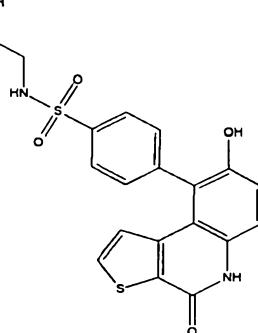
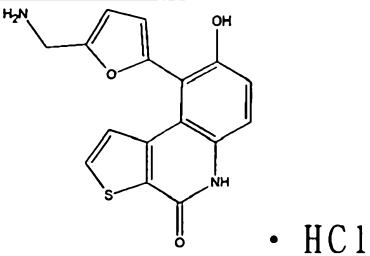
278	<p>• HCl</p>	9-(3-氟-4-((3-羥基吡咯啶-1-基)甲基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
279	<p>• HCl</p>	9-(3-氟-4-((3-羥基吡咯啶-1-基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
280		4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2,2,2-三氟乙基)苯磺醯胺
281		4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2,2,2-三氟乙基)苯磺醯胺
282		N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺

283		8-羟基-9-((2-(甲基磺醯基)乙基胺基)甲基)苯基) 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
284		9-((3-(3-(二甲基氨基)丙基)丙基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽
285		9-((1-(2-氨基乙基)-1H-吡唑-4-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽
286		9-((3-氯-4-((二乙基氨基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
287		4-(7-氟-8-甲氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺醯胺
288		9-(3-乙醯基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

296		9-(4-乙醯基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
297		N-(2-溴乙基)-2-氟-4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
298		9-(3-(3-(二甲基胺基)丙基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二鹽酸鹽
299		N-(2-氟-4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基)甲烷磺醯胺
300		9-(3-氟-4-(2-(甲基磺醯胺基)乙基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基甲烷磺酸酯
301		(R)-N-(1-(4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺醯胺

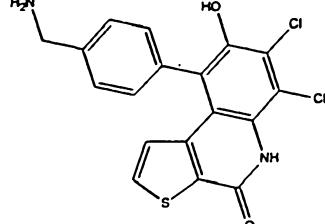
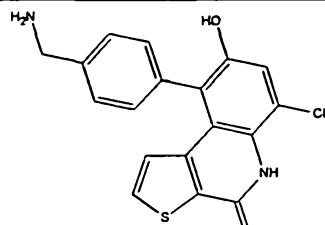
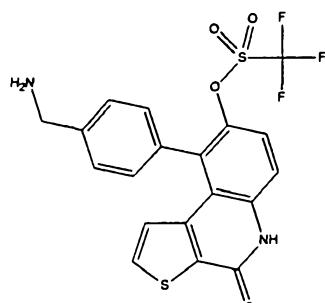
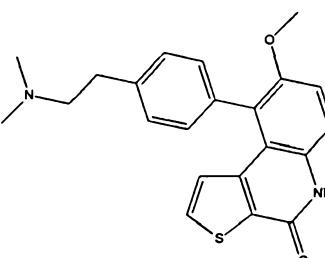
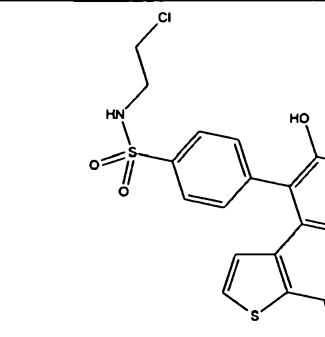
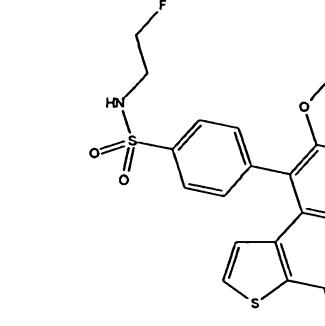
302		(R)-9-(4-(1-(甲基磺 醯胺基) 乙基)苯基)-4-側氧基 -4,5-二氫 噻吩并[2,3-c]噁唑-8- 基甲烷磺酸酯
303		2-氟-N-(2-羥基乙 基)-4-(8- 甲氧基-4-側氧基-4,5- 二氫噻吩并[2,3-c]噁 唑-9-基)苯 磺醯胺
304		4-(8-羥基-4-側氧基 -4,5-二氫 噻吩并[2,3-c]噁唑-9- 基)-N,N- 二甲基苯磺醯胺
305		9-(4-(2-(二甲基胺基) 乙基)苯基)-7-氟-8-甲 氧基噻吩并[2,3-c] 噁唑-4(5H)-酮鹽酸鹽
306		N-(2-溴乙基)-4-(7-氟 -8- 羥基-4-側氧基-4,5-二 氫噻吩并[2,3-c]噁唑- 9-基)苯磺醯胺

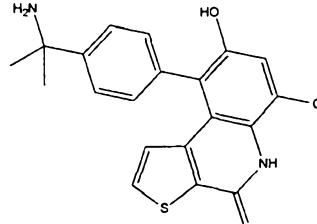
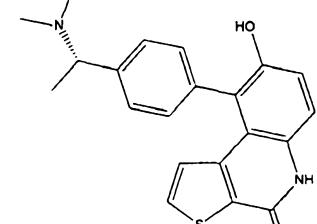
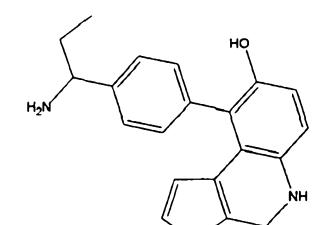
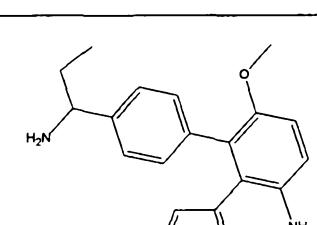
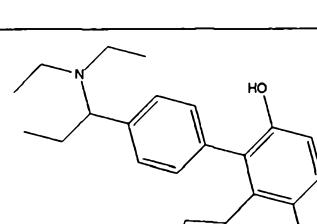
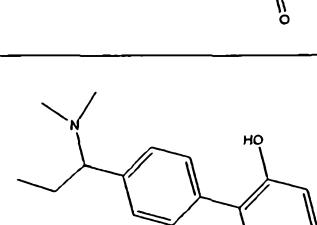
307		4-(7-氟-8-羟基-4-側 氧基-4,5- 二氫 噻吩并[2,3-c]喹 啉-9-基)-N-(2-羟基乙 基)苯 磺醯胺
308		9-(4-(1-(二甲氨基)- 2-甲基丙-2-基)苯 基)-8-羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮鹽酸鹽
309		N-(2-氯-4-(8-甲氧基 -4-側氧基-4,5-二氫 噻吩并[2,3-c]喹啉-9- 基) 苄基)-N-甲基甲烷 磺醯胺
310		4-(8-羟基-4-側 氧基-4,5-二氫 噻吩并[2,3-c]喹啉-9- 基)-N-(2- 甲氧基乙基)苯磺醯胺
311		(E)-3-(8-甲氧基-4-側 氧基-4,5-二氫 噻吩并[2,3-c]喹啉-9- 基)-2-甲基 丙烯腈
312		N-(2-氟-4-(8-甲氧基 -4-側氧基-4,5-二氫 噻吩并[2,3-c]喹啉-9- 基) 苯乙基)-N-甲烷磺醯胺

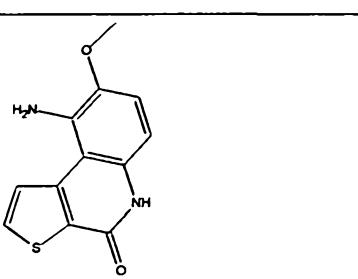
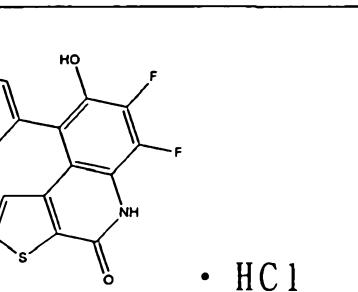
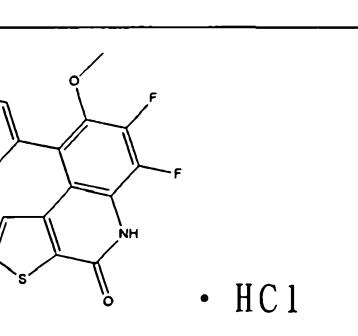
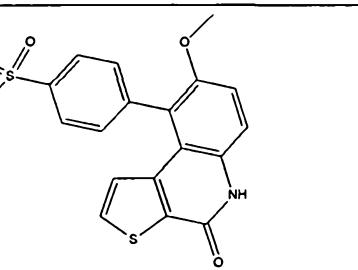
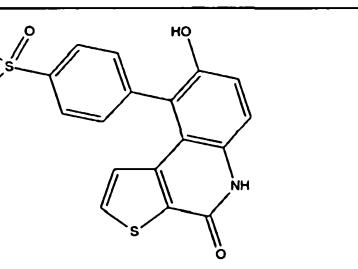
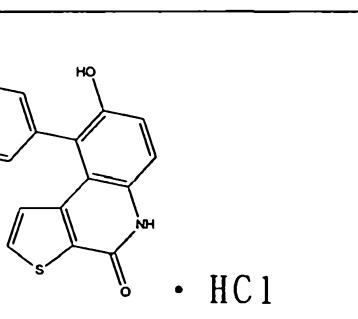
313		8-羟基-9-(4-(1-羟基乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
314		9-(4-(1-(环戊基氨基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮盐酸盐
315		9-(4-(1-(环戊基氨基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮盐酸盐
316		4-(8-羟基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]唑啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺酰胺
317		9-(5-(氨基甲基)-2-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮盐酸盐

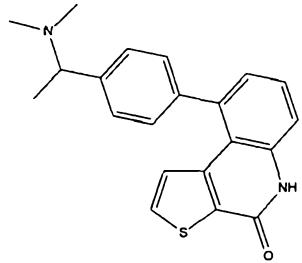
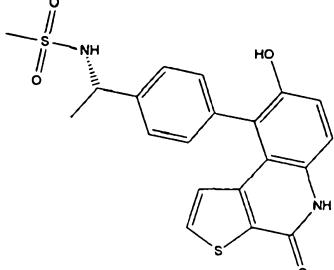
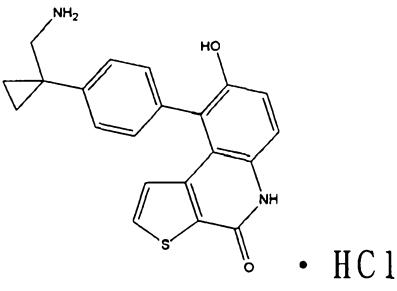
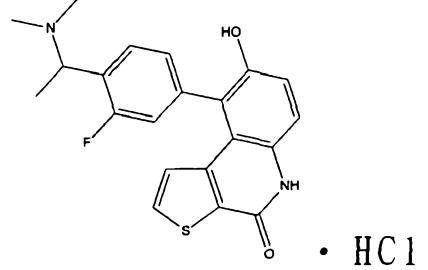
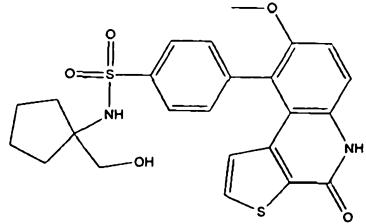
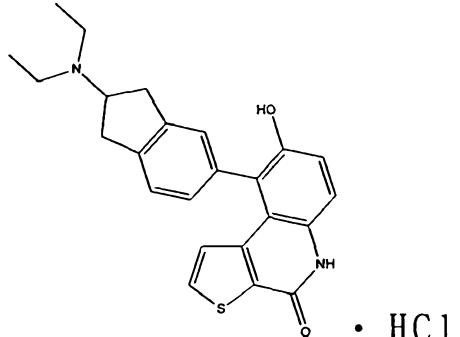
318		9-(3-氯-4-((甲基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
319		9-(4-(2-氨基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
320		N-(3-羟基丙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
321		2-氟-4-(8-羟基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺醯胺
322		4-(8-羟基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(3-羟基丙基)苯磺醯胺

323		N-(3-溴丙基)-4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
324		2-氟-4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-甲氧基乙基)苯磺醯胺
325		9-(3-氯-2-(甲基胺基)甲基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
326		9-(4-(胺基甲基)苯基)-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8-睛鹽酸鹽
327		9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

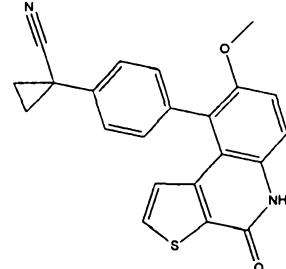
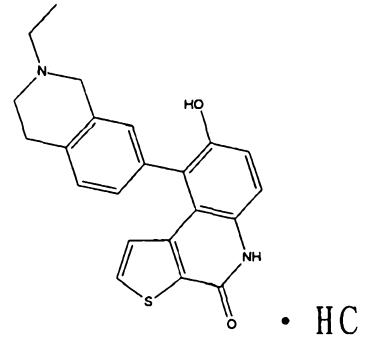
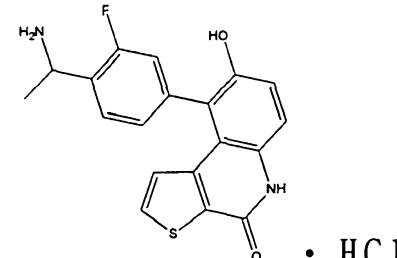
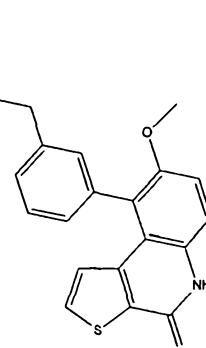
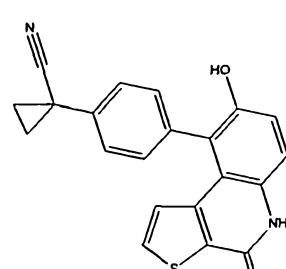
328		9-(4-(胺基甲基)苯基)-6,7-二氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽 • HCl
329		9-(4-(胺基甲基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽 • HCl
330		9-(4-(胺基甲基)苯基)-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基三氟甲烷磺酸酯鹽酸鹽 • HCl
331		9-(4-(2-(二甲基氨基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽 • HCl
332		N-(2-氯乙基)-4-(8-羟基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
333		N-(2-氟乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺

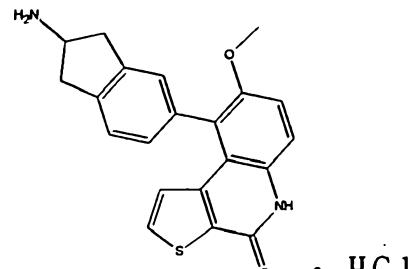
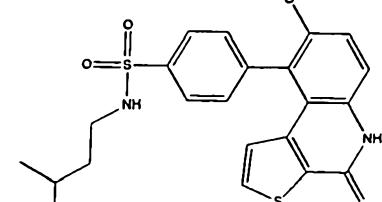
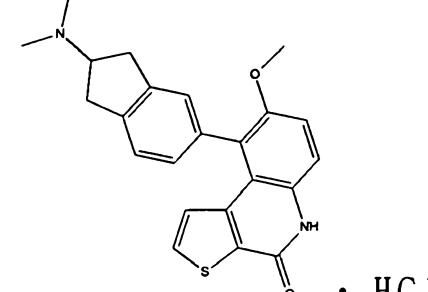
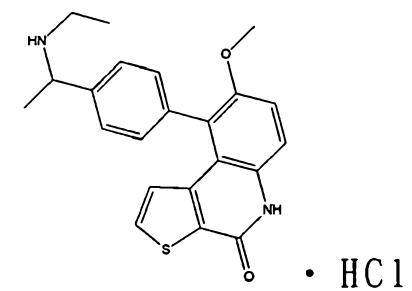
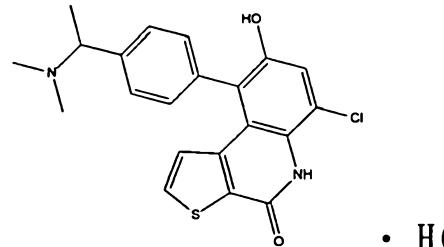
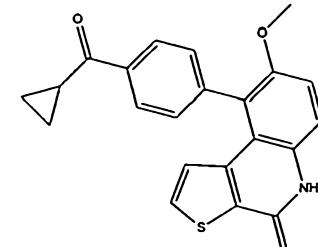
334	 · HCl	9-(4-(2-胺基丙-2-基) 苯基)-6-氯-8-羥基噻 吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
335	 · HCl	(S)-9-(4-(1-(二甲基 胺基)乙基) 苯基)-8-羥基噻吩并 [2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
336	 · HCl	9-(4-(1-胺基丙基)苯 基)-8- 羥基噻吩并[2,3-c]喹 啉- 4(5H)-酮鹽酸鹽
337	 · HCl	9-(4-(1-胺基丙基)苯 基)-8- 甲氧基噻吩并[2,3-c] 喹啉- 4(5H)-酮鹽酸鹽
338	 · HCl	9-(4-(1-(二乙基 氨基)丙基) 苯基)-8-羥基噻 吩并[2,3-c] 喹啉- 4(5H)-酮鹽酸鹽
339	 · HCl	9-(4-(1-(二甲基 胺基) 丙基) 苯基)-8-羥基噻吩并 [2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

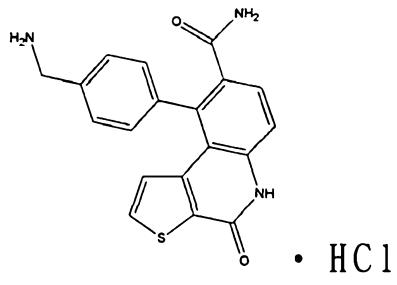
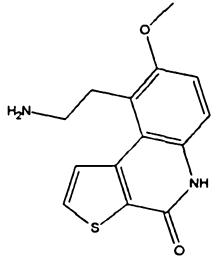
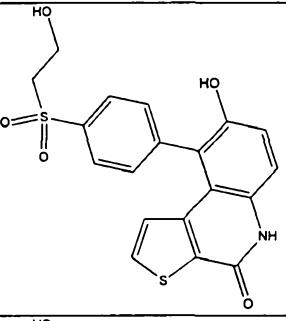
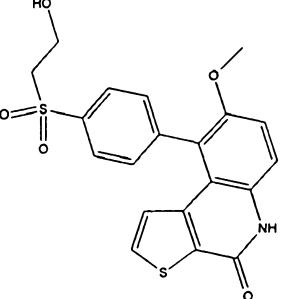
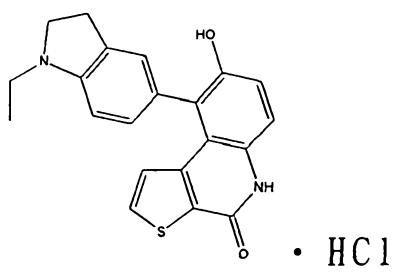
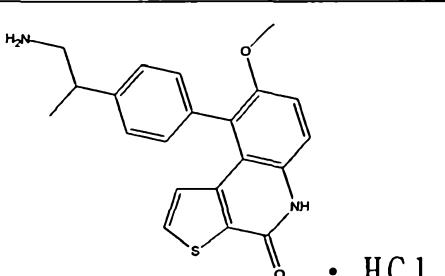
340		9-氨基-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
341		9-(4-(1-(二甲基氨基)乙基)苯基)-6,7-二氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
342		9-(4-(1-(二甲基氨基)乙基)苯基)-6,7-二氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
343		N-環丙基-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
344		N-環丙基-4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
345		9-(2-氨基-2,3-二氫-1H-茚-5-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

346		9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮
347		(S)-N-(1-(4-(8-羥基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺醯胺
348		9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
349		9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
350		N-(1-(羥基甲基)環戊基)-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁啉-9-基)苯磺醯胺
351		9-(2-(二乙基胺基)-2,3-二氫-1H-茚-5-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

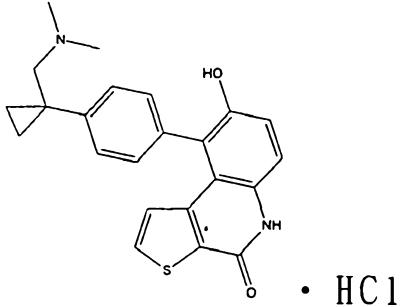
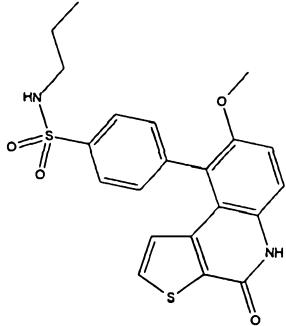
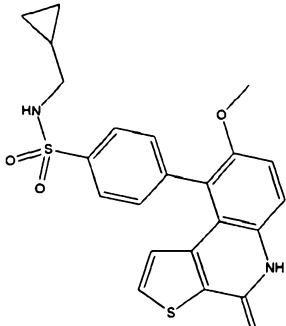
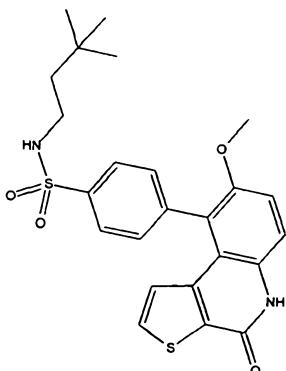
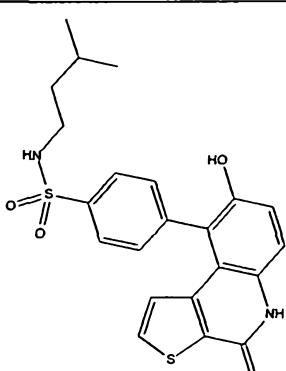
352		9-(2-(二甲基胺基)-2,3-二氫-1H-茚-5-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
353		8-羥基-9-(1,2,3,4-四氫異噠啉-7-基)噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
354		8-甲氧基-9-(1,2,3,4-四氫異噠啉-7-基)噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
355		3-(3-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮-9-基)苯基)丙腈
356		9-(4-(1-(二乙基氨基)乙基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

357		1-(4-(8-甲氧基-4-側 氧基-4,5-二氳 噻吩并[2,3-c]噁啉-9- 基)苯基) 環丙腈
358		9-(2-乙基-1,2,3,4-四 氳異 噁啉-7-基)-8-羥基噻 吩并[2,3-c]噁啉 -4(5H)-酮鹽酸鹽
359		9-(4-(1-胺基乙基)-3- 氟苯基)-8-羥基噻吩并 [2,3-c]噁啉- 4(5H)-酮鹽酸鹽
360		3-(3-(8-甲氧基-4-側 氧基-4,5-二氳 噻吩并[2,3-c]噁啉-9- 基)苯基) 丙腈
361		1-(4-(8-羥基-4-側 氧基-4,5-二氳 噻吩并[2,3-c]噁啉-9- 基)苯基) 環丙腈

362		9-(2-氨基-2,3-二氫-1H-茚-5-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
363		N-異戊基-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
364		9-(2-(二甲基氨基)-2,3-二氫-1H-茚-5-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
365		9-(4-(1-(乙基氨基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
366		6-氯-9-(4-(1-(二甲基氨基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
367		9-(4-(環丙烷羰基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

368		9-(4-(胺基甲基)苯基)-4-側氨基-4,5-二 氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8- 羧醯胺鹽酸鹽
369		9-(2-氨基乙基)-8-甲 氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
370		8-羟基-9-(4-(2-羟基乙基磺酰基)苯基)噻吩 并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
371		9-(4-(2-羟基乙基磺酰基)苯基)-8-甲 氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
372		9-(1-乙基吲哚啉-5- 基)-8-羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
373		9-(4-(1-氨基丙-2-基) 苯基)-8-甲 氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

374	<p>• HCl</p>	8-羟基-9-(2-甲基-1,2,3,4-四 氫異噁啉-7-基)噻吩并 [2,3-c]噁啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
375	<p>• HCl</p>	9-(4-(1-氨基乙基)-3- 氟苯基)-8-甲氧基噻吩 并[2,3-c]噁啉- 4(5H)-酮鹽酸鹽
376	<p>• HCl</p>	8-羟基-9-(1-甲基吲哚 -5-基)噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽
377	<p>• HCl</p>	8-羟基-9-(吲哚-5-基)噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
378	<p>• HCl</p>	9-(吲哚-5-基)-8-甲 氧基噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

379		9-(4-(1-((二甲基胺基)甲基)環丙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
380		4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-丙基苯磺醯胺
381		N-(環丙基甲基)-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
382		N-(3,3-二甲基丁基)-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
383		4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-異戊基苯磺醯胺

384		N-(3,3-二甲基丁基)-4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
385		9-(4-(1-(乙基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
386		3-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-3-側氧基丙腈
387		(E)-9-(2-乙氧基乙烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
388		N-(1-(4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)乙醯胺
389		4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(3,3,3-三氟丙基)苯磺醯胺

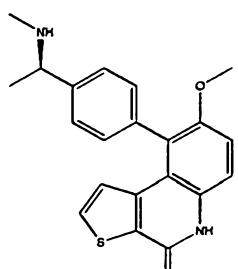
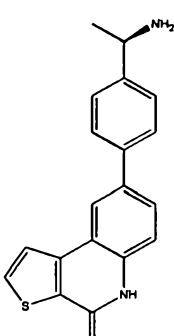
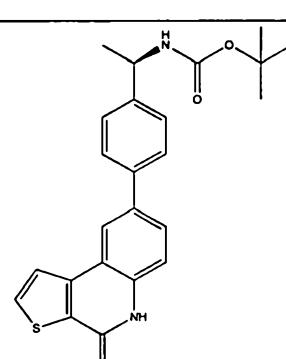
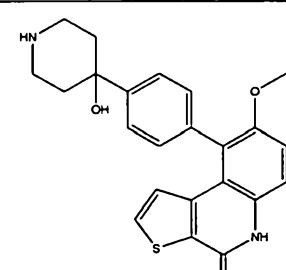
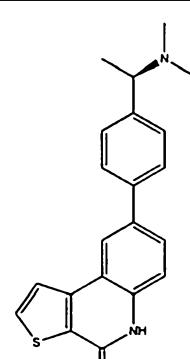
390		4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳 噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(1- (羥基甲基)環戊基)苯磺醯胺
391		N-(2,2-二氟乙基)-4-(8-甲氧基-4-側 氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯磺醯胺

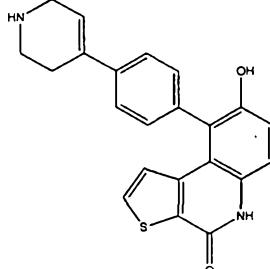
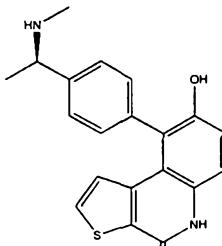
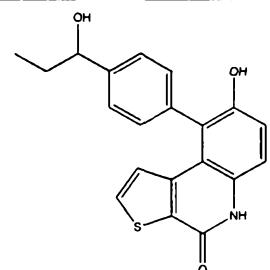
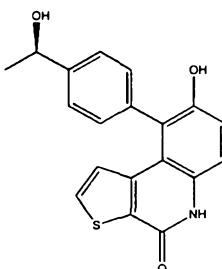
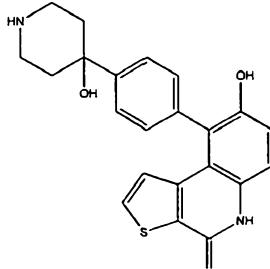
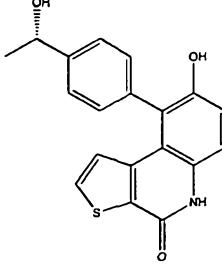
表 1-2(實施例 1031-1438)

編號	分子	名稱
1031		8-甲氧基-9-(4-(1- 甲氧基乙基)苯基) 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1032		9-(4-(1-氨基乙基) 苯基)-6-溴-8-羥基 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1033		8-甲氧基- -9-(2-((哌啶-3-基 甲基)氨基)乙基)噻 吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮

1034		9-(2-((二甲基胺基)甲基)哌啶-1-基)乙基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1035		第 三 丁 基 4-((2-(8-甲氧基-4,5-二 氫噻吩并[2,3-c]唑 啉-9-基)乙基)胺 基)哌啶-1-羧酸酯
1036		8-甲氧基-9-(2-(哌 啶-4-基胺基)乙基) 噻吩并[2,3-c]唑啉 -4(5H)-酮
1037		4-(8-羟基-4-側 氧基-4,5-二氫噻 吩并[2,3-c]唑 啉-9-基)-N-(3,3,3-三 氟丙基)苯磺醯胺
1038		3H-吡咯并[2,3-c] 唑啉-4(5H)-酮
1039		9-(4-(1-胺基乙基) 苯基)-6-環丙基-8- 羥基噻吩并[2,3-c] 唑啉-4(5H)-酮

1040		9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羟基-4-側 氨基-4,5-二氢噻吩 并[2,3-c]噁唑-6- 睛
1041		9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-氯-8-羟基 噻吩并[2,3-c]噁唑 -4(5H)-酮
1042		8- 羟 基 -9-(2-(4-((甲基胺 基)甲基)哌啶-1- 基)乙基)噻吩并 [2,3-c] 噁 咪 -4(5H)-酮
1043		8- 甲 氧 基 -9-(2-(4-((甲基胺 基)甲基)哌啶-1- 基)乙基)噻吩并 [2,3-c] 噎 咪 -4(5H)-酮
1044		9-(2-(4-((二甲基 胺基)甲基)哌啶-1- 基)乙基)-8-羟基噻 吩并[2,3-c]噁唑 -4(5H)-酮
1045		9-(4-(1-羟基丙基) 苯基)-8-甲氧基噻 吩并[2,3-c]噁唑 -4(5H)-酮

1046		(R)-8- 甲 氧 基 -9-(4-(1-(甲基 基)乙基)苯基)噻 吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1047		(R)-8-(4-(1- 胺 基 乙基)苯基)噻吩并 [2,3-c] 喹啉 -4(5H)-酮
1048		(R)- 第 三 丁 基 (1-(4-(4- 側 氧 -4,5- 二 氢 噻 吩 并 [2,3-c] 喹啉 -8- 基 ) 苯基)乙基)氨基甲 酸 酯
1049		9-(4-(4- 羟 基 味 吡 -4- 基 )苯基)-8- 甲 氧 基 噻 吩 并 [2,3-c] 喹啉 -4(5H)-酮
1050		(R)-8-(4-(1-(二 甲 基 胺 基 )乙基)苯基) 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮

1051		8-羟基 -9-(4-(1,2,3,6-四 氢吡啶-4-基)苯基) 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1052		(R)-8-羟基 -9-(4-(1-(甲基胺 基)乙基)苯基)噻吩 并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1053		8-羟基-9-(4-(1-羟 基丙基)苯基)噻吩 并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1054		(R)-8-羟基 -9-(4-(1-羟基乙 基)苯基)噻吩 并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1055		8-羟基-9-(4-(4-羟 基哌啶-4-基)苯基) 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1056		(S)-8-羟基 -9-(4-(1-羟基乙 基)苯基)噻吩 并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮

1057		N-(1-羟基丙-2-基)-4-(8-甲氧基-4,5-二側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
1058		9-(4-(羟基(噻唑-2-基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1059		9-(6-(1-氨基乙基)吡啶-3-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1060		9-(4-(4-羟基丁基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1061		2-(4-(8-羟基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙酰胺
1062		N-(1-溴丙-2-基)-4-(8-羟基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺

1063		8-羟基-9-(4-(羟基 (噻唑-2-基)甲基) 苯基)噻吩并 [2,3-c] 喹啉 -4(5H)-酮
1064		(S)-8-甲氧基 -9-(4-(1-(甲基胺 基)乙基)苯基)噻吩 并 [2,3-c] 喹啉 -4(5H)-酮
1065		9-(6-(1-(二乙基胺 基)乙基)吡啶-3- 基)-8-羟基噻吩并 [2,3-c] 喹啉 -4(5H)-酮
1066		9-(4-(1-氨基乙基) 苯基)-8-羟基-6-甲 基噻吩并 [2,3-c] 喹 啉 -4(5H)-酮
1067		9-(6-(1-氨基乙基) 吡啶-3-基)-8-甲氧 基噻吩并 [2,3-c] 喹 啉 -4(5H)-酮
1068		8-羟基-9-(4-(4-羟 基丁基)苯基)噻吩 并 [2,3-c] 喹啉 -4(5H)-酮

1069		9-(4-(3-氨基丙基)-1-羟基丙基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1070		9-(6-(1-(二甲基胺基)乙基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1071		9-(6-(1-(二甲基胺基)乙基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1072		4-((4-(8-甲氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-1H-吡唑-1-基)甲基)苯甲腈
1073		8-氨基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1074		9-(4-((1H-吡唑-1-基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1075		9-(6-(1-氨基乙基) 吡啶-3-基)-8-甲氧 基噻吩并[2,3-c]喹 啉-4(5H)-酮
1076		9-(4-(1-氨基乙基) 苯基)-4-側 氧 基 -4,5-二氫 噻 吩 并 [2,3-c] 喹 吡 -8- 基 二甲基氨基甲酸酯
1077		9-(4-(1-氨基乙基) 苯基)-4-側 氧 基 -4,5-二氫 噻 吩 并 [2,3-c] 喹 吡 -8- 基 異丙基 碳酸酯
1078		9-(4-((1H-咪唑-1- 基)甲基)苯基)-8- 甲氧基 噻 吩 并 [2,3-c] 喹 吡 -4(5H)-酮
1079		N-(2- 溴 丙 基)-4-(8-羥 基-4- 側 氧 基-4,5-二氫 噻 吩 并 [2,3-c] 喹 吡 -9-基)苯 磺 鹽 胺
1080		(R)-9-(4-(1- 氨 基 乙 基)苯 基)-6,7-二 氯 -8-羥 基 噻 吩 并 [2,3-c] 喹 吡 -4(5H)-酮

1081		(R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]唑啉并[4(5H)-酮]
1082		(S)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]唑啉并[4(5H)-酮]
1083		9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-4-側羟基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]唑啉-8-基二乙基氨基甲酸酯
1084		4-(8-羟基-4-側羟基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]唑啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)-N-甲基苯磺酰胺
1085		N-(2-羟基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側羟基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]唑啉-9-基)-N-甲基苯磺酰胺
1086		9-(4-((1H-吡唑-1-基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]唑啉并[4(5H)-酮]

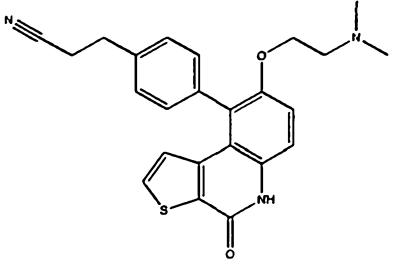
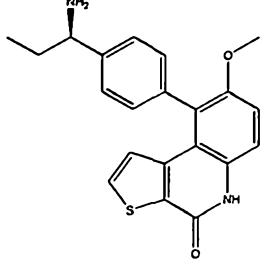
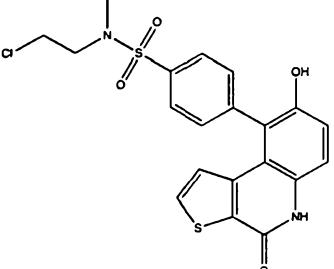
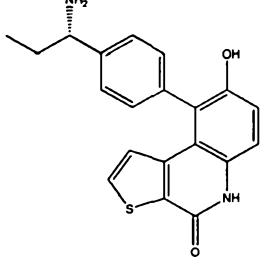
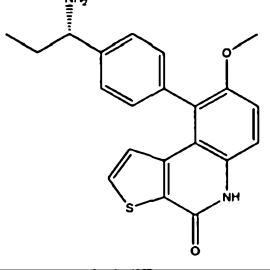
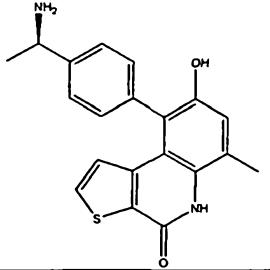
1087		(S)-6-氯-8-羟基 -9-(4-(1-甲基丙基) 基乙基)苯基)噻吩并 [2,3-c] 喹啉 -4(5H)-酮
1088		9-(4-(1-氨基丙基) 苯基)-6-氯-8-羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1089		9-(4-(1-氨基乙基) 苯基)-4-側氨基 -4,5-二氢噻吩并 [2,3-c] 喹啉-8-基 嗎啉-4-羧酸酯
1090		N-(2-羟基乙基) -4-(8-甲氧基 -4-側氨基 -2,3,4,5-四氫-1H- 環戊[c] 喹啉-9-基) 苯磺醯胺
1091		8-溴噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮
1092		9-(4-(2-(二甲基胺 基)丙基)苯基)-8- 羟基噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮

1093		9-(4-(2-胺基丙基) 苯基)-8-甲氧基噻 吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1094		N-(2-溴乙 基)-4-(8-羥基-4- 側氨基-2,3,4,5-四 氫-1H-環戊[c]喹啉 -9-基)苯磺醯胺
1095		9-(4-(2-胺基丙基) 苯基)-8-羥基噻吩 并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1096		8-甲氧基 -9-(1-(2-N-嗎啉基 乙基)-1H-吡唑-4- 基)噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮
1097		9-(4-(2-(二乙基胺 基)丙基)苯基)-8- 羥基噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮
1098		9-(4-(1-胺基乙基) 苯基)-8-羥基 -6-(羥基甲基)噻 吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮

1099		9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基乙酸酯。
1100		9-(1-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-1H-吡唑-4-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1101		9-(4-((1H-咪唑-1-基)甲基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1102		9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-(2-N-嗎啉基乙氧基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1103		8-羥基-9-(1-(2-N-嗎啉基乙基)-1H-吡唑-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1104		N-(2-(1H-吡唑-1-基)乙基)-4-(8-羥基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]imidazo[4,5-f]喹啉-9-基)苯磺醯胺

1105		8-羟基 -9-(4-(2,2,2-三氟 -1-羟基乙基)苯基) 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1106		9-(4-(2-氨基丙基) 苯基)-6-氯-8-羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1107		N-(2-(4-(8-羟基 -4-侧氨基-4,5-二 氢噻吩并[2,3-c]喹 啉-9-基)苯基)-2- 甲基丙基)甲烷磺酰 胺
1108		9-(4-(2-(二甲基 氨基)丙基)苯基)-8- 甲氧基噻吩并 [2,3-c] 喹啉 -4(5H)-酮
1109		9-(4-(1-氨基乙基) 苯基)噻吩并 [2,3-c] 喹啉 -4(5H)-酮
1110		9-(1-(1-(二甲基 氨基)丙-2-基)-1H-吡 唑-4-基)-8-羟基噻 吩并[2,3-c] 喹啉 -4(5H)-酮

1111		9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1112		9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1113		8-甲氧基-9-(4-(2,2,2-三氟-1-羟基乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1114		N-(2-溴乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-甲基苯磺酰胺
1115		N-(2-(1H-咪唑-1-基)乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺
1116		9-(4-(1-(氨基)环丙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1117		3-(4-(8-(2-(二甲基氨基)乙氧基)-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噃啉-9-基)苯基)丙腈
1118		(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噃啉-4(5H)-酮
1119		N-(2-氯乙基)-4-(8-羟基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噃啉-9-基)-N-甲基苯磺醯胺
1120		(S)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]噃啉-4(5H)-酮
1121		(S)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噃啉-4(5H)-酮
1122		(R)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]噃啉-4(5H)-酮

1123		(R)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1124		9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-4-羟基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-8-腈
1125		9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-(羟基甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1126		(R)-6-((4-(1-(二甲胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1127		(S)-9-(4-(1-(乙基氨基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1128		(S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1129		6-氯-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1130		9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-乙缺基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1131		(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1132		(R)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(甲基氨基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1133		9-(4-(2-氨基乙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1134		9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-(二氟甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1135		(R)-6-溴-8-羟基-9-(4-(甲基丙基)苯基)噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
1136		9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
1137		9-(4-(丁基苯基))-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
1138		9-(4-(丁基苯基))-8-羟基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
1139		N-(2-氯乙基)-4-(8-甲氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)苯磺醯胺
1140		9-(4-((3-溴吡咯啶-1-基)磺酰基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
1141		(S)-9-(4-(1-(甲基磺醯胺基)丙基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]噁唑-8-基甲烷磺酸酯

1142		9-(4-(2-胺基乙基) 苯基)-6-溴-8-羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1143		9-(4-(3-(二甲基胺基)-1-羟基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1144		N-(2-溴乙基)-4-(6-氯-8-羟基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
1145		N-(2-氯乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-2,3,4,5-四氢-1H-环戊[c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
1146		N-(2-溴乙基)-4-(5-乙基-8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
1147		(S)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

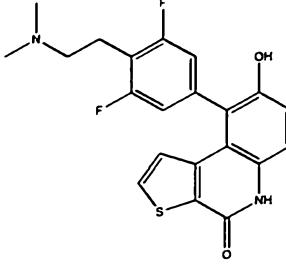
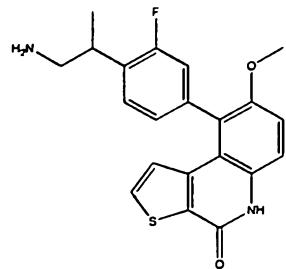
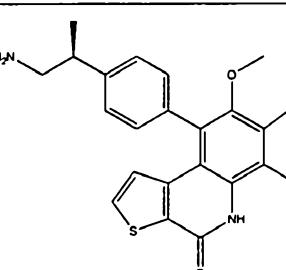
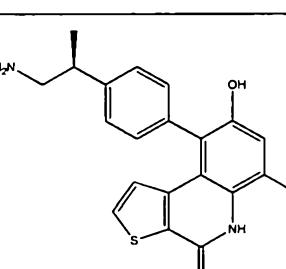
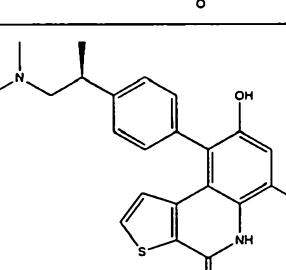
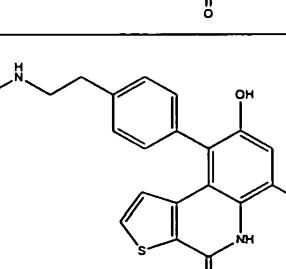
1148		(S)-8-羟基-9-(4-(甲基氨基)丙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1149		9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-(((2-羟基乙基)氨基)甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1150		(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1151		(R)-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1152		8-羟基-9-(4-戊基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1153		9-(4-(2-氨基乙基乙酰基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

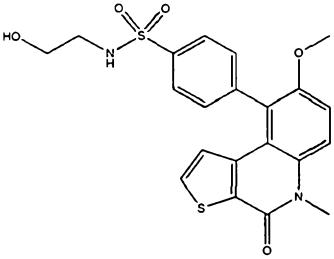
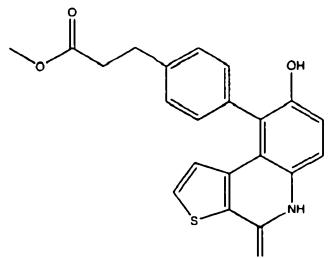
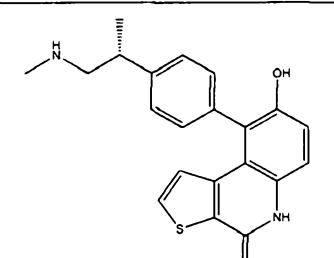
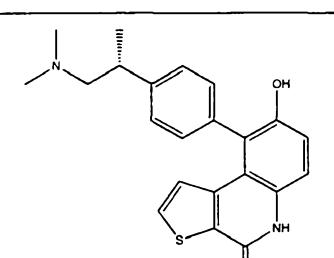
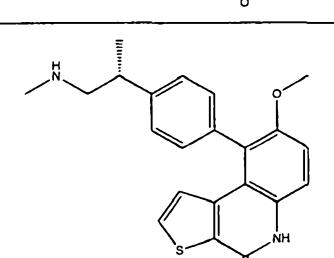
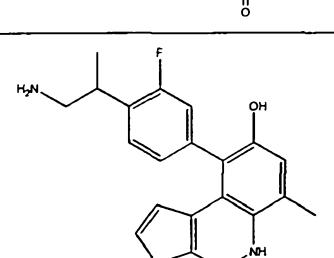
1154		(S)-6-氯-8-羟基-9-(4-(甲基丙基)苯基)噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1155		8-羟基-9-(4-(2-(甲基乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1156		8-甲氧基-9-(4-(2-(甲基乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1157		(R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1158		(R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1159		(R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮

1160		(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1161		(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1162		2-(4-(8-羟基-4-側 氧基-4,5-二氢噻吩 并[2,3-c]喹啉-9- 基)苯基)丁腈
1163		(S)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1164		(S)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1165		6-氯-8-羟基基- 9-(4-(2-(甲基胺 基)乙基)苯基)噻吩 并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1166		(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1167		9-(4-(2-胺基乙基)-3,5-二氟基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1168		(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1169		(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1170		6-氯-8-甲氧基-9-(4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1171		9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1172		(S)-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1173		6-溴-8-甲氧基-9-(4-(2-(甲基氨基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1174		9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1175		(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-6-氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1176		(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1177		9-(4-(2-氨基乙基)苯基)-3,5-二氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1178		9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)-3,5-二氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1179		9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1180		(S)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-6,7-二氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1181		(S)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-6-氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1182		(S)-6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1183		6-溴-8-羟基-9-(4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1185		N-(2-羟基乙基)-4-(8-甲氧基-5-甲基-4-側氧-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
1186		甲基 3-(4-(8-羟基-5-甲基-4-側氧-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙酸酯
1187		(R)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1188		(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1189		(R)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1190		9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

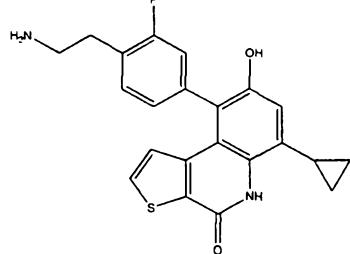
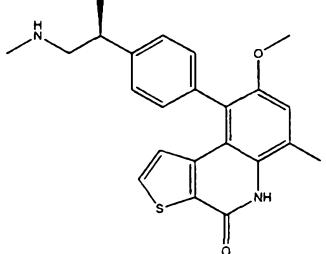
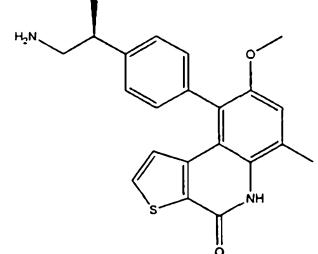
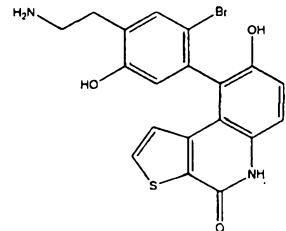
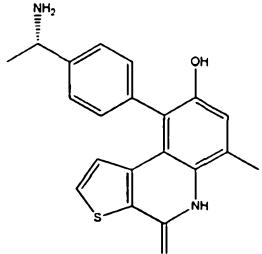
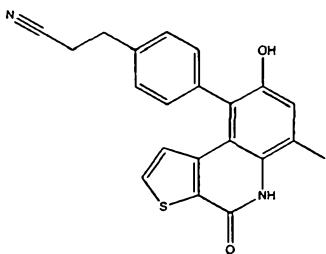
1191		9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1192		9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1193		9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1194		(S)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1195		(S)-6-氯-9-(4-(1-(二乙基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1196		(S)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1197		(S)-8-羟基 -9-(4-(1-(甲基胺 基)丙-2-基)苯基) 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1198		4-(8-羟基-5-甲基 -4-侧氨基-4,5-二 氢噻吩并[2,3-c]喹 啉-9-基)-N-(2-羟 基乙基)苯磺酰胺
1199		N-(2-溴乙 基)-4-(8-羟基-5- 甲基-4-侧氨基- 4,5-二氢噻吩并 [2,3-c]喹啉-9-基) 苯磺酰胺
1200		(R)-6- -9-(4-(1-(二甲 胺基)丙-2-基)苯 基)-8-甲氧基噻 吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1201		(R)-9-(4-(1-胺基 丙-2-基)苯基)-6- 氯-8-甲氧基噻吩并 [2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1202		9-(4-(1-胺基丁-2- 基)苯基)-8-甲氧基 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮

1203		9-(4-(2-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-2-(苯基磺醯基)噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
1204		N-(1-氯丙-2-基)-4-(8-羟基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]噁唑-2-基)苯磺醯胺
1205		N-(1-氯丙-2-基)-4-(8-甲氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]噁唑-2-基)苯磺醯胺
1206		9-(4-(2-胺基乙基)-3-羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
1207		9-(4-(2-胺基乙基)-3-甲氧基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
1208		9-(4-(2-胺基乙基)-2-氯-5-甲氧基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮

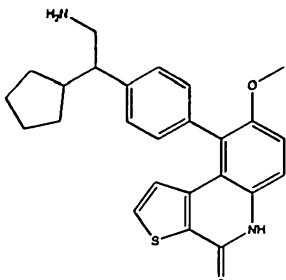
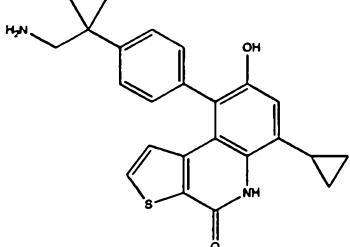
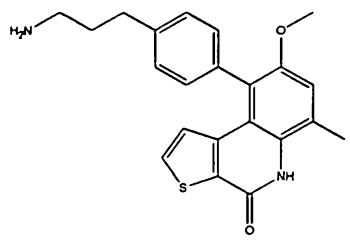
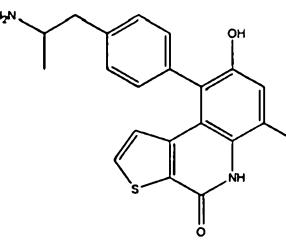
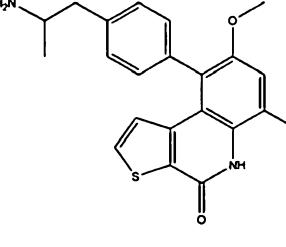
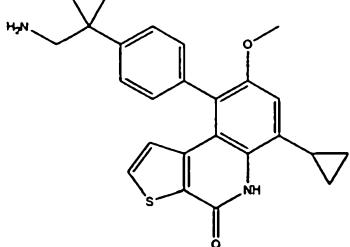
1209		9-(4-(3-(胺基)甲基)戊-3-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1210		(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-羟基-5,6-二甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1211		9-(4-(2-氨基乙基)-2-氯-5-羟基苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1212		9-(4-(氨基甲基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1213		9-(4-(2-氨基乙基)-3-氟苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1214		9-(4-(2-氨基乙基)-3-氟苯基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1215		(S)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1216		9-(4-(2-氨基乙基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1217		9-(4-(2-氨基乙基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1218		9-(4-(2-氨基乙基)-3-氟苯基)-6-氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1219		9-(4-(2-氨基乙基)-3-氟苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1220		9-(4-(2-氨基乙基)-3-氟苯基)-6-环丙基-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1221		9-(4-(2-氨基乙基)-3-氟苯基)-6-環丙基-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1222		(S)-8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(1-(甲氨基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1223		(S)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1224		9-(4-(2-氨基乙基)-2-溴-5-羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1225		(S)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1226		3-(4-(8-羥基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈

1227		9-(4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1228		9-(4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1229		2-(2-氟-4-(8-羟基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈
1230		6-环丙基-9-(4-(2-(二甲基氨基)乙基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1231		6-环丙基-9-(4-(2-(二甲基氨基)乙基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1232		(S)-9-(4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1233		(S)-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1234		9-(3-氟-4-(2-(甲基氨基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1235		9-(3-氟-4-(2-(甲基氨基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1236		9-(4-(2-氨基-1-环戊基乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1237		9-(4-(2-氨基-1,1-二环戊基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1238		3-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧羟基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]唑啉-9-基)苯基)丙腈

1239		9-(4-(2-氨基-1-环戊基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1240		9-(4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-环丙基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1241		9-(4-(3-氨基丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1242		9-(4-(2-氨基丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1243		9-(4-(2-氨基丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1244		9-(4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-环丙基-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1245		6-溴-9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1246		6-溴-9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1247		9-(4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1248		9-(4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1249		(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-8-腈
1250		(R)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-羟基-6-乙烯基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

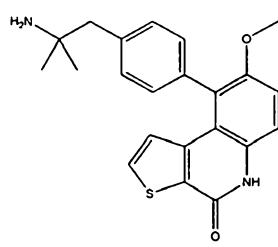
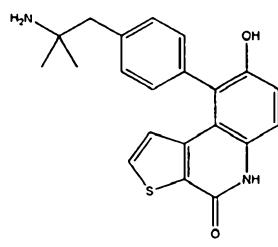
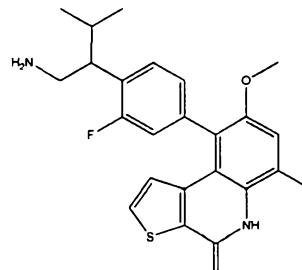
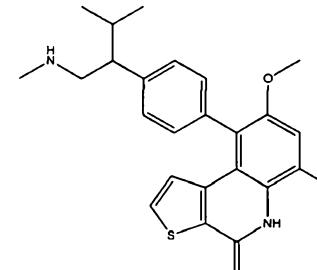
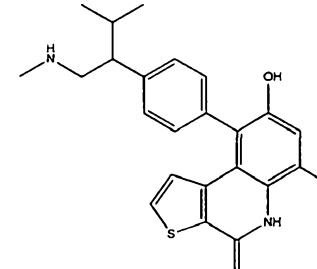
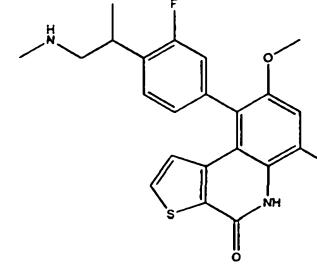
1251		9-(4-(1-(胺基)环丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1252		9-(4-(1-氨基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1253		9-(4-(1-氨基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1254		9-(4-(1-(胺基)环丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1255		(R)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-乙基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1256		(R)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-(二氟甲基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1257		9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1258		9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1259		6-溴-9-(4-(1-(二甲基胺基)-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羟基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1260		9-(4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1261		9-(4-(3-氨基丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1262		(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1263		9-(4-(2-氨基乙基)-3-氯苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1264		9-(4-(2-氨基乙基)-3-氯苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1265		(R)-8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1266		9-(4-(2-氨基丙基)苯基)-6-乙基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1267		(R)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-丁基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1268		9-(4-(2-氨基乙基)-3-氯苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1269		9-(4-(2-胺基丙基) 苯基)-6-乙基-8-甲 氧基噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮
1270		2-(4-(8-甲氧基-4- 側氨基-4,5-二氫噻 吩并[2,3-c]喹啉 -9-基)苯基)-2-(環 氧丙烷-3-基)乙腈
1271		9-(4-(1-胺基-2-甲 基丙-2-基)-3-氟苯 基)-8-羟基噻吩并 [2,3-c] 喹啉 -4(5H)-酮
1272		(R)-6-乙基-8-羟基 -9-(4-(1-(甲基胺 基)乙基)苯基)噻吩 并[2,3-c] 喹啉 -4(5H)-酮
1273		9-(4-(1-胺基丙-2- 基)-3-氟苯基)-8- 甲氧基-6-甲基噻吩 并[2,3-c] 喹啉 -4(5H)-酮
1274		9-(4-(1-胺基-3-甲 基丁-2-基)苯基)-8- 羟基-6-甲基 噻吩并[2,3-c] 喹啉 -4(5H)-酮

1275		9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1276		9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1277		9-(4-(1-氨基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1278		9-(4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1279		9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1280		9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1281		9-(4-(2-氨基-2-甲基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1282		9-(4-(2-氨基-2-甲基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1283		9-(4-(1-氨基-3-甲基丁-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1284		8-甲氧基-6-甲基-9-(3-甲基-1-(甲基氨基)丁-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1285		8-羟基-6-甲基-9-(3-甲基-1-(甲基氨基)丁-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1286		9-(3-氟-4-(1-(甲基氨基)丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1287		9-(4-(1-氨基-2-甲基丙基-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1288		9-(4-(1-氨基-3-甲基丁基-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1289		9-(4-(2-氨基-2-甲基丙基)苯基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1290		9-(4-(1-(氨基甲基)环丁基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1291		9-(4-(1-氨基丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1292		9-(4-(2-氨基-2-甲基丙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1293		9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1294		9-(3-氟-4-(3-甲基-1-(甲基胺基)丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1295		9-(4-(1-(二甲基胺基)-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1296		9-(4-(1-(二甲基胺基)-3-甲基丁-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1297		9-(4-(1-(胺基甲基)环丁基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1298		(R)-8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

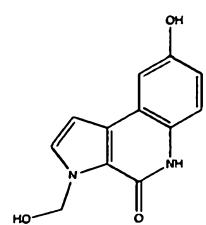
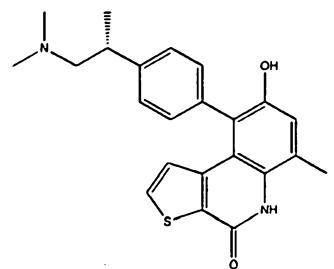
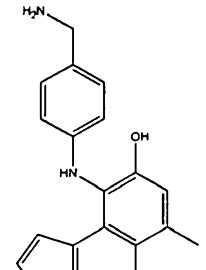
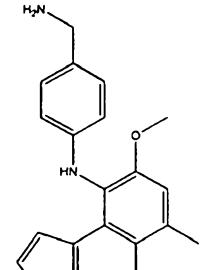
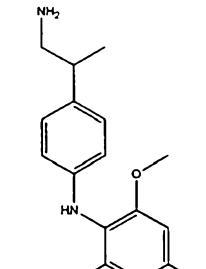
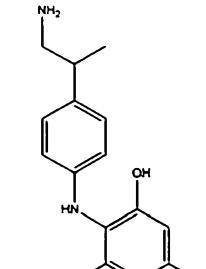
1299		9-(4-(1-(胺基) 基)環丁基)-甲苯 基)-8-甲氧基噻 并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1300		9-(4-(1-(胺基) 基)環丁基)-甲苯 基)-8-羟基噻吩并 [2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1301		8-甲氧基-6-甲基 -9-(4-(哌啶-3-基) 苯基)噻吩并 [2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1302		8-羟基-6-甲基 -9-(4-(哌啶-3-基) 苯基)噻吩并 [2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1303		(S)-9-(4-(1-(胺基) 丙-2-基)-3-氟苯 基)-8-羟基-6-甲基 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
1304		(S)-9-(4-(1-(胺基) 丙-2-基)-3-氟苯 基)-8-羟基-6-甲基 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮

1305		(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1306		(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1307		(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1308		8-甲氧基-3-甲基-3H-吡咯并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1309		9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1310		(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

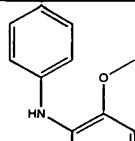


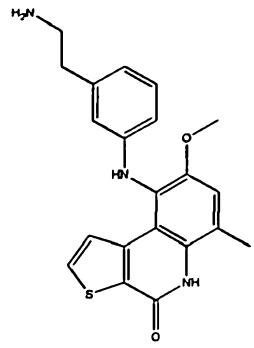
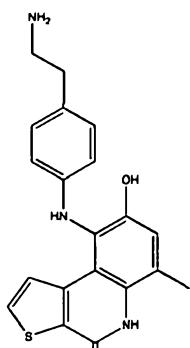
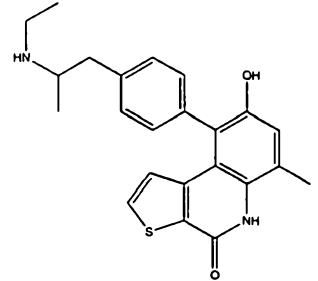
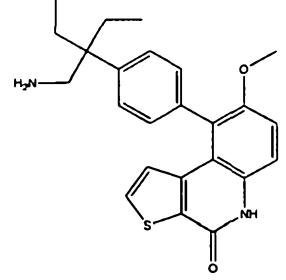
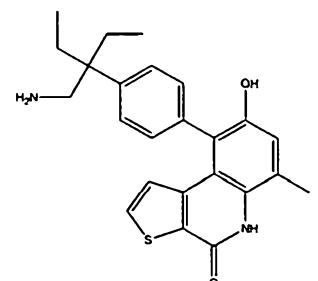
1311		(R)-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1312		9-(4-(1-氨基丁-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1313		8-羟基-3-甲基-3H-吡咯并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1314		9-氨基-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1315		(R)-9-(3-氟-4-(1-(甲基氨基)丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1316		(R)-9-(3-氟-4-(1-(甲基氨基)丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

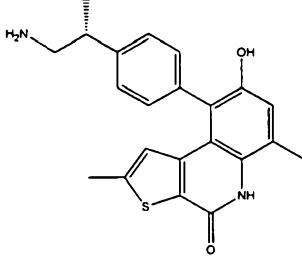
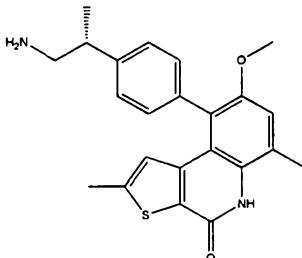
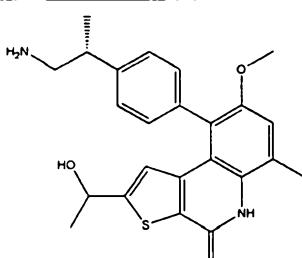
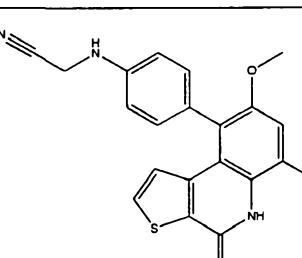
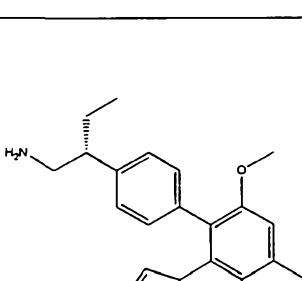
1317		(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1318		(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1319		(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1320		9-((4-(2-氨基乙基)苯基)氨基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1321		9-(4-(1-(氨基甲基)环丁基)苯基)-6-氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1322		(R)-1-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-3-甲基-3H-吡咯并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1323		8-羟基-3-(羟基甲基)-3H-吡咯并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1324		(R)-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1325		9-((4-(氨基甲基)苯基)氨基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1326		9-((4-(氨基甲基)苯基)氨基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1327		9-((4-(1-氨基丙-2-基)苯基)氨基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1328		9-((4-(1-氨基丙-2-基)苯基)氨基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1329		9-(4-(2-氨基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1330		9-(4-(2-氨基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1331		9-(4-(3-(氨基)丙-3-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1332		9-((R)-1-氨基丙-2-基)苯基)-8-羟基-2-(1-羟基乙基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1333		9-((R)-1-氨基丙-2-基)苯基)-2-(1-羟基乙基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1334		3-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]imidazo[4,5-H]quinoxalin-9-基)氨基)苯基丙腈



1335		9-((3-(2-氨基乙基)苯基)氨基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1336		9-((4-(2-氨基乙基)苯基)氨基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1337		9-(4-(2-(乙基氨基)丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1338		9-(4-(3-(氨基甲基)戊-3-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1339		9-(4-(3-(氨基甲基)戊-3-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1340		(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-2,6-二甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1341		(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-2,6-二甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1342		9-((R)-1-胺基丙-2-基)-2-(1-羟基乙基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1343		2-((4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)氨基)乙腈
1344		(R)-9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1345		9-(3-氯-4-(2-(乙基氨基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1346		9-(4-(3-((二甲基氨基)甲基)戊-3-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1347		(R)-6-((R)-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮)
1348		9-(4-(2-(乙基氨基)乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1349		9-(4-(2-(乙基氨基)乙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1350		9-(4-(2-(乙基(甲基)氨基)丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1351		2-(羟基(哌啶-4-基)甲基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1352		(R)-9-(4-(1-氨基丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1353		(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-2-氯-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1354		(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-2-氯-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1355		8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1356		9-(4-(2-(乙基(甲基)胺基)乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1357		9-(4-(3-(胺基)戊-3-基)苯基)-6-氯-8-甲氧基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1358		9-(4-(3-((二甲基氨基)甲基)戊-3-基)苯基)-8-羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1359		9-(6-(二甲基胺基)吡啶-3-基)-8-甲氧基-6-甲基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1360		(R)-9-(4-(1-(二甲基氨基)丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1361		(R)-8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丁-2-基)苯基) 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1362		9-(4-((3-((二乙基氨基)甲基)戊-3-基)苯基)-8-羟基- 6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1363		9-(3-氯-4-(2-(乙基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1364		8-羟基-6-甲基-9-(4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1365		(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1366		(R)-9-(4-(1-(乙基(甲基)胺基)丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1367		(R)-9-(4-(1-(二乙基胺基)丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1368		(R)-9-(4-(1-(乙基(甲基)胺基)丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1369		2-((4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)(甲基)胺基)乙腈
1370		2-((4-(8-羟基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)(甲基)胺基)乙腈
1371		9-(3-氯-4-(2-(乙基(甲基)胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮
1372		9-(4-((1-((二甲基胺基)甲基)環丁基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮
1373		(R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮
1374		9-(6-(2-胺基乙氧基)吡啶-3-基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮

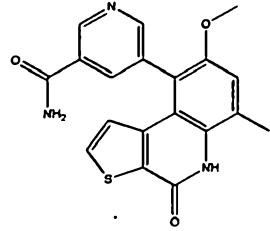
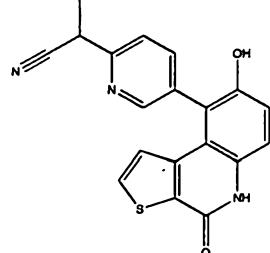
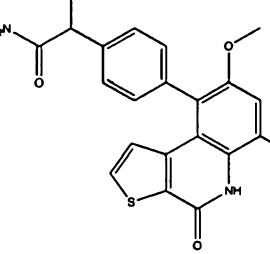
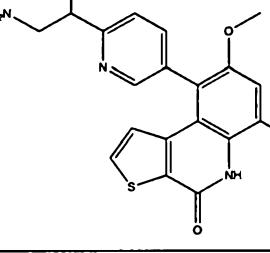
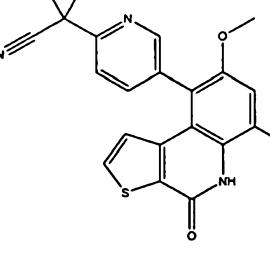
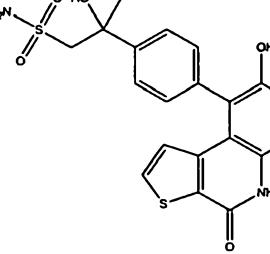
1375		(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-2-氟-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1376		9-(6-(2-胺基乙氧基)吡啶-3-基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1377		9-(4-(1-胺基-2,2,2-三氟乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1378		9-(4-(1-胺基-2,2,2-三氟乙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1379		(R)-9-(4-(1-(乙基甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1380		(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丁-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1381		9-(4-(1-胺基-2,2,2-三氟乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1382		(R)-1-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-3-甲基-3H-吡咯并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1383		(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-2-氟-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1384		9-((2-胺基乙基)胺基)吡啶-3-基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1385		9-((2-胺基乙基)胺基)吡啶-3-基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮
1386		(S)-6-氯-9-(4-(1-(乙基(甲基)胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮

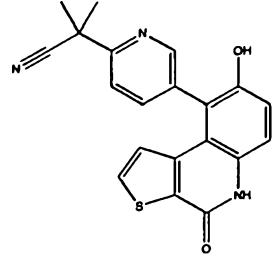
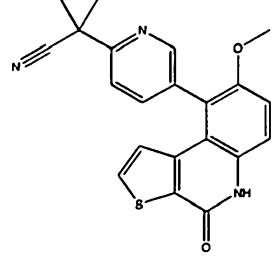
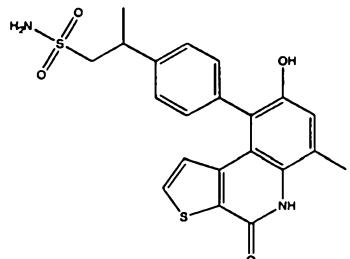
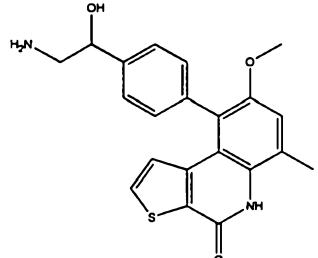
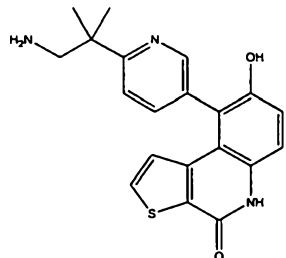
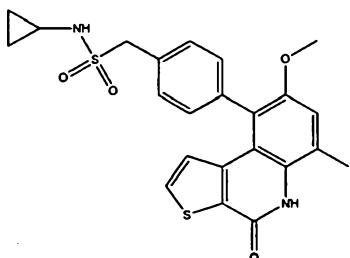
1387		(S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1388		(R)-9-(4-(1-(二乙基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1389		9-(4-(1-胺基-2,2,2-三氟乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1390		9-(4-(1-胺基-2,2,2-三氟乙基)苯基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1391		9-(4-(1-(胺基甲基)环丙基)苯基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1392		(4-(8-羟基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺酰胺

1393		8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(2-(甲基亞礦醯基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
1394		8-羥基-6-甲基-9-(4-(2-(甲基亞礦醯基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
1395		(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)苯基)甲烷磺醯胺
1396		9-(4-((2-氨基乙基)(甲基)氨基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
1397		(R)-N-(2-(2-氟-4-(8-羥基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺
1398		(R)-N-(2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺

1399		(S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1400		9-(4-((2-氨基乙基)(甲基)胺基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1401		9-(4-(1-(氨基甲基)环丙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1402		2-(6-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-3-基)乙腈
1403		8-羟基-6-甲基-9-(4-(2-(甲基亚磺酰基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1404		8-甲氧基-6-甲基-9-(4-((甲基磺酰基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

1405		5-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)菸鹼醯胺
1406		2-(5-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)吡啶-2-基)丙腈
1407		2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)苯基)丙醯胺
1408		9-(6-(1-氨基丙-2-基)吡啶-3-基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮
1409		2-(5-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)吡啶-2-基)-2-甲基丙腈
1410		2-羥基-2-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)苯基)丙烷-1-磺醯胺

1411		N-(第三丁基)-2-羟基-2-(4-(8-甲氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙烷-1-磺醯胺
1412		2-(4-(8-羟基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-dihydro-2H-thieno[3,2-c]imidazo[4,5-f]quinolin-9-基)苯基)丙酰胺
1413		2-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-dihydro-2H-thieno[3,2-c]imidazo[4,5-f]quinolin-9-基)苯基)丙烷-1-磺醯胺
1414		9-(4-(2-氨基-1-氟乙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1415		9-(6-(1-氨基丙-2-基)吡啶-3-基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1416		2-(5-(8-羟基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-dihydro-2H-thieno[3,2-c]imidazo[4,5-f]quinolin-9-基)吡啶-2-基)-2-甲基丙腈

1417		2-(5-(8-羟基-4-甲基-4H-喹啉-4-基)-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]唑啉-9-基)吡啶-2-基)-2-甲基丙腈
1418		2-(5-(8-甲氧基-4-甲基-4H-喹啉-4-基)-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]唑啉-9-基)吡啶-2-基)-2-甲基丙腈
1419		2-(4-(8-羟基-6-甲基-4H-噻吩[3,2-f]喹啉-4-基)-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]唑啉-9-基)苯基)丙烷-1-磺酰胺
1420		9-(4-(2-氨基乙基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮)
1421		9-(6-(1-氨基-2-甲基丙基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]唑啉-4(5H)-酮)
1422		N-环丙基-1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4H-噻吩[3,2-f]喹啉-4-基)-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]唑啉-9-基)苯基)甲烷磺酰胺

1423		2-(5-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-2-基)丙腈
1424		(R)-N-(2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺
1425		N-乙基-1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺
1426		9-(6-(1-氨基丙-2-基)吡啶-3-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
1427		N-環丙基-1-(4-(8-羥基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺
1428		1-(5-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-2-基)環丙腈

1429		N-乙基-1-(4-(8-羟基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺
1430		1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺
1431		1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺
1432		(R)-N-(2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺
1433		(R)-N-(2-(4-(8-羟基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)-N-甲基甲烷磺醯胺
1434		(R)-N-(2-(4-(8-羟基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺

1435		(R)-N-(2-(4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺
1436		(R)-N-(2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)-N-甲基甲烷磺醯胺
1437		(R)-N-(2-(4-(8-羥基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)-N-甲基甲烷磺醯胺
1438		(R)-N-(2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)-N-甲基甲烷磺醯胺

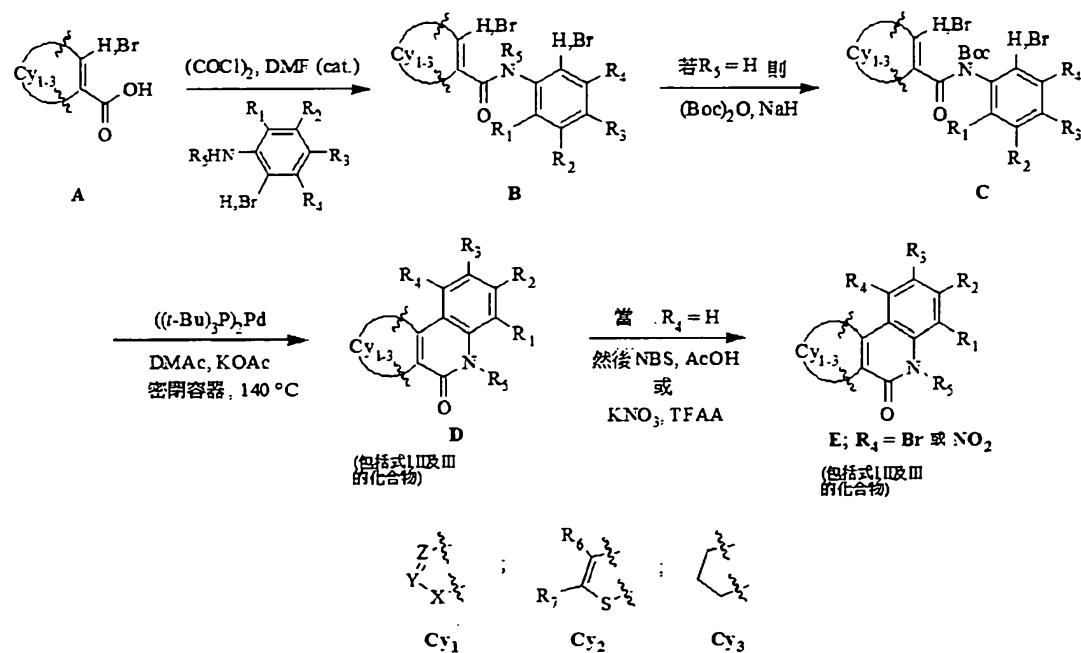
本發明之式(I)之化合物可為從無機酸或有機酸衍生的醫藥上可接受的鹽的形式。從無機酸或有機酸衍生的醫藥上可接受的鹽的代表例，包括藉由對於該式(I)之化合物添加無機酸或有機羧酸獲得之鹽，無機酸包括但不限定於：鹽酸、氫溴酸、磷酸或磺酸，有機羧酸例如乙酸、三氟乙酸、檸檬酸、甲酸、馬來酸、草酸、琥珀酸、苯甲酸、酒石酸、富馬酸、杏仁酸或蘋果酸、甲烷磺酸、或對甲苯磺酸，其不限定範圍。此種酸可利用習知處理製備，且其他本身不是醫藥上可接受的酸包括草酸可用於製備此等鹽。

類。

或者，本發明之式(I)之化合物也可為從有機鹼或無機鹼衍生的醫藥上可接受的鹽的形式，包括藉由添加無機鹼或有機鹼獲得的鹽。例如，可使用鹼包括氫氧化鈉或氫氧化鉀，或鹼土金屬氫氧化物包括氫氧化鈣、氫氧化鎂、氫氧化鋁或氫氧化銨，來製備該化合物的無機鹽。再者，也可使用有機鹼包括三乙胺或二異丙基乙胺以製備該化合物的有機鹽。

該式(I)之化合物可如流程(I)及(II)製備。

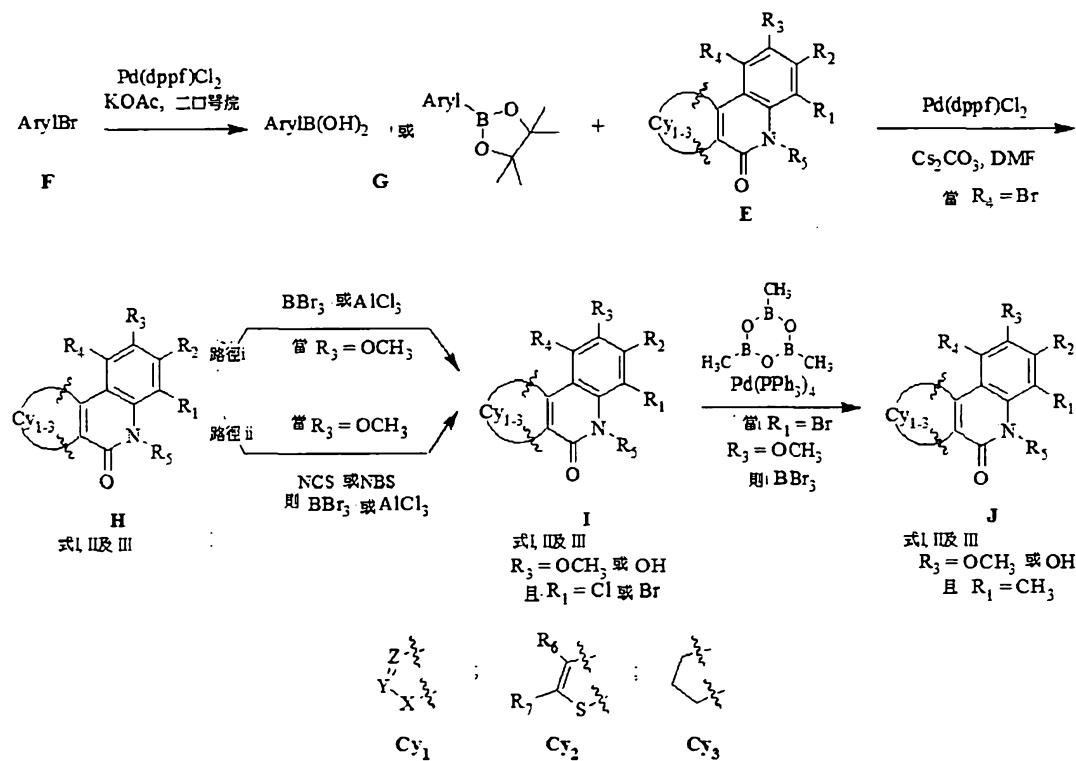
### 流程(I)



多種由流程 I 中所示的環狀化合物 ( $\text{Cy}_{1-3}$ ) 定義的酸 A 係轉變為對應的醯氯後，與必要的苯胺偶聯以獲得偶聯產物 B。當  $R_5 = \text{H}$  時，該醯胺係經保護以獲得中間產物 C，其接著使用雙三第三丁基膦當做選定的催化劑進行關鍵的分子內 Heck 環化作用。此舉提供三環化合物 D，其包括式

I、II 及 III 的一些化合物。於一些例子中，三環化合物 D 級使用 NBS 溴化或使用硝酸鉀及三氟乙酸酐硝化以獲得產物 E(流程 I)。

### 流程 (II)



芳基溴化物 F 可為購買或製備者，且接著經由標準條件轉變為對應的有機硼酸或有機硼酸酯 G。溴化物 E 與必要的有機硼酸酯或有機硼酸 G 一起經歷 Suzuki 或 Buchwald 型交聯偶聯反應，以獲得化合物 H，其中有些為式 I、II 及 III 之化合物。當  $R_3 = OCH_3$  時，以三溴化硼或氯化鋁處理化合物 H(經路徑 i)，會提供去甲基化的化合物 I，其包括式 I、II 及 III 之化合物(流程 II)。此外，以 NCS 或 NBS 處理化合物 H(經路徑 ii)，會提供在  $R_1$  含鹵素的化合物 I。此等鹵代化合物以三溴化硼或氯化鋁處理，以提供該去甲基化的化合物 I。最後，使帶有  $R_1 = Br$  的化合物

與三甲基硼氫三聚物及鉋催化劑反應，以獲得式 I、II 及 III 的化合物 J，其中  $R_1 = CH_3$ 。以三溴化硼處理此等化合物提供式 I、II 及 III 的化合物。

本發明之式(I)或(II)的化合物的鹽、水合物、溶劑合物及異構物，可採用任意已知的方法製備。本發明之式(I)或(II)的化合物的鹽、水合物、溶劑合物及異構物，可用於治療 PBK 依存性疾病，例如癌症。PBK 依存性疾病的治療可藉由抑制 PBK 活性達成。本發明的化合物通常  $IC_{50}$  值 (micro M) 在 0.0001 至 100 的範圍，例如，0.001 至 50，較佳為 0.001 至 10，更佳為 0.001 至 5。

本發明包括一種醫藥組合物，其包括治療上有效量的式(I)或(II)之化合物或其鹽、水合物、溶劑合物或異構物當做活性成分，以及醫藥上可接受的擔體。本發明的醫藥組合物可用於治療或預防 PBK 依存性疾病。

可依照任意習知程序製備醫藥上的配方。當製備配方時，較佳為將活性成分混合或以擔體稀釋，或包納在擔體、小袋或其他容器中。該擔體可為固體、半固體或液體材料，其係當做活性成分的載具、賦形劑或媒介。該配方可為錠劑、藥丸、粉末、小袋、酏劑、懸浮劑、乳劑、溶液、糖漿、氣溶膠、軟及硬明膠膠囊、無菌可注射溶液、無菌包裝粉末等形式。

適當的擔體、賦形劑及稀釋劑，例如：乳糖、葡萄糖、蔗糖、山梨糖、甘露醇、矽酸鈣、纖維素、甲基纖維素、微結晶纖維素、聚乙烯基吡咯啶酮、水及礦物油。該配方

可額外包括填料、抗乳化劑、保存劑等。本發明的組合物可配方為在採用該技術領域中已知的任何程序投予到哺乳動物後，立即釋放、持續釋放或延遲釋放活化物質。

本發明之醫藥組合物可經由各種途徑投予，包括口服、穿皮、皮下、靜脈內及肌肉內投予。

除了以上以外，本發明的組合物可更包含其他醫藥上活性成分，只要其不抑制本發明化合物的體內功能即可。在此揭示的化合物可以與第 2 治療藥劑共同起投予，例如化療藥劑。用語「共同投予」意指投予超過 1 種活性藥劑，使得其中一活性藥劑的生理效果與第 2 活性藥劑的生理效果重疊。針對全身性藥劑，用語共同投予意指在至少 1 個時間點，有多於 1 種活性藥劑存在於血流中。共同投予包括同時投予、大約同時投予或以任意順序依序投予 2 種活性藥劑。於一些具體例中，共同投予可藉由共同配方，意即製備包括 2 種活性藥劑的單一劑型單位而達成。

「治療」疾病包括以下 1 或更多情形：對付該疾病的生理原因、對付疾病症狀的生理原因、減少疾病的嚴重程度、減輕疾病的症狀、及縮短疾病的持續時間。「預防」疾病，包括減少或延遲該疾病或其症狀的開始。

在此揭示的化合物可用於治療或預防 PBK 依存性疾病，包括癌症。據顯示 PBK 為治療癌症的標靶，例如乳癌（本說明書的實施例 504）、膀胱癌（WO2006/085684），及小細胞肺癌（WO2007/013665）。當做標靶的癌症包括但不限於乳癌、膀胱癌、及小細胞肺癌。例如，本發明提供治療或預

防於個體中的 PBK 依存性疾病包括癌症的方法，係藉由對於該個體投予在此揭示的化合物。於一較佳具體例，此化合物可以包括本發明化合物及醫藥上或生理上可接受的單體的醫藥組合物的形式對於個體投予。本發明的醫藥組合物可經各種途徑投予，包括口服、穿皮、皮下、靜脈內及肌肉內，以治療在個體中的 PBK 依存性疾病。

於另一具體例，本發明也提供使用本發明的化合物製造用於治療 PBK 依存性疾病包括癌症的醫藥組合物的方法。例如，本發明係關於使用本發明的化合物製造用於治療 PBK 依存性疾病包括癌症的醫藥組合物的用途。於另一具體例，本發明之化合物可用於治療 PBK 依存性疾病包括癌症。

於另一具體例，本發明也提供一種製造治療 PBK 依存性疾病包括癌症的醫藥組合物的方法或處理，其中方法或處理包括將活性成分與醫藥上或生理上可接受的擔體混合的步驟，其中該活性成分係本發明的化合物。

投予的劑量及方法可視病患的體重、年紀及症狀而異，但該技術領域中的熟悉人士可適當選擇。

例如，當以口服對於正常成人投予(體重 60 kg)，劑量一般為每日約 0.1 mg 至約 100 mg，較佳為每日約 1.0 mg 至約 50 mg，更佳為每日約 1.0 mg 至約 20 mg。

當以注射形式非口服投予該化合物到正常成人(體重 60 kg)時，即使依病患、目標器官、症狀以及投予方法有不同，但以靜脈內每日注射約 0.01 mg 至約 30 mg，較佳為

每日約 0.1 至約 20 mg，且更佳為每日約 0.1 至約 10 mg 為便利的。當為其他動物的情形，適當的劑量可利用轉換為 60 kg 體重而例行的計算。

### 實施例

以下實施例係意欲說明本發明而非限制其範圍。

#### 一般程序 A(流程 I):

步驟 1: 對於必要羧酸 A(1 mol)於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  的懸浮液(0.1 - 0.5 M)，於室溫添加  $(\text{COCl})_2$ (2 mol)，再添加催化性的 DMF。將反應混合物於室溫攪拌 18 小時，於高真空濃縮及乾燥，以獲得中間產物醯氯。將該醯氯溶於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ (0.1 - 0.3 M)，再添加  $\text{Et}_3\text{N}$ (1.5 - 2 mol)及必要的苯胺(1.1 mol)，將反應混合物於室溫攪拌 18 小時。將反應混合物濃縮，以適當溶劑磨碎(triturate)或以閃式層析純化以獲得醯胺 B 固體。

步驟 2: 對於醯胺 B(1 mol)於 THF 的溶液(0.1 - 0.3 M)，於 0 °C 添加  $\text{NaH}$ (1.2 mol)，將反應物加溫至 45 °C 持續 15 min 並冷卻至 0 °C，再添加  $(\text{Boc})_2\text{O}$ (2 mol)。將反應混合物加溫至室溫並攪拌 18 小時。將反應混合物藉由緩慢倒進 0 °C 的攪拌的水及飽和  $\text{NaHCO}_3$  溶液的溶液中以淬滅。將該混合物以乙酸乙酯萃取，將合併的有機層以鹹水清洗，以  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  乾燥並濃縮。將殘渣以適當的溶劑磨碎，或以閃式層析純化以獲得 C 固體。

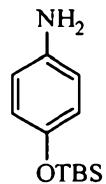
步驟 3: 將中間產物 C(1 mol)、雙(三-第三丁基膦)鉀(5 mol%)及乙酸鉀(4 mol)加到 Parr 壓力反應器中，再添加

二甲基乙醯胺(0.3 M)。將反應混合物以氮氣噴撒 30 min，再於 140-150 °C 加熱 4 小時。將反應混合物冷卻，並藉由導入 0 °C 的鹵水以淬滅。將獲得的沉澱過濾，將濾餅以水及醚清洗，以獲得粗製 D 固體。

步驟 4：對於粗製 D(1 mol)於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2:\text{AcOH}$ (1:1)的溶液，添加 NBS(1 mol)，將反應混合物於室溫攪拌 18 小時。將反應混合物藉由緩慢倒入攪動中的冰與飽和  $\text{Na}_2\text{CO}_3$  水溶液的溶液中以淬滅。當水層為 pH 8 時，將該層分離並濃縮  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  層，以乙腈磨碎，並過濾以獲得 E 固體。

### 實施例 392

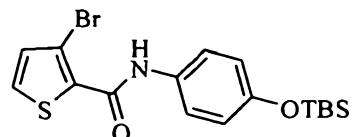
#### 4-(第三丁基二甲基矽氧基)苯胺



對於 4-氨基苯酚(11 g, 100 mmol)及咪唑(10 g, 150 mmol)於 THF(250 mL)的溶液，添加第三丁基二甲基矽基氯化物(18 g, 120 mmol)，將反應混合物於室溫攪拌 18 小時，將反應混合物倒入水中，以二乙醚萃取。將合併的有機層以  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  乾燥，過濾、濃縮，並將殘渣以管柱層析純化以獲得所望產物(15 g, 67%)：ESI MS  $m/z$  224 [ $\text{C}_{12}\text{H}_{21}\text{NOSi} + \text{H}]^+$ 。

### 實施例 393

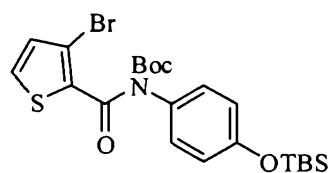
#### 3-溴-N-[4-(第三丁基二甲基矽氧基)苯基]噻吩-2-羧醯胺



依照一般程序 A 的步驟 1，使 5-溴噻吩-2-羧酸 (3.0 g, 14 mmol) 與 4-(第三丁基二甲基矽氧基)苯胺 (4.2 g, 19 mmol) 反應，以獲得所望產物 (4.4 g, 73%) 固體：ESI MS m/z 413 [C<sub>17</sub>H<sub>22</sub>BrNO<sub>2</sub>SSi + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 394

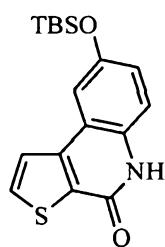
第三丁基 3-溴噻吩-2-羧基 [4-(第三丁基二甲基矽氧基)苯基] 胺基甲酸酯



依照一般程序 A 之步驟 2，使 3-溴-N-[4-(第三丁基二甲基矽氧基)苯基] 噻吩-2-羧醯胺 (4.4 g, 11 mmol) 與 二第三丁基碳酸氫酯 (4.6 g, 21 mmol) 反應，以獲得所望產物 (1.5 g, 28%) 固體：ESI MS m/z 513 [C<sub>22</sub>H<sub>30</sub>BrNO<sub>4</sub>SSi + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 395

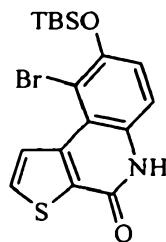
8-(第三丁基二甲基矽氧基) 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 A 之步驟 3，使第三丁基 3-溴噻吩-2-羧基 [4-(第三丁基二甲基矽氧基)苯基] 胺基甲酸酯 (1.0 g, 2.0 mmol) 與 雙(三-第三丁基膦)鈀 (50 mg, 0.098 mmol) 反應，以獲得所望產物 (740 mg, quant.) 固體：ESI MS m/z 332 [C<sub>17</sub>H<sub>21</sub>NO<sub>2</sub>SSi + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 396

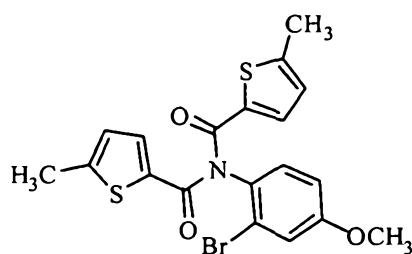
9-溴-8-(第三丁基二甲基矽氧基)噻吩并[2,3-c]喹啉  
-4(5H)-酮



依照一般程序 A 之步驟 4，使 8-(第三丁基二甲基矽氧基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(740 mg, 2.2 mmol) 與 N-溴琥珀醯亞胺(480 mg, 2.7 mmol)反應，以獲得所望產物(340 mg, 37%)棕色固體：ESI MS m/z 411 [C<sub>17</sub>H<sub>20</sub>BrNO<sub>2</sub>SSi + H]<sup>+</sup>。

實施例 397

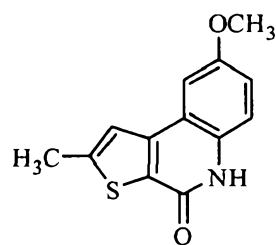
N-(2-溴-4-甲氧基苯基)-5-甲基-N-(5-甲基噻吩-2-羰基)  
噻吩-2-羧醯胺



依照一般程序 A 之步驟 1，使 5-甲基噻吩-2-羧酸(8.5 g, 60 mmol)與 2-溴-4-甲氧基苯胺(6.7 g, 30 mmol)反應，以獲得所望產物(5.0 g, 57%)固體：ESI MS m/z 327 [C<sub>13</sub>H<sub>12</sub>BrNO<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

實施例 398

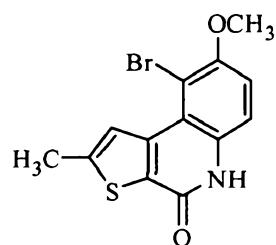
8-甲氧基-2-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 A 之步驟 3，使 N-(2-溴-4-甲氧基苯基)-5-甲基-N-(5-甲基噻吩-2-羧基)噻吩-2-羧醯胺 (500 mg, 1.1 mmol) 與雙(三-第三丁基膦)鉑 (45 mg, 0.089 mmol) 反應，以獲得所望產物 (1.3 g, 48%) 綠色固體：ESI MS m/z 246 [C<sub>13</sub>H<sub>11</sub>NO<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 399

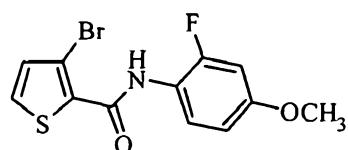
9-溴-8-甲氧基-2-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 A 之步驟 4，使 8-甲氧基-2-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (1.4 g, 5.7 mmol) 與 N-溴琥珀醯亞胺 (1.2 g, 6.9 mmol) 反應，以獲得所望產物 (740 mg, 40%) 棕色固體：ESI MS m/z 325 [C<sub>13</sub>H<sub>10</sub>BrNO<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 400

3-溴-N-(2-氟-4-甲氧基苯基)噻吩-2-羧醯胺

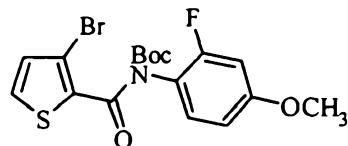


依照一般程序 A 之步驟 1，使 3-溴噻吩-2-羧酸 (7.3 g, 35 mmol) 與 2-氟-4-甲氧基苯胺 (5.0 g, 35 mmol) 反應，以獲得所望產物 (10 g, 90%) 橙色固體：ESI MS m/z 331

$[C_{12}H_{10}FNO_2S + H]^+$ 。

### 實施例 401

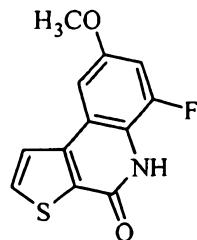
第三丁基 3-溴噻吩-2-羧基(2-氟-4-甲氧基苯基)氨基甲酸酯



依照一般程序 A 之步驟 2，使 3-溴-N-(2-氟-4-甲氧基苯基) 噻吩-2-羧醯胺(12 g, 35 mmol)與二第三丁基碳酸氫酯(12 g, 53 mmol)反應，以獲得所望產物(14 g, >99%) 橙色固體：ESI MS m/z 331  $[C_{12}H_{10}FNO_2S + H]^+$ 。

### 實施例 402

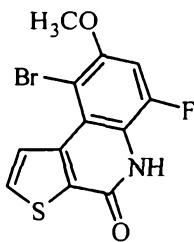
6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 A 之步驟 3，使第三丁基 3-溴噻吩-2-羧基(2-氟-4-甲氧基苯基)氨基甲酸酯(2.0 g, 4.6 mmol)與雙(三-第三丁基膦)鈀(100 mg, 0.20 mmol)反應，以獲得所望產物(950 mg, 80%)暗棕色固體：ESI MS m/z 250  $[C_{12}H_8FNO_2S + H]^+$ 。

### 實施例 403

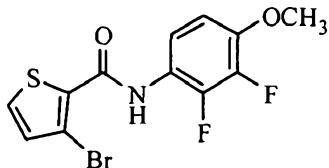
9-溴-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 A 之步驟 4，使 6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(1.0 g, 4.0 mmol)與 N-溴琥珀醯亞胺(570 mg, 4.8 mmol)反應，以獲得所望產物(800 mg, 61%)棕色固體：ESI MS m/z 329 [C<sub>12</sub>H<sub>7</sub>BrFNO<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 404

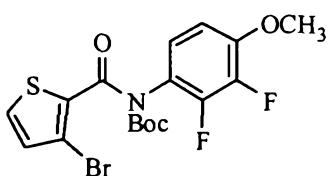
3-溴-N-(2,3-二氟-4-甲氧基苯基)噻吩-2-羧醯胺



依照一般程序 A 之步驟 1，使 3-溴噻吩-2-羧酸(1.3 g, 6.3 mmol)與 2,3-二氟-4-甲氧基苯胺(960 mg, 7.5 mmol)反應以獲得所望產物(2.2 g, >99%)：ESI MS m/z 349 [C<sub>12</sub>H<sub>8</sub>BrF<sub>2</sub>NO<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 405

第三丁基 3-溴噻吩-2-羧基(2,3-二氟-4-甲氧基苯基)胺基甲酸酯

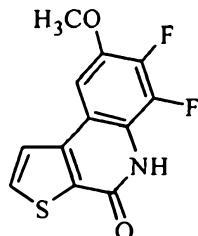


依照一般程序 A 之步驟 2，使 3-溴-N-(2,3-二氟-4-甲氧基苯基)噻吩-2-羧醯胺(2.4 g, 7.00 mmol)與二第三丁基碳酸氫酯(330 mg, 14 mmol)反應以獲得所望產物(2.1

g, 67%)白色固體：ESI MS m/z 448 [C<sub>17</sub>H<sub>16</sub>BrF<sub>2</sub>NO<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 406

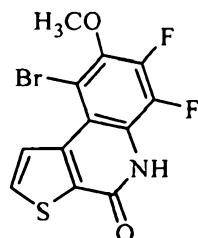
6, 7-二氟-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 A 之步驟 3，使第三丁基 3-溴噻吩-2-羧基(2, 3-二氟-4-甲氧基苯基)氨基甲酸酯(1.4 g, 3.1 mmol)與雙(三-第三丁基膦)鈀(80 mg, 0.15 mmol)反應以獲得所望產物(58 mg, 65%)棕色固體：ESI MS m/z 268 [C<sub>12</sub>H<sub>7</sub>F<sub>2</sub>NO<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 407

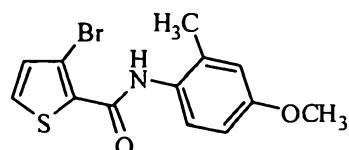
9-溴-6, 7-二氟-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 A 之步驟 4，使 6, 7-二氟-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮(300 mg, 1.1 mmol)與 N-溴琥珀醯亞胺(400 mg, 2.2 mmol)反應以獲得所望產物(200 mg, 57%)黃色固體：ESI MS m/z 347 [C<sub>12</sub>H<sub>6</sub>BrF<sub>2</sub>NO<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 510

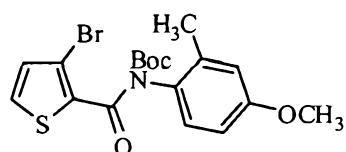
3-溴-N-(4-甲氧基-2-甲基苯基)噻吩-2-羧醯胺



依照一般程序 A 之步驟 1，使 3-溴噻吩-2-羧酸 (6.7 g, 49 mmol) 與 2-甲基-4-甲氧基苯胺 (12 g, 53 mmol) 反應以獲得所望產物 (13 g, 80%) 橙色固體：ESI MS m/z 331 [C<sub>12</sub>H<sub>10</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 511

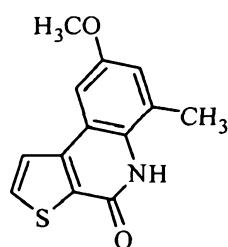
第三丁基 3-溴噻吩-2-羧基(4-甲氧基-2-甲基苯基)胺基甲酸酯



依照一般程序 A 之步驟 2，使 3-溴-N-(4-甲氧基-2-甲基苯基) 噻吩-2-羧醯胺 (12 g, 37 mmol) 與二第三丁基碳酸氫酯 (9.6 g, 44 mmol) 反應以獲得所望產物 (15 g, 96%) 橙色固體：ESI MS m/z 331 [C<sub>12</sub>H<sub>10</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 512

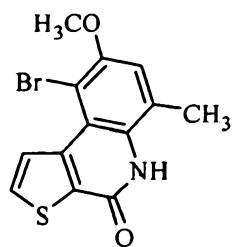
8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 A 之步驟 3，使第三丁基 3-溴噻吩-2-羧基(4-甲氧基-2-甲基苯基)胺基甲酸酯 (14 g, 33 mmol) 與雙(三-第三丁基膦)鉑 (750 mg, 1.5 mmol) 反應以獲得所望產物 (7.0 g, 85%) 暗棕色固體：ESI MS m/z 250 [C<sub>12</sub>H<sub>8</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 513

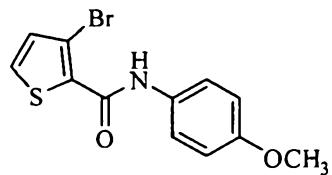
9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 A 之步驟 4，使 8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (6.4 g, 26 mmol) 與 N-溴琥珀醯亞胺 (5.0 g, 26 mmol) 反應以獲得所望產物 (7.0 g, 82%) 棕色固體：ESI MS m/z 329 [C<sub>12</sub>H<sub>7</sub>BrNO<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

實施例 514

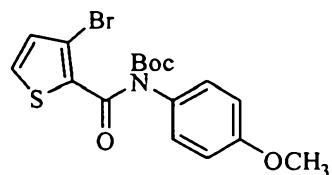
3-溴-N-(4-甲氧基苯基)噻吩-2-羧醯胺



依照一般程序 A 之步驟 1，使 5-溴噻吩-2-羧酸 (75 g, 360 mmol) 與 4-甲氧基苯胺 (54 g, 430 mmol) 反應以獲得所望產物 (110 g, 93%) 固體：ESI MS m/z 313 [C<sub>12</sub>H<sub>10</sub>BrNO<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

實施例 515

第三丁基 3-溴噻吩-2-羧基(4-甲氧基苯基)胺基甲酸酯

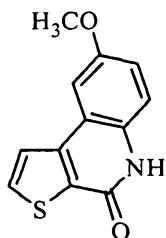


依照一般程序 A 之步驟 2，使 3-溴-N-(4-甲氧基苯基)噻吩-2-羧醯胺 (60 g, 190 mmol) 與二第三丁基碳酸氫酯 (83 g, 380 mmol) 反應以獲得所望產物 (65 g, 82%) 固體：

ESI MS m/z 413 [C<sub>17</sub>H<sub>18</sub>BrNO<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 516

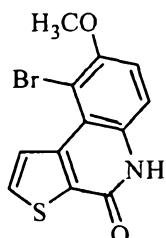
8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 A 之步驟 3，使第三丁基 3-溴噻吩-2-羧基(4-甲氧基苯基)胺基甲酸酯(62 g, 150 mmol)與雙(三-第三丁基膦)鈀(3.7 g, 5 mol%)反應以獲得粗製的所望產物(26 g)灰棕色固體：ESI MS m/z 232 [C<sub>12</sub>H<sub>9</sub>NO<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 517

9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



一般程序 B(流程 II)：

對於溴化物 E(1 mmol)於 DMF 的溶液，添加 Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>(3 mmol)、Pd(dppf)Cl<sub>2</sub>(0.1 mmol)及有機硼酸酯或酸 G(1 - 2 mmol)，將反應物加熱至 80 °C 持續 18 小時，將反應混合物冷卻、濃縮並將殘渣以管柱層析純化(二氧化矽、乙酸乙酯/己烷梯度)或製備性 HPLC(C18 二氧化矽，乙腈/水，0.05% TFA 梯度)，以獲得所望產物 H。於一些例子中，將所望產物溶於 HCl 水溶液，於高真空濃縮及乾燥以獲得所望產物鹽酸鹽。

### 一般程序 C(流程 II):

將來自一般程序 B 的化合物 (1 mmol) 溶於 TFA (10 mmol)，並於室溫攪拌 2 小時並濃縮。將殘渣經離子交換管柱洗提 (使用甲醇及於氯之 7 N 甲醇) 以獲得所望產物游離鹼。於一些例子，該所望產物係溶於 HCl 水溶液，於高真空濃縮及乾燥以獲得所望產物鹽酸鹽。

### 一般程序 D-1(流程 II):

將必要的化合物 (1 mmol) 溶於甲醇，再添加 2 N HCl 於二乙醚 (100 mmol)。將反應混合物於室溫攪拌 2 小時，過濾並濃縮以獲得所望產物鹽酸鹽。

### 一般程序 D-2(流程 II):

將必要的化合物溶於 HCl 水溶液，於高真空濃縮及乾燥以獲得所望產物鹽酸鹽。

### 一般程序 D-3(流程 II):

將必要的化合物 (1 mmol) 溶於 HCl 水溶液 (100 mmol)，於室溫攪拌濃縮 2 小時，於高真空濃縮及乾燥以獲得所望產物鹽酸鹽。

### 一般程序 E - 單一容器 (One Pot)(流程 II):

對芳基溴化物 F (1 mmol) 溶於二噁烷的溶液，添加 K<sub>2</sub>OAc (2 mmol)、Pd(dppf)Cl<sub>2</sub> (0.1 mmol) 及雙戊醯二硼 (bis(pinacolato)diboron) (1.5 mmol)，並將反應物於 90 °C 加熱直到芳基溴化物消耗。對於該反應混合物添加 Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (2 mmol) 及溴化物 E (0.5 mmol)，持續加熱 18 小時，將反應混合物冷卻、濃縮並以層析 (二氧化矽，乙酸乙酯 /

己烷梯度) 或製備性 HPLC(C18 二氧化矽, 乙腈/水, 0.05% TFA 梯度) 純化, 以獲得所望產物 I。於一些例子該所望產物溶於 HCl 水溶液, 於高真空濃縮及乾燥以獲得所望產物鹽酸鹽。

一般程序 F(流程 II):

對化合物 H、I 或 J( $R_3 = OCH_3$ )(1 mmol)於  $CH_2Cl_2$  的溶液或懸浮液, 於 0 °C 添加  $BBr_3$ (6 - 10 mmol), 將反應物加熱至室溫 18 小時或直到起始材料利用 LCMS 分析消失為止。將反應藉由倒在冰水上淬滅, 並將獲得的混合物濃縮, 以製備性 HPLC 精製(C18 二氧化矽, 乙腈/水(有 0.05% TFA)梯度)。將所望的區分合併, 濃縮, 並經離子交換管柱洗提(使用甲醇及於氨中的 7N 甲醇)以獲得所望產物。於一些例子該所望產物溶於 HCl 水溶液, 於高真空濃縮及乾燥以獲得所望產物鹽酸鹽。

一般程序 G(流程 II):

對芳基溴化物 F(1 mmol)溶於二噁烷的溶液添加  $KOAc$ (2 mmol)、 $Pd(dppf)Cl_2$ (0.1 mmol)及雙戊醯二硼(1.5 mmol), 將反應物於 90 °C 加熱 18 小時, 將反應混合物冷卻、濃縮並將殘渣以管柱層析純化(二氧化矽, 乙酸乙酯/己烷梯度)以獲得所望產物。

一般程序 H(流程 II):

對必要化合物 H(1.0 mmol)溶於 DMF 的溶液, 添加 N-氯琥珀醯亞胺(1.2 mmol), 將反應混合物於室溫攪拌 30 min, 於 60 °C 加熱 2 小時。將反應混合物濃縮, 將殘渣以

管柱層析精製(二氧化矽，0 - 30% 乙酸乙酯/庚烷)以獲得所望產物 I。

一般程序 I(流程 II):

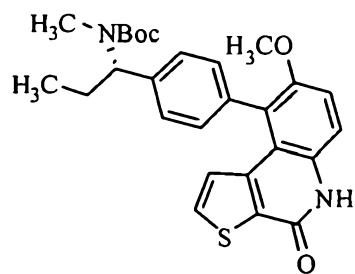
對於必要化合物 H(1.0 mmol)溶於 DMF 的溶液，添加 N-溴琥珀醯亞胺(1.2 mmol)，將反應混合物於室溫攪拌 30 min，於 50 °C 加熱 2 小時。將反應混合物濃縮並將殘渣以管柱層析精製(二氧化矽，0 - 30% 乙酸乙酯/庚烷)以獲得所望產物 I。

一般程序 J(流程 II):

對必要化合物 I(1.0 mmol)溶於甲苯的溶液，添加磷酸三鉀(4.0 mmol)、三甲基硼氫化物(3.0 mmol)、水(0.60 M)及 Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>(0.10 mmol)，將反應混合物脫氣並於 120 °C 加熱 2 小時。將反應混合物冷卻、濃縮並將殘渣以管柱層析純化(二氧化矽，乙酸乙酯/己烷梯度)以獲得所望產物 J。

實施例 518

(S)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)氨基甲酸酯

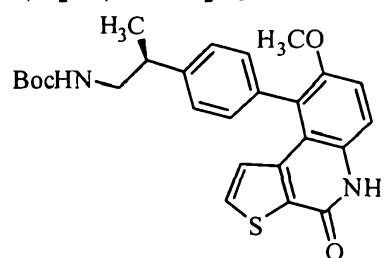


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(670 mg, 2.2 mmol)與(S)-第三丁基 甲基

(1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基)胺基甲酸酯(1.3 g, 3.4 mmol)反應以獲得所望產物(700 mg, 48%)淡棕色固體：ESI MS m/z 479 [C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 519

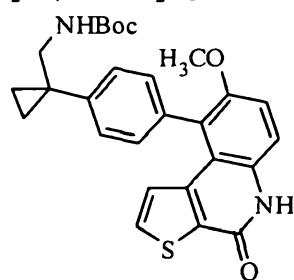
(S)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(240 mg, 0.32 mmol)與(S)-第三丁基 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(3.5 g, 9.7 mmol)反應以獲得所望產物(1.4 g, 32%)淡棕色固體：ESI MS m/z 465 [C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 520

第三丁基(1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)環丙基)甲基胺基甲酸酯

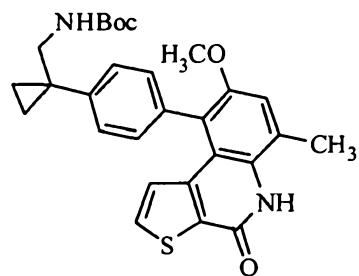


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(830 mg, 2.7 mmol)與第三丁基

(1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)環丙基)甲基胺基甲酸酯(1.5 g, 4.0 mmol)反應以獲得所望產物(670 mg, 52%)淡棕色固體：ESI MS m/z 477 [C<sub>27</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 521

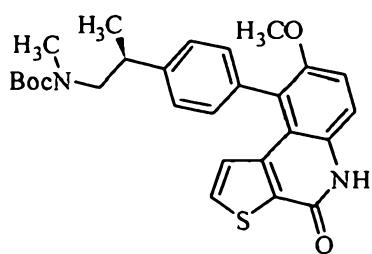
第三丁基(1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)環丙基)甲基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮(150 mg, 0.46 mmol)與第三丁基(1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)環丙基)甲基胺基甲酸酯(260 mg, 0.69 mmol)反應以獲得所望產物(150 mg, 68 %)淡棕色固體：ESI MS m/z 491 [C<sub>28</sub>H<sub>30</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 522

(S)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯

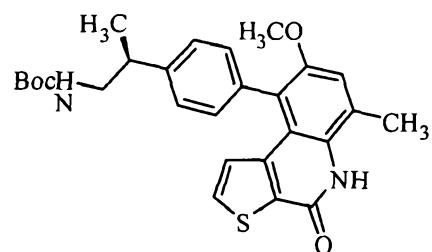


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噠啉

啉-4(5H)-酮(2.5 g, 8.1 mmol)與(S)-第三丁基甲基  
(2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)  
丙基)胺基甲酸酯(4.6 g, 12 mmol)反應以獲得所望產物  
(1.9 g, 50%)淡棕色固體：ESI MS m/z 479 [C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 523

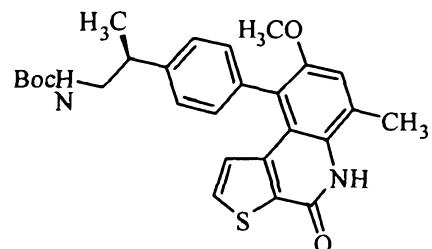
(S)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二  
氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(150 mg, 0.46 mmol)與(S)-第三丁  
基-2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)  
丙基胺基甲酸酯(251 mg, 0.69 mmol)反應以獲得所望產物  
(140 mg, 62%)淡棕色固體：ESI MS m/z 479 [C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 524

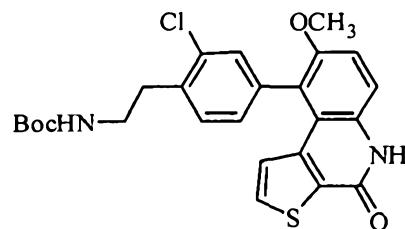
(S)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二  
氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮(150 mg, 0.46 mmol)與(S)-第三丁基 2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(251 mg, 0.69 mmol)反應以獲得所望產物(135 mg, 62%)淡棕色固體：ESI MS m/z 479 [C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 525

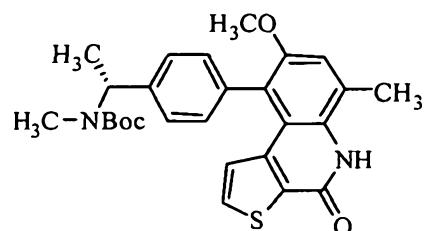
第三丁基 2-氯-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮(3.0 g, 9.7 mmol)與第三丁基 2-氯-4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧雜硼烷-2-基)苯乙基胺基甲酸酯(5.53 g, 14.5 mmol)反應以獲得所望產物(2.65 g, 57%)淡棕色固體。ESI MS m/z 485 [C<sub>25</sub>H<sub>25</sub>ClN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 526

(R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基(甲基)胺基甲酸酯

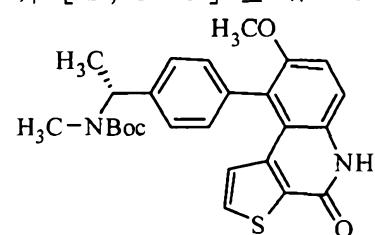


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并

[2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮(150 mg, 0.46 mmol)與(R)-第三丁基甲基(1-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)乙基)氨基甲酸酯(250 mg, 0.69 mmol)反應以獲得所望產物(145 mg, 66%)淡棕色固體：ESI MS m/z 479 [C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 527

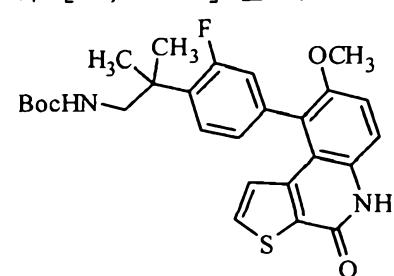
(R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基(甲基)氨基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮(1.4 g, 4.4 mmol)與(R)-第三丁基甲基(1-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)乙基)氨基甲酸酯(2.4 g, 6.6 mmol)反應以獲得所望產物(1.4 g, 66%)淡棕色固體：ESI MS m/z 465 [C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 528

第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙基氨基甲酸酯



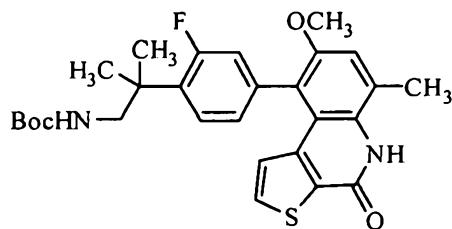
依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹

啉-4(5H)-酮(1.4 g, 4.3 mmol)與第三丁基2-(2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)-2-甲基丙基胺基甲酸酯(2.5 g, 6.4 mmol)反應以獲得所望產物(1.7 g, 79%)淡棕色固體。ESI MS  $m/z$  497 [ $C_{27}H_{29}FN_2O_4S + H_2O$ ] $^{+}$ 。

實施例 529

第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氯噻吩并[2,3-c]

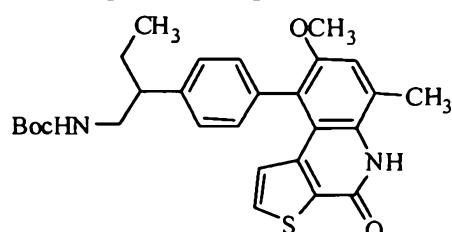
喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(150 mg, 0.46 mmol) 與第三丁基2-(2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)-2-甲基丙基胺基甲酸酯(270 mg, 0.64 mmol)反應以獲得所望產物(130 mg, 56 %)淡棕色固體：ESI MS m/z 511 [C<sub>28</sub>H<sub>31</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

實施例 530

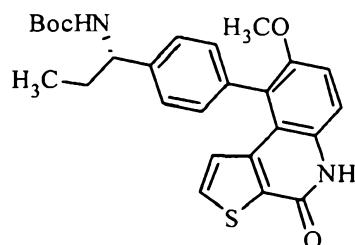
第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丁基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮 (150 mg, 0.46 mmol) 與第三丁基2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丁基胺基甲酸酯 (240 mg, 0.64 mmol) 反應以獲得所望產物 (75 mg, 33 %) 淡棕色固體：ESI MS m/z 493 [C<sub>28</sub>H<sub>32</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 531

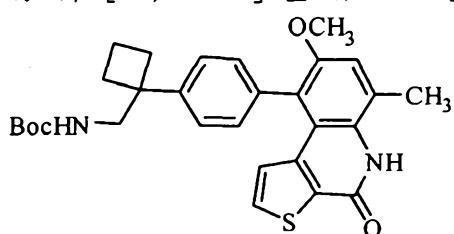
(S)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基) 苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮 (640 mg, 2.1 mmol) 與 (S)-第三丁基1-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (1.13 g, 3.12 mmol) 反應以獲得所望產物 (680 mg, 71%) 淡棕色固體：ESI MS m/z 465 [C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 532

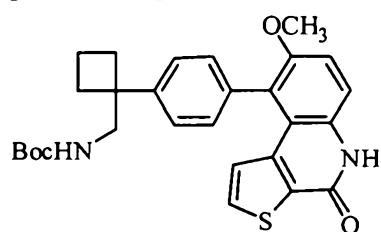
第三丁基(1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基) 苯基)環丁基)甲基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮(150 mg, 0.46 mmol) 與第三丁基(1-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)環丁基)甲基胺基甲酸酯(270 mg, 0.70 mmol)反應以獲得所望產物(105 mg, 45 %)淡棕色固體：ESI MS m/z 505 [C<sub>29</sub>H<sub>32</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 533

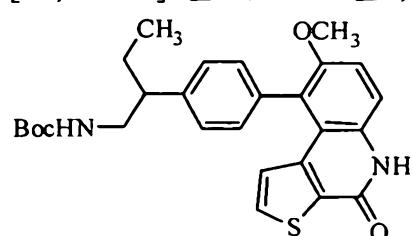
第三丁基(1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)環丁基)甲基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮(1.9 g, 6.0 mmol) 與 第三丁基(1-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)環丁基)甲基胺基甲酸酯(3.5 g, 9.0 mmol)反應以獲得所望產物(1.5 g, 33%)淡棕色固體：ESI MS m/z 491 [C<sub>28</sub>H<sub>30</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 534

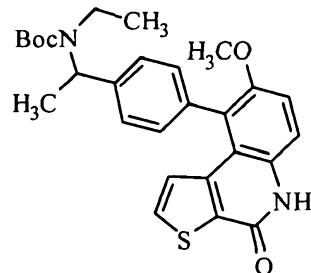
第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)丁基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(840 mg, 2.7 mmol)與第三丁基2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丁基胺基甲酸酯(1.5 g, 4.0 mmol)反應以獲得所望產物(820 mg, 43%)淡棕色固體：ESI MS m/z 479 [C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 535

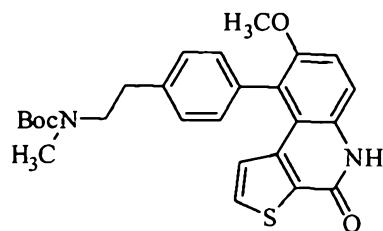
第三丁基乙基(1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(770 mg, 2.5 mmol)與第三丁基乙基(1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)乙基)胺基甲酸酯(1.4 g, 3.7 mmol)反應以獲得所望產物(450 mg, 40%)淡棕色固體：ESI MS m/z 479 [C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 536

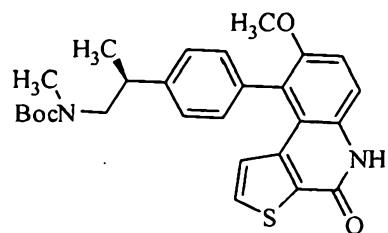
第三丁基4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基(甲基)胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(2.4 g, 7.6 mmol)與第三丁基甲基(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯乙基)胺基甲酸酯(4.2 g, 11 mmol)反應以獲得所望產物(2.1 g, 40%)淡棕色固體：ESI MS m/z 465 [C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 537

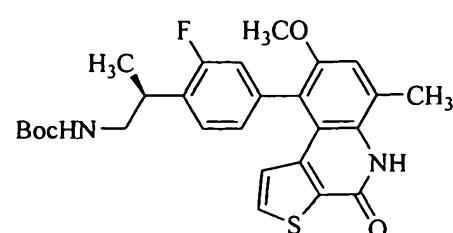
(S)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(2.6 g, 8.2 mmol)與(S)-第三丁基甲基(2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基)胺基甲酸酯(4.6 g, 12 mmol)反應以獲得所望產物(1.9 g, 50%)淡棕色固體：ESI MS m/z 479 [C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 538

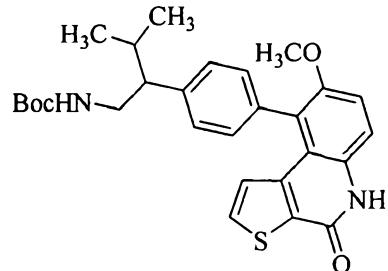
(S)-第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮(380 mg, 1.2 mmol)與(S)-第三丁基 2-(2-氟-4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(400 mg, 1.1 mmol)反應以獲得所望產物(190 mg, 36%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  497 [ $C_{27}H_{29}FN_2O_4S + H$ ]<sup>+</sup>。

### 實施例 539

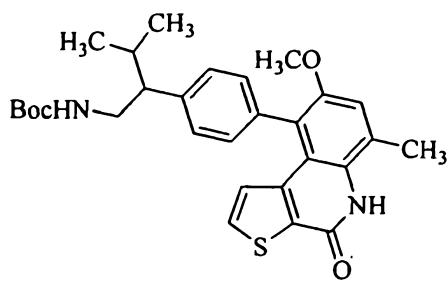
第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)-3-甲基丁基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮(800 mg, 2.58 mmol)與第三丁基 3-甲基-2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丁基胺基甲酸酯(1.2 g, 3.09 mmol)反應以獲得所望產物(250 mg, 20%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  493 [ $C_{28}H_{32}N_2O_4S + H$ ]<sup>+</sup>。

### 實施例 540

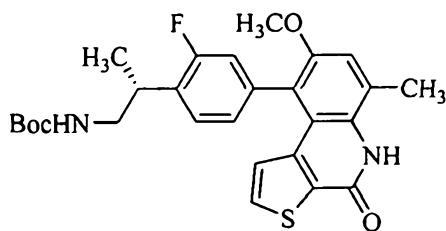
第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)-3-甲基丁基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(500 mg, 1.54 mmol)與第三丁基3-甲基-2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丁基胺基甲酸酯(590 mg, 1.9 mmol)反應以獲得所望產物(120 mg, 15%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  507 [C<sub>29</sub>H<sub>34</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 541

(R)-第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



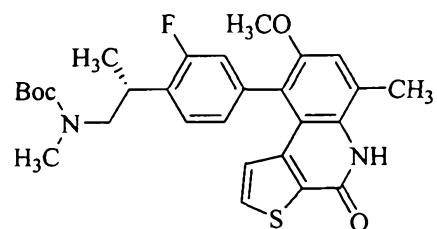
依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(770 mg, 2.4 mmol)與(R)-第三丁基 2-(2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(770 mg, 2.0 mmol)反應以獲得所望產物(500 mg, 49%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  497 [C<sub>27</sub>H<sub>29</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 542

(R)-第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-

-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺

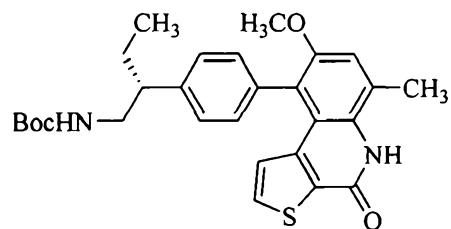
基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮(180 mg, 0.57 mmol)與(R)-第三丁基 2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧杂硼烷-2-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯(150 mg, 0.38 mmol)反應以獲得所望產物(190 mg, 36%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  511 [C<sub>28</sub>H<sub>31</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

實施例 543

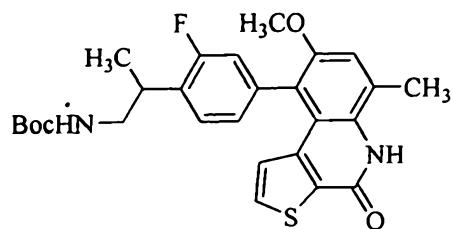
(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)丁基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮(900 mg, 2.9 mmol)與(R)-第三丁基 2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧杂硼烷-2-基)苯基)丁基胺基甲酸酯(900 mg, 2.7 mmol)反應以獲得所望產物(190 mg, 15%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  493 [C<sub>28</sub>H<sub>32</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

實施例 544

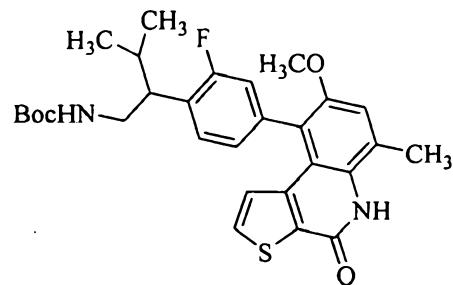
第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]噻吩-9-基)苯基)丙基氨基甲酸酯



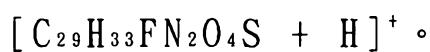
依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噁吩並[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮(900 mg, 2.8 mmol)與第三丁基2-(2-氟-4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(1.3 g, 3.3 mmol)反應以獲得所望產物(200 mg, 27%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  497 [C<sub>27</sub>H<sub>29</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

實施例 545

第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]噻吩-9-基)苯基)-3-甲基丁基胺基甲酸酯

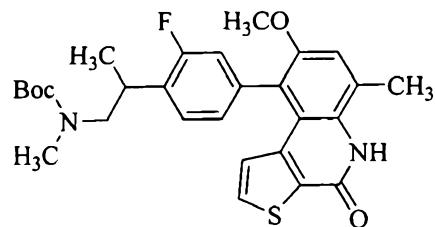


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(170 mg, 0.50 mmol)與第三丁基2-(2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)-3-甲基丁基胺基甲酸酯(200 mg, 0.50 mmol)反應以獲得所望產物(65 mg, 25%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  525



## 實施例 546

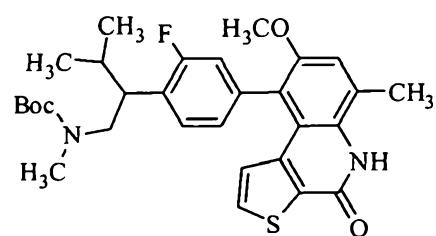
第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(380 mg, 1.16 mmol)與第三丁基 2-(2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氳雜硼烷-2-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯(400 mg, 1.1 mmol)反應以獲得所望產物(190 mg, 36%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  511  $[C_{28}H_{31}FN_2O_4S + H]^+$ 。

## 實施例 547

第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-3-甲基丁基(甲基)胺基甲酸酯

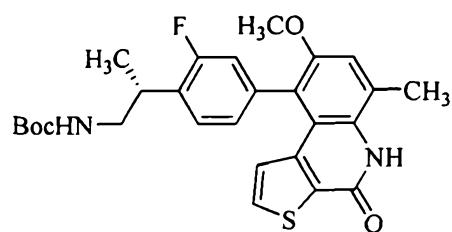


依照一般程序，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(265 mg, 0.81 mmol)與第三丁基 2-(2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氳雜硼烷-2-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯(400 mg, 1.1 mmol)反應以獲得所望產物(190 mg, 36%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  511  $[C_{28}H_{31}FN_2O_4S + H]^+$ 。

苯基)-3-甲基丁基(甲基)胺基甲酸酯(300 mg, 0.89 mmol)反應以獲得所望產物(80 mg, 18%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  539 [C<sub>30</sub>H<sub>35</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 548

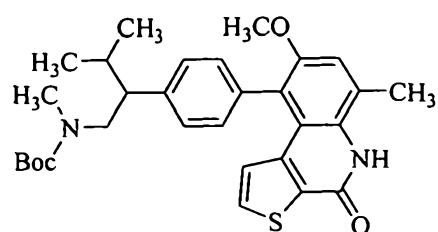
(R)-第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(1.0 g, 3.3 mmol)與 (R)-第三丁基 2-(2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(1.1 g, 3.0 mmol)反應以獲得所望產物(510 mg, 34%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  497 [C<sub>27</sub>H<sub>29</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 549

第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-3-甲基丁基(甲基)胺基甲酸酯

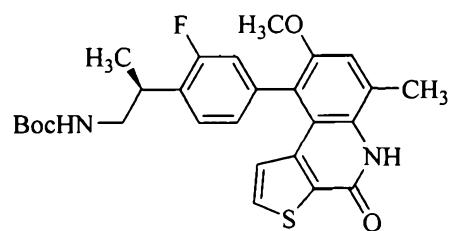


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并

[2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮)(440 mg, 1.4 mmol)與第三丁基  
甲基(3-甲基-2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氫雜硼烷  
-2-基)苯基)丁基)胺基甲酸酯(600 mg, 1.5 mmol)反應以  
獲得所望產物(100 mg, 14%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  521  
[C<sub>30</sub>H<sub>36</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 550

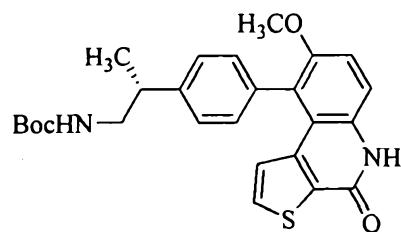
(S)-第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基  
-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸  
酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并  
[2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮)(840 mg, 2.6 mmol)與 (S)-第三  
丁基 2-(2-氟-4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氫雜硼烷  
-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(900 mg, 2.4 mmol)反應以獲  
得所望化合物。

### 實施例 551

(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩  
并[2, 3-c] 喹啉-9-基) 苯基)丙基胺基甲酸酯

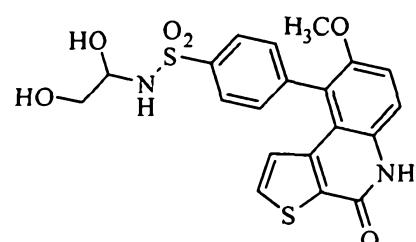


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-噻吩并[2, 3-c]

喹啉-4(5H)-酮(1.2 g, 4.0 mmol)與(R)-第三丁基2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(2.2 g, 6.1 mmol)反應以獲得所望產物(900 mg, 48%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  465 [C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 1057

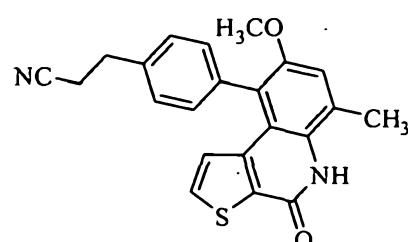
N-(1-羥基丙-2-基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺



依照一般程序B，使9-溴-8-甲氧基-噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(530 mg, 1.8 mmol)與N-(1-羥基丙-2-基)-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯磺醯胺(750 mg, 2.02 mmol)反應以獲得該所望的產物(150 mg, 20%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  445 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 1238

3-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈

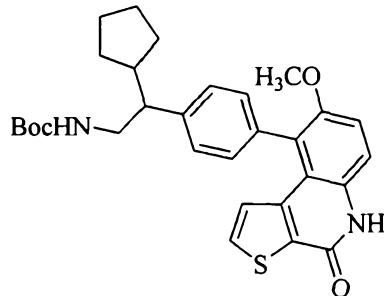


依照一般程序B，使9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(325 mg, 1.0 mmol)與3-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)

丙腈 (330 mg, 1.3 mmol) 反應以獲得所望產物 (140 mg, 37%)  
黃色固體：ESI MS  $m/z$  375 [ $C_{22}H_{18}N_2O_2S + H$ ]<sup>+</sup>。

### 實施例 552

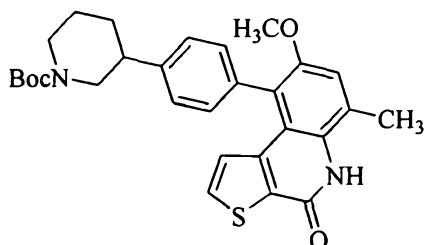
第三丁基 2-環戊基-2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (500 mg, 1.6 mmol) 與 第三丁基 2-環戊基-2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)乙基胺基甲酸酯 (1.3 g, 3.2 mmol) 反應以獲得所望產物 (150 mg, 19%) 黃色固體：ESI MS  $m/z$  519 [ $C_{30}H_{34}N_2O_4S + H$ ]<sup>+</sup>。

### 實施例 553

第三丁基 3-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻  
吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)哌啶-1-羧酸酯

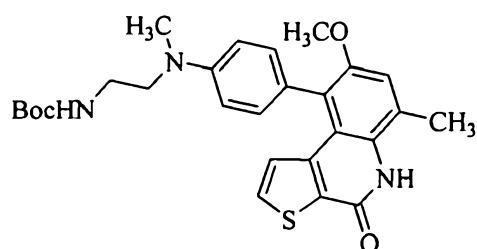


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (190 mg, 0.58 mmol) 與 第三丁基 3-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)哌

啶-1-羧酸酯(180 mg, 0.46 mmol)反應以獲得所望產物(79 mg, 34%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  505 [ $C_{29}H_{32}N_2O_4S + H$ ]<sup>+</sup>。

### 實施例 554

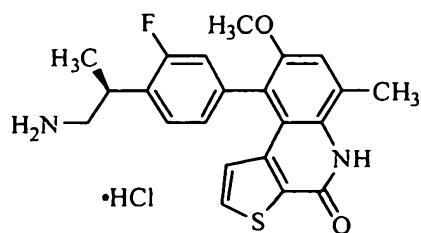
第三丁基 2-((4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)(甲基)胺基)乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(86 mg, 0.26 mmol)與第三丁基 2-(甲基(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)胺基)乙基胺基甲酸酯(100 mg, 0.26 mmol)反應以獲得所望產物(100 mg, 78%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  494 [ $C_{27}H_{31}N_3O_4S + H$ ]<sup>+</sup>。

### 實施例 1310

(S)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

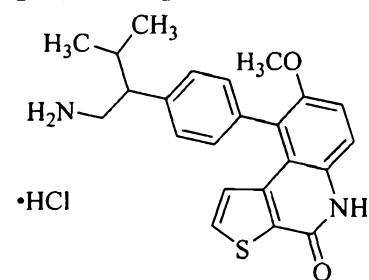


依照一般程序 D1，使(S)-第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(100 mg, 0.20 mmol)與 HCl 在

醚中反應(10 mL)以獲得所望產物(80 mg, 98%) 灰白色固體：ESI MS  $m/z$  397 [C<sub>22</sub>H<sub>21</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>

### 實施例 1253

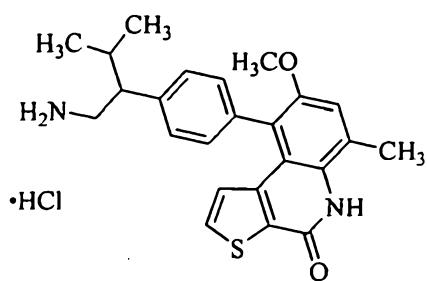
9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 D1，使第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側  
氧基-4,5-二氫噁吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯基)-3-甲基  
丁基胺基甲酸酯(30 mg, 0.060 mmol)與 HCl 在醚中反應(3  
mL)以獲得所望產物(22 mg, 97%) 灰白色固體；<sup>1</sup>H NMR(500  
MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 7.93(s, 3H), 7.62(d, *J* = 5.4 Hz, 1H),  
7.53(d, *J* = 9.1 Hz, 1H), 7.41(d, *J* = 9.0 Hz, 2H),  
7.38 - 7.33(m, 1H), 7.24(d, *J* = 8.2 Hz, 2H), 5.72(d,  
*J* = 5.4 Hz, 1H), 3.70(s, 3H), 3.38 - 3.26(m, 2H),  
2.87(dt, *J* = 12.9, 6.3 Hz, 1H), 2.01(dq, *J* = 13.3, 6.6  
Hz, 1H), 0.97(t, *J* = 7.8 Hz, 3H), 0.82(t, *J* = 9.9 Hz,  
3H). ; ESI MS  $m/z$  393 [C<sub>23</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>. HPLC 98.4%(AUC),  
*t*<sub>R</sub> = 11.65 min.

### 實施例 555

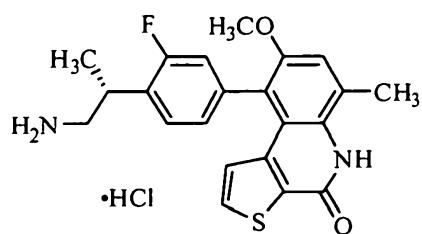
9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噁  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 D1，使第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)-3-甲基丁基胺基甲酸酯(50 mg, 0.060 mmol)與 HCl 在醚中反應(3 mL)以獲得所望產物(37 mg, 92%) 灰白色固體：ESI MS  $m/z$  407 [C<sub>24</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 1317

(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

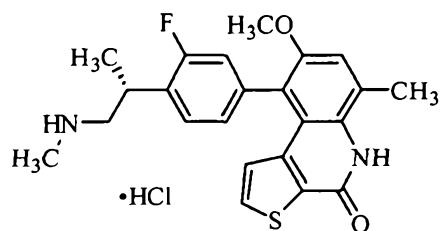


依照一般程序 D1，使(R)-第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(150 mg, 0.30 mmol)與 HCl 在醚中反應(15 mL)以獲得所望產物(105 mg, 81%) 灰白色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.63(dd, J = 5.4, 2.4 Hz, 1H), 7.52(dt, J = 24.8, 7.8 Hz, 1H), 7.30(s, 1H), 7.09(m, 2H), 6.11(dd, J = 26.4, 5.4 Hz, 1H), 3.76(s, 3H), 3.63 – 3.43(m, 1H), 3.42 – 3.16(m, 2H), 2.64(s, 3H), 1.51(d, J = 7.0 Hz, 3H). ESI MS  $m/z$  397 [C<sub>22</sub>H<sub>21</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S]

$+ \text{H}]^+$ ; HPLC >99%(AUC),  $t_R = 11.57 \text{ min.}$

### 實施例 1316

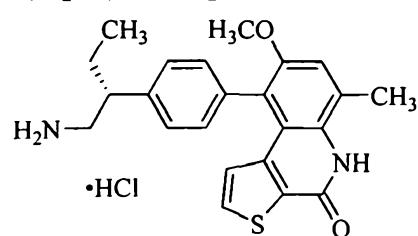
(*R*)-9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-*c*]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 D1，使 (*R*)-第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-*c*]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯 (50 mg, 0.10 mmol) 與 HCl 在醚中反應 (5 mL) 以獲得所望產物 (35 mg, 85%) 黃色固體;  
 $^1\text{H NMR}$  (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.63(d,  $J = 5.4 \text{ Hz}$ , 1H), 7.53(dt,  $J = 28.7, 7.8 \text{ Hz}$ , 1H), 7.29(s, 1H), 7.17 - 7.04(m, 2H), 6.10(dd,  $J = 31.6, 5.4 \text{ Hz}$ , 1H), 3.75(s, 3H), 3.68 - 3.24(m, 3H), 2.78(d,  $J = 13.3 \text{ Hz}$ , 3H), 2.64(s, 3H), 1.52(dd,  $J = 7.0, 3.2 \text{ Hz}$ , 3H).; ESI MS  $m/z$  411 [ $\text{C}_{23}\text{H}_{23}\text{FN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 98.2%(AUC),  $t_R = 11.79 \text{ min.}$

### 實施例 1344

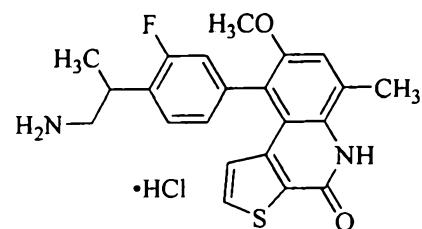
(*R*)-9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-*c*]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 D1，使 (*R*)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-*c*]喹啉-9-基)苯基)丁基胺基甲酸酯(100 mg, 0.20 mmol)與 HCl 在醚中反應(10 mL)以獲得所望產物(75 mg, 94%) 灰白色固體：ESI MS *m/z* 393 [C<sub>23</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 1273

9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-*c*]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

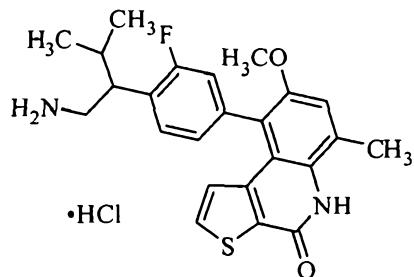


依照一般程序 D1，使第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-*c*]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(200 mg, 0.40 mmol)與 HCl 在醚中反應(20 mL)以獲得所望產物(145 mg, 91%) 灰白色固體：  
<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 10.80(s, 1H), 8.06(s, 3H), 7.74(dd, *J* = 14.6, 5.4 Hz, 1H), 7.52(t, *J* = 7.9 Hz, 1H), 7.30(s, 1H), 7.16 – 7.02(m, 2H), 5.87(dd, *J* = 43.2, 5.4 Hz, 1H), 3.70(s, 3H), 3.51 – 3.40(m, 1H), 3.26 – 3.07(m, 2H), 2.59(s, 3H), 1.39(t, *J* = 7.6 Hz, 3H); ESI MS *m/z* 397 [C<sub>22</sub>H<sub>21</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.8%(AUC), t<sub>R</sub> = 11.60 min.

### 實施例 1283

9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-

甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸

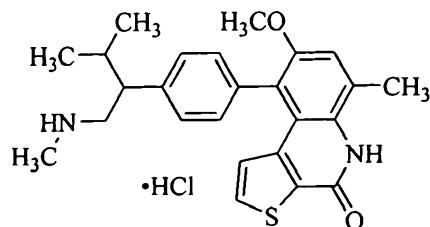


依照一般程序 D1，使第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-3-甲基丁基胺基甲酸酯(52 mg, 0.10 mmol)與 HCl 在醚中反應(5 mL)以獲得所望產物(25 mg, 59%) 灰白色固體；  
<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 7.69(dd, *J* = 16.1, 5.4 Hz, 1H), 7.41(dt, *J* = 13.3, 8.0 Hz, 1H), 7.29(d, *J* = 3.4 Hz, 1H), 7.10 – 6.98(m, 2H), 5.89 – 5.72(m, 1H), 3.71(t, *J* = 6.8 Hz, 3H), 3.19 – 2.83(m, 3H), 2.59(s, 3H), 2.03(dt, *J* = 13.5, 6.7 Hz, 1H), 0.99(t, *J* = 10.0 Hz, 3H), 0.82(dd, *J* = 9.9, 6.8 Hz, 3H)；ESI MS *m/z* 425 [C<sub>24</sub>H<sub>25</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>；HPLC 93.4%(AUC), t<sub>R</sub> = 11.20 min.

實施例 556

8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(3-甲基-1-(甲基胺基)丁-2-基)

苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

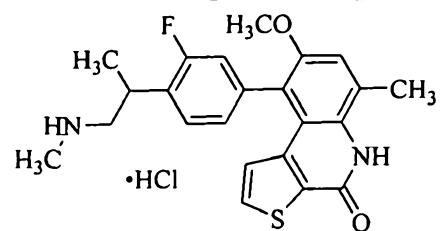


依照一般程序 D1，使第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯

基)-3-甲基丁基(甲基)胺基甲酸酯(100 mg, 0.2 mmol)與HCl在醚中反應(8 mL)以獲得所望產物(40 mg, 47%) 灰白色固體：ESI MS  $m/z$  421 [C<sub>25</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>

### 實施例 1286

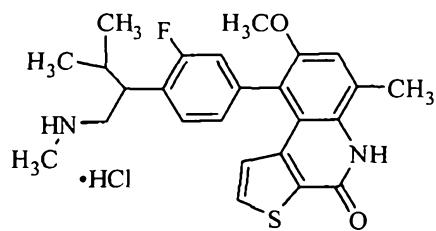
9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 D1，使第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯(100 mg, 0.20 mmol)與 HCl 在醚中反應(5 mL)以獲得所望產物(75 mg, 93%) 灰白色固體：  
<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>)  $\delta$  10.80(s, 1H), 7.75(dd, *J* = 11.7, 5.4 Hz, 1H), 7.52(t, *J* = 7.8 Hz, 1H), 7.30(s, 1H), 7.17 - 7.04(m, 2H), 5.87(dd, *J* = 35.8, 5.4 Hz, 1H), 3.71(s, 3H), 3.55(dd, *J* = 14.0, 6.8 Hz, 1H), 3.28(m, 2H), 2.63(d, *J* = 5.5 Hz, 3H), 2.59(s, 3H), 1.39(dt, *J* = 17.4, 7.6 Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  411 [C<sub>23</sub>H<sub>23</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.9%(AUC), *t*<sub>R</sub> = 10.75 min.

### 實施例 557

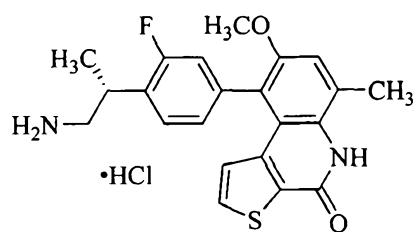
9-(3-氟-4-(3-甲基-1-(甲基胺基)丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 D1，使第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-3-甲基丁基(甲基)胺基甲酸酯(100 mg, 0.18 mmol)與 HCl 在醚中反應(6 mL)以獲得所望產物(55 mg, 70%) 灰白色固體：ESI MS  $m/z$  439 [C<sub>25</sub>H<sub>27</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>

#### 實施例 1317

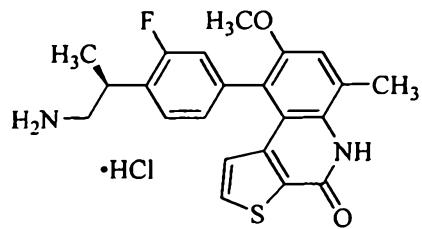
(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 D1，使(R)-第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(510 mg, 1.1 mmol)與 HCl 在醚中反應(25 mL)以獲得所望產物(312 mg, 78%) 灰白色固體：ESI MS  $m/z$  397 [C<sub>22</sub>H<sub>21</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>

#### 實施例 1310

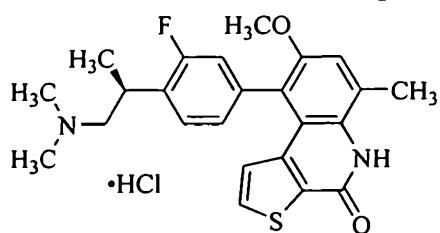
(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 D1，使 (*S*)-第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(520 mg, 1.1 mmol) was reacted with HCl(25 ml)以獲得所望產物(300 mg, 74%) 灰白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.63(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.51(dt,  $J$  = 23.5, 7.8 Hz, 1H), 7.29(s, 1H), 7.14 - 7.02(m, 2H), 6.16 - 6.05(m, 1H), 3.76(s, 3H), 3.54(ddd,  $J$  = 46.9, 14.5, 7.3 Hz, 1H), 3.43 - 3.20(m, 2H), 1.51(d,  $J$  = 7.0 Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  397 [C<sub>22</sub>H<sub>21</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.9%(AUC),  $t_R$  = 10.75 min.

### 實施例 1387

(*S*)-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

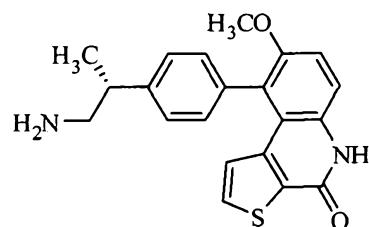


對於 (*S*)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽(110 mg, 0.27 mmol))於 MeOH/THF(3 mL) 1:1 混合物的溶液，添加三聚甲醛(7.5 mg, 0.24 mmol)，再添加 NaCNBH<sub>3</sub>(70 mg 1.2 mmol)，於室溫攪拌 16 小時。將反應混合物藉由添加 2 N

$\text{NaHCO}_3$ (1 mL)淬滅，經由 SCX 離子交換管柱洗提，並使用一般程序 D-2(流程 II)轉換為  $\text{HCl}$  鹽，以獲得所望產物(67 mg, 60%)白色固體：ESI MS  $m/z$  425 [ $\text{C}_{24}\text{H}_{25}\text{FN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ；

### 實施例 558

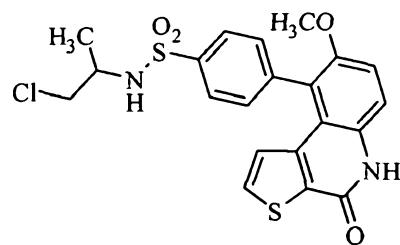
(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 C，使 (R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(2.5 g, 5.4 mmol)與 TFA 反應(10 mL)以獲得所望產物(1.6 g, 81%) 灰白色固體：ESI MS  $m/z$  365 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$

### 實施例 1205

N-(1-氯丙-2-基)-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺

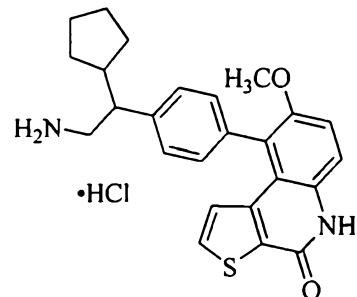


對於 N-(1-羥基丙-2-基)-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺(140 mg, 0.30 mmol)與三苯基膦(160 mg, 0.62 mmol)於  $\text{DMF}/\text{CCl}_4$ (1 mL / 3 mL)的混合物，添加  $\text{NCS}$ (41 mg, 0.31 mmol)，將反

應混合物於室溫攪拌 15 小時。將反應混合物以水稀釋(約 20 mL)，以 DCM 萃取(1 x 50 mL)。將萃取物以水(2 x 20 mL)、鹹水(1 x 10 mL)洗滌，以硫酸鈉乾燥，於真空中蒸發。將殘渣以閃式層析純化以獲得所望產物(100 mg, 74%) 淡黃色固體；ESI MS  $m/z$  464 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>ClN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>

### 實施例 1239

9-(4-(2-胺基-1-環戊基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



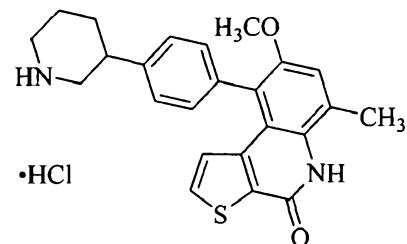
依照一般程序 D1，使第三丁基 2-環戊基-2-(4-(8-甲氧基-4-oxo-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基胺基甲酸酯(50 mg, 0.10 mmol)與 HCl 在醚中反應(5 mL)以獲得所望產物(29 mg, 69%) 灰白色固體：ESI MS  $m/z$  419 [C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>；<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>)  $\delta$  7.59(d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 7.59(d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 7.54(d, *J* = 9.0 Hz, 1H), 7.54(d, *J* = 9.0 Hz, 1H), 7.48(d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 7.44 - 7.36(m, 2H), 7.45 - 7.35(m, 2H), 7.28 - 7.19(m, 2H), 7.28 - 7.19(m, 2H), 5.72(d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 5.72(d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 3.70(s, 3H), 3.33 - 3.20(m, 2H), 2.84(td, *J* = 9.2, 6.0 Hz, 1H), 2.20 - 2.03(m, 1H), 1.98 -

1.84(=m, 1H), 1.76 - 1.35(=m, 5H), 1.28(dq,  $J = 18.0, 8.9$  Hz, 1H), 1.18 - 1.02(=m, 1H). HPLC >99%(AUC),  $t_R = 12.45$  min.

### 實施例 1301

8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(哌啶-3-基)苯基)噻吩并[2,3-c]

噁唑-4(5H)-酮 鹽酸鹽

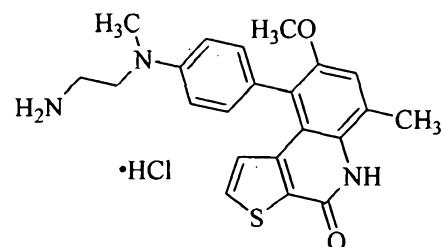


依照一般程序 D1，使第三丁基 3-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)苯基)哌啶-1-羧酸酯 (50 mg, 0.10 mmol) 與 HCl 在醚中反應 (2.5 mL) 以獲得所望產物 (31 mg, 77%) 灰白色固體：ESI MS  $m/z$  405 [C<sub>24</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>

### 實施例 1396

9-(4-((2-胺基乙基)(甲基)胺基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基

噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮 鹽酸鹽

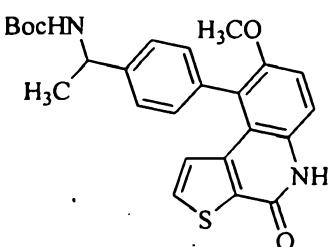


依照一般程序 D1，使第三丁基 2-((4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)苯基)(甲基)胺基)乙基胺基甲酸酯 (100 mg, 0.20 mmol) 與 HCl 在醚中反應 (10 mL) 以獲得所望產物 (65 mg, 83%) 灰

白色固體：ESI MS  $m/z$  394 [C<sub>22</sub>H<sub>23</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>

### 實施例 559

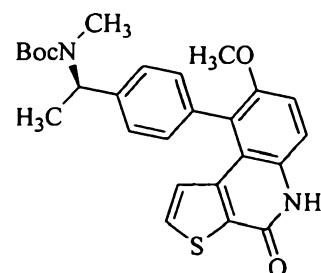
第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (600 mg, 1.9 mmol) 與 第三丁基 1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)乙基胺基甲酸酯 (1.34g, 3.87 mmol) 反應以獲得所望產物 (340 mg, 39%) 棕色固體：ESI MS  $m/z$  451 [C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 560

(R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基(甲基)胺基甲酸酯

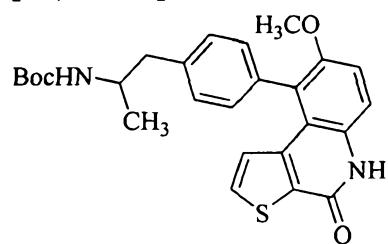


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (300 mg, 0.97 mmol) 與 (R)-第三丁基 甲基 (1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)乙基)胺基甲酸酯 (520 mg, 1.45 mmol) 反應以獲得所望產

物 (120 mg, 27%) 棕色固體: ESI MS m/z 465 [C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 561

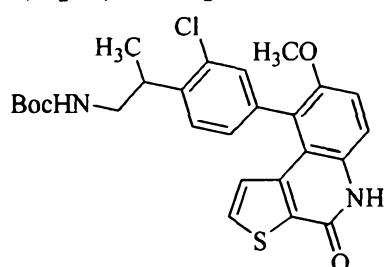
第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙-2-基氨基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (1.5 g, 4.4 mmol) 與 第三丁基 1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丙-2-基氨基甲酸酯 (2.6 g, 7.3 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.1 g, 50%) 棕色固體: ESI MS m/z 465 [C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 562

第三丁基 2-(2-氯-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基氨基甲酸酯

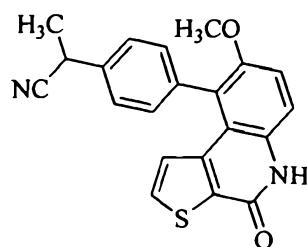


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (3.0 g, 9.7 mmol) 與 第三丁基 2-(2-氯-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丙基氨基甲酸酯 (5.7 g, 14 mmol) 反應以獲得所望產物 (2.7 g,

56%)棕色固體：ESI MS m/z 499 [C<sub>26</sub>H<sub>27</sub>C<sub>1</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 563

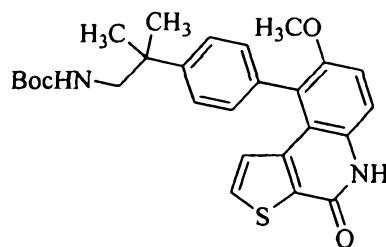
2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(500 mg, 1.6 mmol)與 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丙腈(600 g, 2.2 mmol)反應以獲得所望產物(350 mg, 62%)棕色固體：ESI MS m/z 361 [C<sub>21</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 564

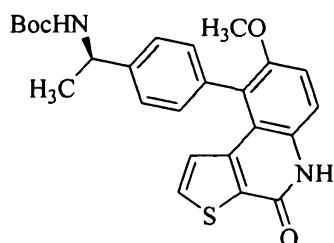
第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(2.0 g, 6.4 mmol)與第三丁基 2-甲基-2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(3.6 g, 9.7 mmol)反應以獲得所望產物(864 mg, 28%)棕色固體：ESI MS m/z 479 [C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 565

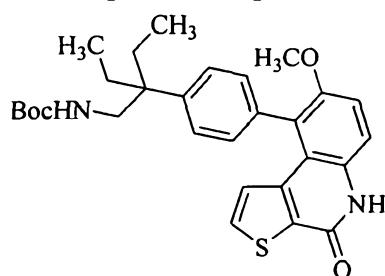
(R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基氨基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (3.0 g, 9.7 mmol) 與 (R)-第三丁基 1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)乙基氨基甲酸酯 (5.0 g, 14 mmol) 反應以獲得所望產物 (2.0 g, 47%) 棕色固體：ESI MS m/z 451 [C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 566

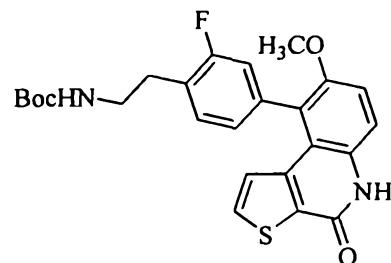
第三丁基 2-乙基-2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丁基氨基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (120 mg, 0.39 mmol) 與 2-乙基-2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丁-1-胺 (220 mg, 0.58 mmol) 反應以獲得所望產物 (50 mg, 27%) 棕色固體：ESI MS m/z 507 [C<sub>29</sub>H<sub>34</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 567

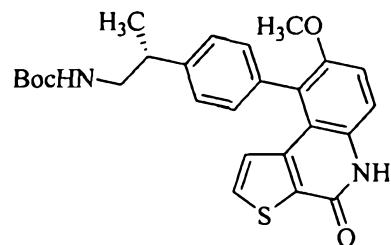
第三丁基 2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (1.5 g, 4.8 mmol) 與 第三丁基 2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯乙基胺基甲酸酯 (2.6 g, 7.3 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.5 g, 65%) 棕色固體：ESI MS m/z 469 [C<sub>25</sub>H<sub>25</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

實施例 568

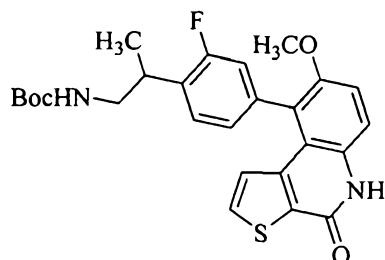
(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (1.5 g, 4.4 mmol) 與 (R)-第三丁基 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (2.0 g, 6.4 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.4 g, 48%) 棕色固體：ESI MS m/z 465 [C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

實施例 569

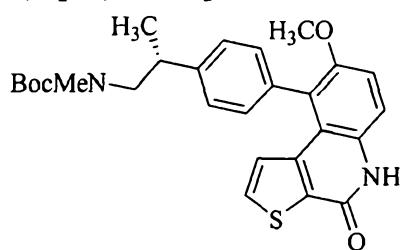
第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基氨基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(1.2 g, 3.8 mmol)與第三丁基 2-(2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丙基氨基甲酸酯(2.2 g, 5.8 mmol)反應以獲得所望產物(905 mg, 51%)棕色固體：ESI MS m/z 483 [C<sub>26</sub>H<sub>27</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

實施例 570

(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)氨基甲酸酯

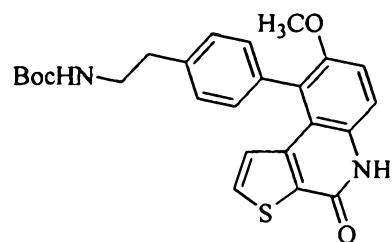


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(700 mg, 2.3 mmol) 與(R)-第三丁基 甲基(2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丙基)氨基甲酸酯(1.3 g, 3.4 mmol)反應以獲得所望產物(383 mg, 38%)黃色固體：ESI MS m/z 479 [C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

實施例 571

第三丁基 4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]

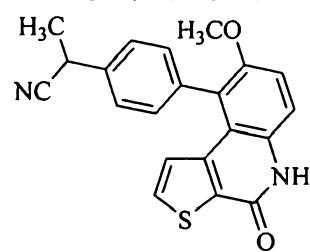
噁啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮(2.0 g, 6.4 mmol)與第三丁基 4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基) 苯乙基胺基甲酸酯(3.4 g, 9.4 mmol)反應以獲得所望產物(1.93 g, 65%)棕色固體：ESI MS m/z 451 [C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 572

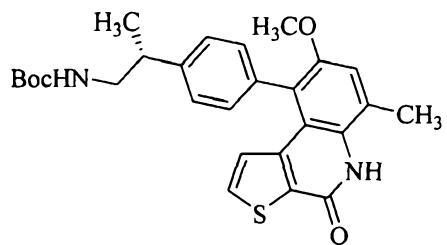
2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁啉-9-基)苯基)丙腈



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮(1.5 g, 4.84 mmol) 與 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基) 苯基) 丙腈(1.87 g, 7.26 mmol)反應以獲得所望產物(1.45 g, 82%)棕色固體：ESI MS m/z 361 [C<sub>21</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 573

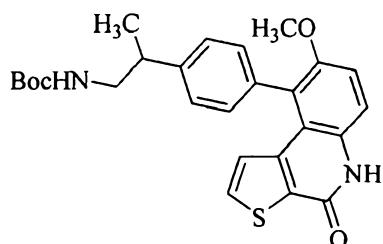
(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (3.0 g, 9.26 mmol) 與 (R)-第三丁基 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (5.2 g, 13.89 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.60 g, 35%) 棕色固體：ESI MS m/z 479 [ $C_{27}H_{30}N_2O_4S + H]^+$ 。

#### 實施例 574

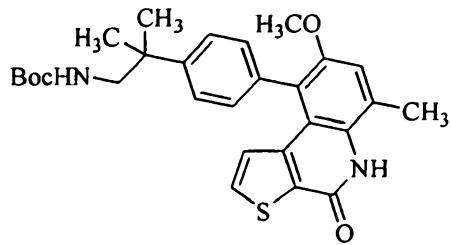
第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (800 mg, 4.84 mmol) 與 第三丁基 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (1.5 g, 4.16 mmol) 反應以獲得所望產物 (550 mg, 46%) 棕色固體：ESI MS m/z 465 [ $C_{26}H_{28}N_2O_4S + H]^+$ 。

#### 實施例 575

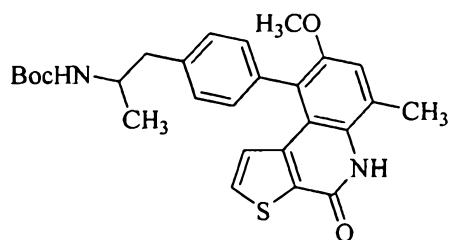
第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (200 mg, 0.62 mmol) 與 第三丁基 2-甲基-2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氫雜硼烷-2-基) 苯基)丙基胺基甲酸酯 (350 mg, 0.93 mmol) 反應以獲得所望產物 (95 mg, 62%) 棕色固體：ESI MS m/z 493 [C<sub>28</sub>H<sub>32</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 576

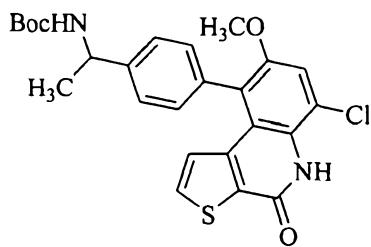
第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4, 5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基) 苯基)丙-2-基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (260 mg, 0.80 mmol) 與 第三丁基 1-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氫雜硼烷-2-基) 苯基)丙-2-基胺基甲酸酯 (430 g, 1.2 mmol) 反應以獲得所望產物 (212 mg, 55%) 黃色油：ESI MS m/z 479 [C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 577

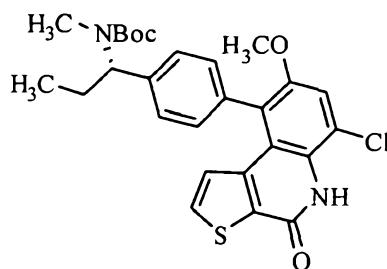
第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4, 5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基) 苯基)乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 H，使第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基乙基胺基甲酸酯)(130 mg, 0.37 mmol)與 NCS(64 mg, 0.48 mmol)反應以獲得所望產物(58 mg, 32%)黃色固體。ESI MS m/z 485 [C<sub>25</sub>H<sub>25</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 578

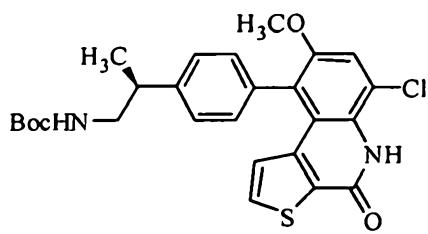
(S)-第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯



依照一般程序 H，使((S)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯)(200 mg, 0.41 mmol)與 NCS(68 mg, 0.50 mmol)反應以提供所望產物(130 mg, 61%)黃色固體：ESI MS m/z 513 [C<sub>27</sub>H<sub>29</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 579

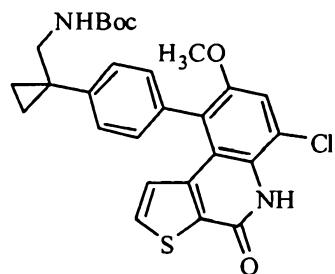
(S)-第三丁基 2-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 H，使 (S)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (500 mg, 1.08 mmol) 與 NCS (175 mg, 1.29 mmol) 反應以提供所望產物 (310 mg, 58%) 黃色固體：  
ESI MS m/z 499 [C<sub>26</sub>H<sub>27</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 580

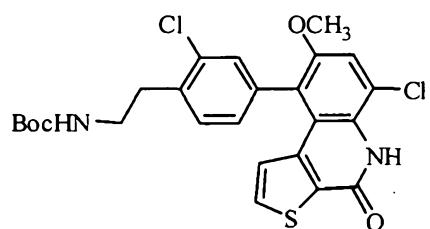
第三丁基 (1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)環丙基)甲基胺基甲酸酯



依照一般程序 H，使 第三丁基 (1-(4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)環丙基)甲基胺基甲酸酯 (300 mg, 0.629 mmol) 與 NCS (85 mg, 0.629 mmol) 反應以提供所望產物 (250 mg, 78%) 黃色固體：ESI MS m/z 511 [C<sub>27</sub>H<sub>27</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 581

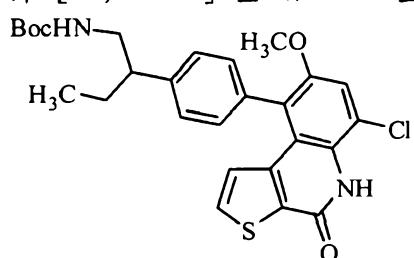
第三丁基 2-氯-4-(6-氯-8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 H，使第三丁基 2-氯-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯(127 mg, 0.26 mmol)與 NCS(43 mg, 0.312 mmol)反應以獲得所望產物(70 mg, 52%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  519 [ $C_{25}H_{24}Cl_2N_2O_4S + H$ ]<sup>+</sup>。

#### 實施例 582

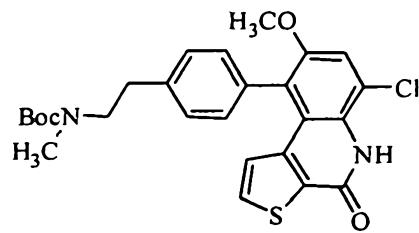
第三丁基 2-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丁基胺基甲酸酯



依照一般程序 H，使於(DMF)之第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丁基胺基甲酸酯(100 mg, 0.21 mmol)與 NCS(34 mg, 0.25 mmol)反應以獲得所望產物(65 mg, 61%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  513 [ $C_{27}H_{29}ClN_2O_4S + H$ ]<sup>+</sup>。

#### 實施例 583

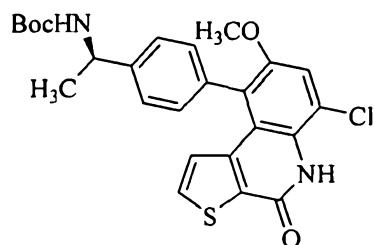
第三丁基 4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基(甲基)胺基甲酸酯



依照一般程序 H，使於(DMF)之第三丁基 4-(8-甲氧基 -4-側 氧 基 -4, 5-二 氯 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -9- 基 ) 苯 乙 基 ( 甲 基 ) 胺 基 甲 酸 酯 (200 mg, 0.43 mmol) 與 NCS(70 mg, 0.50 mmol) 反 應 以 獲 得 所 望 產 物 (120 mg, 55%) 黃 色 固 體 : ESI MS m/z 500 [C<sub>26</sub>H<sub>27</sub>ClN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實 施 例 584

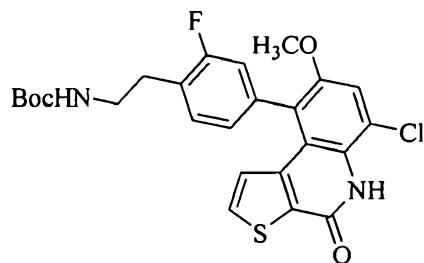
(R)-第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側 氧 基 -4, 5-二 氯 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -9- 基 ) 苯 基 ) 乙 基 胺 基 甲 酸 酯



依照一般程序 H，使 (R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基 -4-側 氧 基 -4, 5-二 氯 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -9- 基 ) 苯 基 ) 乙 基 胺 基 甲 酸 酯 (300 mg, 0.67 mmol) 與 NCS(110 mg, 0.87 mmol) 反 應 以 獲 得 所 望 產 物 (27 mg, 11%) 黃 色 固 體 : ESI MS m/z 485 [C<sub>25</sub>H<sub>25</sub>ClN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實 施 例 585

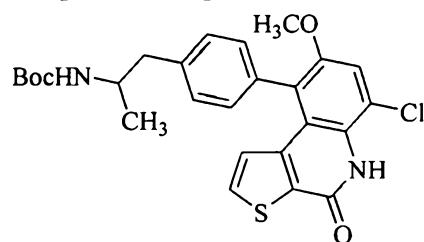
第三丁基 4-(6-氯-8-甲氧基-4-側 氧 基 -4, 5-二 氯 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -9- 基 ) -2- 氯 苯 乙 基 胺 基 甲 酸 酯



依照一般程序 H，使第三丁基 2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯(300 mg, 0.64 mmol)與 NCS(94 mg, 0.71 mmol)反應以獲得所望產物(150 mg, 46%)黃色固體。ESI MS m/z 503 [C<sub>25</sub>H<sub>24</sub>C1FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 586

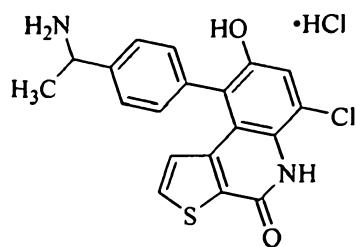
第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙-2-基胺基甲酸酯



依照一般程序 H，使第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙-2-基胺基甲酸酯(220 mg, 0.47 mmol)與 NCS(69 mg, 0.52 mmol)反應以獲得所望產物(60 mg, 26%)棕色固體。ESI MS m/z 499 [C<sub>26</sub>H<sub>27</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 1041

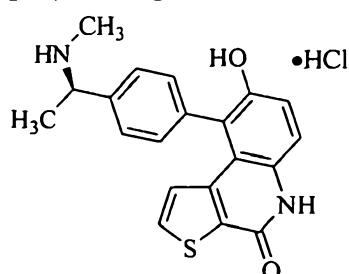
9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲氨基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基胺基甲酸酯(50 mg, 0.10 mmol)與  $\text{BBr}_3$ (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 2 mL, 2 mmol)反應以獲得所望產物(21 mg, 58%)淡黃色固體(21 mg, 58%):  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.65(dt,  $J = 5.2, 3.4$  Hz, 2H), 7.59(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.41(dt,  $J = 4.0, 2.6$  Hz, 2H), 7.30(s, 1H), 6.07(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.62(q,  $J = 6.8$  Hz, 1H), 1.76(d,  $J = 6.9$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  371 [ $\text{C}_{19}\text{H}_{15}\text{ClN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 97.8%(AUC),  $t_R = 9.72$  min.

### 實施例 1052

#### (R)-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽



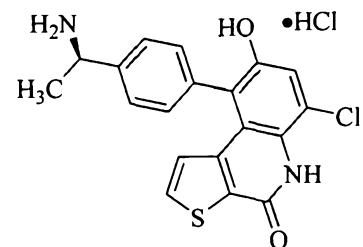
依照一般程序 F，使(R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氨基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基(甲基)胺基甲酸酯(120 mg, 0.25 mmol)與  $\text{BBr}_3$ (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 3 mL, 3 mmol)反應以獲得所望產物(50 mg, 56%)

淡黃色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.64(ddd,  $J = 7.1, 5.6, 2.3$  Hz, 2H), 7.57(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.49 - 7.39(m, 3H), 7.18(d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.04(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.48(q,  $J = 7.0$  Hz, 1H), 2.72(s, 3H), 1.80(d,  $J = 6.9$  Hz, 3H); ESI MS m/z 351 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.6%(AUC),  $t_R = 7.82$  min.

### 實施例 1081

(R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]

喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

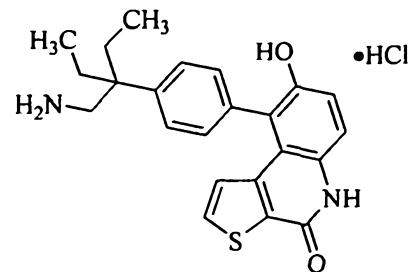


依照一般程序 F，使第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基胺基甲酸酯(35 mg, 0.07 mmol)與 BBr<sub>3</sub>(1.0 M 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, 2 mL, 2 mmol)反應以獲得所望產物(23 mg, 84%)淡黃色固體：  
 $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.67 - 7.61(m, 2H), 7.59(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.44 - 7.39(m, 2H), 7.30(s, 1H), 6.07(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.62(q,  $J = 6.8$  Hz, 1H), 1.76(d,  $J = 6.9$  Hz, 3H); ESI MS m/z 371 [C<sub>19</sub>H<sub>15</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.2%(AUC),  $t_R = 9.58$  min.

### 實施例 1209

9-(4-(3-(胺基甲基)戊-3-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]

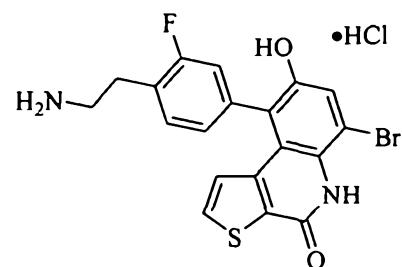
## 喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 2-乙基-2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丁基胺基甲酸酯(20 mg, 0.05 mmol)與  $\text{BBr}_3$ (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 3 mL, 3 mmol)反應以獲得所望產物(7.0 mg, 36%)淡黃色固體： $^1\text{H NMR}$ (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.63(d,  $J = 8.4$  Hz, 2H), 7.54(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.45 – 7.37(m, 3H), 7.19(dd,  $J = 8.9, 2.2$  Hz, 1H), 6.08(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.29(s, 2H), 1.97(dt,  $J = 14.6, 7.2$  Hz, 4H), 0.93(t,  $J = 7.4$  Hz, 6H). ESI MS  $m/z$  393 [ $\text{C}_{23}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 99.6%(AUC),  $t_{\text{R}} = 9.47$  min.

## 實施例 1213

## 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-溴-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

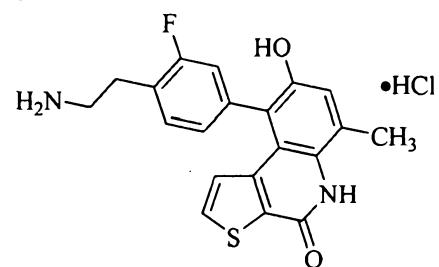


依照一般程序 F，使第三丁基 4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-氟苯乙基胺基甲酸酯(100 mg, 0.18 mmol)以  $\text{BBr}_3$ (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ ,

5 mL, 5 mmol)處理以獲得所望產物灰白色固體(24 mg, 30%):  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.69(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.51(t,  $J = 7.7$  Hz, 1H), 7.48(s, 1H), 7.14(d,  $J = 9.0$  Hz, 2H), 6.18(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.37 - 3.20(m, 3H), 3.14 - 3.04(m, 1H); ESI MS m/z 433 [ $\text{C}_{19}\text{H}_{14}\text{BrFN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 98.6%(AUC),  $t_{\text{R}} = 9.12$  min.

### 實施例 1217

9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

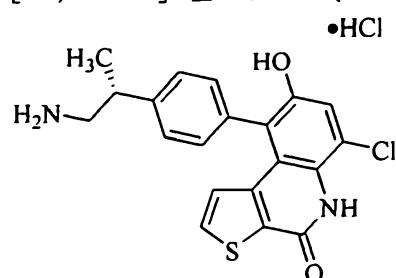


依照一般程序 F, 使第三丁基 2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯(78 mg, 0.16 mmol)以  $\text{BBr}_3$ (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 3 mL, 3 mmol)處理以獲得所望產物黃色固體(16 mg, 27%):  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.62(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.49(t,  $J = 7.9$  Hz, 1H), 7.14 - 7.05(m, 3H), 6.21(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.36 - 3.21(m, 2H), 3.13 - 3.04(m, 1H), 2.57(s, 3H); ESI MS m/z 369 [ $\text{C}_{20}\text{H}_{17}\text{FN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 97.3%(AUC),  $t_{\text{R}} = 8.47$  min.

### 實施例 1166

(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并

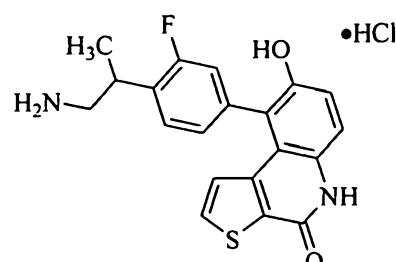
## [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使 (R)-第三丁基 2-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (100 mg, 0.20 mmol) 以  $\text{BBr}_3$  (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 5 mL, 5 mmol) 處理以獲得所望產物白色固體 (23 mg, 30%)： $^1\text{H NMR}$  (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.63 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.56 (dd,  $J = 7.9, 1.9$  Hz, 1H), 7.47 (dd,  $J = 7.8, 1.9$  Hz, 1H), 7.39 – 7.28 (m, 3H), 6.12 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.36 – 3.13 (m, 3H), 1.49 (d,  $J = 6.5$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  385 [ $\text{C}_{20}\text{H}_{17}\text{ClN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 98.4% (AUC),  $t_R = 9.19$  min.

## 實施例 1174

## 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

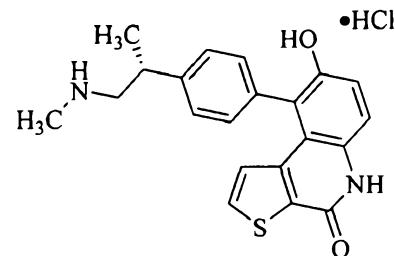


依照一般程序 F，使第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (120 mg, 0.25 mmol) 以  $\text{BBr}_3$  (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 5

mL, 5 mmol)處理以獲得所望產物灰白色固體(35 mg, 37%).  
<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.65(dd, *J* = 5.4, 3.4 Hz, 1H),  
 7.59(s, 1H), 7.51(s, 1H), 7.43(dd, *J* = 8.9, 2.3 Hz,  
 1H), 7.24 – 7.09(m, 2H), 6.22(dd, *J* = 9.4, 5.4 Hz,  
 1H), 3.62(d, *J* = 7.2 Hz, 1H), 3.49 – 3.25(m, 2H),  
 1.52(t, *J* = 6.7 Hz, 3H); ESI MS m/z 369 [C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S  
 + H]<sup>+</sup>; HPLC 99.3%(AUC), t<sub>R</sub> = 8.37 min.

### 實施例 1187

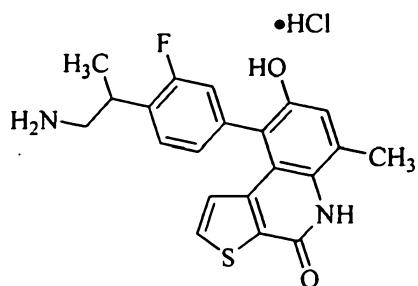
(R)-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽



依照一般程序 F，將(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯(250 mg, 0.52 mmol)以 BBr<sub>3</sub>(1.0 M 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, 4 mL, 4 mmol)處理以獲得所望產物淡黃色固體(39 mg, 42%).  
<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.58(dd, *J* = 10.8, 3.6 Hz, 2H), 7.50 – 7.46(m, 1H), 7.42(d, *J* = 8.9 Hz, 1H), 7.38(dd, *J* = 7.9, 1.8 Hz, 1H), 7.32(dd, *J* = 7.7, 1.7 Hz, 1H), 7.18(d, *J* = 8.9 Hz, 1H), 6.14(d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 3.37 – 3.28(m, 3H), 2.75(s, 3H), 1.50(d, *J* = 6.7 Hz, 3H); ESI MS m/z 365 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.1%(AUC), t<sub>R</sub> = 8.43 min.

## 實施例 1190

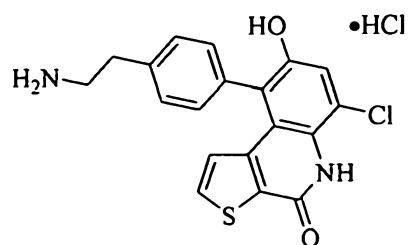
9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(120 mg, 0.25 mmol)以  $\text{BBr}_3$ (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 5 mL, 5 mmol)處理以獲得所望產物灰白色固體(39 mg, 42%).  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.64(dd,  $J = 5.4, 4.6$  Hz, 1H), 7.57(t,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.48(t,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.22 - 7.05(m, 3H), 6.23(dd,  $J = 8.4, 5.4$  Hz, 1H), 3.61(dd,  $J = 14.4, 7.2$  Hz, 1H), 3.51 - 3.23(m, 2H), 2.57(s, 3H), 1.52(t,  $J = 7.0$  Hz, 3H); ESI MS m/z 383 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 96.1%(AUC),  $t_R = 8.85$  min.

## 實施例 1133

9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-6-氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

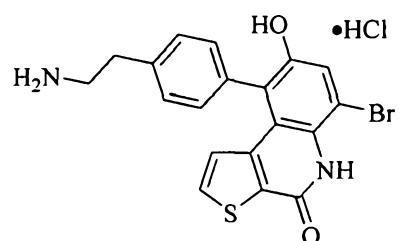


依照一般程序 F，使第三丁基 4-(6-氟-8-甲氧基-4-

側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯(79 mg, 0.25 mmol)以  $\text{BBr}_3$ (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 9 mL, 9 mmol)處理以獲得所望產物黃色固體(12 mg, 20%).  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.61(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.49(d,  $J = 8.1$  Hz, 2H), 7.31(d,  $J = 7.0$  Hz, 3H), 6.10(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.37 - 3.27(m, 2H), 3.12(t,  $J = 7.6$  Hz, 2H); ESI MS m/z 371 [ $\text{C}_{19}\text{H}_{15}\text{ClN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 96.9%(AUC),  $t_R = 8.83$  min.

#### 實施例 1142

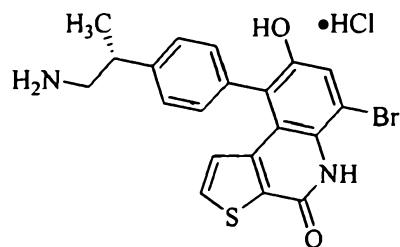
9-(4-(2-氨基乙基)苯基)-6-溴-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F, 使第三丁基 4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯(410 mg, 0.76 mmol)以  $\text{BBr}_3$ (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 10 mL, 10 mmol)處理以獲得所望產物灰白色固體(58 mg, 18%):  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.62(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.53 - 7.45(m, 3H), 7.31(d,  $J = 8.1$  Hz, 2H), 6.10(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.31 - 3.28(m, 2H), 3.11(t,  $J = 7.6$  Hz, 2H); ESI MS m/z 415 [ $\text{C}_{19}\text{H}_{15}\text{BrN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 94.9%(AUC),  $t_R = 9.02$  min.

#### 實施例 1176

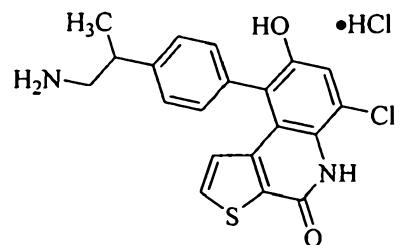
(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐



依照一般程序 F，使 (R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (60 mg, 0.11 mmol) 與  $\text{BBr}_3$  (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 6 mL, 6 mmol) 反應以獲得所望產物灰白色固體 (24 mg, 51%)： $^1\text{H NMR}$  (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.64(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.56(dd,  $J = 7.9, 1.9$  Hz, 1H), 7.50 – 7.45(m, 2H), 7.37(dd,  $J = 7.9, 1.8$  Hz, 1H), 7.32(dd,  $J = 7.7, 1.7$  Hz, 1H), 6.12(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.36 – 3.18(m, 3H), 1.49(d,  $J = 6.5$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  429 [ $\text{C}_{20}\text{H}_{17}\text{BrN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99% (AUC),  $t_R = 9.30$  min.

### 實施例 1136

9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮盐酸盐

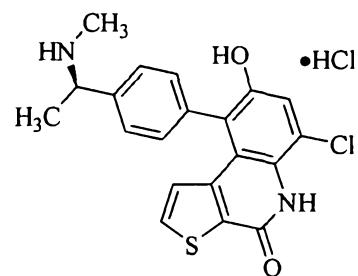


依照一般程序 F，使 第三丁基 2-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (40 mg, 0.08 mmol) 與  $\text{BBr}_3$  (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 3

mL, 3 mmol)反應以獲得所望產物黃色固體(13 mg, 40%):  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.63(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.56(dd,  $J$  = 7.9, 1.8 Hz, 1H), 7.48(dd,  $J$  = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.40 - 7.28(m, 3H), 6.12(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.29 - 3.19(m, 3H), 1.49(d,  $J$  = 6.3 Hz, 3H); ESI MS m/z 385 [C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>C<sub>1</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 99%(AUC),  $t_R$  = 8.12 min.

### 實施例 1132

(R)-6-氯-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

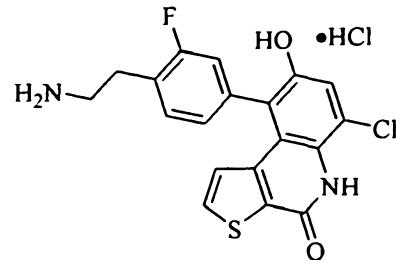


依照一般程序 F, 使(R)-第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲  
氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)  
乙基(甲基)胺基甲酸酯(43 mg, 0.09 mmol)以 BBr<sub>3</sub>(1.0 M  
於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, 4 mL, 4 mmol)處理以獲得所望產物白色固體(15  
mg, 45%):  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.69 - 7.59(m, 3H),  
7.45(dd,  $J$  = 7.0, 5.8, 2.1 Hz, 2H), 7.30(s, 1H),  
6.03(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 4.48(q,  $J$  = 6.9 Hz, 1H), 2.72(s,  
3H), 1.79(d,  $J$  = 6.9 Hz, 3H); ESI MS m/z 385  
[C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>C<sub>1</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.1%(AUC),  $t_R$  = 8.85 min.

### 實施例 1219

9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并

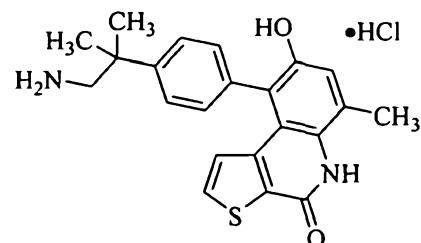
## [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 4-(6-氯-8-甲氨基-4-側氨基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)-2-氟苯乙基胺基甲酸酯(70 mg, 0.14 mmol)以  $\text{BBr}_3$ (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 6 mL, 6 mmol)處理以獲得所望產物白色固體(26 mg, 48%);  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.67(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.51(t,  $J = 7.7$  Hz, 1H), 7.30(s, 1H), 7.17 - 7.11(m, 2H), 6.18(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.35 - 3.20(m, 2H), 3.14 - 3.04(m, 1H); ESI MS  $m/z$  389 [ $\text{C}_{19}\text{H}_{14}\text{ClFN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99%(AUC),  $t_R = 8.93$  min.

## 實施例 1228

## 9-(4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

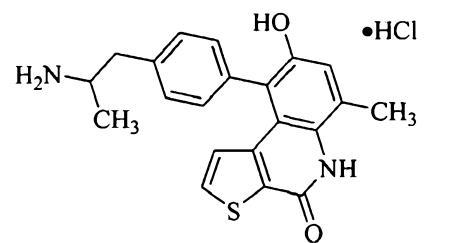


依照一般程序 F，使第三丁基 2-(4-(8-甲氨基-6-甲基-4-側氨基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙基胺基甲酸酯(40 mg, 0.08 mmol)以  $\text{BBr}_3$ (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 4 mL, 4 mmol)處理以獲得所望產物棕色固體

(21 mg, 67%);  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.64(d,  $J = 8.4$  Hz, 2H), 7.58(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.36(d,  $J = 8.3$  Hz, 2H), 7.09(s, 1H), 6.18(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.28(s, 2H), 2.58(s, 3H), 1.58(s, 6H); ESI MS  $m/z$  379 [ $\text{C}_{22}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 96.5%(AUC),  $t_{\text{R}} = 9.04$  min.

### 實施例 1242

#### 9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

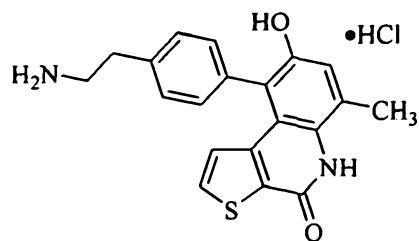


依照一般程序 F，使第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙-2-基胺基甲酸酯(90 mg, 0.19 mmol)以  $\text{BBr}_3$ (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 8 mL, 8 mmol)處理以獲得所望產物淡棕色固體(25 mg, 53%):  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.57(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.45(dd,  $J = 20.6, 7.8$  Hz, 2H), 7.32 - 7.26(m, 2H), 7.09(s, 1H), 6.12(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.65(dd,  $J = 13.7, 6.9$  Hz, 1H), 3.14 - 2.99(m, 2H), 2.57(s, 3H), 1.41(d,  $J = 6.6$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  365 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 98.6%(AUC),  $t_{\text{R}} = 8.68$  min.

### 實施例 1191

#### 9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噁吩并[2,3-c]

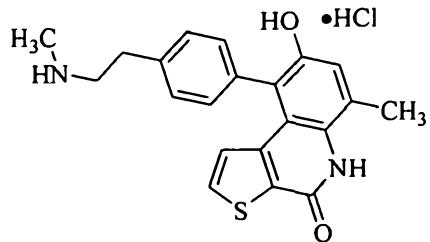
## 喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯(30 mg, 0.06 mmol)以  $\text{BBr}_3$ (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 4 mL, 4 mmol)處理以獲得所望產物淡黃色固體(20 mg, 90%):  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.55(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.47(d,  $J = 8.1$  Hz, 2H), 7.30(d,  $J = 8.1$  Hz, 2H), 7.07(d,  $J = 0.8$  Hz, 1H), 6.14(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.34 - 3.27(m, 2H), 3.11(t,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 2.57(s, 3H); ESI MS m/z 351 [ $\text{C}_{20}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 98.4%(AUC),  $t_{\text{R}} = 8.32$  min.

## 實施例 1364

## 8-羥基-6-甲基-9-(4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

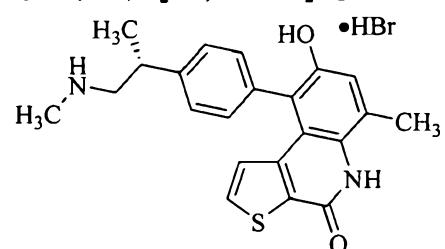


依照一般程序 F，使 8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(32 mg, 0.06 mmol)以  $\text{BBr}_3$ (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 3 mL, 3 mmol)處理以獲得所望產物淡黃色固體(15 mg, 62%):  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.55(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.47(d,  $J = 8.1$  Hz,

2H), 7.34 - 7.27(m, 2H), 7.07(d,  $J = 0.7$  Hz, 1H), 6.12(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.39(t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 3.18 - 3.10(m, 2H), 2.79(s, 3H), 2.57(s, 3H); ESI MS m/z 365 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC), t<sub>R</sub> = 8.41 min.

### 實施例 1307

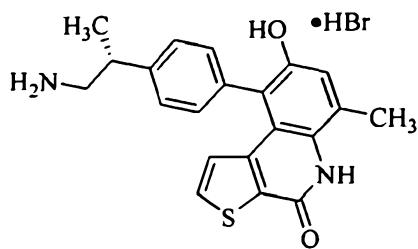
(R)-8-羥基-6-甲基-9-(4-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 溴化氫鹽



依照一般程序 F，使(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯(2.08 g, 4.23 mmol)以 BBr<sub>3</sub>(1.0 M 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, 40 mL, 40 mmol)處理以獲得所望產物黃色固體(1.05 g, 65%); <sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.60 - 7.54(m, 2H), 7.46(dd,  $J = 7.8, 1.9$  Hz, 1H), 7.37(dd,  $J = 7.9, 1.8$  Hz, 1H), 7.31(dd,  $J = 7.7, 1.7$  Hz, 1H), 7.08(d,  $J = 0.8$  Hz, 1H), 6.16(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.37 - 3.24(m, 3H), 2.74(s, 3H), 2.57(s, 3H), 1.50(d,  $J = 6.8$  Hz, 3H); ESI MS m/z 379 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC), t<sub>R</sub> = 8.74 min.

### 實施例 1169

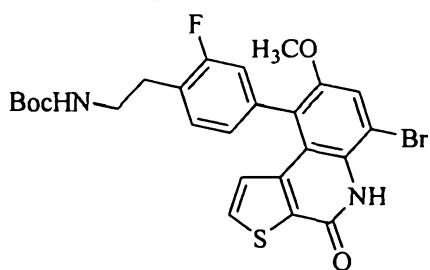
(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 溴化氫鹽



依照一般程序 F，使 (R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯 (2.20 g, 4.60 mmol) 以  $\text{BBr}_3$  (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 50 mL, 50 mmol) 處理以獲得所望產物黃色固體 (1.50 g, 73%)： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.58 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.55 (dd,  $J = 7.9, 1.8$  Hz, 1H), 7.45 (dd,  $J = 7.8, 1.9$  Hz, 1H), 7.35 (dd,  $J = 7.9, 1.7$  Hz, 1H), 7.30 (dd,  $J = 7.7, 1.6$  Hz, 1H), 7.08 (d,  $J = 0.8$  Hz, 1H), 6.17 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.36 - 3.19 (m, 3H), 2.57 (d,  $J = 0.6$  Hz, 3H), 1.50 (d,  $J = 6.4$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  365 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 98.3% (AUC),  $t_{\text{R}} = 8.64$  min.

### 實施例 587

第三丁基 4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-氟苯乙基胺基甲酸酯

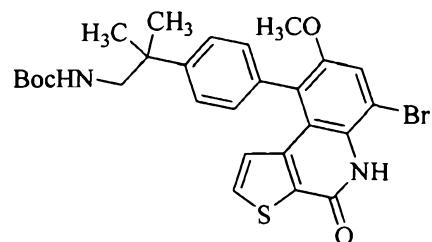


依照一般程序 I，使第三丁基 2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯 (1.1 g, 2.3 mmol) 與  $\text{NBS}$  (540 mg, 3.1 mmol) 反應

以獲得所望產物(920 mg, 70%)棕色固體。ESI MS m/z 547  
 $[C_{25}H_{24}BrFN_2O_4S + H]^+$ 。

### 實施例 588

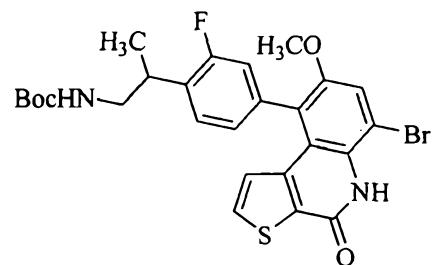
第三丁基 2-(4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙基胺基甲酸酯



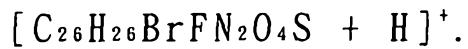
依照一般程序 I，使第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙基胺基甲酸酯(600 mg, 1.3 mmol)與 NBS(330 mg, 1.9 mmol)反應以獲得所望產物(350 mg, 51%)黃色固體：ESI MS m/z 557  $[C_{27}H_{29}BrN_2O_4S + H]^+$ 。

### 實施例 589

第三丁基 2-(4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-氟苯基)丙基胺基甲酸酯

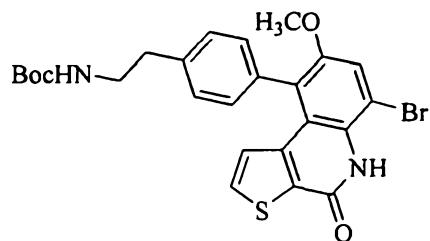


依照一般程序 I，使第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(500 mg, 1.0 mmol)與 NBS(220 mg, 1.2 mmol)反應以獲得所望產物(280 mg, 48%)棕色油。ESI MS m/z 561



## 實施例 590

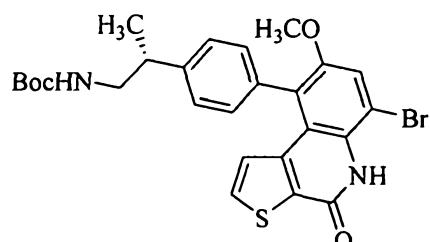
第三丁基 4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 I，使第三丁基 4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯(600 mg, 1.3 mmol)與 NBS(280 mg, 1.5 mmol)反應以獲得所望產物(410 mg, 60%) 淡紅棕色固體。ESI MS m/z 529 [C<sub>25</sub>H<sub>25</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>.

## 實施例 591

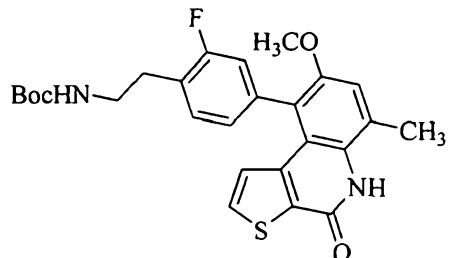
(R)-第三丁基 2-(4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 I，使(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(220 mg, 0.39 mmol) 與 NBS(90 mg, 0.51 mmol) 反應以獲得所望產物(60 mg, 28%) 淡紅色油：ESI MS m/z 543 [C<sub>26</sub>H<sub>27</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 592

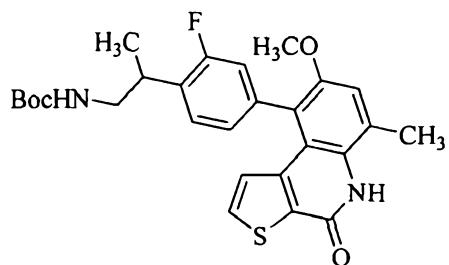
第三丁基 2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 I，使第三丁基 4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-氟苯乙基胺基甲酸酯(300 mg, 0.55 mmol)與三甲基硼氫三聚物(207 mg, 1.65 mmol)及 Pd(pph<sub>3</sub>)<sub>4</sub>(63 mg, 0.05 mmol)反應以獲得所望產物(155 mg, 58%)棕色固體。ESI MS m/z 483 [C<sub>26</sub>H<sub>27</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 593

第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯

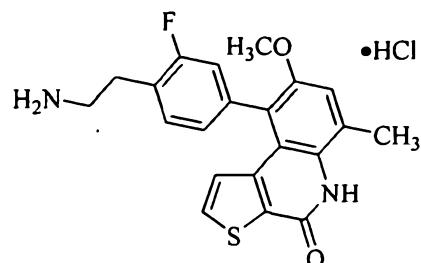


依照一般程序 I，使第三丁基 2-(4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-氟苯基)丙基胺基甲酸酯(282 mg, 0.50 mmol)與三甲基硼氫三聚物(170 mg, 1.35 mmol)及 Pd(pph<sub>3</sub>)<sub>4</sub>(50 mg, 0.04 mmol)反應以獲得所望產物(130 mg, 52%)黃色固體。ESI MS m/z

497 [C<sub>27</sub>H<sub>29</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

實施例 1216

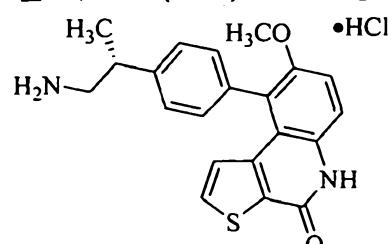
9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 C，使第三丁基 2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯(50 mg, 0.10 mmol)與 TFA(2 mL)反應以獲得所望產物(32 mg, 80%)黃色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.62(d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.48(dd, J = 9.7, 6.1 Hz, 1H), 7.29(s, 1H), 7.08(dd, J = 9.0, 6.2, 1.6 Hz, 2H), 6.12(d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.75(s, 3H), 3.34 - 3.27(m, 1H), 3.27 - 3.06(m, 3H), 2.64(s, 3H); ESI MS m/z 383 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.6%(AUC), t<sub>R</sub> = 9.22 min.

實施例 1161

(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

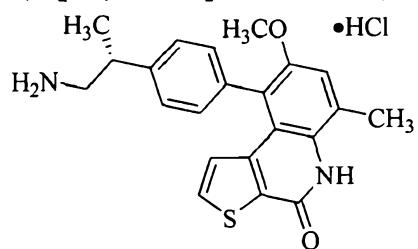


依照一般程序 C，使(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基

-4-側 氧 基 -4, 5-二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 噻 吡 -9-基 ) 苯 基 ) 丙 基 胺 基 甲 酸 酯 (200 mg, 0.55 mmol) 與 TFA(10 mL) 反 應 以 獲 得 所 望 產 物 (51 mg, 26%) 白 色 固 體:  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.61 - 7.44(m, 4H), 7.39(d,  $J$  = 9.1 Hz, 1H), 7.30(dd,  $J$  = 13.2, 7.9, 1.7 Hz, 2H), 6.00(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.33 - 3.18(m, 3H), 1.49(d,  $J$  = 6.6 Hz, 3H); ESI MS m/z 365 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.6%(AUC),  $t_{\text{R}}$  = 8.88 min

### 實 施 例 1305

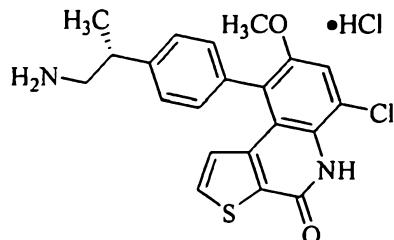
(R)-9-(4-(1-胺 基 丙 -2-基 ) 苯 基 ) -8-甲 氧 基 -6-甲 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 噻 吡 -4(5H)-酮 鹽 酸 鹽



依 照 一 般 程 序 C , 使 (R)-第 三 丁 基 2-(4-(8-甲 氧 基 -6-甲 基 -4-側 氧 基 -4, 5-二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 噻 吡 -9-基 ) 苯 基 ) 丙 基 胺 基 甲 酸 酯 (1.5 g, 3.1 mmol) 與 TFA(30 mL) 反 應 以 獲 得 所 望 產 物 (520 mg, 47%) 黃 色 固 體:  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.56(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.50(dd,  $J$  = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.45(dd,  $J$  = 7.7, 1.9 Hz, 1H), 7.28(dd,  $J$  = 9.4, 7.0, 1.7 Hz, 3H), 6.01(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.75(s, 3H), 3.36 - 3.18(m, 3H), 2.64(s, 3H), 1.48(d,  $J$  = 6.6 Hz, 3H); ESI MS m/z 379 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 99%(AUC),  $t_{\text{R}}$  = 8.81 min.

## 實施例 1201

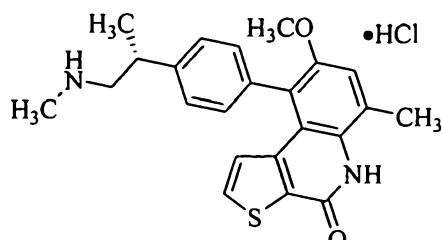
(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-甲氧基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 C，使(R)-第三丁基 2-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(60 mg, 0.12 mmol)與 TFA(4 mL)反應以獲得所望產物(28 mg, 52%)黃色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.61(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.54 - 7.50(m, 2H), 7.48(dd,  $J = 7.8, 1.7$  Hz, 1H), 7.32 - 7.25(m, 2H), 5.97(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.76(s, 1H), 3.29 - 3.17(m, 3H), 1.48(d,  $J = 6.5$  Hz, 2H); ESI MS m/z 399 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC),  $t_R = 9.65$  min.

## 實施例 1298

(R)-8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

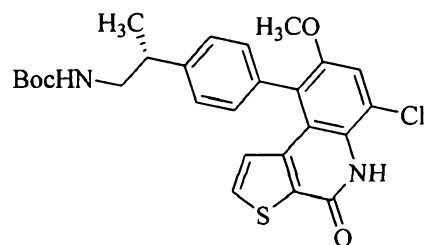


依照一般程序 C，使(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯(600 mg, 1.2 mmol)與 TFA(20 mL)

反應以獲得所望產物(330 mg, 69%)淡黃色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.56(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.52(dd,  $J = 7.9, 1.9$  Hz, 1H), 7.47(dd,  $J = 7.7, 1.9$  Hz, 1H), 7.28(ddd,  $J = 14.7, 7.9, 1.7$  Hz, 3H), 6.00(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.36 – 3.26(m, 3H), 2.76(s, 3H), 2.64(s, 3H), 1.48(d,  $J = 6.7$  Hz, 3H); ESI MS m/z 393 [C<sub>23</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.6%(AUC),  $t_{\text{R}} = 8.96$  min.

#### 實施例 594

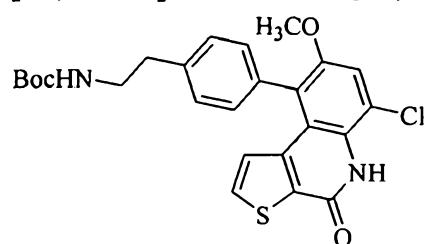
(R)-第三丁基 2-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基氨基甲酸酯



依照一般程序 H，使(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基氨基甲酸酯(400 mg, 0.86 mmol)與 NCS(138 mg, 1.03 mmol)反應以獲得所望產物(210 mg, 49%)棕色固體。ESI MS m/z 499 [C<sub>26</sub>H<sub>27</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 595

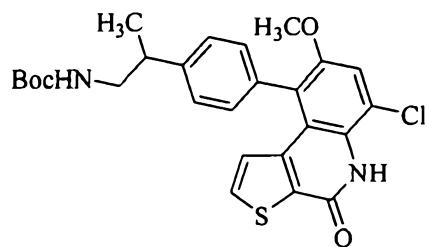
第三丁基 4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基氨基甲酸酯



依照一般程序 H，使第三丁基 4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 哚啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯(200 mg, 0.43 mmol)與 NCS(68 mg, 0.52 mmol)反應以獲得所望產物(79 mg, 38%)棕色固體。ESI MS m/z 485 [C<sub>25</sub>H<sub>25</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 596

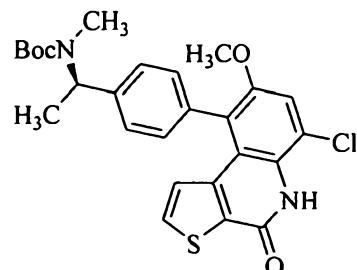
第三丁基 2-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 哚啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 H，使第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 哚啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(180 mg, 0.39 mmol)與 NCS(57 mg, 0.42 mmol)反應以獲得所望產物(110 mg, 56%)淡黃色固體。ESI MS m/z 499 [C<sub>26</sub>H<sub>27</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 597

(R)-第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 哚啉-9-基)苯基)乙基(甲基)胺基甲酸酯

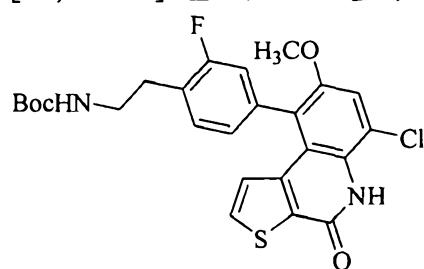


依照一般程序 H，使(R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-

-4-側 氧 基 -4, 5-二 氢 嘧 吩 并 [2, 3-c] 喹 吼 -9- 基 ) 苯 基 ) 乙 基  
( 甲 基 ) 胺 基 甲 酸 酯 (200 mg, 0.43 mmol) 與 NCS(69 mg, 0.52  
mmol) 反 應 以 獲 得 所 望 產 物 (43 mg, 20%) 淡 黃 色 固 體 。 ESI  
MS m/z 499 [C<sub>26</sub>H<sub>27</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實 施 例 598

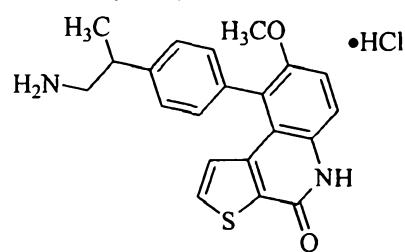
第 三 丁 基 4-(6-氯 -8- 甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5-二 氢 嘙 吩 并  
[2, 3-c] 喹 吼 -9- 基 ) -2- 氯 苯 乙 基 胺 基 甲 酸 酯



依 照 一 般 程 序 H , 使 第 三 丁 基 2-氯 -4-(8- 甲 氧 基 -4-  
側 氧 基 -4, 5-二 氢 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吼 -9- 基 ) 苯 乙 基 胺 基 甲  
酸 酯 (300 mg, 0.64 mmol) 與 NCS(94 mg, 0.71 mmol) 反 應  
以 獲 得 所 望 產 物 (150 mg, 46%) 黃 色 固 體 。 ESI MS m/z 503  
[C<sub>25</sub>H<sub>24</sub>C1FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實 施 例 373

9-(4-(1-胺 基 丙 -2- 基 ) 苯 基 ) -8- 甲 氧 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹  
啉 -4(5H)- 酮 鹽 酸 鹽

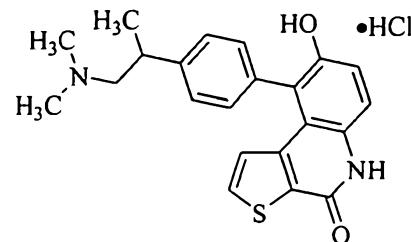


對 於 2-(4-(8- 甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5-二 氢 嘙 吩 并  
[2, 3-c] 喹 吼 -9- 基 ) 苯 基 ) 丙 脂 (1.4 g, 4.0 mmol) 於 甲 苯

(10 mL) 的溶液，於 0 °C 添加  $\text{BH}_3 \cdot \text{THF}$  (1.0 M 於 THF, 10 mL, 10 mmol)，將反應物加溫至室溫，並加熱回流 4 小時。將反應物藉由添加 0 °C 的甲醇 (1 mL) 瓢滅。將得到的混合物濃縮，並以製備性 HPLC 純化 (C18 二氧化矽，乙腈/水 (有 0.05% TFA) 梯度)。將所望產物溶於  $\text{HCl}$  水溶液，於高真空濃縮及乾燥以獲得所望產物 (352 mg, 24%) 棕色固體：ESI MS m/z 365 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ 。

### 實施例 1112

#### 9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

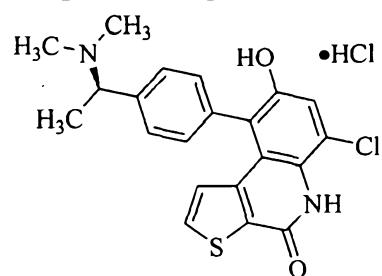


依照實施例 1387 概述的程序，使 9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并 [2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽 (15 mg, 0.040 mmol) 與三聚甲醛 (4.0 mg, 0.13 mmol) 反應，於純化後將所得的材料如一般程序 D-2 所揭示，轉換為鹽酸鹽，以獲得所望產物 (12 mg, 75%) 淡黃色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.66 - 7.51 (m, 3H), 7.47 - 7.30 (m, 3H), 7.18 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.12 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.67 - 3.57 (m, 1H), 3.51 - 3.38 (m, 2H), 2.95 (d,  $J = 16.0$  Hz, 6H), 1.49 (d,  $J = 6.5$  Hz, 3H); ESI MS m/z 379 [ $\text{C}_{22}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99% (AUC),  $t_R = 8.46$  min.

## 實施例 1126

(R)-6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩

并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

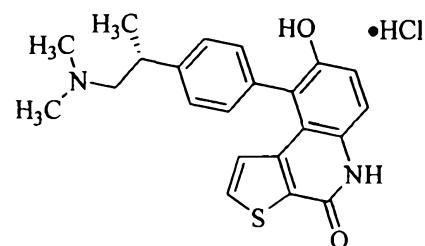


依照實施例 1387 概述的程序，使(R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽(120 mg, 0.32 mmol)與三聚甲醛(29 mg, 0.97 mmol)反應，純化後將得到的材料如一般程序 D-2 揭示，轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物(21 mg, 16%)淡黃色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.71(dd, *J* = 10.5, 7.8 Hz, 2H), 7.64(d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 7.47(t, *J* = 7.1 Hz, 2H), 7.31(s, 1H), 6.01(d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 4.66(q, *J* = 6.9 Hz, 1H), 2.97(s, 3H), 2.86(s, 3H), 1.86(d, *J* = 7.0 Hz, 3H). ESI MS m/z 399 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.5%(AUC), t<sub>R</sub> = 9.96 min.

## 實施例 1188

(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并

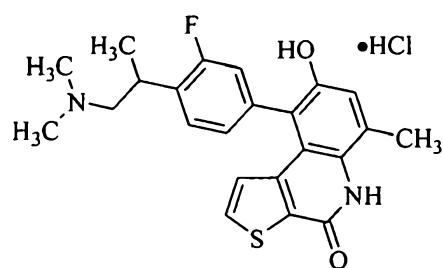
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照實施例 1387 概述的程序，使 (R)-8-甲基  
-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噁吩并[2,3-c]喹啉  
-4(5H)-酮鹽酸鹽(40 mg, 0.11 mmol)與三聚甲醛(7 mg,  
0.21 mmol)反應，於純化後將所得材料如一般程序 D-2 揭示轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物(28 mg, 67%)白色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.65 - 7.52(m, 3H), 7.44 - 7.32(m, 3H), 7.18(d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.12(d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.62(d, J = 3.1 Hz, 1H), 3.46(dd, J = 13.2, 4.7 Hz, 2H), 2.97(s, 3H), 2.94(s, 3H), 1.49(d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS m/z 379 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC), t<sub>R</sub> = 8.57 min.

### 實施例 1193

9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羥基-6-甲基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

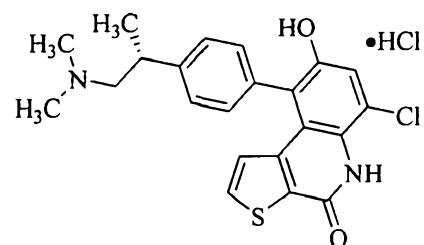


依照實施例 1387 概述的程序，使 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羥基-6-甲基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽(30 mg, 0.08 mmol)與三聚甲醛(9 mg, 0.31 mmol)反應，於純化後將所得材料如一般程序 D-2 揭示轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物(25 mg, 75%)淡黃色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.67 - 7.51(m, 2H),

7.26 - 7.10(m, 2H), 7.08(dd,  $J = 1.6, 0.8$  Hz, 1H),  
 6.20(dd,  $J = 8.1, 5.4$  Hz, 1H), 3.88 - 3.40(m, 3H),  
 3.0 - 2.96(m, 6H), 2.57(s, 3H), 1.57 - 1.46(m, 3H);  
 ESI MS m/z 411 [C<sub>23</sub>H<sub>23</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC), t<sub>R</sub> = 9.14 min.

### 實施例 1347

(R)-6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羥基  
 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

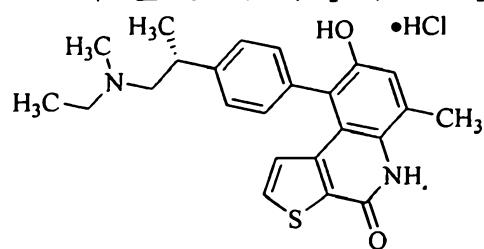


依照實施例 1387 概述的程序，使(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽(30 mg, 0.10 mmol)與三聚甲醛(6 mg, 0.20 mmol)反應，於純化後將所得材料如一般程序 D-2 揭示轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物(12 mg, 29%)黃色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.66 - 7.57(m, 2H), 7.55(d,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.40 - 7.27(m, 3H), 6.07(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.62(dd,  $J = 12.2, 8.9$  Hz, 1H), 3.46(ddd,  $J = 11.7, 9.3, 6.3$  Hz, 2H), 2.98(s, 3H), 2.94(s, 3H), 1.48(d,  $J = 6.5$  Hz, 3H); ESI MS m/z 413 [C<sub>22</sub>H<sub>21</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC), t<sub>R</sub> = 9.46 min.

### 實施例 1379

(R)-9-(4-(1-(乙基(甲基)胺基)丙-2-基)苯基)-8-羥基

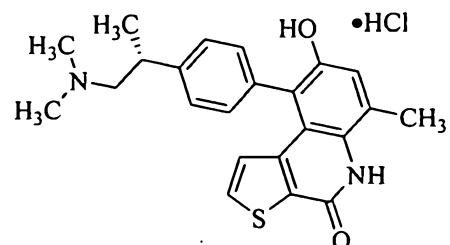
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照實施例 1387 概述的程序，使((R)-8-羥基-6-甲基-9-(4-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽(15 mg, 0.04 mmol) 與乙醛(5 uL, 0.08 mmol) 反應，於純化後將所得材料如一般程序 D-2 揭示轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物(8 mg, 50%)黃色固體：  
 $^1\text{H NMR}$ (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.66 - 7.49(m, 3H), 7.42 - 7.27(m, 2H), 7.08(s, 1H), 6.13(dd,  $J = 19.9, 5.4$  Hz, 1H), 3.70(dd,  $J = 12.8, 10.3$  Hz, 1H), 3.58 - 3.14(m, 4H), 2.91(d,  $J = 23.4$  Hz, 3H), 2.57(s, 3H), 1.49(dd,  $J = 6.8, 3.3$  Hz, 3H), 1.36(dt,  $J = 12.8, 7.3$  Hz, 3H);  
ESI MS  $m/z$  407 [ $\text{C}_{24}\text{H}_{26}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99%(AUC),  $t_{\text{R}} = 9.16$  min.

實施例 1324

(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



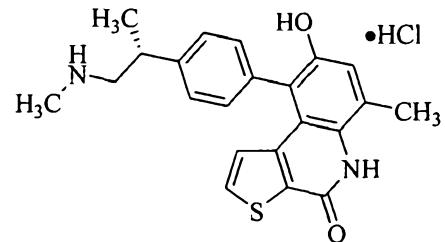
依照實施例 1387 概述的程序，使(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉

-4(5H)-酮 溴化氫鹽(100 mg, 0.26 mmol)與三聚甲醛(24 mg, 0.80 mmol)反應，於純化後將所得材料如一般程序D-2揭示轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物(34 mg, 34%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.61 - 7.55(m, 1H), 7.53(dd,  $J$  = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.36(dd,  $J$  = 7.9, 1.7 Hz, 1H), 7.31(dd,  $J$  = 7.7, 1.7 Hz, 1H), 7.08(s, 1H), 6.12(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.61(dd,  $J$  = 12.3, 9.3 Hz, 1H), 3.45(dt,  $J$  = 9.1, 6.2 Hz, 2H), 2.97(s, 1H), 2.94(s, 1H), 2.57(s, 1H), 1.48(d,  $J$  = 6.6 Hz, 1H); ESI MS m/z 393 [C<sub>23</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC),  $t_R$  = 8.90 min.

### 實施例 1306

(R)-8-羥基-6-甲基-9-(4-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)

塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



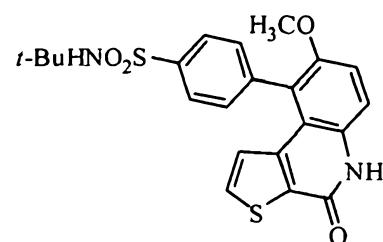
依照一般程序 D-3，使(R)-8-羥基-6-甲基-9-(4-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮溴化氫鹽(120 mg, 0.26 mmol)於HCl水溶液(100 mmol)並於室溫攪拌濃縮2小時，於高真空濃縮及乾燥以獲得所望產物鹽酸鹽。將所望產品於高真空乾燥以獲得所望產物淡黃色固體(27 mg, 28%):  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.61 - 7.53(m, 2H), 7.46(dd,  $J$  = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.36(dd,  $J$  = 7.9, 1.6 Hz, 1H), 7.31(dd,  $J$  = 7.7, 1.7

Hz, 1H), 7.08(s, 1H), 6.16(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.41 - 3.24(m, 3H), 2.74(s, 3H), 2.57(s, 3H), 1.50(d,  $J = 6.8$  Hz, 3H); ESI MS m/z 379 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.7%(AUC), t<sub>R</sub> = 8.82 min.

### 實施例 408

N-第三丁基-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-

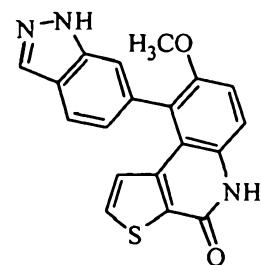
9-基)苯磺醯胺



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(5.0 g, 16 mmol) 與 4-(N-第三丁基胺磺醯基)苯基有機硼酸(5.4 g, 21 mmol)反應以獲得所望產物(4.3 g, 60%)黃色固體：ESI MS m/z [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 409

9-(1H-吲唑-6-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

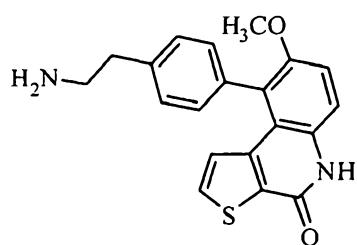


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(100 mg, 0.32 mmol) 與 6-(4,4,5,5-四甲基

-1, 3, 2-二氧雜硼烷-2-基)-1H-吲唑(120 mg, 0.48 mmol)反應以獲得所望產物(35 mg, 31%)棕色固體：ESI MS m/z 348 [C<sub>18</sub>H<sub>11</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>.

### 實施例 169

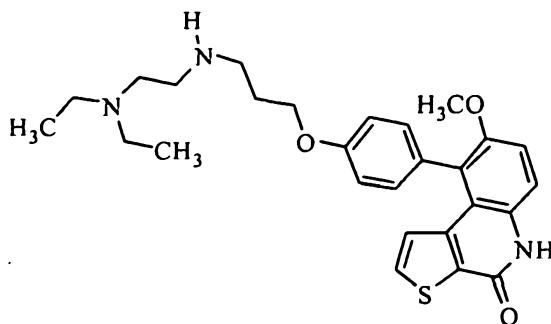
9-[4-(2-胺基乙基)苯基]-8-甲氧基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 C，使第三丁基 4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噁吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯(310 mg, 0.69 mmol)與 TFA(2 mL)反應以獲得所望產物(220 mg, 90%) 灰白色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 7.91(s, 1H), 7.91(br s, 2H), 7.71(d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.52(d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.40(m, 3H), 7.22(d, J = 8.1 Hz, 2H), 5.80(d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.68(s, 3H), 3.20 - 3.17(m, 2H), 3.02 - 2.99(m, 2H); ESI MS m/z 351 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.8%(AUC), t<sub>R</sub> = 8.32 min.

### 實施例 145

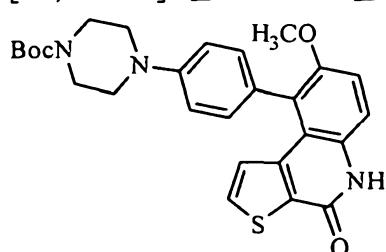
9-(4-{3-[2-(二乙基胺基)乙基胺基]丙氧基}苯基)-8-甲氧基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(100 mg, 0.33 mmol)與  $N^1, N^1$ -二乙基- $N^2$ -{3-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯氧基]丙基}乙-1,2-二胺(250 mg, 0.67 mmol)反應以獲得所望產物(58 mg, 37%)棕色固體： $^1H$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.56(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.52(d,  $J$  = 9.1 Hz, 1H), 7.36(d,  $J$  = 9.1 Hz, 1H), 7.18(d,  $J$  = 8.6 Hz, 2H), 7.12(d,  $J$  = 8.6 Hz, 2H), 6.11(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 4.25(t,  $J$  = 5.7 Hz, 2H), 3.74(s, 3H), 3.74 - 3.43(m, 4H), 3.42(t,  $J$  = 7.4 Hz, 2H), 3.34 - 3.33(m, 4H), 2.35 - 2.25(m, 2H), 1.37(t,  $J$  = 7.3 Hz, 6H); ESI MS m/z 480 [C<sub>27</sub>H<sub>33</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.6%,  $t_R$  = 8.42 min.

#### 實施例 410

第三丁基 4-[4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]哌啶-1-羧酸酯

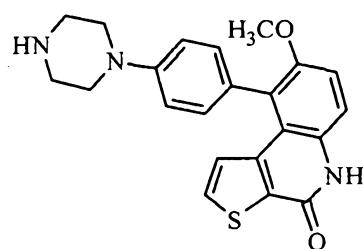


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(80 mg, 0.26 mmol)與 第三丁基

4-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂硼烷-2-基)苯基]哌啶-1-羧酸酯(170 mg, 0.44 mmol)反應以獲得所望產物(68 mg, 32%)黃色固體：ESI MS m/z 492 [C<sub>27</sub>H<sub>29</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 411

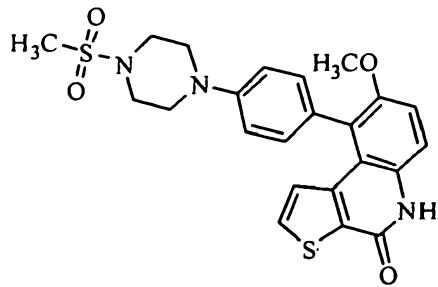
8-甲氧基-9-[4-(哌啶-1-基)苯基]噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 C，使第三丁基 4-[4-(8-甲氧基-4-側  
氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯基]哌啶-1-  
羧酸酯(160 mg, 0.33 mmol)與 TFA(4 mL)反應以獲得所望  
產物(23 mg, 22%)淡黃色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)  
 $\delta$  11.84(s, 1H), 8.72(s, 2H), 7.76(d, J = 5.4 Hz, 1H),  
7.49(d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.37(d, J = 9.1 Hz, 1H),  
7.20 - 7.03(m, 4H), 5.95(d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.68(s,  
3H), 3.52 - 3.41(m, 4H), 3.31(s, 4H)。

### 實施例 412

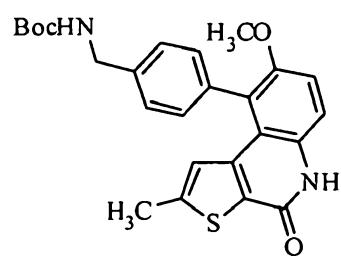
8-甲氧基-9-{4-[4-(甲基磺醯基)哌啶-1-基]苯基}噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



對於 8-甲氧基 -9-[4-(哌啶-1-基)苯基]噻吩并[2,3-c] 噻吩-4(5H)-酮(89 mg, 0.23 mmol)於二氯甲烷(2 mL)的溶液，添加 N, N-二異丙基乙胺(0.42 mL, 0.68 mmol)及甲烷磺醯氯(45 μL, 0.27 mmol)，將該反應混合物攪拌 1 小時。將該反應混合物以水淬滅並分層。將水層以乙酸乙酯萃取，將合併的有機層以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 乾燥，過濾、濃縮，將殘渣以製備性 HPLC(C18 二氧化矽，乙腈/水，有 0.05% TFA 梯度)純化以獲得所望產物(72 mg, 68%)棕色固體：ESI MS m/z 470 [C<sub>23</sub>H<sub>23</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 413

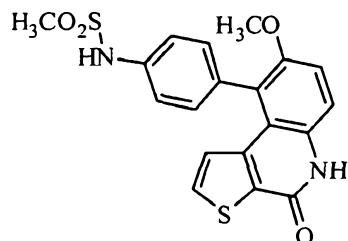
第三丁基 4-(8-甲氧基-2-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 噻吩-9-基)苄基胺基甲酸酯



依照一般程序 B A，使 9-溴-8-甲氧基-2-甲基噻吩并[2,3-c] 噻吩-4(5H)-酮(100 mg, 0.31 mmol)與 4-[(第三丁基羧基胺基) 甲基]苯基有機硼酸(120 mg, 0.40 mmol)反應以提供所望產物(80 mg, 55%)棕色固體：ESI MS m/z 451 [C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 414

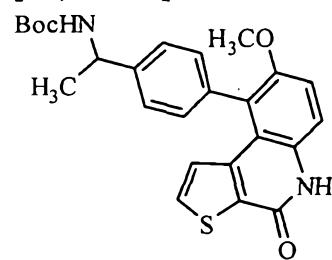
N-[4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]甲烷磺醯胺



依照一般程序 B 之步驟 1，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(50 mg, 0.10 mmol)與 4-(甲基磺醯胺)苯基有機硼酸(52 mg, 0.24 mmol)反應以獲得所產物(40 mg, 62%)棕色固體：ESI MS m/z 400 [C<sub>19</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 415

第三丁基 1-[4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]乙基胺基甲酸酯

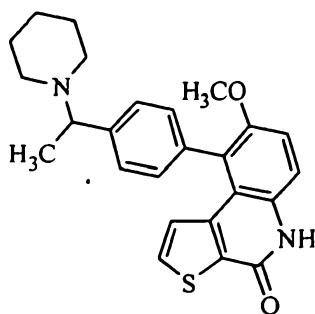


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(600 mg, 2.0 mmol)與第三丁基 1-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基]乙基胺基甲酸酯(340 mg, 39%)反應棕色固體：ESI MS m/z 451 [C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 416

8-甲氧基-9-{4-[1-(哌啶-1-基)乙基]苯基}噻吩并[2,3-c]

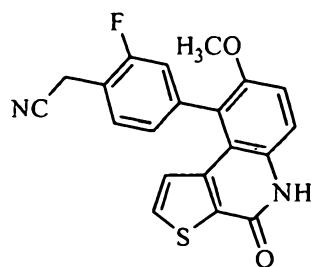
## 喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(150 mg, 0.48 mmol)與 4-[1-(哌啶-1-基)乙基]苯基有機硼酸(170 mg, 0.73 mmol)反應以獲得所望產物(10 mg, 5%)黃色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.74 – 7.66(m, 2H), 7.62 – 7.53(m, 2H), 7.49 – 7.34(m, 3H), 5.94(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.61(q,  $J = 6.9$  Hz, 1H), 3.86 – 3.78(m, 1H), 3.76(s, 1H), 3.47(d,  $J = 12.6$  Hz, 1H), 3.10 – 2.98(m, 1H), 2.96 – 2.82(m, 1H), 2.11 – 1.91(m, 2H), 1.89(d,  $J = 7.0$  Hz, 2H), 1.85 – 1.70(m, 1H).

## 實施例 417

## 2-[2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]乙腈



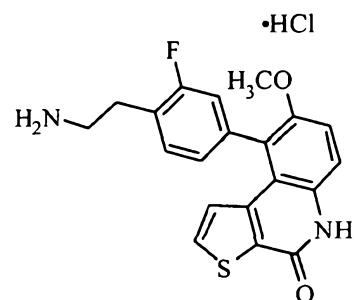
依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(350 mg, 1.1 mmol)與 2-[2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基]乙腈(440 mg, 1.7

mmol)反應以獲得所望產物(400 mg, >99%)棕色固體: ESI MS m/z 365 [C<sub>20</sub>H<sub>13</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>.

### 實施例 265

9-[4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]

喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

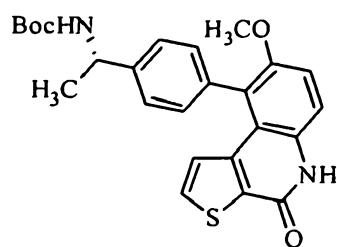


對於 2-[2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]乙腈(49 mg, 0.14 mmol)於甲苯的溶液(3 mL)，添加硼烷(1.0 M 於 THF, 3.0 mL, 0.30 mmol)，將反應物加熱回流3小時。將反應混合物冷卻為室溫，濃縮並將殘渣以製備性HPLC純化。將殘渣溶於HCl水溶液，於高真空濃縮及乾燥以提供鹽酸鹽(4.5 mg, 9%)棕色固體: <sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.63(d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.56(d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.50(t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.40(d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.11 - 7.05(m, 2H), 6.11(d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.76(s, 3H), 3.25 - 3.08(m, 4H), 2.75(br s, 3H); ESI MS m/z 369 [C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 95.0%(AUC), t<sub>R</sub> = 7.89 min.

### 實施例 418

(S)-第三丁基 1-[4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-

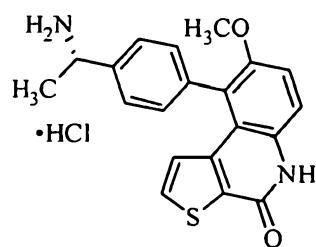
## 9-(基)苯基]乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (280 mg, 0.89 mmol) 與 (S)-第三丁基 1-[4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氫雜硼烷-2-基) 苯基] 乙基胺基甲酸酯 (320 mg, 1.1 mmol) 反應以獲得所望產物 (220 mg, 55%) 白色固體：ESI MS m/z 351 [C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S - Boc]<sup>+</sup>。

## 實施例 232

## (S)-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

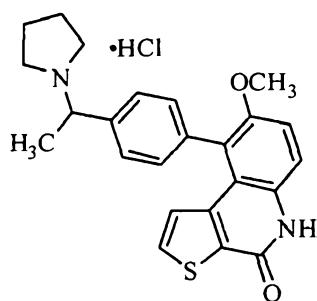


依照一般程序 C，使 (S)-第三丁基 1-[4-(8-甲氧基-4, 5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基] 乙基胺基甲酸酯 (90 mg, 0.12 mmol) 與 TFA (3 mL) 反應以獲得所望產物 (11 mg, 15%) 灰白色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.65 – 7.62 (m, 2H), 7.56 – 7.54 (m, 2H), 7.40 – 7.38 (m, 3H), 6.04 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 4.62 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 7.73 (s, 3H), 1.77 (d, J = 6.9 Hz, 3H); ESI MS m/z 351 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.6% (AUC), t<sub>R</sub> =

8.33 min.

### 實施例 216

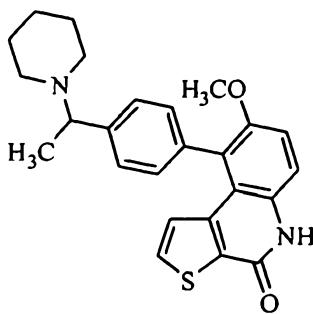
8-甲氧基-9-{4-[1-(吡咯啶-1-基)乙基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (120 mg, 0.39 mmol) 與 4-[1-(吡咯啶-1-基)乙基]苯基有機硼酸 (170 mg, 0.77 mmol) 反應以獲得所望產物 (70 mg, 45%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.69 – 7.67 (m, 2H), 7.60 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.56 (d,  $J = 9.0$  Hz, 1H), 7.44 – 7.40 (m, 3H), 5.96 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.54 (q,  $J = 6.8$  Hz, 1H), 3.89 – 3.84 (m, 1H), 3.76 (s, 3H), 3.38 – 3.16 (m, 3H), 2.29 – 2.00 (m, 4H), 1.87 (d,  $J = 6.9$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  405 [ $\text{C}_{24}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99%,  $t_{\text{R}} = 8.98$  min.

### 實施例 419

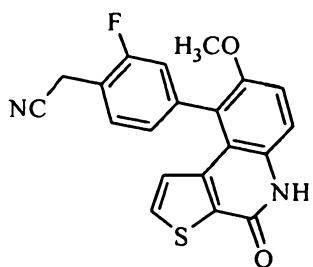
8-甲氧基-9-{4-[1-(哌啶-1-基)乙基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (150 mg, 0.48 mmol) 與 4-[1-(哌啶-1-基)乙基]苯基有機硼酸 (170 mg, 0.73 mmol) 反應以獲得所望產物 (10 mg, 5%) 黃色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.74 – 7.66 (m, 2H), 7.62 – 7.53 (m, 2H), 7.49 – 7.34 (m, 3H), 5.94 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.61 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 3.86 – 3.78 (m, 1H), 3.76 (s, 1H), 3.47 (d, J = 12.6 Hz, 1H), 3.10 – 2.98 (m, 1H), 2.96 – 2.82 (m, 1H), 2.11 – 1.91 (m, 2H), 1.89 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 1.85 – 1.70 (m, 1H).

#### 實施例 420

2-[2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基]乙腈

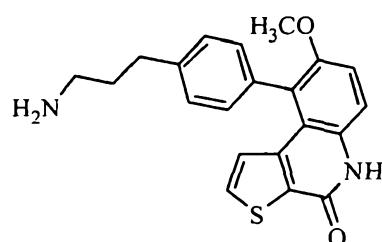


依照一般程序 B 之步驟 1，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (350 mg, 1.1 mmol) 與 2-[2-氟-4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氫雜硼烷-2-基)苯基]乙腈 (440 mg, 1.7 mmol) 反應以獲得所望產物 (400 mg, >99%)

棕色固體：ESI MS  $m/z$  365  $[C_{20}H_{13}FN_2O_2S + H]^+$ .

### 實施例 421

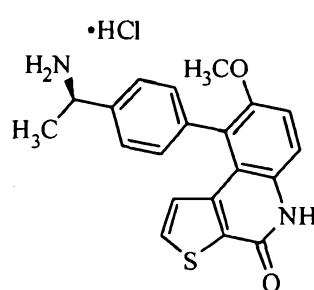
9-[4-(3-胺基丙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照實施例 265 概述的程序，使 3-[4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]丙腈(250 mg, 0.69 mmol)與硼烷(1.0 M 於 THF, 10 mL, 10 mmol)反應以獲得所望產物(150 mg, 60%)棕色油：ESI MS  $m/z$  365  $[C_{21}H_{20}N_2O_2S + H]^+$ 。

### 實施例 274

(R)-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

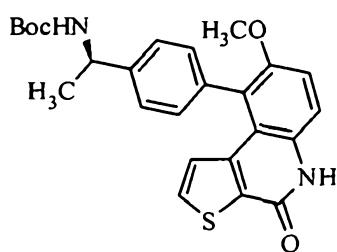


依照一般程序 C，使(R)-第三丁基 1-[4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯基]乙基胺基甲酸酯(50 mg, 0.11 mmol)與 TFA(3 mL)反應以獲得所望產物(11 mg, 26%) 灰白色固體： $^1H$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.63 – 7.62(m, 2H), 7.56 – 7.55(m, 2H),

7.40 - 7.37(m, 3H), 6.04(d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.62(q, J = 6.9 Hz, 1H), 3.79(s, 3H), 2.77(br s, 3H), 1.76(d, J = 6.9 Hz, 3H); ESI MS m/z 351 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.7%(AUC), t<sub>R</sub> = 8.24 min.

### 實施例 422

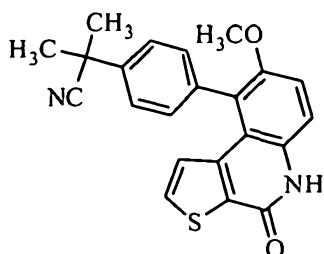
(R)-第三丁基 1-[4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B 之步驟 1，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(480 mg, 1.5 mmol)與(R)-第三丁基 1-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基]乙基胺基甲酸酯(800 mg, 2.3 mmol)反應以獲得所望產物(410 mg, 59%)棕色固體：ESI MS m/z 451 [C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>.

### 實施例 423

2-[4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]-2-甲基丙腈

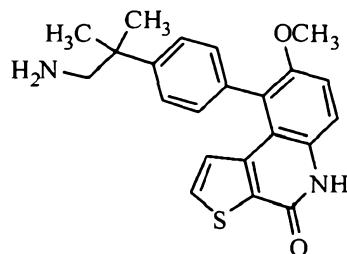


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(380 mg, 1.2 mmol)與 2-甲基

-2-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基]丙腈(500 mg, 1.9 mmol)反應以獲得所望產物(260 mg, 56%)棕色固體：ESI MS m/z 375 [C<sub>22</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>.

#### 實施例 424

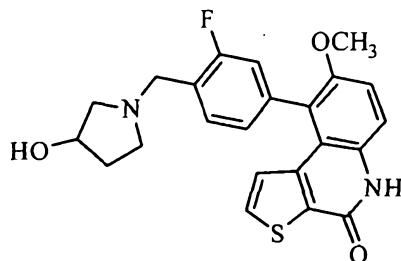
9-[4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)苯基]-8-甲氧基噁吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮



依照實施例 265 概述的程序，使 2-[4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噁吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基]-2-甲基丙腈(250 mg, 0.67 mmol)與硼烷反應(1.0 M 於 THF, 10 mL, 10.0 mmol)以獲得所望產物(100 mg, 40%)黃色固體：ESI MS m/z 379 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 425

9-{3-氟-4-[(3-羥基吡咯啶-1-基)甲基]苯基}-8-甲氧基噁吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮



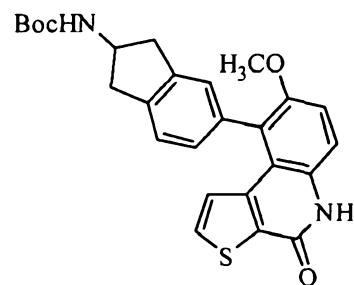
依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噁吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮(180 mg, 0.58 mmol)與 1-[2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基]吡咯啶-3-醇(280

mg, 0.87 mmol)反應以獲得所望產物(130 mg, 48%)棕色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.79 – 7.72(m, 1H), 7.66(d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.58(d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.42(d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.33 – 7.21(m, 2H), 6.09(td, J = 5.3, 2.4 Hz, 1H), 4.75 – 4.53(m, 3H), 3.91 – 3.66(m, 4H), 3.66 – 3.34(m, 3H), 2.55 – 2.44(m, 1H), 2.28 – 2.15(m, 1H), 2.14 – 2.04(m, 1H)。

#### 實施例 426

第三丁基 5-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2,3-

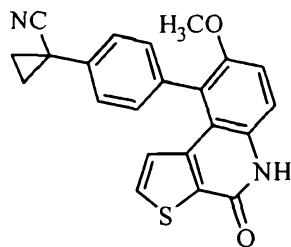
二氫-1H-茚-2-基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(1.1 g, 3.6 mmol)與第三丁基 5-溴-2,3-二氫-1H-茚-2-基胺基甲酸酯(2.0 g, 5.6 mmol)反應以獲得所望產物(250 mg, 15%)棕色固體：ESI MS m/z 363 [C<sub>26</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H - 100]<sup>+</sup>。

#### 實施例 427

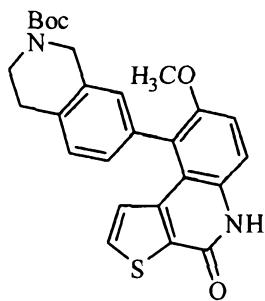
1-[4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]環丙腈



依照一般程序 B，使 1-(4-溴苯基)環丙腈 (1.5 g, 7.1 mmol) 與雙戊醯二硼 (2.7 g, 10 mmol) 反應以提供粗製有機硼酸酯，再與 9-溴-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (1.3 g, 4.2 mmol) 反應以獲得所望產物 (378 mg, 29%) 白色固體：ESI MS m/z 373 [C<sub>22</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 428

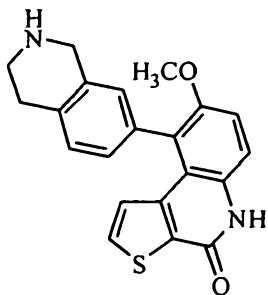
第三丁基 7-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)-3,4-二氫異喹啉-2(1H)-羧酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (1 g, 3.3 mmol) 與第三丁基 7-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)-3,4-二氫異喹啉-2(1H)-羧酸酯 (1.8 g, 5.0 mmol) 反應以獲得所望產物 (720 mg, 48%) 棕色固體：ESI MS m/z 463 [C<sub>26</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 429

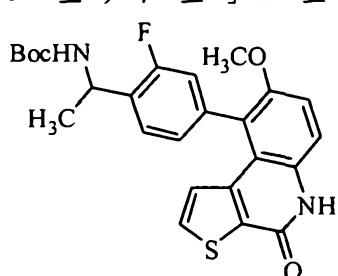
8-甲氧基-9-(1,2,3,4-四氫異喹啉-7-基)噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 C，使第三丁基 7-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)-3,4-二氳異喹啉-2(1H)-羧酸酯(260 mg, 0.53 mmol)與 TFA(5 mL) 反應以獲得所望產物(180 mg, 20%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.61 - 7.56(m, 1H), 7.55(dd, J = 9.0, 3.2 Hz, 1H), 7.44(d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.41 - 7.36(m, 1H), 7.22(d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.16(s, 1H), 6.13(d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.42(s, 2H), 3.73(s, 3H), 3.68 - 3.54(m, 2H), 3.29 - 3.20(m, 2H)。

### 實施例 430

第三丁基 1-[2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯基]乙基胺基甲酸酯

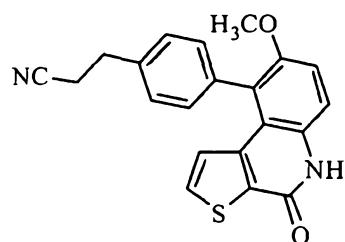


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮(800 mg, 2.6 mmol)與第三丁基 1-[2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氳雜硼烷-2-基)苯基]乙基胺基甲酸酯(1.4 g, 3.9 mmol)反應以獲得所望產物(480 mg,

40%)棕色固體：ESI MS  $m/z$  469  $[C_{25}H_{25}FN_2O_4S + H]^+$ 。

### 實施例 431

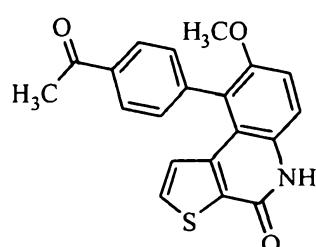
3-[4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]丙腈



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(400 mg, 1.3 mmol)與 3-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基]丙腈(600 mg, 1.9 mmol)反應以獲得所望產物(320 mg, 69%)棕色固體：ESI MS  $m/z$  361  $[C_{21}H_{16}N_2O_2S + H]^+$ 。

### 實施例 432

9-(4-乙醯基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

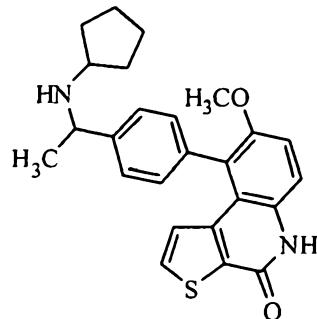


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(1.0 g, 3.2 mmol)與 1-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基]乙酮(1.2 g, 4.8 mmol)反應以獲得所望產物(520 mg, 46%)棕色固體： $^1H$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  8.16(d,  $J = 8.1$  Hz, 2H), 7.61 – 7.54(m, 2H), 7.45 – 7.39(m, 3H), 6.05(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H),

3.75(s, 3H), 2.71(s, 3H)。

### 實施例 433

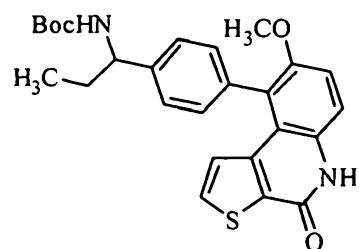
9-{4-[1-(環戊基胺基)乙基]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 E，使 N-[1-(4-溴苯基)乙基]環戊胺 (600 mg, 2.3 mmol) 與雙戊醯二硼 (410 mg, 1.6 mmol) 反應以獲得粗製有機硼酸酯，再與 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (250 mg, 0.81 mmol) 反應以獲得所望產物 (330 mg, 97%) 棕色固體： $^1\text{H}$  NMR (300 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.73 – 7.64(m, 2H), 7.60 – 7.50(m, 2H), 7.47 – 7.34(m, 3H), 6.01(d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.57(q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.74(s, 3H), 3.62 – 3.45(m, 1H), 2.30 – 2.02(m, 2H), 1.93 – 1.85(m, 2H), 1.81(d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.77 – 1.51(m, 4H)。

### 實施例 434

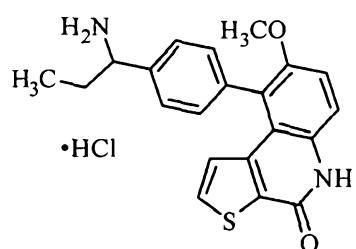
第三丁基 1-[4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(1.1 g, 3.7 mmol)與第三丁基1-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基]丙基胺基甲酸酯(2.0 g, 5.5 mmol)反應以獲得所望產物(1.2 g, 68%)白色固體：ESI MS m/z 465 [C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 337

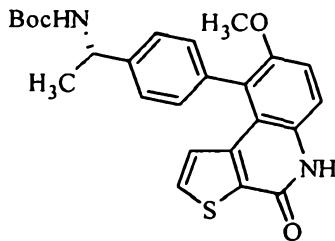
9-[4-(1-胺基丙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽



依照一般程序 C，使第三丁基 1-[4-(8-甲氧基-4-側  
氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯基]丙基胺基  
甲酸酯(30 mg, 0.064 mmol)與 TFA(2 mL)反應以獲得所  
望產物(17 mg, 72%)白色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  
 $\delta$  7.64 – 7.57(m, 2H), 7.54(d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.53(d,  
J = 1.6 Hz, 1H), 7.39 – 7.35(m, 3H), 5.98(d, J = 5.4  
Hz, 1H), 4.32(q, J = 5.1 Hz, 1H), 5.53(s, 3H),  
2.17 – 2.07(m, 2H), 1.03(t, J = 7.4 Hz, 3H); ESI MS m/z  
365 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC), t<sub>R</sub> = 9.47 min.

### 實施例 435

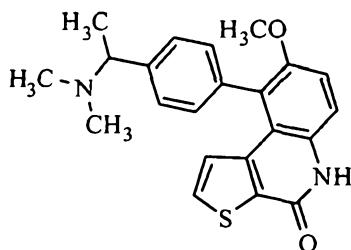
(S)-第三丁基 1-[4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩  
并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(760 mg, 2.4 mmol)與(S)-第三丁基1-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基]乙基胺基甲酸酯(1.3 g, 3.7 mmol)反應以獲得所望產物(730 mg, 66%)淡黃色固體：ESI MS m/z 451 [C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 436

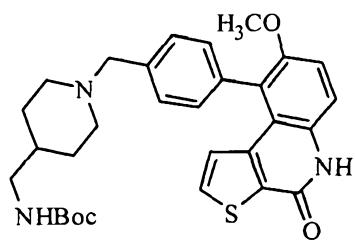
9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(1.5 g, 4.8 mmol)與 4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基有機硼酸(1.5 g, 6.3 mmol)反應以獲得所望產物(1.1 g, 58%)白色固體：ESI MS m/z 379 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 139

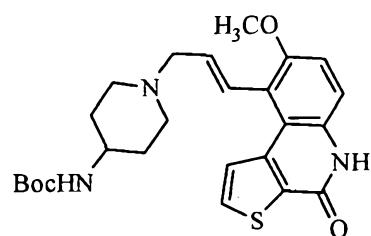
第三丁基 {1-[4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基}哌啶-4-基}甲基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(110 mg, 0.31 mmol)與 4-(4-[((第三丁乙基羰基胺基)甲基]哌啶-1-基)甲基)苯基有機硼酸(80 mg, 0.26 mol)反應以獲得所望產物(25 mg, 20%)黃色玻璃：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.69 – 7.66(m, 2H), 7.57 – 7.54(m, 2H), 7.41 – 7.38(m, 3H), 5.96 – 5.95(m, 1H), 4.48 – 4.44(m, 2H), 3.75(s, 3H), 3.70 – 3.64(m, 2H), 3.27 – 2.91(m, 4H), 2.25 – 1.95(m, 2H), 1.57(s, 1H), 1.52 – 1.42(m, 10 H); ESI MS m/z 534 [C<sub>30</sub>H<sub>35</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.6%(AUC), t<sub>r</sub> = 14.10 min.

#### 實施例 437

(E)-第三丁基 1-[3-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)烯丙基]哌啶-4-基胺基甲酸酯

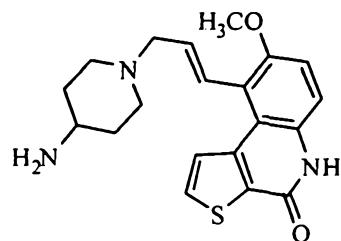


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(180 mg, 0.48 mmol)與 (E)-第三丁基 1-[3-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)烯丙基]哌啶-4-基胺基甲酸酯(100 mg, 0.32 mmol)反應以獲得所望產物(86 mg, 57%)棕色固體：ESI MS m/z 470 [C<sub>25</sub>H<sub>31</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>S

+ H]<sup>+</sup>。

### 實施例 152

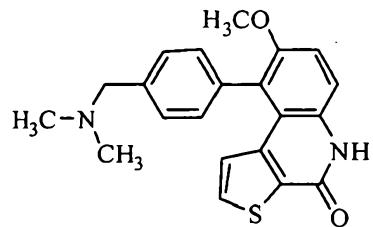
(E)-9-[3-(4-胺基哌啶-1-基)丙-1-烯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 C，使(E)-第三丁基 1-[3-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)烯丙基] 哌啶-4-基胺基甲酸酯(40 mg, 0.085 mmol)與 TFA(1 mL) 反應以獲得所望產物(15 mg, 86%)黃色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.94(d, J = 5.3 Hz, 1H), 7.86(d, J = 5.3 Hz, 1H), 7.34(d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.24(d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.06(d, J = 16.0 Hz, 1H), 6.14 - 6.08(m, 1H), 4.12(d, J = 7.1 Hz, 2H), 3.84(br s, 2H), 3.55(br s, 1H), 3.26(br s, 3H), 2.38(d, J = 13.3 Hz, 2H), 2.12 - 2.07(m, 2H), 1.35 - 1.31(m, 1H), 0.96 - 0.90(m, 1H); ESI MS m/z 370 [C<sub>20</sub>H<sub>23</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 95.6%(AUC), t<sub>R</sub> = 6.78 min.

### 實施例 164

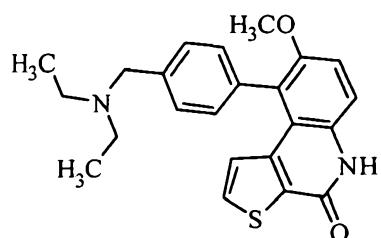
9-{4-[(二甲基胺基)甲基]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮



依照實施例 460 概述的程序，使 9-[4-(胺基甲基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(100 mg, 0.27 mmol)與甲醛反應(37% 於水, 20 mg, 0.67 mmol)以獲得獲得所望產物(45 mg, 47%):  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.67(d,  $J = 8.2$  Hz, 2H), 7.58 - 7.54(m, 2H), 7.42 - 7.38(m, 3H), 5.96(d,  $J = 5.5$  Hz, 1H), 4.47(s, 2H), 3.75(s, 3H), 2.98(s, 6H); ESI MS  $m/z$  365 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99%(AUC),  $t_R = 8.50$  min.

### 實施例 438

9-{4-[(二乙基胺基)甲基]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

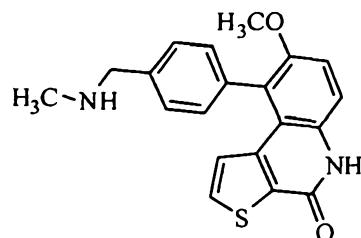


依照一般程序 E，使  $\text{N}-(4-\text{溴苄基})-\text{N}-\text{乙基乙胺}$ (200 mg, 0.83 mmol)與雙戊醯二硼(230 mg, 0.91 mmol)反應以獲得粗製有機硼酸酯，再與 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(260 mg, 0.83 mmol)反應以獲得所望產物(58 mg, 25%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.69(d,  $J = 8.2$  Hz, 2H), 7.60 - 7.54(m, 2H), 7.46 - 7.43(m, 2H), 7.41(d,  $J = 9.1$  Hz, 1H), 5.99(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.50(s, 2H),

3.75(s, 3H), 3.41 - 3.32(m, 4H), 1.44(t, J = 7.3 Hz, 6H)。

### 實施例 188

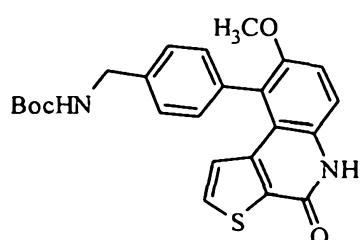
8-甲氨基-9-{4-[（甲基胺基）甲基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 E，使 1-(4-溴苯基)-N-甲基甲胺(200 mg, 1.0 mmol)與雙戊醯二硼(280 mg, 1.1 mmol)反應以獲得粗製有機硼酸酯，再與 9-溴-8-甲氨基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(310 mg, 1.0 mmol)反應以獲得所望產物(145 mg, 42%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.65(d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.58 - 7.52(m, 2H), 7.42 - 7.35(m, 3H), 6.02(d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.33(s, 2H), 3.73(s, 3H), 2.83(s, 3H)。

### 實施例 439

第三丁基 4-(8-甲氨基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯

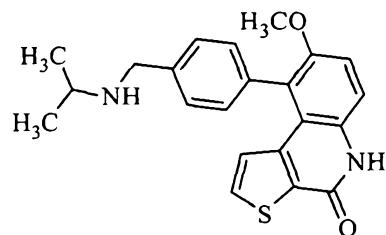


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氨基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(150 mg, 0.48 mmol)與 4-[（第三丁基氨基）甲基]苯基

胺基)甲基]苯基有機硼酸(180 mg, 0.73 mmol)反應以獲得所望產物(180 mg, 83%)棕色固體：ESI MS m/z 437 [C<sub>24</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 440

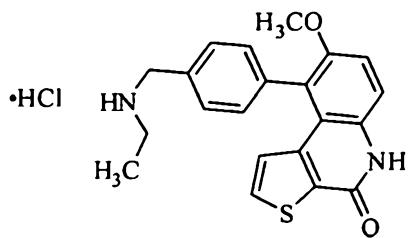
9-{4-[（異丙基胺基）甲基]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮



依照一般程序 E，使 N-(4-溴苄基)丙-2-胺(200 mg, 0.88 mmol)與雙戊醯二硼(240 mg, 0.96 mmol)反應以獲得粗製有機硼酸酯，再與 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮(270 mg, 0.88 mmol)反應以獲得所望產物(190 mg, 57%)淡棕色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>CD<sub>2</sub>OD) δ 7.68 - 7.63(m, 2H), 7.56 - 7.49(m, 2H), 7.41 - 7.34(m, 3H), 6.04(dd, J = 5.4, 2.4 Hz, 1H), 4.33(s, 2H), 3.72 - 3.67(m, 3H), 3.56 - 3.50(m, 1H), 1.45(dd, J = 6.6, 2.2 Hz, 6H)。

### 實施例 269

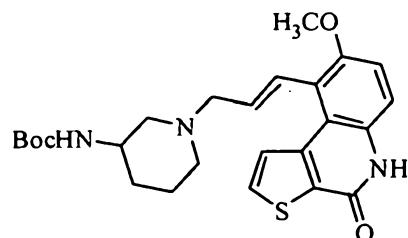
9-{4-[（乙基胺基）甲基]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 E，使 N-(4-溴苄基)乙胺(300 mg, 1.4 mmol)與雙戊醯二硼(390 mg, 1.5 mmol)反應以獲得粗製有機硼酸酯，再與 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(430 mg, 1.4 mmol)反應以獲得所望產物(160 mg, 31%)棕色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.67(d,  $J = 8.1$  Hz, 2H), 7.57 - 7.54(m, 2H), 7.39 - 7.36(m, 3H), 6.03(d,  $J = 5.5$  Hz, 1H), 4.34(s, 2H), 3.72(s, 3H), 3.23(q,  $J = 7.3$  Hz, 2H), 1.97(s, 2H), 1.42(t,  $J = 7.3$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  365 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99%(AUC),  $t_R = 8.61$  min.

#### 實施例 441

(E)-第三丁基 1-[3-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)烯丙基]哌啶-3-基胺基甲酸酯

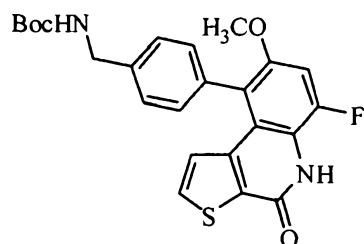


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(530 mg, 1.7 mmol)與(E)-第三丁基 1-[3-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)烯丙基]哌啶-3-基胺基甲酸酯(320 mg, 0.88 mmol)反應以獲得所

望產物 (190 mg, 47%) 淡棕色固體：ESI MS m/z 456  
[C<sub>24</sub>H<sub>29</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 442

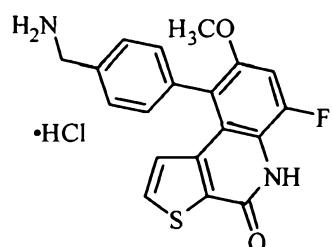
第三丁基 4-(6-氟-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (150 mg, 0.50 mmol) 與第三丁基 4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基) 苄基胺基甲酸酯 (200 mg, 0.60 mmol) 反應以獲得所望產物 (100 mg, 48%) 棕色固體：ESI MS m/z 455 [C<sub>24</sub>H<sub>23</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 257

9-[4-(胺基甲基)苯基]-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

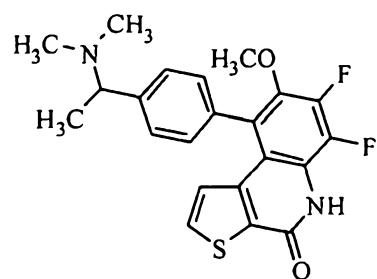


依照一般程序 D-1，使第三丁基 4-(6-氟-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯 (15 mg, 0.030 mmol) 與 HCl (2 N in 二乙基 ether, 1.5 mL) 反應以獲得所望產物 (10 mg, 90%) 白色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.63 (d, J = 8.1 Hz, 2H),

7.58(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.36(d,  $J = 8.1$  Hz, 2H), 7.32(d,  $J = 12.7$  Hz, 1H), 6.04(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.27(s, 2H), 3.72(s, 3H); ESI MS  $m/z$  355 [ $C_{19}H_{15}FN_2O_2S + H$ ]<sup>+</sup>; HPLC 99%(AUC),  $t_R = 10.64$  min.

#### 實施例 443

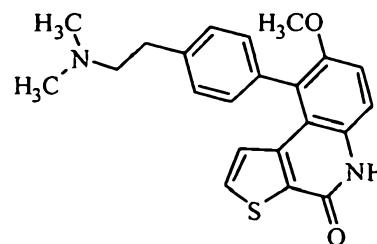
9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-6,7-二氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 B，使 9-溴-6,7-二氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(150 mg, 0.40 mmol)與 4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基有機硼酸(120 mg, 0.50 mmol)反應以獲得所望產物(55 mg, 35%) 灰白色固體：ESI MS  $m/z$  415 [ $C_{22}H_{20}F_2N_2O_2S + H$ ]<sup>+</sup>。

#### 實施例 444

9-{4-[2-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

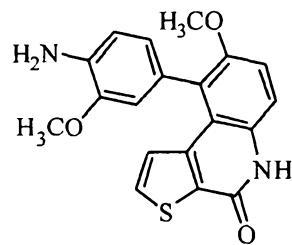


依照實施例 460 概述的程序，使 9-[4-(2-胺基乙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(100 mg,

0.30 mmol)與甲醛反應(100 mg, 1.0 mmol)以獲得所產物(85 mg, 84%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{CN}+\text{D}_2\text{O}$ )  $\delta$  7.54 – 7.50(m, 2H), 7.42(d,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 7.32(d,  $J = 9.1$  Hz, 1H), 7.13(d,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 5.83(d,  $J = 5.3$  Hz, 1H), 3.69(s, 3H), 3.43 – 3.40(m, 2H), 3.16 – 3.13(m, 2H), 2.92(s, 6H).

### 實施例 445

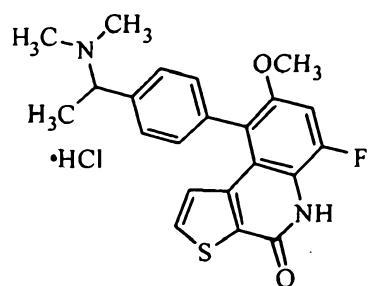
9-(4-胺基-3-甲氧基苯基)-8-甲氧基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序B，使9-溴-8-甲氧基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(100 mg, 0.30 mmol)與2-甲氧基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯胺(150 mg, 0.50 mmol)反應以獲得所產物(64 mg, 60%)棕色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.61(d,  $J = 5.3$  Hz, 1H), 7.58 – 7.53(m, 2H), 7.41(d,  $J = 5.3$  Hz, 1H), 7.16(s, 1H), 7.01(d,  $J = 5.3$  Hz, 1H), 6.09(d,  $J = 5.1$  Hz, 1H), 3.93(s, 3H), 3.77(s, 3H)。

### 實施例 222

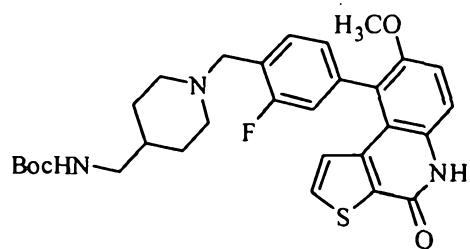
9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-6-氟-8-甲氧基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽



依照一般程序 B，使 9-溴-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(100 mg, 0.30 mmol)與 4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基有機硼酸(100 mg, 0.45 mmol)反應以獲得所望產物(49 mg, 41%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$  10.28(s, 1H), 7.77(d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.71(q, J = 8.0 Hz, 2H), 7.46(d, J = 12.8 Hz, 1H), 7.38(d, J = 8.2 Hz, 2H), 5.69(d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.64(t, J = 6.0 Hz, 1H), 3.71(s, 3H), 2.82(d, J = 4.2 Hz, 3H), 2.70(d, J = 4.4 Hz, 3H), 1.74(d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS m/z 397 [C<sub>22</sub>H<sub>21</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC), t<sub>R</sub> = 9.85 min.

#### 實施例 446

第三丁基 {1-[2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基]哌啶-4-基}甲基胺基甲酸酯



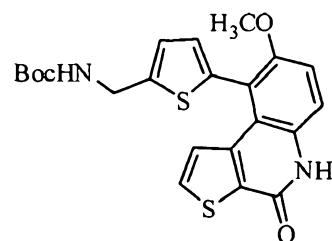
依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(100 mg, 0.30 mmol)與第三丁基 {1-[2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苄基]哌啶-4-基}甲基胺基甲酸酯

-4-基}甲基胺基甲酸酯(150 mg, 0.36 mmol)反應以獲得所望產物(81 mg, 49%)黃色固體：ESI MS  $m/z$  552 [C<sub>30</sub>H<sub>34</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 447

第三丁基 [5-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)噻吩-

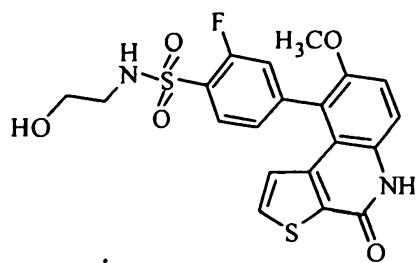
2-基]甲基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮(150 mg, 0.48 mmol)與 5-[((第三丁基氨基)甲基)噻吩-2-基有機硼酸(130 mg, 0.53 mmol)反應以獲得所望產物(30 mg, 18%) 灰白色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.74(d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.56(d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.36(d, J = 9.1 Hz, 1H), 6.49(d, J = 3.1 Hz, 1H), 6.40(br s, 1H), 6.01(d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.27(s, 2H), 3.82(s, 3H), 1.39(s, 9H)。

### 實施例 448

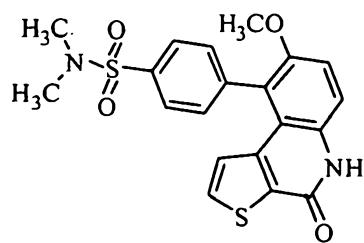
2-氟-N-(2-羥基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯磺醯胺



依照一般程序 E，使 4-溴-2-氟-N-(2-羥基乙基)苯磺醯胺 (3.30 mg, 1.1 mmol) 與雙戊醯二硼反應 (300 mg, 1.2 mmol) 以獲得粗製有機硼酸酯，再與 9-溴-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (310 mg, 1.0 mmol) 反應以獲得所望產物 (68 mg, 13%) 灰白色固體：<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 11.95(s, 1H), 8.04(t, J = 5.8 Hz, 1H), 7.93(t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.93(d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.57(d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.49 – 7.43(m, 2H), 7.30(dd, J = 8.0, 1.5 Hz, 1H), 5.89(d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.78(t, J = 5.6 Hz, 1H), 3.72(s, 3H), 3.46(q, J = 6.2 Hz, 2H), 3.05(m, 2H)。

#### 實施例 449

#### 4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N,N-二甲基苯磺醯胺

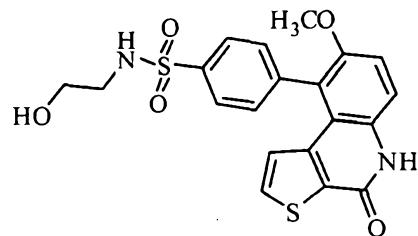


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (100 mg, 0.32 mmol) 與 N,N-二甲基-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基) 苯磺醯胺 (110 mg, 0.35 mmol) 反應以獲得所望產物 (33 mg, 粗製)

棕色固體：ESI MS  $m/z$  415 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 450

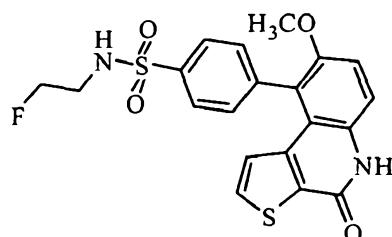
N-(2-羥基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺



依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (500 mg, 1.5 mmol) 與 N-(2-羥基乙基)-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯磺醯胺 (450 mg, 1.5 mmol) 反應以獲得所望產物 (130 mg, 20%) 灰白色固體：<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 11.93(s, 1H), 7.94(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.78 - 7.74(m, 2H), 7.58 - 7.42(m, 4H), 5.74(d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.78(t, J = 5.6 Hz, 1H), 3.71(s, 3H), 3.45(q, J = 6.1 Hz, 2H), 2.93(q, J = 6.2 Hz, 2H)。

### 實施例 333

N-(2-氟乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺



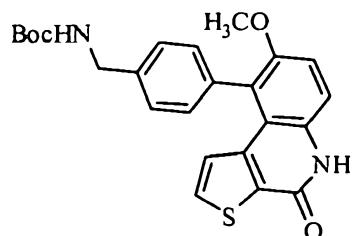
對於 N-(2-羥基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺 (120 mg, 0.28

mmol)於二氯甲烷(10 mL)及 THF(6 mL)的溶液，於 -78 °C 氮氣下，添加 DAST(89 mg, 0.56 mmol)，將反應混合物於 -78 °C 攪拌 2 小時，並回溫至室溫，再攪拌 16 小時。將反應混合物濃縮並將殘渣以管柱層析純化(二氧化矽凝膠，乙酸乙酯/己烷梯度)。將獲得的粗製殘渣於二氯甲烷中磨碎並過濾以獲得所望產物(90 mg, 75%)灰白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$  11.92(s, 1H), 8.10(t, J = 5.9 Hz, 1H), 7.95(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.76(d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.56(d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.51(d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.43(d, J = 9.2 Hz, 1H), 5.75(d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.51(t, J = 4.9 Hz, 1H), 4.42(t, J = 4.9 Hz, 1H), 3.71(s, 3H), 3.24(q, J = 5.2 Hz, 1H), 3.19(q, J = 5.2 Hz, 1H); ESI MS m/z 433 [C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>; HPLC 93.4%(AUC),  $t_R$  = 15.64 min.

### 實施例 451

第三丁基 4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]

噁唑-9-基)苄基胺基甲酸酯



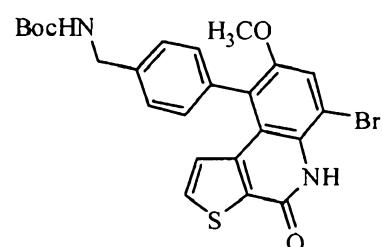
依照一般程序 E，使第三丁基 4-溴苄基胺基甲酸酯(2.9 g, 10 mmol)與雙戊醯二硼反應(2.8 g, 11 mmol)以獲得粗製有機硼酸酯，再與 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮(2.8 g, 9.0 mmol)反應以獲得所望產物

(2.7 g, 68%)棕色固體：ESI MS m/z 437 [C<sub>24</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 452

第三丁基 4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯

9-基)苄基胺基甲酸酯

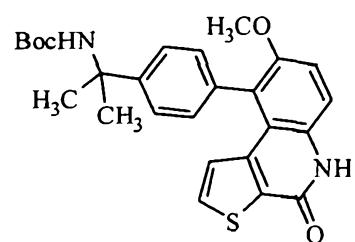


對於第三丁基 4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯(29 mg, 0.055 mmol)於 DMF(1 mL)的溶液添加 N-溴琥珀醯亞胺(12 mg, 0.066 mmol)，將反應混合物於室溫攪拌 1 小時，於 50 °C 加熱 2 小時。將反應混合物濃縮，並將殘渣以製備性 TLC(二氧化矽，甲醇/二氯甲烷梯度)純化以獲得所望產物(10 mg, 35%)：ESI MS m/z 516 [C<sub>24</sub>H<sub>23</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 453

第三丁基 2-[4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]丙-2-基

丙-2-基胺基甲酸酯



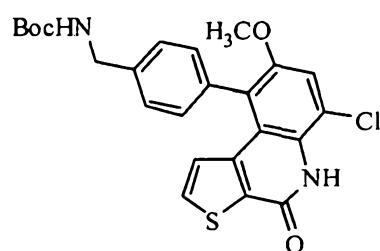
依照一般程序 E，使第三丁基 2-(4-溴苯基)丙-2-基胺基甲酸酯(160 mg, 0.50 mmol)與雙戊醯二硼(140 mg,

0.55 mmol)反應以獲得粗製有機硼酸酯，再與 9-溴-8-甲  
氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(140 mg, 0.45 mmol)  
反應以獲得所望產物(110 mg, 47%)棕色固體：ESI MS m/z  
465 [C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 454

第三丁基 4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并  
[2,3-c]喹啉-

9-基)苄基胺基甲酸酯

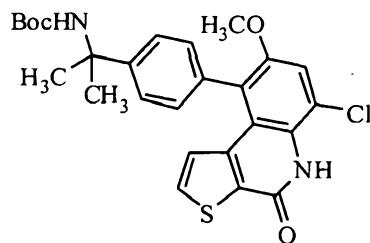


將第三丁基 4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并  
[2,3-c]喹啉-9-基) 苄基胺基甲酸酯(45 mg, 0.10 mmol)  
及 N-氯琥珀醯亞胺(17 mg, 0.13 mmol) 於 DMF(1 mL)的溶  
液，於 50 °C 加熱 3 小時。將反應混合物於減壓下濃縮。  
將殘渣以製備性 HPLC(水/乙腈，有 0.05% TFA 梯度)純化  
以獲得所望產物(15 mg, 32%)棕色固體：ESI MS m/z 471  
[C<sub>24</sub>H<sub>23</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 455

第三丁基 2-[4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩  
并[2,3-c]喹啉-

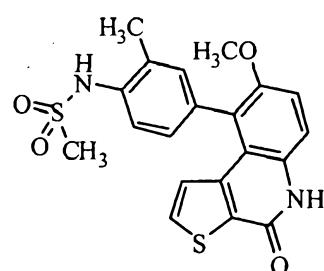
9-基)苯基]丙-2-基胺基甲酸酯



將第三丁基 2-[4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]丙-2-基胺基甲酸酯(130 mg, 0.27 mmol)及 N-氯琥珀醯亞胺(47 mg, 0.35 mmol)於 DMF(3 mL) 的溶液，於 70 °C 加熱 2 小時。將反應混合物冷卻至室溫，以水淬滅，將水層以二氯甲烷/甲醇(9:1)萃取。將合併的有機層以硫酸鈉乾燥，過濾、濃縮，並將殘渣以管柱層析純化(二氧化矽，甲醇/二氯甲烷梯度)以獲得所望產物(42 mg, 31%)棕色固體：ESI MS m/z 500 [C<sub>26</sub>H<sub>27</sub>C<sub>1</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 456

N-[4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-甲基苯基]甲烷磺醯胺

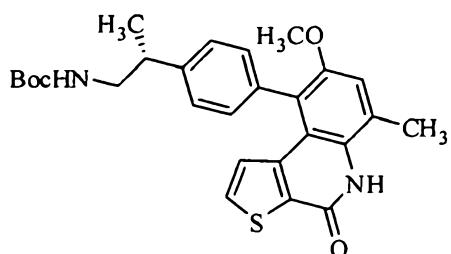


依照一般程序 E，使 N-(4-溴-2-甲基苯基)甲烷磺醯胺(130 mg, 0.50 mmol)與雙戊醯二硼(140 mg, 0.55 mmol)反應以獲得粗製有機硼酸酯，再與 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(140 mg, 0.45 mmol)反應以獲得所望產物(51 mg, 27%)棕色固體：ESI MS m/z 415 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub>

$+ \text{H}]^+$ 。

### 實施例 599

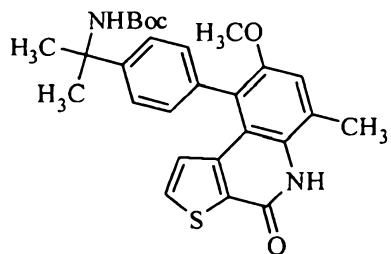
(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 E，使 (R)-第三丁基 2-(4-溴苯基)丙基胺基甲酸酯 (60 mg, 0.20 mmol) 與 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并 [2,3-c] 噠啉-4(5H)-酮 (60 mg, 0.20 mmol) 反應以獲得所望產物 (52 mg, 62%) 棕色固體：ESI MS m/z 479 [ $\text{C}_{27}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}]^+$

### 實施例 600

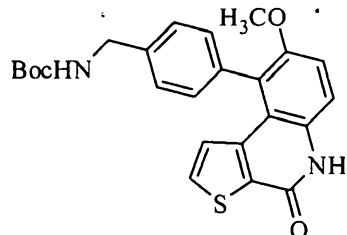
第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)丙-2-基胺基甲酸酯



依照一般程序 E，使 第三丁基 2-(4-溴苯基)丙-2-基胺基甲酸酯 (0.44 g, 1.4 mmol) 與 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并 [2,3-c] 噠啉-4(5H)-酮 (0.45 g, 1.4 mmol) 反應以獲得所望產物 (0.53 g, 79%) 棕色固體：ESI MS m/z 479 [ $\text{C}_{27}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_4\text{S} + \text{H}]^+$ 。

## 實施例 601

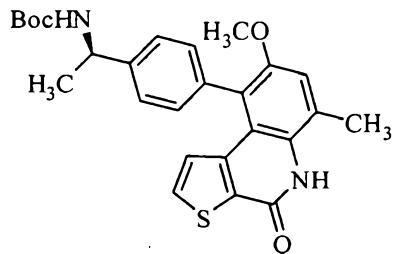
第三丁基 4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯



依照一般程序 E，使第三丁基 4-溴苄基胺基甲酸酯 (0.78 g, 2.7 mmol) 與 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (0.76 g, 2.5 mmol) 反應以獲得所望產物 (0.66 g, 62%) 棕色固體：ESI MS m/z 437 [C<sub>24</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 602

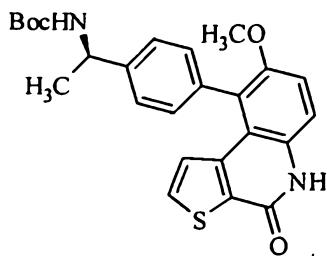
(R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 E，使 (R)-第三丁基 1-(4-溴苯基)乙基胺基甲酸酯 (60 mg, 0.20 mmol) 與 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (60 mg, 0.20 mmol) 反應以獲得所望產物 (52 mg, 62%) 棕色固體：

## 實施例 603

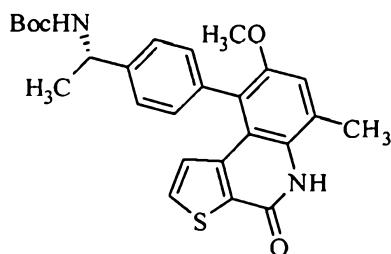
(R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 E，使 (*R*)-第三丁基 1-(4-溴苯基)乙基胺基甲酸酯 (1.5 g, 5 mmol) 與 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (1.4 g, 4.6 mmol) 反應以獲得所望產物 (0.90 g, 43%) 棕色固體：ESI MS m/z 451 [C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 604

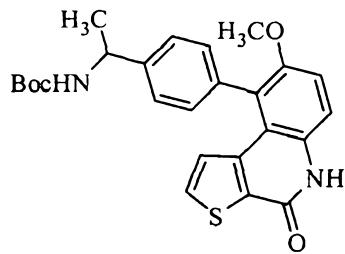
(*S*)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 E，使 (*S*)-第三丁基 1-(4-溴苯基)乙基胺基甲酸酯 (60 mg, 0.20 mmol) 與 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (60 mg, 0.20 mmol) 反應以獲得所望產物 (52 mg, 62%) 棕色固體：ESI MS m/z 465 [C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 605

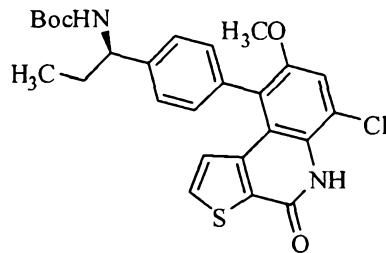
第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 E，使第三丁基 1-(4-溴苯基)乙基胺基甲酸酯 (3.0 g, 10 mmol) 與 9-溴-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (2.8 g, 9.0 mmol) 反應以獲得所望產物 (2.0 g, 50%) 棕色固體：ESI MS m/z 451 [C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 606

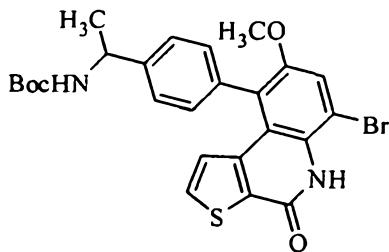
(R)-第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 H，使 (R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (0.67 g, 1.5 mmol) 與 N-氯琥珀醯亞胺 (0.29 g, 1.6 mmol) 於 DMF (10 mL) 反應以獲得所望產物 (0.28 g, 35%) 棕色固體：ESI MS m/z 499 [C<sub>26</sub>H<sub>27</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 607

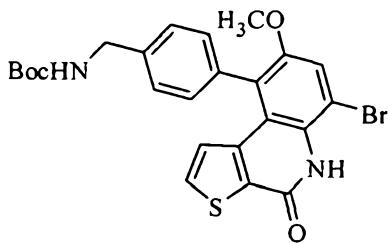
第三丁基 1-(4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基)乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 I，使第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側  
氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯基)乙基胺基  
甲酸酯(1.0 g, 2.2 mmol)與 *N*-溴琥珀醯亞胺(0.45 g, 2.5  
mmol) 於 DMF(10 mL)反應以獲得所望產物(0.35 g, 29%)  
棕色固體：ESI MS m/z 529 [C<sub>25</sub>H<sub>25</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 608

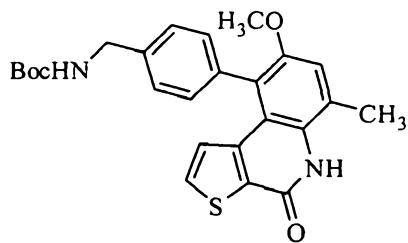
第三丁基 4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并  
[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯



依照一般程序 I，使第三丁基 4-(8-甲氧基-4-側氧基  
-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯  
(0.66 g, 1.5 mmol)與 *N*-溴琥珀醯亞胺(0.30 g, 1.7 mmol)  
於 DMF(10 mL)反應以獲得所望產物(0.39 g, 51%)棕色固  
體：ESI MS m/z 515 [C<sub>24</sub>H<sub>23</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 609

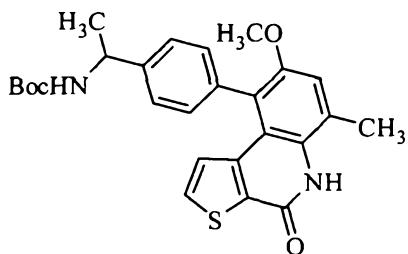
第三丁基 4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩  
并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯



依照一般程序 J，使第三丁基 4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基) 芒基胺基甲酸酯 (52 mg, 0.10 mmol) 與三甲基硼氫烴三聚物 (13 mg, 0.10 mmol) 反應以獲得所望產物 (43 mg, 95%) 灰色固體：ESI MS m/z 451 [C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 610

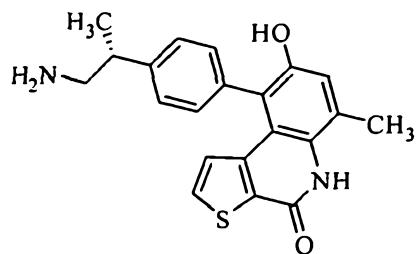
第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基) 苯基)乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 J，使第三丁基 1-(4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基) 苯基)乙基胺基甲酸酯 (32 mg, 0.060 mmol) 與三甲基硼氫烴三聚物 (8 mg, 0.060 mmol) 反應以獲得所望產物 (20 mg, 61%) 灰色固體：ESI MS m/z 465 [C<sub>26</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 1168

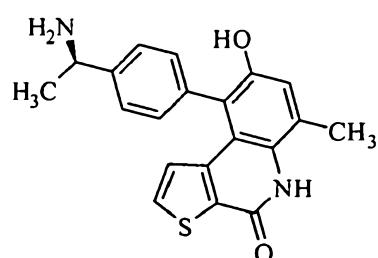
(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 F，使 (R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基 -6- 甲基 -4- 側 氧 基 -4,5- 二 氯 噻 吡 并 [2,3-c] 噩 吲 -9- 基 ) 苯 基 ) 丙 基 胺 基 甲 酸 酯 (43 mg, 0.095 mmol) 與 三 溴 硼 烷 (1.0 M 於 二 氯 甲 烷 , 1.0 mL, 1.0 mmol) 反 應 以 獲 得 所 望 產 物 (18 mg, 51%) 灰 色 固 體 :  $^1\text{H}$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.75 - 10.65 (m, 1H), 9.14 (s, 1H), 8.09 (s, 3H), 7.68 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.43 (d,  $J$  = 8.4 Hz, 2H), 7.21 (d,  $J$  = 8.3 Hz, 2H), 7.05 (s, 1H), 5.86 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.27 - 2.95 (m, 3H), 1.38 (d,  $J$  = 6.6 Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  365 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.6%,  $t_R$  = 8.42 min.

### 實 施 例 1122

(R)-9-(4-(1-胺 基 乙 基 ) 苯 基 ) -8- 羥 基 -6- 甲 基 噻 吡 并 [2,3-c] 噬 吲 -4(5H)- 酮

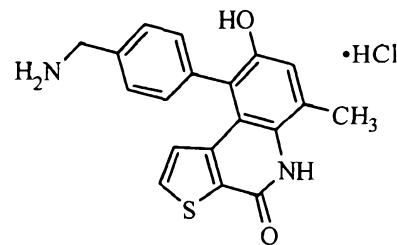


依照一般程序 F，使 (R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基 -6- 甲 基 -4- 側 氧 基 -4,5- 二 氯 噻 吡 并 [2,3-c] 噬 吲 -9- 基 ) 苯 基 ) 乙 基 胺 基 甲 酸 酯 (43 mg, 0.095 mmol) 與 三 溴 硼 烷 (1.0 M 於 二 氯 甲 烷 , 1.0 mL, 1.0 mmol) 反 應 以 獲 得 所 望 產 物 (18

mg, 51%)灰色固體： $^1\text{H}$  NMR(300 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>)  $\delta$  10.72(s, 1H), 8.52(s, 3H), 7.65(dd, *J* = 13.3, 6.8 Hz, 3H), 7.30(d, *J* = 8.2 Hz, 2H), 7.06(s, 1H), 5.87(d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 4.64 – 4.45(m, 1H), 2.50(s, 3H), 1.63(d, *J* = 6.8 Hz, 3H); ESI MS m/z 480 [C<sub>27</sub>H<sub>33</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.6%, *t*<sub>R</sub> = 8.42 min.

### 實施例 1212

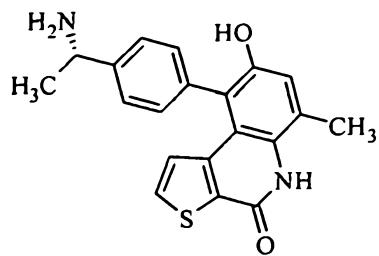
#### 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羥基-6-甲基噁吩并[2,3-*c*]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噁吩并[2,3-*c*]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯(43 mg, 0.095 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol)反應以獲得所望產物(18 mg, 51%)灰色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.62(d, *J* = 8.1 Hz, 2H), 7.53(d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 7.39(d, *J* = 8.0 Hz, 2H), 7.07(s, 1H), 6.10(d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 4.26(s, 1H), 2.57(s, 3H); ESI MS m/z 335 [C<sub>19</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S - H]<sup>+</sup>; HPLC 96.7%, *t*<sub>R</sub> = 7.99 min.

### 實施例 1225

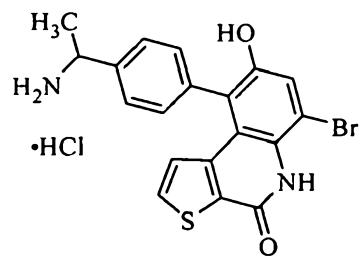
#### (S)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噁吩并[2,3-*c*]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 F，使 (S)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (52 mg, 0.11 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol) 反應以獲得所望產物 (20 mg, 46%) 灰白色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.62 (d, *J* = 7.4 Hz, 2H), 7.54 (d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 7.39 (d, *J* = 7.4 Hz, 2H), 7.07 (s, 1H), 6.09 (d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 4.61 (q, *J* = 6.9 Hz, 1H), 2.57 (s, 3H), 1.76 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H); ESI MS m/z 351 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC > 99%, t<sub>R</sub> = 8.40 min.

### 實施例 1032

9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-溴-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



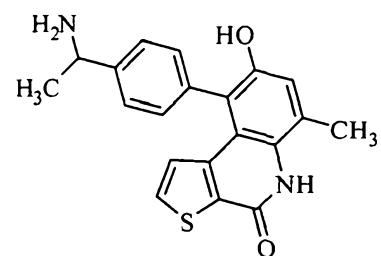
依照一般程序 F，使第三丁基 1-(4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基胺基甲酸酯 (17 mg, 0.032 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol) 反應以獲得所望產物 (8 mg, 55%) 淡黃色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, MeOD) δ 7.62 (d, *J* = 7.4

Hz, 2H), 7.54(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.42 - 7.37(m, 2H), 7.07(d,  $J = 0.7$  Hz, 1H), 6.09(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.67 - 4.56(m, 1H), 2.57(s, 3H), 1.76(d,  $J = 6.9$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  415 [ $C_{19}H_{15}BrN_2O_2S + H$ ]<sup>+</sup>; HPLC 95.0%,  $t_R = 12.16$  min.

### 實施例 1066

9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噁吩并[2,3-c]

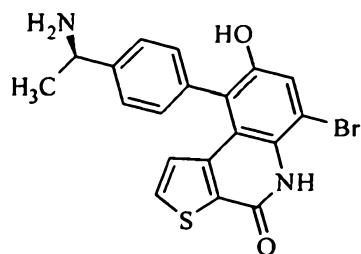
喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 F，使 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(20 mg, 0.043 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol)反應以獲得所望產物(10 mg, 60%)淡灰色固體： $^1H$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.62(d,  $J = 7.4$  Hz, 2H), 7.54(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.42 - 7.37(m, 2H), 7.07(d,  $J = 0.7$  Hz, 1H), 6.09(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.67 - 4.56(m, 1H), 2.57(s, 3H), 1.76(d,  $J = 6.9$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  351 [ $C_{20}H_{18}N_2O_2S + H$ ]<sup>+</sup>; HPLC > 99%,  $t_R = 8.40$  min.

### 實施例 1123

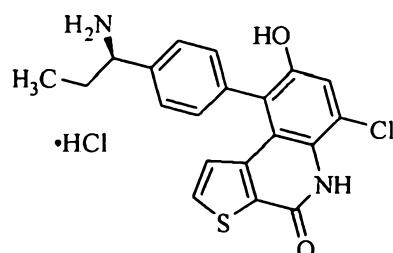
(R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-溴-8-羥基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 F，使(R)-第三丁基 1-(4-(6-溴-8-甲  
氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)  
乙基胺基甲酸酯(24 mg, 0.045 mmol)與三溴硼烷(1.0 M  
於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol)反應以獲得所望產物(18  
mg, 88%)淡灰色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, MeOD) δ 7.64(dd,  
*J* = 10.4, 3.5 Hz, 3H), 7.61(d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 7.47(s,  
1H), 7.42(d, *J* = 7.5 Hz, 2H), 6.07(d, *J* = 5.4 Hz, 1H),  
4.65 – 4.59(m, 1H), 1.76(d, *J* = 6.9 Hz, 3H); ESI MS  
m/z 415 [C<sub>19</sub>H<sub>15</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.0%, t<sub>R</sub> = 8.74 min.

#### 實施例 1159

(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

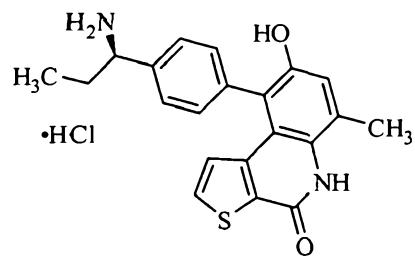


依照一般程序 F，使(R)-第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲  
氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)  
丙基胺基甲酸酯(30 mg, 0.063 mmol)與三溴硼烷(1.0 M  
於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol)反應以獲得所望產物(22  
mg, 87%)淡黃色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.63 –

7.56(m, 2H), 7.53(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.40(t,  $J = 6.6$  Hz, 3H), 7.08(s, 1H), 6.04(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.31(dd,  $J = 9.2, 5.9$  Hz, 1H), 2.57(s, 3H), 2.21 - 2.01(m, 2H), 1.03(t,  $J = 7.4$  Hz, 3H); ESI MS m/z 383 [C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>C<sub>1</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S - H]<sup>+</sup>; HPLC 96.9%,  $t_R = 8.69$  min.

### 實施例 1157

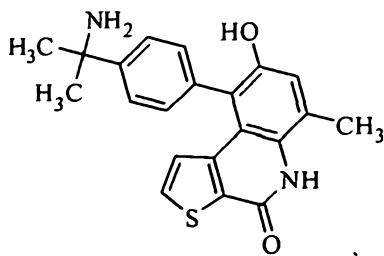
(R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使 (R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (30 mg, 0.063 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol) 反應以獲得所望產物 (22 mg, 87%) 淡灰色固體: <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.63 - 7.56(m, 2H), 7.53(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.40(t,  $J = 6.6$  Hz, 3H), 7.08(s, 1H), 6.04(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.31(dd,  $J = 9.2, 5.9$  Hz, 1H), 2.57(s, 3H), 2.21 - 2.01(m, 2H), 1.03(t,  $J = 7.4$  Hz, 3H); ESI MS m/z 365 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC > 99%,  $t_R = 8.69$  min.

### 實施例 1330

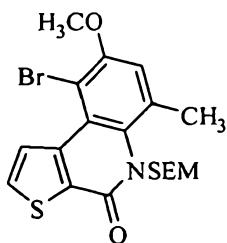
9-(4-(2-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 F，使 (S)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并 [2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (52 mg, 0.11 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol) 反應以獲得所望產物 (20 mg, 46%) 灰白色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.68 (d, *J* = 8.4 Hz, 2H), 7.54 (d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 7.41 (d, *J* = 8.4 Hz, 2H), 7.07 (s, 1H), 6.08 (d, *J* = 5.4 Hz, 1H), 2.57 (s, 3H), 1.86 (s, 6H); ESI MS m/z 363 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S - H]<sup>+</sup>; HPLC 98.7%, t<sub>R</sub> = 8.51 min.

#### 實施例 611 982

9-溴-8-甲氧基-6-甲基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)噻吩并 [2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮

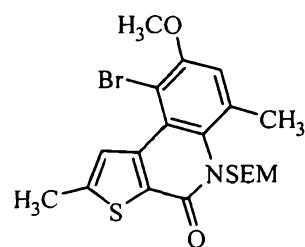


對於 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并 [2,3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (2.2 g, 6.8 mmol) 懸浮於 DMF (15 mL) 與 THF (15 mL) 的混合物的懸浮液，於 0 °C 添加氫化鈉 (60%, 0.54 g, 13.6 mmol)。於加入 (2-(氯甲氧基)乙基)三甲基矽烷 (3.4 g, 20 mmol) 前，將反應混合物於 0 °C 攪拌 30 min。將獲得的混合物於室溫攪拌過夜，然後倒入冰水 (50 mL) 中。將獲得

的沉澱物過濾，並以管柱層析純化(二氧化矽，庚烷/乙酸乙酯)以獲得所望產物(2.7 g, 87%)淡黃色固體：ESI MS m/z 454 [C<sub>19</sub>H<sub>24</sub>BrNO<sub>3</sub>SSi + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 612

9-溴-8-甲氧基-2,6-二甲基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

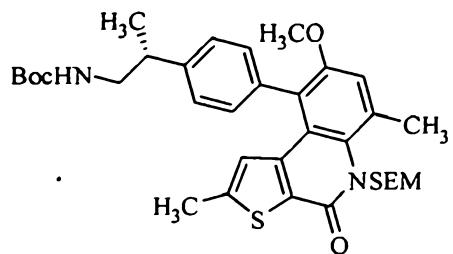


對於攪拌過中的二異丙基胺(85 μL, 0.6 mmol)於 THF(2.5 mL)的溶液，於 -78 °C 添加 n-BuLi(2.5 M, 0.24 mL, 0.60 mmol)，再將反應混合物於 0 °C 攪拌 10 min，然後冷卻至 -78 °C。滴加 9-溴-8-甲氧基-6-甲基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(0.23 g, 0.50 mmol)於 THF(1 mL)的溶液，將反應混合物於 -78 °C 攪拌 30 min。添加碘甲烷(93 μL, 1.5 mmol)，將反應混合物於 -78 °C 攪拌 2 小時，再藉由添加飽和氯化銨水溶液淬滅，並以二氯甲烷萃取。將有機層以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 乾燥，過濾、於真空濃縮，將殘渣以管柱層析純化(二氧化矽，庚烷/乙酸乙酯)以獲得所望產物(0.13 g, 55%)白色固體：ESI MS m/z 468 [C<sub>20</sub>H<sub>26</sub>BrNO<sub>3</sub>SSi + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 613

(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-2,6-二甲基-4-側氧基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)-4,5-二氫噻吩并

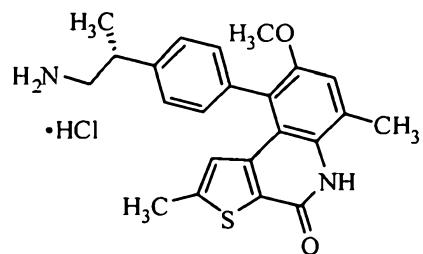
[2, 3-c] 嘴啉 -9- 基) 苯基) 丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 (R)- 第三丁基 2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧雜硼烷-2-基) 苯基) 丙基胺基甲酸酯 (0.12 g, 0.33 mmol) 與 9-溴-8-甲氧基-2, 6-二甲基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基) 嘴吩并 [2, 3-c] 嘴啉-4(5H)-酮 (0.12 g, 0.33 mmol) 反應以獲得所望產物 (78 mg, 45%) 固體：ESI MS m/z 623 [C<sub>34</sub>H<sub>46</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>SSi + H]<sup>+</sup>。

實施例 1341

(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-2, 6-二甲基嘴吩并 [2, 3-c] 嘴啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

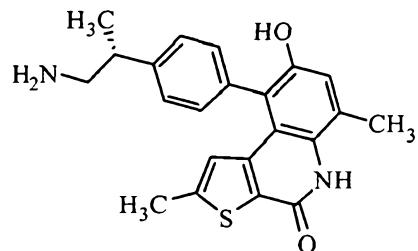


對於 (R)- 第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-2, 6-二甲基-4-側氧基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)-4, 5-二氫嘴吩并 [2, 3-c] 嘴啉-9-基) 苯基) 丙基胺基甲酸酯 (24 mg, 0.039 mmol) 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (1 mL) 的溶液，於室溫添加三氟乙酸 (1.0 mL)，將反應物於室溫攪拌 2 小時。將混合物濃縮，並將殘渣溶於甲醇 (2 mL)，以 NH<sub>4</sub>OH (2 mL) 處理。將獲得的混合物於室溫攪拌 2 小時，並以製備性 HPLC (C18 二氧化

矽，乙腈/水(有 0.05% TFA)梯度)純化。合併所望的區分，濃縮，將殘渣溶於 HCl 水溶液，於高真空濃縮及乾燥以獲得所望產物(5 mg, 30%)鹽酸鹽： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.52(dd,  $J = 7.8, 1.5$  Hz, 1H), 7.47(dd,  $J = 7.7, 1.5$  Hz, 1H), 7.32(s, 1H), 7.31 - 7.22(m, 2H), 5.30(d,  $J = 2.7$  Hz, 1H), 3.29 - 3.18(m, 3H), 2.63(s, 3H), 1.47(d,  $J = 6.1$  Hz, 3H); ESI MS m/z 392 [C<sub>23</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 1340

(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基-2,6-二甲基噁  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

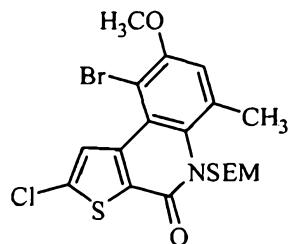


對於(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-2,6-二甲基-4-側  
氧基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)-4,5-二氫噁  
吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(40 mg,  
0.064 mmol) 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>(1 mL)的溶液，於 0 °C 添加 BBr<sub>3</sub>(1.0 M 於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol)，將反應物於該溫度攪拌 1 小時，並藉由倒入水或冰水中以淬滅。將獲得的混合物濃縮，將殘渣溶解於甲醇(2 mL)，以 NH<sub>4</sub>OH(2 mL)處理。將獲得的混合物於室溫攪拌 2 小時，以製備性 HPLC(C18 二  
氧化矽，乙腈/水(有 0.05% TFA)梯度)純化。合併所望的區分，濃縮，並將殘渣溶於 HCl 水溶液，於高真空濃縮及乾燥以獲得所望產物鹽酸鹽： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$

7.55(dd,  $J = 7.9, 1.9$  Hz, 1H), 7.45(dd,  $J = 7.7, 1.9$  Hz, 1H), 7.34(dd,  $J = 7.9, 1.8$  Hz, 1H), 7.28(dd,  $J = 7.7, 1.7$  Hz, 1H), 7.06(d,  $J = 0.7$  Hz, 1H), 5.70(d,  $J = 1.1$  Hz, 1H), 3.29 - 3.13(m, 3H), 2.55(s, 3H), 2.30(d,  $J = 1.0$  Hz, 3H), 1.50(d,  $J = 6.5$  Hz, 3H); ESI MS m/z 378 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 614

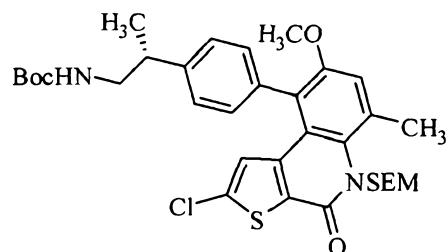
9-溴-2-氯-8-甲氧基-6-甲基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



對於已攪拌的二異丙基胺(85  $\mu$ L, 0.6 mmol)於 THF(2.5 mL)的溶液，於 -78 °C 添加 n-BuLi(2.5M, 0.24 mL, 0.6 mmol)。將獲得的混合物於 0 °C 攪拌 10 min，然後於 -78 °C 冷卻。滴加 9-溴-8-甲氧基-6-甲基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(0.23 g, 0.50 mmol)於 THF(1 mL)的溶液，並將獲得的混合物於 -78 °C 攪拌 30 min。滴加六氟乙烷(0.24 g, 1.0 mmol)，並將混合物於 -78 °C 攪拌 2 小時，並回溫至室溫。將反應物藉由添加飽和氯化銨淬滅，並以二氯甲烷(2x)萃取。將合併的萃取物以 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 乾燥，過濾並於真空中濃縮。將殘渣以管柱層析純化(庚烷 / 乙酸乙酯)以獲得所望產物(0.13 g, 52%)白色固體：ESI MS m/z 488 [C<sub>19</sub>H<sub>23</sub>BrClNO<sub>3</sub>SSi + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 615

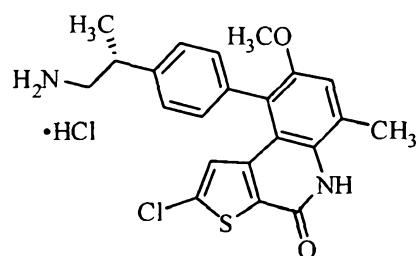
(R)-第三丁基 2-(4-(2-氯-8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 E，使 (R)-第三丁基 2-(4-溴苯基)丙基胺基甲酸酯 (97 mg, 0.31 mmol) 與 9-溴-8-甲氧基-2,6-二甲基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (0.10 g, 0.21 mmol) 反應以獲得所望產物 (62 mg, 46%) 固體：ESI MS m/z 643 [C<sub>33</sub>H<sub>43</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>SSi + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 1354

(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-2-氯-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

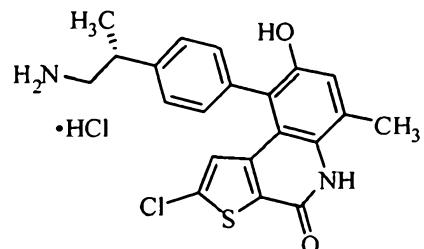


對於 (R)-第三丁基 2-(4-(2-氯-8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (11 mg, 0.017 mmol) 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (1 mL) 的溶液，於室溫添加三氟乙酸 (1.0 mL)，並將反應物於室溫攪拌 2 小時。將混合物濃縮，並將

殘渣溶解於甲醇(2 mL)，並以 NH<sub>4</sub>OH(2 mL)處理。將獲得的混合物於室溫攪拌 2 小時，以製備性 HPLC(C18 二氧化矽，乙腈/水(有 0.05% TFA)梯度)純化。合併所望的區分，濃縮並將殘渣溶於 HCl 水溶液，於高真空濃縮及乾燥以獲得所望產物(7 mg, 92%)鹽酸鹽：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.52(dd, *J* = 7.8, 1.5 Hz, 1H), 7.47(dd, *J* = 7.7, 1.5 Hz, 1H), 7.32(s, 1H), 7.31 – 7.22(m, 2H), 5.30(d, *J* = 2.7 Hz, 1H), 3.29 – 3.18(m, 3H), 2.63(s, 3H), 1.47(d, *J* = 6.1 Hz, 3H); ESI MS m/z 413 [C<sub>22</sub>H<sub>21</sub>ClN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 1353

(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-2-氯-8-羥基-6-甲基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

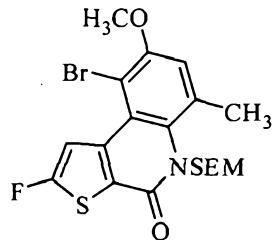


對於(R)-第三丁基 2-(4-(2-氯-8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)-4,5-二氫噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(32 mg, 0.050 mmol)於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> 的溶液，於 0 °C 添加 BBr<sub>3</sub>(1.0 M 於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol)，將反應物於該溫度攪拌 1 小時，並藉由倒入水或冰水中以淬滅。將獲得的混合物濃縮，並將殘渣溶解於甲醇(2 mL)，以 NH<sub>4</sub>OH(2 mL)處理。將獲得的混合物於室溫攪拌 2 小時，以製備性 HPLC(C18 二氧化矽，乙腈/水(有 0.05% TFA)梯度)純化。將所望的區

分合併，濃縮並將殘渣溶於 HCl 水溶液，於高真空濃縮及乾燥以獲得所望產物鹽酸鹽： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.57(dd,  $J = 7.9, 1.8$  Hz, 1H), 7.48(dd,  $J = 7.8, 1.8$  Hz, 1H), 7.35(dd,  $J = 7.9, 1.7$  Hz, 1H), 7.29(dd,  $J = 7.8, 1.6$  Hz, 1H), 7.10(d,  $J = 0.7$  Hz, 1H), 5.75(s, 1H), 3.28 – 3.19(m, 3H), 2.55(s, 3H), 1.50(d,  $J = 6.4$  Hz, 3H). ESI MS  $m/z$  399 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{19}\text{ClN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ 。

### 實施例 616

9-溴-2-氟-8-甲氧基-6-甲基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

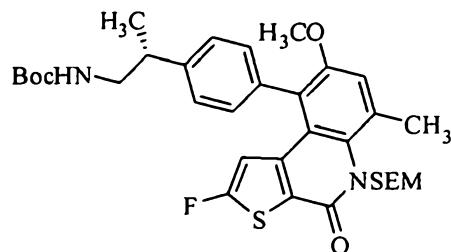


對於已攪拌的二異丙基胺( $84 \mu\text{L} 0.6 \text{ mmol}$ )於 THF( $2.5 \text{ mL}$ )的溶液，於  $-78^\circ\text{C}$  加入  $n\text{-BuLi}(2.5\text{M}, 0.24 \text{ mL}, 0.6 \text{ mmol})$ 。將獲得的混合物於  $0^\circ\text{C}$  攪拌  $10 \text{ min}$ ，然後於  $-78^\circ\text{C}$  冷卻。滴加 9-溴-8-甲氧基-6-甲基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮( $0.23 \text{ g}, 0.50 \text{ mmol}$ )於 THF( $1 \text{ mL}$ )的溶液，並將獲得的混合物於  $-78^\circ\text{C}$  攪拌  $30 \text{ min}$ 。加入  $N$ -氟苯磺醯亞胺( $0.32, 1.0 \text{ mmol}$ )於 THF( $1 \text{ mL}$ )的溶液，並將該混合物於  $-78^\circ\text{C}$  攪拌  $2 \text{ 小時}$ 。將反應物藉由添加飽和氯化銨淬滅，並以二氯甲烷萃取( $2\times$ )。將合併的萃取物以  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  乾燥，過濾並於真空中濃縮。將殘渣藉由管柱層析純化(庚烷/乙酸乙酯)以獲得所望

產物 (98 mg, 41%) 白色固體 : ESI MS m/z 472  
 $[C_{19}H_{23}BrFN_0O_3SSi + H]^+$ 。

### 實施例 617

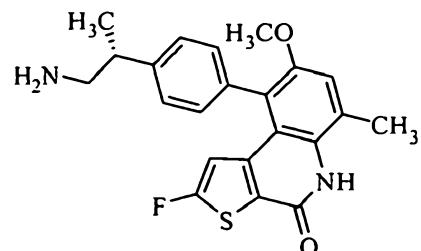
(R)-第三丁基 2-(4-(2-氟-8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 B，使 (R)-第三丁基 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (0.11 g, 0.31 mmol) 與 9-溴-2-氟-8-甲氧基-6-甲基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (98 mg, 0.21 mmol) 反應以獲得所望產物 (0.11 g, 85%) 固體 : ESI MS m/z 627  $[C_{33}H_{43}FN_2O_5SSi + H]^+$ 。

### 實施例 1375

(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-2-氟-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

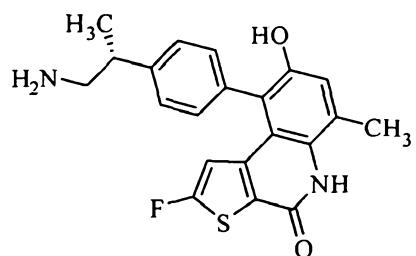


對於 (R)-第三丁基 2-(4-(2-氟-8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)-4,5-二氫噻吩

并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (17 mg, 0.027 mmol) 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  (1 mL) 的溶液，於室溫添加三氟乙酸 (1.0 mL)，將反應物於該溫度攪拌 2 小時。將混合物濃縮，並將殘渣溶於甲醇 (2 mL)，以  $\text{NH}_4\text{OH}$  (2 mL) 處理。將獲得的混合物於室溫攪拌 2 小時，以製備性 HPLC (C18 二氧化矽，乙腈 / 水 (有 0.05% TFA) 梯度) 純化。合併所望區分，濃縮並將殘渣溶於  $\text{HCl}$  水溶液，於高真空濃縮及乾燥以獲得所望產物 (5 mg, 43%) 鹽酸鹽： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.52 (dd,  $J = 7.8, 1.5$  Hz, 1H), 7.47 (dd,  $J = 7.7, 1.5$  Hz, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.31 - 7.22 (m, 2H), 5.30 (d,  $J = 2.7$  Hz, 1H), 3.29 - 3.18 (m, 3H), 2.63 (s, 3H), 1.47 (d,  $J = 6.1$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  397 [ $\text{C}_{22}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ 。

### 實施例 1383

(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-2-氟-8-羥基-6-甲基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮

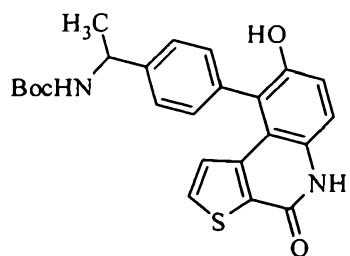


對於 (R)-第三丁基 2-(4-(2-氟-8-甲基-6-甲基-4-側氨基-5-((2-(三甲基矽基)乙氧基)甲基)-4,5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (60 mg, 0.096 mmol) 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  (1 mL) 的溶液，於 0 °C 加入  $\text{BBr}_3$  (1.0 M 於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol)，並將反應物於該溫度攪拌 1 小時，藉由倒入水或冰水中以淬滅。將獲得的混合物

濃縮，將殘渣溶於甲醇(2 mL)，以 NH<sub>4</sub>OH(2 mL)處理。將獲得的混合物於室溫攪拌 2 小時，並以製備性 HPLC(C18 二氧化矽，乙腈/水(有 0.05% TFA)梯度)純化。合併所望的區分，濃縮並將殘渣溶於 HCl 水溶液，於高真空濃縮及乾燥以獲得所望產物鹽酸鹽：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.55(dd, *J* = 7.9, 1.7 Hz, 1H), 7.46(dd, *J* = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.32(dd, *J* = 23.9, 7.9 Hz, 2H), 7.10(s, 1H), 5.46(d, *J* = 2.9 Hz, 1H), 3.28 - 3.15(m, 3H), 2.55(s, 3H), 1.49(d, *J* = 6.3 Hz, 3H); ESI MS m/z 383 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 618

第三丁基 1-(4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基胺基甲酸酯

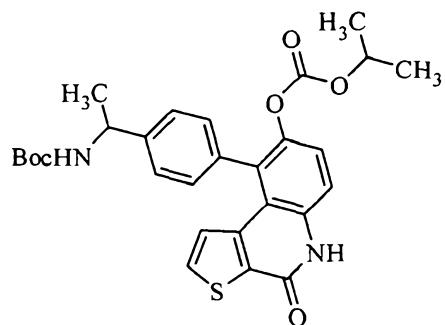


對於第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯基)乙基胺基甲酸酯(0.96 g, 2.1 mmol)於二氯甲烷(15 mL)的溶液，於 0 °C 加入 BBr<sub>3</sub>(1.0 M 於二氯甲烷, 15 mL, 15 mmol)，將反應物於該溫度攪拌 1 小時，並藉由倒在水或冰水上以淬滅。將沉澱過濾，並懸浮於 DMF(8 mL)。加入二第三丁基碳酸氫酯(0.85 g, 3.9 mmol)及三乙胺(1.1 mL, 7.8 mmol)，並將混合物於室溫攪拌 2 小時。加入水並將沉澱以管柱層析純化以獲得所望產

物固體：ESI MS  $m/z$  437  $[C_{24}H_{24}N_2O_4S + H]^+$ 。

### 實施例 619

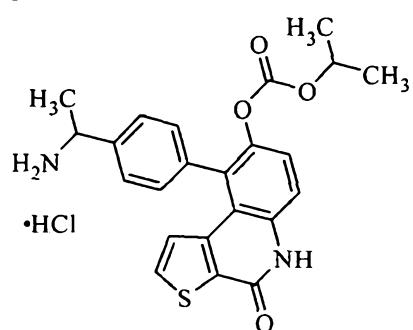
第三丁基 1-(4-(異丙氧基羧基)-4-側氧基-4,5-二  
氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基乙基氨基甲酸酯



對於第三丁基 1-(4-(異丙基-4-側氧基-4,5-二  
氫噻  
吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基氨基甲酸酯(44 mg,  
0.10 mmol)於 THF(2 mL)的溶液，於 0 °C 加入 NaH(60%，  
6 mg, 0.15 mmol)，將反應物於該溫度攪拌 1 小時。加入氯  
甲酸異丙酯(21  $\mu$ L, 0.15 mmol)，並將獲得的混合物於室  
溫攪拌 3 小時。加水並將該混合物以二氯甲烷萃取( $2 \times 15$   
mL)。將合併的萃取物以  $Na_2SO_4$  乾燥，過濾並於真空中濃  
縮。將殘渣以管柱層析純化(庚烷/乙酸乙酯)以獲得所望產  
物(26 mg, 50%)固體：ESI MS  $m/z$  523  $[C_{28}H_{30}N_2O_6S + H]^+$ 。

### 實施例 1077

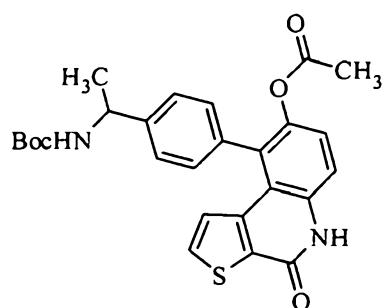
9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-4-側氧基-4,5-二  
氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基異丙基碳酸酯鹽酸鹽



依照一般程序 C，使第三丁基 1-(4-(異丙氧基羰基氧)-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基乙基胺基甲酸酯(20 mg, 0.038 mmol)與三氟乙酸(3 mL)反應以獲得所望產物(18 mg, quant.)淡黃色固體：ESI MS m/z 423 [C<sub>23</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 620

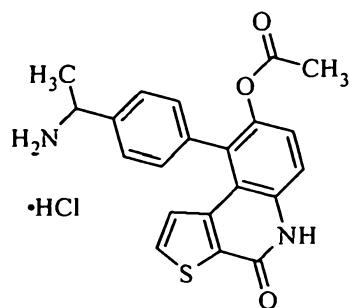
9-(4-(1-(第三丁氧基羰基氨基)乙基)苯基)-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基乙酸酯



依照程序製備第三丁基 1-(4-(異丙氧基羰基氧)-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基乙基胺基甲酸酯(44 mg, 0.10 mmol)，與乙酸酐反應(11 μL, 0.12 mmol)以獲得所望產物(30 mg, 63%)固體：ESI MS m/z 479 [C<sub>26</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>S + H]<sup>+</sup>。

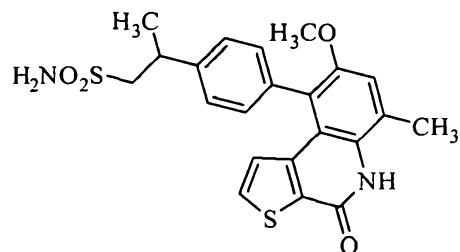
### 實施例 1099

9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基乙酸酯 鹽酸鹽



## 實施例 621

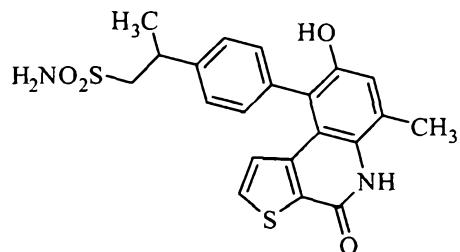
2-(4-(4-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)丙烷-1-磺醯胺



依照一般程序 E，使 2-(4-溴苯基)丙-1-磺醯胺 (0.12 g, 0.43 mmol) 與 9-溴-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮 (0.14 g, 0.44 mmol) 反應以獲得所望產物 (16 mg, 8%) 棕色固體：ESI MS m/z 443 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 1419

2-(4-(8-羥基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)丙烷-1-磺醯胺

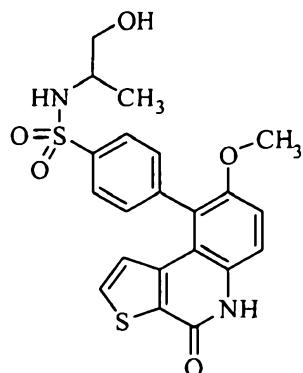


依照一般程序 F，使 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)丙-1-磺醯胺 (16 mg, 0.036 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol) 反應以獲得所望產物 (7.0 mg, 44%) 淡棕色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.68 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.54 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.41 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.07 (s, 1H), 6.08 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 2.57 (s, 3H), 1.86 (s, 6H)；

ESI MS  $m/z$  429 [ $C_{21}H_{20}N_2O_4S_2 + H$ ]<sup>+</sup>; HPLC 98.7%,  $t_R = 8.51$  min.

### 實施例 1057

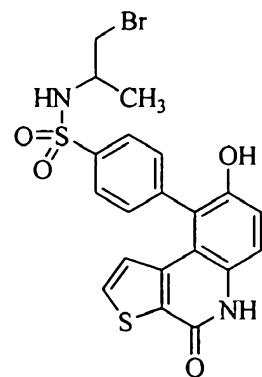
N-(1-羥基丙-2-基)-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯磺醯胺



依照一般程序 B，使 N-(1-羥基丙-2-基)-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯磺醯胺 (570 mg, 1.7 mmol) 與 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮 (471 mg, 1.5 mmol) 以獲得所望產物 (109 mg, 16%) 灰白色粉末。ESI MS  $m/z$  445 [ $C_{21}H_{20}N_2O_5S_2 + H$ ]<sup>+</sup>;

### 實施例 1062

N-(1-溴丙-2-基)-4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯磺醯胺



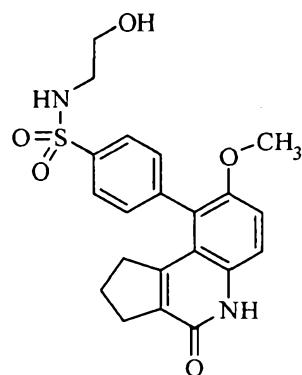
依照一般程序 F，使 N-(1-羥基丙-2-基)-4-(8-甲氧基

-4-側 氧 基 -4, 5- 二 氯 嘧 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -9- 基 ) 苯 磺 鹼 胺  
(55 mg, 0.12 mmol) 與 三 溴 硼 烷 (0.2 mL) 反 應 以 獲 得 所 望  
產 物 (48 mg, 79%) 灰 白 色 固 體 :

$^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD); ESI MS m/z 494 [C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>; HPLC 99.0% (AUC), t<sub>R</sub> = 11.39 min;

#### 實 施 例 1090

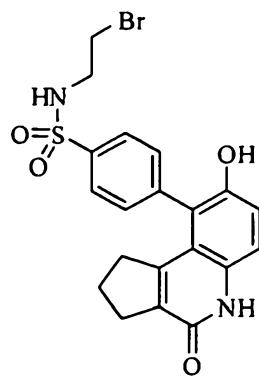
N-(2-羥 基 乙 基 )-4-(8-甲 氧 基 -4-側 氧 基 -2, 3, 4, 5-四 氯  
-1H-環 戊 [c] 喹 吡 -9- 基 ) 苯 磺 鹼 胺



依 照 一 般 程 序 B , 使 N-(2-羥 基 乙 基 )-4-(4, 4, 5, 5-四  
甲 基 -1, 3, 2-二 氧 雜 硼 烷 -2- 基 ) 苯 磺 鹼 胺 (268 mg, 0.82  
mmol) 與 9-溴 -8- 甲 氧 基 -2, 3- 二 氯 -1H- 環 戊 [c] 喹 吡  
-4(5H)-酮 (268 mg, 0.68 mmol) 反 應 以 獲 得 所 望 產 物 (68 mg,  
16%) 灰 白 色 固 體 :  $^1\text{H}$  NMR: (300 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) ESI MS  
m/z 415 [C<sub>21</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 11.73 min;

#### 實 施 例 1094

N-(2-溴 乙 基 )-4-(8-羥 基 -4-側 氧 基 -2, 3, 4, 5-四 氯 -1H-環  
戊 [c] 喹 吡 -9- 基 ) 苯 磺 鹼 胺

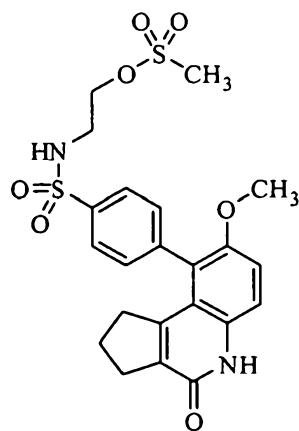


依照一般程序 F，使 N-(2-羥基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-2,3,4,5-四氫-1H-環戊[c]喹啉-9-基)苯磺醯胺 (55 mg, 0.13 mmol) 與三溴硼烷 (0.2 mL) 反應以獲得所望產物 (11 mg, 18%) 灰白色固體：

$^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ ) ESI MS  $m/z$  464 [ $\text{C}_{20}\text{H}_{19}\text{BrN}_2\text{O}_4\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 94.9% (AUC),  $t_{\text{R}} = 14.88 \text{ min}$ ;

#### 實施例 622

2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-2,3,4,5-四氫-1H-環戊[c]喹啉-9-基)苯基磺醯胺)乙基 甲烷磺酸酯

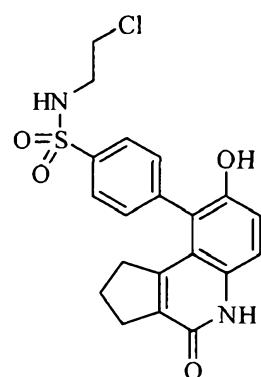


對於已攪拌的 N-(2-羥基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-2,3,4,5-四氫-1H-環戊[c]喹啉-9-基)苯磺醯胺 (230 mg, 0.555 mmol) 與三乙胺 (168 mg, 1.66 mmol) 於無水四氫呋喃 (10 mL) 的溶液，添加甲烷磺醯氯 (88 mg, 0.666 mmol)。將該反應混合物於室溫攪拌 20 小時。之後將反應

混合物過濾以移除白色沉澱，將其以四氫呋喃洗滌(30 mL)。將濾液於減壓下濃縮成橙色固體。將殘渣以閃式層析純化以獲得所望產物棕色固體(141 mg, 51%)。ESI MS  $m/z$  493 [C<sub>22</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>7</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>

### 實施例 1145

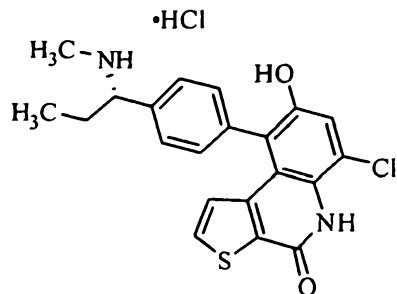
N-(2-氯乙基)-4-(8-羥基-4-側氨基-2,3,4,5-四氫-1H-環戊[c]喹啉-9-基)苯磺醯胺



對於已攪拌的 2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-2,3,4,5-四氫-1H-環戊[c]喹啉-9-基)苯基磺醯胺)乙基甲烷磺酸酯(141 mg, 0.286 mmol)於無水二氯乙烷(10 mL)的溶液，添加氯化鋁(190 mg, 1.43 mmol)。將反應混合物回流攪拌20小時。之後將反應物冷卻至室溫，並於減壓下濃縮。將殘渣以甲醇(10 mL)處理，使於室溫靜置1小時。於靜置時產生沉澱，由母液過濾出來。將該沉澱以製備性HPLC(C18二氧化矽，乙腈/水，有0.05% TFA梯度)純化以獲得所望產物(9 mg, 7.5%)灰白色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>) ESI MS  $m/z$  419 [C<sub>20</sub>H<sub>19</sub>C<sub>1</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.6%(AUC), *t*<sub>R</sub> = 15.94 min.

### 實施例 1154

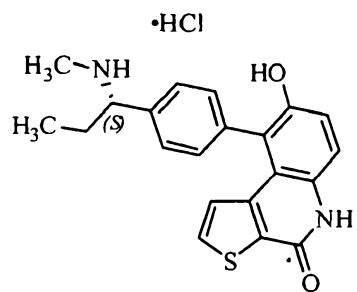
(S)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐



依照一般程序 F, 使 (S)-第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯 (100 mg, 0.194 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷 1.16 mL, 1.16 mmol) 反應以獲得所望產物 (35 mg, 45%) 白色固體:  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, DMSO)  $\delta$  10.81(d,  $J = 10.5$  Hz, 1H), 9.83(s, 1H), 9.70 - 9.45(m, 1H), 9.28(s, 1H), 7.73(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.70 - 7.60(m, 2H), 7.38(dd,  $J = 12.4, 4.7$  Hz, 3H), 5.70(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.19(dt,  $J = 12.1, 6.0$  Hz, 1H), 2.51(s, 3H), 2.20(ddd,  $J = 14.4, 9.5, 5.9$  Hz, 1H), 2.02 - 1.89(m, 1H), 0.84(t,  $J = 7.4$  Hz, 3H); ESI MS m/z 399 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 96.9%(AUC),  $t_{\text{R}} = 9.36$  min.

實施例 1148

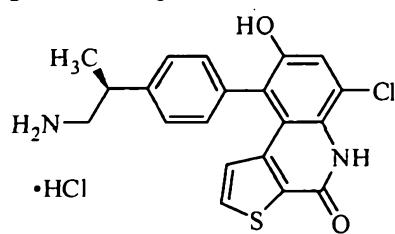
(S)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐



依照一般程序 F，使 (S)-第三丁基 1-(4-(8-甲氨基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯 (135 mg, 0.282 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 1.69 mL, 1.69 mmol) 反應以獲得所望產物 (48 mg, 47%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.62 (ddd,  $J = 11.7, 8.0, 1.7$  Hz, 2H), 7.56 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.51 - 7.40 (m, 3H), 7.19 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 5.97 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.22 (dd,  $J = 10.7, 4.6$  Hz, 1H), 2.70 (s, 3H), 2.34 - 2.02 (m, 2H), 1.04 - 0.96 (m, 3H); ESI MS  $m/z$  365 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 95.9% (AUC),  $t_R = 8.38$  min.

#### 實施例 1181

(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



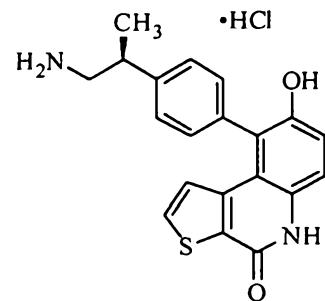
依照一般程序 F，使 (S)-第三丁基 2-(4-(6-氯-8-甲氨基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (100 mg, 0.20 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M

於二氯甲烷，1.2 mL，1.2 mmol)反應以獲得所望產物(35 mg, 46%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.62(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.56(dd,  $J$  = 7.9, 1.9 Hz, 1H), 7.48(dd,  $J$  = 7.8, 1.9 Hz, 1H), 7.36(dd,  $J$  = 7.9, 1.7 Hz, 1H), 7.34 - 7.29(m, 2H), 6.12(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.29 - 3.15(m, 3H), 1.49(d,  $J$  = 6.5 Hz, 3H); ESI MS m/z 385 [C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC),  $t_R$  = 8.74 min.

### 實施例 1163

(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]

喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

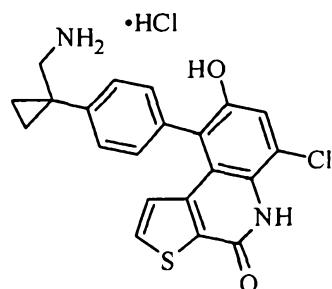


依照一般程序 F，使(S)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯(110 mg, 0.236 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷，1.42 mL, 1.42 mmol)反應以獲得所望產物(38 mg, 47%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.61 - 7.53(m, 2H), 7.47(dd,  $J$  = 7.8, 1.9 Hz, 1H), 7.41(dd,  $J$  = 10.9, 6.1 Hz, 1H), 7.37(dd,  $J$  = 7.9, 1.7 Hz, 1H), 7.32(dd,  $J$  = 7.7, 1.7 Hz, 1H), 7.18(d,  $J$  = 8.9 Hz, 1H), 6.15(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.29 - 3.17(m, 3H), 1.50(d,  $J$  = 6.4 Hz, 3H); ESI MS m/z 351 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC

>99% (AUC),  $t_R = 8.58 \text{ min.}$

### 實施例 1116

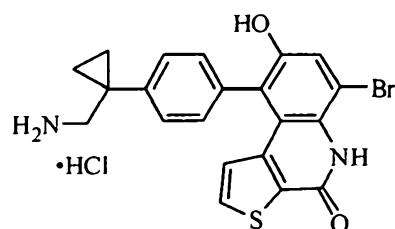
9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基(1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)環丙基)甲基胺基甲酸酯(50 mg, 0.09 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 0.58 mL, 0.58 mmol)反應以獲得所望產物(19 mg, 48%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR; (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.66 - 7.58(m, 3H), 7.38 - 7.27(m, 3H), 6.14(d,  $J = 5.4 \text{ Hz}$ , 1H), 3.26(s, 2H), 1.19(t,  $J = 5.5 \text{ Hz}$ , 2H), 1.11(t,  $J = 5.5 \text{ Hz}$ , 2H); ESI MS  $m/z$  397 [C<sub>21</sub>H<sub>17</sub>C<sub>1</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.4% (AUC),  $t_R = 9.24 \text{ min.}$

### 實施例 1401

9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯基)-6-溴-8-羥基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

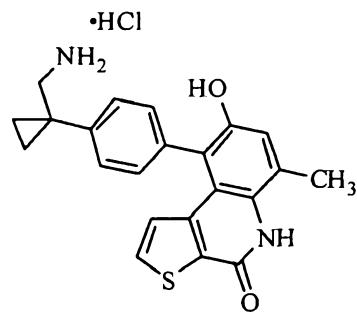


依照一般程序 F，使 9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯

基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽(100 mg, 0.22 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 1.32 mL, 1.32 mmol)反應以獲得所望產物(52 mg, 54%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.63(t,  $J$  = 6.8 Hz, 3H), 7.48(s, 1H), 7.33(d,  $J$  = 8.2 Hz, 2H), 6.14(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.26(s, 2H), 1.19(t,  $J$  = 5.6 Hz, 2H), 1.12(t,  $J$  = 5.5 Hz, 2H); ESI MS m/z 442 [C<sub>21</sub>H<sub>17</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC),  $t_R$  = 9.25 min.

#### 實施例 1254

9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



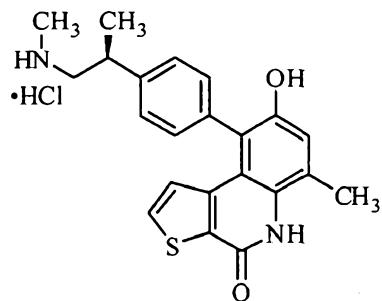
依照一般程序 F，使第三丁基(1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)環丙基)甲基胺基甲酸酯(120 mg, 0.24 mmol) was reacted with 三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 1.46 mL, 1.46 mmol)以獲得所望產物(38 mg, 42%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.60(dd,  $J$  = 12.3, 7.1, 3.6 Hz, 3H), 7.34 - 7.29(m, 2H), 7.08(d,  $J$  = 0.6 Hz, 1H), 6.19(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.25(s, 2H), 2.57(s, 3H), 1.22 - 1.06(m, 4H); ESI MS m/z 377 [C<sub>23</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.6%(AUC),  $t_R$

= 8.97 min.

### 實施例 1215

(S)-8-羥基-6-甲基-9-(4-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)

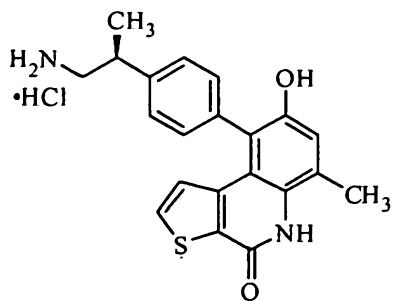
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使(S)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯(50 mg, 0.10 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 0.61 mL, 0.61 mmol)反應以獲得所望產物(12 mg, 32%)淡黃色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.60 - 7.53(m, 2H), 7.47(dd,  $J$  = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.35(dd,  $J$  = 7.9, 1.7 Hz, 1H), 7.30(dd,  $J$  = 7.7, 1.7 Hz, 1H), 7.08(s, 1H), 6.15(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.40 - 3.27(m, 3H), 2.74(s, 3H), 2.57(s, 3H), 1.50(d,  $J$  = 6.6 Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  379 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC),  $t_R$  = 8.88 min.

### 實施例 1232

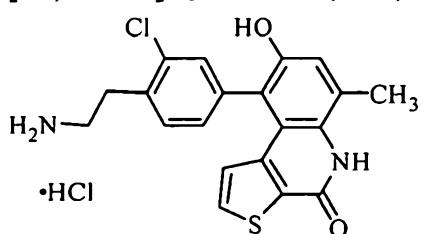
(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使 (S)-第三丁基 2-(4-(8-甲氨基  
-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)苯  
基)丙基胺基甲酸酯 (100 mg, 0.209 mmol) 與三溴硼烷 (1.0  
M 於二氯甲烷, 1.25 mL, 1.25 mmol) 反應以獲得所望產物  
(38 mg, 52%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.60 -  
7.52 (m, 2H), 7.45 (dd,  $J$  = 7.8, 1.9 Hz, 1H), 7.35 (dd,  
 $J$  = 7.9, 1.7 Hz, 1H), 7.29 (dd,  $J$  = 7.7, 1.7 Hz, 1H),  
7.08 (s, 1H), 6.16 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.29 - 3.17 (m,  
3H), 2.57 (s, 3H), 1.50 (d,  $J$  = 6.4 Hz, 3H); ESI MS  $m/z$   
365 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.0% (AUC),  $t_R$  = 8.63 min.

#### 實施例 1264

9-(4-(2-氨基乙基)-3-氯苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并  
[2,3-c]噁唑-4(5H)-酮 鹽酸鹽

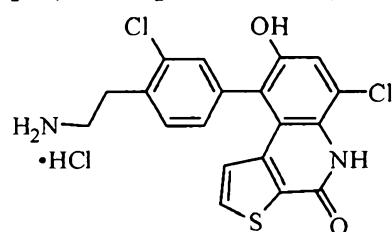


依照一般程序 F，使第三丁基 2-氯-4-(8-甲氨基-6-  
甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁唑-9-基)苯乙  
基胺基甲酸酯 (120 mg, 0.24 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於  
二氯甲烷, 1.45 mL, 1.45 mmol) 反應以獲得所望產物 (52

mg, 57%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.64(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.54(d,  $J$  = 7.8 Hz, 1H), 7.37(d,  $J$  = 1.4 Hz, 1H), 7.23(dd,  $J$  = 7.7, 1.4 Hz, 1H), 7.08(s, 1H), 6.19(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.42 - 3.14(m, 4H), 2.56(s, 3H); ESI MS m/z 385 [C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>ClN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.2%(AUC),  $t_R$  = 8.55 min.

### 實施例 1268

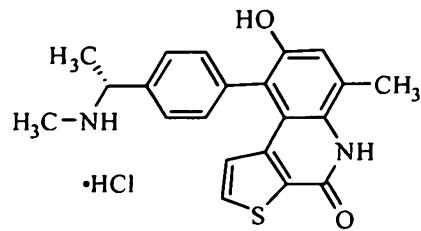
9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 2-氯-4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基氨基甲酸酯(80 mg, 0.154 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 0.92 mL, 0.92 mmol)反應以獲得所望產物(37 mg, 59%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.68(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.56(d,  $J$  = 7.8 Hz, 1H), 7.42(d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 7.30(s, 1H), 7.27(dd,  $J$  = 7.8, 1.7 Hz, 1H), 6.17(d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.39 - 3.25(m, 4H); ESI MS m/z 405 [C<sub>19</sub>H<sub>14</sub>Cl<sub>2</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.1%(AUC),  $t_R$  = 9.17 min.

### 實施例 1262

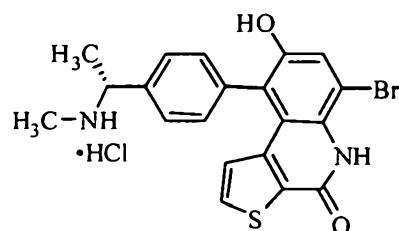
(R)-8-羥基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使 (R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基(甲基)胺基甲酸酯(150 mg, 0.313 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 1.9 mL, 1.9 mmol)反應以獲得所望產物(85 mg, 74%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.63(dd,  $J = 7.0, 5.5, 2.2$  Hz, 2H), 7.57(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.43(dd,  $J = 7.4, 6.1, 2.1$  Hz, 2H), 7.08(s, 1H), 6.05(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.47(q,  $J = 6.9$  Hz, 1H), 2.71(s, 3H), 2.57(s, 3H), 1.79(d,  $J = 6.9$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  365 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC),  $t_R = 8.40$  min.

### 實施例 1135

(R)-6-溴-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

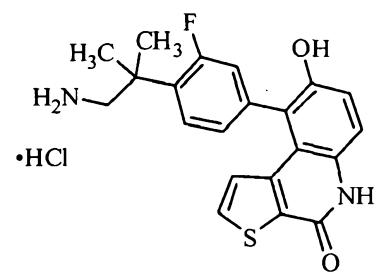


依照一般程序 F，使 (R)-第三丁基 1-(4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基(甲基)胺基甲酸酯(100 mg, 0.18 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 1.1 mL, 1.1 mmol)反應以獲得所望

產物 (38 mg, 48%) 白色固體:  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, DMSO)  $\delta$  10.20(s, 1H), 9.88(s, 1H), 9.76 - 9.59(m, 1H), 9.37 - 9.21(m, 1H), 7.78(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.74 - 7.64(m, 2H), 7.54(s, 1H), 7.40 - 7.33(m, 2H), 5.77(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.44(dd,  $J = 12.5, 6.4$  Hz, 1H), 2.50(s, 3H), 1.68(d,  $J = 6.8$  Hz, 3H); ESI MS m/z 429 [C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC),  $t_R = 9.00$  min.

### 實施例 1271

9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

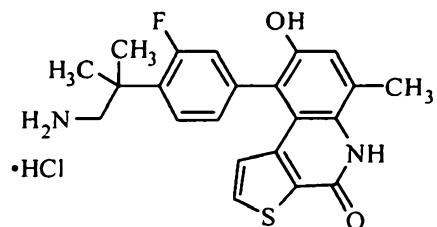


依照一般程序 F，使第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙基胺基甲酸酯(130 mg, 0.26 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 1.57 mL, 1.57 mmol)反應以獲得所望產物(35 mg, 35%)白色固體:  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, DMSO)  $\delta$  11.81(s, 1H), 9.34(s, 1H), 7.98(s, 3H), 7.72(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.49(t,  $J = 8.5$  Hz, 1H), 7.40(d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 7.17(t,  $J = 9.0$  Hz, 1H), 7.12(dd,  $J = 10.7, 9.7, 1.7$  Hz, 2H), 6.02(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.25(s, 2H), 1.51(d,  $J = 9.1$  Hz, 6H); ESI MS m/z 383 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC

>99%(AUC),  $t_R = 8.77 \text{ min.}$

### 實施例 1278

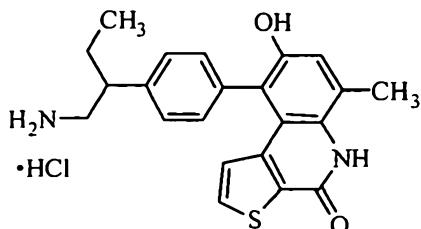
9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F, 使第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙基胺基甲酸酯(50 mg, 0.10 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 0.58 mL, 0.58 mmol)反應以獲得所望產物(22 mg, 58%)白色固體:  $^1\text{H NMR}$ (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.64(d,  $J = 5.4 \text{ Hz}$ , 1H), 7.57(t,  $J = 8.4 \text{ Hz}$ , 1H), 7.15(dd,  $J = 15.1, 10.7, 1.7 \text{ Hz}$ , 2H), 7.08(d,  $J = 0.7 \text{ Hz}$ , 1H), 6.26(d,  $J = 5.4 \text{ Hz}$ , 1H), 3.31(s, 2H), 2.57(s, 3H), 1.62(d,  $J = 5.6 \text{ Hz}$ , 6H); ESI MS  $m/z$  397 [C<sub>22</sub>H<sub>21</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC),  $t_R = 9.07 \text{ min.}$

### 實施例 1291

9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



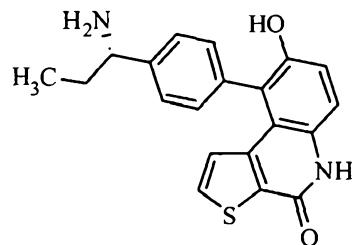
依照一般程序 F, 使第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲

基 -4-側 氧 基 -4, 5-二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -9- 基 ) 苯 基 ) 丁 基 胺 基 甲 酸 酯 (100 mg, 0.23 mmol) 與 三 溴 硼 烷 (1.0 M 於 二 氯 甲 烷, 1.4 mL, 1.4 mmol) 反 應 以 獲 得 所 望 產 物 (42 mg, 55%) 白 色 固 體:  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.57 - 7.50 (m, 2H), 7.40 (ddd,  $J$  = 18.8, 7.8, 1.8 Hz, 2H), 7.31 (dd,  $J$  = 7.7, 1.7 Hz, 1H), 7.09 (d,  $J$  = 0.8 Hz, 1H), 6.13 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.25 (ddd,  $J$  = 26.6, 13.1, 7.1 Hz, 2H), 2.93 (dq,  $J$  = 15.3, 5.2 Hz, 1H), 2.57 (d,  $J$  = 0.6 Hz, 3H), 1.97 - 1.74 (m, 2H), 0.99 (t,  $J$  = 7.4 Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  379 [ $\text{C}_{22}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99% (AUC),  $t_R$  = 9.21 min.

### 實 施 例 1120

(*S*)-9-(4-(1-胺 基 丙 基)苯 基)-8-羥 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -4(5H)-酮 鹽 酸 鹽

$\cdot\text{HCl}$

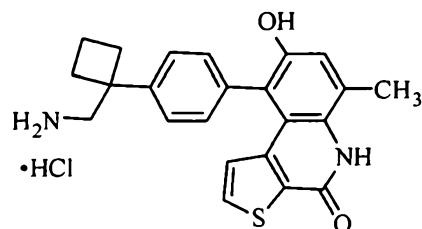


依 照 一 般 程 序 F, 使 (*S*)-第 三 丁 基 1-(4-(8-甲 氧 基 -4-側 氧 基 -4, 5-二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -9- 基 ) 苯 基 ) 丙 基 胺 基 甲 酸 酯 (100 mg, 0.22 mmol) 與 三 溴 硼 烷 (1.0 M 於 二 氯 甲 烷, 1.3 mL, 1.3 mmol) 反 應 以 獲 得 所 望 產 物 (28 mg, 38%) 白 色 固 體:  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.65 - 7.58 (m, 2H), 7.54 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.46 - 7.40 (m, 3H),

7.18(d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.03(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H),  
 4.32(dd,  $J = 9.2, 5.9$  Hz, 1H), 2.21 - 2.03(m, 2H),  
 1.04(t,  $J = 7.4$  Hz, 3H); ESI MS m/z 351 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC),  $t_R = 8.24$  min.

### 實施例 1290

9-(4-(1-(胺基甲基)環丁基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

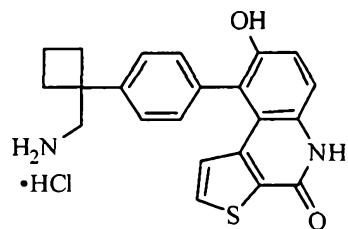


依照一般程序 F，使第三丁基(1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)環丁基)甲基胺基甲酸酯(130 mg, 0.32 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 1.9 mL, 1.9 mmol)反應以獲得所望產物(82 mg, 65%)白色固體：<sup>1</sup>H NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.63(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.46 - 7.41(m, 2H), 7.38 - 7.32(m, 2H), 7.09(d,  $J = 0.7$  Hz, 1H), 6.26(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.36 - 3.33(m, 2H), 2.65(dd,  $J = 21.2, 9.3$  Hz, 2H), 2.58(s, 3H), 2.45 - 2.37(m, 2H), 2.27(ddd,  $J = 17.7, 11.5, 8.6$  Hz, 1H), 2.12 - 2.01(m, 1H); ESI MS m/z 391 [C<sub>23</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%(AUC),  $t_R = 9.37$  min.

### 實施例 1300

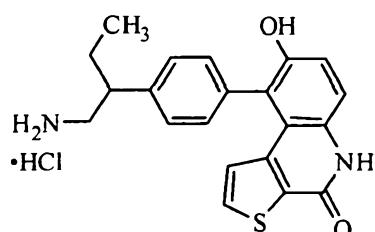
9-(4-(1-(胺基甲基)環丁基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]

## 喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基(1-(4-(8-甲氨基-4-側  
氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)環丁基)甲  
基胺基甲酸酯(100 mg, 0.20 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於  
二氯甲烷, 1.23 mL, 1.23 mmol)反應以獲得所望產物(52  
mg, 68%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.64(d,  $J$   
 $= 5.4$  Hz, 1H), 7.44(dd,  $J = 17.8, 10.5, 3.8$  Hz, 3H),  
7.39 – 7.35(m, 2H), 7.19(d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.25(d,  
 $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.44(s, 2H), 2.65(dd,  $J = 21.3, 9.4$   
Hz, 2H), 2.46 – 2.36(m, 2H), 2.33 – 2.20(m, 1H),  
2.14 – 2.00(m, 1H); ESI MS m/z 377 [C<sub>22</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>;  
HPLC >99%(AUC),  $t_R = 9.00$  min.

## 實施例 1309

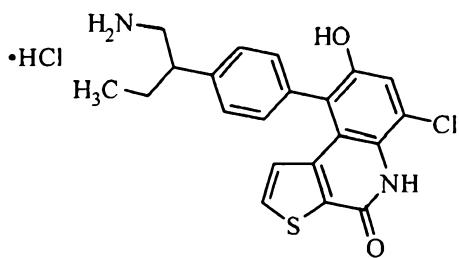
9-(4-(1-氨基丁-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉  
-4(5H)-酮 鹽酸鹽

依照一般程序 F，使第三丁基 2-(4-(8-甲氨基-4-側  
氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丁基胺基  
甲酸酯(100 mg, 0.21 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯

甲烷, 1.25 mL, 1.25 mmol)反應以獲得所望產物 (45 mg, 60%) 白色固體:  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.58 - 7.50 (m, 2H), 7.46 - 7.36 (m, 3H), 7.32 (dt,  $J$  = 12.4, 6.2 Hz, 1H), 7.19 (d,  $J$  = 8.9 Hz, 1H), 6.11 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.40 - 3.19 (m, 2H), 2.95 (dq,  $J$  = 15.3, 5.2 Hz, 1H), 1.98 - 1.85 (m, 1H), 1.86 - 1.71 (m, 1H), 1.06 - 0.91 (m, 3H); ESI MS  $m/z$  365 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC),  $t_R$  = 8.15 min.

### 實施例 1312

9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

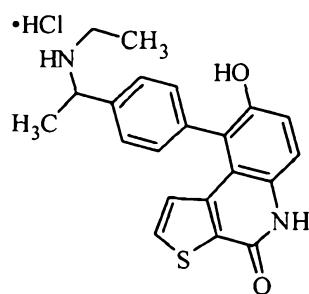


依照一般程序 F, 使第三丁基 2-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丁基胺基甲酸酯 (65 mg, 0.13 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 0.76 mL, 0.76 mmol) 反應以獲得所望產物 (28 mg, 56%) 白色固體:  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.60 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.54 (dd,  $J$  = 7.9, 1.8 Hz, 1H), 7.44 (dd,  $J$  = 7.7, 1.8 Hz, 1H), 7.39 (dd,  $J$  = 7.9, 1.8 Hz, 1H), 7.35 - 7.30 (m, 2H), 6.08 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.38 - 3.22 (m, 2H), 2.98 - 2.89 (m, 1H), 1.97 -

1.85 (m, 1H), 1.85 - 1.72 (m, 1H), 0.98 (t, J = 7.4 Hz, 3H); ESI MS m/z 399 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>ClN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 10.29 min.

### 實施例 385

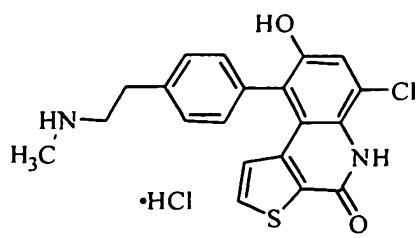
9-(4-(1-(乙基氨基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 乙基(1-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)氨基甲酸酯 (150 mg, 0.31 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 1.9 mL, 1.9 mmol) 反應以獲得所望產物 (37 mg, 33%) 白色玻璃: <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, MeOD); δ 7.65 (dd, J = 13.2, 4.9 Hz, 2H), 7.57 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.48 - 7.39 (m, 3H), 7.18 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.04 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.53 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.20 - 3.08 (m, 1H), 3.08 - 2.96 (m, 1H), 1.79 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 1.36 (t, J = 7.3 Hz, 3H). ESI MS m/z 365 [+ H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 12.05 min.

### 實施例 1165

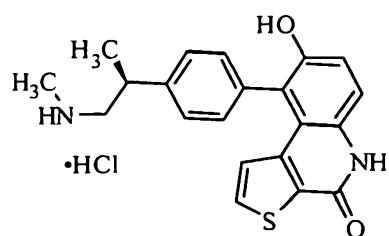
6-氯-8-羟基-9-(4-(2-(甲基氨基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基(甲基)胺基甲酸酯 (60 mg, 0.12 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 0.72 mL, 0.72 mmol) 反應以獲得所望產物 (22 mg, 50%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, DMSO- $\text{d}_6$ )  $\delta$  10.77 (s, 1H), 9.72 (s, 1H), 8.72 (s, 1H), 7.76 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.42 (d,  $J$  = 8.1 Hz, 2H), 7.31 (s, 1H), 7.24 (d,  $J$  = 8.1 Hz, 2H), 5.85 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.30 - 3.23 (m, 2H), 3.09 - 3.02 (m, 2H), 2.65 (s, 3H); ESI MS  $m/z$  385 [C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC),  $t_R$  = 9.03 min.

### 實施例 1197

(S)-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

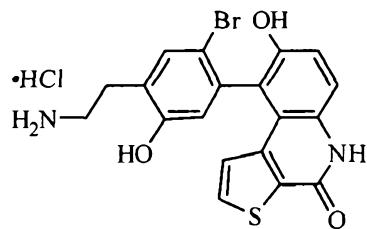


依照一般程序 F，使 (S)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯 (100 mg, 0.21 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 1.25 mL, 1.25 mmol) 反應以獲得所望產

物 (31 mg, 41%) 白色固體:  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.61 - 7.53 (m, 2H), 7.48 (dd,  $J = 7.8, 1.9$  Hz, 1H), 7.44 - 7.37 (m, 2H), 7.33 (dd,  $J = 7.7, 1.7$  Hz, 1H), 7.18 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.14 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.41 - 3.25 (m, 3H), 2.75 (s, 3H), 1.50 (d,  $J = 6.8$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  365 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99% (AUC),  $t_R = 8.36$  min.

#### 實施例 1224

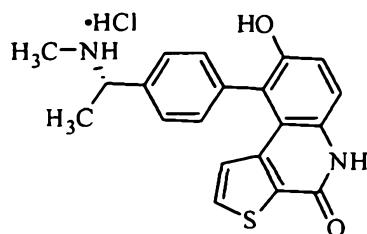
9-(4-(2-胺基乙基)-2-溴-5-羥基苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F, 使(第三丁基 5-溴-2-羥基-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯 (50 mg, 0.90 mmol)與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 0.54 mL, 0.54 mmol)反應以獲得所望產物 (18 mg, 48%) 白色固體:  $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.68 (d,  $J = 5.5$  Hz, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.44 (d,  $J = 9.0$  Hz, 1H), 7.18 (d,  $J = 9.0$  Hz, 1H), 6.82 (s, 1H), 6.33 (d,  $J = 5.5$  Hz, 1H), 3.25 (m, 2H), 2.95 (m, 2H); ESI MS  $m/z$  432 [ $\text{C}_{19}\text{H}_{15}\text{BrN}_2\text{O}_3\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 96.9% (AUC),  $t_R = 8.10$  min.

#### 實施例 1082

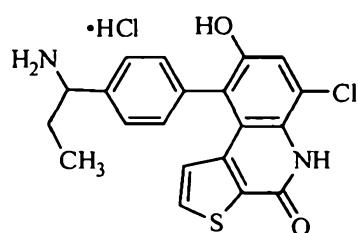
(S)-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽



依照一般程序 F，使(S)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基(甲基)胺基甲酸酯 (100 mg, 0.22 mmol)與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 1.30 mL, 13.0 mmol)反應以獲得所望產物 (50 mg, 66%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.68 – 7.61 (m, 2H), 7.57 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.49 – 7.39 (m, 3H), 7.18 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.04 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.48 (q,  $J = 6.8$  Hz, 1H), 2.72 (s, 3H), 1.80 (d,  $J = 6.9$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  351 [ $\text{C}_{20}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 96.9% (AUC),  $t_R = 7.68$  min.

### 實施例 1088

9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

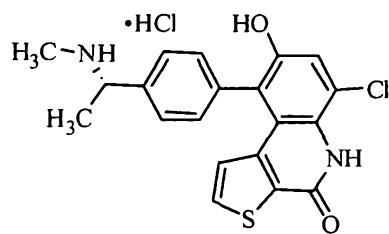


依照一般程序 F，使第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (40 mg, 0.08 mmol)與三溴硼烷 (1.0 M 於

二氯甲烷，0.48 mL, 0.48 mmol)反應以獲得所望產物(12 mg, 40%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.65 - 7.56 (m, 3H), 7.46 - 7.39 (m, 2H), 7.30 (s, 1H), 6.02 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 4.32 (dd,  $J$  = 9.1, 6.0 Hz, 1H), 2.21 - 2.02 (m, 2H), 1.03 (t,  $J$  = 7.4 Hz, 3H); ESI MS m/z 385 [C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 95.9% (AUC),  $t_R$  = 9.15 min.

### 實施例 1087

(S)-6-氯-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

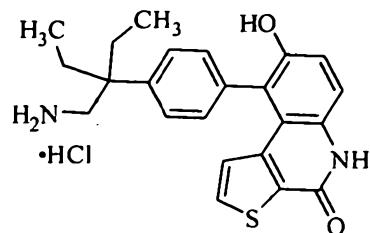


依照一般程序 F，使(S)-第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基(甲基)胺基甲酸酯(40 mg, 0.08 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 0.48 mL, 0.48 mmol)反應以獲得所望產物(18 mg, 60%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.72 - 7.60 (m, 3H), 7.49 - 7.39 (m, 2H), 7.30 (s, 1H), 6.03 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 4.49 (q,  $J$  = 6.9 Hz, 1H), 2.73 (d,  $J$  = 4.3 Hz, 3H), 1.80 (d,  $J$  = 6.9 Hz, 3H); ESI MS m/z 385 [C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC),  $t_R$  = 13.60 min.

### 實施例 1209

## 9-(4-(3-(胺基甲基)戊-3-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]

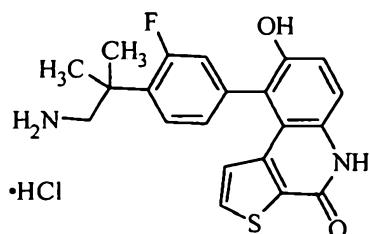
## 喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 2-乙基-2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丁基胺基甲酸酯 (200 mg, 0.40 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 2.37 mL, 2.37 mmol) 反應以獲得所望產物 (120 mg, 78%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.62 (d,  $J = 8.4$  Hz, 2H), 7.54 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.41 (dd,  $J = 15.2, 8.6$  Hz, 3H), 7.19 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.08 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.34 (s, 2H), 2.05 - 1.88 (m, 4H), 0.93 (t,  $J = 7.4$  Hz, 6H); ESI MS  $m/z$  393 [ $\text{C}_{23}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99% (AUC),  $t_R = 9.38$  min.

## 實施例 1271

## 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

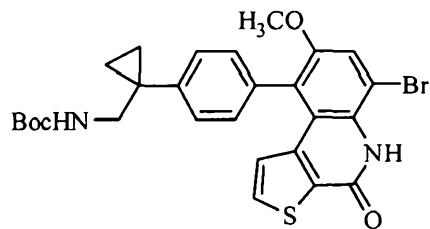


依照一般程序 F，使第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙基胺基甲酸酯 (80 mg, 0.16 mmol) 與三溴硼烷

(1.0 M 於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol)反應以獲得所望產物(35 mg, 56%)黃色玻璃： $^1\text{H}$  NMR(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.67 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.59 (t,  $J = 8.4$  Hz, 1H), 7.44 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 7.20 (d,  $J = 8.9$  Hz, 3H), 6.25 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.54 (d,  $J = 13.0$  Hz, 2H), 3.28 (s, 1H), 1.63 (d,  $J = 4.6$  Hz, 6H); ESI MS m/z 383 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC),  $t_R = 8.89$  min.

### 實施例 623

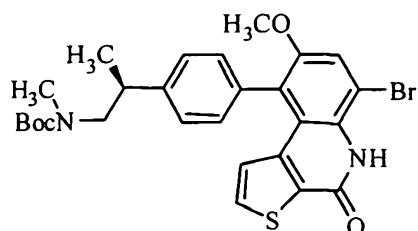
第三丁基 (1-(4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)環丙基)甲基胺基甲酸酯



依照一般程序 I，使第三丁基 (1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)環丙基)甲基胺基甲酸酯 (750 mg, 1.57 mmol)與 NBS (280 mg, 1.57 mmol) )反應以獲得所望產物(473 mg, 54%) 黃色固體：ESI MS m/z 555 [C<sub>27</sub>H<sub>27</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 624

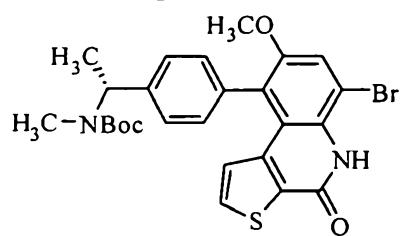
(S)-第三丁基 2-(4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯



依照一般程序 I，使 (S)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯 (1.0 g, 2.0 mmol)與 NBS (446 mg, 2.5 mmol)反應以獲得所望產物 (500 mg, 43%) 黃色固體：ESI MS m/z 557 [C<sub>27</sub>H<sub>29</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 625

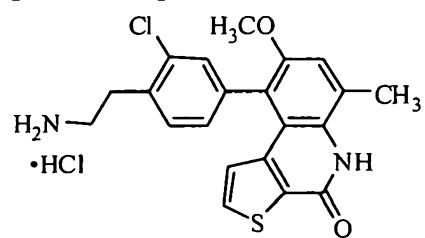
(R)-第三丁基 1-(4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基(甲基)胺基甲酸酯



依照一般程序 I，使 (R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基(甲基)胺基甲酸酯 (400 mg, 0.86 mmol)與 NBS (184 mg, 1.03 mmol)反應以獲得所望產物 (285 mg, 61%) 黃色固體：ESI MS m/z 543 [C<sub>26</sub>H<sub>30</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 1263

9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

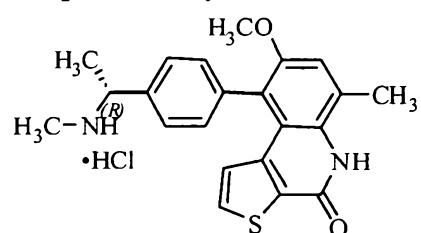


依照一般程序 C，使第三丁基 2-氯-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙

基胺基甲酸酯 (50 mg, 0.10 mmol) 與 TFA (3.0 mL) 反應以獲得所望產物淡黃色固體 (27 mg, 68%):  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.62 (t,  $J$  = 5.8 Hz, 1H), 7.53 (d,  $J$  = 7.8 Hz, 1H), 7.35 (d,  $J$  = 1.6 Hz, 1H), 7.29 (s, 1H), 7.21 (dd,  $J$  = 7.7, 1.7 Hz, 1H), 6.11 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.75 (d,  $J$  = 7.4 Hz, 3H), 3.38 - 3.16 (m, 4H), 2.64 (s, 3H); ESI MS m/z 399 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.8% (AUC),  $t_R$  = 9.50 min.

### 實施例 1265

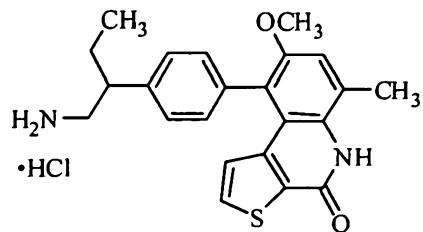
(R)-8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 C，使 (R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基(甲基)胺基甲酸酯 (50 mg, 0.10 mmol) 與 TFA (3.0 mL) 反應以獲得所望產物黃色固體 25 mg, 63%):  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.64 (d,  $J$  = 8.4 Hz, 2H), 7.57 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.38 (d,  $J$  = 8.6 Hz, 2H), 7.29 (s, 1H), 5.99 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 4.48 (q,  $J$  = 6.8 Hz, 1H), 3.73 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 2.64 (s, 3H), 1.80 (d,  $J$  = 6.9 Hz, 3H). ESI MS m/z 379 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.0% (AUC),  $t_R$  = 9.51 min.

## 實施例 1277

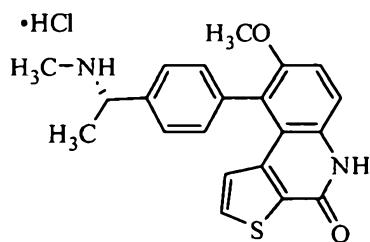
9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 C，使第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)丁基胺基甲酸酯 (40 mg, 0.08 mmol) 與 TFA (3.0 mL) 反應以獲得所望產物白色固體 14 mg, 44%):  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.54 - 7.47 (m, 2H), 7.42 (dd,  $J$  = 7.7, 1.8 Hz, 1H), 7.35 - 7.25 (m, 3H), 5.96 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.37 - 3.26 (m, 2H), 3.02 - 2.89 (m, 1H), 2.64 (s, 3H), 1.97 - 1.85 (m, 1H), 1.81 - 1.67 (m, 1H), 0.96 (t,  $J$  = 7.3 Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  393 [C<sub>23</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC),  $t_R$  = 9.74 min.

## 實施例 1064

(S)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

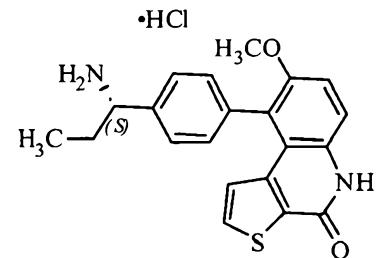


依照一般程序 C，使 (S)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)乙基

(甲基)氨基甲酸酯 (30 mg, 0.06 mmol)與 TFA (1.5 mL)反應以獲得所望產物 (15 mg, 65%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)； $\delta$  7.64 (d,  $J$  = 8.5 Hz, 2H), 7.61 - 7.52 (m, 2H), 7.45 - 7.36 (m, 3H), 5.98 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 4.48 (q,  $J$  = 6.8 Hz, 1H), 3.74 (s, 3H), 2.73 (s, 3H), 1.79 (t,  $J$  = 8.0 Hz, 3H). ESI MS  $m/z$  365 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99% (AUC),  $t_R$  = 13.69 min.

### 實施例 1121

(S)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽



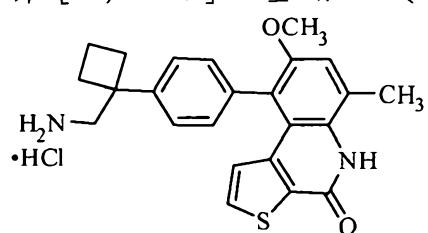
依照一般程序 C，使 (S)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基氨基甲酸酯 (40 mg, 0.09 mmol) 與 TFA (2.0 mL) 反應以獲得所望產物 (15 mg, 49%) 淡黃色玻璃： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.60 (tt,  $J$  = 7.1, 3.6 Hz, 2H), 7.57 - 7.51 (m, 2H), 7.42 - 7.36 (m, 3H), 6.00 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 4.32 (dd,  $J$  = 9.2, 6.0 Hz, 1H), 3.73 (s, 3H), 2.11 (qdd,  $J$  = 13.6, 8.3, 6.7 Hz, 3H), 1.08 - 0.98 (m, 3H); ESI MS  $m/z$  365 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99% (AUC),  $t_R$  = 8.74 min.

### 實施例 1391

(500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.63 - 7.51 (m, 3H), 7.32 - 7.23 (m, 3H), 6.02 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.74 (s, 3H), 3.28 (s, 2H), 2.64 (s, 3H), 1.21 - 1.08 (m, 4H); ESI MS m/z 391 [C<sub>23</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 95.7% (AUC),  $t_R$  = 9.15 min.

### 實施例 1297

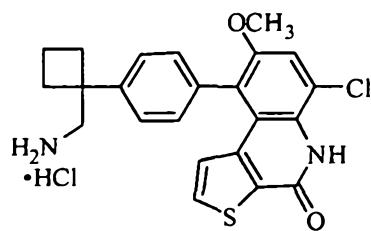
9-(4-(1-(胺基甲基)環丁基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 C，使第三丁基 (1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)環丁基)甲基胺基甲酸酯 (200 mg, 0.42 mmol) TFA (5.0 mL) 反應以獲得所望產物 (150 mg, 89%) 白色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.61 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.47 - 7.41 (m, 2H), 7.35 - 7.30 (m, 3H), 6.07 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.76 (s, 3H), 3.46 (s, 2H), 2.65 (s, 3H), 2.64 - 2.57 (m, 2H), 2.47 - 2.37 (m, 2H), 2.32 - 2.15 (m, 1H), 2.12 - 1.97 (m, 1H); ESI MS m/z 405 [C<sub>24</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC),  $t_R$  = 12.27 min.

### 實施例 1321

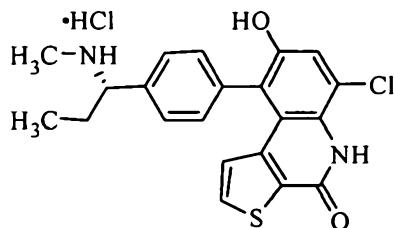
9-(4-(1-(胺基甲基)環丁基)苯基)-6-氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 C，使第三丁基 (1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)環丁基)甲基胺基甲酸酯 (25 mg, 0.05 mmol) 與 TFA (2.5 mL) 反應以獲得所望產物 (16 mg, 80%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.66 (s, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.47 (s, 2H), 7.34 (s, 2H), 6.04 (s, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.47 (s, 2H), 2.68 - 2.54 (m, 2H), 2.47 - 2.35 (m, 2H), 2.31 - 2.20 (m, 1H), 2.12 - 2.02 (m, 1H); ESI MS  $m/z$  426 [C<sub>23</sub>H<sub>21</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC),  $t_R$  = 9.87 min.

#### 實施例 1154

(S)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(甲基氨基)丙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

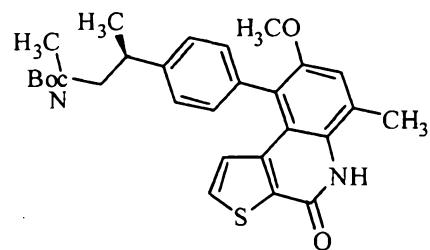


依照一般程序 F，使 (S)-第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯 (100 mg, 0.194 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷 1.2 mL, 1.16 mmol) 反應以獲得所望產物 (35 mg, 45%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, DMSO)  $\delta$  10.81 (d,  $J$  = 10.5 Hz, 1H), 9.83 (s, 1H), 9.70 -

9.45 (m, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.73 (d, J = 5.4 Hz, 1H),  
 7.70 - 7.60 (m, 2H), 7.38 (dd, J = 12.4, 4.7 Hz, 3H),  
 5.70 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.19 (dt, J = 12.1, 6.0 Hz,  
 1H), 2.51 (s, 3H), 2.20 (ddd, J = 14.4, Z

### 實施例 626

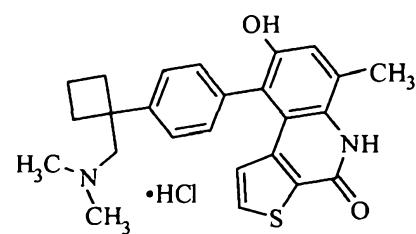
(S)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二  
 氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯



依照一般程序 J，使(S)-第三丁基 2-(4-(6-溴-8-甲  
 氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)  
 丙基(甲基)胺基甲酸酯 (150 mg, 0.269 mmol)與三甲基  
 硼氫烴三聚物 (102 mg, 0.8 mmol)反應以獲得所望產物  
 (95 mg, 75%)棕色固體：ESI MS m/z 493 [C<sub>28</sub>H<sub>32</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S +  
 H]<sup>+</sup>。

### 實施例 1372

9-(4-(1-((二甲基胺基)甲基)環丁基)苯基)-8-羥基-6-甲  
 基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

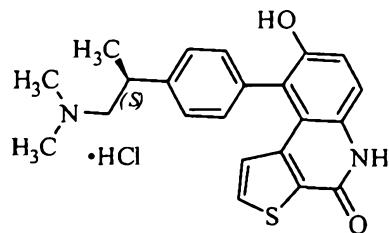


依照實施例 460 揭示的程序，使 9-(4-(胺基甲基)  
 環丁基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉

-4(5H)-酮 鹽酸鹽 (110 mg, 0.28 mmol) )與甲醛(37%於水, 22 mg, 0.70 mmol)反應以獲得所望產物白色固體 (28 mg, 25%):  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.65 (t,  $J = 7.4$  Hz, 3H), 7.43 (d,  $J = 8.1$  Hz, 2H), 7.12 (s, 1H), 6.24 (d,  $J = 5.3$  Hz, 1H), 3.80 (s, 2H), 2.86 (s, 6H), 2.77 - 2.67 (m, 2H), 2.60 (s, 3H), 2.52 (dt,  $J = 11.9, 8.8$  Hz, 2H), 2.30 - 2.17 (m, 1H), 2.17 - 2.05 (m, 1H); ESI MS m/z 419 [C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC),  $t_R = 9.51$  min.

### 實施例 1172

(S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

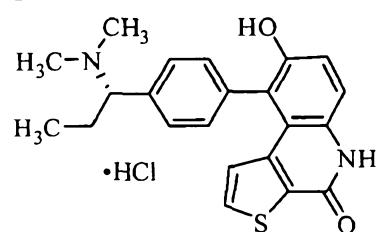


依照實施例 460 揭示的程序，使 (S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽 (20 mg, 0.06 mmol) ) 與甲醛(37%於水, 5.0 mg, 0.15 mmol)反應以獲得所望產物白色固體 (15 mg, 70%):  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.64 - 7.51 (m, 3H), 7.45 - 7.37 (m, 2H), 7.34 (dd,  $J = 7.7, 1.7$  Hz, 1H), 7.19 (t,  $J = 7.7$  Hz, 1H), 6.12 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.62 (td,  $J = 11.5, 2.6$  Hz, 1H), 3.50 - 3.40 (m, 2H), 2.97 (s, 3H), 2.94 (s, 3H), 1.48 (d,  $J = 6.6$  Hz, 3H); ESI MS

m/z 379 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 8.63 min.

### 實施例 1128

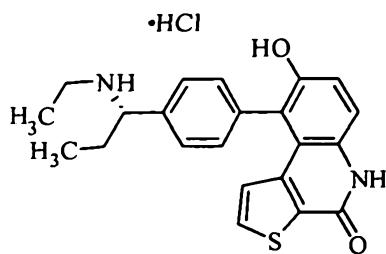
(S)-9-(4-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照實施例 460 揭示的程序，使(S)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽(25 mg, 0.07 mmol)與甲醛(37%於水, 5.5 mg, 0.18 mmol)反應以獲得所望產物白色固體(12 mg, 45%): <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, MeOD) δ 7.66 (ddd, J = 19.7, 7.7, 1.6 Hz, 2H), 7.55 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.52 - 7.45 (m, 2H), 7.43 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.20 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 5.95 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.38 (dd, J = 11.3, 4.4 Hz, 1H), 2.99 (d, J = 2.1 Hz, 3H), 2.85 (d, J = 3.2 Hz, 3H), 2.40 - 2.18 (m, 2H), 1.03 - 0.93 (m, 3H); ESI MS m/z 379 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.4% (AUC), t<sub>R</sub> = 8.14 min.

### 實施例 1127

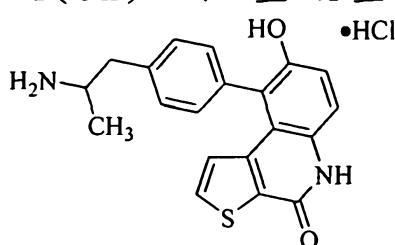
(S)-9-(4-(乙基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照實施例 460 揭示的程序，使 (S)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-羥基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽 (30 mg, 0.09 mmol) )與甲醛 (37%於水, 9.5 mg, 0.21 mmol) 反應以獲得所望產物白色固體 (15 mg, 46%):  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.68 - 7.57 (m, 2H), 7.54 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.45 (ddd,  $J$  = 17.0, 10.1, 5.3 Hz, 3H), 7.19 (d,  $J$  = 8.9 Hz, 1H), 5.97 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 4.26 (dd,  $J$  = 11.1, 4.3 Hz, 1H), 3.11 (tt,  $J$  = 14.6, 7.3 Hz, 1H), 3.05 - 2.95 (m, 1H), 2.25 (ddd,  $J$  = 13.0, 7.4, 4.4 Hz, 1H), 2.09 (ddd,  $J$  = 13.1, 11.2, 7.4 Hz, 1H), 1.35 (t,  $J$  = 7.3 Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  379 [ $\text{C}_{22}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 98.4% (AUC),  $t_{\text{R}} = 8.51 \text{ min.}$

### 實施例 1095

9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-8-羥基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

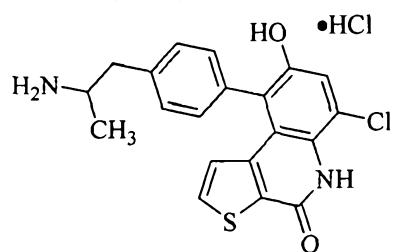


依照一般程序 F，使第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基)丙-2-基胺基甲酸酯 (650 mg, 1.40 mmol) 與  $\text{BBr}_3$  (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 10

mL, 10 mmol)反應以獲得所望產物(152 mg, 31%)淡黃色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.56 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.43 (dd, J = 13.3, 8.3 Hz, 2H), 7.34 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.18 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.11 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.71 - 3.60 (m, 1H), 3.05 (dd, J = 7.2, 2.2 Hz, 2H), 1.40 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS m/z 351 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.6% (AUC), t<sub>R</sub> = 8.08 min.

#### 實施例 1106

9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

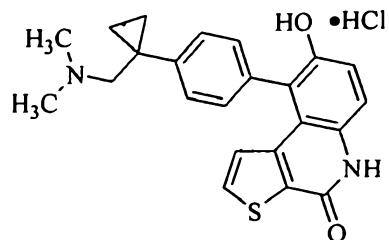


依照一般程序 F，使第三丁基 1-(4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙-2-基胺基甲酸酯 (55 mg, 0.11 mmol) 與 BBr<sub>3</sub> (1.0 M 於 CH<sub>2</sub>C<sub>1</sub><sub>2</sub>, 2 mL, 2 mmol) 反應以獲得所望產物 (28 mg, 66%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.61 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.47 (dd, J = 22.8, 7.8 Hz, 2H), 7.36 - 7.29 (m, 3H), 6.08 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.65 (dd, J = 13.7, 6.9 Hz, 1H), 3.05 (ddd, J = 34.9, 13.6, 7.3 Hz, 2H), 1.39 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS m/z 385 [C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>C<sub>1</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 8.77 min.

## 實施例 379

9-(4-(1-((二甲基胺基)甲基)環丙基)苯基)-8-羥基噻吩

并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

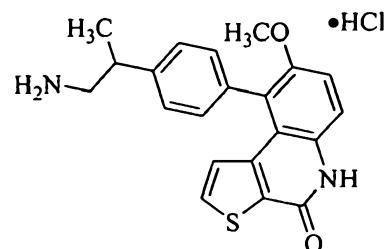


依照實施例 1387 揭示的程序，使 9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯基)-8-羥基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽 (10 mg, 0.03 mmol) 與三聚甲醛 (8 mg, 0.11 mmol) 反應，於過濾後將獲得的材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物 (7.0 mg, 87%) 淡黃色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.70 (d,  $J = 7.9$  Hz, 2H), 7.58 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.39 (dd,  $J = 25.8, 8.4$  Hz, 3H), 7.18 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.12 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 2.94 (s, 6H), 1.34 - 1.25 (m, 2H), 1.23 - 1.14 (m, 2H); ESI MS  $m/z$  391 [ $\text{C}_{23}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 96.7% (AUC),  $t_{\text{R}} = 8.72$  min.

## 實施例 373

9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹

啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

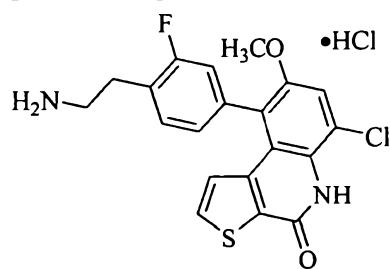


對於 2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并

[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)丙腈 (50 mg, 0.14 mmol)於甲苯 (13 mL) 的溶液，於 0 °C 加入  $\text{BH}_3 \cdot \text{THF}$  (1.0 M, 13 mL, 13 mmol)，將反應物回溫至室溫並加熱回流 4 小時。將此反應藉由倒在水或冰水上以淬滅，並將獲得的混合物濃縮並以製備性 HPLC (C18 二氧化矽，乙腈/水 (有 0.05% TFA) 梯度) 純化。將所望產物溶於 HCl 水溶液、濃縮並於真空下乾燥以獲得所望產物淡黃色固體 (5.4 mg, 10%)： $^1\text{H NMR}$  (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.60 - 7.49 (m, 3H), 7.47 (dd,  $J = 7.7, 1.7$  Hz, 1H), 7.39 (d,  $J = 9.1$  Hz, 1H), 7.34 - 7.25 (m, 2H), 6.00 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.30 - 3.18 (m, 3H), 1.49 (d,  $J = 6.5$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  365 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 99% (AUC),  $t_R = 8.76$  min.

### 實施例 1218

9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-氟-8-甲氧基噠吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

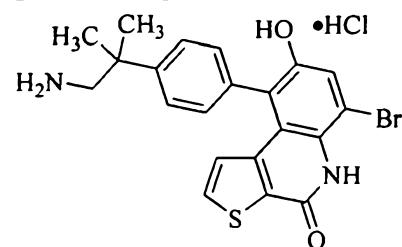


依照一般程序 F，將第三丁基 2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噠吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯乙基胺基甲酸酯 (70 mg, 0.14 mmol) 以  $\text{BBr}_3$  (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 5 mL, 5 mmol) 處理以獲得所望產物白色固體 (17 mg, 30%)： $^1\text{H NMR}$  (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.66 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.54

(s, 1H), 7.50 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 6.09 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.76 (s, 3H), 3.25 - 3.06 (m, 4H); ESI MS m/z 403 [C<sub>20</sub>H<sub>16</sub>ClFN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.9% (AUC), t<sub>R</sub> = 9.63 min.

### 實施例 1247

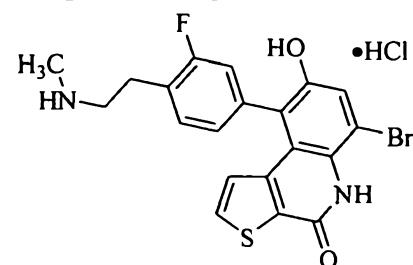
9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，將第三丁基 2-(4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙基胺基甲酸酯 (110 mg, 0.20 mmol)以 BBr<sub>3</sub> (1.0 M 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, 10 mL, 10 mmol)處理以獲得所望產物棕色固體 (39 mg, 45%): ESI MS m/z 443 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 96.3% (AUC), t<sub>R</sub> = 9.56 min.

### 實施例 1245

6-溴-9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

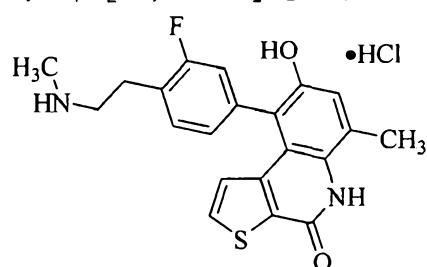


依照一般程序 F，將第三丁基 4-(6-溴-8-甲氧基-4-

側氨基-4,5-二氫噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-氟苯乙基(甲基)胺基甲酸酯(90 mg, 0.16 mmol)於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> 於 0 °C 添加 BBr<sub>3</sub> (1.0 M 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, 6 mL, 6 mmol)，將反應物回溫至室溫 4 小時。此反應藉由倒在水或冰水上淬滅，將獲得的混合物濃縮，並以製備性 HPLC (C18 二氧化矽，乙腈/水 (有 0.05% TFA) 梯度) 純化。將所望產物溶於 HCl 水溶液、濃縮並於高真空下乾燥以獲得所望產物白色固體 (15 mg, 21%)：ESI MS m/z 447 [C<sub>20</sub>H<sub>16</sub>BrFN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>；HPLC >99% (AUC)，t<sub>R</sub> = 9.26 min.

### 實施例 1258

9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

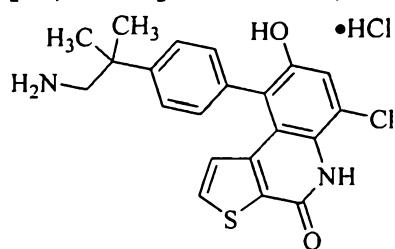


依照一般程序 F，對第三丁基 2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基(甲基)胺基甲酸酯 (60 mg, 0.12 mmol) 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> 於 0 °C 添加 BBr<sub>3</sub> (1.0 M 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, 6 mL, 6 mmol)，將反應物回溫至室溫 4 小時。此反應藉由倒在水或冰水上淬滅，將獲得的混合物濃縮，並以製備性 HPLC (C18 二氧化矽，乙腈/水 (有 0.05% TFA) 梯度) 純化。將所望產物溶於 HCl 水溶液、濃縮並於高真空下乾燥以獲得所望產物灰白色固體 (31 mg, 67%)：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.63 (d, J =

5.4 Hz, 1H), 7.51 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.15 - 7.06 (m, 3H), 6.20 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.42 - 3.35 (m, 2H), 3.30 - 3.10 (m, 2H), 2.80 (s, 3H), 2.57 (s, 3H); ESI MS m/z 383 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 8.65 min.

### 實施例 1260

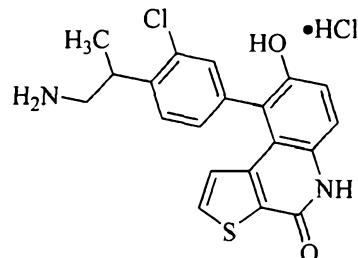
9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，對第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側  
氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)-2-甲基丙  
基胺基甲酸酯 (70 mg, 0.14 mmol) 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> 於 0 °C 加  
入 BBr<sub>3</sub> (1.0 M 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, 5 mL, 5 mmol)，將反應物回溫  
至室溫 4 小時。此反應藉由倒在水或冰水上淬滅，將獲得  
的混合物濃縮，並以製備性 HPLC (C18 二氧化矽，乙腈/  
水 (有 0.05% TFA) 梯度) 純化。將所望產物溶於 HCl 水溶  
液、濃縮並於高真空下乾燥以獲得所望產物棕色固體 (12  
mg, 38%)：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.66 (d, J = 8.4  
Hz, 2H), 7.63 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 8.4  
Hz, 2H), 7.32 (s, 1H), 6.13 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.29  
(s, 2H), 1.58 (s, 6H); ESI MS m/z 399 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S +  
H]<sup>+</sup>; HPLC 98.8% (AUC), t<sub>R</sub> = 9.26 min.

## 實施例 1280

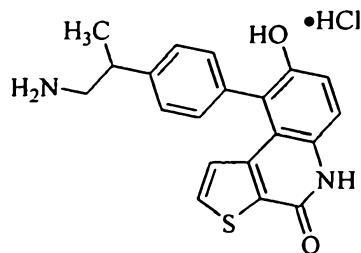
9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽



依照一般程序 F，對第三丁基 2-(2-氯-4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (120 mg, 0.24 mmol) 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  於 0 °C 加入  $\text{BBr}_3$  (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 15 mL, 15 mmol)，將反應物回溫至室溫 4 小時。此反應藉由倒在水或冰水上淬滅，將獲得的混合物濃縮，並以製備性 HPLC (C18 二氧化矽，乙腈/水 (有 0.05% TFA) 梯度) 純化。將所望產物溶於  $\text{HCl}$  水溶液、濃縮並於高真空下乾燥以獲得所望產物棕色固體 (40 mg, 43%)： $^1\text{H NMR}$  (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.65 (ddd,  $J = 9.9, 9.3, 6.1$  Hz, 2H), 7.46 - 7.36 (m, 2H), 7.33 - 7.27 (m, 1H), 7.18 (t,  $J = 9.0$  Hz, 1H), 6.10 (dd,  $J = 28.8, 5.4$  Hz, 1H), 3.86 - 3.66 (m, 1H), 3.29 - 3.12 (m, 2H), 1.44 - 1.28 (m, 3H); ESI MS  $m/z$  385 [ $\text{C}_{20}\text{H}_{17}\text{ClN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99% (AUC),  $t_{\text{R}} = 9.07$  min.

## 實施例 1111

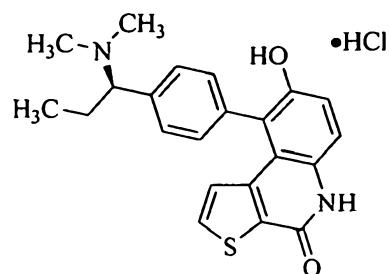
9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽



依照一般程序 F，對 9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (120 mg, 0.33 mmol)於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> 於 0 °C 加入 BBr<sub>3</sub> (1.0 M 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, 5 mL, 5 mmol)，將反應物回溫至室溫 4 小時。此反應藉由倒在水或冰水上淬滅，將獲得的混合物濃縮，並以製備性 HPLC (C18 二氧化矽，乙腈/水 (有 0.05% TFA) 梯度) 純化。將所產物溶於 HCl 水溶液、濃縮並於高真空下乾燥以獲得所產物淡黃色固體 (48 mg, 42%)：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.57 (dd, J = 12.7, 6.7 Hz, 2H), 7.47 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.18 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.15 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.28 – 3.17 (m, 3H), 1.50 (d, J = 6.1 Hz, 3H)；ESI MS m/z 351 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>；HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 8.25 min.

### 實施例 1151

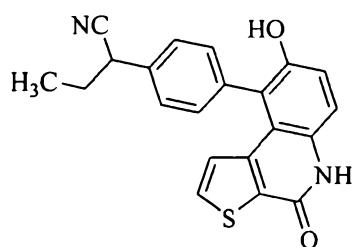
(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-羥基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照實施例 1387 揭示的程序，使 (R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽 (20 mg, 0.06 mmol) 與三聚甲醛反應 (10 mg, 0.17 mmol)，於過濾後將獲得的材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物 (5 mg, 24%) 淡黃色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.71 (dd,  $J = 10.5, 7.8$  Hz, 2H), 7.64 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.47 (t,  $J = 7.1$  Hz, 2H), 7.31 (d,  $J = 8.9$  Hz, 2H), 6.01 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.66 (q,  $J = 6.9$  Hz, 1H), 2.97 (s, 3H), 2.86 (s, 3H), 2.20 - 2.00 (m, 2H), 1.86 (d,  $J = 7.0$  Hz, 3H); ESI MS m/z 379 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 95.6% (AUC),  $t_R = 8.92$  min.

### 實施例 1162

2-(4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丁腈



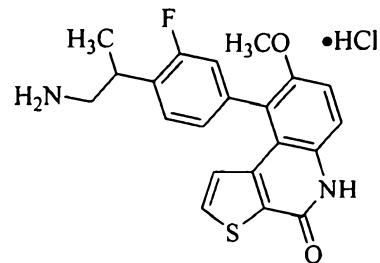
依照一般程序 F，對 2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丁腈 (80 mg, 0.21 mmol) 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> 於 0 °C 添加 BBr<sub>3</sub> (1.0 M 於 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, 3 mL, 3 mmol)，將反應物回溫至室溫 4 小時。此反應藉由倒在水或冰水上淬滅，將獲得的混合物濃縮，並以製備性 HPLC (C18 二氧化矽，乙腈/水 (有 0.05% TFA) 梯度) 純化。將所望產物溶於 HCl 水溶液、濃縮並於高真空下乾燥以獲得

所望產物淡黃色固體 (4.3 mg, 6%):  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.56 (dd, J = 10.8, 4.6 Hz, 3H), 7.43 - 7.31 (m, 3H), 7.17 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.00 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.15 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 2.07 (p, J = 7.3 Hz, 2H), 1.16 (t, J = 7.4 Hz, 3H); ESI MS m/z 361 [C<sub>21</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.5% (AUC), t<sub>R</sub> = 12.2 min.

### 實施例 1174

9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]

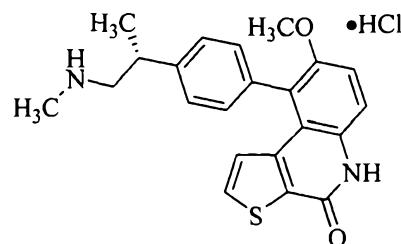
#### ● 喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 C，使第三丁基 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (120 mg, 0.25 mmol) 與 TFA (10 mL) 反應以獲得所望產物 (35 mg, 37%) 灰白色固體:  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.64 (dd, J = 5.4, 3.1 Hz, 1H), 7.54 (ddd, J = 25.0, 11.7, 5.2 Hz, 2H), 7.40 (dd, J = 9.1, 1.1 Hz, 1H), 7.18 - 7.06 (m, 2H), 6.10 (dd, J = 27.5, 5.4 Hz, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.64 - 3.43 (m, 1H), 3.42 - 3.22 (m, 2H), 1.51 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS m/z 383 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 96.5% (AUC), t<sub>R</sub> = 9.07 min.

### ● 實施例 1189

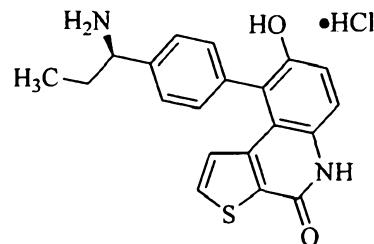
(R)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 C，使(R)-第三丁基 2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯 (120 mg, 0.25 mmol)與 TFA (8 mL) 反應以獲得所望產物 (56 mg, 59%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.60 - 7.51 (m, 3H), 7.48 (dd,  $J = 7.8, 1.9$  Hz, 1H), 7.39 (d,  $J = 9.1$  Hz, 1H), 7.31 (ddd,  $J = 15.8, 7.8, 1.8$  Hz, 2H), 5.99 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.46 - 3.36 (m, 1H), 3.37 - 3.24 (m, 2H), 2.76 (s, 3H), 1.49 (d,  $J = 6.7$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  379 [ $\text{C}_{22}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99% (AUC),  $t_R = 8.96$  min.

實施例 1131

(R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



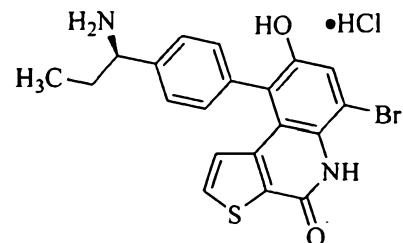
依照一般程序 F，對(R)-第三丁基 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c] 喹啉-9-基)苯基)丙

基胺基甲酸酯 (70 mg, 0.15 mmol) 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  於 0 °C 添  
加  $\text{BBr}_3$  (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 3 mL, 3 mmol)，將反應物回溫  
至室溫 4 小時。此反應藉由倒在水或冰水上淬滅，將獲得  
的混合物濃縮，並以製備性 HPLC (C18 二氯化矽，乙腈/  
水 (有 0.05% TFA) 梯度) 純化。將所望產物溶於  $\text{HCl}$  水溶  
液、濃縮並於高真空下乾燥以獲得所望產物淡黃色固體  
(35 mg, 67%)： $^1\text{H NMR}$  (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.61 (s, 2H),  
7.55 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.45 - 7.40 (m, 3H), 7.18  
(d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.03 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.32  
(dd,  $J = 9.2, 5.9$  Hz, 1H), 2.23 - 2.01 (m, 2H), 1.04  
(t,  $J = 7.4$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  351 [ $\text{C}_{20}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ;  
HPLC >99% (AUC),  $t_{\text{R}} = 8.06$  min.

### 實施例 1150

(R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-6-溴-8-羥基噻吩并[2,3-c]

噁啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



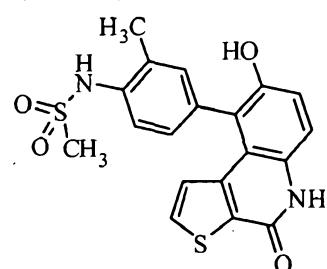
依照一般程序 F，對(R)-第三丁基 1-(4-(6-溴-8-甲  
氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁啉-9-基)苯基)  
丙基胺基甲酸酯 (50 mg, 0.09 mmol) 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  於 0 °C 加  
入  $\text{BBr}_3$  (1.0 M 於  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , 5 mL, 5 mmol)，將反應物回溫  
至室溫 4 小時。此反應藉由倒在水或冰水上淬滅，將獲得  
的混合物濃縮，並以製備性 HPLC (C18 二氯化矽，乙腈/

水 (有 0.05% TFA) 梯度) 純化。將所望產物溶於 HCl 水溶液、濃縮並於高真空下乾燥以獲得所望產物淡黃色固體 (36 mg, 92%)： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.65 - 7.57 (m, 3H), 7.50 - 7.46 (m, 1H), 7.45 - 7.39 (m, 2H), 6.02 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.32 (dd,  $J = 9.2, 6.0$  Hz, 1H), 2.20 - 2.00 (m, 2H), 1.03 (t,  $J = 7.4$  Hz, 3H)；ESI MS  $m/z$  429 [ $\text{C}_{20}\text{H}_{17}\text{BrN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ；HPLC >99% (AUC),  $t_R = 9.17$  min.

#### 實施例 254

N-[4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-甲基苯基]

甲烷磺醯胺

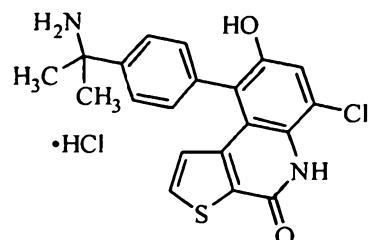


依照一般程序 F，使 N-[4-(8-甲氨基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2-甲基苯基]甲烷磺醯胺 (47 mg, 0.11 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 3.0 mL, 3.0 mmol) 反應以獲得所望產物 (17 mg, 39%) 灰白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.58 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.55 (d,  $J = 8.1$  Hz, 1H), 7.39 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.17 - 7.14 (m, 2H), 6.10 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.40 (s, 3H), 2.43 (s, 3H)；ESI MS  $m/z$

401 [C<sub>19</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>; HPLC 96.4% (AUC), t<sub>R</sub> = 10.23 min.

### 實施例 334

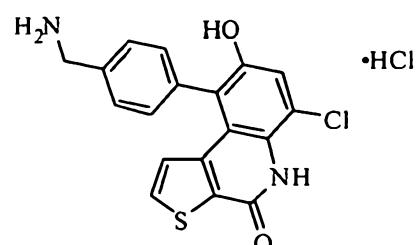
9-[4-(2-胺基丙-2-基)苯基]-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 2-[4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]丙-2-基胺基甲酸酯 (10 mg, 0.020 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol) 反應以獲得所望產物 (9.7 mg, 97%) 灰白色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.71 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.30 (s, 1H), 6.06 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 1.86 (s, 6H); ESI MS m/z 385 [C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 10.89 min

### 實施例 329

9-[4-(胺基甲基)苯基]-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

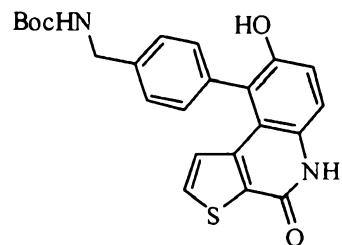


依照一般程序 F，使第三丁基 4-(6-氯-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸

酯 (15 mg, 0.032 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 1 mL, 1 mmol) 反應以獲得所望產物 (10 mg, 80%) 棕色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.64 (d,  $J = 8.2$  Hz, 2H), 7.59 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.43 – 7.38 (m, 2H), 7.30 (s, 1H), 6.08 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.27 (s, 2H); ESI MS  $m/z$  357 [ $\text{C}_{18}\text{H}_{13}\text{ClN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; ESI MS  $m/z$  357 [ $\text{C}_{18}\text{H}_{13}\text{ClN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 98.4% (AUC),  $t_{\text{R}} = 8.62$  min.

#### 實施例 457

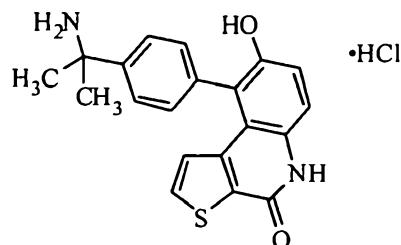
第三丁基 4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基胺基甲酸酯



依照實施例 463 的程序，使 9-[4-(胺基甲基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (320 mg, 1.0 mmol) 與二第三丁基碳酸氫酯 (260 mg, 1.2 mmol) 反應以獲得所望產物 (150 mg, 36%): ESI MS  $m/z$  323 [ $\text{C}_{23}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_4\text{S} + \text{H}]^+$ 。

#### 實施例 319

9-[4-(2-胺基丙-2-基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

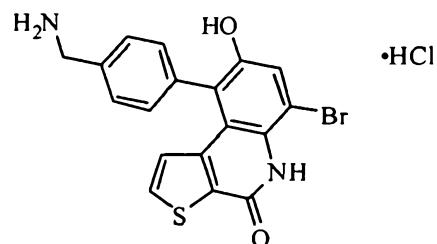


依照一般程序 F，使第三丁基 2-[4-(8-甲氨基-4-側

氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]丙-2-基胺基甲酸酯(29 mg, 0.063 mmol)與三溴硼烷(1.0 M, 1.0 mL, 0.10 mmol)反應以獲得所望產物(12 mg, 52%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.70 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.55 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.46 - 7.37 (m, J = 8.6, 7.7 Hz, 3H), 7.17 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.07 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 1.86 (s, 6H); ESI MS m/z 351 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.3% (AUC), t<sub>R</sub> = 10.48 min.

### 實施例 270

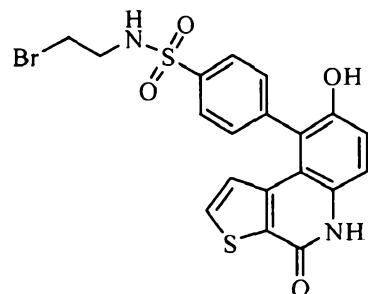
9-[4-(胺基甲基)苯基]-6-溴-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯(10 mg, 0.019 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 1.0 mL, 1.0 mmol)反應以獲得所望產物(3.9 mg, 47%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.64 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.47 (s, 1H), 7.42 - 7.40 (m, 2H), 6.08 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 4.27 (s, 2H); ESI MS m/z 403 [(C<sub>18</sub>H<sub>13</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + 2) + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.1% (AUC), t<sub>R</sub> = 7.90 min.

### 實施例 210

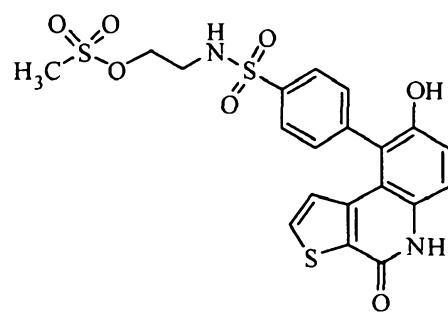
N-(2-溴乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺



依照一般程序 F，使 N-(2-羟基乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺 (1.7 g, 3.9 mmol) 與三溴硼烷 (3.7 mL, 24 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.7 g, 91%) 灰白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  11.84 (s, 1H), 9.43 (s, 1H), 8.16 (t,  $J$  = 5.9 Hz, 1H), 7.94 (d,  $J$  = 8.3 Hz, 2H), 7.75 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.52 (d,  $J$  = 8.3 Hz, 2H), 7.41 (d,  $J$  = 8.9 Hz, 1H), 7.19 (d,  $J$  = 8.9 Hz, 1H), 5.83 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 3.51 (t,  $J$  = 6.4 Hz, 2H), 3.28 (q,  $J$  = 6.2 Hz, 2H); ESI MS  $m/z$  478 [ $\text{C}_{19}\text{H}_{15}\text{BrN}_2\text{O}_4\text{S}_2 + \text{H}]^+$ ; HPLC 98.5% (AUC),  $t_R$  = 15.23 min.

#### 實施例 458

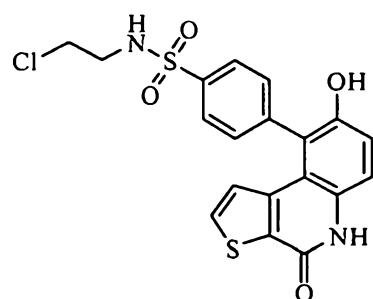
2-{4-[8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基]苯基磺酰胺基}乙基甲烷磺酸酯



對於 N-(2-羥基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺 (390 mg, 0.90 mmol) 及三乙基胺 (450 mg, 4.5 mmol) 於無水 THF (20 mL) 的溶液，添加甲烷磺醯氯 (0.21 mL, 2.7 mmol)，將反應混合物於室溫攪拌 20 小時。將獲得的沉澱過濾，以 THF (50 mL) 洗滌濾餅。將濾液濃縮，並將殘渣以閃式層析純化 (二氧化矽，乙酸乙酯 / 己烷梯度) 以獲得所望產物棕色固體 (250 mg, 55%)。<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 11.93 (s, 1H), 8.14 (t, J = 11.7 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.79 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.43 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 5.74 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.24 (t, J = 10.5 Hz, 2H), 3.71 (s, 3H), 3.20 (q, J = 11.7 Hz, 2H) ESI MS m/z 509 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>7</sub>S<sub>3</sub> + H]<sup>+</sup>

### 實施例 332

N-(2-氯乙基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺

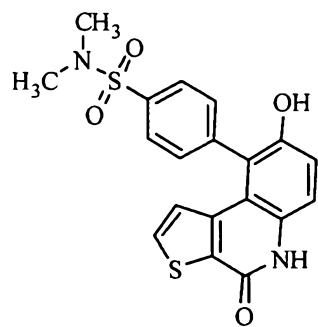


對於 2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基磺醯胺基)乙基甲烷磺酸酯 (250 mg, 0.49 mmol) 溶於無水二氯乙烷的溶液添加氯化鋁 (330

mg, 2.5 mmol), 將反應混合物加熱回流 20 小時。將反應物冷卻至室溫，濃縮並以甲醇(10 mL)淬滅。將獲得的混合物於室溫靜置 1 小時，將獲得的沉澱過濾並乾燥以獲得所望產物(88 mg, 41%)灰白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  11.83 (s, 1H), 9.42 (s, 1H), 8.13 (t,  $J$  = 7.2 Hz, 1H), 7.94 (d,  $J$  = 5.1 Hz, 2H), 7.74 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.51 (d,  $J$  = 5.1 Hz, 2H), 7.41 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.18 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 5.82 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 3.65 (t,  $J$  = 3.9 Hz, 2H), 3.22 (q,  $J$  = 3.6 Hz, 2H); ESI MS m/z 435 [C<sub>19</sub>H<sub>15</sub>C1N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.2% (AUC),  $t_R$  = 14.98 min,

#### 實施例 304

4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N,N-二甲基苯磺醯胺

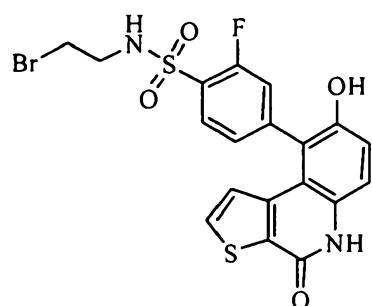


依照一般程序 F, 使來自實施例 74 的粗製產物, 4-(8-甲氨基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N,N-二甲基苯磺醯胺 (33 mg, 0.080 mmol) 與三溴硼烷 (0.2 mL) 反應以獲得所望產物 (9 mg, 2 步驟 7%) 棕色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  11.85 (s, 1H), 9.44 (s, 1H), 7.88 (dd,  $J$  = 6.8, 1.6 Hz, 2H), 7.79 (d,  $J$

= 5.4 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 6.6, 1.7 Hz, 2H), 7.42 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.20 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 5.69 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 2.71 (s, 6H); ESI MS m/z 401 [C<sub>19</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>; HPLC 94.5% (AUC), t<sub>R</sub> = 14.84 min.

### 實施例 297

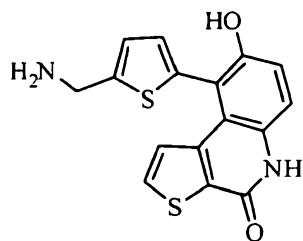
N-(2-溴乙基)-2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺



依照一般程序 F，使 2-氟-N-(2-羟基乙基)-4-(8-甲氨基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺 (52 mg, 0.12 mmol) 與三溴硼烷 (0.80 mL, 0.23 mmol) 反應以獲得所望產物 (47 mg, 81%) 白色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 11.86 (s, 1H), 9.52 (s, 1H), 8.45 (t, J = 5.7 Hz, 1H), 7.92 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 10.9 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.30 (dd, J = 8.0, 1.4 Hz, 1H), 7.19 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 6.00 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.53 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 3.42 (q, J = 6.0 Hz, 2H); ESI MS m/z 499 [C<sub>19</sub>H<sub>14</sub>BrFN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.3% (AUC), t<sub>R</sub> = 15.61 min.

### 實施例 266

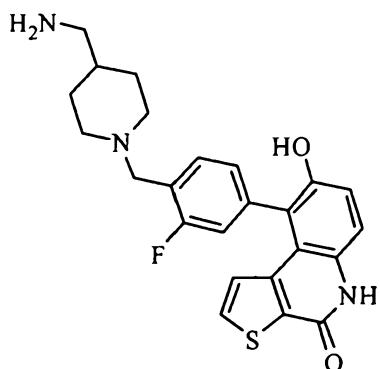
9-[5-(胺基甲基)噻吩-2-基]-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉  
-4(5H)-酮



依照一般程序 F，使第三丁基 [5-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)噻吩-2-基]甲基胺基甲酸酯 (30 mg, 0.067 mmol) 與三溴硼烷 (0.50 mL) 反應以獲得所望產物 (25 mg, 91%) 灰白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.67 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.43 (d,  $J = 9.0$  Hz, 1H), 7.16 – 7.14 (m, 2H), 6.86 (d,  $J = 3.5$  Hz, 1H), 6.35 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.12 (s, 2H); ESI MS  $m/z$  329 [ $\text{C}_{16}\text{H}_{12}\text{N}_2\text{O}_2\text{S}_2 + \text{H}]^+$ ; HPLC 95.6% (AUC),  $t_{\text{R}} = 9.59$  min.

### 實施例 235

9-{4-[4-(胺基甲基)哌啶-1-基]甲基}-3-氟苯基-8-羟基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

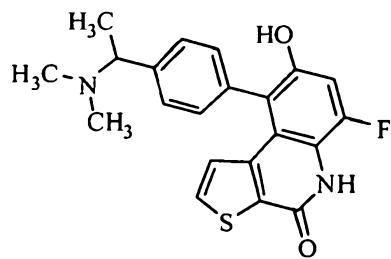


依照一般程序 F，使第三丁基 {1-[2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基]哌啶

-4-基}甲基胺基甲酸酯 (10 mg, 0.020 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 0.20 mL, 0.20 mmol) 反應以獲得所望產物 (6.0 mg, 65%) 淡黃色固體:  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>CN + D<sub>2</sub>O)  $\delta$  7.73 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.63 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.21 - 7.18 (m, 2H), 6.07 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.45 (q, 14.0 Hz, 2H), 3.15 - 3.11 (m, 2H), 2.94 - 2.90 (m, 2H), 2.51 (s, 2H), 2.09 - 2.06 (m, 3H), 2.00 - 1.96 (m, 4H); ESI MS m/z 438 [C<sub>24</sub>H<sub>24</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 94.6% (AUC), t<sub>R</sub> = 7.26 min.

### 實施例 225

9-{4-[2-(二甲基胺基)乙基]苯基}-6-氟-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

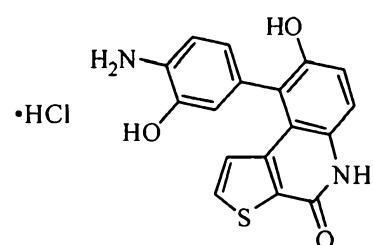


依照一般程序 F, 使 9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (6.0 mg, 0.015 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 0.10 mL, 0.075 mmol) 反應以獲得所望產物 (5.2 mg, 90%) 灰白色固體:  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.72 (t, J = 9.4 Hz, 2H), 7.63 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.46 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 7.04 (d, J = 12.0 Hz, 1H), 6.02 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.68 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 2.98 (s, 3H), 2.87 (s,

3H), 1.87 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS m/z 383 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 96.0 % (AUC), t<sub>R</sub> = 9.97 min.

### 實施例 217

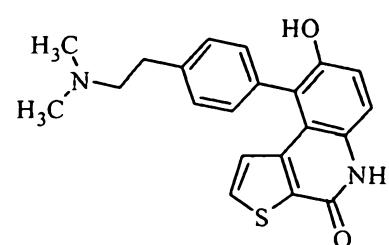
9-(4-胺基-3-羥基苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽



依照一般程序 F，使 9-(4-胺基-3-甲氧基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (20 mg, 0.060 mmol) 與溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 0.20 mL, 0.18 mmol) 反應以獲得所望產物 (16 mg, 84%) 灰白色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.62 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.18 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.97 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 6.21 (d, J = 5.4 Hz, 1H); ESI MS m/z 325 [C<sub>17</sub>H<sub>12</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 94.3% (AUC), t<sub>R</sub> = 8.17 min.

### 實施例 93

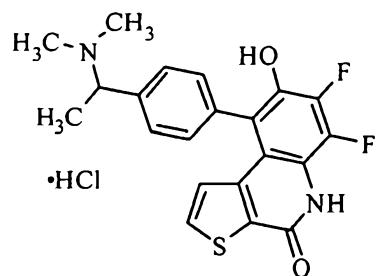
9-{4-[2-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 F，使 9-{4-[2-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (25 mg, 0.060 mmol)與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 0.20 mL, 0.18 mmol)反應以獲得所望產物 (20 mg, 89%) 黃色固體：  
 $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{CN} + \text{D}_2\text{O}$ )  $\delta$  7.55 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.43 – 7.41 (m, 3H), 7.22 – 7.18 (m, 3H), 5.99 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.00 (s, 4H), 2.56 (s, 6H); ESI MS  $m/z$  365 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 98.3% (AUC),  $t_R = 9.24$  min.

### 實施例 341

9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-6,7-二氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



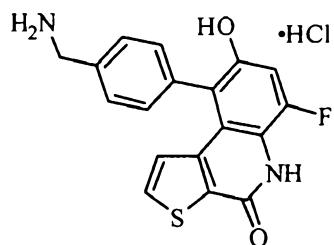
依照一般程序 F，使 9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-6,7-二氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (20 mg, 0.050 mmol)與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 0.50 mL, 0.50 mmol)反應以獲得所望產物 (15 mg, 72%) 灰白色固體：  
 $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{CN} + \text{D}_2\text{O}$ )  $\delta$  7.68 – 7.67 (m, 2H), 7.61 – 7.59 (m, 1H), 7.43 – 7.41 (m, 2H), 5.86 – 5.84 (m, 1H), 4.58 – 4.54 (m, 1H), 2.86 (s, 3H), 2.76 (s, 3H), 1.79 – 1.77 (m, 3H); ESI MS  $m/z$

401 [C<sub>21</sub>H<sub>18</sub>F<sub>2</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.8% (AUC), t<sub>R</sub> = 9.35 min.

### 實施例 256

9-[4-(胺基甲基)苯基]-6-氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉

-4(5H)-酮 鹽酸鹽

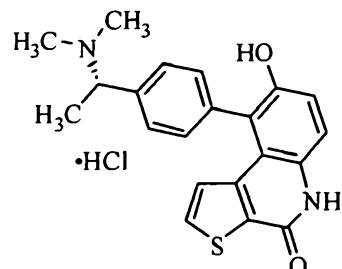


依照一般程序 F，使第三丁基 4-(6-氟-8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯 (30 mg, 0.075 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 0.75 mL, 0.75 mmol) 反應以獲得所望產物 (22 mg, 88%) 灰白色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.64 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.58 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.02 (d, J = 12.0 Hz, 1H), 6.07 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.28 (s, 2H); ESI MS m/z 341 [C<sub>18</sub>H<sub>13</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 8.34 min.

### 實施例 335

(S)-9-{4-[1-(二甲基氨基)乙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉 -

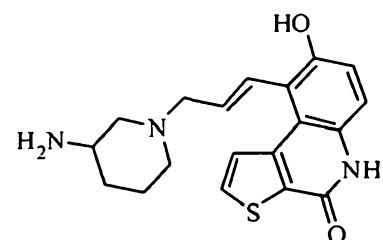
4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照實施例 460 揭示的程序，使(S)-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(100 mg, 0.30 mmol)與甲醛(37%於水, 27 mg, 0.89 mmol)反應，並於過濾後將獲得的材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物(43 mg, 40%)白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.69 (q, J = 7.8 Hz, 2H), 7.58 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.48 - 7.42 (m, 3H), 7.18 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.01 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.65 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 2.97 (s, 3H), 2.87 (s, 3H), 1.86 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS m/z 365 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 9.30 min.

### 實施例 459

(E)-9-[3-(3-胺基哌啶-1-基)丙-1-烯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

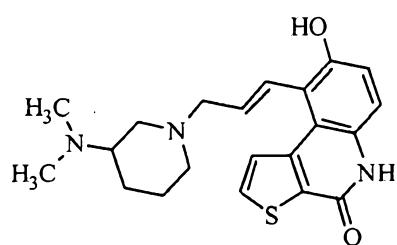


依照一般程序 F，使(E)-第三丁基 1-[3-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)烯丙基]哌啶-3-基胺基甲酸酯(320 mg, 0.88 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 4.0 mL, 4.0 mmol)反應以獲得所望產物(100 mg, 41%)黃色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  8.00 (dd, J = 19.3, 5.4 Hz, 2H), 7.32 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 16.0 Hz, 1H), 7.12 (d, J = 8.9

Hz, 1H), 6.39 – 6.25 (m, 1H), 4.25 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 3.94 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 3.83 (d, J = 11.9 Hz, 1H), 3.76 – 3.65 (m, 1H), 3.28 – 3.10 (m, 2H), 2.24 (dd, J = 35.1, 13.6 Hz, 2H), 2.06 – 1.98 (m, 1H), 1.81 – 1.68 (m, 1H).

### 實施例 460

(E)-9-{3-[3-(二甲基胺基)哌啶-1-基]丙-1-烯基}-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

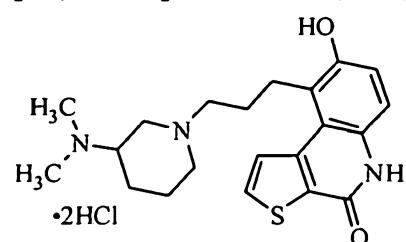


將 (E)-9-[3-(3-胺基哌啶-1-基)丙-1-烯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (60 mg, 0.15 mmol) 及 甲醛 (37% 於水, 13 mg, 0.44 mmol) 於甲醇 (1 mL) 的溶液於室溫攪拌 30 min, 再添加氰基硼氫化鈉 (28 mg, 0.44 mmol)。將該反應混合物於室溫攪拌過夜，濃縮並在水與乙酸乙酯間分層。將層體分離，並將水層以二氯甲烷萃取。將合併有機層以鹵水洗滌，以硫酸鈉乾燥、過濾並濃縮。將殘渣以製備性 HPLC (C18 二氧化矽, 水 / 乙腈 w/ 0.05% TFA 梯度) 純化以獲得所望產物 (30 mg, 53%) 黃色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.97 (dd, J = 19.4, 5.3 Hz, 2H), 7.30 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 15.9 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.33 – 6.22 (m, 1H), 4.32 – 4.18 (m, 3H), 3.90 – 3.77 (m, 2H), 3.47 (t, J =

11.6 Hz, 1H), 3.18 (t, J = 11.3 Hz, 1H), 3.01 (s, 6H), 2.40 - 2.23 (m, 2H), 2.10 - 1.84 (m, 2H)。

### 實施例 298

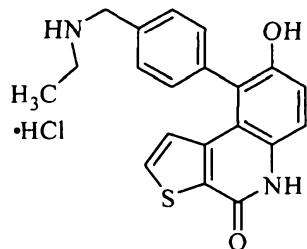
9-{3-[3-(二甲基胺基)哌啶-1-基]丙基}-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



對於 (E)-9-{3-[3-(二甲基胺基)哌啶-1-基]丙-1-烯基}-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (20 mg, 0.052 mmol) 於甲醇 (10 mL) 的溶液，於氮氣下添加 Pd 碳 (10 wt %, 12 mg)，將反應混合物置於 Parr 振盪器於氫氣圍 (40 psi) 放置 18 小時。將反應混合物以矽藻土過濾，將濾液過濾。將殘渣以製備性 HPLC (C18 Silica, 水 / 乙腈 有 0.05% TFA 梯度) 純化，並將於過濾材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物 (5.6 mg, 40%) 白色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 8.08 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.27 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.94 - 3.87 (m, 1H), 3.72 - 3.61 (m, 2H), 3.45 - 3.35 (m, 4H), 2.99 - 2.94 (m, 1H), 2.94 (s, 6H), 2.26 - 2.14 (m, 4H), 1.90 - 1.72 (m, 2H), 1.24 (s, 2H), 1.20 (s, 1H); ESI MS m/z 386 [C<sub>21</sub>H<sub>27</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 6.71 min.

### 實施例 267

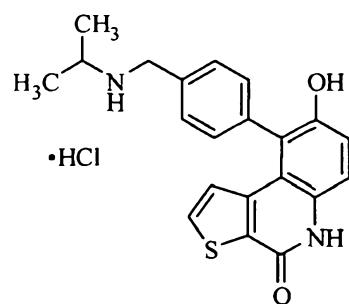
9-{4-[*(乙基胺基)甲基*]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3-*c*]喹啉  
-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使 9-{4-[*(乙基胺基)甲基*]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-*c*]喹啉-4(5H)-酮 (70 mg, 0.19 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 1.2 mL, 1.2 mmol) 反應以獲得所望產物 (42 mg, 63%) 黃色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.66 (d,  $J = 8.2$  Hz, 2H), 7.55 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.43 - 7.41 (m, 3H), 7.17 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.08 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.34 (s, 2H), 3.22 (q,  $J = 7.3$  Hz, 2H), 1.41 (t,  $J = 7.3$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  351 [ $\text{C}_{20}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99% (AUC),  $t_{\text{R}} = 8.01$  min.

### 實施例 229

8-羟基-9-{4-[*(異丙基胺基)甲基*]苯基}噻吩并[2,3-*c*]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

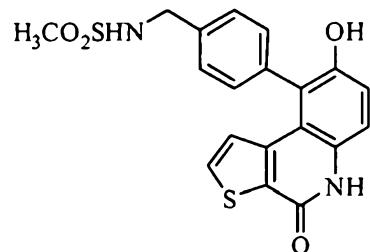


依照一般程序 F，使 9-{4-[*(異丙基胺基)甲基*]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-*c*]喹啉-4(5H)-酮與三溴硼烷

(1.0 M 於二氯甲烷, 1.6 mL, 1.6 mmol)反應以獲得所望產物(48 mg, 50%)淡棕色玻璃： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.70 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 7.58 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 7.44 – 7.41 (m, 3H), 7.18 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.12 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 4.37 (s, 2H), 3.59 – 3.55 (m, 1H), 1.48 (d, J = 6.5 Hz, 6H); ESI MS m/z 365 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >97.8% (AUC), t<sub>r</sub> = 7.93 min.

### 實施例 212

● N-[4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]甲烷磺醯胺

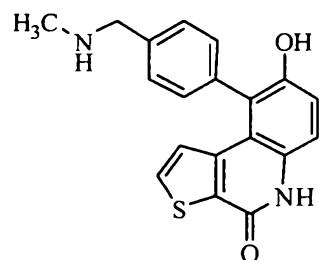


將 9-[4-(胺基甲基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (50 mg, 0.16 mmol)與甲烷磺醯氯(43 mg, 0.37 mmol)於二氯甲烷 (5 mL)的溶液，於室溫攪拌 10 min。添加 N,N-二異丙基乙基胺(48 mg, 0.37 mmol)，將反應混合物攪拌 1.5 小時，於減壓下濃縮，將殘渣以製備性 HPLC (C18 二氧化矽，水/乙腈 有 0.05% TFA 梯度)純化以獲得所望產物(28 mg, 45%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$  11.77 (s, 1H), 9.22 (s, 1H), 7.70 – 7.67 (m, 2H), 7.49 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.36 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 5.89 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.29 (d, J = 6.4 Hz, 2H),

2.94 (s, 3H); ESI MS m/z 401 [C<sub>19</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC > 99% (AUC), t<sub>R</sub> = 12.12 min.

### 實施例 187

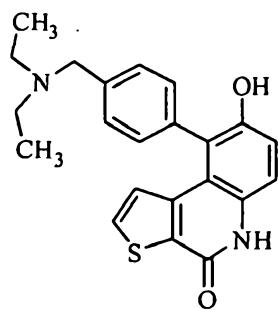
8-羥基-9-{4-[（甲基胺基）甲基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 F，使 8-甲氧基-9-{4-[（甲基胺基）甲基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (100 mg, 0.29 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 1.7 mL, 1.7 mmol) 反應以獲得所望產物 (28 mg, 30%) 白色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.65 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.55 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.44 – 7.41 (m, 3H), 7.17 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.05 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.33 (s, 2H), 2.83 (s, 3H); ESI MS m/z 337 [C<sub>19</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC > 99% (AUC), t<sub>R</sub> = 10.02 min.

### 實施例 184

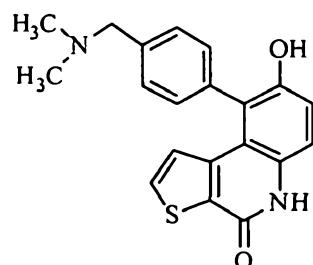
9-{4-[（二乙基胺基）甲基]苯基}-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 F，使 9-{4-[（二乙基胺基）甲基]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (30 mg, 0.076 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 0.46 mL, 0.46 mmol) 反應以獲得所望產物 (12 mg, 42%) 白色固體：  
 $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.69 (d,  $J = 8.1$  Hz, 2H), 7.56 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.48 - 7.42 (m, 3H), 7.18 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.03 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.50 (s, 2H), 3.36 - 3.31 (m, 4H), 1.43 (t,  $J = 7.3$  Hz, 6H); ESI MS m/z 379 [C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.2 % (AUC),  $t_R = 8.27$  min.

### 實施例 165

9-{4-[（二甲基胺基）甲基]苯基}-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

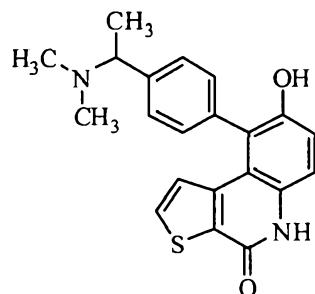


依照一般程序 F，使 9-{4-[（二甲基胺基）甲基]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (30 mg, 0.082 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 0.49 mL, 0.49 mmol) 反應以獲得所望產物 (11 mg, 40%) 白色固體：  
 $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.54 - 7.50 (m, 3H), 7.39 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 7.29 (d,  $J = 8.0$  Hz, 2H), 7.18 (d,  $J = 8.9$

Hz, 1H), 5.99 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 3.64 (s, 2H), 2.36 (s, 6H); ESI MS m/z 351 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.5% (AUC), t<sub>R</sub> = 7.71 min.

### 實施例 191

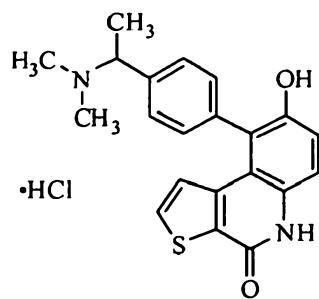
9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照實施例 460 揭示的程序，使 9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (40 mg, 0.12 mmol) 與甲醛 (37%於水, 14 mg, 0.50 mmol) 反應，過濾後將所獲材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物 (20 mg, 42%) 白色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.71 – 7.67 (m, 2H), 7.58 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.48 – 7.41 (m, 3H), 7.18 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.01 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.65 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 2.97 (s, 3H), 2.87 (s, 3H), 1.86 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS m/z 365 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 7.86 min.

### 實施例 192

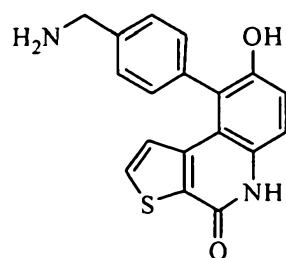
9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使 9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (3.2 g, 7.1 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 43 mL, 43 mmol) 反應，將所獲材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物 (1.3 g, 92%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.71 – 7.67 (m, 2H), 7.58 (d,  $J = 4.4$  Hz, 1H), 7.48 – 7.41 (m, 3H), 7.18 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.01 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.65 (q,  $J = 7.0$  Hz, 1H), 2.97 (s, 3H), 2.87 (s, 3H), 1.86 (d,  $J = 7.0$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  365 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99% (AUC),  $t_{\text{R}} = 7.86$  min.

### 實施例 72

9-[4-(胺基甲基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

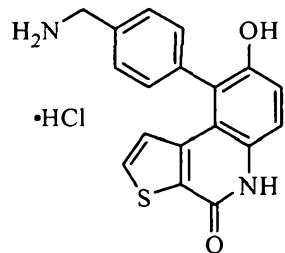


依照一般程序 F，使第三丁基 4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯 (70 mg, 0.16 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 0.96 mL,

0.96 mmol)反應以獲得所望產物(37 mg, 60%) 白色固體：  
 $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$  11.80 (s, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.25 (br s, 2H), 7.68 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.39 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.17 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 5.92 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.18 (m, 2H); ESI MS m/z 323 [C<sub>18</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.3% (AUC), t<sub>R</sub> = 10.74 min.

### 實施例 73

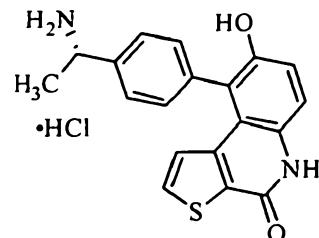
9-[4-(胺基甲基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉  
-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯(260 mg, 0.60 mmol)與三溴硼烷(1.0 M 於二氯甲烷, 3.6 mL, 3.6 mmol)反應，將所獲材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物(120 mg, 50%)灰白色固體：  
 $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$  11.80 (s, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.25 (br s, 2H), 7.68 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.39 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.17 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 5.92 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.18 (m, 2H); ESI MS m/z 323 [C<sub>18</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.3% (AUC), t<sub>R</sub> = 10.74 min.

## 實施例 233

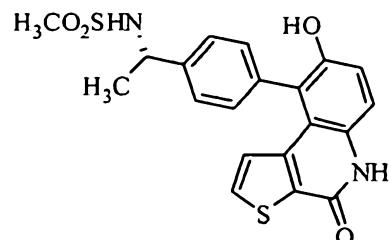
(S)-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使(S)-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (100 mg, 0.22 mmol) 與三溴硼烷 (3.0 mL) 反應以獲得所望產物 (16 mg, 22%) 黃色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.63 – 7.61 (m, 2H), 7.56 – 7.55 (m, 1H), 7.43 – 7.41 (m, 3H), 7.17 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.08 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.61 (q, J = 4.7 Hz, 1H), 1.76 (d, J = 6.9 Hz, 3H); ESI MS m/z 337 [C<sub>19</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.6% (AUC), t<sub>R</sub> = 7.62 min.

## 實施例 347

(S)-N-{1-[4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]乙基}甲烷磺醯胺

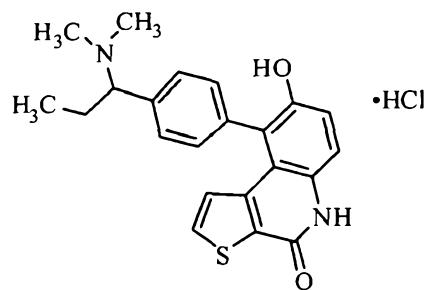


依照實施例 301 揭示的程序，使 (S)-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (100 mg, 0.30 mmol) 與甲烷磺醯氯 (100 mg, 0.89 mmol) 反應以獲得所望產物 (70 mg, 56%) 淡棕色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,

$\text{CD}_3\text{OD}) \quad \delta \quad 5.89 - 7.55$  (m, 2H), 7.52 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.38 (d  $J = 8.9$  Hz, 1H), 7.30 - 7.28 (m, 2H), 7.15 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.00 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.71 (q,  $J = 7.1$  Hz, 1H), 2.82 (s, 3H), 1.61 (d,  $J = 7.0$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  415 [ $\text{C}_{20}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}_2 + \text{H}]^+$ ; HPLC >99% (AUC),  $t_R = 12.43$  min.

### 實施例 339

#### 9-{4-[1-(二甲基胺基)丙基]苯基}-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽



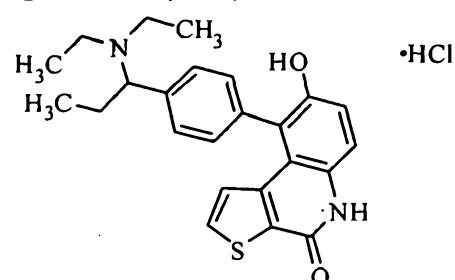
依照實施例 460 揭示的程序，使 9-[4-(1-胺基丙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (100 mg, 0.29 mmol) 與甲醛 (26 mg, 0.86 mmol) 反應，將所獲材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物 (62 mg, 58%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}) \quad \delta$  7.69 - 7.64 (m, 2H), 7.56 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.51 - 7.47 (m, 2H), 7.43 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 7.19 (d,  $J = 8.0$  Hz, 1H), 5.95 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.38 (dd,  $J = 11.3, 4.3$  Hz, 1H), 2.99 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 2.32 - 2.25 (m, 2H), 0.98 (t,  $J = 7.3$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  379 [ $\text{C}_{22}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 97.2% (AUC),  $t_R = 9.45$

min.

### 實施例 338

9-[4-[1-(二乙基胺基)丙基]苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]

喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

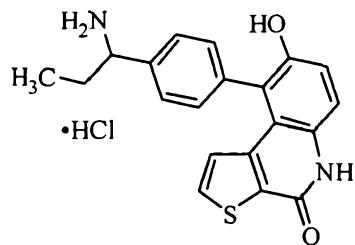


依照實施例 460 揭示的程序，使(9-[4-(1-胺基丙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (100 mg, 0.29 mmol)與甲醛(38 mg, 0.86 mmol)反應，將所獲材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物 (52 mg, 45%)淡棕色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.71 (dd,  $J = 7.7, 1.8$  Hz, 1H), 7.66 (dd,  $J = 7.9$  Hz, 1.9 Hz, 1H), 7.54 (d,  $J = 5.5$  Hz, 1H), 7.49 - 7.45 (m, 2H), 7.42 (d,  $J = 5.5$  Hz, 1H), 7.19 (d,  $J = 4.2$  Hz, 1H), 5.95 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.48 (dd,  $J = 11.7, 3.8$  Hz, 1H), 3.47 - 3.40 (m, 3H), 3.12 - 3.08 (m, 1H), 2.35 - 2.21 (m, 2H), 1.45 (t,  $J = 7.3$  Hz, 3H), 1.35 (t,  $J = 7.3$  Hz, 3H), 0.95 (t,  $J = 7.3$  Hz, 3H); ESI MS m/z 407 [C<sub>24</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 96.3% (AUC),  $t_R = 10.74$  min.

### 實施例 336

9-[4-(1-胺基丙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉

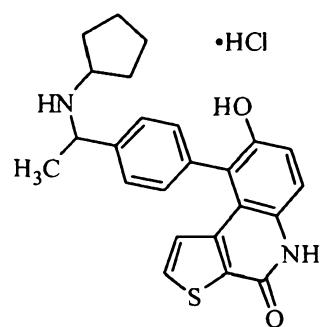
-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 1-[4-(8-甲氧基-4-側  
氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]丙基胺基  
甲酸酯 (70 mg, 0.15 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯  
甲烷, 0.90 mL, 0.90 mmol) 反應以獲得所望產物 (35 mg,  
52%) 淡黃色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ  
7.63 – 7.58 (m, 2H), 7.53 (d, J = 5.4 Hz, 1H),  
7.42 – 7.39 (m, 3H), 7.17 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.02 (d,  
J = 5.4 Hz, 1H), 4.32 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 2.17 – 2.08  
(m, 2H), 1.03 (t, J = 7.4 Hz, 3H); ESI MS m/z 351  
[C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 9.39 min.

#### 實施例 314

9-{4-[1-(環戊基胺基)乙基]苯基}-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

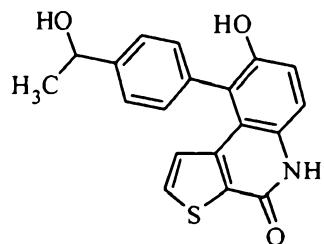


依照一般程序 F，使 9-{4-[1-(環戊基胺基)乙基]苯  
基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (200 mg,  
0.48 mmol) 與三溴硼烷 (15 mL) 反應以獲得所望產物 (25

mg, 13%) 棕色固體： $^1\text{H}$  NMR (300 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.71 – 7.64 (m, 2H), 7.56 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.48 – 7.41 (m, 3H), 7.18 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.06 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.57 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.59 – 3.49 (m, 1H), 2.26 – 2.08 (m, 2H), 1.87 – 1.62 (m, 9H); ESI MS m/z 405 [C<sub>24</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 8.84 min.

### 實施例 313

● 8-羥基 -9-[4-(1-羥基乙基)苯基]噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

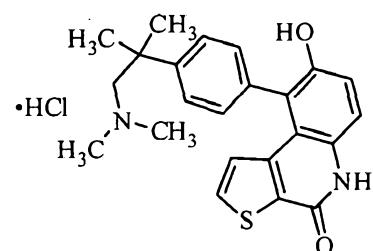


將 9-(4-乙醯基苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (200 mg, 0.59 mmol) 於乙醇 (4 mL) 的溶液冷卻至 0 °C，添加硼氫化鈉 (45 mg, 1.2 mmol)。將反應混合物於室溫攪拌 18 小時，然而仍有起始材料。將反應物冷卻至 0 °C，添加氫化鋰鋁 (1.0 M 於 THF, 1.2 mL, 1.2 mmol)，將反應混合物於室溫攪拌 2 小時。將反應物冷卻至 0 °C，以甲醇淬滅並濃縮。將殘渣以製備性 HPLC (C18 二氧化矽，水 / 乙腈 有 0.05% TFA 梯度) 純化以獲得所產物 (2.6 mg, 1%) 淡棕色固體： $^1\text{H}$  NMR (300 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.59 – 7.52 (m, 3H), 7.39 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.29 – 7.25 (m, 2H), 7.16 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.03 (d,

$J = 5.4 \text{ Hz}$ , 1H), 4.97 (q,  $J = 6.4 \text{ Hz}$ , 1H), 1.56 (d,  $J = 6.5 \text{ Hz}$ , 3H); ESI MS  $m/z$  338 [ $\text{C}_{19}\text{H}_{15}\text{NO}_3\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 98.6% (AUC),  $t_R = 9.78 \text{ min}$ .

### 實施例 308

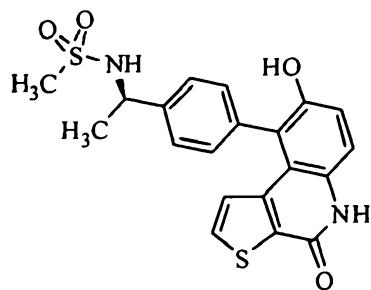
9-[4-[1-(二甲基胺基)-2-甲基丙-2-基]苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照實施例 460 揭示的程序，使 9-[4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (30 mg, 0.082 mmol) 與甲醛反應 (7.4 mL, 0.25 mmol)，將所獲材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物 (7 mg, 22%) 淡黃色固體： $^1\text{H NMR}$  (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.71 (d,  $J = 8.3 \text{ Hz}$ , 2H), 7.56 (d,  $J = 5.4 \text{ Hz}$ , 1H), 7.40 (q,  $J = 6.6 \text{ Hz}$ , 3H), 7.17 (d,  $J = 8.9 \text{ Hz}$ , 1H), 6.07 (d,  $J = 5.4 \text{ Hz}$ , 1H), 3.68 (s, 2H), 2.81 (s, 6H), 1.62 (s, 6H); ESI MS  $m/z$  393 [ $\text{C}_{23}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 97.5% (AUC),  $t_R = 8.46 \text{ min}$ .

### 實施例 301

(R)-N-{1-[4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]乙基}甲烷磺醯胺

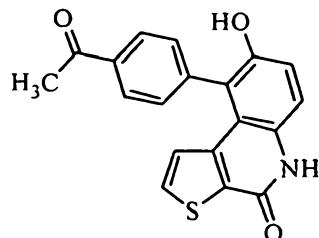


將 (R)-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

(28 mg, 0.83 mmol) 及 甲烷磺醯氯 (82  $\mu$ L, 1.0 mmol) 於 1:1 二氯甲烷 / THF (6 mL) 及 DMF (1.5 mL) 的溶液於室溫攪拌 10 min, 再加入 N,N-二異丙基乙胺 (170  $\mu$ L, 1.0 mmol)。將反應混合物攪拌 1.5 小時，濃縮並以製備性 HPLC (C18 二氧化矽，水 / 乙腈 有 0.05% TFA 梯度) 純化以獲得所望產物 (8.9 mg, 2%) 淡棕色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.59 – 7.55 (m, 2H), 7.53 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.31 – 7.30 (m, 2H), 7.16 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.02 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.71 (q, J = 4.6 Hz, 1H), 2.82 (s, 3H), 1.62 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS m/z 415 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>; HPLC 96.4% (AUC),  $t_{\text{R}} = 10.14 \text{ min}$ .

### 實施例 296

9-(4-乙醯基苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

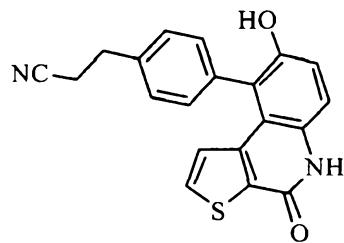


依照一般程序 F，使 9-(4-乙醯基苯基)-8-甲氧基噻吩

并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (450 mg, 1.3 mmol) 與三溴硼烷 (15 mL) 反應以獲得所望產物 (320 mg, 74%) 淡棕色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$  11.82 (s, 1H), 9.38 (s, 1H), 8.10 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.74 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.44 – 7.39 (m, 3H), 7.18 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 5.90 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 2.68 (s, 3H); ESI MS m/z 336 [C<sub>19</sub>H<sub>13</sub>NO<sub>3</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.3 % (AUC),  $t_{\text{R}} = 10.59 \text{ min.}$

### 實施例 290

3-[4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]丙腈

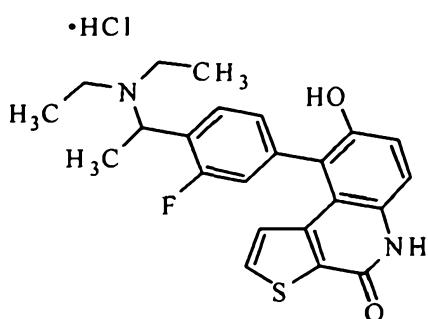


依照一般程序 F，使 3-[4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]丙腈 (45 mg, 0.13 mmol) 與三溴硼烷 (3 mL) 反應以獲得所望產物 (5.6 mg, 13%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.53 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.39 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.16 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 5.96 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.10 (t, J = 3.8 Hz, 2H), 2.89 (t, J = 7.1 Hz, 2H); ESI MS m/z 347 [C<sub>20</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC),  $t_{\text{R}} = 10.99 \text{ min.}$

### 實施例 356

9-{4-[1-(二乙基胺基)乙基]-3-氟苯基}-8-羥基噻吩并

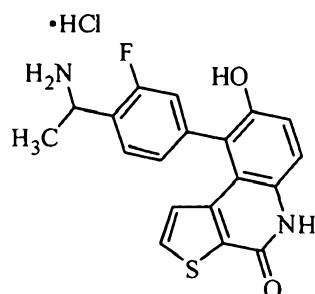
## [2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



將 9-(4-(1-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-羥基喹啉并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (40 mg, 0.11 mmol) 及乙醛 (25 mg, 0.45 mmol) 於甲醇 (2 mL) 的溶液，於室溫攪拌 30 min，再添加氰基硼氫化鈉 (28 mg, 0.452 mmol)，將反應混合物於室溫攪拌 18 小時。將反應混合物濃縮，於水與乙酸乙酯間分層，將層體分離。水層以二氯甲烷萃取，並將合併的有機層以鹵水洗滌，以無水硫酸鈉乾燥、過濾並濃縮。將殘渣以製備性 HPLC (C18 二氧化矽，水/乙腈 有 0.05% TFA 梯度) 純化，將所獲材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物 (30 mg, 65%) 黃色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.84 – 7.82 (m, 1H), 7.67 – 7.65 (m, 1H), 7.44 (dd, J = 9.1, 1.5 Hz, 1H), 7.34 – 7.28 (m, 2H), 7.19 (dd, J = 8.9, 2.5 Hz, 1H), 6.14 (t, J = 5.1 Hz, 1H), 5.16 – 5.06 (m, 1H), 3.46 – 3.35 (m, 3H), 3.30 – 3.15 (m, 1H), 2.79 (s, 1H), 1.88 (t, J = 6.2 Hz, 3H), 1.48 – 1.37 (m, 6H); ESI MS m/z 411 [C<sub>23</sub>H<sub>23</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 8.57 min.

## 實施例 359

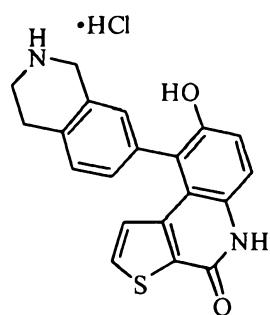
9-[4-(1-胺基乙基)-3-氟苯基]-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐



依照一般程序 F，使第三丁基 1-[2-氟-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]乙基氨基甲酸酯 (400 mg, 0.856 mmol) 与三溴硼烷 (4 mL) 反应以获得所望产物 (99 mg, 33%) 白色固体： $^1\text{H}$  NMR (300 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.70 – 7.60 (m, 2H), 7.43 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.27 – 7.15 (m, 3H), 6.18 (q, J = 3.0 Hz, 1H), 1.78 (t, J = 6.5 Hz, 3H); ESI MS m/z 355 [C<sub>19</sub>H<sub>15</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>r</sub> = 7.84 min.

### 實施例 353

8-羟基-9-(1,2,3,4-四氢异喹啉-7-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐

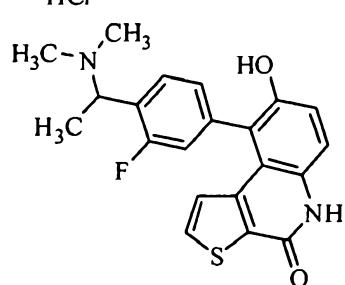


依照一般程序 F，使 8-甲氧基-9-(1,2,3,4-四氢异喹啉-7-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (40 mL, 0.11 mmol) 与三溴硼烷 (2 mL) 反应以获得所望产物 (26 mg,

68%)灰白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.56 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.27 - 7.25 (m, 1H), 7.19 (br s, 1H), 7.16 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.17 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.12 (s, 2H), 3.67 - 3.57 (m, 2H), 3.29 - 3.22 (m, 2H); ESI MS m/z 349 [C<sub>20</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC),  $t_R$  = 7.82 min.

### 實施例 349

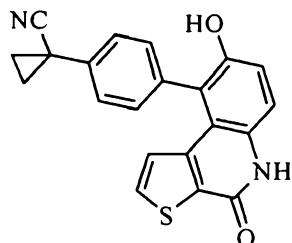
9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]-3-氟苯基}-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐  
•HCl



依照實施例 460 揭示的程序，使 9-[4-(1-胺基乙基)-3-氟苯基]-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (40 mg, 0.11 mmol) 與甲醛反應 (14 mg, 0.45 mmol) 以獲得所望產物 (23 mg, 53%) 黃色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.81 - 7.73 (m, 1H), 7.66 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 7.44 (dd, J = 8.9, 2.3 Hz, 1H), 7.34 - 7.29 (m, 2H), 7.20 - 7.18 (m, 1H), 6.14 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 5.03 - 4.92 (m, 1H), 3.03 - 2.86 (m, 6H), 2.78 (br s, 1H), 1.88 (dd, J = 7.0, 2.4 Hz, 3H); ESI MS m/z 383 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC),  $t_R$  = 8.04 min.

## 實施例 361

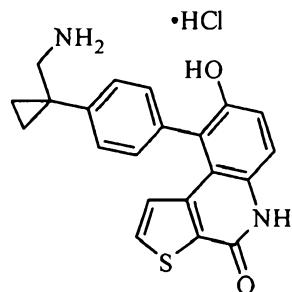
1-[4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]環丙腈



依照一般程序 F，使 1-[4-(8-甲氨基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]環丙腈 (340 mg, 0.91 mmol) 與三溴硼烷 (1.3 mL) 反應以獲得所望產物 (90 mg, 28%) 淡棕色固體：ESI MS  $m/z$  359 [C<sub>21</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 348

9-{4-[1-(胺基甲基)環丙基]苯基}-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

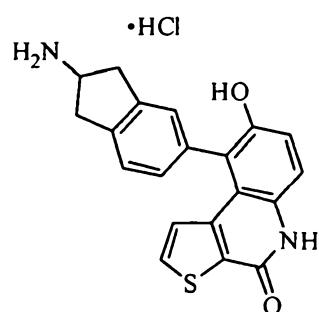


依照實施例 265 揭示的程序，使 1-[4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]環丙腈 (80 mg, 0.11 mmol) 與硼烷 (3 mL) 反應，將所獲材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物 (20 mg, 28%) 棕色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.62 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.58 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.41 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.18 (d, J

= 8.9 Hz, 1H), 6.17 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.25 (s, 2H), 1.21 - 1.12 (m, 4H); ESI MS m/z 363 [C<sub>21</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.3% (AUC), t<sub>R</sub> = 8.38 min.

### 實施例 345

#### 9-(2-胺基-2,3-二氫-1H-茚-5-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使第三丁基 5-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-2,3-二氫-1H-茚-2-基胺基甲酸酯 (210 mg, 0.59 mmol) 與三溴硼烷 (10 mL) 反應以獲得所望產物 (55 mg, 27%) 黃色固體：

主要異構物：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.56 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.19 - 7.15 (m, 2H), 6.14 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.24 - 4.20 (m, 1H), 3.62 - 3.49 (m, 2H), 3.22 - 3.07 (m, 2H); ESI MS m/z 349 [C<sub>20</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 60.4% (AUC), t<sub>R</sub> = 7.89 min;

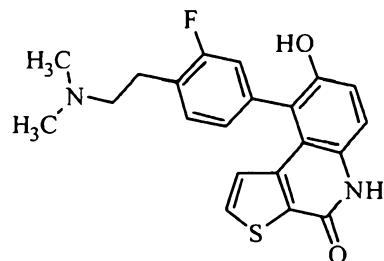
次要異構物：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.55 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.41 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.19 - 7.15 (m, 2H), 6.26 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.24 - 4.20 (m, 1H), 3.62 - 3.49

(m, 2H), 3.22 - 3.07 (m, 2H); ESI MS m/z 349 [C<sub>20</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 39.5% (AUC), t<sub>R</sub> = 7.65 min.

### 實施例 327

9-{4-[2-(二甲基胺基)乙基]-3-氟苯基}-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

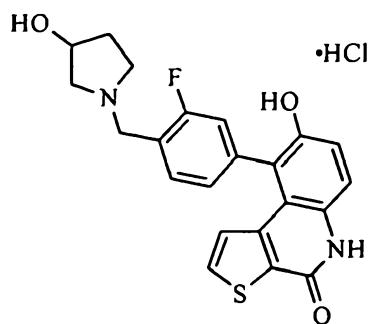
•HCl



依照一般程序 F，使 9-[4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基]-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (25 mg, 0.063 mmol) 與三溴硼烷 (3 mL) 反應以獲得所望產物 (3.5 mg, 13%) 棕色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.62 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.55 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.18 - 7.11 (m, 3H), 6.15 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.52 (t, J = 8.2 Hz, 2H), 3.26 - 3.19 (m, 1H), 3.04 (s, 6H); ESI MS m/z 383 [C<sub>21</sub>H<sub>19</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]; HPLC 96.2% (AUC), t<sub>R</sub> = 8.06 min.

### 實施例 278

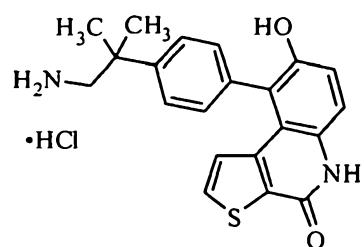
9-{3-氟-4-[(3-羟基吡咯啶-1-基)甲基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使 9-{3-氟-4-[(3-羟基丙基)氨基]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(90 mg, 0.21 mmol)與三溴硼烷(2 mL)反應以獲得所望產物(32 mg, 34%)淡黃色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.78 – 7.75 (m, 1H), 7.65 (d,  $J = 5.3$  Hz, 1H), 7.44 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 7.30 – 7.27 (m, 2H), 7.19 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.15 – 6.13 (m, 1H), 4.76 – 4.57 (m, 3H), 3.86 – 3.72 (m, 1H), 3.62 – 3.53 (m, 1H), 3.49 – 3.40 (m, 1H), 2.78 (br s, 1H), 2.54 – 2.46 (m, 1H), 2.22 – 2.20 (m, 1H), 2.15 – 2.05 (m, 1H); ESI MS  $m/z$  411 [ $\text{C}_{22}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_3\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC >99% (AUC),  $t_{\text{R}} = 7.58$  min.

### 實施例 277

9-[4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基]-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽

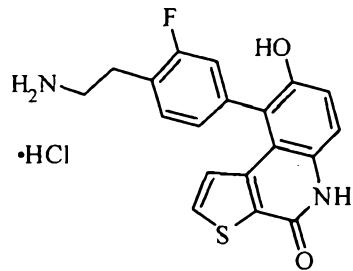


依照一般程序 F，使 9-[4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮(100 mg, 0.27 mmol)與三溴硼烷(3 mL)反應以獲得所望產物(25

mg, 22%)灰白色固體:  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.66 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.59 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.19 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.16 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.28 (s, 2H), 1.59 (s, 6H); ESI MS m/z 365 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 96.9% (AUC), t<sub>R</sub> = 9.47 min.

### 實施例 276

9-[4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

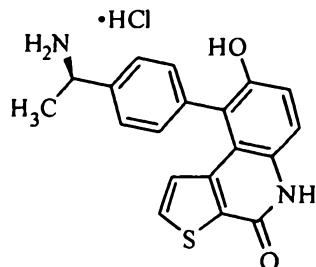


依照一般程序 F, 使 9-[4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (260 mg, 0.71 mmol) 與三溴硼烷 (6 mL) 反應以獲得所望產物 (12 mg, 12%) 淡黃色固體:  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.63 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.52 - 7.49 (m, 1H), 7.42 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.15 - 7.12 (m, 2H), 6.20 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.30 - 3.23 (m, 2H), 3.12 - 3.06 (m, 2H), 2.79 (br s, 3H); ESI MS m/z 355 [C<sub>19</sub>H<sub>15</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 94.9% (AUC), t<sub>R</sub> = 7.80 min.

### 實施例 275

(R)-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉

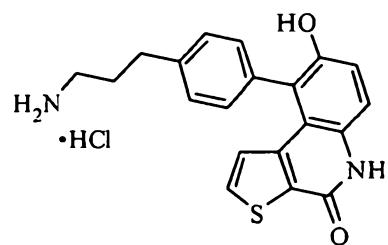
啉 -4(5H)- 酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使 (R)- 第三丁基 1-[4-(8-甲氧基 -4-側 氧 基 -4, 5-二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 嘉 -9- 基 ) 苯 基 ] 乙 基 胺 基 甲 酸 酯 (350 mg, 0.78 mmol) 與 三 溴 硼 烷 (15 mL) 反 應 以 獲 得 所 望 產 物 (120 mg, 42%) 灰 白 色 固 體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.65 – 7.62 (m, 2H), 7.55 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.42 – 7.41 (m, 3H), 7.17 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.08 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.61 (q, J = 4.5 Hz, 1H), 2.78 (br s, 3H), 1.76 (d, J = 6.9 Hz, 3H); ESI MS m/z 337[C<sub>19</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 7.49 min.

實 施 例 273

9-[4-(3-胺 基 丙 基 ) 苯 基 ]-8-羥 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 嘉 -4(5H)- 酮 鹽酸鹽

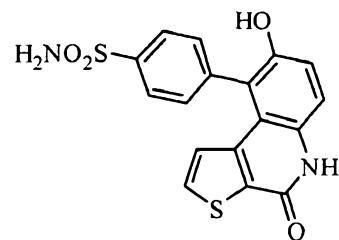


依照一般程序 F，使 9-[4-(3-胺 基 丙 基 ) 苟 基 ]-8-甲 氧 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 嘉 -4(5H)- 酮 (140 mg, 0.39 mmol) 與 三 溴 硼 烷 (6 mL) 反 應 以 獲 得 所 望 產 物 (18 mg, 12%) 淡 黃 色

固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.53 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.39 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.16 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.02 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 3.04 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 2.11 - 2.08 (m, 2H); ESI MS m/z 351 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 96.2%, t<sub>R</sub> = 8.91 min.

### 實施例 65

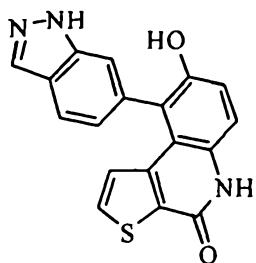
4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺



依照一般程序 F，使 N-第三丁基-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺 (4.3 g, 9.9 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 M 於二氯甲烷, 48 mL, 48 mmol) 反應以獲得所望產物 (3.4 g, 94%) 淡紅色固體： $^1\text{H}$  NMR (300 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$  11.83 (s, 1H), 9.12 (s, 1H), 7.96 - 7.95 (m, 2H), 7.76 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.48 - 7.47 (m, 4H), 7.41 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.18 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 5.91 (d, J = 5.4 Hz, 1H); ESI MS m/z 373 [C<sub>17</sub>H<sub>12</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>; HPLC 98.1% (AUC), t<sub>R</sub> = 10.29 min.

### 實施例 61

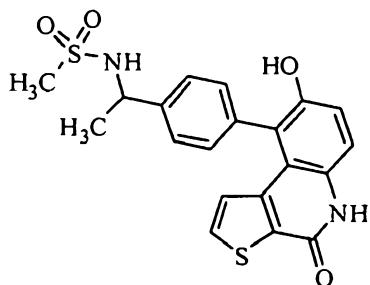
8-羥基-9-(1H-吲唑-6-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 F，使 9-(1H-咪唑-6-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (35 mg, 0.10 mmol) 與三溴硼烷 (1.5 mL, 0.15 mmol) 反應以獲得所望產物 (3.6 mg, 11%) 淡棕色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  8.17 (s, 1H), 7.75 – 7.73 (m, 2H), 7.48 (d,  $J$  = 5.5 Hz, 1H), 7.42 (d,  $J$  = 8.9 Hz, 1H), 7.34 (d,  $J$  = 9.2 Hz, 1H), 7.19 (d,  $J$  = 8.9 Hz, 1H), 5.91 (d,  $J$  = 5.5 Hz, 1H); ESI MS  $m/z$  334 [ $\text{C}_{18}\text{H}_{11}\text{N}_3\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 96.3% (AUC),  $t_{\text{R}} = 9.20 \text{ min.}$

### 實施例 193

$\text{N}-\{1-[4-(8-\text{羥基}-4-\text{側氨基}-4,5-\text{二氫噻吩并}[2,3-\text{c}]喹啉-9-\text{基})\text{苯基}]\text{乙基}\}\text{甲烷磺醯胺}$

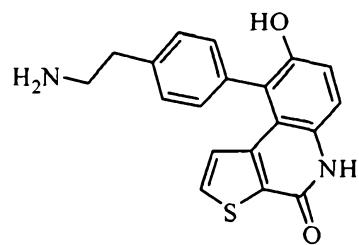


將 9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (30 mg, 0.089 mmol) 與甲烷磺醯氯 (9.0  $\mu\text{L}$ , 0.11 mmol) 於 2:1 二氯甲烷/THF (3 mL) 的溶液於室溫攪拌 10 min, 再添加  $\text{N},\text{N}$ -二異丙基乙基胺 (19  $\mu\text{L}$ , 0.11 mmol)。將反應混合物攪拌 1.5 小時，濃縮並以製備性 HPLC (C18 二氧化矽，水/乙腈 有 0.05% TFA 梯度) 純化以獲

得所望產物(7.2 mg, 20%)不定形棕色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.57 – 7.56 (m, 2H), 7.53 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.32 – 7.30 (m, 2H), 7.16 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.02 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.71 (q, J = 4.6 Hz, 1H), 2.82 (s, 3H), 1.62 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS m/z 415 [C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%, t<sub>R</sub> = 10.18 min.

### 實施例 175

9-[4-(2-胺基乙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

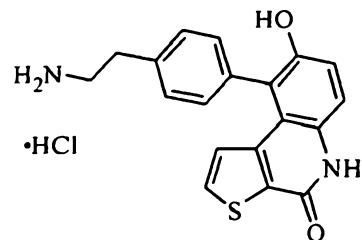


依照一般程序 F，使 9-[4-(2-胺基乙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (800 mg, 1.8 mmol) 與三溴硼烷 (10 mL) 反應以獲得所望產物 (520 mg, 88%) 灰白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$  11.78 (s, 1H), 9.20 (s, 1H), 7.88 (br s, 2H), 7.69 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.41 – 7.36 (m, 3H), 7.22 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 5.88 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.21 – 3.14 (m, 2H), 3.01 – 2.98 (m, 2H); ESI MS m/z 337 [C<sub>19</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 7.72 min.

### 實施例 176

9-[4-(2-胺基乙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉

-4(5H)-酮 鹽酸鹽

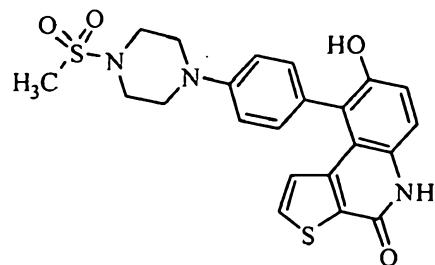


依照一般程序 F，使 9-[4-(2-胺基乙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (800 mg, 1.8 mmol) 與三溴硼烷 (10 mL) 反應，將所獲材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物 (520 mg, 88%) 灰白色固體：

<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 11.78 (s, 1H), 9.20 (s, 1H), 7.88 (br s, 2H), 7.69 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.41 – 7.36 (m, 3H), 7.22 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 5.88 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.21 – 3.14 (m, 2H), 3.01 – 2.98 (m, 2H); ESI MS m/z 337 [C<sub>19</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 7.72 min.

實施例 112

8-羥基-9-{4-[4-(甲基磺醯基)哌啶-1-基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

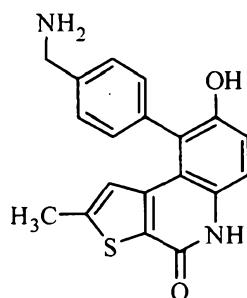


依照一般程序 F，使 8-甲氧基-9-{4-[4-(甲基磺醯基)哌啶-1-基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (32 mg, 0.068 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 mL) 反應以獲得所望產物

(5.2 mg, 17%)灰白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.58 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.20 (s, 4H), 7.15 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.16 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.44 - 3.43 (m, 8H), 2.92 (s, 3H); ESI MS m/z 456 [C<sub>22</sub>H<sub>21</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%, t<sub>R</sub> = 10.47 min.

#### 實施例 95

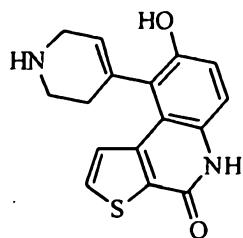
9-[4-(胺基甲基)苯基]-8-羥基-2-甲基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 F，使第三丁基 4-(8-甲氧基-2-甲基-4-側氨基-4,5-二氫噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯 (80 mg, 0.17 mmol) 與三溴硼烷 (2.0 mL) 反應以獲得所望產物 (20 mg, 37%) 灰白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.63 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.40 - 7.37 (m, 3H), 7.15 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.76 (s, 1H), 4.28 (s, 2H), 2.33 (s, 3H); ESI MS m/z 337 [C<sub>19</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%, t<sub>R</sub> = 5.91 min.

#### 實施例 84

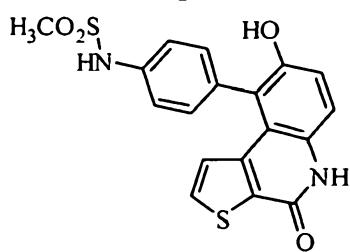
8-羥基-9-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮



依照一般程序 B，使 9-溴-8-(第三丁基二甲基矽基氧) 噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮 (80 mg, 0.20 mmol) 與 第三丁基 4-(4, 4, 5, 5-tetra 甲基-1, 3, 2-二 氧 雜 硼 烷-2-基) 環己-3-烯基胺基甲酸酯 (90 mg, 0.29 mmol) 反應以獲得所望產物 (140 mg, 23%) 灰白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  8.01 - 7.98 (m, 2H), 7.35 (d,  $J$  = 8.9 Hz, 1H), 7.12 (d,  $J$  = 8.9 Hz, 1H), 5.80 (s, 1H), 4.01 - 3.91 (m, 2H), 3.63 - 3.60 (m, 2H), 2.88 - 2.84 (m, 1H), 2.57 - 2.53 (m, 1H); ESI MS m/z 299 [C<sub>16</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC),  $t_R$  = 6.70 min.

### 實施例 77

N-[4-(8-羥基-4-側 氧 基-4, 5-二 氰 噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基]甲烷 磺 鹼 胺

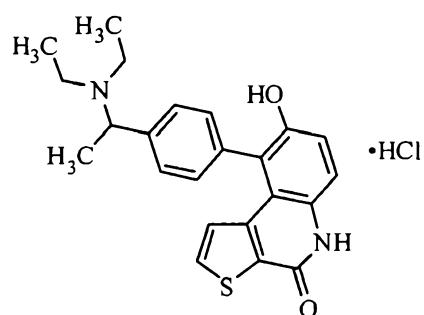


依照一般程序 F，使 N-[4-(8-甲 氧 基-4-側 氧 基-4, 5-二 氰 噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基]甲烷 磺 鹼 胺 (40 mg, 0.10 mmol) 與 三溴硼烷 (3.0 mL) 反應以獲得所望產物 (3.8 mg, 10%) 灰白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.61 (d,  $J$  = 5.4 Hz, 1H), 7.44 - 7.43 (m, 2H), 7.39 (d,  $J$

= 5.4 Hz, 1H), 7.29 - 7.27 (m, 2H), 7.16 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.12 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 3.09 (s, 3); ESI MS m/z 387 [C<sub>18</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%, t<sub>R</sub> = 9.69 min.

### 實施例 196

#### 9-{4-[1-(二乙基胺基)乙基]苯基}-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

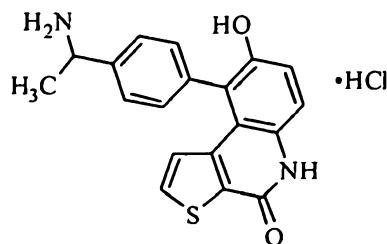


依照實施例 460 揭示的程序，使 9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (30 mg, 0.081 mmol) 與甲醛 (37%於水, 15 mg, 0.26 mmol) 反應，將所獲材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物 (7.2 mg, 21%) 淡棕色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.73 (q, J = 6.9 Hz, 2H), 7.58 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.48 - 7.45 (m, 2H), 7.43 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.19 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.02 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.78 (q, J = 4.7 Hz, 1H), 3.51 - 3.34 (m, 3H), 3.19 - 3.12 (m, 1H), 1.86 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 1.43 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.37 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS m/z 393 [C<sub>23</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC), t<sub>R</sub> = 8.29 min.

### 實施例 195

#### 9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉

-4(5H)-酮 鹽酸鹽

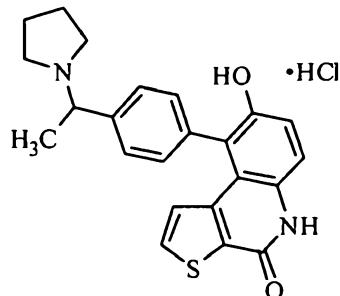


依照一般程序 F，使第三丁基 1-[4-(8-甲氧基-4-側  
氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]乙基胺基  
甲酸酯 (320 mg, 0.71 mmol) 與三溴硼烷 (10 mL) 反應以  
獲得所望產物 (160 mg, 59%) 淡棕色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  
 $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.64 – 7.63 (m, 2H), 7.55 (d,  $J = 5.4$  Hz,  
1H), 7.43 – 7.40 (m, 3H), 7.17 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.08  
(d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.61 (q,  $J = 6.9$  Hz, 1H), 1.76  
(d,  $J = 6.9$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  337 [ $\text{C}_{19}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ;  
HPLC 98.1% (AUC),  $t_{\text{R}} = 7.63$  min.

實施例 194

8-羥基-9-{4-[1-(吡咯啶-1-基)乙基]苯基}噻吩并

[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

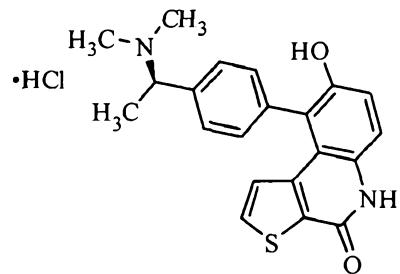


依照一般程序 F，使 8-甲氧基-9-{4-[1-(吡咯啶-1-  
基)乙基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (70 mg,  
0.17 mmol) 與三溴硼烷 (2.0 mL) 反應以獲得所望產物 (43  
mg, 58%) 灰白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$

7.70 - 7.66 (m, 2H), 7.59 (d, J = 5.4 Hz, 1H),  
 7.48 - 7.44 (m, 2H), 7.42 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.18 (d,  
 J = 8.9 Hz, 1H), 6.01 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.53 (q,  
 J = 6.8 Hz, 1H), 3.45 (br s, 1H), 3.20 - 3.10 (m, 1H),  
 2.20 - 2.00 (m, 4H), 1.87 (d, J = 6.9 Hz, 3H); ESI MS  
 m/z 391 [C<sub>23</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99%, t<sub>R</sub> = 8.21 min.

### 實施例 272

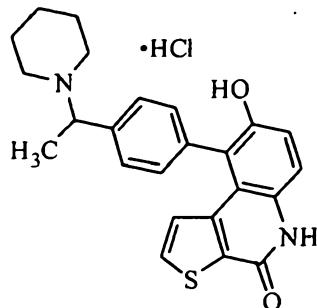
#### (R)-9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照實施例 460 所揭示的程序，使(R)-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (50 mg, 0.15 mmol) 與甲醛反應 (14 mL, 0.45 mmol)，將所獲材料如一般程序 D-2 概述者轉換為鹽酸鹽以獲得所望產物 (12 mg, 20%) 灰白色固體：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 7.71 (q, J = 2.6 Hz, 2H), 7.59 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.48 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.43 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.19 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.02 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.66 (q, J = 7.1 Hz, 1H), 2.97 (s, 3H), 2.87 (s, 3H), 1.86 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS m/z 365 [C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC 97.1% (AUC), t<sub>R</sub> = 8.57 min.

## 實施例 262

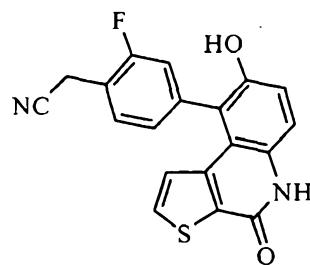
8-羥基-9-{4-[1-(哌啶-1-基)乙基]苯基}噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使 8-甲氧基-9-{4-[1-(哌啶-1-基)乙基]苯基}噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮 (40 mg, 0.096 mmol) 與三溴硼烷 (1.0 mL) 反應以獲得所望產物 (4.9 mg, 13%) 黃色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.73 (d,  $J = 8.4$  Hz, 1H), 7.68 (d,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.58 (d,  $J = 5.5$  Hz, 1H), 7.48 – 7.42 (m, 3H), 7.19 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.01 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.60 (q,  $J = 4.5$  Hz, 1H), 3.79 (d,  $J = 12.0$  Hz, 1H), 3.50 (d,  $J = 11.7$  Hz, 1H), 3.02 (t,  $J = 11.3$  Hz, 1H), 2.89 (t,  $J = 6.0$  Hz, 1H), 2.09 – 1.72 (m, 8H), 1.55 – 1.45 (m, 1H); ESI MS  $m/z$  405 [ $\text{C}_{24}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 95.0% (AUC),  $t_{\text{R}} = 7.83$  min.

## 實施例 261

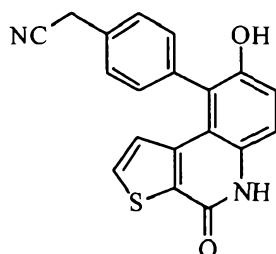
2-[2-氟-4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基]乙腈



依照一般程序 F，使 2-[2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]乙腈 (42 mg, 1.2 mmol) 與三溴硼烷 (12 mL, 12 mmol) 反應以獲得所望產物 (22 mg, 55%) 淡棕色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  7.65 (m, 2H), 7.42 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 7.19 – 7.14 (m, 3H), 6.16 (d,  $J = 5.5$  Hz, 1H), 4.07 (s, 2H); ESI MS  $m/z$  351 [ $\text{C}_{19}\text{H}_{11}\text{FN}_2\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 97.1% (AUC),  $t_{\text{R}} = 13.67$  min.

### 實施例 81

2-[4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]乙腈

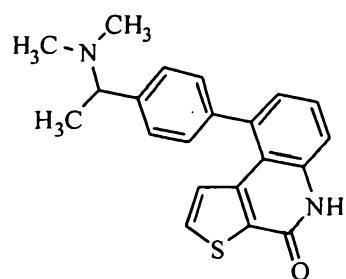


依照一般程序 B，使 9-溴-8-(第三丁基二甲基矽基氧)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (50 mg, 0.12 mmol) 與 4-(氰基甲基)苯基有機硼酸 (26 mg, 0.18 mmol) 反應，以獲得經 TBS 保護的中間產物，再以氫氧化鋰水溶液處理以獲得所望產物 (20 mg, 50%) 灰白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  9.28 (s, 1H), 7.73 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H),

7.50 (d,  $J = 8.1$  Hz, 2H), 7.38 (d,  $J = 8.9$  Hz, 1H),  
 7.29 (d,  $J = 8.1$  Hz, 2H), 7.18 (m, 1H), 5.90 (d,  $J =$   
 5.4 Hz, 1H), 4.19 (s, 2H); ESI MS  $m/z$  333 [ $C_{19}H_{12}N_2O_2S$   
 + H]<sup>+</sup>; HPLC 96.2% (AUC),  $t_R = 12.07$  min.

### 實施例 346

9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

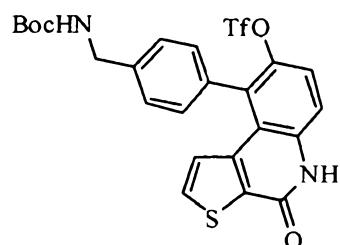


對於 9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (350 mg, 1.0 mmol) 於無水 THF (20 mL) 的溶液，於 0 °C 添加氫化鈉 (60 wt %, 160 mg, 5.0 mmol)，將該反應混合物加熱至 60 °C 1 小時。將反應混合物冷卻至 0 °C，加入三氟-N-苯基-N-[(三氟甲基)磺醯基]甲烷磺醯胺 (450 mg, 1.1 mmol)，將反應混合物回溫至室溫並攪拌 1 小時。將反應混合物以飽和氯化銨水溶液淬滅，並將層體分離。將水層以 3:1 氯仿 / 異丙醇萃取，將合併的有機層以無水硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮以獲得粗製三氟甲磺酸鹽 (400 mg) 棕色固體。將該粗製的三氟甲磺酸鹽於無水 DMF (30 mL)，脫氣 10 min，再加入三乙基胺 (1.7 mL, 12 mmol)、1,1'-雙(二苯基膦)二茂鐵二氯鉑 (II) (70 mg, 0.080 mmol) 及甲酸 (0.3 mL, 8.00 mmol)。將反

應混合物於 100 °C 加熱 24 小時，冷卻、濃縮，將殘渣以製備性 HPLC (C18 二氧化矽，水 / 乙腈 有 0.05% TFA 梯度) 純化以獲得所望產物 (60 mg, 21%，2 步驟) 白色固體：  
 $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  12.00 (s, 1H), 7.61 (d,  $J = 8.0$  Hz, 1H), 7.51 (t,  $J = 7.7$  Hz, 1H), 7.45 – 7.42 (m, 3H), 7.35 – 7.34 (m, 2H), 7.16 (d,  $J = 7.2$  Hz, 1H), 6.30 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 3.45 (d,  $J = 6.3$  Hz, 1H), 2.32 (s, 6H), 1.50 (d,  $J = 6.6$  Hz, 3H); ESI MS  $m/z$  349 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{OS} + \text{H}]^+$ ; HPLC 98.5% (AUC),  $t_R = 10.86$  min.

#### 實施例 461

9-{4-[（第三丁基羧基胺基）甲基]苯基}-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基三氟甲烷磺酸鹽

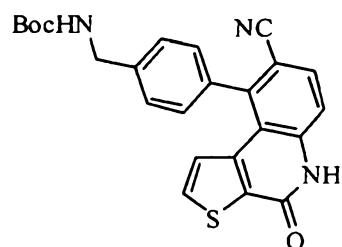


對於第三丁基 4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯 (150 mg, 0.36 mmol) 於 THF (3 mL) 的溶液，於 0 °C 加入氫化鈉 (60 wt %, 18 mg, 0.44 mmol)，將反應混合物於 0 °C 攪拌 1 小時。加入 N-苯基-雙(三氟甲烷磺醯亞胺) (160 mg, 0.44 mmol)，並將反應混合物回溫至室溫並攪拌 18 小時。將反應混合物以水淬滅，將水層以二氯甲烷萃取。將合併的有機層以無水硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮，將殘渣以管柱層析純化 (二氧化矽，甲醇 / 二氯甲烷梯度) 以獲得所望產物 (200 mg, 98%)：ESI

MS m/z 555 [C<sub>24</sub>H<sub>21</sub>F<sub>3</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>S<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 462

第三丁基 4-(8-氟基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苄基氨基甲酸酯

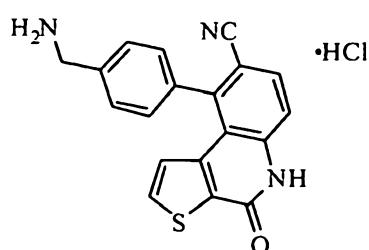


將 9-{4-[((第三丁基氨基甲酸基)甲基)苯基]-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-8-基}三氟甲磺酸鹽(176 mg, 0.320 mmol)、氯化鋅(75 mg, 0.640 mmol)、1,1'-雙(二苯基膦)二茂鐵(18 mg, 0.032 mmol)及參(二苄叉丙酮)二鈀(O)(15 mg, 0.016 mmol)於無水DMF(4 mL)的溶液，於130 °C加熱3小時。將反應混合物冷卻，以水淬滅，將獲得的沉澱過濾，並以管柱層析純化(二氧化矽，甲醇/二氯甲烷梯度)以獲得所望產物(120 mg, 87%)棕色固體：ESI MS m/z 432 [C<sub>24</sub>H<sub>21</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>S + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 326

9-[4-(胺基甲基)苯基]-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-

8-腈 鹽酸鹽

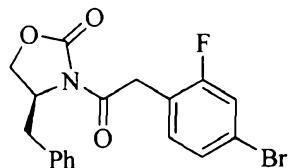


依照一般程序 D-3，使第三丁基 4-(8-氟基-4-側氧基

-4,5-二氫噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基甲酸酯 (10 mg, 0.023 mmol) 與 4 N HCl (3 mL) 反應以獲得所望產物 (7.4 mg, 74%) 暗棕色固體:  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  7.89 (d,  $J = 8.6$  Hz, 1H), 7.74 (t,  $J = 9.5$  Hz, 2H), 7.65 (dd,  $J = 14.4, 7.0$  Hz, 2H), 7.55 - 7.53 (m, 2H), 6.08 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 4.32 (s, 2H); ESI MS m/z 330 [C<sub>19</sub>H<sub>13</sub>N<sub>3</sub>OS - H]<sup>+</sup>; HPLC 98.3% (AUC),  $t_{\text{R}} = 9.36$  min.

### 實施例 627

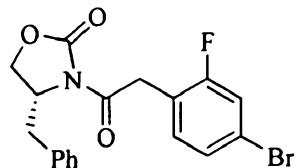
(S)-4-苄基-3-(2-(4-溴-2-氟苯基)乙醯基)𫫇唑啶-2-酮



對於 (2-(4-溴-2-氟苯基)乙酸) (3 g, 13 mmol) 及三乙基胺 (2.5 mL, 14 mmol) 於甲苯 (50 mL) 的溶液，於 0 °C 滴加三甲基乙醯氯 (6.1 mL, 65 mmol)。10 min 後，將反應混合物冷卻至 -78 °C。於分開的燒瓶，對於 (S)-(+)-4-苄基-2-𫫇唑啶酮 (2.5 g, 14 mmol) 於四氫呋喃 (50 mL) 的溶液，於 -78 °C 加入 LiHMDS (1 M 於己烷, 17 mL, 17 mmol) 直到存留帶黃色的顏色。10 min 後將獲得的溶液經由套管轉移到如上製備的混合無水物的懸浮液中。使反應混合物在 4 小時的期間到達室溫，然後以飽和重硫酸鈉稀釋 (約 20 mL)，以乙酸乙酯萃取 (約 100 mL)。將萃取物以鹵水洗滌 (2 x 50 mL)，以硫酸鈉乾燥，並於真空下蒸發，將殘渣進行閃式層析再磨碎 (己烷) 以獲得所望產物 (2.1 g, 42 %) 白色固體。ESI MS m/z 393 [C<sub>18</sub>H<sub>15</sub>BrFNO<sub>3</sub> + H]<sup>+</sup>

## 實施例 628

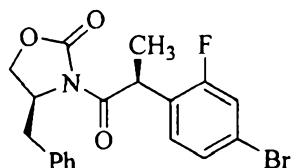
(R)-4-苄基-3-(2-(4-溴-2-氟苯基)乙醯基)𫫇唑啶-2-酮



依照實施例 627 揭示的程序，使(2-(4-溴-2-氟苯基)乙酸)(10.8 g, 30.7 mmol)與(S)-(+) -4-苄基-2-𫫇唑啶酮(5.44 g, 30.7 mmol)反應以獲得所望產物(4.5 g, 36%)白色固體。ESI MS m/z 393 [C<sub>18</sub>H<sub>15</sub>BrFNO<sub>3</sub> + H]<sup>+</sup>

## 實施例 629

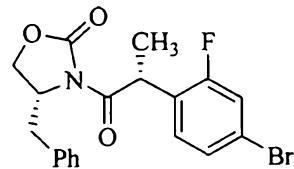
(S)-4-苄基-3-((S)-2-(4-溴-2-氟苯基)丙醯基)𫫇唑啶-2-酮



對於(S)-4-苄基-3-(2-(4-溴-2-氟苯基)乙醯基)𫫇唑啶-2-酮(3.6 g, 9.2 mmol)於THF(40 mL)的溶液，添加甲基碘的溶液(1 M 甲苯溶液 9.6 mL, 9.6 mmol)。將混合物冷卻至-78 °C，滴加雙(三甲基矽基)醯胺鈉(1 M 於 THF, 9.6 mL, 9.6 mmol)。將獲得的暗紅色混合物於約-78 °C攪拌15 min，使其回溫至室溫。3.5小時後，將反應混合物以飽和重硫酸鈉水溶液稀釋(約 20 mL)，以乙酸乙酯萃取(1 x 50 mL)。將萃取物以鹵水洗滌(2 x 50 mL)，以硫酸鈉乾燥，並於真空下蒸發。對殘渣進行閃式層析以獲得所望產物(1.7 g, 45%)淡黃色固體：ESI MS m/z 407 [C<sub>19</sub>H<sub>17</sub>BrFNO<sub>3</sub> + H]<sup>+</sup>

## 實施例 630

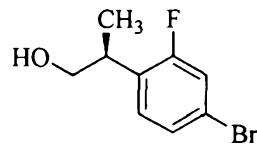
(R)-4-苄基-3-((R)-2-(4-溴-2-氟苯基)丙醯基)𫫇唑啶-2-酮



依照實施例 628 揭示的程序，使 (R)-4-苄基-3-(2-(4-溴-2-氟苯基)乙酰基)𫫇唑啶-2-酮 (4.6 g, 12 mmol) 與甲基碘反應 (1M 甲苯溶液, 12.3 mL, 12.3 mmol) 以獲得所望產物 (3.0 g, 60%) 淡黃色固體：ESI MS m/z 407 [C<sub>19</sub>H<sub>17</sub>BrFNO<sub>3</sub> + H]<sup>+</sup>

## 實施例 631

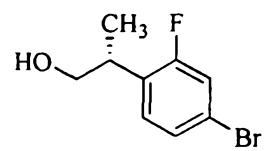
(S)-2-(4-溴-2-氟苯基)丙-1-醇



對於 ((S)-4-苄基-3-((S)-2-(4-溴-2-氟苯基)丙醯基)𫫇唑啶-2-酮) (1.7 g, 4.2 mmol) 於 THF (12 mL) 的溶液加入硼氫化鈉 (700 mg, 21 mmol) 於水 (2 mL) 的溶液。將該反應混合物於室溫攪拌 3 小時。藉由緩慢加入鹽酸水溶液 (1 N, 約 2.9 mL) 將多餘的氫化物淬滅。再將混合物以水 (10 mL) 稀釋，以乙酸乙酯萃取 (1 x 30 mL)。將合併的有機層以鹵水洗滌 (2 x 10 mL)，以硫酸鈉乾燥，並於真空下蒸發。將殘渣以閃式層析純化，以獲得所望產物 (0.8 g, 82%) 淡黃色油：ESI MS m/z 234 [C<sub>9</sub>H<sub>10</sub>BrFO + H]<sup>+</sup>

## 實施例 632

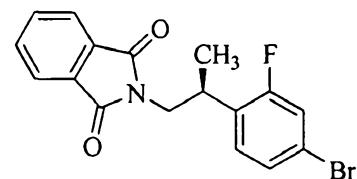
(R)-2-(4-溴-2-氟苯基)丙-1-醇



依照實施例 630 揭示的程序，使 (R)-4-苄基-3-((R)-2-(4-溴-2-氟苯基)丙醯基)𫫇唑啶-2-酮 (3 g, 7.4 mmol) 與硼氫化鈉反應 (1.2 g, 37 mmol) 以獲得所望產物 (1.5 g, 87%) 淡黃色油；ESI MS m/z 234 [C<sub>9</sub>H<sub>10</sub>BrFO + H]<sup>+</sup>

## 實施例 633

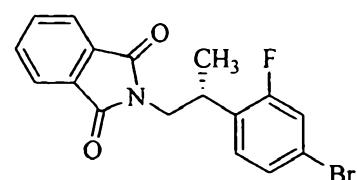
(S)-2-(2-(4-溴-2-氟苯基)丙基)異吲哚啉-1,3-二酮



對於 (S)-2-(4-溴-2-氟苯基)丙-1-醇 (800 mg, 3.43 mmol)、鄰苯二甲醯亞胺 (554 mg, 3.77 mmol) 及三苯基膦 (1.34 g, 5.14 mmol) 於 THF (2 mL) 的溶液，滴加 DIAD (1 mL, 5.14 mmol)。將反應混合物於室溫攪拌 18 小時，並於真空下蒸發。將殘渣進行閃式層析以獲得所望產物 (1 g, 81%) 白色固體 ESI MS m/z 363 [C<sub>17</sub>H<sub>13</sub>BrFN<sub>2</sub>O<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>

## 實施例 634

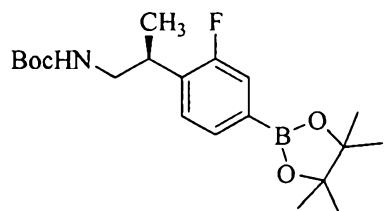
(R)-2-(2-(4-溴-2-氟苯基)丙基)異吲哚啉-1,3-二酮



依照實施例 633 揭示的程序，使 (R)-2-(4-溴-2-氟苯基)丙-1-醇 (1.5 mg, 6.4 mmol) 與鄰苯二甲醯亞胺 (1.0 mg, 7.008 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.6 g, 69%) 白色固體：ESI MS m/z 363 [C<sub>17</sub>H<sub>13</sub>BrFNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>

### 實施例 635

(S)-第三丁基 2-(2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基氨基甲酸酯



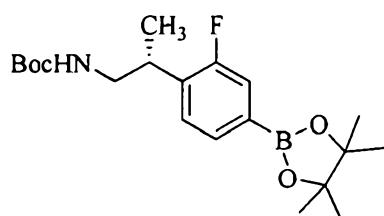
對於 ((S)-2-(2-(4-溴-2-氟苯基)丙基)異吲哚啉-1,3-二酮) (1.0 g, 2.8 mmol) 於甲苯 (10 mL) 的溶液滴加肼 (1.3 mL, 41.5 mmol)。將該反應混合物於 80 - 90 °C 加熱 1 小時，並冷卻至室溫。將上清傾倒，並將殘餘的固體以甲苯洗滌。將合併的溶液於真空下蒸發，溶於 DCM (10 mL) 並冷卻至 0 °C。其次，加入 Boc<sub>2</sub>O (870 mg, 4 mmol) 與 Et<sub>3</sub>N (0.5 mL, 4 mmol)，將反應混合物於室溫攪拌 30 min。將反應混合物以 DCM (20 mL) 稀釋，並以 1N HCl (1 x 10 mL)、水 (1 x 20 mL) 洗滌再以鹵水洗滌 (1 x 10 mL)，以硫酸鈉乾燥並於真空蒸發，以獲得所望產物 (860 mg, 99%)，其用在次一步驟而不經進一步純化。ESI MS m/z 333 [C<sub>14</sub>H<sub>19</sub>BrFNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>

次一步驟依照程序 G 實施 (流程 II)：使 (S)-第三丁基 2-(4-溴-2-氟苯基)丙基氨基甲酸酯 (860 mg, 2.66) 與

KOAc (833 mg, 8.5 mmol)、Pd(dppf)Cl<sub>2</sub> (200 mg, 0.26 mmol) 及雙戊醯二硼 (863 mg, 3.4 mmol) 反應以獲得 (S)-第三丁基 2-(2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯無色糊狀物 (900 mg, 89%)：ESI MS m/z 380 [C<sub>20</sub>H<sub>31</sub>BFNO<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>

### 實施例 636

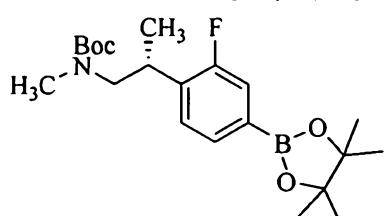
(R)-第三丁基 2-(2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照實施例 635 揭示的程序，使 (R)-2-(2-(4-溴-2-氟苯基)丙基)異吲哚啉-1,3 二酮 (1.6 g, 4.42 mmol) 與 肼 (2.1 g, 66 mmol)、Boc<sub>2</sub>O (2.0 g, 8.8 mmol) 反應，再與雙戊醯二硼 (1.0 g, 4.0 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.1 g, 80%) 無色糊狀物：ESI MS m/z 380 [C<sub>20</sub>H<sub>31</sub>BFNO<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>

### 實施例 637

(R)-第三丁基 2-(2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基(甲基)胺基甲酸酯

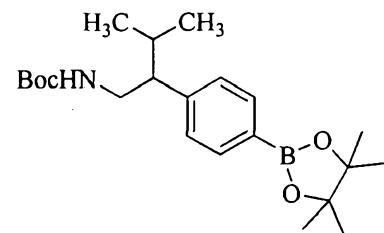


依照實施例 647 揭示的程序，使 (R)-第三丁基 2-(2-

氟 -4-(4, 4, 5, 5-四甲基 -1, 3, 2-二氧雜硼烷 -2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯 (400 mg, 1 mmol) 與甲基碘 (1 M 甲苯溶液, 2 mL, 2 mmol) 及 NaHMDS (1 M 溶液, 2 mL, 2 mmol) 反應以獲得所望產物 (330 mg, 82%) 黏稠物。ESI MS m/z 394 [C<sub>21</sub>H<sub>38</sub>BFN<sub>0</sub><sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>

### 實施例 638

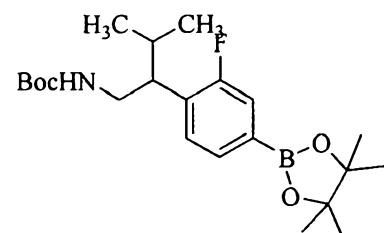
第三丁基 3-甲基 -2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基 -1, 3, 2-二氧雜硼烷 -2-基)苯基)丁基胺基甲酸酯



依照實施例 647 敘述的程序，使 2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基 -1, 3, 2-二氧雜硼烷 -2-基)苯基)乙腈 (5.6 g, 23 mmol) 與異丙基碘 (4 g, 24 mmol) NaHMDS (1 M 溶液, 24 mL, 24 mmol) 反應以獲得所望產物 (2.1 g, 23%) 黏稠物。ESI MS m/z 390 [C<sub>22</sub>H<sub>36</sub>BN<sub>0</sub><sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>

### 實施例 639

第三丁基 2-(2-氟 -4-(4, 4, 5, 5-四甲基 -1, 3, 2-二氧雜硼烷 -2-基)苯基)-3-甲基丁基胺基甲酸酯

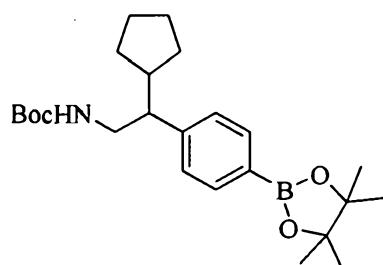


依照實施例 647 敘述的程序，使 2-(2-氟 -4-(4, 4, 5, 5-四甲基 -1, 3, 2-二氧雜硼烷 -2-基)苯基)乙腈 (1.7 g, 6.5

mmol) 與異丙基碘反應 (1.1 g, 6.8 mmol) NaHMDS (1 M 溶液, 7.1 mL, 7.1 mmol) 以獲得所望產物 (0.65 g, 24%) 黏稠物。ESI MS m/z 408 [C<sub>22</sub>H<sub>36</sub>FBNO<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>

#### 實施例 640

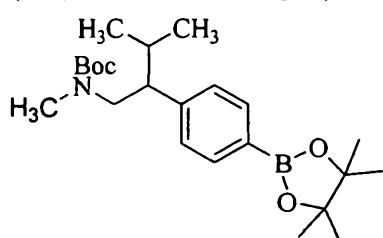
第三丁基 2-環戊基-2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)乙基氨基甲酸酯



依照實施例 647 敘述的程序，使 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)乙腈 (1.7 g, 7.16 mmol) 與環戊基碘反應 (1 M 甲苯溶液, 7.16 mL, 7.16 mmol) and NaHMDS (1 M 溶液, 7.16 mL, 7.16 mmol) 以獲得所望產物 (1.6 g, 53%) 黏稠物。ESI MS m/z 415 [C<sub>24</sub>H<sub>38</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 641

第三丁基 甲基(3-甲基-2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丁基)氨基甲酸酯



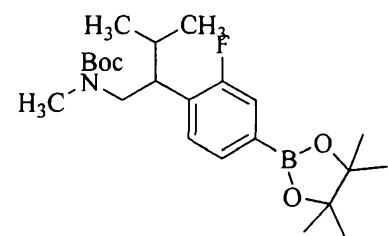
#### 實施例 642

依照實施例 647 敘述的程序，使第三丁基 3-甲基

-2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丁基胺基甲酸酯(400 mg, 1 mmol)與甲基碘(1M 甲苯溶液, 2 mL, 2 mmol)與 NaHMDS (1 M 溶液, 2 mL, 2 mmol)反應以獲得所望產物(350 mg, 84%) 黏稠物。ESI MS m/z 403 [C<sub>23</sub>H<sub>38</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 643

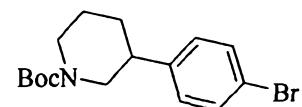
第三丁基 2-(2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)-3-甲基丁基(甲基)胺基甲酸酯



依照實施例 647 敘述的程序，使第三丁基 2-(2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)-3-甲基丁基胺基甲酸酯(650 mg, 1.6 mmol)與甲基碘(1M 甲苯溶液, 3.2 mL, 3.2 mmol)及 NaHMDS (1 M 溶液, 4.8 mL, 4.8 mmol)反應以獲得所望產物(650 mg, 94%) 黏稠物。ESI MS m/z 421 [C<sub>23</sub>H<sub>38</sub>FBNO<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>

### 實施例 644

第三丁基 3-(4-溴苯基)哌啶-1-羧酸酯

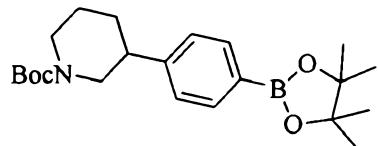


對於 3-(4-溴苯基)吡啶(0.4 g, 1.68 mmol)及 HCl (1.0 N 水溶液, 1.7 mL, 1.7 mmol)於 MeOH (20 mL)的溶液加入 PtO<sub>2</sub> (0.5 g)，於室溫在氫氣氛圍(50 psi)於 Parr

氫化裝置內攪拌 24 小時。將混合物經矽藻土過濾，將濾液於減壓下揮發。將獲得的白色固體溶於 EtOAc (50 mL)，以 1 N NaOH (10 mL) 洗滌。將水相以 EtOAc (3 x 50 mL) 萃取，並將合併的有機相乾燥 ( $\text{Na}_2\text{SO}_4$ )。溶劑蒸發獲得白色固體再度溶於 DCM，於 0 °C 加入  $\text{Boc}_2\text{O}$  再加入  $\text{Et}_3\text{N}$ 。將該反應混合物於室溫攪拌 1 小時後，以 DCM 稀釋，依序以 1 N HCl、水及鹹水洗滌，以硫酸鈉乾燥，並於真空下蒸發。將殘渣進行閃式層析以獲得所望產物黏稠物 (350 mg, 61%) ESI MS m/z 341 [ $\text{C}_{16}\text{H}_{22}\text{BrNO}_2 + \text{H}]^+$ 。

#### 實施例 645

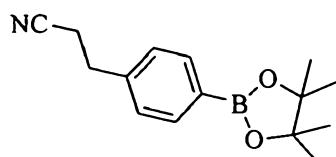
第三丁基 3-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)哌啶-1-羧酸酯



一般程序 G，係使第三丁基 3-(4-溴苯基)哌啶-1-羧酸酯 (350 mg, 1) 與雙戊醯二硼 (275, 1.2 mmol) 反應以獲得所望產物 (190 mg, 48%) 黏稠物：ESI MS m/z 388 [ $\text{C}_{22}\text{H}_{34}\text{BN}_2\text{O}_4 + \text{H}]^+$ 。

#### 實施例 646

3-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙腈

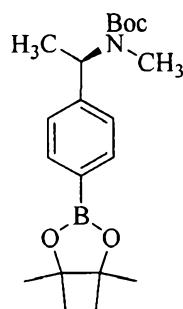


一般程序 G，係使第三丁基 3-(4-溴苯基)哌啶-1-羧

酸酯 (350 mg, 1) 與 雙戊醯二硼 (275, 1.2 mmol) 反應以獲得所望產物 (190 mg, 48%) 黏稠物：ESI MS m/z 388 [C<sub>22</sub>H<sub>34</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 647

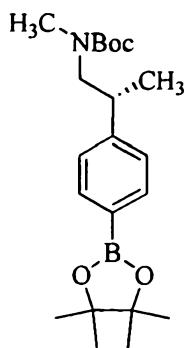
N- 甲基 (R)- 第三丁基 甲基 (1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)乙基)胺基甲酸酯



將 (R)- 第三丁基 1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)乙基胺基甲酸酯 (1.0 g, 2.88 mmol) 於無水 THF (20 mL) 的溶液冷卻至 0 °C，並分次加入氫化鈉 (60 wt %, 330 mg, 8.64 mmol)。將混合物攪拌 10 min，然後於 60 °C 加熱 1 小時。然後將燒瓶冷卻至室溫，加入甲基碘 (277 mL, 4.32 mmol)。將混合物再次於 60 °C 加熱 12 小時。LCMS 顯示反應完成。將反應混合物以水淬滅，並以乙酸乙酯稀釋 (200 mL)。將層體分離，將有機層以無水硫酸鈉乾燥，過濾、濃縮，將殘渣以管柱層析純化 (二氯化矽，0 - 30% 乙酸乙酯 / 庚烷) 以獲得所望產物 (520 mg, 43%) 白色固體：ESI MS m/z 306 [C<sub>20</sub>H<sub>32</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> - 56]<sup>+</sup>。

### 實施例 648

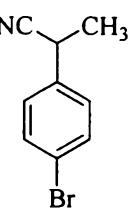
(R)- 第三丁基 甲基 (2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基)胺基甲酸酯



將 (R)-第三丁基 2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧雜硼烷-2-基) 莓基)丙基胺基甲酸酯 (9.0 g, 24.93 mmol) 於無水 THF (120 mL) 的溶液冷卻至 0 °C，加入 NaHMDS (30 mL, 29.9 mmol)。將該混合物攪拌 1 小時，加入甲基碘 (1.9 mL, 29.9) 於 THF (40 mL)，並攪拌 14 小時。將反應混合物以水 (20 mL) 淚滅，以乙酸乙酯 (250 mL) 稀釋。將層體分離，將有機層以無水硫酸鈉乾燥，過濾、濃縮，將殘渣以管柱層析純化(二氧化矽，0 - 30% 乙酸乙酯/庚烷)以獲得所望產物 (6.2 g, 66%) 淡黃色油：ESI MS m/z 376 [C<sub>21</sub>H<sub>34</sub>BN<sub>0</sub><sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 649

##### 2-(4-溴苯基)丙腈

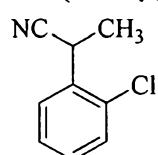


將 2-(4-溴苯基)乙腈 (5.0 g, 25.5 mmol) 於無水 THF (70 mL) 的溶液冷卻至 0 °C，分次加入氫化鈉 (60 wt %, 1.5 g, 38.3 mmol)。將該混合物於室溫攪拌 1 小時。之後，加入甲基碘 (1.8 mL, 28.1 mmol)，並將該混合物攪拌 14 小時。將反應混合物小心地以水於 0 °C 淚滅，並以乙酸乙

酯稀釋 (200 mL)。將層體分離，並將有機層以無水硫酸鈉乾燥，過濾、濃縮，將殘渣以管柱層析純化 (二氧化矽，0 - 30% 乙酸乙酯 / 庚烷) 以獲得所望產物 (3.8 g, 72%) 黃色油：ESI MS  $m/z$  210 [ $C_9H_8BrN + H$ ]<sup>+</sup>。

### 實施例 650

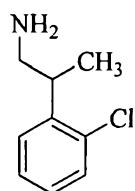
#### 2-(2-氯苯基)丙腈



依照實施例 649 的程序，使 2-(2-氯苯基)乙腈 (15 g, 98.9 mmol) 與 NaHMDS (118 mL, 118 mmol) 及甲基碘 (7.0 mL, 108 mmol) 反應以獲得所望產物 (14 g, 87%) 棕色油：ESI MS  $m/z$  166 [ $C_9H_8ClN + H$ ]<sup>+</sup>。

### 實施例 651

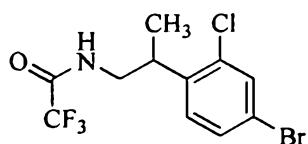
#### 2-(2-氯苯基)丙-1-胺



對於 2-(2-氯苯基)丙腈 (14 g, 84.8 mmol) 於甲苯的溶液，於 0 °C 加入  $BH_3 \cdot THF$  (127, 255 mmol)，將反應物回溫至室溫，加熱回流 4 小時。將反應混合物冷卻，以水淬滅，濃縮並將殘渣以管柱層析純化 (二氧化矽，乙酸乙酯 / 己烷梯度) 以獲得所望產物 (13.9 g, 97%) 帶紅色的油：ESI MS  $m/z$  170 [ $C_9H_{12}ClN + H$ ]<sup>+</sup>。

### 實施例 652

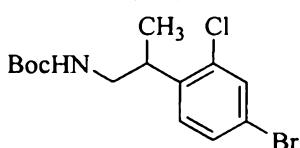
#### N-(2-(4-溴-2-氯苯基)丙基)-2,2,2-三氟乙醯胺



將三氟乙酸酐 (12.8 mL, 90.1 mmol) 於無水二氯甲烷 (82 mL) 的溶液冷卻至 0 °C，並滴加於無水二氯甲烷 (30 mL) 中的 2-(2-氯苯基)丙-1-胺 (14 g, 82.8 mmol)。將該混合物於室溫攪拌 1.5 小時。再次將燒瓶冷卻至 0 °C，一次加入甲烷磺酸 (13 mL)，再加入 1,3-二溴-5,5-二甲基乙內醯脲 (11.8 g, 41.4 mmol)。將該混合物攪拌 14 h 以水淬滅 (30 mL)，以二氯甲烷 (150 mL) 稀釋。將層體分離並將有機層以無水硫酸鈉乾燥、過濾、濃縮並將殘渣以管柱層析純化 (二氧化矽, 0 - 30% 乙酸乙酯 / 庚烷) 以獲得所望產物 (14 g, 50%) 帶黃色的油：ESI MS m/z 344 [C<sub>11</sub>H<sub>10</sub>BrClF<sub>3</sub>NO + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 653

第三丁基 2-(2-氯-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯

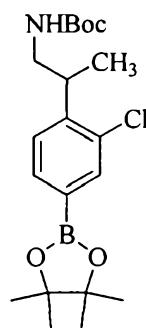


將 N-(2-(4-溴-2-氯苯基)丙基)-2,2,2-三氟乙醯胺 (14 g, 40.6 mmol)、甲醇 (200 mL) 及氫氧化鈉 (2M, 200 mL, 81.2 mmol) 的混合物，於室溫攪拌 14 小時。LCMS 顯示反應完成。移除溶劑，以二氯甲烷 (200 mL) 萃取，並濃縮以獲得油。將殘渣溶於二氯甲烷 (100 mL)，冷卻至 0 °C。將三乙基胺 (8.3 mL, 61.0 mmol)、二第三丁基碳酸

氯酯 (13.3 g, 61.0 mmol) 及該反應混合物於室溫攪拌 18 小時。將反應混合物濃縮，並將殘渣以管柱層析純化(二氧化矽，乙酸乙酯/己烷梯度)以獲得所望產物 (13.8 g, 90%) 白色固體：ESI MS  $m/z$  293 [ $C_{14}H_{19}BrClNO_2 - 56$ ]<sup>+</sup>。

#### 實施例 654

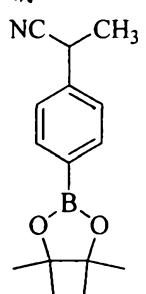
第三丁基 2-(2-氯-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 G，係使第三丁基 2-(4-溴-2-氯苯基)丙基胺基甲酸酯 (12.0 g, 34.5 mmol) 與雙戊醯二硼 (13.2 g, 51.7 mmol) 反應以獲得所望產物 (8.0 g, 58%) 不定形帶紅色的油：ESI MS  $m/z$  396 [ $C_{20}H_{31}BClNO_4 + H$ ]<sup>+</sup>。

#### 實施例 655

2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙腈



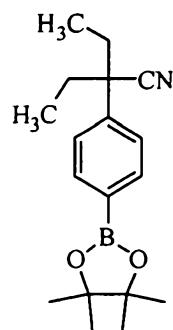
依照一般程序 G，係使 2-(4-溴苯基)丙腈 (3.5 g, 18.2 mmol) 與雙戊醯二硼 (4.6 g, 27.1 mmol) 反應以獲得

所望產物 (2.5 g, 53%) 棕色固體：ESI MS m/z 258  
 $[C_{15}H_{20}BN_0_2 + H]^+$ 。

### 實施例 656

2-乙基-2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)

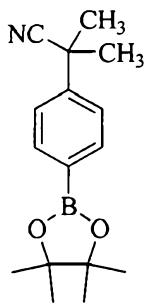
苯基)丁腈



將 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)乙腈 (2.0 g, 8.23 mmol) 於 DMF (40 mL) 的溶液冷卻至 0 °C，分次添加氫化鈉 (60 wt %, 1.2 g, 32.9 mmol)。將該混合物攪拌 10 min，加入於 THF (10 mL) 的乙基碘 (0.74 mL, 9.05 mmol)。將該混合物於室溫攪拌 12 小時。將反應混合物以水淬滅，以乙酸乙酯稀釋。將層體分離並將有機層以無水硫酸鈉乾燥、過濾、濃縮並將殘渣以管柱層析純化 (二氧化矽，0 - 30% 乙酸乙酯 / 庚烷) 以獲得所望產物 (950 mg, 38%) 棕色固體：ESI MS m/z 300  
 $[C_{18}H_{26}BN_0_2 + H]^+$ 。

### 實施例 657

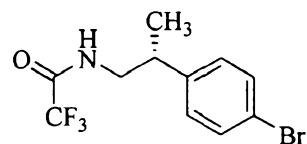
2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙腈



依照一般程序 G，係使 2-(4-溴苯基)丙腈 (5.0 g, 22.3 mmol) 與雙戊醯二硼 (8.7 g, 33.5 mmol) 反應以獲得所望產物 (5.8 g, 95%) 白色固體：ESI MS m/z 272 [C<sub>16</sub>H<sub>22</sub>BN<sub>1</sub>O<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 658

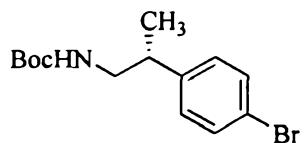
(R)-N-(2-(4-溴苯基)丙基)-2,2,2-三氟乙醯胺



將三氟乙酸酐 (11.4 mL, 81.4 mmol) 於無水二氯甲烷 (73 mL) 的溶液冷卻至 0 °C，並滴加 (R)-2-苯基丙-1-胺 (10 g, 73.9 mmol) 於無水二氯甲烷 (20 mL)。將混合物於室溫攪拌 1.5 小時。再次將燒瓶冷卻至 0 °C，一次加入甲烷磺酸 (12 mL)，再加入 1,3-二溴-5,5-二甲基乙內醯脲 (11 g, 36.9 mmol)。將該混合物攪拌 14 小時，以水淬滅 (30 mL)，並以二氯甲烷 (100 mL) 稀釋。將層體分離並將有機層以無水硫酸鈉乾燥、過濾、濃縮並將殘渣以管柱層析純化 (二氧化矽，0 - 30% 乙酸乙酯 / 庚烷) 以獲得所望產物 (21 g, 91%) 黃色固體：ESI MS m/z 310 [C<sub>11</sub>H<sub>11</sub>BrF<sub>3</sub>NO + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 659

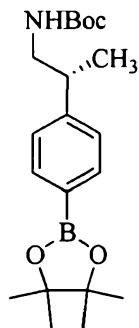
(R)-第三丁基 2-(4-溴苯基)丙基胺基甲酸酯



將 (R)-N-(2-(4-溴苯基)丙基)-2,2,2-三氟乙醯胺 (21 g, 68.3 mmol)、甲醇 (40 mL) 及氫氧化鈉 (2M, 68 mL, 136 mmol) 的混合物，於室溫攪拌 14 小時。LCMS 顯示反應完成。移除溶劑，以二氯甲烷 (250 mL) 萃取，並濃縮以獲得油。將殘渣溶於二氯甲烷 (100 mL) 並冷卻至 0 °C。將三乙基胺 (14 mL, 102 mmol) 及二第三丁基碳酸氫酯 (22 g, 102 mmol) 及反應混合物於室溫攪拌 18 小時。將反應混合物濃縮，將殘渣以管柱層析純化(二氧化矽，乙酸乙酯/己烷梯度)以獲得所望產物 (19 g, 91%) 黃色油：ESI MS m/z 257 [C<sub>14</sub>H<sub>20</sub>BrNO<sub>2</sub> - 56]<sup>+</sup>。

#### 實施例 660

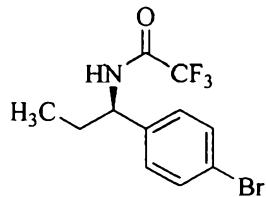
(R)-第三丁基 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 G，係使 (R)-第三丁基 2-(4-溴苯基)丙基胺基甲酸酯 (19 g, 60.5 mmol) 與雙戊醯二硼 (24 g, 94.4 mmol) 反應以獲得所望產物 (22 g, 99%) 淡黃色固體：ESI MS m/z 362 [C<sub>20</sub>H<sub>32</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 661

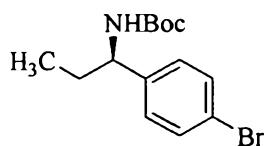
## (R)-N-(1-(4-溴苯基)丙基)-2,2,2-三氟乙醯胺



將三氟乙酸酐 (5.7 mL, 40.7 mmol) 於無水二氯甲烷 (40 mL) 的溶液冷卻至 0 °C，並滴加於無水二氯甲烷 (10 mL) 之 (R)-1-苯基丙-1-胺 (5 g, 36.9 mmol)。將混合物於室溫攪拌 1.5 小時。再次將燒瓶冷卻至 0 °C，並一次加入甲烷磺酸 (6.3 mL)，再加入 1,3-二溴-5,5-二甲基乙內醯脲 (5.3 g, 18.5 mmol)。將該混合物攪拌 14 小時，以水淬滅 (30 mL)，並以二氯甲烷 (50 mL) 稀釋。將層體分離並將有機層以無水硫酸鈉乾燥、過濾、濃縮並將殘渣以管柱層析純化 (二氧化矽，0 - 30% 乙酸乙酯 / 庚烷) 以獲得所望產物 (8.1 g, 73%) 白色固體：ESI MS m/z 310 [C<sub>11</sub>H<sub>11</sub>BrF<sub>3</sub>NO + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 662

## (R)-第三丁基 1-(4-溴苯基)丙基氨基甲酸酯

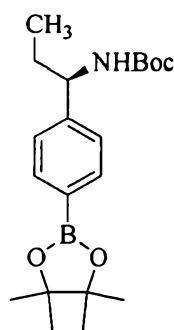


將 (R)-N-(1-(4-溴苯基)丙基)-2,2,2-三氟乙醯胺 (8.1 g, 68.3 mmol)、甲醇 (20 mL) 與氫氧化鈉 (2M, 15 mL, 30.6 mmol) 的混合物於室溫攪拌 14 小時。LCMS 顯示反應完成。移除溶劑，以二氯甲烷 (150 mL) 萃取，並濃縮以獲得油。將殘渣溶於二氯甲烷 (100 mL) 並冷卻至 0 °C。將三乙基胺 (2.2 mL, 15.3 mmol) 及二第三丁基碳酸氫酯

(3.3 g, 15.3 mmol) 及反應混合物於室溫攪拌 18 小時。將反應混合物濃縮，並將殘渣以管柱層析純化(二氧化矽，乙酸乙酯 / 己烷梯度)以獲得所望產物 (5.8 g, 70%) as off-white solid: ESI MS m/z 257 [C<sub>14</sub>H<sub>20</sub>BrNO<sub>2</sub> - 56]<sup>+</sup>。

### 實施例 663

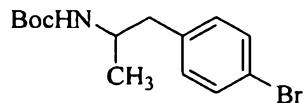
(R)-第三丁基 1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 G，使(R)-第三丁基 1-(4-溴苯基)丙基胺基甲酸酯 (5.8 g, 18.4 mmol) 與雙戊醯二硼 (7.03 g, 27.7 mmol) 反應以獲得所望產物 (6.18 g, 92%) 黃色油：ESI MS m/z 362 [C<sub>20</sub>H<sub>32</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 664

第三丁基 1-(4-溴苯基)丙-2-基胺基甲酸酯

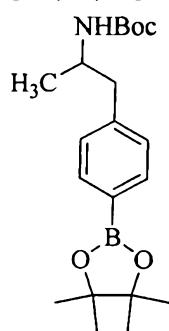


對於 1-(4-溴苯基)丙-2-酮 (5.0 g, 23.4 mmol) 於乙醇 (115 mL) 的溶液添加於甲醇 (9 N, 20.2 mL, 140 mmol) 的氫，再加入異丙氧鈦 (13.3 mL, 46.9 mmol)。將該混合物於 50 °C 加熱過夜。將燒瓶冷卻至 0 °C，分幾次添加 NaBH<sub>4</sub> (142 mg, 3.76 mmol)。攪拌 1 小時後，加入 NH<sub>4</sub>OH (2

N, 4.0 mL), 並將混合物攪拌 1 小時。濾去白色固體，並將濾液以二氯甲烷萃取。將溶劑移除，獲得的油溶於二氯甲烷 (100 mL) 並冷卻至 0 °C。將三乙胺 (4.8 mL, 35.2 mmol)、二第三丁基碳酸氫酯 (10.2 g, 46.9 mmol) 及反應混合物於室溫攪拌 18 小時。將反應混合物濃縮，並將殘渣以管柱層析純化 (二氧化矽，乙酸乙酯/己烷梯度) 以獲得所望產物 (4.2 g, 57%) 白色固體：ESI MS m/z 257 [C<sub>14</sub>H<sub>20</sub>BrNO<sub>2</sub> - 56]<sup>+</sup>。

#### 實施例 665

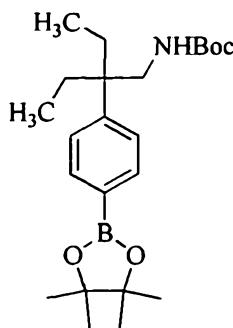
第三丁基 1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙-2-基胺基甲酸酯



依照一般程序 G，使第三丁基 1-(4-溴苯基)丙-2-基胺基甲酸酯 (8.8 g, 28.03 mmol) 與雙戊醯二硼 (10.7 g, 42.0 mmol) 反應以獲得所望產物 (10.5 g, 99%) 棕色油：ESI MS m/z 362 [C<sub>20</sub>H<sub>32</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 666

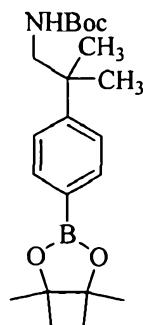
第三丁基 2-乙基-2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丁基胺基甲酸酯



對於氯化合物 (500 mg, 1.67 mmol) 於甲苯 (10 mL) 的溶液，於 0 °C 加入  $\text{BH}_3 \cdot \text{THF}$  (1.0 M 於 THF, 16 mL, 10 mmol)，將反應物回溫至室溫，並加熱回流 4 小時。將反應混合物冷確，以水淬滅，濃縮。將殘渣溶於二氯甲烷 (30 mL)，並冷卻至 0 °C。將三乙胺 (0.36 mL, 2.51 mmol)、二第三丁基碳酸氫酯 (547 mg, 2.51 mmol) 及反應混合物於室溫攪拌 18 小時。將反應混合物濃縮，並將殘渣以管柱層析純化 (二氧化矽，乙酸乙酯 / 己烷梯度) 以獲得所望產物 (480 mg, 71%) 棕色固體：ESI MS  $m/z$  404 [ $\text{C}_{23}\text{H}_{38}\text{BN}_0_4 + \text{H}]^+$ 。

### 實施例 667

第三丁基 2-甲基-2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙基氨基甲酸酯



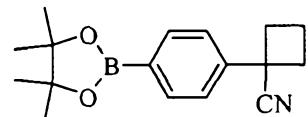
依照實施例 666 揭示的程序，使 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丙腈 (5.8 g, 21.4 mmol) 與  $\text{BH}_3 \cdot \text{THF}$  (1.0 M 於 THF, 64 mL, 64 mmol) 與二

第三丁基碳酸氫酯(7.0 g, 32.1 mmol)反應以獲得所望產物(6.9 g, 86%) 白色固體：ESI MS  $m/z$  310 [C<sub>21</sub>H<sub>34</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> - 56]<sup>+</sup>。

### 實施例 668

1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)環

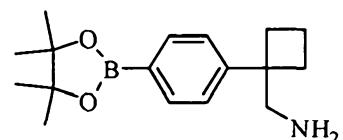
丁腈



對於 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)乙腈(7.0 g, 29 mmol)於 THF 的溶液，於 0 °C 加入 NaHMDS (1.0 M, 120 mL, 120 mmol)。攪拌 20 min 後，加入 1,3-二碘丙烷(26 g, 86 mmol)，並將反應混合物於室溫攪拌 2 小時。將反應混合物冷卻至 0 °C，以 MeOH (5.0 mL)淬滅，並將殘渣以管柱層析純化(二氧化矽，乙酸乙酯/己烷梯度)以獲得所望產物(4.0 g, 47%) 黃色油：ESI MS  $m/z$  286 [C<sub>17</sub>H<sub>22</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 669

(1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)環丁基)甲胺

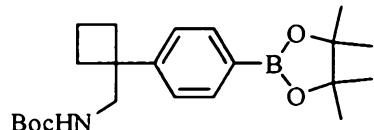


依照實施例 666 揭示的程序，使 1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)環丁腈(4.0 g, 14 mmol)與 BH<sub>3</sub> · THF (1.0 M 於 THF, 60 mL, 60 mmol)反應以

獲得所望產物 (3.7 g, 91%) 黃色油：ESI MS m/z 288  
[C<sub>17</sub>H<sub>26</sub>BN<sub>0</sub><sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 670

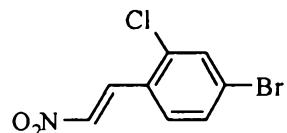
第三丁基 (1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)環丁基)甲基胺基甲酸酯



依照實施例 463 揭示的程序，使 (1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)環丁基) 甲胺 (3.7 g, 13 mmol) 與二第三丁基碳酸氫酯反應 (3.4 g, 16 mmol) 以獲得所望產物 (3.5 g, 71%) 黃色油：ESI MS m/z 388 [C<sub>22</sub>H<sub>34</sub>BN<sub>0</sub><sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 671

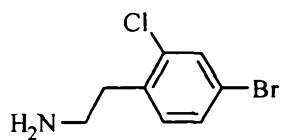
4-溴-2-氯-1-(2-硝基乙烯基)苯



對於 4-溴-2-氯苯甲醛 (7.5 g, 34 mmol) 於硝基甲烷的溶液添加甲基胺 鹽酸鹽 (1.3 g, 22 mmol)、NaOAc (1.8 g, 22 mmol)，將混合物於室溫劇烈攪拌 18 小時。將反應混合物以水 (60 mL) 稀釋，並以 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (3x100 mL) 萃取，將有機相乾燥 (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>)，蒸發以獲得所望產物 (8.5 g, 95%) 淡黃色油：ESI MS m/z 262 [C<sub>8</sub>H<sub>5</sub>BrClNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 672

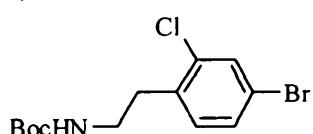
2-(4-溴-2-氯苯基)乙胺



對於已攪拌的 LiBH<sub>4</sub> (2.0 M, 73 mL, 145 mmol)於 THF (60 mL)的懸浮液，於室溫花 10 分鐘滴加氯化三甲基矽烷 (32 g, 290 mmol)。於室溫攪拌 20 min 後，對該混合物打入氮氣 5 分鐘以移除殘留的已形成三甲基矽烷。於室溫以攪拌狀態滴加 4-溴-2-氯-1-(2-硝基乙烯基)苯 (9.5 g, 36.2 mmol)於 THF (60 mL)的溶液 10 分鐘。將獲得的混合物加熱回流 1 小時。將反應混合物於冰浴冷卻，並小心地以 MeOH (100 mL)淬滅。將溶劑蒸發，並將殘渣於 20 % KOH (120 mL) 與 CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (60 mL)之間分層。將有機層乾燥、濃縮並以管柱層析純化(二氧化矽，乙酸乙酯/己烷梯度)以獲得所望產物 (8.5 g, 95%) 淡黃色油：ESI MS m/z 234 [C<sub>8</sub>H<sub>9</sub>BrClN + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 673

#### 第三丁基 4-溴-2-氯苯乙基氨基甲酸酯

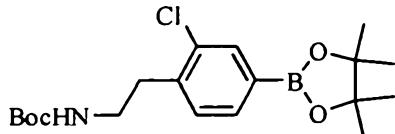


依照實施例 463 揭示的程序，使 2-(4-溴-2-氯苯基)乙胺 (7.5 g, 32 mmol)與二第三丁基碳酸氫酯 (8.3 g, 38 mmol)反應以獲得所望產物 (9.7 g, 90%) 白色固體：ESI MS m/z 334 [C<sub>13</sub>H<sub>17</sub>BrCLNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 674

#### 第三丁基 2-氯-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷

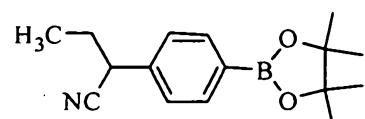
-2-基)苯乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 G，使第三丁基 4-溴-2-氯苯乙基胺基甲酸酯 (9.6 g, 30 mmol) 與雙戊醯二硼 (11 g, 45 mmol) 反應以獲得所望產物 (8.2 g, 73%) 無色油：ESI MS m/z 382 [C<sub>19</sub>H<sub>29</sub>BCLNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

實施例 675

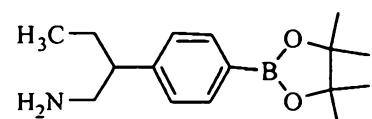
● 2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丁腈



依照實施例 649 揭示的程序，使 2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)乙腈 (5.2 g, 21 mmol) 與乙基溴 (2.6 g, 24 mmol) 反應以獲得所望產物 (3.4 g, 59%) 無色油：ESI MS m/z 272 [C<sub>16</sub>H<sub>22</sub>BNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

● 實施例 676

2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丁-1-胺

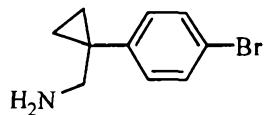


依照實施例 666 揭示的程序，使 2-(4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)丁腈 (3.4 g, 12.5 mmol) 與 BH<sub>3</sub> · THF (1.0 M 於 THF, 64 mL, 64 mmol) 反應以獲得所望產物 (3.2 g, 93%) 淡黃色油：ESI MS m/z 276

$[C_{16}H_{26}BN_0_2 + H]^+$ 。

### 實施例 677

(1-(4-溴苯基)環丙基)甲胺

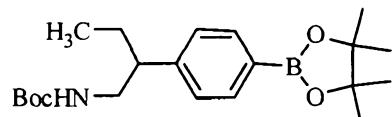


依照實施例 666 揭示的程序，使 1-(4-溴苯基)環丙腈 (2.0 g, 9.0 mmol) 與  $BH_3 \cdot THF$  (1.0 M 於 THF, 50 mL, 50 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.9 g, 94%) 黃色油：ESI MS m/z 226  $[C_{10}H_{12}BrN + H]^+$ 。

### 實施例 678

第三丁基 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丁-1-胺

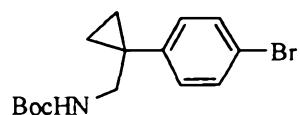
苯基)丁基胺基甲酸酯



依照實施例 463 揭示的程序，使 2-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯基)丁-1-胺 (2.9 g, 10.5 mmol) 與二第三丁基碳酸氫酯反應 (2.8 g, 12.6 mmol) 以獲得所望產物 (2.4 g, 62%) 淡黃色油：ESI MS m/z 376  $[C_{21}H_{34}BN_0_4 + H]^+$ 。

### 實施例 679

第三丁基 (1-(4-溴苯基)環丙基)甲基胺基甲酸酯

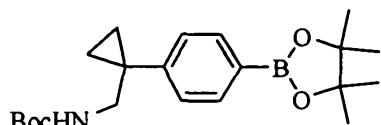


依照實施例 463 揭示的程序，使 (1-(4-溴苯基)環丙

基)甲胺 (2.2 g, 9.5 mmol) 與二第三丁基碳酸氫酯反應 (2.5 g, 12 mmol) 以獲得所望產物 (1.5 g, 52%) 黃色油： ESI MS m/z 326 [C<sub>15</sub>H<sub>20</sub>BrNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 680

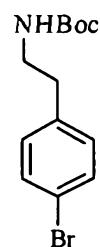
第三丁基 (1-(4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基)環丙基) 甲基胺基甲酸酯



依照一般程序 G，使第三丁基 (1-(4-溴苯基)環丙基) 甲基胺基甲酸酯 (1.3 g, 4.0 mmol) 與雙戊醯二硼 (1.55 g, 6.1 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.8 g, 60%) 無色油： ESI MS m/z 374 [C<sub>21</sub>H<sub>32</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 463

第三丁基 4-溴苯乙基胺基甲酸酯

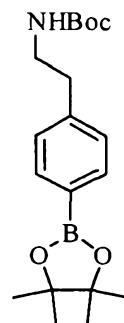


對於 2-(4-溴苯基)乙胺 (3.0 g, 15 mmol) 於二氯甲烷 (75 mL) 的溶液，於 0 °C 加入三乙基胺 (2.5 mL, 18 mmol) 及二第三丁基碳酸氫酯 (3.9 g, 18 mmol)，將反應混合物於室溫攪拌 18 小時。將反應混合物濃縮，並將殘渣以乙腈磨碎，過濾以獲得所望產物 (3.5 g, 75%) 黃色固體： ESI MS m/z 301 [C<sub>13</sub>H<sub>18</sub>BrNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 464

第三丁基 4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧杂硼烷-2-基)

苯乙基氨基甲酸酯

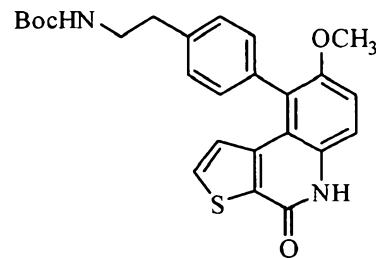


依照一般程序 G，使第三丁基 4-溴苯乙基氨基甲酸酯 (1.3 g, 4.3 mmol) 與雙戊醯二硼 (1.3 g, 5.1 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.1 g, 70%) 淡棕色固體：ESI MS m/z 348 [C<sub>19</sub>H<sub>30</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 465

第三丁基 4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]

噁唑-9-基)苯乙基氨基甲酸酯

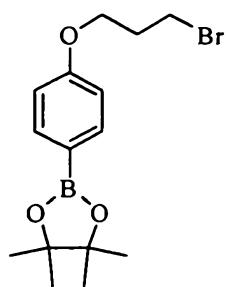


依照一般程序 B，使 9-溴-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]噁唑-4(5H)-酮 (780 mg, 2.5 mmol) 與 第三丁基 4-(4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧杂硼烷-2-基)苯乙基氨基甲酸酯 (1.5 g, 4.3 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.0 g, 90%) 棕色固體：ESI MS m/z 451 [C<sub>25</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 466

2-[4-(3-溴丙氧基)苯基]-4, 4, 5, 5-四甲基-1, 3, 2-二氧杂

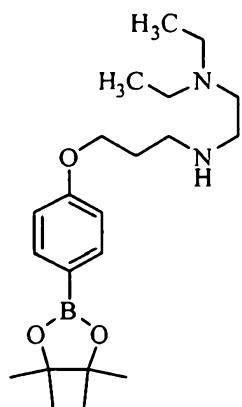
## 硼烷



對於 4-(3-溴丙氧基)苯基有機硼酸 (1.0 g, 3.9 mmol) 於二乙醚 (40 mL) 的溶液，添加頻哪醇 (1.4 g, 12 mmol)，並將反應混合物攪拌 18 小時並濃縮以獲得所望產物 (1.5 g, 粗製) 淡棕色油，其用在次一步驟而不進一步純化：ESI MS  $m/z$  247 [ $C_{15}H_{22}BBrO_3 - 94$ ]<sup>+</sup>。

## 實施例 467

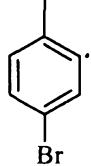
$N^1, N^1$ -二乙基- $N^2$ -{3-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯氧基]丙基}乙-1,2-二胺



將 2-[4-(3-溴丙氧基)苯基]-4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷 (500 mL, 2.02 mmol)、 $N^1, N^1$ -二乙基乙-1,2-二胺 (0.87 mL, 6.1 mmol) 及碳酸鉀 (550 mg, 4.0 mmol) 於乙腈 (15 mL) 的溶液加熱至 50 °C 達 3 小時。將反應混合物冷卻，過濾，將濾液濃縮以獲得所望產物 (400 mg, 53%) 黃色油：ESI MS  $m/z$  377 [ $C_{21}H_{37}BN_2O_3 + H$ ]<sup>+</sup>。

## 實施例 468

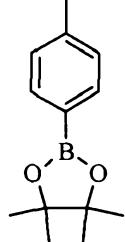
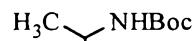
第三丁基 1-(4-溴苯基)乙基氨基甲酸酯



依照實施例 463 揭示的程序，使 1-(4-溴苯基)乙胺 (3.0 g, 15 mmol) 與二第三丁基碳酸氫酯 (3.9 g, 18 mmol) 反應以獲得所望產物 (4.2 g, 93%) 白色固體：ESI MS m/z 301 [C<sub>13</sub>H<sub>18</sub>BrNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 469

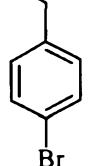
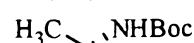
第三丁基 1-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基]乙基氨基甲酸酯



依照一般程序 G，使第三丁基 1-(4-溴苯基)乙基氨基甲酸酯 (2.2 g, 7.3 mmol) 與雙戊醯二硼 (3.9 g, 11 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.3 g, 53%) 灰白色固體：ESI MS m/z 247 [C<sub>19</sub>H<sub>30</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 470

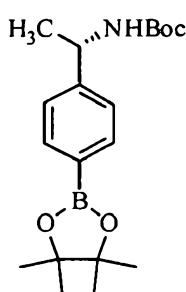
(S)-第三丁基 1-(4-溴苯基)乙基氨基甲酸酯



依照實施例 463 揭示的程序，使(S)-1-(4-溴苯基)乙胺(500 mg, 2.5 mmol)與二第三丁基碳酸氫酯(650 mg, 3.0 mmol)反應以獲得所望產物(640 mg, 82%)白色固體：ESI MS m/z 247 [C<sub>13</sub>H<sub>18</sub>BrNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 471

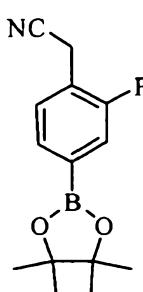
(S)-第三丁基 1-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基]乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 G，使(S)-第三丁基 1-(4-溴苯基)乙基胺基甲酸酯(630 mg, 2.1 mmol)與雙戊醯二硼(1.1 g, 3.1 mmol)反應以獲得所望產物(320 mg, 44%)棕色固體：ESI MS m/z 347 [C<sub>19</sub>H<sub>30</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> - Boc]<sup>+</sup>。

### 實施例 472

2-[2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基]乙腈

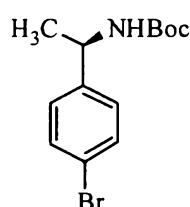


依照一般程序 G，使 2-(4-溴-2-氟苯基)乙腈(4.0 g, 19 mmol)與雙戊醯二硼(7.1 g, 28 mmol)反應以獲得所望產物(2.5 g, 57%)棕色固體：ESI MS m/z 232 [C<sub>14</sub>H<sub>17</sub>BFNO<sub>2</sub>

$+ \text{H}]^+$ 。

### 實施例 473

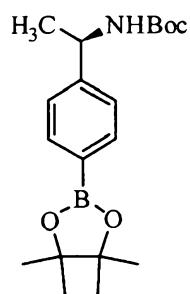
(R)-第三丁基 1-(4-溴苯基)乙基氨基甲酸酯



依照實施例 463 揭示的程序，使 (R)-1-(4-溴苯基)乙胺 (1.0 g, 5.0 mmol) 與二第三丁基碳酸氫酯 (1.3 g, 5.9 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.2 g, 86%) 灰白色固體：ESI MS m/z 301 [C<sub>13</sub>H<sub>18</sub>BrNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 474

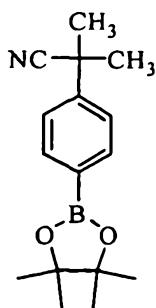
(R)-第三丁基 1-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基]乙基氨基甲酸酯



依照一般程序 G，使 (R)-第三丁基 1-(4-溴苯基)乙基氨基甲酸酯 (1.2 g, 4.0 mmol) 與雙戊醯二硼 (1.5 g, 6.0 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.0 g, 77%) 無色油：ESI MS m/z 292 [C<sub>19</sub>H<sub>30</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> - 55]<sup>+</sup>。

### 實施例 475

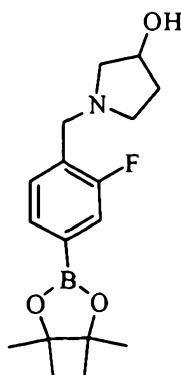
2-甲基-2-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基]丙腈



依照一般程序 G，使 2-(4-溴苯基)-2-甲基丙腈 (1.0 g, 4.5 mmol) 與雙戊醯二硼 (1.7 g, 6.7 mmol) 反應以獲得所望產物 (980 mg, 81%) 灰白色固體：ESI MS m/z 272 [C<sub>16</sub>H<sub>22</sub>BNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 476

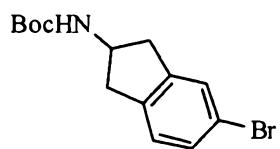
1-[2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基]吡咯啶-3-醇



將 2-[4-(溴甲基)-3-氟苯基]-4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷 (300 mg, 0.95 mmol)、吡咯啶-3-醇 (99 mg, 1.1 mmol) 及碳酸鉀 (160 mg, 1.1 mmol) 於乙腈 (5 mL) 的溶液，加熱至 50 °C 達 3 小時。將反應混合物冷卻，過濾，將濾液濃縮以獲得所望產物 (280 mg, 92%) 紅色油：ESI MS m/z 322 [C<sub>17</sub>H<sub>25</sub>BFN<sub>3</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 477

第三丁基 5-溴-2,3-二氫-1H-茚-2-基胺基甲酸酯

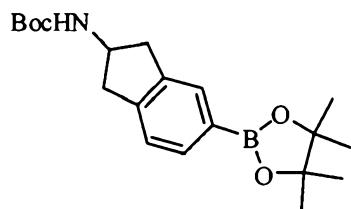


依照實施例 463 揭示的程序，使 5-溴-2,3-二氫-1H-節-2-胺 (2.5 g, 8.5 mmol) 與二第三丁基碳酸氫酯反應 (2.8 g, 13 mmol) 以獲得所望產物 (2.5 g, 96 %) 白色固體：ESI MS m/z 313 [C<sub>14</sub>H<sub>18</sub>BrNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 478

第三丁基 5-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)-2,3-二氫-

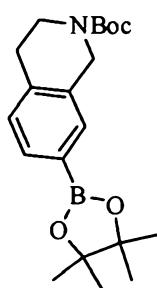
1H-節-2-基氨基甲酸酯



依照一般程序 G，使第三丁基 5-溴-2,3-二氫-1H-節-2-基氨基甲酸酯 (2.5 g, 8.0 mmol) 與雙戊醯二硼 (3.0 g, 12 mmol) 反應以獲得所望產物 (2.1 g, 72%) 無色油：ESI MS m/z 360 [C<sub>20</sub>H<sub>30</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 479

第三丁基 7-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)-3,4-二氫異噃啉-2(1H)-羧酸酯

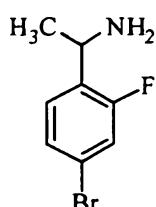


依照一般程序 G，使第三丁基 7-溴-3,4-二氫異噃啉

-2(1H)-羧酸酯 (1.3 g, 4.4 mmol) 與雙戊醯二硼 (1.7 g, 6.6 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.1 g, 72%) 無色油：ESI MS m/z 360 [C<sub>20</sub>H<sub>30</sub>BN<sub>0</sub><sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 480

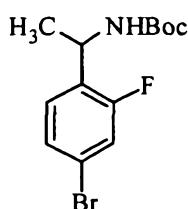
1-(4-溴-2-氟苯基)乙胺



對於 1-(4-溴-2-氟苯基)乙酮 (2.0 g, 9.2 mmol) 於甲醇 (50 mL) 的溶液添加氯 (7 N 於甲醇, 8.0 mL, 55 mmol) 及異丙氧鉄 (IV) (5.4 mL, 18 mmol)。將反應混合物於室溫攪拌 18 小時，冷卻至 0 °C，並加入硼氫化鈉 (520 mg, 14 mmol)。將反應混合物回溫至室溫，攪拌 20 min，以 2 M 氢氧化銨淬滅並過濾。將反應混合物以二氯甲烷萃取，並將合併的有機層以硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮以獲得所望產物 (1.2 g, 63%) 油：ESI MS m/z 219 [C<sub>8</sub>H<sub>9</sub>BrFN + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 481

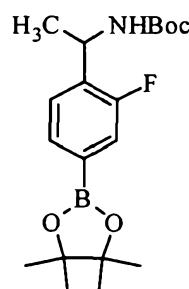
第三丁基 1-(4-溴-2-氟苯基)乙基胺基甲酸酯



依照實施例 463 揭示的程序，使 1-(4-溴-2-氟苯基)乙胺 (1.2 g, 5.6 mmol) 與二第三丁基碳酸氫酯反應 (1.4 g, 6.7 mmol) 以獲得所望產物 (1.3 g, 73%) 白色固體：ESI MS m/z 219 [C<sub>13</sub>H<sub>17</sub>BrFN<sub>0</sub><sub>2</sub> + H - 100]<sup>+</sup>。

## 實施例 482

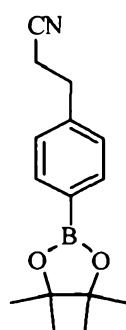
第三丁基 1-[2-氟-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基]乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 G，使第三丁基 1-(4-溴-2-氟苯基)乙基胺基甲酸酯 (1.3 g, 4.4 mmol) 與雙戊醯二硼 (1.7 g, 6.6 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.5 g, 93%) 白色固體：ESI MS m/z 266 [C<sub>19</sub>H<sub>29</sub>BFNO<sub>4</sub> + H - 100]<sup>+</sup>。

## 實施例 483

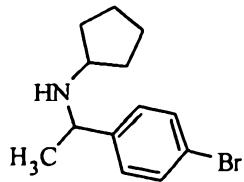
3-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基]丙腈



依照一般程序 G，使 3-(4-溴苯基)丙腈 (1.0 g, 4.8 mmol) 與雙戊醯二硼 (1.8 g, 7.1 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.1 g, 97%) 淡棕色固體：ESI MS m/z 258 [C<sub>15</sub>H<sub>20</sub>BNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 484

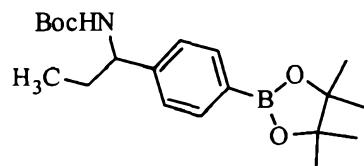
N-(1-[4-溴苯基]乙基)環戊胺



對於 1-(4-溴苯基)乙酮 (500 mg, 2.5 mmol) 於乙醇 (16 mL) 的溶液添加環戊胺 (320 mg, 3.8 mmol)，將反應混合物於 50 °C 加熱 18 小時。將反應混合物冷卻至 0 °C，添加硼氫化鈉 (140 mg, 3.8 mmol)，並將反應混合物回溫至室溫並攪拌 30 min。將反應混合物以 2 M 氨氧化銨水溶液淬滅，以二氯甲烷萃取。將合併的有機層以硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮以獲得所望產物 (600 mg, 90%) 紅色油：ESI MS m/z 269 [C<sub>13</sub>H<sub>18</sub>BrN + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 485

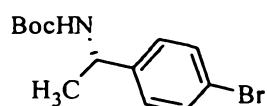
第三丁基 1-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基]丙基胺基甲酸酯



依照一般程序 G，使第三丁基 1-(4-溴苯基)丙基胺基甲酸酯 (2.0 g, 6.4 mmol) 與雙戊醯二硼 (2.4 g, 9.6 mmol) 反應以獲得所望產物 (2.1 g, 93%) 黃色固體：ESI MS m/z 305 [C<sub>20</sub>H<sub>32</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> - 56]<sup>+</sup>。

#### 實施例 486

(S)-第三丁基 1-(4-溴苯基)乙基胺基甲酸酯

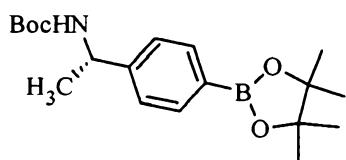


依照實施例 463 揭示的程序，使 (S)-1-(4-溴苯基)

乙胺 (1.0 g, 5.0 mmol) 與二第三丁基碳酸氫酯反應 (1.3 g, 6.0 mmol) 以獲得所望產物 (1.3 g, 88%) 白色固體：ESI MS m/z 300 [C<sub>13</sub>H<sub>18</sub>BrNO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 487

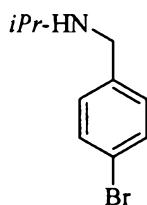
(S)-第三丁基 1-[4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)苯基]乙基胺基甲酸酯



依照一般程序 G，使 (S)-第三丁基 1-(4-溴苯基)乙基胺基甲酸酯 (1.3 g, 4.4 mmol) 與雙戊醯二硼反應 (1.7 g, 6.6 mmol) 以獲得所望產物 (1.4 g, 96%) 棕色固體：ESI MS m/z 348 [C<sub>19</sub>H<sub>30</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 488

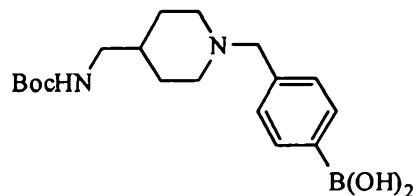
N-(4-溴苄基)丙-2-胺



將 1-溴-4-(溴甲基)苯 (2.0 g, 8.0 mmol)、異丙基胺 (950 mg, 16 mmol) 及碳酸鉀 (2.2 g, 16 mmol) 於乙腈 (40 mL) 的溶液，於室溫攪拌 18 小時。將反應混合物以水淬滅，以乙酸乙酯萃取。將合併的有機層以鹵水洗滌，以無水硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將殘渣以管柱層析精製 (二氧化矽，0 - 100% 二氯甲烷/甲醇) 以獲得所望產物 (1.4 g, 78%) 棕色固體：ESI MS m/z 228 [C<sub>10</sub>H<sub>14</sub>BrN + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 489

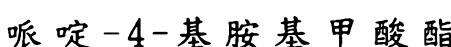
4-( {4-[ (第三丁氧基羧基胺基) 甲基 ] 味啶-1-基 } 甲基 ) 苯基有機硼酸



依照實施例 488 揭示的程序，使 4-甲醯基苯基有機硼酸 (100 mg, 0.47 mmol) 與第三丁基 味啶-4-基甲基胺基甲酸酯 (70 mg, 0.47 mmol) 反應以獲得所望產物 (120 mg, 77%) 棕色固體：ESI MS m/z 349 [C<sub>18</sub>H<sub>29</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 490

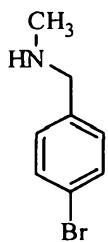
(E)-第三丁基 1-[3-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)烯丙基] 味啶-4-基胺基甲酸酯



依照實施例 488 揭示的程序，使 (Z)-2-(3-氯丙-1-烯基)-4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷 (210 mg, 1.1 mmol) 與第三丁基 味啶-4-基胺基甲酸酯反應 (640 mg, 3.2 mmol) 以獲得所望產物 (100 mg, 30%) 棕色固體：ESI MS m/z 367 [C<sub>14</sub>H<sub>27</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 491

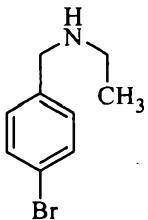
1-(4-溴苯基)-N-甲基甲胺



依照實施例 488 揭示的程序，使 1-溴-4-(溴甲基)苯 (1.0 g, 4.0 mmol) 與甲胺 (620 mg, 20 mmol) 反應以獲得所望產物 (750 mg, 93%) 棕色固體：ESI MS m/z 201 [C<sub>8</sub>H<sub>10</sub>BrN + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 492

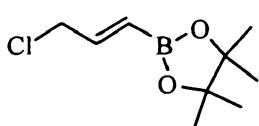
#### N-(4-溴苄基)乙胺



依照實施例 488 揭示的程序，使 1-溴-4-(溴甲基)苯 (2.0 g, 8.0 mmol) 與乙胺 (720 mg, 16 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.3 g, 75%) 棕色固體：ESI MS m/z 215 [C<sub>9</sub>H<sub>12</sub>BrN + H]<sup>+</sup>。

### 實施例 493

#### (E)-2-(3-氯丙-1-烯基)-4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷



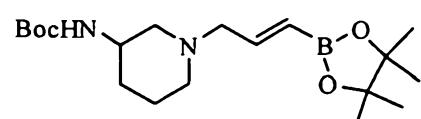
將 (E)-3-氯丙-1-烯基有機硼酸 (5 g, 41 mmol)、頻哪醇 (4.9 g, 41 mmol) 及硫酸鎂 (15 g, 120 mmol) 於二氯甲烷 (100 mL) 的溶液於室溫攪拌 18 小時。將反應混合物經過二氧化矽凝膠過濾，將濾餅以二氯甲烷洗滌。將濾

液濃縮以獲得所望產物(4.8 g, 60%) 無色油：ESI MS m/z 203 [C<sub>9</sub>H<sub>16</sub>BClO<sub>2</sub> + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 494

(E)-第三丁基 1-[3-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷-2-基)烯丙基]

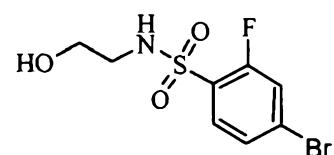
哌啶-3-基胺基甲酸酯



依照實施例 488 揭示的程序，使(E)-2-(3-氯丙-1-烯基)-4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧雜硼烷(500 mg, 2.5 mmol)與第三丁基 哌啶-3-基胺基甲酸酯(740 mg, 3.7 mmol)反應以獲得所望產物(320 mg, 24%) 黃色油：ESI MS m/z 367 [C<sub>19</sub>H<sub>35</sub>BN<sub>2</sub>O<sub>4</sub> + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 495

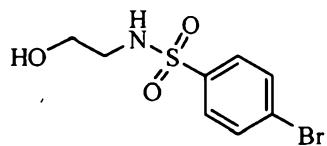
4-溴-2-氟-N-(2-羥基乙基)苯磺醯胺



對於 2-胺基乙醇(0.24 mL, 4.0 mmol)及三乙基胺(1.5 mL, 11 mmol)於無水 THF(15 mL)的溶液分部添加4-溴-2-氟苯-1-磺醯氯(1.0 g, 3.7 mmol)，將反應混合物於室溫攪拌16小時。將反應物過濾，將濾液濃縮並將殘渣以管柱層析純化(二氧化矽，乙酸乙酯/己烷梯度)以獲得所望產物(850 mg, 77%)：ESI MS m/z 298 [C<sub>8</sub>H<sub>9</sub>BrFNO<sub>3</sub>S + H]<sup>+</sup>。

## 實施例 496

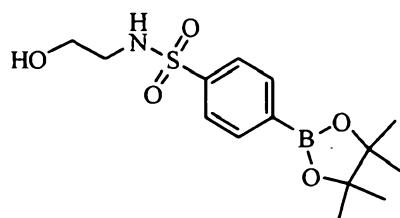
4-溴-N-(2-羥基乙基)苯磺醯胺



對於 2-胺基乙醇 (2.3 mL, 39 mmol) 及三乙基胺 (16 mL, 120 mmol) 於無水 THF (100 mL) 的溶液分部添加 4-溴苯-1-磺醯氯 (10 g, 39 mmol)，將反應混合物於室溫攪拌 16 小時。將反應物過濾，將濾液濃縮，將殘渣以管柱層析純化(二氧化矽，乙酸乙酯/己烷梯度)以獲得所望產物 (5.5 g, 50%)：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7.74 (td, J = 9.0, 2.1 Hz, 2H), 7.67 (td, J = 9.0, 2.1 Hz, 2H), 5.08 (s, 1H), 3.72 (t, J = 5.1 Hz, 2H), 3.12 (t, J = 4.8 Hz, 2H), 1.83 (s, 1H)。

## 實施例 497

N-(2-羥基乙基)-4-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氫雜硼烷-2-基)苯磺醯胺



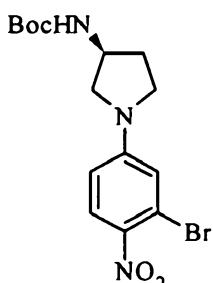
依照一般程序 G，使 4-溴-N-(2-羥基乙基)苯磺醯胺 (5.0 g, 18 mmol) 與雙戊醯二硼 (4.9 g, 20 mmol) 反應以獲得所望產物 (4.2 g, 40%) 黃色固體：<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7.95 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.85 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 5.14 (t, J = 6.1 Hz, 1H), 3.68 (t, J = 5.0

Hz, 2H), 3.09 (q,  $J = 5.4$  Hz, 2H), 1.36 (s, 12H)。

### 實施例 498

(S)-第三丁基 1-(3-溴-4-硝基苯基)吡咯啶-3-基胺基

甲酸酯

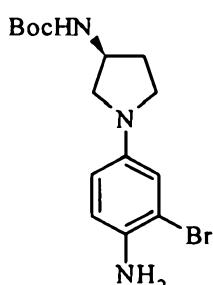


將 2-溴-4-氟-1-硝基苯 (1.5 g, 6.8 mmol)、(S)-第三丁基 吡咯啶-3-基胺基甲酸酯 (1.9 g, 10 mmol) 及碳酸氫鈉 (1.7 g, 20 mmol) 於 DMSO (40 mL) 的溶液，於 80 °C 加熱 1 小時。將反應混合物冷卻至室溫，倒進過量的水，將獲得的沉澱過濾。將固體以氯化銨水溶液、鹵水及水洗滌以獲得所望產物 (2.5 g, 96%) 黃色固體：  
 $[C_{15}H_{20}BrN_3O_4 + H]^+$ 。

### 實施例 499

(S)-第三丁基 1-(4-胺基-3-溴苯基)吡咯啶-3-基胺基

甲酸酯

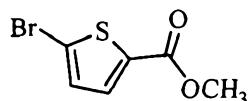


將 (S)-第三丁基 1-(3-溴-4-硝基苯基)吡咯啶-3-基胺基甲酸酯 (2.5 g, 6.5 mmol)、氯化銨 (380 mg, 7.1 mmol) 及鐵 (1.8 g, 32 mmol) 於乙醇 (20 mL) 與水 (10 mL) 的溶液

加熱回流 1 小時。將反應混合物冷卻至室溫，經由矽藻土過濾。將濾液濃縮以獲得所望產物 (2.3 g, >99%) 藍色固體：ESI MS  $m/z$  357 [ $C_{15}H_{22}BrN_3O_2 + H$ ]<sup>+</sup>。

### 實施例 500

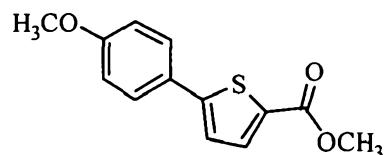
#### 甲基 5-溴 噻吩-2-羧酸酯



將 5-溴 噻吩-2-羧酸 (5.0 g, 24 mmol)、甲基碘 (5.1 g, 30 mmol) 及碳酸鉀 (6.7 g, 48 mmol) 於 DMF (50 mL) 的溶液，於室溫攪拌 64 小時。將反應物以水淬滅，將水層以乙酸乙酯萃取多次。將合併的有機層以氯化鋰水溶液及鹹水洗滌，以無水硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮。將殘渣以管柱層析純化 (二氧化矽，乙酸乙酯 / 己烷梯度) 以獲得所望產物 (4.2 g, 79%)：<sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  7.54 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 3.87 (s, 3H)。

### 實施例 501

#### 甲基 5-(4-甲氧基苯基)噻吩-2-羧酸酯

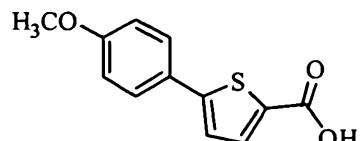


依照一般程序 B，使 4-甲氧基苯基有機硼酸 (2.7 g, 18 mmol) 與 甲基 5-溴 噻吩-2-羧酸酯 (2.0 g, 9.0 mmol) 反應以獲得所望產物 (1.4 g, 61%)：<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  7.71 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 9.7, 2.5

Hz, 2H), 7.14 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 6.89 (td, J = 9.7, 2.5 Hz, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.80 (s, 3H)。

#### 實施例 502

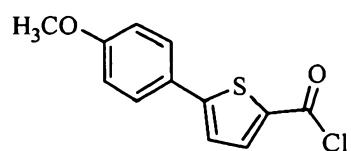
5-(4-甲氧基苯基)噻吩-2-羧酸



將甲基 5-(4-甲氧基苯基)噻吩-2-羧酸酯 (1.4 g, 5.6 mmol) 及 1 M 氫氧化鈉 (55 mL) 於甲醇 (55 mL) 的溶液於 80 °C 加熱 18 小時。將反應混合物冷卻至室溫，以乙酸乙酯稀釋。將有機層以 1 N 鹽酸及氯化鈉水溶液洗滌，以無水硫酸鈉乾燥，過濾並濃縮以獲得所望產物 (1.2 g, 93%) 灰白色固體：ESI MS m/z 325 [C<sub>12</sub>H<sub>10</sub>O<sub>3</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 503

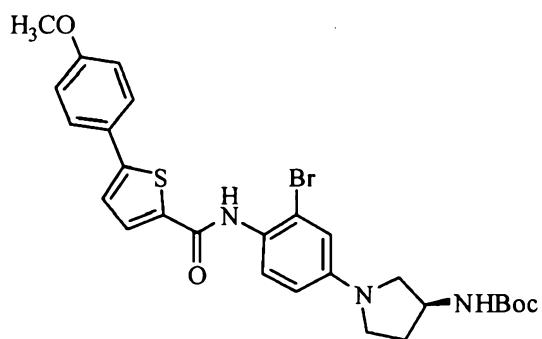
5-(4-甲氧基苯基)噻吩-2-羰基氯



對於 5-(4-甲氧基苯基)噻吩-2-羧酸 (0.60 g, 2.5 mmol) 於甲苯 (4 mL) 的溶液加入亞硫醯氯 (560 mL, 7.7 mmol)，將反應混合物於 100 °C 加熱 18 小時。將反應混合物冷卻至室溫並過濾以獲得所望產物 (642 mg, crude)：ESI MS m/z 253 [C<sub>12</sub>H<sub>9</sub>ClO<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 504

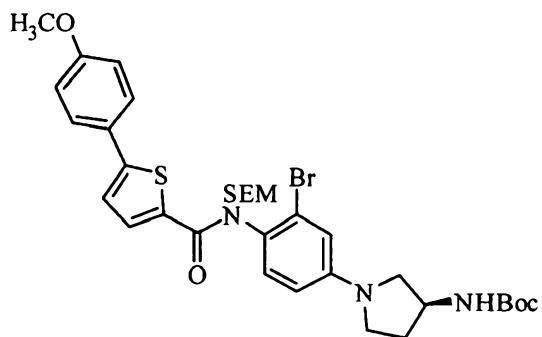
(S)-第三丁基 1-{3-溴-4-[5-(4-甲氧基苯基)噻吩-2-羧醯胺基苯基}吡咯啶-3-基胺基甲酸酯



依照一般程序 A 的步驟 1，使 5-(4-甲氧基苯基)噻吩-2-羧基氯 (640 mg, 2.5 mmol) 與 (S)-第三丁基 1-(4-胺基-3-溴苯基)吡咯啶-3-基胺基甲酸酯 (800 mg, 2.2 mmol) 反應以獲得所望產物 (500 mg, 39%) 淡黃色固體：ESI MS m/z 573 [C<sub>27</sub>H<sub>30</sub>BrN<sub>3</sub>O<sub>4</sub>S + H]<sup>+</sup>。

#### 實施例 505

(S)-第三丁基 1-{3-溴-4-[5-(4-甲氧基苯基)-N-{[2-(三甲基矽基)乙氧基]甲基}噻吩-2-羧醯胺基]苯基}吡咯啶-3-基胺基甲酸酯

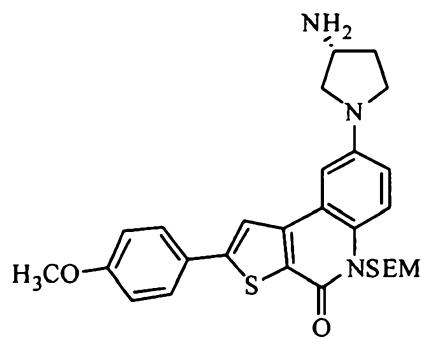


將 (S)-第三丁基 1-{3-溴-4-[5-(4-甲氧基苯基)噻吩-2-羧醯胺基]苯基}吡咯啶-3-基胺基甲酸酯 (400 mg, 0.69 mmol) 於 THF (20 mL) 的溶液冷卻至 0 °C，加入氫化鈉 (60 wt %, 140 mg, 3.5 mmol)。將反應物回溫至室溫，再加入 2-(三甲基矽基)乙氧基甲基氯 (370 mL, 2.1 mmol)，將反應混合物於室溫攪拌 18 小時。將反應混合物

以水淬滅，以乙酸乙酯稀釋。將層體分離，將有機層以無水硫酸鈉乾燥，過濾、濃縮，將殘渣以管柱層析純化(二氧化矽，0 - 30% 乙酸乙酯/庚烷)，獲得所望產物(400 mg, 87%)：ESI MS  $m/z$  703 [ $C_{33}H_{44}BrN_3O_5SSi + H$ ]<sup>+</sup>。

### 實施例 506

(S)-8-(3-胺基吡咯啶-1-基)-2-(4-甲氧基苯基)-5-{[2-(三甲基矽基)乙氧基]甲基}噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

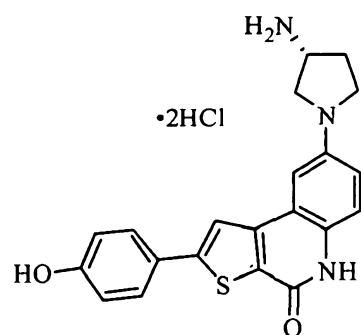


依照一般程序 A 的步驟 3，使(S)-第三丁基 1-{3-溴-4-[5-(4-甲氧基苯基)-N-{[2-(三甲基矽基)乙氧基]甲基}噁吩-2-羧醯胺基]苯基}吡咯啶-3-基胺基甲酸酯(210 mg, 0.29 mmol)與雙(三-第三丁基膦)鉑(15 mg, 0.029 mmol)反應，獲得所望產物(25 mg, 14%)：ESI MS  $m/z$  622 [ $C_{28}H_{35}N_3O_3SSi + H$ ]<sup>+</sup>。

### 實施例 51

(S)-8-(3-胺基吡咯啶-1-基)-2-(4-羥基苯基)噁吩并[2,3-c]

喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 F，使 (S)-8-(3-胺基吡咯啶-1-基)-2-(4-甲氧基苯基)-5-{[2-(三甲基矽基)乙氧基]甲基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮 (25 mg, 0.040 mmol)與三溴硼烷 (38 mL, 0.40 mmol)反應，獲得所望產物 (6.4 mg, 43%) 黃綠色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  8.06 (s, 1H), 7.71 (d,  $J = 8.6$  Hz, 2H), 7.36 (d,  $J = 9.0$  Hz, 1H), 7.26 (s, 1H), 6.99 (d,  $J = 8.4$  Hz, 1H), 6.90 (d,  $J = 8.5$  Hz, 2H), 4.09 (s, 1H), 3.74 - 3.69 (m, 2H), 3.59 - 3.57 (m, 1H), 3.48 - 3.39 (m, 1H), 2.57 - 2.52 (m, 1H), 2.25 - 2.23 (m, 1H); ESI MS  $m/z$  378 [ $\text{C}_{21}\text{H}_{19}\text{N}_3\text{O}_2\text{S} + \text{H}]^+$ ; HPLC 97.1% (AUC),  $t_{\text{R}} = 10.89$  min.

未特別在以上實施例中敘述的以特定程序製造之本發明化合物，也可參照上述製造本發明化合物、實施例等的一般程序，以相似或類同的方法合成。

### 實施例 507

#### 激酶分析法

PBK 活性係在存在或不存在化合物之下，使用螢光異硫氰酸鹽標定的(經 FITC 標定)的組蛋白 H3 胜肽當成受質來確認。經 FITC 標定的組蛋白 H3 胜肽的磷酸化程度，由固定化金屬離子親和性系螢光極化(IMAP)技術(Sportsman

JR, et al., Assay Drug Dev. Technol. 2: 205-14, 2004), 使用 IMAP FP 累進結合系統(Progressive Binding System) (Molecular Devices Corporation)測定。將受測化合物溶於 DMSO 成為 12.5 mM, 然後系列稀釋使 DMSO 濃度在該分析法中成為 1%。將系列稀釋的化合物、0.8 ng/micro-L PBK (Carna Biosciences)及 100 nM 經 FITC 標定的組蛋白 H3 胜肽在反應緩衝液(20 mM HEPES, 0.01% Tween-20, 0.3 mM MgCl<sub>2</sub>, 2 mM 二硫蘇糖醇、50 micro-M ATP, pH 7.4)室溫反應 1 小時。反應藉由添加 3 倍體積的累進結合溶液中止。於室溫溫育 0.5 小時後, 以 Wallac EnVision 2103 多標籤讀取儀(PerkinElmer)測定螢光極化。IC<sub>50</sub> 值係藉由使用 SigmaPlot 第 10.0 版 10.0 (Systat Software, Inc.), 以非線性四參數擬合計算。

本發明的典型化合物的 IC<sub>50</sub> 值如下表 2 所示：

表 2

識別號	化合物	IC <sub>50</sub> (microM) (激酶分析)
51	(S)-8-(3-胺基呡咯啶-1-基)-2-(4-羥基苯基)噁吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮 二鹽酸鹽	0.078
61	8-羥基-9-(1H-吲唑-6-基)噁吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.0035
65	4-(8-羥基-4-側氧基-4, 5-二氫噁吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯礦醯胺	0.0018
72	9-[4-(胺基甲基)苯基]-8-羥基噁吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.00063
73	9-[4-(胺基甲基)苯基]-8-羥基噁吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.00038

77	<i>N</i> -[4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苯基]甲烷磺酰胺	0.0026
81	2-[4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苯基]乙腈	0.012
84	8-羟基-9-(1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.00078
93	9-{4-[2-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.0054
95	9-[4-(胺基甲基)苯基]-8-羟基-2-甲基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.0044
112	8-羟基-9-{4-[4-(甲基磺酰基)哌啶-1-基]苯基}噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.012
139	第三丁基{1-[4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苄基]哌啶-4-基}甲基胺基甲酸酯	0.0094
145	9-(4-{3-[2-(二乙基胺基)乙基胺基]丙氧基}苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.047
152	(E)-9-[3-(4-胺基哌啶-1-基)丙-1-烯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.031
164	9-{4-[(二甲基胺基)甲基]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.011
165	9-{4-[(二甲基胺基)甲基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.0069
169	9-[4-(2-胺基乙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.022
175	9-[4-(2-胺基乙基)苯基]-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.0012
176	9-[4-(2-胺基乙基)苯基]-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0011
184	9-{4-[(二乙基胺基)甲基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.0077

187	8-羟基-9-{4-[(甲基胺基)甲基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.0009
188	8-甲氧基-9-{4-[(甲基胺基)甲基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.0078
192	9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0016
191	9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.0019
193	N-[1-[4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]乙基]甲烷磺酰胺	0.0037
194	8-羟基-9-{4-[1-(吡咯啶-1-基)乙基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0028
195	9-[4-(1-氨基乙基)苯基]-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.00073
196	9-{4-[1-(二乙基胺基)乙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0045
210	N-(2-溴乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺	0.0113
212	N-[4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基]甲烷磺酰胺	0.0055
216	8-甲氧基-9-{4-[1-(吡咯啶-1-基)乙基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.021
217	9-(4-氨基-3-羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0023
222	9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.082
225	9-{4-[2-(二甲基胺基)乙基]苯基}-6-氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.023
229	8-羟基-9-{4-[(异丙基胺基)甲基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0042

232	(S)-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0074
233	(S)-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.00081
235	9-(4-{[4-(胺基甲基)哌啶-1-基]甲基}-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.00057
254	N-[4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)-2-甲基苯基]甲烷磺醯胺	0.003
256	9-[4-(胺基甲基)苯基]-6-氟-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0025
257	9-[4-(胺基甲基)苯基]-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.026
261	2-[2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基]乙腈	0.015
262	8-羟基-9-{4-[1-(哌啶-1-基)乙基]苯基}噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0043
265	9-[4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基]-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0038
266	9-[5-(胺基甲基)噻吩-2-基]-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.00078
267	9-{4-[(乙基胺基)甲基]苯基}-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.002
269	9-{4-[(乙基胺基)甲基]苯基}-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.006
270	9-[4-(胺基甲基)苯基]-6-溴-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.031
272	(R)-9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.00088
273	9-[4-(3-胺基丙基)苯基]-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.00074
274	(R)-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0038

275	(R)-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.00054
276	9-[4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基]-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0005
277	9-[4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基]-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.00067
278	9-{3-氟-4-[(3-羟基吡咯啶-1-基)甲基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.00097
290	3-[4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苯基]丙腈	0.0032
296	9-(4-乙酰基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.023
297	N-(2-溴乙基)-2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苯磺酰胺	0.013
298	9-{3-[3-(二甲基胺基)哌啶-1-基]丙基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮二盐酸盐	0.083
301	(R)-N-{1-[4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苯基]乙基}甲烷磺酰胺	0.0032
304	4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)-N,N-二甲基苯磺酰胺	0.045
308	9-{4-[1-(二甲基胺基)-2-甲基丙-2-基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0028
313	8-羟基-9-[4-(1-羟基乙基)苯基]噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.002
314	9-{4-[1-(环戊基胺基)乙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0028
319	9-[4-(2-胺基丙-2-基)苯基]-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.00043
326	9-[4-(胺基甲基)苯基]-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-8-腈盐酸盐	0.013

327	9-{4-[2-(二甲基胺基)乙基]-3-氟苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0019
329	9-[4-(氨基甲基)苯基]-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.016
332	<i>N</i> -(2-氯乙基)-4-(8-羟基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苯磺酰胺	0.023
333	<i>N</i> -(2-氯乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苯磺酰胺	0.031
334	9-[4-(2-氨基丙-2-基)苯基]-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.01
335	( <i>S</i> )-9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0029
336	9-[4-(1-氨基丙基)苯基]-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.00082
337	9-[4-(1-氨基丙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0052
338	9-{4-[1-(二乙基胺基)丙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0037
339	9-{4-[1-(二甲基胺基)丙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0019
341	9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-6,7-二氟-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.034
345	9-(2-氨基-2,3-二氢-1 <i>H</i> -茚-5-基)-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0012
346	9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.0092
347	( <i>S</i> )- <i>N</i> {1-[4-(8-羟基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苯基]乙基}甲烷磺酰胺	0.002
348	9-{4-[1-(氨基甲基)环丙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0019
349	9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]-3-氟苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0019

353	8-羟基-9-(1, 2, 3, 4-四氟异喹啉-7-基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.002
356	9-{4-[1-(二乙基氨基)乙基]-3-氟苯基}-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0036
359	9-[4-(1-氨基乙基)-3-氟苯基]-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.00092
361	1-[4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氟噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基]环丙腈	0.032
373	9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0032
379	9-(4-(1-((二甲基氨基)甲基)环丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0036
385	9-(4-(1-(乙基氨基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0039
1032	9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.047
1041	9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.012
1052	(R)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基氨基)乙基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0013
1062	N-(1-溴丙-2-基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氟噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺	0.031
1064	(S)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基氨基)乙基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0025
1066	9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.012
1077	9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-4-侧氨基-4, 5-二氟噻吩并[2, 3-c]喹啉-8-基 羟丙基碳酸酯盐酸盐	0.076
1081	(R)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0086
1082	(S)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基氨基)乙基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0011

1087	(S)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.019
1088	9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.016
1094	N-(2-溴乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-2,3,4,5-四氢-1H-环戊[c]喹啉-9-基)苯磺酰胺	0.01
1095	9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0013
1099	9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基乙酸酯盐酸盐	0.033
1106	9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.041
1111	9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0013
1112	9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0033
1116	9-(4-(1-(胺基甲基)环丙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.022
1120	(S)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.00088
1121	(S)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0029
1122	(R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0059
1123	(R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.033
1126	(R)-6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.042
1127	(S)-9-(4-(1-(乙基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0014

1128	(S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0022
1131	(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并 [2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0013
1132	(R)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯 基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.014
1133	9-(4-(2-氨基乙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并 [2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.02
1135	(R)-6-溴-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯 基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.03
1136	9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩 并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0086
1139	N-(2-氯乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二 氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺	0.07
1142	9-(4-(2-氨基乙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并 [2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.045
1145	N-(2-氯乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-2,3,4,5-四 氢-1H-环戊[c]喹啉-9-基)苯磺酰胺	0.013
1148	(S)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙基)苯基)噻 吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0013
1150	(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻 吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.047
1151	(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-羟基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0025
1154	(S)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙基)苯 基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0094
1157	(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.018
1159	(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻 吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.026
1160	(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩 并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.00064

1161	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.002
1162	2-(4-(8-羟基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丁腈	0.013
1163	(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0013
1165	6-氯-8-羟基-9-(4-(2-(甲基氨基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.058
1166	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0044
1168	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0026
1169	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮氫溴酸鹽	0.0089
1172	(S)-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.004
1174	9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0015
1176	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.017
1179	9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.003
1181	(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.033
1187	(R)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基氨基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0013
1188	(R)-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0025
1189	(R)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基氨基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.003
1190	9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0051

1191	9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.019
1193	9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.046
1197	(S)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0028
1201	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.02
1204	N-(1-氯丙-2-基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺	0.015
1209	9-(4-(3-(胺基甲基)戊n-3-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0018
1212	9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.016
1213	9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.019
1215	(S)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.06
1216	9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.057
1217	9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0047
1218	9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.087
1219	9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0055
1224	9-(4-(2-胺基乙基)-2-溴-5-羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.0064
1225	(S)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.016

1226	3-(4-(8-羟基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈	0.092
1228	9-(4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.039
1232	(S)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.016
1236	9-(4-(2-氨基-1-环戊基乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.0046
1239	9-(4-(2-氨基-1-环戊基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.023
1242	9-(4-(2-氨基丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.037
1245	6-溴-9-(3-氟-4-(2-(甲基氨基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.045
1247	9-(4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.072
1251	9-(4-(1-(氨基甲基)环丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.055
1252	9-(4-(1-氨基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.0014
1253	9-(4-(1-氨基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0041
1254	9-(4-(1-(氨基甲基)环丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0096
1258	9-(3-氟-4-(2-(甲基氨基)乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.025
1260	9-(4-(1-氨基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.075
1262	(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(氨基甲基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.012
1263	9-(4-(2-氨基乙基)-3-氯苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.033

1264	9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯基)-8-羟基-6-甲基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.003
1265	(R)-8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙 基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.067
1268	9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯基)-6-氯-8-羟基噻 吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0039
1271	9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)-3-氯苯基)-8- 羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.001
1273	9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-甲氧基 -6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.04
1274	9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-羟基 -6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.018
1277	9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.063
1278	9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)-3-氯苯基)-8- 羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸 盐	0.022
1280	9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-羟基噻吩 并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.01
1283	9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)-3-氯苯基)-8- 甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐 酸盐	0.047
1285	8-羟基-6-甲基-9-(4-(3-甲基-1-(甲基胺基)丁 -2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.05
1286	9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-甲 氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸 盐	0.043
1288	9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)-3-氯苯基)-8- 羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.02
1290	9-(4-(1-(胺基甲基)环丁基)苯基)-8-羟基-6- 甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.01

1291	9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.015
1293	9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.0089
1294	9-(3-氟-4-(3-甲基-1-(甲基胺基)丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.017
1297	9-(4-(1-(胺基甲基)环丁基)苯基)-8-甲氨基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.035
1298	(R)-8-甲氨基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.032
1300	9-(4-(1-(胺基甲基)环丁基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0017
1302	8-羟基-6-甲基-9-(4-(哌啶-3-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.075
1303	(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.014
1304	(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮溴氨酸盐	0.013
1305	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氨基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.015
1306	(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0073
1307	(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮溴氨酸盐	0.018
1309	9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.00074
1310	(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氨基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.054

1311	(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.017
1312	9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-6-氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.019
1315	(R)-9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0081
1316	(R)-9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.033
1317	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.022
1318	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0036
1319	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮氯溴酸盐	0.0034
1321	9-(4-(1-(胺基甲基)环丁基)苯基)-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.096
1324	(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.032
1330	9-(4-(2-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0083
1340	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-2,6-二甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.012
1341	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-2,6-二甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.038
1347	(R)-6-氟-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.043

1352	(R)-9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.04
1353	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-2-氯-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.004
1354	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-2-氯-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.011
1364	8-羟基-6-甲基-9-(4-(2-(甲基氨基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.055
1372	9-(4-(1-((二甲基氨基)甲基)环丁基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.042
1375	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-2-氯-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.022
1379	(R)-9-(4-(1-(乙基(甲基)氨基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.076
1380	(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基氨基)丁-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.085
1383	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-2-氯-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0037
1391	9-(4-(1-(胺基甲基)环丙基)苯基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.07
1399	(S)-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.058
1400	9-(4-((2-胺基乙基)(甲基)氨基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.06
1401	9-(4-(1-(胺基甲基)环丙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.051
1419	2-(4-(8-羟基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙烷-1-磺酰胺	0.082

## 實施例 508

## 西方墨點分析

為了評估 PBK 於數個細胞株中的表現狀態，使用由此等細胞收集的粗製細胞溶解物實施西方墨點分析。使用抗 PBK 抗體(選殖體 31，BD Biosciences)觀察其表現。乳癌細胞株，T47D 與 BT-549，顯著表現 PBK，而膀胱癌細胞株與 HT-1197 未表現 PBK。

### 實施例 509

#### 細胞分析

使用 T47D、A549、BT-549 評估對抗 PBK 的活性抑制劑候選物的標靶專一性細胞毒性，並使用 HT-1197 細胞當成負對照。將 100 micro-L 細胞懸浮液接種於 96 井微滴定盤(ViewPlate-96FTC, PerkinElmer)上。T47D、BT-549 及 HT-1197 的起始細胞濃度各為 3,000 細胞/井、2,000 細胞/井，及 2,500 細胞/井。使用 Cell Counting Kit-8 (DOJINDO)，於暴露於抑制劑候選物後 72 小時確認細胞生長。以 IC<sub>50</sub> 當做抑制劑的抗增殖活性的指標，並且利用系列稀釋法計算 (0、1.5625、3.125、6.25、12.5、25、50 及 100 micro-M) IC<sub>50</sub>。正確的 IC<sub>50</sub> 值係如上述計算。本發明的典型化合物的 IC<sub>50</sub> 值，如下表 3 所示：

表 3-1；

識別號	化合物	IC <sub>50</sub> (microM) (BT549)	IC <sub>50</sub> (microM) (T47D)	IC <sub>50</sub> (microM) (A549)	IC <sub>50</sub> (microM) (HT1197)
-----	-----	---	--	--	--

51	(S)-8-(3-胺基吡咯啶-1-基)-2-(4-羟基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮二盐酸盐	14	2.1	21	62
61	8-羟基-9-(1H-吲哚-6-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	1.8	3.7	2.6	5.1
65	4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺	3.3	4.4	100	100
72	9-[4-(氨基甲基)苯基]-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	1.1	1.2	3.2	12
73	9-[4-(氨基甲基)苯基]-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.67	0.65	1.2	11
77	N-[4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]甲烷磺酰胺	7.9	3.2	46	100
81	2-[4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]乙腈	3.5	6.2	7.7	27
84	8-羟基-9-(1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	5.4	4.8	11	7.1
93	9-{4-[2-(二甲基氨基)乙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	2.5	4.7	3	7
95	9-[4-(氨基甲基)苯基]-8-羟基-2-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	4.1	2.9	8.1	22
112	8-羟基-9-{4-[4-(甲基磺酰基)哌啶-1-基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	3.9	6.9	6.6	6.8
139	第三丁基{1-[4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]哌啶-4-基}甲基胺基甲酸酯	3.8	4.3	5	3.9

145	9-(4-{2-[二乙基胺基]乙基胺基}丙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	7.7	4.8	8.2	9.2
152	( <i>E</i> )-9-[3-(4-胺基哌啶-1-基)丙-1-烯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	5.8	4.4	12	6.5
164	9-{4-[二甲基胺基]甲基}苯基}-8-甲氧基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	2.9	4.9	2.4	7
165	9-{4-[二甲基胺基]甲基}苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	3.2	6.2	3	6.5
169	9-[4-(2-胺基乙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	2.4	4.2	3.7	6.1
175	9-[4-(2-胺基乙基)苯基]-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	0.7	0.67	0.85	1.5
176	9-[4-(2-胺基乙基)苯基]-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.64	0.49	0.64	1.1
184	9-{4-[二乙基胺基]甲基}苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	2.9	6.1	2.7	7.1
187	8-羟基-9-{4-[(甲基胺基)甲基]苯基}噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	1.3	1.4	1.6	2
188	8-甲氧基-9-{4-[(甲基胺基)甲基]苯基}噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	3.5	7.9	3.8	8
192	9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.34	0.67	0.3	0.66

191	9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.4	0.78	0.35	0.87
193	N-{1-[4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基]乙基}甲烷磺酰胺	2.4	1.7	13	39
194	8-羟基-9-{4-[1-(吡咯啶-1-基)乙基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.46	1	0.49	1.2
195	9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.37	0.4	0.61	2.4
196	9-{4-[1-(二乙基胺基)乙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	1.1	2.3	1	2.7
210	N-(2-溴乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺	0.006	0.25	0.028	14
212	N-[4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基]甲烷磺酰胺	5.5	1.4	17	40
216	8-甲氧基-9-{4-[1-(吡咯啶-1-基)乙基]苯基}噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	2.9	5.8	2.6	7.4
217	9-(4-胺基-3-羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	2.8	6.8	5.6	48
222	9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	3.8	7	3.5	8.7
225	9-{4-[2-(二甲基胺基)乙基]苯基}-6-氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	1.2	3	1.2	3.4

229	8-羥基-9-{4-[（異丙基胺基）甲基]苯基}噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	1.9	4	2.1	4.2
232	( <i>S</i> )-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	2.1	5	2	7.3
233	( <i>S</i> )-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羥基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.28	0.38	0.36	1.1
235	9-(4-{[4-(胺基甲基)哌啶-1-基]甲基}-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	3.2	2.2	7.1	10
254	<i>N</i> -[4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)-2-甲基苯基]甲烷磺醯胺	4.8	5.2	14	32
256	9-[4-(胺基甲基)苯基]-6-氟-8-羥基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.57	0.99	0.75	3.3
257	9-[4-(胺基甲基)苯基]-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	3.4	8.2	3.7	100
261	2-[2-氟-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苯基]乙腈	0.69	1.1	1.3	6.6
262	8-羥基-9-{4-[1-(哌啶-1-基)乙基]苯基}噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	1.2	2.7	1	2.6
265	9-[4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	3	5.6	4.4	7.7
266	9-[5-(胺基甲基)噻吩-2-基]-8-羥基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	1.3	1.5	2.7	13

267	9-{4-[(乙基胺基)甲基]苯基}-8-羟基塞吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽	1.9	3.1	2	3.3
269	9-{4-[(乙基胺基)甲基]苯基}-8-甲氧基塞吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽	3	6.9	2.3	6.7
270	9-[4-(胺基甲基)苯基]-6-溴-8-羟基塞吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽	0.36	0.65	0.44	2.4
272	( <i>R</i> )-9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-羟基塞吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽	0.19	0.36	0.17	0.49
273	9-[4-(3-胺基丙基)苯基]-8-羟基塞吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽	3.8	2.1	6.4	5.3
274	( <i>R</i> )-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-甲氧基塞吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽	1.3	2.8	1.6	5.1
275	( <i>R</i> )-9-[4-(1-胺基乙基)苯基]-8-羟基塞吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽	0.32	0.34	0.57	5.2
276	9-[4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基]-8-羟基塞吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽	0.81	0.57	1.3	2.1
277	9-[4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基]-8-羟基塞吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽	0.53	0.74	0.69	2.1
278	9-{3-氟-4-[(3-羟基吡咯啶-1-基)甲基]苯基}-8-羟基塞吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽	2.5	2.7	5	10

290	3-[4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳 噁吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苯基]丙 腈	0.63	0.96	0.76	2.8
296	9-(4-乙醯基苯基)-8-羥基噁吩并 [2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	5.4	7.4	3.5	14
297	<i>N</i> -(2-溴乙基)-2-氟-4-(8-羥基-4- 側氧基-4,5-二氳噁吩并[2,3- <i>c</i> ]喹 啉-9-基)苯磺醯胺	0.21	1.2	0.47	32
298	9-{3-[3-(二甲基胺基)哌啶-1-基] 丙基}-8-羥基噁吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉 -4(5H)-酮 二鹽酸鹽	6.2	6.9	4.4	11
301	( <i>R</i> )- <i>N</i> -{1-[4-(8-羥基-4-側氧基 -4,5-二氳噁吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9- 基)苯基]乙基}甲烷磺醯胺	7.2	3	14	28
304	4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噁 吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)- <i>N,N</i> -二甲 基苯磺醯胺	4.6	6.9	5.2	100
308	9-{4-[1-(二甲基胺基)-2-甲基丙 -2-基]苯基}-8-羥基噁吩并 [2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	1.8	3.8	1.4	4.2
313	8-羥基-9-[4-(1-羥基乙基)苯基] 噁吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	1.7	3	2.6	11
314	9-{4-[1-(環戊基胺基)乙基]苯 基}-8-羥基噁吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉 -4(5H)-酮鹽酸鹽	1.9	4.1	1.5	3.7
319	9-[4-(2-胺基丙-2-基)苯基]-8-羥 基噁吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮鹽 酸鹽	0.55	0.9	0.64	2.3
326	9-[4-(胺基甲基)苯基]-4-側氧基 -4,5-二氳噁吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-8- 腈鹽酸鹽	4.3	5.9	7.9	10

327	9-{4-[2-(二甲基胺基)乙基]-3-氟苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	3.3	6.4	3.7	7.8
329	9-[4-(胺基甲基)苯基]-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.32	0.63	0.36	1.4
332	<i>N</i> -(2-氯乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苯磺酰胺	0.012	0.31	0.034	24
333	<i>N</i> -(2-氯乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苯磺酰胺	2.5	9.3	2	24
334	9-[4-(2-氨基丙-2-基)苯基]-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.48	1.1	0.49	1.3
335	( <i>S</i> )-9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	1.1	2.4	1.2	3.3
336	9-[4-(1-氨基丙基)苯基]-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.21	0.35	0.32	0.97
337	9-[4-(1-氨基丙基)苯基]-8-甲氧基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	1.5	3.4	1.4	3.9
338	9-{4-[1-(二乙基胺基)丙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	2	7.1	1.8	4.5
339	9-{4-[1-(二甲基胺基)丙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.35	0.79	0.36	0.98

341	9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}-6,7-二氟-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	1.4	2.9	1.5	3.3
345	9-(2-氨基-2,3-二氢-1H-茚-5-基)-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	3.1	4.4	5.7	7.1
346	9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]苯基}噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮	2.5	7.2		6.8
347	(S)-N-{1-[4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苯基]乙基}甲烷磺酰胺	1	0.75	5.6	29
348	9-{4-[1-(氨基甲基)环丙基]苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.31	3.2	0.38	1.2
349	9-{4-[1-(二甲基胺基)乙基]-3-氟苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.58	1.3	0.48	1.3
353	8-羟基-9-(1,2,3,4-四氢异喹啉-7-基)噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	1.9	3.7	3.2	4.2
356	9-{4-[1-(二乙基胺基)乙基]-3-氟苯基}-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	1.5	3.3	1.3	3.5
359	9-[4-(1-氨基乙基)-3-氟苯基]-8-羟基噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.35	0.64	0.62	4
361	1-[4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3- <i>c</i> ]喹啉-9-基)苯基]环丙腈	0.94	2.5	0.96	2.7

表中的“>100”代表高於100 micro M。

表 3-2;

識別號	化合物	IC50	IC50	IC50	IC50
-----	-----	------	------	------	------

		(microM) (BT549)	(microM) (T47D)	(microM) (A549)	(microM) (HT1197)	(microM) (22Rv1)
373	9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.46	0.82	0.58	1.5	-
379	9-(4-(1-((二甲基胺基)甲基)環丙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.52	1	0.46	1.4	-
385	9-(4-(1-(乙基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.8	1.8	0.94	2.6	-
1032	9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-溴-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.27	0.53	0.3	1.2	-
1041	9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.19	0.34	0.16	0.65	-
1052	(R)-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.17	0.32	0.17	0.45	-
1062	N-(1-溴丙-2-基)-4-(8-羥基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺	0.15	1.9	0.88	12	-
1064	(S)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	1	2.2	0.89	2.9	-
1066	9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]	0.065	0.13	0.12	0.34	-

	喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽					
1077	9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氫噁吩并[2,3-c]喹啉-8-基異丙基碳酸酯鹽酸鹽	0.41	0.45	0.66	2.5	-
1081	(R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-氯-8-羥基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.086	0.17	0.1	0.39	-
1082	(S)-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.36	0.6	0.43	1	-
1087	(S)-6-氯-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.23	0.5	0.26	0.66	-
1088	9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-6-氯-8-羥基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.24	0.52	0.24	0.66	-
1094	N-(2-溴乙基)-4-(8-羥基-4-側氧基-2,3,4,5-四氫-1H-環戊[c]喹啉-9-基)苯磺醯胺	0.0071	0.29	0.028	21	-
1095	9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-8-羥基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.81	0.54	0.95	0.93	-
1099	9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氫噁吩并[2,3-c]喹啉-8-基乙酸酯鹽酸鹽	0.46	0.37	0.54	1.9	-

1106	9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.13	0.26	0.15	0.62	-
1111	9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.12	0.072	0.12	0.37	-
1112	9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.21	0.47	0.25	0.64	-
1116	9-(4-(1-(胺基甲基)环丙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.098	0.17	0.12	0.54	-
1120	(S)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.093	0.15	0.13	0.33	-
1121	(S)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.42	0.7	0.36	1.5	-
1122	(R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	-	0.065	0.049	0.17	0.065
1123	(R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.18	0.34	0.16	0.76	-
1126	(R)-6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.14	0.29	0.11	0.32	-

1127	(S)-9-(4-(1-(乙基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.3	0.63	0.22	0.65	-
1128	(S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.43	1	0.37	1.2	-
1131	(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.51	0.71	0.68	4.8	-
1132	(R)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.097	0.19	0.09	0.32	-
1133	9-(4-(2-氨基乙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.15	0.23	0.18	0.87	-
1135	(R)-6-溴-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.14	0.28	0.13	0.41	-
1136	9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.032	0.057	0.035	0.18	-
1139	N-(2-氯乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺	0.017	0.2	0.023	14	-
1142	9-(4-(2-氨基乙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.17	0.25	0.21	1	-

1145	N-(2-氯乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-2,3,4,5-四氢-1H-环戊[c]喹啉-9-基)苯磺酰胺	0.01	0.18	0.051	31	-
1148	(S)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.13	0.25	0.12	0.26	-
1150	(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	-	1.1	0.51	1.3	0.88
1151	(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.39	0.85	0.32	1	-
1154	(S)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.14	0.29	0.13	0.32	-
1157	(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.16	0.32	0.22	0.58	-
1159	(R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.38	0.76	0.4	1.1	-
1160	(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.054	0.057	0.056	0.23	0.069
1161	(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并	0.22	0.45	0.27	0.82	-

	[2, 3-c] 哌啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽					
1162	2-(4-(8-羥基-4-側氧基 -4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c] 哌 啉-9-基)苯基)丁腈	0.51	1.2	0.65	1.3	-
1163	(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基) 苯基)-8-羥基噻吩并[2, 3-c] 噃啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.33	0.24	0.32	0.96	-
1165	6-氯-8-羥基-9-(4-(2-(甲基 胺基)乙基)苯基)噻吩并 [2, 3-c] 噃啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽	0.37	0.65	0.41	1.2	-
1166	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基) 苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并 [2, 3-c] 噃啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽	0.013	0.026	0.017	0.12	-
1168	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基) 苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并 [2, 3-c] 噃啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽	-	0.0084	0.0065	0.027	0.008
1169	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基) 苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并 [2, 3-c] 噃啉-4(5H)-酮氫溴 酸鹽	0.013	0.024	0.023	0.079	0.022
1172	(S)-9-(4-(1-(二甲基胺基) 丙-2-基)苯基)-8-羥基噻吩 并[2, 3-c] 噃啉-4(5H)-酮鹽 酸鹽	0.31	0.65	0.33	0.65	-
1174	9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟 苯基)-8-羥基噻吩并[2, 3-c] 噃啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.16	0.12	0.27	1.2	-

	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.024	0.038	0.027	0.1	-
1179	9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.45	0.86	0.63	1.9	-
1181	(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.1	0.21	0.11	0.6	-
1187	(R)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.19	0.19	0.2	0.32	-
1188	(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.16	0.29	0.16	0.43	-
1189	(R)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.69	1.3	0.59	1.3	-
1190	9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.015	0.019	0.021	0.11	-
1191	9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.064	0.073	0.12	0.48	-

1193	9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.14	0.24	0.13	0.33	-
1197	(S)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.43	0.54	0.62	1	-
1201	(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.053	0.12	0.046	0.14	-
1204	N-(1-氯丙-2-基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺	0.16	1.9	0.71	15	-
1209	9-(4-(3-(氨基甲基)戊-3-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.49	1	0.48	1.2	-
1212	9-(4-(氨基甲基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.12	0.2	0.15	0.63	-
1213	9-(4-(2-氨基乙基)-3-氟苯基)-6-溴-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.23	0.38	0.36	1.7	-
1215	(S)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.14	0.26	0.15	0.5	-
1216	9-(4-(2-氨基乙基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并	0.21	0.46	0.28	0.64	-

	[2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽					
1217	9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽	0.065	0.084	0.14	0.48	-
1218	9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-氯-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽	0.55	1.2	0.62	1.3	-
1219	9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽	0.1	0.18	0.17	0.88	-
1224	9-(4-(2-胺基乙基)-2-溴-5-羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽	0.98	0.77	0.49	1.5	-
1225	(S)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽	0.091	0.16	0.1	0.38	-
1226	3-(4-(8-羟基-6-甲基-4-侧 氧基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)丙 睛	0.59	1.2	0.49	1.3	-
1228	9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻 吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽	0.15	0.33	0.16	0.81	-
1232	(S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基) 苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并	0.037	0.062	0.041	0.2	-

	[2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽					
1236	9-(4-(2-胺基-1-環戊基乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.51	0.8	0.46	1	-
1239	9-(4-(2-胺基-1-環戊基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽	1.5	1.1	0.89	1.7	-
1242	9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.11	0.15	0.12	0.42	-
1245	6-溴-9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽 酸鹽	0.72	1.3	0.85	2.5	-
1247	9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽 酸鹽	0.52	0.94	0.47	1.3	-
1251	9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽 酸鹽	0.26	0.52	0.2	0.65	-
1252	9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.25	0.21	0.16	0.42	-
1253	9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽	1.5	0.87	0.76	1.9	-

1254	9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基) 苯基)-8-羥基-6-甲基塞吩并 [2, 3-c] 哒啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽	0.035	0.053	0.039	0.24	-
1258	9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙 基)苯基)-8-羥基-6-甲基塞 吩并 [2, 3-c] 哒啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽	0.43	0.6	0.66	1.5	-
1260	9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2- 基)苯基)-6-氯-8-羥基塞吩 并 [2, 3-c] 哒啉-4(5H)-酮鹽 酸鹽	0.43	0.93	0.5	1.7	-
1262	(R)-8- 羥 基 -6- 甲 基 -9-(4-(1-(甲基胺基)乙基) 苯基)塞吩并 [2, 3-c] 哒啉 -4(5H)-酮鹽酸鹽	0.039	0.078	0.045	0.13	-
1263	9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯 基)-8-甲氧基-6-甲基塞吩并 [2, 3-c] 哒啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽	0.2	0.41	0.23	0.58	-
1264	9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯 基)-8-羥基-6-甲基塞吩并 [2, 3-c] 哒啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽	0.032	0.046	0.075	0.17	-
1265	(R)-8- 甲 氧 基 -6- 甲 基 -9-(4-(1-(甲基胺基)乙基) 苯基)塞吩并 [2, 3-c] 哒啉 -4(5H)-酮鹽酸鹽	0.11	0.26	0.11	0.32	-
1268	9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯 基)-6-氯-8-羥基塞吩并 [2, 3-c] 哒啉-4(5H)-酮鹽酸 鹽	0.077	0.12	0.13	0.38	-

1271	9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.3	0.57	0.47	1.6	-
1273	9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.073	0.17	0.071	0.2	-
1274	9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.066	0.098	0.045	0.18	-
1277	9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.13	0.28	0.14	0.29	-
1278	9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.11	0.26	0.29	0.51	-
1280	9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.45	2.6	0.37	7	-
1283	9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.25	0.56	0.56	0.53	-
1285	8-羟基-6-甲基-9-(4-(3-甲基-1-(甲基胺基)丁-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.11	0.21	0.23	0.28	-
1286	9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.093	0.22	0.095	0.22	-

	基 噻 吩 并 [2, 3-c] 哌 咪 -4(5H)-酮鹽酸鹽					
1288	9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基 噻 吩 并 [2, 3-c] 哌 咪 -4(5H)-酮	0.047	0.074	0.11	0.14	-
1290	9-(4-(1-(胺基甲基)環丁基)苯基)-8-羟基-6-甲基 噻 吩 并 [2, 3-c] 哌 咪-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.025	0.044	0.021	0.096	-
1291	9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基 噻 吩 并 [2, 3-c] 哌 咪-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.026	0.029	0.022	0.11	-
1293	9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基 噻 吩 并 [2, 3-c] 哌 咪-4(5H)-酮	0.032	0.052	0.035	0.19	-
1294	9-(3-氟-4-(3-甲基-1-(甲基胺基)丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基 噻 吩 并 [2, 3-c] 哌 咪-4(5H)-酮	0.085	0.18	0.078	0.34	-
1297	9-(4-(1-(胺基甲基)環丁基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基 噻 吩 并 [2, 3-c] 哌 咪-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.26	0.62	0.22	0.52	-
1298	(R)-8-甲 氧 基 -6- 甲 基 -9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基) 噻 吩 并 [2, 3-c] 哌 咪-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.064	0.14	0.068	0.16	-
1300	9-(4-(1-(胺基甲基)環丁基)苯基)-8-羟基 噻 吩 并 [2, 3-c]	0.1	0.12	0.077	0.23	-

	喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽					
1302	8-羟基-6-甲基-9-(4-(哌啶-3-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.74	0.83	0.97	1.5	-
1303	(S)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮	0.081	0.13	0.092	0.51	-
1304	(S)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮溴氨酸鹽	-	0.12	0.099	0.34	0.074
1305	(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.021	0.04	0.02	0.064	-
1306	(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基氨基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	-	0.035	0.02	0.073	0.033
1307	(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基氨基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮溴氨酸鹽	0.042	0.085	0.057	0.15	0.073
1309	9-(4-(1-氨基丁-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.094	0.066	0.065	0.21	-
1310	(S)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.4	0.8	0.37	0.89	-

1311	(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.037	0.07	0.045	0.11	-
1312	9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.058	0.076	0.054	0.23	-
1315	(R)-9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.024	0.041	0.034	0.1	-
1316	(R)-9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.083	0.16	0.086	0.23	-
1317	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.036	0.072	0.042	0.1	-
1318	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.0084	0.015	0.015	0.063	-
1319	(R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮溴氨酸盐	-	0.016	0.014	0.054	0.014
1321	9-(4-(1-(胺基甲基)环丁基)苯基)-6-氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	1	2.2	0.8	2	-

	(R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.03	0.066	0.024	0.069	-
1324	9-(4-(2-氨基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.19	0.43	0.18	0.76	-
1330	(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-羟基-2,6-二甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.17	0.25	0.19	0.65	-
1340	(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-2,6-二甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.86	0.98	0.57	0.88	-
1341	(R)-6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.11	0.26	0.1	0.26	-
1347	(R)-9-(4-(1-氨基丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.071	0.099	0.055	0.34	-
1352	(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-2-氯-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.079	0.087	0.045	0.11	-
1353	(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-2-氯-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐	0.29	0.53	0.15	0.23	-
1354	(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-2-氯-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮盐酸盐					

1364	8-羟基-6-甲基-9-(4-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	0.26	0.3	0.27	0.66	-
1372	9-(4-(1-((二甲基胺基)甲基)环丁基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	-	0.084	0.035	0.1	0.075
1375	(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-2-氟-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	-	0.42	0.16	0.37	0.35
1379	(R)-9-(4-(1-(乙基(甲基)胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	-	0.28	0.11	0.31	0.22
1380	(R)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丁-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	-	0.24	0.096	0.37	0.19
1383	(R)-9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-2-氟-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	-	0.057	0.029	0.1	0.048
1391	9-(4-(1-(氨基甲基)环丙基)苯基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	-	1.2	0.67	1.4	0.99
1399	(S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	-	0.45	0.18	0.47	0.3

1400	9-(4-((2-胺基乙基)(甲基)胺基)苯基)-8-羟基-6-甲基 噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	-	1.4	0.9	2.8	1.1
1401	9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯基)-6-溴-8-羟基噁吩并 [2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽	-	0.4	0.3	1.2	0.34
1419	2-(4-(8-羟基-6-甲基-4-側 氧基-4,5-二氫噁吩并 [2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙 烷-1-磺醯胺	-	-	0.72	6.4	0.28

表中的“>100”代表高於 100 micro M。

### [產業利用性]

本發明提供具有 PBK 抑制作用的新穎三環化合物。本發明的化合物可用在抑制 PBK 的醫藥組合物。此種醫藥組合物適於治療或預防癌症。

### 【圖式簡單說明】

無

### 【主要元件符號說明】

無

I503323

公告本

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫) C07D 4/95/00 (2006.01)

※申請案號： 100110555

A61K 31/4365 (2006.01)

※申請日： 100.3.28 ※IPC 分類：

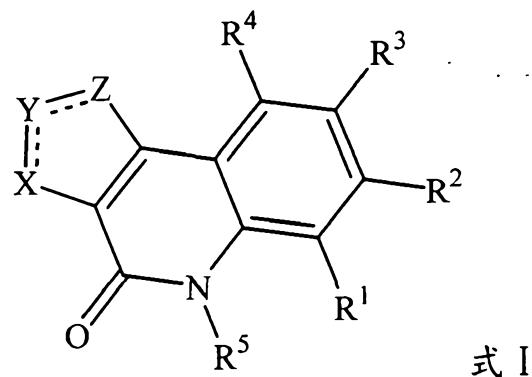
A61K 31/4738 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

三環化合物以及含此化合物之 PBK 抑制劑 / Tricyclic compounds and PBK Inhibitors Containing the Same

二、中文發明摘要：

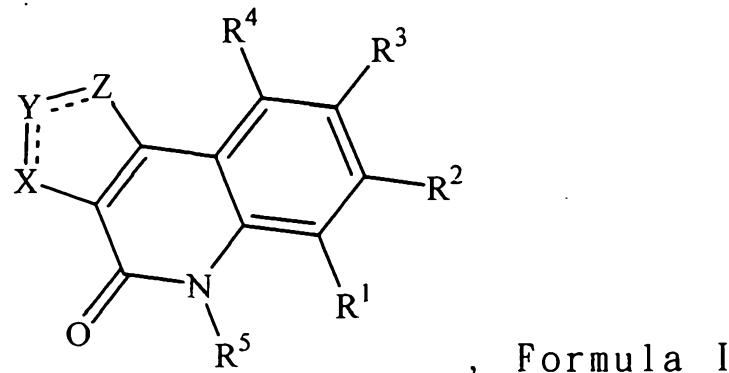
本發明提供式 I 之三環化合物。此化合物為 PBK 抑制劑，有用於治療 PBK 相關疾病，包括癌症。



式 I

三、英文發明摘要：

Tricyclic compounds of formula I are provided. These compounds are PBK inhibitors, and are useful for the treatment of PBK related diseases, including cancer.



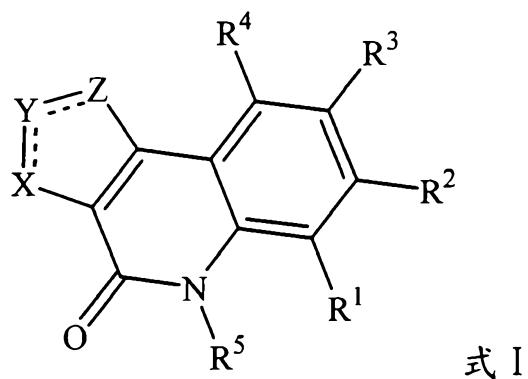
, Formula I

四、指定代表圖：

(一) 本案指定代表圖為：無

(二) 本代表圖之元件符號簡單說明：無

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



(103) 月 20 日修正替換頁

塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(101): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基-2-(N-吗啉基甲基)塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(102): 9-(1H-苯并[d]咪唑-5-基)-8-羟基塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(103): 9-(4-(二氟甲基)苯基)-8-甲氧基塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(104): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-甲氧基-2-(N-吗啉基甲基)塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(105): 8-羟基-9-(4-(2-(哌啶-1-基)乙基胺基)苯基)塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(106): 8-羟基-9-(4-(哌啶-1-基)苯基)塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(107): 8-甲氧基-2,3-二氢-1H-环戊[c]喹啉-4(5H)-酮；

(108): 8-羟基-2,3-二氢-1H-环戊[c]喹啉-4(5H)-酮；

(109): 5-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢塞吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯并[d]𫫇唑-2(3H)-酮；

(110): 第三丁基 4-(2-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢塞吩并[2,3-c]喹啉-9-基)benzyl 胺基)乙基)哌啶-1-羧酸酯；

(111): 8-甲氧基-9-(4-(哌啶-1-基)苯基)塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(112): 8-羟基-9-(4-(4-(甲基磺酰基)哌啶-1-基)苯基)

(103 年 3 月 20 日修正替換頁)

- (125): N-(2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)乙醯胺；
- (126): N-(2-胺基乙基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲醯胺；
- (127): N-(2-胺基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲醯胺；
- (128): N-(2-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)乙醯胺；
- (129): 4-(8-羥基-4-側氧基-2,3,4,5-四氫-1H-環戊[c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (130): 8-羥基-9-(4-(4-甲基哌啶-1-羧基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (131): 8-甲氧基-9-(4-(4-甲基哌啶-1-羧基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (132): 8-羥基-9-(4-((4-甲基哌啶-1-基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (133): 8-甲氧基-9-(4-((4-甲基哌啶-1-基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (134):(E)-9-(3-(二乙基胺基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (135):(E)-9-(3-(4-(胺基甲基)哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (136):(E)-9-(3-(2-(二乙基胺基)乙基胺基)丙-1-烯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

103年3月20日修正替換頁

- (137): N-(4-(8-羥基-4-側氧基-2,3,4,5-四氫-1H-環戊[c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；
- (138): 9-(2-(二甲基胺基)嘧啶-5-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (139): 第三丁基(1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基)哌啶-4-基)甲基胺基甲酸酯；
- (140): 8-羥基-9-(4-(4-甲基哌啶-1-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (141): 8-甲氧基-9-(4-(4-甲基哌啶-1-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (142): 8-甲氧基-9-(1-(甲基磺醯基)-1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (143):(E)-9-(3-(二乙基胺基)丙-1-烯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (144): 9-(3-(4-(胺基甲基)哌啶-1-基)丙基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (145): 9-(4-(3-(2-(二乙基胺基)乙基胺基)丙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (146): 9-(4-(3-(二乙基胺基)丙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (147): 9-(4-(3-(2-(二乙基胺基)乙基胺基)丙氧基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (148):(E)-9-(3-(4-(胺基甲基)哌啶-1-基)丙-1-烯

苯基) 噻吩并 [2, 3-c] 嘇啉 -4(5H)- 酮；

103 年 3 月 20 日修正替換頁

(161): 9-(3-(2-(二乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-甲氧基

噻吩并 [2, 3-c] 嘇啉 -4(5H)- 酮；

(162): 9-(3-(3-(二乙基胺基)丙氧基)苯基)-8-甲氧基

噻吩并 [2, 3-c] 嘇啉 -4(5H)- 酮；

(163): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻

吩并 [2, 3-c] 嘇啉 -4(5H)- 酮；

(164): 9-(4-((二甲基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩

并 [2, 3-c] 嘇啉 -4(5H)- 酮；

(165): 9-(4-((二甲基胺基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并

[2, 3-c] 嘇啉 -4(5H)- 酮；

(166): 9-(3-(2-(二乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-羟基噻

吩并 [2, 3-c] 嘇啉 -4(5H)- 酮；

(167): 8-羟基 -9-(3-(2-(4-甲基哌啶-1-基)乙氧基)苯

基) 噻吩并 [2, 3-c] 嘇啉 -4(5H)- 酮；

(168): N-乙基-N-(2-(4-(8-甲氧基-4-侧氧基-4, 5-二

氢噻吩并 [2, 3-c] 嘇啉 -9- 基) 苯氧基) 乙基) 甲烷磺醯

胺；

(169): 9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并

[2, 3-c] 嘇啉 -4(5H)- 酮；

(170): 2-(3-(8-羟基-4-侧氧基-4, 5-二氢噻吩并

[2, 3-c] 嘇啉 -9- 基) 苯基) 乙腈；

(171): 2-(3-(8-甲氧基-4-侧氧基-4, 5-二氢噻吩并

(03 年) 月 20 日修正替換頁

[2, 3-c] 喹啉-9-基) 苯基) 乙腈；

(172): 9-(1-(2-(二甲基胺基)乙基)-1, 2, 3, 6-四氫吡啶-4-基)-8-羥基塞吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(173): N-(2-(4-(8-羥基-4-側氧基-4, 5-二氫塞吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺醯胺；

(174): 9-(1-(2-(二乙基胺基)乙基)-1, 2, 3, 6-四氫吡啶-4-基)-8-羥基塞吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(175): 9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-8-羥基塞吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(176): 9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-8-羥基塞吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(177): N-(2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫塞吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺醯胺；

(178): N-(2-(3-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫塞吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺醯胺；

(179): N-(2-胺基乙基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4, 5-二氫塞吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

(180): 8-羥基-9-(1, 2, 3, 6-四氫吡啶-4-基)-2, 3-二氫-1H-環戊[c]喹啉-4(5H)-酮；

(181): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基-2, 3-二氫-1H-環戊[c]喹啉-4(5H)-酮；

(182): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基-2, 3-二氫-1H-環戊[c]喹啉-4(5H)-酮；

(183): 9-(4-((二乙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基塞吩

103 年 3 月 20 日修正替換頁

[2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(208)：8-甲氧基-9-(5-甲氧基吡啶-3-基)-2, 3-二氫-1H-環戊[c]喹啉-4(5H)-酮；

(209)：9-(4-(3-胺基吡咯啶-1-基磺醯基)苯基)-8-羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(210)：N-(2-溴乙基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

(211)：9-(4-((二異丙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(212)：N-(4-(8-羥基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苄基)甲烷磺醯胺；

(213)：9-(4-((異丙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(214)：2-(二甲基胺基)-N-(3-(8-羥基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺；

(215)：2-胺基-N-(3-(8-羥基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺；

(216)：8-甲氧基-9-(4-(1-(吡咯啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(217)：9-(4-胺基-3-羥基苯基)-8-羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(218)：N-(2-甲氧基-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；

(219)：9-(3, 5-二氟-4-羥基苯基)-8-甲氧基噻吩并

103 年 3 月 20 日修正替換頁

- (291): 9-(4-乙醯基苯基)-8-甲基  
~~氧基~~ 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (292): 2-氟-N-(2-羟基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲醯胺；
- (293): 4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯甲醯胺；
- (294): 1,1-二乙基-3-(4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基)脲；
- (295): N-(2-羟基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲醯胺；
- (296): 9-(4-乙醯基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (297): N-(2-溴乙基)-2-氟-4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (298): 9-(3-(3-(二甲基胺基)哌啶-1-基)丙基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (299): N-(2-氟-4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基)甲烷磺醯胺；
- (300): 9-(3-氟-4-(2-(甲基磺醯胺基)乙基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基甲烷磺酸酯；
- (301):(R)-N-(1-(4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺醯胺；
- (302):(R)-9-(4-(1-(甲基磺醯胺基)乙基)苯基)-4-側

(103) 年 月 20 日修正替換頁

- (105): 8-羥基-9-(4-(2-(哌啶-1-基)乙基胺基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (106): 8-羥基-9-(4-(哌啶-1-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (107): 8-甲氧基-2,3-二氫-1H-環戊[c]喹啉-4(5H)-酮；
- (108): 8-羥基-2,3-二氫-1H-環戊[c]喹啉-4(5H)-酮；
- (109): 5-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯并[d]𫫇唑-2(3H)-酮；
- (110): 第三丁基 4-(2-(4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基)乙基)哌啶-1-羧酸酯；
- (111): 8-甲氧基-9-(4-(哌啶-1-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (112): 8-羥基-9-(4-(4-(甲基磺醯基)哌啶-1-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (113): 8-羥基-9-(4-((哌啶-3-基胺基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (114): N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲醯胺；
- (115): 9-(4-(3-(二甲基胺基)丙氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (116): 8-甲氧基-9-(1-(哌啶-4-基)-1H-吡唑-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(103) 年 3 月 20 日修正替換頁

- (117): 8-羥基-9-(1-(哌啶-4-基)-1H-吡唑-4-基)噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (118): 8-甲氧基噻唑并4,5-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (119): 2-((4-(胺基甲基)哌啶-1-基)甲基)-8-羥基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (120): N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧  
基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲醯胺；
- (121): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羥基-2,3-二氫-1H-  
環戊[c]喹啉-4(5H)-酮；
- (122):(E)-丁基 3-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩  
并[2,3-c]喹啉-9-基)丙烯酸酯；
- (123): 8-甲氧基-9-(1H-吡咯并[2,3-b]吡啶-15-基)噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (124): 8-羥基-9-(1H-吡咯并[2,3-b]吡啶-15-基)噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (125): N-(2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并  
[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)乙醯胺；
- (126): N-(2-胺基乙基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二  
氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲醯胺；
- (127): N-(2-胺基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-  
二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲醯胺；
- (128): N-(2-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并  
[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)乙醯胺；
- (129): 4-(8-羥基-4-側氧基-2,3,4,5-四氫-1H-環戊[c]

103 年 3 月 20 日修正替換頁

喹啉-9-基)苯磺醯胺;

(130): 8-羥基-9-(4-(4-甲基哌啶-1-羧基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮;

(131): 8-甲氧基-9-(4-(4-甲基哌啶-1-羧基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮;

(132): 8-羥基-9-(4-((4-甲基哌啶-1-基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮;

(133): 8-甲氧基-9-(4-((4-甲基哌啶-1-基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮;

(134):(E)-9-(3-(二乙基胺基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮;

(135):(E)-9-(3-(4-(胺基甲基)哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮;

(136):(E)-9-(3-(2-(二乙基胺基)乙基胺基)丙-1-烯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮;

(137): N-(4-(8-羥基-4-側氨基-2,3,4,5-四氫-1H-環戊[c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺;

(138): 9-(2-(二甲基胺基)嘧啶-5-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮;

(139): 第三丁基(1-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基)哌啶-4-基)甲基胺基甲酸酯;

(140): 8-羥基-9-(4-(4-甲基哌啶-1-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮;

103  
103 年 3 月 20 日修正替換頁

- (165): 9-(4-((二甲基胺基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (166): 9-(3-(2-(二乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (167): 8-羟基-9-(3-(2-(4-甲基哌啶-1-基)乙氧基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (168): N-乙基-N-(2-(4-(8-甲氧基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯氧基)乙基)甲烷磺酰胺；
- (169): 9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (170): 2-(3-(8-羟基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙腈；
- (171): 2-(3-(8-甲氧基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙腈；
- (172): 9-(1-(2-(二甲基胺基)乙基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (173): N-(2(4-(8-羟基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺酰胺；
- (174): 9-(1-(2-(二乙基胺基)乙基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (175): 9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(23) 月 日修正替換頁

- (176): 9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (177): N-(2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺醯胺；
- (178): N-(2-(3-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺醯胺；
- (179): N-(2-胺基乙基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (180): 8-羥基-9-(1,2,3,6-四氳吡啶-4-基)-2,3-二氳-1H-環戊[c]喹啉-4(5H)-酮；
- (181): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基-2,3-二氳-1H-環戊[c]喹啉-4(5H)-酮；
- (182): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基-2,3-二氳-1H-環戊[c]喹啉-4(5H)-酮；
- (183): 9-(4-((二乙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (184): 9-(4-((二乙基胺基)甲基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (185): 9-(3-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (186): 9-(3-(2-胺基乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (187): 8-羥基-9-(4-((甲基胺基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(103) 年 (3) 月 (20) 日修正替換頁

- (212): N-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；
- (213): 9-(4-((異丙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (214): 2-(二甲基胺基)-N-(3-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺；
- (215): 2-胺基-N-(3-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺；
- (216): 8-甲氧基-9-(4-(1-(吡咯啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (217): 9-(4-胺基-3-羥基苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (218): N-(2-甲氧基-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；
- (219): 9-(3,5-二氟-4-羥基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (220): N-(2-羥基-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；
- (221): 9-(4-((4-(胺基甲基)哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (222): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (223): 9-(3,5-二氟-4-羥基苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(03) 年 3 月 20 日修正替換頁

苯基) 噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(284): 9-(3-(3-(二甲基胺基)吡咯啶-1-基)丙基)-8-羥基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(285): 9-(1-(2-氨基乙基)-1H-吡唑-4-基)-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(286): 9-(3-氯-4-((二乙基胺基)甲基)苯基)-8-羥基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(287): 4-(7-氟-8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)-N-(2-羥基乙基)苯磺醯胺；

(288): 9-(3-乙醯基苯基)-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(289): 2-氟-4-(8-羥基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)-N-(2-羥基乙基)苯甲醯胺；

(290): 3-(4-(8-羥基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基)丙腈；

(291): 9-(4-乙醯基苯基)-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

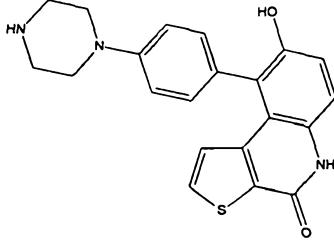
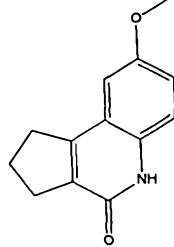
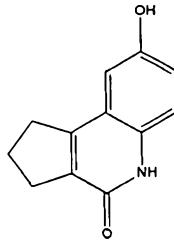
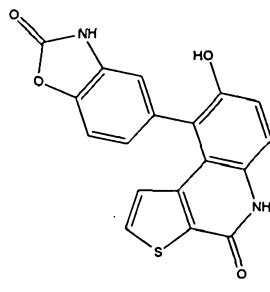
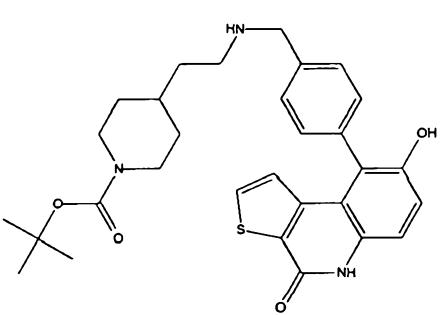
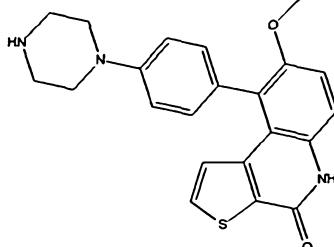
(292): 2-氟-N-(2-羥基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯甲醯胺；

(293): 4-(8-羥基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)-N-(2-羥基乙基)苯甲醯胺；

(294): 1, 1-二乙基-3-(4-(8-羥基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苄基)脲；

(295): N-(2-羥基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-

103 年 3 月 20 日修正替換頁

106		8-羟基 -9-(4-(哌啶-1-基) 苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉 - 4(5H)-酮
107		8-甲氧基 -2,3-二氢 -1H-环 戊[c]喹啉 -4(5H)-酮
108		8-羟基 -2,3-二氢 -1H- 环 戊[c]喹啉 -4(5H)-酮
109		5-(8-羟基 -4-侧氨基 -4,5-二氢 噻吩并[2,3-c]喹啉 -9- 基)苯并 [d]𫫇唑 -2(3H)-酮
110		第三丁基 4-(2-(4-(8- 羟基 -4-侧氨基 -4,5- 二氢噻吩并[2,3-c]喹啉 -9- 基) 苄基氨基)乙基)哌啶 - 1-羧酸酯
111		8-甲氧基 -9-(4-(哌 啶-1-基) 苯基)噻吩并[2,3-c]喹 啉 - 4(5H)-酮

103 年 3 月 20 日修正替換頁

123		8- 甲 氧 基 -9-(1H- 吡 喎 并 [2, 3-b] 吡 單 -5- 基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吒 - 4(5H)-酮
124		8- 細 基 -9-(1H- 吡 喎 并 [2, 3-b] 吡 單 -5- 基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吒 - 4(5H)-酮
125		N-(2-(4-(8- 甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吒 -9- 基 ) 苯 基 ) 乙 基 ) 乙 醤 胺
126		N-(2- 胺 基 乙 基 )-4-(8- 細 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吒 -9- 基 ) 苯 甲 醤 胺
127		N-(2- 胺 基 乙 基 )-4-(8- 甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吒 -9- 基 ) 苯 甲 醤 胺
128		N-(2-(4-(8- 細 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吒 -9- 基 ) 苯 基 ) 乙 基 ) 乙 醤 胺

135		(E)-9-(3-(4-(胺基甲基)哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
136		(E)-9-(3-(2-(二乙基氨基)乙基氨基)丙-1-烯基)-8-羥基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
137		N-(4-(8-羥基-4-側氫-2,3,4,5-四氫-1H-環戊[c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺
138		9-(2-(二甲基氨基)嘧啶-5-基)-8-羥基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
139		第三丁基 (1-(4-(8-甲氧基-4-側氫-4,5-二氫噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基)哌啶-4-基)甲基胺基甲酸酯
140		8-羥基-9-(4-(4-甲基哌啶-1-基)苯基)噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮

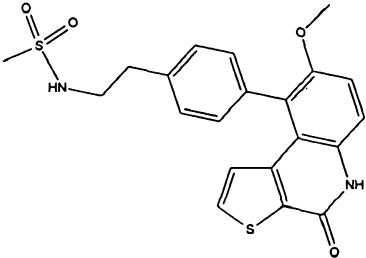
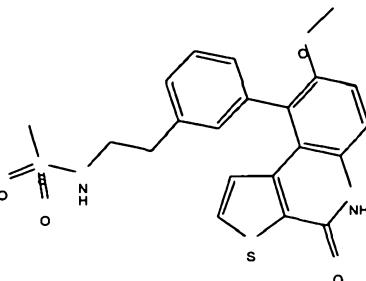
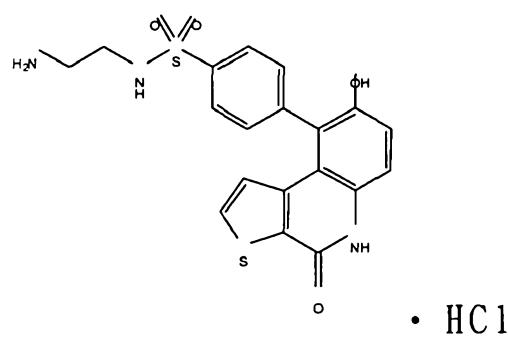
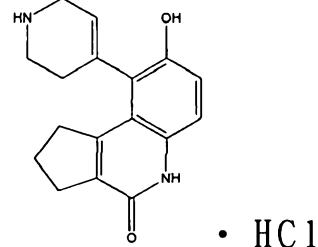
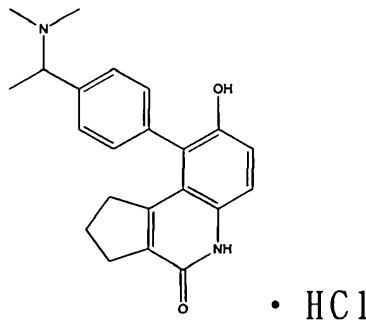
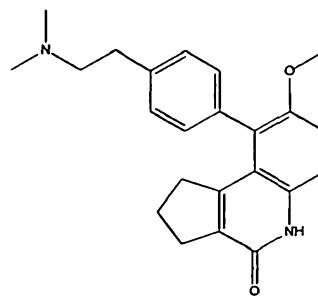
03年3月20日修正替換頁

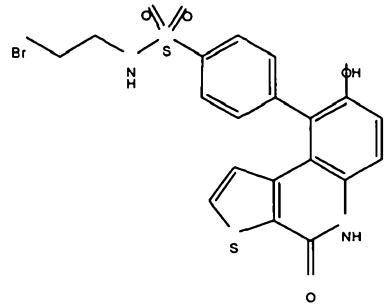
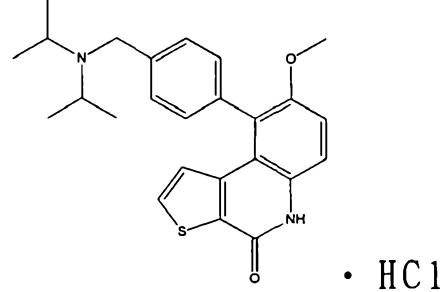
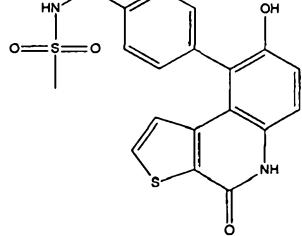
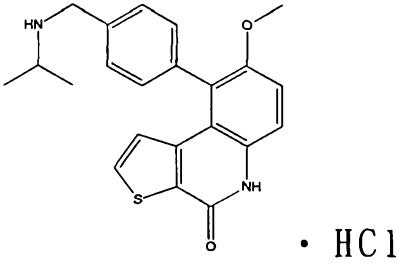
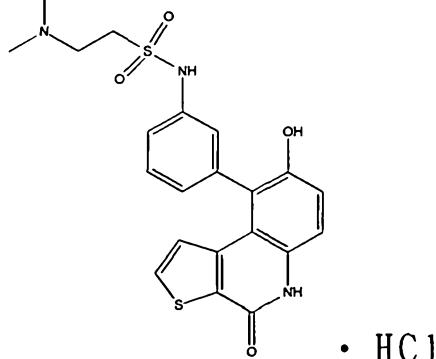
165		9-((二甲基胺基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
166		9-(3-(2-(二乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
167		8-羟基-9-(3-(2-(4-甲基哌啶-1-基)乙氧基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
168		N-乙基-N-(2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯氧基)乙基)甲烷磺酰胺
169		9-(4-(2-氨基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
170		2-(3-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙腈

03 年 3 月 20 日修正替換頁

171		2-(3-(8-甲氧基-4-側 氧基-4,5-二氫 噻吩并[2,3-c]喹啉-9- 基)苯基) 乙腈
172		9-(1-(2-(二甲基胺基) 乙基)-1,2,3,6-四氫吡 啶-4-基)-8-羥基 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
173		N-(2-(4-(8-羥基-4-側 氧基-4,5-二氫噻吩并 [2,3-c]喹啉-9-基)苯 基)乙基) 甲烷磺醯胺
174		9-(1-(2-(二乙基胺基) 乙基)-1,2,3,6-四氫吡 啶-4-基)-8-羥基 噻吩并[2,3-c]喹啉 -4(5H)-酮
175		9-(4-(2-胺基乙基)苯 基)-8- 羥基噻吩并[2,3-c]喹 啉- 4(5H)-酮
176		9-(4-(2-胺基乙基)苯 基)-8- 羥基噻吩并[2,3-c]喹 啉- 4(5H)-酮鹽酸鹽

103 年 3 月 20 日修正替換頁

177		N-(2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噓啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺醯胺
178		N-(2-(3-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噓啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺醯胺
179		N-(2-氨基乙基)-4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噓啉-9-基)苯磺醯胺鹽酸鹽
180		8-羥基-9-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)-2,3-二氫-1H-環戊[c]噓啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
181		9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基-2,3-二氫-1H-環戊[c]噓啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
182		9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基-2,3-二氫-1H-環戊[c]噓啉-4(5H)-酮

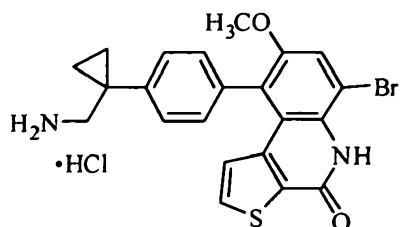
210		N-(2-溴乙基)-4-(8-羟基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺
211		9-((4-((二異丙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
212		N-(4-(8-羟基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)甲基)甲烷磺醯胺
213		9-((4-((異丙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮鹽酸鹽
214		2-((二甲基胺基)-N-(3-(8-羟基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺鹽酸鹽

103 年 3 月 20 日修正替換頁

289		2-氟-4-(8-羟基-4-側 氧基-4,5- 二氫噻吩并[2,3-c]喹 啉-9-基)- N-(2-羟基乙基)苯甲醯 胺
290		3-(4-(8-羟基-4-側 氧基-4,5- 二氫 噻吩并[2,3-c]喹啉-9- 基)苯基) 丙腈
291		9-(4-乙醯基苯基)-8- 甲氧基噻吩并 [2,3-c]喹啉-4(5H)-酮
292		2-氟-N-(2-羟基乙 基)-4-(8- 甲氧基-4-側 氧基-4,5- 二氫噻吩并[2,3-c]喹 啉-9-基)苯甲醯 胺
293		4-(8-羟基-4-側 氧基-4,5- 二氫 噻吩并[2,3-c]喹啉-9- 基)-N-(2- 羟基乙基)苯甲醯 胺
294		1,1-二乙基-3-(4-(8- 羟基-4-側 氧基-4,5- 二氫 噻吩并[2,3-c]喹 啉-9-基) 苄基)脲
295		N-(2-羟基乙基)-4-(8- 甲氧基-4-側 氧基-4,5- 二氫 噻吩并[2,3-c]喹 啉-9-基)苯甲醯 胺

103年3月20日修正替換頁  
并  
8-甲氧基噻吩

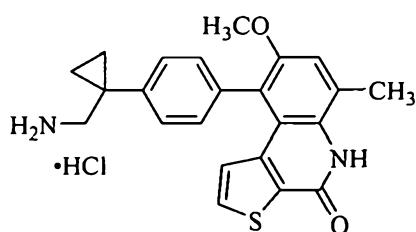
9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯基)-6-溴-[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽



依照一般程序 C，使第三丁基 (1-(4-(6-溴-8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)環丙基)甲基胺基甲酸酯 (50 mg, 0.09 mmol) 與 TFA (5.0 mL) 反應以獲得所望產物 (19 mg, 47%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, MeOD)  $\delta$  7.71 – 7.65 (m, 1H), 7.65 – 7.57 (m, 3H), 7.32 – 7.27 (m, 2H), 5.99 (t,  $J = 6.4$  Hz, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.29 (s, 2H), 1.21 – 1.10 (m, 4H); ESI MS  $m/z$  456 [C<sub>22</sub>H<sub>19</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S + H]<sup>+</sup>; HPLC >99% (AUC),  $t_R = 10.83$  min.

實施例 1251

9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮 鹽酸鹽

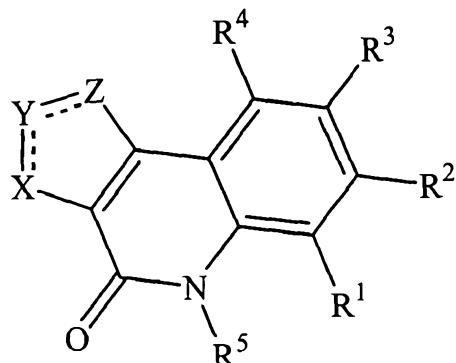


依照一般程序 C，使第三丁基 (1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)環丙基)甲基胺基甲酸酯 (70 mg, 0.14 mmol) 與 TFA (4.0 mL) 反應以獲得所望產物 (32 mg, 56%) 白色固體： $^1\text{H}$  NMR

## 七、申請專利範圍：

06年4月7日修正A.660-1738

1. 一種以通式 I 表示的化合物或其在醫藥上可接受的鹽：



通式 I

其中  $R^1$ 、 $R^2$  及  $R^3$  各自獨立地代表選自以下構成的群組的基團：

氫原子、

羥基、

鹵素、

氰基、

硝基、

胺基、

 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炫基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、 $C_3-C_{10}$  環烯基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_6-C_{10}$  芳基、

二氫節基、

雜芳基、

3 至 8 員雜環烷基、

$-OSO_2CH_3$ 、

$-OSO_2CF_3$ 、及

$-CONH_2$ 、

$-OCONR^{101}R^{102}$ ，其中  $R^{101}$  與  $R^{102}$  各自獨立地為為氫原子、 $C_1-C_6$  烷基，或  $R^{101}$  與  $R^{102}$  一起形成嗎啉基，

$-OCOR^{103}$ ，其中  $R^{103}$  表示  $C_1-C_6$  烷基，及

$-OCOOR^{104}$ ，其中  $R^{104}$  表示  $C_1-C_6$  烷基，

其中  $R^1$ 、 $R^2$  及  $R^3$  選擇性經獨立地選自由取代基 A 構成的群組的取代基取代；

$R^4$  為選自以下構成的群組：羥基、鹵素、氨基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、 $C_3-C_{10}$  環烯基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_6-C_{10}$  芳基、二氫節基、雜芳基，及 3 至 8 員雜環烷基，且  $R^4$  選擇性經取代基 A 取代；

其中取代基 A 獨立地選自以下構成的群組：

羥基；

側氧基 ( $=O$ )；

氰基；

鹵素；

選擇性經取代基 B 取代之  $C_1-C_6$  烷基；

$C_3-C_{10}$  環烷基，選擇性經氰基或有  $-NR^{31}R^{32}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基取代，其中  $R^{31}$  與  $R^{32}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；

$-NR^{21}R^{22}$ , 其中  $R^{21}$  與  $R^{22}$  各自獨立地表示氫原子;  $C_1-C_6$  烷基, 選擇性經羥基、胺基、二( $C_1-C_6$  烷基)胺基、 $-SO_2(C_1-C_6$  烷基)、3 至 8 員雜環烷基、或氟基取代; 或 3 至 8 員雜環烷基, 選擇性經  $-COOR^{105}$  取代, 其中  $R^{105}$  表示  $C_1-C_6$  烷基;

$C_1-C_6$  烷氧基, 選擇性經鹵素、選擇性有  $C_1-C_6$  烷基取代之 3 至 8 員雜環烷基、或  $-NR^{33}R^{34}$  取代, 其中  $R^{33}$  與  $R^{34}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基礦醯基、或選擇性有  $C_1-C_6$  烷基礦醯基或二( $C_1-C_6$  烷基)胺基取代的  $C_1-C_6$  烷基;

$-SO_2NR^{23}R^{24}$ , 其中  $R^{23}$  與  $R^{24}$  各自獨立地表示氫原子;  $C_1-C_6$  烷基, 選擇性經羥基、 $C_1-C_6$  烷氧基、鹵素、 $C_3-C_{10}$  環烷基、雜芳基、或  $-NR^{35}R^{36}$  取代, 其中  $R^{35}$  與  $R^{36}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基;  $C_3-C_{10}$  環烷基, 選擇性經  $C_1-C_6$  羅基烷基取代; 3 至 8 員雜環烷基; 或  $R^{23}$  與  $R^{24}$  一起形成選擇性經胺基或鹵素取代的 3 至 8 員雜環烷基;

$C_1-C_6$  烷基礦醯基, 選擇性經羥基取代;

$-NHSO_2(C_1-C_6$  烷基), 其中該碳原子選擇性經  $-NR^{37}R^{38}$  取代, 其中  $R^{37}$  與  $R^{38}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基;

3 至 8 員雜環烷基, 選擇性經  $-NR^{39}R^{40}$  取代, 其中  $R^{39}$  與  $R^{40}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $C_1-C_6$  烷基礦醯基;  $C_1-C_6$  烷基, 選擇性經  $-NR^{41}R^{42}$  取代, 其中  $R^{41}$  與  $R^{42}$

各自獨立地代表氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基；羥基；或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基  
礦醯基；

芳基，選擇性經選擇性有氟基或胺基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷  
基取代；

雜芳基；

-COOR<sup>11</sup>，其中 R<sup>11</sup> 表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基；及

-COR<sup>12</sup>，其中 R<sup>12</sup> 表示 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基；C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基；氟基  
甲基；胺基甲基；-NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>，其中 R<sup>25</sup> 與 R<sup>26</sup> 各自獨立地表  
示氫原子或選擇性有羥基或 -NR<sup>43</sup>R<sup>44</sup> 取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷  
基，其中 R<sup>43</sup> 與 R<sup>44</sup> 各自獨立地表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基；  
或選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基取代的 3 至 8 員雜環烷基；

其中取代基 B 獨立地選自由以下構成的群組：

鹵素；

羥基；

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基；

氟基；

環烷基；

選擇性經氟基取代的 C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> 芳基；

雜芳基；

3 至 8 員雜環烷基，選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、羥基、胺基、  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 胺基烷基、或有 C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> 烷基氧羧基胺基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
烷基取代；

-NR<sup>51</sup>R<sup>52</sup>，其中 R<sup>51</sup> 與 R<sup>52</sup> 各自獨立地表示氫原子；C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
烷基，選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基礦醯基或選擇性有 -COOR<sup>53</sup> 取

代的 3 至 8 員雜環烷基取代，其中  $R^{53}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；3 至 8 員雜環烷基； $C_1-C_6$  烷基礦醯基； $C_3-C_{10}$  環烷基； $-COR^{55}$ ，其中  $R^{55}$  表示  $C_1-C_6$  烷基； $-COOR^{56}$ ，其中  $R^{56}$  表示  $C_1-C_6$  烷基；或  $-CONR^{57}R^{58}$ ，其中  $R^{57}$  與  $R^{58}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；

$-COOR^{54}$ ，其中  $R^{54}$  表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；

$-CONH_2$ ；

$-SO_2NR^{106}R^{107}$ ，其中  $R^{106}$  與  $R^{107}$  各自獨立地表示氫原子、 $C_1-C_6$  烷基、或  $C_3-C_{10}$  環烷基；

$C_1-C_6$  烷基亞礦醯基；及

$C_1-C_6$  烷基礦醯基；

其中  $R^5$  為氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；及

其中  $\text{---X---Y---Z---}$  為結構： $-S-CR^7=CR^6-$ ，

其中  $R^6$  選自以下構成的群組：

氫原子、

羥基、

$C_1-C_6$  烷基、

選擇性經羥基取代的  $C_6-C_{10}$  芳基，及

選擇性經  $-NR^{61}R^{62}$  取代的 3 至 8 員雜環烷基，其中  $R^{61}$  與  $R^{62}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；

其中  $R^7$  選自以下構成的群組：

氫原子；

鹵素；

$C_1-C_6$  烷基，選擇性經羥基、 $-NR^{71}R^{72}$ ，其中  $R^{71}$  與  $R^{72}$  各自獨立地表示氫原子；選擇性經二甲基胺基取代的  $C_1-C_6$  烷基； $C_3-C_{10}$  環烷基，選擇性經胺基或 3 至 8 員雜環烷基取代；或選擇性經  $C_1-C_6$  胺基烷基取代的 3 至 8 員雜環烷基所取代；

$C_6-C_{10}$  芳基，選擇性經羥基取代；

$C_6-C_{10}$  芳基礦醯基；及

$-COR^{73}$ ，其中  $R^{73}$  表示選擇性經胺基取代的 3 至 8 員雜環烷基；或  $-NR^{74}R^{75}$ ，其中  $R^{74}$  與  $R^{75}$  各自獨立地表示氫原子、3 至 8 員雜環烷基、或選擇性經胺基取代的  $C_3-C_{10}$  環烷基。

2. 如申請專利範圍第 1 項所示之化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^1$  為氫原子、氟基、選擇性經羥基或鹵素取代的  $C_1-C_6$  烷基，或  $C_3-C_{10}$  環烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  烷基、或鹵素。
3. 如申請專利範圍第 1 項所示之化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^2$  為氫原子、羥基、鹵素、 $C_1-C_6$  烷氧基、或選擇性經羥基取代的  $C_6-C_{10}$  芳基。
4. 如申請專利範圍第 1 項所示之化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^2$  為氫原子、羥基、鹵素、 $C_1-C_6$  烷氧基、或二羥基苯基。
5. 如申請專利範圍第 1 項所示之化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中  $R^3$  選自以下構成的群組：氫原子；羥基；選擇性經羥基、鹵素、或羥基乙基胺基取代的  $C_1-C_6$  烷

基；鹵素；選擇性經二甲基胺基或嗎啉基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷  
氧基；C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基苯基，其中該脂肪族碳選擇性  
經 -NR<sup>51</sup>R<sup>52</sup> 取代；氰基；硝基；胺基；3 至 8 員雜環烷基，  
選 擇 性 經 胺 基 取 代 ； 雜 芳  
基；-OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>；-OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>；-OCOR<sup>103</sup>，其中 R<sup>103</sup> 表示 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷  
基；-OCOOR<sup>104</sup>，其中 R<sup>104</sup> 表示 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷  
基；-OCONR<sup>101</sup>R<sup>102</sup>，其中 R<sup>101</sup> 與 R<sup>102</sup> 各自獨立地代表氫  
原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基，或 R<sup>101</sup> 與 R<sup>102</sup> 一起形成嗎啉基；及  
-CONH<sub>2</sub>。

6. 如申請專利範圍第 5 項所示之化合物或其在醫藥上可  
接受的鹽，其中當 R<sup>3</sup> 為 3 至 8 員雜環烷基，則該 3 至 8  
員雜環烷基選自以下構成的群組：哌啶基、吡咯啶基、  
嗎啉基或哌啶基，且選擇性經胺基取代；及當 R<sup>3</sup> 為雜芳  
基，該雜芳基為吡啶基。
7. 如申請專利範圍第 1 項所示之化合物或其在醫藥上可  
接受的鹽，其中 R<sup>4</sup> 為雜芳基或 3 至 8 員雜環烷基，且  
該雜芳基選自以下構成的群組：吡啶基、1H-吲唑基、1H-  
四唑基、[1, 2, 4]三唑并[1, 5-a]吡啶基、苯并咪唑基、  
2, 3-二氫苯并𫫇唑基、吡唑基、吡咯并[2, 3-b]吡啶基、  
嘧啶基、吲哚啉基、呋喃基、噻吩基及四氫異喹啉基)；  
及該 3 至 8 員雜環烷基選自以下構成的群組：氮丙啶  
基、三亞甲亞胺基、吡咯啶基、咪唑啶基、哌啶基、哌  
啶基、氮雜環庚烷基、嗎啉基，及 1, 2, 3, 6-四氫吡啶  
基；其中 R<sup>4</sup> 的各基團選擇性經取代基 A-1 取代；

其中取代基 A-1 選自以下構成的群組：

羥基；

側氧基；

氯基；

鹵素；

$C_1-C_6$  烷基，選擇性經選自由取代基 B-1 構成的群組的取代基取代；

$C_3-C_{10}$  環烷基，選擇性經氯基、或有  $-NR^{31}R^{32}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基取代；

$-NR^{21A}R^{22A}$ ，其中  $R^{21A}$  與  $R^{22A}$  各自獨立地表示氫原子； $C_1-C_6$  烷基，選擇性經胺基、二( $C_1-C_6$  烷基) 胺基、 $-SO_2$  ( $C_1-C_6$  烷基)、哌啶基、或氯基取代；或哌啶基，選擇性經  $-COOR^{105}$  取代；

$C_1-C_6$  烷氧基，選擇性經鹵素；3 至 8 員雜環烷基，選自哌啶基與哌啶基，各選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代；或  $-NR^{33}R^{34}$  取代；

$-SO_2NR^{23A}R^{24A}$ ，其中  $R^{23A}$  與  $R^{24A}$  各自獨立地表示氫原子；選擇性經羥基、 $C_1-C_6$  烷氧基、鹵素、 $C_3-C_{10}$  環烷基、吡唑基、咪唑基、或  $-NR^{35}R^{36}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基； $C_3-C_{10}$  環烷基，選擇性經  $C_1-C_6$  羥基烷基取代；三亞甲亞胺；吡咯啶基，或  $R^{23A}$  與  $R^{24A}$  一起形成選擇性經胺基或鹵素取代的吡咯啶基；

$C_1-C_6$  烷基磺醯基，選擇性經羥基取代；

$-NHSO_2(C_1-C_6$  烷基)，其中該碳原子選擇性經  $-NR^{37}R^{38}$

取代；

3 至 8 員雜環烷基，係選自由以下構成的群組：三亞甲亞胺基、吡咯啶基、哌啶基、哌嗪基，及四氫吡啶基，其中任一者選擇性經  $-NR^{39}R^{40}$  取代；選擇性經  $-NR^{41}R^{42}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基；羥基；或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基；

$1H$ -四唑基；

芳基，選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代，其中  $C_1-C_6$  為選擇性經氰基或胺基取代的脂肪族碳；

$-COOR^{11}$ ；及

$-COR^{12A}$ ，其中  $R^{12A}$  表示選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代的哌嗪基； $C_3-C_{10}$  環烷基；氰基甲基；胺基甲基； $-NR^{25}R^{26}$ ，其中  $R^{25}$  與  $R^{26}$  各自獨立地表示氫原子或選擇性經羥基或  $-NR^{43}R^{44}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基；或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基；

其中取代基 B-1 選自以下構成的群組：

鹵素；

羥基；

$C_1-C_6$  烷氧基；

氰基；

環烷基；

苯基，選擇性經氰基取代；

雜芳基，選自由以下構成的群組：咪唑基，吡唑基及噻唑基；

3 至 8 員雜環烷基，選自由以下構成的群組取代：吡咯啶基、哌啶基、哌嗪基、嗎啉基，及環氧化丙烷基，其中

任一者選擇性經羥基、氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 氨基烷基、或選擇性有 C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> 烷基氧羧基氨基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基；

-NR<sup>51A</sup>R<sup>52A</sup>，其中 R<sup>51A</sup> 與 R<sup>52A</sup> 各自獨立地表示氫原子；C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基，選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基磺醯基或選擇性有 -COOR<sup>53</sup> 取代的哌啶基取代；哌啶基；C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基磺醯基；C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基；-COR<sup>55</sup>、-COOR<sup>56</sup>、或 -CONR<sup>57</sup>R<sup>58</sup>；

-COOR<sup>54</sup>；

-CONH<sub>2</sub>；

-SO<sub>2</sub>NR<sup>106</sup>R<sup>107</sup>；

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基亞磺醯基；及

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基磺醯基。

8. 如申請專利範圍第 1 項所示之化合物或其在醫藥上可接受的鹽，其中 R<sup>4</sup> 為選自基團(p)的基團：

其中基團(p)獨立地選自由以下構成的群組：

羥基、

鹵素、

氨基，選擇性經選自由取代基(g)構成的群組的取代基取代，

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基，選擇性經選自由取代基(a)構成的群組的取代基取代，

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基，選擇性經選自由取代基(b)構成的群組的取代基取代，

C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基、

C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烯基、

$C_1-C_6$  烷基，

$C_6-C_{10}$  芳基，選擇性經選自由取代基(c)構成的群組的取代基取代；

二氫茚基，選擇性經選自由取代基(d)構成的群組的取代基取代；

雜芳基，選自由以下構成的群組：吡啶基、 $1H$ -吲唑基、 $1H$ -四唑基、[1, 2, 4]三唑并[1, 5-a]吡啶基、苯并咪唑基、2, 3-二氫苯并噁唑基、吡唑基、吡咯并[2, 3-b]吡啶基、嘧啶基、吲哚啉基、呋喃基、噻吩基及四氫異噠啉基，其中任一者選擇性經選自由取代基(e)構成的群組的取代基取代；及

3 至 8 員雜環烷基，選自由以下構成的群組：吡咯啶基、哌啶基、哌啶基、嗎啉基及 1, 2, 3, 6-四氫吡啶基，其中任一者選擇性經選自由取代基(f)構成的群組的取代基取代；

其中取代基(a)選自以下構成的群組：

$-NR^{21A}R^{22A}$ ，其中  $R^{21A}$  與  $R^{22A}$  各自獨立地表示氫原子； $C_1-C_6$  烷基，選擇性經哌啶基取代；或哌啶基，選擇性經  $-COOR^{105}$  取代；

3 至 8 員雜環烷基，選自由以下構成的群組：吡咯啶基及哌啶基，其中任一者選擇性經選擇性有  $-NR^{41}R^{42}$  或  $-NR^{39}R^{40}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基取代，其中  $R^{39}$  與  $R^{40}$  各自獨立地表示氫原子或  $C_1-C_6$  烷基；及

$-NHSO_2(C_1-C_6\text{ 烷基})$ ；

其中取代基(b)選自以下構成的群組：

$-COOR^{11}$ ；

$-NR^{21a}R^{22a}$ ，其中  $R^{21a}$  與  $R^{22a}$  各自獨立地表示氫原子、或選擇性有二( $C_1-C_6$  烷基)胺基或  $C_1-C_6$  烷基礦醯基取代的  $C_1-C_6$  烷基取代；

3 至 8 員雜環烷基，擇自以下構成的群組：三亞甲亞胺基、吡咯啶基及哌啶基，其中任一者選擇性經  $-NR^{39}R^{40}$ 、選擇性有  $-NR^{41}R^{42}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基、羥基、或  $C_1-C_6$  烷基礦醯基取代；

氟基；及

$C_1-C_6$  烷氧基；

其中取代基(c)選自以下構成的群組：

羥基；

氟基；

鹵素；

$C_1-C_6$  烷基，選擇性經選自由以下取代基 B-C 構成的群組的取代基取代；

$C_3-C_{10}$  環烷基，選擇性經氟基、或有  $-NR^{31}R^{32}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基取代；

$-NR^{21c}R^{22c}$ ，其中  $R^{21c}$  與  $R^{22c}$  各自獨立地表示氫原子或選擇性有胺基或氟基取代的  $C_1-C_6$  烷基取代；

$C_1-C_6$  烷氧基，選擇性經鹵素、3 至 8 員雜環烷基，選自哌啶基及哌啶基，其中任一者選擇性經  $C_1-C_6$  烷基取代、或  $-NR^{33}R^{34}$  取代；

$-SO_2NR^{23c}R^{24c}$ , 其中  $R^{23c}$  與  $R^{24c}$  各自獨立地表示氫原子；選擇性經羥基、 $C_1-C_6$  烷氧基、鹵素、 $C_3-C_{10}$  環烷基、吡唑基、咪唑基或  $-NR^{35}R^{36}$  取代的  $C_1-C_6$  烷基； $C_3-C_{10}$  環烷基，選擇性經  $C_1-C_6$  羥基烷基取代；三亞甲亞胺基；吡咯啶基，或其中  $R^{23c}$  與  $R^{24c}$  一起形成選擇性經胺基或鹵素取代之吡咯啶基；

$C_1-C_6$  烷基磺醯基，選擇性經羥基取代；

$-NHSO_2(C_1-C_6$  烷基)，其中該碳原子選擇性經  $-NR^{37}R^{38}$  取代；

哌啶基，選擇性經  $C_1-C_6$  烷基或  $C_1-C_6$  烷基磺醯基取代；

哌啶基，選擇性經羥基取代；

$1H$ -四唑基；

$1, 2, 3, 6$ -四氫吡啶基；及

$-COR^{12c}$ , 其中  $R^{12c}$  表示哌啶基，其選擇性經  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_{10}$  環烷基、氰基甲基、胺基甲基、 $-NR^{25}R^{26}$ 、或  $C_1-C_6$  烷基取代；及

其中取代基 B-C 選自以下構成的群組：

鹵素；

羥基；

甲氧基；

氰基；

$C_3-C_{10}$  環烷基；

3 至 8 員雜環烷基，選自以下構成的群組：吡咯啶

基、哌啶基、哌啶基、嗎啉基及環氧丙烷基，其中任一者選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、羥基、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 胺基烷基、或有 C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> 烷基氧羧基胺基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基取代；

-NR<sup>51c</sup>R<sup>52c</sup>，其中 R<sup>51c</sup> 與 R<sup>52c</sup> 各自獨立地表示氫原子；C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基，選擇性經 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基磺醯基取代、或哌啶基，選擇性有 -COOR<sup>53</sup> 取代；哌啶基；C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基磺醯基；C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基；-COR<sup>55</sup>；或 -CONR<sup>57</sup>R<sup>58</sup>；

雜芳基擇自以下構成的群組：咪唑基、吡唑基，及噻唑基；

-COOR<sup>54</sup>；

-CONH<sub>2</sub>；

-SO<sub>2</sub>NR<sup>106</sup>R<sup>107</sup>；

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基亞磺醯基；及

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基磺醯基；

其中取代基(d)選自以下構成的群組：

-NR<sup>21d</sup>R<sup>22d</sup>，其中 R<sup>21d</sup> 與 R<sup>22d</sup> 各自獨立地表示氫原子或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基；

其中取代基(e)選自以下構成的群組：

羥基；

側氨基；

氰基；

C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> 環烷基，選擇性經氰基取代；

-NR<sup>21e</sup>R<sup>22e</sup>，其中 R<sup>21e</sup> 與 R<sup>22e</sup> 各自獨立地表示氫原子或選擇性有胺基取代的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基；

哌啶基；

$C_1-C_6$  烷 氧 基，選 擇 性 經  $-NR^{33}R^{34}$  取 代；

$C_1-C_6$  烷 基，選 擇 性 經 氰 基； $-NR^{51e}R^{52e}$ ，其 中  $R^{51e}$  與  $R^{52e}$  各 自 獨 立 地 表 示 氢 原 子、 $C_1-C_6$  烷 基、或  $-COOR^{56}$ ；嗎 啟 基；或 氰 基 苯 基 取 代；

$-CONH_2$ ；

其中 取 代 基 (f) 選 自 以 下 構 成 的 群 組：

$C_1-C_6$  烷 基，選 擇 性 經  $-NR^{51f}R^{52f}$  取 代，其 中  $R^{51f}$  與  $R^{52f}$  各 自 獨 立 地 表 示 氢 原 子、 $C_1-C_6$  烷 基、或  $-COOR^{56}$ ；及  $C_1-C_6$  烷 基 磺 鹽 基；

其中 取 代 基 (g) 為 芳 基，其 選 擇 性 經 具 有 選 擇 性 以 氰 基 或 氨 基 取 代 的 脂 肪 族 碳 的  $C_1-C_6$  烷 基 取 代。

9. 如 申 請 專 利 範 圍 第 1 項 之 以 通 式 (I) 表 示 的 化 合 物，或 其 在 醫 藥 上 可 接 受 的 鹽，其 中  $R^6$  為 氢 原 子；羥 基； $C_1-C_6$  烷 基；選 擇 性 經 1 至 3 個 羥 基 取 代 的 苯 基；選 擇 性 經 氨 基 取 代 的 哌 啟 基；或 哌 啡 基。

10. 如 申 請 專 利 範 圍 第 9 項 所 述 之 化 合 物 或 其 在 醫 藥 上 可 接 受 的 鹽，其 中  $R^7$  為 氢 原 子；選 擇 性 經 羥 基 或 哌 啟 基 取 代 的  $C_1-C_6$  烷 基；或 鹵 素。

11. 如 申 請 專 利 範 圍 第 1 項 所 述 之 化 合 物 或 其 在 醫 藥 上 可 接 受 的 鹽，其 中  $R^7$  為

氫 原 子；

$C_1-C_6$  烷 基，選 擇 性 經 羥 基； $-NR^{71A}R^{72A}$ ，其 中  $R^{71A}$  與  $R^{72A}$  各 自 獨 立 地 代 表 氢 原 子、選 擇 性 有 二 甲 基 氨 基 取 代 的

$C_1-C_6$  烷基、選擇性有胺基取代的  $C_3-C_{10}$  環烷基、或哌啶基；或 3 至 8 員雜環烷基，擇自以下構成的群組：哌啶基及嗎啉基，其中任一者選擇性經  $C_1-C_6$  胺基烷基取代；取代；

苯基，選擇性經 1 至 2 個羥基取代；

苯基磺醯基；或

$-COR^{73A}$ ，其中  $R^{73A}$  表示選擇性經胺基取代的哌啶基、或  $-NR^{74A}R^{75A}$ ，其中  $R^{74A}$  與  $R^{75A}$  各自獨立地表示氫原子、哌啶基、或選擇性有胺基取代的  $C_3-C_{10}$  環烷基。

12. 一種選自以下構成的群組的化合物或其在醫藥上可接受的鹽：

(6): 7, 9-二甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(7): 7, 9-二羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(8): 7, 8, 9-三甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(10): 7, 8, 9-三羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(11): 9-(3-(2-胺基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(42): 9-溴-8-羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(43): 9-(3, 4-二羥基苯基)-8-羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(47): 9-(3, 5-二羥基苯基)-8-羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(48): 8-羥基-9-(3-羥基苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (49): 8-羥基-9-(4-羥基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (50): 9-(3,4-二氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (52): 5-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)2-氯吡啶；
- (53): 9-(6-氨基吡啶-3-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (54): 4-(8-羥基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲酰胺；
- (55): 9-(3-氟-4-羥基苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (58): 9-(3,4-二氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (59): 9-(4-氟-3-羥基苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (60): 8-羥基-9-(3-羥基-5-(三氟甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (61): 8-羥基-9-(1H-吲唑-6-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (62): 8-羥基-9-(3,4,5-三羥基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (63): 9-(4-羥基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (64): 9-(4-(1H-四唑-5-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (65): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (66): 9-(3-氯-4-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (67): 9-(4-氯-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (68): 9-(3,4-二氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (69): 9-(4-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (70): 8-羟基-9-苯基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (71): 9-(4-(二氟甲氧基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (72): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (73): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (74): 9-(3-胺基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (75): 3-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；
- (76): 8-羟基-9-(3,4,5-三氟苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉

-4(5H)-酮；

(77): N-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；

(78): 8-甲氧基-9-苯基噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮；

(79): 8-羥基-9-(萘-2-基)噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮；

(80): 8-羥基-9-(4-(羥基甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮；

(81): 2-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噁啉-9-基)苯基)乙腈；

(82): 8-羥基-9-(4-(甲基磺醯基)苯基)噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮；

(83): 8-羥基-9-(吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮；

(84): 8-羥基-9-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮；

(85): 8-羥基-9-(4-羥基-3-甲氧基苯基)噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮；

(86): 9-(3-氟-4-(N-嗎啉基甲基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮；

(87): 9-(3-(胺基甲基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮；

(88): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噁啉-4(5H)-酮；

- (89): 9-(3-(二氟甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (90): 9-(3-(胺基甲基)苯基)-8-羟基-2-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (91): 9-环己烯基-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (92): 9-(3,5-二氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (93): 9-(4-(2-(二甲基氨基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (94): 9-(3-(胺基甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (95): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基-2-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (96): 9-环丙基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (97): 9-([1,2,4]三唑并[1,5-a]吡啶-6-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (98): 8-甲氧基-9-(1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (99): 9-环己烯基-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (100): 8-甲氧基-9-(4-(哌啶-1-基)乙基氨基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (101): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基-2-(N-吗啉基甲

基) 塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(102): 9-(1H-苯并[d]咪唑-5-基)-8-羟基塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(103): 9-(4-(二氟甲基)苯基)-8-甲氧基塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(104): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-甲氧基-2-(N-吗啉基甲基)塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(105): 8-羟基-9-(4-(2-(哌啶-1-基)乙基胺基)苯基)塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(106): 8-羟基-9-(4-(哌啶-1-基)苯基)塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(109): 5-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢塞吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯并[d]𫫇唑-2(3H)-酮；

(110): 第三丁基 4-(2-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢塞吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基胺基)乙基)哌啶-1-羧酸酯；

(111): 8-甲氧基-9-(4-(哌啶-1-基)苯基)塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(112): 8-羟基-9-(4-(4-(甲基磺酰基)哌啶-1-基)苯基)塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(113): 8-羟基-9-(4-((哌啶-3-基胺基)甲基)苯基)塞吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(114): N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢塞吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲酰胺；

- (115): 9-(4-(3-(二甲基胺基)丙氧基)苯基)-8-甲氧基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (116): 8-甲氧基-9-(1-(哌啶-4-基)-1H-吡唑-4-基)噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (117): 8-羟基-9-(1-(哌啶-4-基)-1H-吡唑-4-基)噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (120): N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氧  
基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲酰胺；
- (122): (E)-丁基 3-(8-羟基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩  
并[2,3-c]喹啉-9-基)丙烯酸酯；
- (123): 8-甲氧基-9-(1H-吡咯并[2,3-b]吡啶-5-基)噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (124): 8-羟基-9-(1H-吡咯并[2,3-b]吡啶-5-基)噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (125): N-(2-(4-(8-甲氧基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并  
[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)乙酰胺；
- (126): N-(2-氨基乙基)-4-(8-羟基-4-侧氧基-4,5-二  
氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲酰胺；
- (127): N-(2-氨基乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氧基-4,5-  
二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲酰胺；
- (128): N-(2-(4-(8-羟基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并  
[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)乙酰胺；
- (130): 8-羟基-9-(4-(4-甲基哌啶-1-羰基)苯基)噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(131): 8-甲氧基-9-(4-(4-甲基哌啶-1-羧基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(132): 8-羟基-9-(4-((4-甲基哌啶-1-基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(133): 8-甲氧基-9-(4-((4-甲基哌啶-1-基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(134): (E)-9-(3-(二乙基氨基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(135): (E)-9-(3-(4-(氨基甲基)哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(136): (E)-9-(3-(2-(二乙基氨基)乙基氨基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(138): 9-(2-(二甲基氨基)嘧啶-5-基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(139): 第三丁基 (1-(4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基)哌啶-4-基)甲基胺基甲酸酯；

(140): 8-羟基-9-(4-(4-甲基哌啶-1-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(141): 8-甲氧基-9-(4-(4-甲基哌啶-1-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(142): 8-甲氧基-9-(1-(甲基磺酰基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(143): (E)-9-(3-(二乙基氨基)丙-1-烯基)-8-羟基噻

吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(144): 9-(3-(4-(胺基甲基)哌啶-1-基)丙基)-8-甲氧基  
基吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(145): 9-(4-(3-(2-(二乙基胺基)乙基胺基)丙氧基)苯基)-8-甲  
氧基基吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(146): 9-(4-(3-(二乙基胺基)丙氧基)苯基)-8-甲氧基  
基吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(147): 9-(4-(3-(2-(二乙基胺基)乙基胺基)丙氧基)苯基)-8-羟  
基基吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(148): (E)-9-(3-(4-(胺基甲基)哌啶-1-基)丙-1-烯  
基)-8-羟基基吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(149): 9-(4-(3-(二甲基胺基)丙氧基)苯基)-8-羟基基  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(150): 8-羟基-9-(4-(2-(哌啶-1-基)乙氧基)苯基)基  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(151): 9-(4-(2-(乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-羟基基  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(152): (E)-9-(3-(4-胺基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲  
氧基基吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(153): 9-(1-(2-胺基乙基)-1,2,3,6-四氢吡啶-4-  
基)-8-甲氧基基吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(154): 9-(4-(2-(乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-甲氧基基  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(155): 9-(4-(2-(二乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-羟基基

吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(156): 9-(4-(2-(二乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-甲氧基

噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(157): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙氧基)苯基)-8-羟基噻

吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(158): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙氧基)苯基)-8-甲氧基

噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(159): 8-甲氧基-9-(4-(2-(哌啶-1-基)乙氧基)苯基)

噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(160): 8-甲氧基-9-(3-(2-(4-甲基哌啶-1-基)乙氧基)

苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(161): 9-(3-(2-(二乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-甲氧基

噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(162): 9-(3-(3-(二乙基胺基)丙氧基)苯基)-8-甲氧基

噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(163): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻

吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(164): 9-(4-((二甲基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩

并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(165): 9-(4-((二甲基胺基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并

[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(166): 9-(3-(2-(二乙基胺基)乙氧基)苯基)-8-羟基噻

吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(167): 8-羟基-9-(3-(2-(4-甲基哌啶-1-基)乙氧基)苯

基) 嘧 吩 并 [2, 3-c] 喹 吼 -4(5H)- 酮 ;

(168): N- 乙 基 -N-(2-(4-(8- 甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吼 -9- 基 ) 苯 氧 基 ) 乙 基 ) 甲 烷 磺 醚 肽 ;

(169): 9-(4-(2- 胍 基 乙 基 ) 苯 基 ) -8- 甲 氧 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吼 -4(5H)- 酮 ;

(170): 2-(3-(8- 羥 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吼 -9- 基 ) 苯 基 ) 乙 脂 ;

(171): 2-(3-(8- 甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吼 -9- 基 ) 苯 基 ) 乙 脂 ;

(172): 9-(1-(2-(二 甲 基 胍 基 ) 乙 基 ) -1, 2, 3, 6- 四 氢 吡 呤 -4- 基 ) -8- 羥 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吼 -4(5H)- 酮 ;

(173): N-(2-(4-(8- 羥 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吼 -9- 基 ) 苯 基 ) 乙 基 ) 甲 烷 磺 醚 肽 ;

(174): 9-(1-(2-(二 乙 基 胍 基 ) 乙 基 ) -1, 2, 3, 6- 四 氢 吡 呤 -4- 基 ) -8- 羥 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吼 -4(5H)- 酮 ;

(175): 9-(4-(2- 胍 基 乙 基 ) 苟 基 ) -8- 羥 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吼 -4(5H)- 酮 ;

(176): 9-(4-(2- 胍 基 乙 基 ) 苟 基 ) -8- 羥 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吼 -4(5H)- 酮 ;

(177): N-(2-(4-(8- 甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吼 -9- 基 ) 苟 基 ) 乙 基 ) 甲 烷 磺 醚 肽 ;

(178): N-(2-(3-(8- 甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吼 -9- 基 ) 苟 基 ) 乙 基 ) 甲 烷 磺 醚 肽 ;

(179): N-(2-胺基乙基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

(183): 9-(4-((二乙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(184): 9-(4-((二乙基胺基)甲基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(185): 9-(3-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(186): 9-(3-(2-胺基乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(187): 8-羥基-9-(4-((甲基胺基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(188): 8-甲氧基-9-(4-((甲基胺基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(189): 9-(4-胺基-3-甲氧基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(190): 3-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲腈；

(191): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(192): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(193): N-(1-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺醯胺；

- (194): 8-羥基-9-(4-(1-(吡咯啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (195): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (196): 9-(4-(1-(二乙基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (197): N-(2-胺基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (198): N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (199): 4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(吡咯啶-3-基)苯磺醯胺；
- (200): N-(三亞甲亞胺-3-基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (201): 9-(4-(2-(二乙基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (202): 2-胺基-N-(3-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺；
- (203): 4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲腈；
- (204): 4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲腈；
- (205): (E)-9-(3-(3-胺基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (206): N-(2-羥基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (207): 8-甲氧基-9-(5-甲氧基吡啶-3-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (209): 9-(4-(3-胺基吡咯啶-1-基磺醯基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (210): N-(2-溴乙基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (211): 9-(4-((二異丙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (212): N-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基)甲烷磺醯胺；
- (213): 9-(4-((異丙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (214): 2-(二甲基胺基)-N-(3-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺；
- (215): 2-胺基-N-(3-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺；
- (216): 8-甲氧基-9-(4-(1-(吡咯啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (217): 9-(4-胺基-3-羥基苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (218): N-(2-甲氧基-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；

(219): 9-(3,5-二氟-4-羟基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(220): N-(2-羟基-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；

(221): 9-(4-((4-(氨基甲基)哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(222): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(223): 9-(3,5-二氟-4-羟基苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(224): 6-氟-8-甲氧基-9-(1,2,3,6-四氢吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(225): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-6-氟-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(226): 9-(4-((二乙基胺基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(227): (E)-9-(3-(3-羟基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(228): (E)-8-羟基-9-(3-(3-羟基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(229): 8-羟基-9-(4-((异丙基胺基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(230): (E)-9-(3-(3-氨基三亚甲亚胺-1-基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (231): (E)-8-甲氧基-9-(3-(2-(甲基磺醯基)乙基胺基)丙-1-烯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (232): (S)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (233): (S)-9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (235): 9-(4-((4-(氨基甲基)哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (236): 8-甲氧基-9-(4-(1-(2-(甲基磺醯基)乙基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (237): 9-(4-((3-氨基吡咯啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (238): (E)-9-(3-(3-氨基三亞甲亞胺-1-基)丙-1-烯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (239): (E)-9-(3-(乙基胺基)丙-1-烯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (240): 9-(4-((3-氨基哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (241): 9-(4-((3-氨基吡咯啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (242): 9-(4-((3-氨基哌啶-1-基)甲基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (243): 8-羟基-9-(4-(1-(2-(甲基磺醯基)乙基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (244): (E)-9-(3-(3-胺基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-甲  
氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (245): (E)-9-(3-(3-胺基吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)-8-  
羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (246): (E)-9-(3-(3-胺基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羥  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (247): (E)-8-羥基-9-(3-(2-(甲基磺醯基)乙基胺基)  
丙-1-烯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (248): 8-甲氧基-9-(4-(2-(甲基磺醯基)乙基胺基)  
乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (249): 2-(2-氟-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩  
并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙腈；
- (250): (E)-N-(1-(3-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻  
吩并[2,3-c]喹啉-9-基)烯丙基)三亞甲亞胺-3-基)甲  
烷磺醯胺；
- (251): 4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]  
喹啉-9-基)-N,N-二甲基苯磺醯胺；
- (252): 4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]  
喹啉-9-基)-N-甲基苯磺醯胺；
- (253): 第三丁基 (5-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)呋喃-2-基)甲基胺基甲酸  
酯；
- (254): N-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并  
[2,3-c]喹啉-9-基)-2-甲基苯基)甲烷磺醯胺；

(255): N-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)-2-甲基苯基)甲烷磺醯胺；

(256): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-6-氟-8-羥基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮；

(257): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-6-氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮；

(258): 6-氟-8-羥基-9-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮；

(259): 9-(4-((二乙基胺基)甲基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮；

(260): 8-甲氧基-9-(4-(1-(哌啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮；

(261): 2-(2-氟-4-(8-羥基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]噠啉-9-基)苯基)乙腈；

(262): 8-羥基-9-(4-(1-(哌啶-1-基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮；

(263): (E)-9-(3-(3-(二甲基胺基)哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮；

(264): (E)-9-(3-(3-(二甲基胺基)吡咯啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮；

(265): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮；

(266): 9-(5-(胺基甲基)噻吩-2-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]噠啉-4(5H)-酮；

(267): 9-(4-((乙基胺基)甲基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(268): (E)-9-(3-(4-胺基哌啶-1-基)丙-1-烯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(269): 9-(4-((乙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(270): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-6-溴-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(271): 9-(3-氯-4-((二乙基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(272): (R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(273): 9-(4-(3-胺基丙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(274): (R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(275): (R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(276): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(277): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(278): 9-(3-氟-4-((3-羥基吡咯啶-1-基)甲基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (279): 9-(3-氟-4-((3-羟基吡咯啶-1-基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (280): 4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2,2,2-三氟乙基)苯磺醯胺；
- (281): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2,2,2-三氟乙基)苯磺醯胺；
- (282): N-(2-(二甲基胺基)乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (283): 8-羟基-9-(4-((2-(甲基磺醯基)乙基胺基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (284): 9-(3-(3-(二甲基胺基)吡咯啶-1-基)丙基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (285): 9-(1-(2-氨基乙基)-1H-吡唑-4-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (286): 9-(3-氯-4-((二乙基胺基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (287): 4-(7-氟-8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺醯胺；
- (288): 9-(3-乙醯基苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (289): 2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯甲醯胺；
- (290): 3-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈；

(291): 9-(4-乙醯基苯基)-8-甲氧基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(292): 2-氟-N-(2-羟基乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲酰胺；

(293): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯甲酰胺；

(294): 1,1-二乙基-3-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苄基)尿素；

(295): N-(2-羟基乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯甲酰胺；

(296): 9-(4-乙醯基苯基)-8-羟基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(297): N-(2-溴乙基)-2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(298): 9-(3-(3-(二甲基胺基)哌啶-1-基)丙基)-8-羟基噁吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(299): N-(2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯乙基)甲烷磺酰胺；

(300): 9-(3-氟-4-(2-(甲基磺酰胺基)乙基)苯基)-4-侧氨基-4,5-二氢噁吩并[2,3-c]喹啉-8-基甲烷磺酸酯；

(301): (R)-N-(1-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噁吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺酰胺；

(302): (R)-9-(4-(1-(甲基磺酰胺基)乙基)苯基)-4-侧

氧基 -4, 5- 二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 啉 -8- 基 甲 烷 磺 酸 酯 ;

(303): 2- 氟 -N-(2- 羟 基 乙 基 )-4-(8- 甲 氧 基 -4- 側 氧 基  
-4, 5- 二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 啉 -9- 基 ) 苯 磺 醚 胺 ;

(304): 4-(8- 羟 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c]  
喹 啉 -9- 基 )-N, N- 二 甲 基 苯 磺 醚 胺 ;

(305): 9-(4-(2-(二 甲 基 胺 基 ) 乙 基 ) 苯 基 )-7- 氟 -8- 甲  
氧 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 啉 -4(5H)- 酮 ;

(306): N-(2- 溴 乙 基 )-4-(7- 氟 -8- 羟 基 -4- 側 氧 基 -4, 5-  
二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 啉 -9- 基 ) 苯 磺 醚 胺 ;

(307): 4-(7- 氟 -8- 羟 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩 并  
[2, 3-c] 喹 啉 -9- 基 )-N-(2- 羟 基 乙 基 ) 苯 磺 醚 胺 ;

(308): 9-(4-(1-(二 甲 基 胺 基 )-2- 甲 基 丙 -2- 基 ) 苯  
基 )-8- 羟 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 啉 -4(5H)- 酮 ;

(309): N-(2- 氟 -4-(8- 甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩  
并 [2, 3-c] 喹 啉 -9- 基 ) 苄 基 )-N- 甲 基 甲 烷 磺 醚 胺 ;

(310): 4-(8- 羟 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c]  
喹 啉 -9- 基 )-N-(2- 甲 氧 基 乙 基 ) 苯 磺 醚 胺 ;

(311): (E)-3-(8- 甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩 并  
[2, 3-c] 喹 啉 -9- 基 )-2- 甲 基 丙 烯 脂 ;

(312): N-(2- 氟 -4-(8- 甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩  
并 [2, 3-c] 喹 啉 -9- 基 ) 苯 乙 基 ) 甲 烷 磺 醚 胺 ;

(313): 8- 羟 基 -9-(4-(1- 羟 基 乙 基 ) 苯 基 ) 噻 吩 并 [2, 3-c]  
喹 啉 -4(5H)- 酮 ;

(314): 9-(4-(1-(環 戊 基 胺 基 ) 乙 基 ) 苟 基 )-8- 羟 基 噻 吩

并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(315): 9-(4-(1-(環戊基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(316): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺醯胺；

(317): 9-(5-(胺基甲基)呋喃-2-基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(318): 9-(3-氯-4-((甲基胺基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(319): 9-(4-(2-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(320): N-(3-羟基丙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

(321): 2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺醯胺；

(322): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)-N-(3-羟基丙基)苯磺醯胺；

(323): N-(3-溴丙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

(324): 2-氟-4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)-N-(2-甲氧基乙基)苯磺醯胺；

(325): 9-(3-氯-4-((甲基胺基)甲基)苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(326): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-4-侧氨基-4, 5-二氢噻

吩并[2,3-c]喹啉-8-腈；

(327): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(328): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-6,7-二氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(329): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(330): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基三氟甲烷磺酸酯；

(331): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(332): N-(2-氯乙基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

(333): N-(2-氯乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

(334): 9-(4-(2-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(335): (S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(336): 9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(337): 9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(338): 9-(4-(1-(二乙基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩

并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(339): 9-(4-(1-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩

并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(340): 9-氨基-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(341): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-6, 7-二氟-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(342): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-6, 7-二氟-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(343): N-环丙基-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(344): N-环丙基-4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(345): 9-(2-氨基-2, 3-二氢-1H-茚-5-基)-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(346): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(347): (S)-N-(1-(4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯基)乙基)甲烷磺酰胺；

(348): 9-(4-(1-(氨基甲基)环丙基)苯基)-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(349): 9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(350): N-(1-(羟基甲基)环戊基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-

- 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -9- 基 ) 苯 磺 鹽 胺 ;
- (351): 9-(2-(二乙基胺基)-2, 3-二氢-1H-茚-5-基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮;
- (352): 9-(2-(二甲基胺基)-2, 3-二氢-1H-茚-5-基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮;
- (353): 8-羟基-9-(1, 2, 3, 4-四氢異喹啉-7-基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮;
- (354): 8-甲氧基-9-(1, 2, 3, 4-四氢異喹啉-7-基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮;
- (355): 3-(3-(8-羟基-4-側氧基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈;
- (356): 9-(4-(1-(二乙基胺基)乙基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮;
- (357): 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)環丙腈;
- (358): 9-(2-乙基-1, 2, 3, 4-四氢異喹啉-7-基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮;
- (359): 9-(4-(1-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮;
- (360): 3-(3-(8-甲氧基-4-側氧基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈;
- (361): 1-(4-(8-羟基-4-側氧基-4, 5-二氢噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)環丙腈;
- (362): 9-(2-胺基-2, 3-二氢-1H-茚-5-基)-8-甲氧基噻

吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(363): N-異戊基-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻  
吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

(364): 9-(2-(二甲基胺基)-2,3-二氫-1H-茚-5-基)-8-  
甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(365): 9-(4-(1-(乙基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(366): 6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(367): 9-(4-(環丙烷羰基)苯基)-8-甲氧基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(368): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氫噻  
吩并[2,3-c]喹啉-8-羧醯胺；

(369): 9-(2-胺基乙基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉  
-4(5H)-酮；

(370): 8-羥基-9-(4-(2-羥基乙基磺醯基)苯基)噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(371): 9-(4-(2-羥基乙基磺醯基)苯基)-8-甲氧基噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(372): 9-(1-乙基吲哚啉-5-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]  
喹啉-4(5H)-酮；

(373): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(374): 8-羥基-9-(2-甲基-1,2,3,4-四氫異喹啉-7-基)

噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(375): 9-(4-(1-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(376): 8-羟基-9-(1-甲基吲哚啉-5-基)噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(377): 8-羟基-9-(吲哚啉-5-基)噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(378): 9-(吲哚啉-5-基)-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(379): 9-(4-(1-((二甲基胺基)甲基)环丙基)苯基)-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(380): 4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)-N-丙基苯磺酰胺；

(381): N-(环丙基甲基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(382): N-(3, 3-二甲基丁基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(383): 4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)-N-异戊基苯磺酰胺；

(384): N-(3, 3-二甲基丁基)-4-(8-羟基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-9-基)苯磺酰胺；

(385): 9-(4-(1-(乙基胺基)乙基)苯基)-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(386): 3-(4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二氢噻吩并

[2, 3-c] 嘧 啡 -9- 基 ) 苯 基 ) -3- 側 氧 基 丙 脂 ;

(387): (E)-9-(2-乙 氧 基 乙 烯 基 )-8-甲 氧 基 嘧 啡 并 [2, 3-c] 嘧 啡 -4(5H)- 酮 ;

(388): N-(1-(4-(8-羥 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 嘧 啡 并 [2, 3-c] 嘧 啡 -9- 基 ) 苯 基 ) 乙 基 ) 乙 鏈 肓 ;

(389): 4-(8-甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 嘙 啡 并 [2, 3-c] 嘙 啡 -9- 基 )-N-(3, 3, 3- 三 氟 丙 基 ) 苯 磺 鏈 肓 ;

(390): 4-(8-羥 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 嘙 啡 并 [2, 3-c] 嘙 啡 -9- 基 )-N-(1-(羥 基 甲 基 ) 環 戊 基 ) 苯 磺 鏈 肓 ;

(391): N-(2, 2- 二 氟 乙 基 )-4-(8-甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 嘙 啡 并 [2, 3-c] 嘙 �啡 -9- 基 ) 苯 磺 鏈 肓 ;

(1031): 8-甲 氧 基 -9-(4-(1-甲 氧 基 乙 基 ) 苯 基 ) 嘙 啡 并 [2, 3-c] 嘙 啡 -4(5H)- 酮 ;

(1032): 9-(4-(1-胺 基 乙 基 ) 苟 基 )-6-溴 -8-羥 基 嘙 啡 并 [2, 3-c] 嘙 啡 -4(5H)- 酮 ;

(1033): 8-甲 氧 基 -9-(2-((哌 定 -3- 基 甲 基 ) 胺 基 ) 乙 基 ) 嘙 啡 并 [2, 3-c] 嘙 啡 -4(5H)- 酮 ;

(1034): 9-(2-(4-((二 甲 基 胺 基 ) 甲 基 ) 哌 定 -1- 基 ) 乙 基 )-8-甲 氧 基 嘙 啡 并 [2, 3-c] 嘙 啡 -4(5H)- 酮 ;

(1035): 第 三 丁 基 4-((2-(8-甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 嘙 啡 并 [2, 3-c] 嘙 啡 -9- 基 ) 乙 基 ) 胺 基 ) 哌 定 -1- 羥 酸 酯 ;

(1036): 8-甲 氧 基 -9-(2-(哌 定 -4- 基 胺 基 ) 乙 基 ) 嘙 啡 并 [2, 3-c] 嘙 啡 -4(5H)- 酮 ;

- (1037): 4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(3,3,3-三氟丙基)苯磺醯胺；
- (1039): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-環丙基-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1040): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-6-睛；
- (1041): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1042): 8-羥基-9-(2-(4-((甲基胺基)甲基)哌啶-1-基)乙基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1043): 8-甲氧基-9-(2-(4-((甲基胺基)甲基)哌啶-1-基)乙基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1044): 9-(2-(4-((二甲基胺基)甲基)哌啶-1-基)乙基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1045): 9-(4-(1-羥基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1046): (R)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1049): 9-(4-(4-羥基哌啶-4-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1050): (R)-8-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1051): 8-羥基-9-(4-(1,2,3,6-四氫吡啶-4-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1052): (R)-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1053): 8-羥基-9-(4-(1-羥基丙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1054): (R)-8-羥基-9-(4-(1-羥基乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1055): 8-羥基-9-(4-(4-羥基哌啶-4-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1056): (S)-8-羥基-9-(4-(1-羥基乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1057): N-(1-羥基丙-2-基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳)噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (1058): 9-(4-(羥基(塞唑-2-基)甲基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1059): 9-(6-(1-胺基乙基)吡啶-3-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1060): 9-(4-(4-羥基丁基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1061): 2-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳)噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙醯胺；
- (1062): N-(1-溴丙-2-基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氳)噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (1063): 8-羥基-9-(4-(羥基(塞唑-2-基)甲基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1064): (S)-8-甲 氧 基 -9-(4-(1-(甲 基 胺 基)乙 基)苯 基) 噻 吩 并 [2, 3-c] 噩 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1065): 9-(6-(1-(二 乙 基 胺 基)乙 基)吡 啶 -3- 基)-8- 羥 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1066): 9-(4-(1- 胺 基 乙 基)苯 基)-8- 羥 基 -6- 甲 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1067): 9-(6-(1- 胺 基 乙 基)吡 啶 -3- 基)-8- 甲 氧 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1068): 8- 羥 基 -9-(4-(4- 羥 基 丁 基)苯 基) 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1069): 9-(4-(3- 胺 基 -1- 羥 基 丙 基)苯 基)-8- 甲 氧 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1070): 9-(6-(1-(二 甲 基 胺 基)乙 基)吡 啶 -3- 基)-8- 羥 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1071): 9-(6-(1-(二 甲 基 胺 基)乙 基)吡 啶 -3- 基)-8- 甲 氧 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1072): 4-((4-(8- 甲 氧 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吲 -9- 基)-1H- 吡 喹 -1- 基)甲 基)苯 甲 脂 ;

(1074): 9-(4-((1H- 吡 喹 -1- 基)甲 基)苯 基)-8- 甲 氧 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1075): 9-(6-(1- 胺 基 乙 基)吡 啶 -3- 基)-8- 甲 氧 基 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1076): 9-(4-(1- 胺 基 乙 基)苯 基)-4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻 吩 并 [2, 3-c] 噬 吲 -8- 基 二 甲 基 胺 基 甲 酸 酯 ;

(1077): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氫  
噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基異丙基碳酸酯；

(1078): 9-(4-((1H-咪唑-1-基)甲基)苯基)-8-甲氧基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1079): N-(2-溴丙基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

(1080): (R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6,7-二氯-8-羥  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1081): (R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-氯-8-羥基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1082): (S)-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1083): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氫  
噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基二乙基胺基甲酸酯；

(1084): 4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]  
喹啉-9-基)-N-(2-羥基乙基)-N-甲基苯磺醯胺；

(1085): N-(2-羥基乙基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-  
二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-甲基苯磺醯胺；

(1086): 9-(4-((1H-吡唑-1-基)甲基)苯基)-8-羥基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1087): (S)-6-氯-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)  
苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1088): 9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1089): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氫  
噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基嗎啉-4-羧酸酯；
- (1091): 8-溴噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1092): 9-(4-(2-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-羥基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1093): 9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1095): 9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-8-羥基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1096): 8-甲氧基-9-(1-(2-N-嗎啉基乙基)-1H-吡唑  
-4-基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1097): 9-(4-(2-(二乙基胺基)丙基)苯基)-8-羥基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1098): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基-6-(羥基甲  
基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1099): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氫  
噻吩并[2,3-c]喹啉-8-基乙酸酯；
- (1100): 9-(1-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-1H-吡唑-4-  
基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1101): 9-(4-((1H-咪唑-1-基)甲基)苯基)-8-羥基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1102): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-(2-嗎啉基乙氧基)  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1103): 8-羥基-9-(1-(2-N-嗎啉基乙基)-1H-吡唑-4-

基) 噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1104): N-(2-(1H-吡唑-1-基)乙基)-4-(8-羟基-4-側  
氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

(1105): 8-羟基-9-(4-(2,2,2-三氟-1-羟基乙基)苯基)  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1106): 9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1107): N-(2-(4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氳  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-甲基丙基)甲烷磺醯胺；

(1108): 9-(4-(2-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-甲氧基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1109): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉  
-4(5H)-酮；

(1110): 9-(1-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-1H-吡唑-4-  
基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1111): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1112): 9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1113): 8-甲氧基-9-(4-(2,2,2-三氟-1-羟基乙基)苯  
基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1114): N-(2-溴乙基)-4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氳  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-甲基苯磺醯胺；

(1115): N-(2-(1H-咪唑-1-基)乙基)-4-(8-羟基-4-側

氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

(1116): 9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1117): 3-(4-(8-(2-(二甲基胺基)乙氧基)-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈；

(1118): (R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1119): N-(2-氯乙基)-4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)-N-甲基苯磺醯胺；

(1120): (S)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1121): (S)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1122): (R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1123): (R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-溴-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1124): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8-腈；

(1125): 9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-(羥基甲基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1126): (R)-6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1127): (S)-9-(4-(1-(乙基胺基)丙基)苯基)-8-羥基

噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1128): (S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙基)苯基)-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1129): 6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1130): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-6-乙炔基-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1131): (R)-9-(4-(1-氨基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1132): (R)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1133): 9-(4-(2-氨基乙基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1134): 9-(4-(1-氨基乙基)苯基)-8-(二氟甲基)噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1135): (R)-6-溴-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1136): 9-(4-(1-氨基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1137): 9-(4-丁基苯基)-8-甲氧基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1138): 9-(4-丁基苯基)-8-羟基噻吩并 [2, 3-c] 喹啉-4(5H)-酮；

(1139): N-(2-氯乙基)-4-(8-甲氧基-4-侧氨基-4, 5-二

氫 嘧 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -9- 基 ) 苯 磺 鹼 胺 ;

(1140): 9-(4-((3-溴 吡 呲 -1- 基 ) 磺 鹼 基 ) 苯 基 )-8- 細  
基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -4(5H)- 酮 ;

(1141): (S)-9-(4-(1-(甲 基 磺 鹼 胺 基 ) 丙 基 ) 苟 基 )-4-  
側 氧 基 -4, 5- 二 氢 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -8- 基 甲 烷 磺 酸  
酯 ;

(1142): 9-(4-(2- 胺 基 乙 基 ) 苟 基 )-6- 溴 -8- 細 基 嘙 吩 并  
[2, 3-c] 喹 吡 -4(5H)- 酮 ;

(1143): 9-(4-(3-(二 甲 基 胺 基 )-1- 細 基 丙 基 ) 苟 基 )-8-  
甲 氧 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -4(5H)- 酮 ;

(1144): N-(2- 溴 乙 基 )-4-(6- 氯 -8- 細 基 -4- 側 氧 基  
-4, 5- 二 氢 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -9- 基 ) 苟 磺 鹼 胺 ;

(1146): N-(2- 溴 乙 基 )-4-(5- 乙 基 -8- 細 基 -4- 側 氧 基  
-4, 5- 二 氢 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -9- 基 ) 苟 磺 鹼 胺 ;

(1147): (S)-8- 甲 氧 基 -9-(4-(1-(甲 基 胺 基 ) 丙 基 ) 苟 基 )  
噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -4(5H)- 酮 ;

(1148): (S)-8- 細 基 -9-(4-(1-(甲 基 胺 基 ) 丙 基 ) 苟 基 )  
噻 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -4(5H)- 酮 ;

(1149): 9-(4-(1- 胺 基 乙 基 ) 苟 基 )-8-(((2- 細 基 乙 基 )  
胺 基 ) 甲 基 ) 噹 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -4(5H)- 酮 ;

(1150): (R)-9-(4-(1- 胺 基 丙 基 ) 苟 基 )-6- 溴 -8- 細 基 嘙  
吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -4(5H)- 酮 ;

(1151): (R)-9-(4-(1-(二 甲 基 胺 基 ) 丙 基 ) 苟 基 )-8- 細  
基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吡 -4(5H)- 酮 ;

(1152): 8-羥基-9-(4-戊基苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1153): 9-(4-(2-胺基乙醯基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1154): (S)-6-氯-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1155): 8-羥基-9-(4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1156): 8-甲氧基-9-(4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1157): (R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1158): (R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1159): (R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1160): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1161): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1162): 2-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丁腈；

(1163): (S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1164): (S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1165): 6-氯-8-羟基-9-(4-(2-(甲基氨基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1166): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1167): 9-(4-(2-胺基乙基)-3,5-二氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1168): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1169): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1170): 6-氯-8-甲氧基-9-(4-(2-(甲基氨基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1171): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1172): (S)-9-(4-(1-(二甲基氨基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1173): 6-溴-8-甲氧基-9-(4-(2-(甲基氨基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1174): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1175): (R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-6-氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1176): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1177): 9-(4-(2-胺基乙基)-3,5-二氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1178): 9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)-3,5-二氟苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1179): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1180): (S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6,7-二氟-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1181): (S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1182): (S)-6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1183): 6-溴-8-羥基-9-(4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1185): N-(2-羥基乙基)-4-(8-甲氧基-5-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

(1186): 甲基 3-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙酸酯；

(1187): (R)-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1188): (R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1189): (R)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)

苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1190): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-

甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1191): 9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩

并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1192): 9-(4-(2-胺基乙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻

吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1193): 9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-3-氟苯

基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1194): (S)-6-氯-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-

基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1195): (S)-6-氯-9-(4-(1-(二乙基胺基)丙-2-基)苯

基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1196): (S)-8-甲氧基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)

苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1197): (S)-8-羟基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯

基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1198): 4-(8-羟基-5-甲基-4-侧氧基-4,5-二氢噻吩并

[2,3-c]喹啉-9-基)-N-(2-羟基乙基)苯磺醯胺；

(1199): N-(2-溴乙基)-4-(8-羟基-5-甲基-4-侧氧基

-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；

(1200): (R)-6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯

基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1201): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-甲  
氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1202): 9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1203): 9-(4-(2-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-2-(苯基  
磺醯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1204): N-(1-氯丙-2-基)-4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-  
二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (1205): N-(1-氯丙-2-基)-4-(8-甲氧基-4-側氧基  
-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯磺醯胺；
- (1206): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-羟基苯基)-8-羟基噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1207): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-甲氧基苯基)-8-甲氧基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1208): 9-(4-(2-胺基乙基)-2-氯-5-甲氧基苯基)-8-  
甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1209): 9-(4-(3-(胺基甲基)戊-3-基)苯基)-8-羟基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1210): (R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-8-羟基-5,6-二  
甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1211): 9-(4-(2-胺基乙基)-2-氯-5-羟基苯基)-6-氯  
-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1212): 9-(4-(胺基甲基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并  
[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1213): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-溴-8-羟基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1214): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-溴-8-甲氧基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1215): (S)-8-羟基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基氨基)丙  
-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1216): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-  
甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1217): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1218): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-氯-8-甲氧基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1219): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-氯-8-羟基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1220): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-环丙基-8-  
甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1221): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氟苯基)-6-环丙基-8-  
羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1222): (S)-8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基氨基)丙  
-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1223): (S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1224): 9-(4-(2-胺基乙基)-2-溴-5-羟基苯基)-8-羟  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1225): (S)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基-6-甲基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1226): 3-(4-(8-羥基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻  
吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈；
- (1227): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-甲氧  
基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1228): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羥基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1229): 2-(2-氟-4-(8-羥基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二  
氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈；
- (1230): 6-環丙基-9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)-3-氟  
苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1231): 6-環丙基-9-(4-(2-(二甲基胺基)乙基)-3-氟  
苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1232): (S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基-6-  
甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1233): (S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-  
羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1234): 9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1235): 9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1236): 9-(4-(2-胺基-1-環戊基乙基)苯基)-8-羥基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1237): 9-(4-(2-胺基-1,1-二環戊基乙基)苯基)-8-甲  
氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1238): 3-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氨基-4,5-二氳  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙腈；
- (1239): 9-(4-(2-胺基-1-環戊基乙基)苯基)-8-甲氧基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1240): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-環丙  
基-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1241): 9-(4-(3-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1242): 9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩  
并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1243): 9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻  
吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1244): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-環丙  
基-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1245): 6-溴-9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯  
基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1246): 6-溴-9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯  
基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1247): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-  
羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1248): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-溴-8-  
甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1249): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-8-腈；
- (1250): (R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-8-羥基-6-乙烯基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1251): 9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1252): 9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1253): 9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1254): 9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1255): (R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-乙基-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1256): (R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-(二氟甲基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1257): 9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1258): 9-(3-氟-4-(2-(甲基胺基)乙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1259): 6-溴-9-(4-(1-(二甲基胺基)-2-甲基丙-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1260): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1261): 9-(4-(3-胺基丙基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1262): (R)-8-羥基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1263): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1264): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1265): (R)-8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1266): 9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-6-乙基-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1267): (R)-9-(4-(1-胺基乙基)苯基)-6-丁基-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1268): 9-(4-(2-胺基乙基)-3-氯苯基)-6-氯-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1269): 9-(4-(2-胺基丙基)苯基)-6-乙基-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1270): 2-(4-(8-甲氧基-4-側氨基-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)-2-(環氧丙烷-3-基)乙腈；
- (1271): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1272): (R)-6-乙基-8-羥基-9-(4-(1-(甲基胺基)乙基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1273): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1274): 9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1275): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1276): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1277): 9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1278): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1279): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1280): 9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氯苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1281): 9-(4-(2-胺基-2-甲基丙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1282): 9-(4-(2-胺基-2-甲基丙基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1283): 9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)-3-氯苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1284): 8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(3-甲基-1-(甲基胺基)丁-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1285): 8-羥基-6-甲基-9-(4-(3-甲基-1-(甲基胺基)丁-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1286): 9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1287): 9-(4-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1288): 9-(4-(1-胺基-3-甲基丁-2-基)-3-氟苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1289): 9-(4-(2-胺基-2-甲基丙基)苯基)-6-溴-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1290): 9-(4-(1-(胺基甲基)環丁基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1291): 9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1292): 9-(4-(2-胺基-2-甲基丙基)苯基)-6-溴-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1293): 9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1294): 9-(3-氟-4-(3-甲基-1-(甲基胺基)丁-2-基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1295): 9-(4-(1-(二甲基胺基)-3-甲基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1296): 9-(4-(1-(二甲基胺基)-3-甲基丁-2-基)-3-氟苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1297): 9-(4-(1-(胺基甲基)環丁基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1298): (R)-8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1299): 9-(4-(1-(胺基甲基)環丁基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1300): 9-(4-(1-(胺基甲基)環丁基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1301): 8-甲氧基-6-甲基-9-(4-(哌啶-3-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1302): 8-羥基-6-甲基-9-(4-(哌啶-3-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1303): (S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1304): (S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1305): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1306): (R)-8-羥基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1307): (R)-8-羥基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1309): 9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1310): (S)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1311): (R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1312): 9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-6-氯-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1314): 9-胺基-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1315): (R)-9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1316): (R)-9-(3-氟-4-(1-(甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1317): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1318): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1319): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1320): 9-((4-(2-胺基乙基)苯基)胺基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1321): 9-(4-(1-(胺基甲基)环丁基)苯基)-6-氯-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1324): (R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1325): 9-((4-(胺基甲基)苯基)氨基)-8-羥基-6-甲基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1326): 9-((4-(胺基甲基)苯基)氨基)-8-甲氧基-6-甲  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1327): 9-((4-(1-胺基丙-2-基)苯基)氨基)-8-甲氧基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1328): 9-((4-(1-胺基丙-2-基)苯基)氨基)-8-羥基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1329): 9-(4-(2-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1330): 9-(4-(2-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基-6-甲基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1331): 9-(4-(3-(胺基甲基)戊-3-基)苯基)-8-甲氧基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1332): 9-(4-((R)-1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羥基  
-2-(1-羥基乙基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1333): 9-(4-((R)-1-胺基丙-2-基)苯基)-2-(1-羥基  
乙基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1334): 3-(4-((8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)氨基)苯基)丙腈；

(1335): 9-((3-(2-胺基乙基)苯基)氨基)-8-甲氧基-6-  
甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1336): 9-((4-(2-胺基乙基)苯基)氨基)-8-羥基-6-甲  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

- (1337): 9-(4-(2-(乙基胺基)丙基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1338): 9-(4-(3-(胺基甲基)戊-3-基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1339): 9-(4-(3-(胺基甲基)戊-3-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1340): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-羟基-2,6-二甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1341): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-8-甲氧基-2,6-二甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1342): 9-(4-((R)-1-胺基丙-2-基)苯基)-2-(1-羟基乙基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1343): 2-((4-(8-甲氧基-6-甲基-4-侧氨基-4,5-二氢噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)氨基)乙腈；
- (1344): (R)-9-(4-(1-胺基丁-2-基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1345): 9-(3-氯-4-(2-(乙基胺基)乙基)苯基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1346): 9-(4-(3-((二甲基胺基)甲基)戊-3-基)苯基)-8-羟基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1347): (R)-6-氯-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)苯基)-8-羟基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；
- (1348): 9-(4-(2-(乙基胺基)乙基)苯基)-8-羟基-6-甲

基 嘧 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1349) : 9-(4-(2-(乙 基 胺 基 ) 乙 基 ) 苯 基 ) -8- 甲 氧 基 -6- 甲 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1350) : 9-(4-(2-(乙 基 (甲 基 ) 胺 基 ) 丙 基 ) 苟 基 ) -8- 羥 基 -6- 甲 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1351) : 2-(羟 基 (哌 定 -4- 基 ) 甲 基 ) -8- 甲 氧 基 -6- 甲 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1352) : (R)-9-(4-(1-胺 基 丁 -2- 基 ) 苟 基 ) -8- 羟 基 -6- 甲 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1353) : (R)-9-(4-(1-胺 基 丙 -2- 基 ) 苟 基 ) -2- 氯 -8- 羟 基 -6- 甲 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1354) : (R)-9-(4-(1-胺 基 丙 -2- 基 ) 苟 基 ) -2- 氯 -8- 甲 氧 基 -6- 甲 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1355) : 8- 甲 氧 基 -6- 甲 基 -9-(4-(2-(甲 基 胺 基 ) 乙 基 ) 苟 基 ) 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1356) : 9-(4-(2-(乙 基 (甲 基 ) 胺 基 ) 乙 基 ) 苟 基 ) -8- 羟 基 -6- 甲 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1357) : 9-(4-(3-(胺 基 甲 基 ) 戊 -3- 基 ) 苟 基 ) -6- 氯 -8- 甲 氧 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1358) : 9-(4-(3-((二 甲 基 胺 基 ) 甲 基 ) 戊 -3- 基 ) 苟 基 ) -8- 羟 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1359) : 9-(6-(二 甲 基 胺 基 ) 吡 定 -3- 基 ) -8- 甲 氧 基 -6- 甲 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1360) : (R)-9-(4-(1-(二 甲 基 胺 基 ) 丁 -2- 基 ) 苟 基 ) -8-

羥基 -6- 甲基 嘧吩并 [2, 3-c] 喹啉 -4(5H)- 酮；

(1361): (R)-8- 甲氧基 -6- 甲基 -9-(4-(1-(甲基胺基)丁  
-2-基)苯基) 嘧吩并 [2, 3-c] 喹啉 -4(5H)- 酮；

(1362): 9-(4-(3-((二乙基胺基)甲基)戊 -3- 基)苯  
基)-8- 羥基 -6- 甲基 嘙吩并 [2, 3-c] 喹啉 -4(5H)- 酮；

(1363): 9-(3-氯 -4-(2-(乙基胺基)乙基)苯基)-8- 羥基  
噻吩并 [2, 3-c] 喹啉 -4(5H)- 酮；

(1364): 8- 羥基 -6- 甲基 -9-(4-(2-(甲基胺基)乙基)苯  
基) 嘙吩并 [2, 3-c] 喹啉 -4(5H)- 酮；

(1365): (R)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丁 -2- 基)苯基)-8-  
甲氧基 -6- 甲基 嘙吩并 [2, 3-c] 喹啉 -4(5H)- 酮；

(1366): (R)-9-(4-(1-(乙基(甲基)胺基)丁 -2- 基)苯  
基)-8- 甲氧基 -6- 甲基 嘙吩并 [2, 3-c] 喹啉 -4(5H)- 酮；

(1367): (R)-9-(4-(1-(二乙基胺基)丁 -2- 基)苯基)-8-  
羥基 -6- 甲基 嘙吩并 [2, 3-c] 喹啉 -4(5H)- 酮；

(1368): (R)-9-(4-(1-(乙基(甲基)胺基)丁 -2- 基)苯  
基)-8- 羥基 -6- 甲基 嘙吩并 [2, 3-c] 喹啉 -4(5H)- 酮；

(1369): 2-((4-(8- 甲氧基 -6- 甲基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢  
噻吩并 [2, 3-c] 喹啉 -9- 基)苯基)(甲基)胺基)乙腈；

(1370): 2-((4-(8- 羥基 -6- 甲基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 噻  
吩并 [2, 3-c] 喹啉 -9- 基)苯基)(甲基)胺基)乙腈；

(1371): 9-(3-氯 -4-(2-(乙基(甲基)胺基)乙基)苯  
基)-8- 羥基 嘙吩并 [2, 3-c] 喹啉 -4(5H)- 酮；

(1372): 9-(4-(1-((二甲基胺基)甲基)環丁基)苯

基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1373): (R)-9-(4-(1-胺基丙基)苯基)-6-溴-8-甲氧基  
噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1374): 9-(6-(2-胺基乙氧基)吡啶-3-基)-8-羥基-6-  
甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1375): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-2-氟-8-甲  
氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1376): 9-(6-(2-胺基乙氧基)吡啶-3-基)-8-甲氧基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1377): 9-(4-(1-胺基-2,2,2-三氟乙基)苯基)-8-羥基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1378): 9-(4-(1-胺基-2,2,2-三氟乙基)苯基)-8-甲氧  
基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1379): (R)-9-(4-(1-(乙基(甲基)胺基)丙-2-基)苯  
基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1380): (R)-8-羥基-6-甲基-9-(4-(1-(甲基胺基)丁  
-2-基)苯基)噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1381): 9-(4-(1-胺基-2,2,2-三氟乙基)苯基)-8-甲氧  
基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1383): (R)-9-(4-(1-胺基丙-2-基)苯基)-2-氟-8-羥  
基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1384): 9-(6-((2-胺基乙基)胺基)吡啶-3-基)-8-羥基  
-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1385): 9-(6-((2-胺基乙基)胺基)吡啶-3-基)-8-甲氧

基 -6- 甲 基 嘧 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1386): (S)-6- 氯 -9-(4-(1-(乙 基 (甲 基) 胺 基) 丙 -2- 基 ) 苯 基 ) -8- 羅 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1387): (S)-9-(4-(1-(二 甲 基 胺 基) 丙 -2- 基 ) -3- 氟 苯 基 ) -8- 甲 氧 基 -6- 甲 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1388): (R)-9-(4-(1-(二 乙 基 胺 基) 丙 -2- 基 ) 苯 基 ) -8- 羅 基 -6- 甲 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1389): 9-(4-(1- 胺 基 -2, 2, 2- 三 氟 乙 基) 苟 基 ) -8- 羅 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1390): 9-(4-(1- 胺 基 -2, 2, 2- 三 氟 乙 基) 苟 基 ) -6- 溴 -8- 甲 氧 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1391): 9-(4-(1-(胺 基 甲 基) 環 丙 基) 苟 基 ) -6- 溴 -8- 甲 氧 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1392): (4-(8- 羅 基 -6- 甲 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -9- 基) 苟 基 ) 甲 烷 磺 鹼 胺 ;

(1393): 8- 甲 氧 基 -6- 甲 基 -9-(4-(2-(甲 基 亞 磺 鹼 基) 乙 基) 苟 基 ) 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1394): 8- 羅 基 -6- 甲 基 -9-(4-((甲 基 磺 鹼 基) 甲 基) 苟 基 ) 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1395): (4-(8- 甲 氧 基 -6- 甲 基 -4- 側 氧 基 -4, 5- 二 氢 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -9- 基) 苟 基 ) 甲 烷 磺 鹼 胺 ;

(1396): 9-(4-((2- 胺 基 乙 基)(甲 基) 胺 基) 苟 基 ) -8- 甲 氧 基 -6- 甲 基 嘙 吩 并 [2, 3-c] 喹 吲 -4(5H)- 酮 ;

(1397): (R)-N-(2-(2- 氟 -4-(8- 羅 基 -6- 甲 基 -4- 側 氧 基

-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷  
磺醯胺；

(1398): (R)-N-(2-(2-氟-4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺；

(1399): (S)-9-(4-(1-(二甲基胺基)丙-2-基)-3-氟苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1400): 9-(4-((2-胺基乙基)(甲基)胺基)苯基)-8-羥基-6-甲基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1401): 9-(4-(1-(胺基甲基)環丙基)苯基)-6-溴-8-羥基噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1402): 2-(6-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)吡啶-3-基)乙腈；

(1403): 8-羥基-6-甲基-9-(4-(2-(甲基亞磺醯基)乙基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1404): 8-甲氧基-6-甲基-9-(4-((甲基磺醯基)甲基)苯基)噻吩并[2, 3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1405): 5-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)菸鹼醯胺；

(1406): 2-(5-(8-羥基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)吡啶-2-基)丙腈；

(1407): 2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4, 5-二氫噻吩并[2, 3-c]喹啉-9-基)苯基)丙醯胺；

(1408): 9-(6-(1-胺基丙-2-基)吡啶-3-基)-8-甲氧基

-6-甲基 嘧吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1409): 2-(5-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-2-基)-2-甲基丙腈；

(1410): 2-羟基-2-(4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氳  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙烷-1-磺醯胺；

(1411): N-(第三丁基)-2-羟基-2-(4-(8-甲氧基-4-側  
氧基-4,5-二氳 嘧吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙烷  
-1-磺醯胺；

(1412): 2-(4-(8-羟基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙醯胺；

(1413): 2-(4-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氳 嘙吩并  
[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙烷-1-磺醯胺；

(1414): 9-(4-(2-氨基-1-氟乙基)苯基)-8-甲氧基-6-  
甲基 嘙吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1415): 9-(6-(1-氨基丙-2-基)吡啶-3-基)-8-羟基-6-  
甲基 嘙吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1416): 2-(5-(8-羟基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-2-基)-2-甲基丙腈；

(1417): 2-(5-(8-羟基-4-側氧基-4,5-二氳 嘙吩并  
[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-2-基)-2-甲基丙腈；

(1418): 2-(5-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳 嘙吩并  
[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-2-基)-2-甲基丙腈；

(1419): 2-(4-(8-羟基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙烷-1-磺醯胺；

(1420): 9-(4-(2-胺基-1-羥基乙基)苯基)-8-甲氧基-6-甲基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1421): 9-(6-(1-胺基-2-甲基丙-2-基)吡啶-3-基)-8-羥基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1422): N-環丙基-1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；

(1423): 2-(5-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-2-基)丙腈；

(1424): (R)-N-(2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺；

(1425): N-乙基-1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；

(1426): 9-(6-(1-胺基丙-2-基)吡啶-3-基)-8-甲氧基噻吩并[2,3-c]喹啉-4(5H)-酮；

(1427): N-環丙基-1-(4-(8-羥基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；

(1428): 1-(5-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)吡啶-2-基)環丙腈；

(1429): N-乙基-1-(4-(8-羥基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氳噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)甲烷磺醯胺；

(1430): 1-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基-4,5-二氫  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺；

(1431): 1-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫噻吩并  
[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)乙烷磺醯胺；

(1432): (R)-N-(2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺；

(1433): (R)-N-(2-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻  
吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)-N-甲基甲烷磺醯  
胺；

(1434): (R)-N-(2-(4-(8-羥基-6-甲基-4-側氧基-4,5-  
二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺；

(1435): (R)-N-(2-(4-(8-羥基-4-側氧基-4,5-二氫噻  
吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)甲烷磺醯胺；

(1436): (R)-N-(2-(4-(8-甲氧基-4-側氧基-4,5-二氫  
噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)-N-甲基甲烷磺  
醯胺；

(1437): (R)-N-(2-(4-(8-羥基-6-甲基-4-側氧基-4,5-  
二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)-N-甲基甲  
烷磺醯胺；

(1438): (R)-N-(2-(4-(8-甲氧基-6-甲基-4-側氧基  
-4,5-二氫噻吩并[2,3-c]喹啉-9-基)苯基)丙基)-N-甲  
基甲烷磺醯胺。

13. 一種醫藥組合物，包含至少一種如申請專利範圍第 1

項所述之化合物或其在醫藥上可接受的鹽，及醫藥上可接受的擔體。

14. 如申請專利範圍第 13 項所述之醫藥組合物，其可用於預防或治療 PBK 依存性疾病。

15. 如申請專利範圍第 14 項所述之醫藥組合物，其中該 PBK 依存性疾病為癌症。

16. 一種 PBK 抑制劑，包含至少一種如申請專利範圍第 1 項所述之化合物或其在醫藥上可接受的鹽。

17. 一種如申請專利範圍第 1 項所述之化合物或其在醫藥上可接受的鹽在製造治療 PBK 依存性疾病的醫藥組合物的用途。

I503323

第 100110555 號

104 年 4 月 7 日修正替換頁

八、圖式：無