发明名称  2-吡啶酮-5-酮
摘要
结构式(I)的化合物及其生理上可接受的盐是丝氨酸/苏氨酸和酪氨酸激酶活性抑制剂。几种其活性被这些化合物抑制的酪氨酸激酶与血管生成过程有关。因此，这些化合物可以改善其中血管生成或内皮细胞增殖为因子的疾病状况。这些化合物可用于治疗癌症和增殖疾病。
1. 下式所示的化合物及其生理上可接受的盐在制备用于抑制一种或多种蛋白激酶活性的药物中的应用：

![化学结构式]

其中：

R 选自取代或未取代的：C₁₋₅烷基、喹啉基、噻吩基、咪唑基、吡咯基、吲哚基、吡咯并喹啉基、苯基、吲哚基和吡唑基；

R¹ 是氢或—A—Z；

R² 是氢或选自取代或未取代的 C₁₋₅烷基团；

A 是—(CH₂)ₚ—、—(CH₃)ₚ—NH—或—(CH₂)ₚ—O—；

Z 是—H、C₁₋₅烷基、R¹OC(O)—、—NR¹'R²—、—C(O)NR¹'R²—、R¹O—或选自下列一组的环系：(C₁₋₅)环烷基、苯、吡咯、异喹啉、吲哚、吲哚、吡啶、噻唑、苯并噻唑、四氢喹唑、噻吩、呋喃和噻唑，其中所述环系是未取代的或者被一个或多个选自下列一组的基团取代：卤素、C₁₋₅烷基、R¹O—、HO—、R¹OC(O)—、硝基、苯基和—NR¹'R²；

每处出现的 R³ 彼此独立地选自取代或未取代的：C₁₋₅烷基团、苯基团、苯甲基团和(C₁₋₅)环烷基团；

每处出现的 R¹ 和 R² 彼此独立地为氢或选自取代或未取代的：C₁₋₅烷基团、苯基团、苯甲基团和(C₁₋₅)环烷基团；并且

n 是 0—3 的整数；条件是该化合物不是 3H—吡唑—3—酮，2, 4—二氢—4—[4—羟基—3, 5—双 (1—甲基乙基) 苯基]—亚甲基]—5—甲基。

2. 权利要求 1 的应用，其中的化合物为立体异构体的混合物。

3. 权利要求 2 的应用，其中的立体异构体是对映体。

4. 权利要求 2 的应用，其中的立体异构体是 E 和 Z 异构体。

5. 权利要求 1 的应用，其中的化合物是结构异构体的混合物。

6. 权利要求 5 的应用，其中的结构异构体是互变异构体。
7. 权利要求 1 的应用，其中所述蛋白激酶是受体酪氨酸激酶或非受体酪氨酸激酶。

8. 权利要求 7 的应用，其中所述酪氨酸激酶是自含激酶插入域受体、fms 样酪氨酸激酶-1、TIE-2、成纤维细胞生长因子受体、血小板衍生生长因子受体、胰岛素样生长因子-1 受体、met 原癌基因、淋巴 T 细胞激酶、劳斯肉瘤病毒肿瘤蛋白的细胞同源物、fgr 和 yes 相关蛋白质，存在于造血组织和脑中、Gardner-Rasheed 肉瘤病毒肿瘤蛋白的细胞同源物和 Yamaguchi 73 肉瘤病毒肿瘤蛋白的细胞同源物的相关蛋白质、淋巴 B 细胞激酶）和 Yamaguchi 73 肉瘤病毒肿瘤蛋白的细胞同源物。

9. 权利要求 1 的应用，其中所述蛋白激酶是丝氨酸激酶。

10. 权利要求 1 的应用，其中所述蛋白激酶是苏氨酸激酶。

11. 下式所示的化合物及其生理上可接受的盐在制备用于治疗或根本上抑制需治疗者炎性疾病药物中的应用：

![化合物结构式]

其中：
R 选自取代或未取代的：C_1-C_6 环烷基、嘧啶基、噻吩基、咪唑基、吡咯基、吲哚基、吡咯并嘧啶基、苯基、吲哚咪基和吡唑基；
R' 是氢或-A-Z；
R'' 是氢或选自取代或未取代的 C_1-C_6 烷基团；
A 是-(CH_2)_n-、-(CH_3)_n-NH-或-(CH_2)_n-O-；
Z 是-H、C_1-C_6 烷基、R'OC(O)-、-NR'R''、-C(O)NR'R''、R'O-或选自下列一组的环系：(C_1-C_6) 环烷基、苯、吡咯、异噁唑、吲哚、吡啶、噻啶、苯并噻唑、四氢呋喃、噻吩、呋喃和哒嗪，其中所述环系是未取代的或者被一个或多个选自下列一组的基团取代：卤素、C_1-C_6 烷基、R'O-、HO-、R'OC(O)-、硝基、苯基和-NR'R''；

每处出现的 R' 每彼此独立地选自取代或未取代的：C_1-C_6 烷基团、苯基团、苯甲基团和 (C_1-C_6) 环烷基团；
每处出现的 R' 和 R' 彼此独立地为氢或选自取代或未取代的：C₁-C₆
烷基团、苯基团和 (C₃-C₆) 环烷基团；并且
n 是 0-3 的整数。

12. 下式所示的化合物及其理上可接受的盐在制备用于治疗或
抑制需治疗者血管生成的药物中的应用：

![化合物结构](image)

其中:
R 选自取代或未取代的：C₁-C₆ 环烷基、噻啉基、噻吩基、咪唑基、
吡咯基、吲哚基、吲哚并噻啶基、苯基、吲哚咪基和吡啶基；
R' 是氢或-\(-A-Z;\)
R'' 是氢或选自取代或未取代的 C₁-C₆ 烷基团；
A 是-\(-(CH₂)ₙ-、-(CH₃)ₙNH-或-(CH₂)nO-;\)
Z 是-\(-H、C₁-C₆ 烷基、R'OC(O)-、-NR'R''、-C(0)NR'R''、R'O-或选自
下列一组的环基：(C₃-C₆) 环烷基、苯、吡咯、异噻唑、吲哚、吡啶、
吡嗪、嘧啶、苯并噻啶、四氢呋喃、噻吩、呋喃和哒嗪，其中所述环
系是未取代的或者被一个或多个选自下列一组的基团取代：卤素、C₁-
C₆ 烷基团、R'O-、HO-、R'O(C(O)-、硝基、苯基和-NR'R''；
每处出现的 R' 彼此独立地选自取代或未取代的：C₁-C₆ 烷基团、苯
基团、苯甲基团和 (C₃-C₆) 环烷基团；
每处出现的 R' 和 R' 彼此独立地为氢或选自取代或未取代的：C₁-C₆
烷基团、苯基团和 (C₃-C₆) 环烷基团；并且
n 是 0-3 的整数。

13. 下式所示的化合物及其生理上可接受的盐在制备用于诱导需
治疗者血管生成作用的药物中的应用：
其中：
R 选自取代或未取代的：C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>环烷基、喹啉基、噻吩基、咪唑基、吡咯基、吲哚基、吡咯并嘧啶基、苯基、吖啶基和吡唑基；

R<sup>1</sup> 是氢或-<sub>A</sub>–Z；
R<sup>2</sup> 是氢或选自取代或未取代的 C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>烷基团；
A 是-<sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub></sub>–，-<sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NH–或-<sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>O–；
Z 是-H、C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>烷基、R<sup>1</sup>OC (O)-、-NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、-C (O) NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、R<sup>1</sup>O–或选自下列一组的环系：(C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>)环烷基、苯、吡咯、异唑基、吲哚、吡啶、

吡嗪、嘧啶、苯并噻唑、四氢呋喃、噻吩、呋喃和噻嗪，其中所述环系是未取代的或者被一个或多个选自下列一组的基团取代：卤素、C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>烷基、R<sup>1</sup>O–、HO–、R<sup>2</sup>OC (O)-、硝基、苯基和-NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>；

每处出现的 R<sup>1</sup>彼此独立地选自取代或未取代的：C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>烷基团、苯基团、苯甲基团和(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)环烷基团；

每处出现的 R<sup>1</sup> 和 R<sup>2</sup> 每处独立地为氢或选自取代或未取代的：C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>烷基团、苯基团和(C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>)环烷基团；并且
n 是 0–3 的整数。

14. 下式所示的化合物及其生理上可接受的盐在制备用于治疗或抑制需治疗者疾病或病症的药物中的应用：
其中：

R 选自取代或未取代的：芳基基团、(C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6}) 烷基基、杂环基、芳烷基、(C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6}) 烷基基-烷基和杂环基-烷基；

R\textsuperscript{1} 是氢或-A-Z；

R\textsuperscript{2} 是氢或选自取代或未取代的：C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6} 烷基基、芳基基团、(C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6}) 烷基基、杂环基、芳烷基、(C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6}) 烷基基-烷基基-烷基基；

A 是 -(CH\textsubscript{2})\textsubscript{n}-、-(CH\textsubscript{2})\textsubscript{n}NH-、-(CH\textsubscript{2})\textsubscript{n}O-、-(CH\textsubscript{2})\textsubscript{n}S-、-(CH\textsubscript{2})\textsubscript{n}O(0)-

或-(CH\textsubscript{2})\textsubscript{n}S(O)-；

Z 是-H、C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6} 烷基基、芳烷基、R\textsuperscript{1}CO-、R\textsuperscript{1}OC(0)-、-NR\textsuperscript{1}R\textsuperscript{2}、

R\textsuperscript{1}O-或选自下述一组的环系：(C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6}) 烷基基、苯、吡咯、异 吡唑、吲哚、吡啶、嘧啶、苯并噻唑、四氢呋喃、噻吩、三嗪、

咪唑、吲哚、苯并咪唑、吡嗪、噻唑啉、吡啶、噻唑、噻唑及其 N-氧化物，其中所述环系是未取代的或者被一个或多个选自下述一组的基团取代：卤素、C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6} 烷基基、R\textsuperscript{1}O-、HO-、HOC(0)-、R\textsuperscript{1}OC(0)-、三卤代

甲基、硝基、芳基、-CN、-C(0)NR\textsuperscript{1}R\textsuperscript{2} 和 NR\textsuperscript{1}R\textsuperscript{2}；

每处出现的 R\textsuperscript{1} 彼此独立地选自取代或未取代的：C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6} 烷基基、C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6} 烷氧基 C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6} 烷基基、芳基基团、(C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6}) 烷基基、芳烷基、(C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6})

烷基基-烷基基-烷基基；

每处出现的 R\textsuperscript{1} 和 R\textsuperscript{2} 彼此独立地为氢或选自取代或未取代的：C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6} 烷基基、芳基基团、(C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6}) 烷基基、杂环基、芳烷基、(C\textsubscript{1}—C\textsubscript{6}) 烷基基-

烷基基和杂环基-烷基基； ；并且

n 是 0—3 的整数，

其中所述疾病或病症治自癌，关节炎，动脉粥样硬化，再狭窄，牛皮癣，血管瘤，心肌血管生成，冠状和脑侧突，局部缺血性四肢血管

生成，角膜疾病，潮红，新生血管性青光眼，黄斑变性，创伤愈合，消化性溃疡，与螺旋杆菌有关的疾病，病毒引起的血管生成疾病，骨折，

糖尿病性视网膜病，节段性回肠炎，炎性肠疾病，猫抓伤引起的发烧，

视网膜病或早熟，溃疡，甲状腺增生，灼伤，外伤，急性肺损伤，慢性肺病，中风，息肉，囊肿，滑膜炎，慢性和变应性炎症，卵巢过度

刺激综合征，肺和脑水肿，瘫痪症，纤维变性，肝硬化，腕管综合征，

脓毒性，成人呼吸窘迫综合征，多器官机能障碍综合征，腹水和与肿瘤有关的渗漏积液以及水肿。
15. 下述所示的化合物及其生理上可接受的盐在制备用于影响需治疗者血管渗透性过高或水肿产生的药物中的应用:

![化合物结构式](image)

其中:
- R 选自取代或未取代的：C₅-C₆环烷基、喹啉基、噻吩基、咪唑基、吡咯基、吲哚基、吡啶并嘧啶基、苯基、吲哚咪基和咪唑基；
- R₁是氢或-A-Z；
- R₂是氢或选自取代或未取代的 C₁-C₅烷基团；
- A 是 -(CH₂)ₙ-、-(CH₃)ₙNH 或-(CH₃)ₙO-；
- Z 是-H、C₁-C₆烷基、R₃OC(0)-、-NR₁R₂、-C(0)NR₁R₂、R₂O-或选自下列一组的环系：C₅-C₆环烷基、苯、喹啉、异喹啉、吲哚、吡啶、
吡嗪、嘧啶、苯并嘧啶、四氢喹啉、噻吩、呋喃和喹嗪，其中所述环系是未取代的或者被一个或多个选自下列一组的基团取代：卤素、C₁-C₅烷基、R₁O-、HO-、R₃OC(0)-、硝基、苯基和-NR₁R₂；
- 每处出现的 R₁彼此独立地选自取代或未取代的：C₁-C₅烷基团、苯基团、苯甲基团和(C₅-C₆)环烷基团；
- 每处出现的 R₂和 R₂彼此独立地为氢或选自取代或未取代的：C₁-C₆烷基团、苯基团和(C₅-C₆)环烷基团；并且
- n 是 0-3 的整数。

16. 权利要求 15 的应用，其中对水肿产生的作用为抗水肿。

17. 下列结构式表示的化合物及其生理上可接受的盐：
其中：

R 选自取代或未取代的：C₁-C₆环烷基、嘌呤基、噻吩基、咪唑基、吡咯基、吲哚基、吡啶并嘧啶基、苯基、吲哚基、吡啶基、氮杂吲哚基和 4,5,6,7-四氢吲哚基；

R¹ 是氢或 -A-Z；

R² 是氢或选自取代或未取代的 C₁-C₅烷基团；

A 是 - (CH₂)ₙ-、-(CH₃)₂NH-或 -(CH₃)₂O-；

Z 是 -H、C₁-C₅烷基、R³OC (O)-、-NR²R¹、-C(O)NR²R¹、R³O-或选自下列一组的环系：(C₅-C₆)环烷基、苯、吡啶、异噁唑、异吲哚、吡啶、吡嗪、嘧啶、苯并噻唑、四氢呋喃、噻吩、呋喃和哒嗪，其中所述环系是未取代的或者被一个或多个选自下列一组的基团取代：卤素、C₁-C₆烷基、R³O-、HO-、R³OC (O)-、硝基、苯基和 -NR²R¹；

每处出现的 R¹ 彼此独立地选自取代或未取代的：C₁-C₆烷基团、苯基团、苯甲基团和 (C₁-C₅) 环烷基团；

每处出现的 R² 和 R³ 彼此独立地为氢或选自取代或未取代的：C₁-C₆烷基团、苯基团和 (C₁-C₅) 环烷基团；并且回

n 是 0-3 的整数；条件是当 R 是未取代的吲哚-3-基，R¹ 不是 -NH₂；

和条件是该化合物不是 3H-吡唑-3-酮，2,4-二氢-4-[ [4-羟基-3,5-双 (1-甲基乙基) 苯基] 亚甲基 ] -5-甲基，

![化学结构式]

25
18. 权利要求17的化合物，其中：
A是-NH或-O-；并且
Z是环丙基、3-吡啶基或吡喃基。
19. 权利要求17的化合物，其中：
A是-O-；并且
Z是乙基、正丙基或异丙基。
20. 权利要求17的化合物，其中：
A是-CH₂-；并且
Z是苯基，其中所述苯基是未取代的或者被一个或多个选自下列一
组的基团取代：卤素、烃基、-NR'R'、硝基、C₁-C₆烷基、R'O-、-C(O)OR'和-OC(O)R'。

21. 权利要求17的化合物，选自下列一组的化合物：
3-环丙基-4-[(3,5-二甲基-4-(4-甲基-1-哌嗪基甲基)吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二甲基-4-哌啶子基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-二甲氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-吗啉代甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-二乙氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-甲基-1-哌嗪基甲基)-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-1-吡咯烷基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-哌啶子甲基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二溴-4-羟基半基基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-氧代-1,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(5-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-环丙基-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(5-三氟甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-（2-二甲氨基乙氧基甲基吡咯-2-基）亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-（2-二甲氨基乙氧基甲基吡咯-2-基）亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-乙氧基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-（2-二甲氨基乙氧基甲基吲哚-2-基）亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-（2-二甲氨基乙氧基甲基吲哚-2-基）亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-（2-二甲氨基乙氧基甲基吡咯-2-基）亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-（2-二甲氨基乙氧基甲基吡咯-2-基）亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-（2-二甲氨基乙氧基甲基吡咯-2-基）亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-（4-二乙氧基甲基吡咯-2-基）亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-（4-二乙氧基甲基吡咯-2-基）亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3, 3-二乙氧基甲基吡咯-2-基）亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(3-（2-氨基-2-羧乙基）吲哚-2-基）亚甲基]-3-环丙基-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(5-乙氧基-4-甲氧基甲基-3-甲氧基甲基吡咯-2-基）亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(5-氯-4-甲氧基甲基-3-甲氧基甲基吡咯-2-基）亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-（2-氨基甲基吡咯-2-基）亚甲基]-3-（3-吡啶
基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{[(3,5\text{-}二甲基\text{-}4\text{-}[(4\text{-}甲基\text{-}1\text{-}呫嚓基甲基)吡咯\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{[(3,5\text{-}二甲基\text{-}4\text{-}[(1\text{-}呫喀烷基甲基吡咯\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{[(4\text{-}二乙氨基甲基\text{-}3,5\text{-}二甲基吡咯\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{[(3,5\text{-}二甲基\text{-}4\text{-}呫啶子基甲基吡咯\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{(4\text{-}二乙醇氨基甲基\text{-}3,5\text{-}二甲基-呫咯\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{[(3\text{-}二甲氨基甲基\text{-}4,5\text{-}四亚甲基吡咯\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{[(3\text{-}呫啉代甲基\text{-}4,5\text{-}四亚甲基吡咯\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{[(3\text{-}二乙氨基甲基\text{-}3,5\text{-}四亚甲基吡咯\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{[(3\text{-}4\text{-}甲基\text{-}1\text{-}呫嚓基甲基)\text{-}4,5\text{-}四亚甲基吡咯\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}4\text{-}[(3\text{-}1\text{-}呫喀烷基)甲基\text{-}4,5\text{-}四亚甲基吡咯\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{(3\text{-}呫啶子基甲基\text{-}4,5\text{-}四亚甲基吡咯\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{[(4\text{-}二甲氨基\text{-}4,5,6,7\text{-}四氢吲哚\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{[(4\text{-}二乙氨基乙基\text{-}3,5\text{-}二甲基吡咯\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{(3,5\text{-}二溴\text{-}4\text{-}羟基亚苄基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{(4\text{-}氧代\text{-}1,5,6,7\text{-}四氢吲哚\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，

4-\{[(4\text{-}二甲氨基甲基\text{-}5\text{-}甲基吡咯\text{-}2\text{-}基)亚甲基)\text{-}3\text{-}(3\text{-}吡啶基)\text{-}2\text{-}吡啶咔\text{-}5\text{-}酮，
4-[(4-溴吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氯吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氯吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-吲哚基)-4-[(5-三氟甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(吗哚代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(4-吗吲代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(4-吗吲代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(4-吗吲代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,4-(2二氧基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(2-乙酰氨基-2-甲氧羰基乙基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(2-氯基-2-羧乙基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-乙氧基-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吲哚-2-基)亚甲
基]-3-(3-吡啶基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(5-氯-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-
(3-吡啶基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基
-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(4-甲基-1-哌嗪基甲基)吡咯-2-基)亚甲
基]-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异
丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基-吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(哌啶子基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(4-二乙醇氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基甲基-4,5-四甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(3-吗啉代甲基-4,5-四甲基吡咯-2-基)亚甲
基]-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(3-二乙氨基甲基-4,5-四甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(3-(4-甲基-1-哌嗪基)甲基-4,5-四甲基吡咯
-2-基)亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(3-(1-吡咯烷基)甲基-4,5-四甲基吡咯-2-基]
亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(3-(4-甲基-1-哌嗪基)甲基-4,5-四甲基吡咯
-2-基)亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基
-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧
基-2-吡啶啉-5-酮，
4-(3,5-二溴-4-羟基亚苄基)-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(4-氧代-1, 5, 6, 7-四氢吖嗪-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
5
4-[(4-溴吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(5-三氟甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
15
4-[(3-乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
20
4-[(3-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(4-吗啉代乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
25
3-异丙氧基-4-[(3-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(3-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
30
4-[(3, 4-二乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧羰基-2-烷乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-
吡唑啉-5-酮，
4-((5-乙氨基-4-甲氧基甲基-3-甲氧基甲基吡咯-2-基)亚甲基)-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-((5-氧-4-甲氧基甲基-3-甲氧基甲基吡咯-2-基)亚甲基)-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-((3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基)-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-((3,5-二甲基-4-((4-甲基-1-哌嗪基甲基)吡咯-2-基)亚甲基)-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-((3,5-二甲基-4-((1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基)-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-((4-二乙氧基甲基-3,5-二甲基-吡咯-2-基)亚甲基)-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-((3,5-二甲基-4-((哌啶子基甲基吡咯-2-基)亚甲基)-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-((4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基-吡咯-2-基)亚甲基)-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-((3-亚烷基代甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-((3-二乙氧基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基)-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-((3-(4-氨基-1-哌嗪基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-((3-(1-吡咯烷基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-((3-哌啶子基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-((4-二甲氨基-4,5,6,7-四氮杂氮-2-基)亚甲基)-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-((4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基)-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二溴-4-羟基亚苄基)-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基哒唑-2-基)亚甲基]-3-乙氧基
-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(4-四氢呫喃-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基哒唑-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-
吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(5-三氟甲基哒唑-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-二甲氨基乙氧基哒唑-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡
唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-二甲氨基乙氧基哒唑-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-
吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧基呋喃-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基乙氧基哒唑-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡
唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基乙氧基哒唑-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-
吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(4-吗啉代乙氧基哒唑-2-基)亚甲基]-2-吡唑
啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(4-吗啉代乙氧基哒唑-2-基)亚甲基]-2-吡唑
啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(3-吗啉代乙氧基哒唑-2-基)亚甲基]-2-吡唑
啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(5-甲氧基哒唑-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基哒唑-2-基)亚甲基]-3-
乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(2-乙氧基哒唑-2-基)亚甲基)-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-氨基-2-巯乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-乙氧基-4-甲氧基基甲基-3-甲氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(二甲氨基甲基)-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-吲哚代甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(二乙氨基甲基)-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(4-甲基-1-吡嗪基甲基)-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
3-吡嗪基-4-[[3-(1-吡咯烷基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(哌啶子基甲基)-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二溴-4-环基亚苄基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(四氢克咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-(氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
3-吡嗪基-4-[[5-三氯甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二甲氨基乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二甲氨基乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧基乙酰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氧基乙氧基乙酰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氧基乙氧基乙酰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-吗啉代乙氧基乙酰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-吗啉代乙氧基乙酰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-吗啉代乙氧基乙酰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧基乙酰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-乙氧基乙酰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-乙氧基乙酰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
3-吡嗪基-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 4-二乙氧基乙酰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-2-乙酰氨基-2-甲氧羰基乙基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-2-氯基-2-羧乙基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-乙氧基-4-甲氧基烷基甲基-3-甲氧基烷基吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氯-4-甲氧羰基烷基甲基-3-甲氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-(4-溴吡咯-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-(4-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-(5-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[(5-三氟甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[(4-乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[4-(2-二甲氨基乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[4-(2-二甲氨基乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-二甲氨基乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-二甲氨基乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-二甲氨基乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[4-(4-吗啉代乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[4-(4-吗啉代乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[3-(4-吗啉代乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[3-(4-吗啉代乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[(5-甲氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮。
酮，

3-【咪唑-2-基】-4-【(4,5-二亚甲基咪唑-2-基)亚甲基]2-吡唑啉-5-酮，

4-【(3,5-二甲基-4-(2-二甲基乙基-2-基)亚甲基]3-【咪唑-2-基】-2-吡唑啉-5-酮，

3-【咪唑-2-基】-2-吡唑啉-5-酮，

4-【(3,5-二甲基-4-(2-二甲基乙基-2-基)亚甲基]3-【咪唑-2-基】-2-吡唑啉-5-酮，

3-【咪唑-2-基】-4-【(吲哚-3-基)亚甲基]2-吡唑啉-5-酮，

3-【咪唑-2-基】-4-【(吲哚-2-基)亚甲基]2-吡唑啉-5-酮，

3-【咪唑-2-基】-4-【(吲哚-2-基)亚甲基]2-吡唑啉-5-酮，

4-【(3,4-二乙基碳基-2-基)亚甲基]3-【(咪唑-2-基)]-2-吡唑啉-5-酮，


4-【(5-乙氧基-4-甲氧基基甲基]3-【甲氧基基-2-基]亚甲基]3-【(咪唑-2-基)]-2-吡唑啉-5-酮，

4-【(5-氯-4-甲氧基基甲基]3-【甲氧基基-2-基]亚甲基]3-【(咪唑-2-基)]-2-吡唑啉-5-酮，

4-【(4-氯吡咯-2-基)亚甲基]3-【(1-甲基环丙基)]-2-吡唑啉-5-酮，

4-【(4-氯吡咯-2-基)亚甲基]3-【(1-甲基环丙基)]-2-吡唑啉-5-酮，

4-【(5-氯吡咯-2-基)亚甲基]3-【(1-甲基环丙基)]-2-吡唑啉-5-酮，

3-【(1-甲基环丙基)]-4-【(5-氯基基-2-基]亚甲基]2-吡唑啉-5-酮，

4-【(4-氯基基-2-基)亚甲基]3-【(1-甲基环丙基)]-2-吡唑啉-5-酮，

4-【(4-乙氧基基-2-基)亚甲基]3-【(1-甲基环丙基)]-2-吡唑啉-5-酮，

4-【(4-2-甲氧基乙基-2-基)亚甲基]3-【(1-甲基环丙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4- [4- (2- 二甲氨基乙氨基碳基吡咯-2- 基) 亚甲基]-3- (1- 甲基环丙基)-2- 吡啶啉-5- 酮，
4- [3- (3- 乙氧羰基吲哚-2- 基) 亚甲基]-3- (1- 甲基环丙基)-2- 吡啶啉-5- 酮，
3- (1- 甲基环丙基)-4- [3- (2- 二甲氨基乙氧羰基吲哚-2- 基) 亚甲基]-3- (1- 甲基环丙基)-2- 吡啶啉-5- 酮，
3- (1- 甲基环丙基)-4- [3- (4- 吲哚代乙氧羰基吲哚-2- 基) 亚甲基]-2- 吡啶啉-5- 酮，
3- (1- 甲基环丙基)-4- [3- (4- 吲哚代乙氧羰基吲哚-2- 基) 亚甲基]-2- 吡啶啉-5- 酮，
3- (1- 甲基环丙基)-4- [3- (4- 吲哚代乙氧羰基吲哚-2- 基) 亚甲基]-2- 吡啶啉-5- 酮，
3- (1- 甲基环丙基)-4- [3- (4- 吲哚代乙氧羰基吲哚-2- 基) 亚甲基]-2- 吡啶啉-5- 酮，
3- (1- 甲基环丙基)-4- [3- (4- 吲哚代乙氧羰基吲哚-2- 基) 亚甲基]-2- 吡啶啉-5- 酮，
3- (1- 甲基环丙基)-4- [3- (4- 吲哚代乙氧羰基吲哚-2- 基) 亚甲基]-2- 吡啶啉-5- 酮，
3- (1- 甲基环丙基)-4- [3- (4- 吲哚代乙氧羰基吲哚-2- 基) 亚甲基]-2- 吡啶啉-5- 酮，
3- (1- 甲基环丙基)-4- [3- (4- 吲哚代乙氧羰基吲哚-2- 基) 亚甲基]-2- 吡啶啉-5- 酮，
3- (1- 甲基环丙基)-4- [3- (4- 吲哚代乙氧羰基吲哚-2- 基) 亚甲基]-2- 吡啶啉-5- 酮，
4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡啶-5-酮，
4-[(3,4-二乙氧基基苯基-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡啶-5-酮，
4-[(3-2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡啶-5-酮，
4-[(3-2-氨基-2-硫乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡啶-5-酮，
4-[(5-乙氧基-4-甲氧基基苯基-3-甲氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡啶-5-酮，
4-[(5-氯-4-甲氧基基苯基-3-甲氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡啶-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡啶-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(4-甲基-1-哌嗪基基甲基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-2-吡啶-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(1-吡啶烷基基甲基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡啶-5-酮，
4-[(4-二乙氧基基苯基-3, 5-二甲基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡啶-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-哌啶子基甲基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡啶-5-酮，
4-[(4-二乙氧基基苯基-3, 5-二甲基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡啶-5-酮，
4-[(3-二甲氧基基苯基-4, 5-四亚甲基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡啶-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(3-吗啉代甲基-4, 5-四亚甲基基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡啶-5-酮，
4-[(3-二乙氧基基乙基-4, 5-四亚甲基基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡啶-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(3-(4-甲基-1-哌嗪基基甲基)基-4, 5-四亚甲基基基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡啶-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(3-(1-吡啶烷基)甲基-4, 5-四亚甲基基基吡咯-2-
基]-亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；

3-(2-呋喃基)-4-[(3-哌啶子基甲基]-4, 5-四亚甲基吡咯]-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；

4-[(4-二甲氨基-4, 5, 6, 7-四氢吡啶]-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮；

4-[(4-二乙氨基乙基]-3, 5-二亚甲基吡咯]-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮；

4-(3, 5-二溴-4-羟基亚苄基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮；

3-(2-呋喃基)-4-[(4-氧代-1, 5, 6, 7-四氢吲哚]-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；

4-[(4-溴吡咯]-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮；

4-[(4-氧代吡咯]-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮；

4-[(5-氧代吡咯]-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮；

3-(2-呋喃基)-4-[(5-三氟甲基吡咯]-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；

4-[(4-乙氧羰基吡咯]-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮；

4-[(4-二甲氨基乙氧羰基吡咯]-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮；

4-[(4-二甲氨基乙氧羰基吡咯]-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮；

4-[3-(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚]-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮；

4-[3-(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚]-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮；

3-(2-呋喃基)-4-[4-(4-吗啉代乙氧羰基吡咯]-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；

3-(2-呋喃基)-4-[4-(4-吗啉代乙氧羰基吡咯]-2-基)亚甲基]-2-
2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(3-(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(3-(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(5-甲氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氧基乙氧羰基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧羰基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氧基乙烯基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,4-二乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-(2-呋喃基))-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-2-乙酰氨基-2-甲氧羰基乙基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(2-氨基-2-甲氧羰基乙基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氧-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氧-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻
吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(4-甲基-1-哌嗪基)甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻
吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻
吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氧基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻
吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-哌啶子基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻
吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙醇氨甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻
吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二氧甲基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻
吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-吗啉代甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻
吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二氧甲基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻
吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(4-甲基-1-哌嗪基甲基)-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲
基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(1-吡咯烷基甲基)-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻
吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-哌啶子基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻
吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二氧甲基-4,5,6,7-四氢吡啶-2-基)亚甲基]-3-(2-噻
吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻
吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二溴-4-羟基甲基)-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氧化-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二氧甲基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩
基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[4-(2-二甲氨基乙氧基硫基-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[4-(2-二甲氨基乙氧基硫基-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-甲氧基基乙氧基硫基-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-二甲氨基乙氧基硫基-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-二甲氨基乙氧基硫基-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[4-(4-吗啉代乙氧基硫基-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[4-(4-吗啉代乙氧基硫基-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(4-吗啉代乙氧基硫基-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(4-吗啉代乙氧基硫基-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(5-二甲基-4-乙氧基硫基-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[1-(1-甲基硫基-3-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3,5-二甲基-4-乙氧基硫基-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-甲氧基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[3,4-二氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[3-(2-氨基-2-羰基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[5-乙氧基-4-甲氧基基甲基-3-甲氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[5-氯-4-甲氧基基甲基-3-甲氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-溴基-2-基]亚甲基]-3-环丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-氯基-2-基]亚甲基]-3-环丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[5-氯基-2-基]亚甲基]-3-环丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[[5-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[[4-乙氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[[4-(2-二甲氨基乙氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[[4-(2-二甲氨基乙氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡啶啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(3-乙氧酰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(3-二甲氧基乙氧酰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
5 3-环丙氧基-4-[(3-二甲氧基乙氧酰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(4-吲哚代乙氧酰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(4-吲哚代乙氧酰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
10 3-环丙氧基-4-[(3-4-吲哚代乙氧酰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(3-4-吲哚代乙氧酰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
15 3-环丙氧基-4-[(3,5-二甲基-4-乙基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(3,5-二甲基-4-乙氧酰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
20 3-环丙氧基-4-[(5-甲氧基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(4,5-四亚甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氧基乙氧酰基)吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
25 3-环丙氧基-4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氧基乙氧酰基)吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(3,4-二乙氧酰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
30
4-[[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基苯基)吲哚-2-基]甲基]-3-环丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-氧基-2-羧乙基)吲哚-2-基]甲基]-3-环丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(5-乙氧基-4-甲氧基苯并三唑-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氯-4-甲氧基苯并三唑-2-基)亚甲基]-3-环丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-溴吡咯-2-基)亚甲基]-3-[(2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-[(2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-[(2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-(5-嘧啶基乙基)]-4-[(5-三氟甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-乙氧基苯并三唑-2-基)亚甲基]-3-[(2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-2-二甲氧基乙氧基苯并三唑-2-基)亚甲基]-3-[(2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-2-二甲氧基乙氧基苯并三唑-2-基)亚甲基]-3-[(2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧基苯并三唑-2-基)亚甲基]-3-[(2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-2-二甲氧基苯并三唑-2-基)亚甲基]-3-[(2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-2-二甲氧基乙氧基苯并三唑-2-基)亚甲基]-3-[(2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-4-吗啉代乙氧基苯并三唑-2-基)亚甲基]-3-[(2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-4-吗啉代乙氧基苯并三唑-2-基)亚甲基]-3-[(2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(N-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(N-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[3,5-二甲基-4-(5-嘧啶基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(5-嘧啶基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(5-嘧啶基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[5-甲氨基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-4-[[4,5-四亚甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧羰基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧羰基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基)亚甲基]-3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-4-[[吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[3,4-二乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-乙酰氧基-2-甲氧羰基乙基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-乙酰氧基-2-甲氧羰基乙基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-乙氧基-4-(5-嘧啶基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(5-嘧啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-氯-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吡咯-2-基]甲基]-3-
[2-(5-噻啶基乙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-溴吡咯-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-氯吡咯-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-氯吡咯-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-苯乙基)-4-[[5-三氟甲基吡咯-2-基]甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-乙氧羰基吡咯-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二甲氨基乙氧羰基吡咯-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二甲氨基乙氧羰基吡咯-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-乙氧羰基吲哚-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-
5-酮，
4-[[3-(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-4-(4-吗啉代乙氧羰基吡咯-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-2-
吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(4-吗啉代乙氧羰基吡咯-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-2-
吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-2-
吡唑啉-5-酮，
4-[[1-甲基吲哚-3-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-乙氧羰基吡咯-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲氧羰基吲哚-2-基]甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-
酮，

3-([2-苯基)-4-[(4, 5-四亚甲基毗咯-2-基) 亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[3, 5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基基) 吡咯-2-基] 亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[3, 5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基基) 吡咯-2-基] 亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[吲哚-2-基] 亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[3, 4-二氧基基旨略-2-基] 亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[3-(2-乙酰基基旨略-2-甲氧基基乙基) 吲哚-2-基] 亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[3-(2-氯基基旨略-2-基) 吲哚-2-基] 亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[5-乙基基旨略-4-甲氧基基甲基-3-甲氧基基旨略-2-基] 亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[5-氯基基旨略-4-甲氧基基甲基-3-甲氧基基旨略-2-基] 亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[4-溴毗咯-2-基] 亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基) 乙基]-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[4-氯毗咯-2-基] 亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基) 乙基]-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[5-氯毗咯-2-基] 亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基) 乙基]-2-吡唑啉-5-酮，

3-[2-(4-羟苯基) 乙基]-4-[(5-三氟甲基旨略-2-基) 亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[4-乙氧基基旨略-2-基] 亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基) 乙基]-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[4-(2-二甲氨基乙氧基基旨略-2-基) 亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基) 乙基]-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[4-(2-二甲氨基乙氧基基旨略-2-基) 亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基) 乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧基苯基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(2-二甲氨基乙氧基苯基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(2-二甲氨基乙氧基苯基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-羟苯基)乙基]-4-[(4-吗啉代乙氧基苯基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-羟苯基)乙基]-4-[(4-吗啉代乙氧基苯基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-羟苯基)乙基]-4-[(5-甲氧基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-羟苯基)乙基]-4-[(4,5-二甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
15-4-[3,5-二甲基-4-乙氧基苯基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-羟苯基)乙基]-4-[(5-甲氧基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-羟苯基)乙基]-4-[(4,5-二甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基苯基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基苯基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
25-4-[(3,4-二乙氧基苯基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基苯基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-二氢基-2-凝固苯基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
30-4-[(5-乙氧基-4-乙氧基苯基甲基-3-甲氧基苯基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氯-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-
[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(4-溴吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑
啉-5-酮；
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(5-氯吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑
啉-5-酮；
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(5-三氯甲基吡咯-2-基)亚甲基]-
2-吡唑啉-5-酮；
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-
2-吡唑啉-5-酮；
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(2-二甲氨基乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(4-乙氧羰基基吡咯-2-基)亚甲基]-
2-吡唑啉-5-酮；
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(3-乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-
2-吡唑啉-5-酮；
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(3-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(3-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(4-吗啉代乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(4-吗啉代乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(3-四氢呋喃基丁基甲基)-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(5-甲氧基吲哚-2-基)亚甲基]-2-
吡唑啉-5-酮；
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[[4,5-二亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[[3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基)吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[[3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基)吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[[3,4-二乙氧基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-氨基-2-羧乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[[5-乙氧基-4-甲氧基基甲基-3-甲氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[[5-氯-4-甲氧基基甲基-3-甲氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-[[4-甲基-1-哌嗪基甲基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-[[4-甲基-1-哌嗪基甲基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氧基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-[[哌啶子基甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氧基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲基甲基-4, 5-四亚甲基咔唑-2-基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-吗啉代甲基-4, 5-四亚甲基咔唑-2-基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二乙氨基甲基-4, 5-四亚甲基咔唑-2-基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(4-甲基-1-哌嗪基)甲基-4, 5-四亚甲基咔唑-2-基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-嘧啶基)-4-[[3-(1-吡咯烷基)甲基-4, 5-四亚甲基咔唑-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-哌嗪子甲基-4, 5-四亚甲基咔唑-2-基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基-4, 5, 6, 7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基乙基-3, 5-二甲基咔唑-2-基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-(3, 5-二氯-4-羟基亚苯基)-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-二甲氨基甲基咔唑-2-基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氧代-1, 5, 6, 7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基咔唑-2-基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-吗啉代甲基咔唑-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3, 5-二甲基-4-(4-甲基-1-哌嗪基甲基)咔唑-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3, 5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基咔唑-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3, 5-二甲基-4-(二乙氨基甲基咔唑-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3, 5-二甲基-4-(哌嗪子甲基咔唑-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙醇氨基甲基-3, 5-二甲基毗咯-2-基)亚甲基]-3-(5-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基甲基-4, 5-四亚甲基毗咯-2-基)亚甲基]-3-(5-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-吗啉代甲基-4, 5-四亚甲基毗咯-2-基)亚甲基]-3-(5-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二乙氨基甲基-4, 5-四亚甲基毗咯-2-基)亚甲基]-3-(5-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(4-甲基-1-哌嗪基)甲基-4, 5-四亚甲基毗咯-2-基)亚甲基]-3-(5-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-嘧啶基)-4-[[3-(1-吡咯烷基)甲基-4, 5-四亚甲基毗咯-2-
基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-哌啶子基甲基-4, 5-四亚甲基毗咯-2-基)亚甲基]-3-(5-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基-4, 5, 6, 7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基乙基-3, 5-二甲基毗咯-2-基)亚甲基]-3-(5-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二溴-4-羟基亚苄基)-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-二甲氨基甲基毗咯-2-基)亚甲基]-3-(5-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氧代-1, 5, 6, 7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基毗咯-2-基)亚甲基]-3-(5-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-[(4-甲基-1-哌嗪基甲基)吡咯-2-基]亚甲
基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-喹
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(吲哚子基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-喹
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙醇氨基甲基-3,5-二甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-喹
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基甲基-4,5-四亚甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-喹
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-吗啉代甲基-4,5-四亚甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-喹
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二乙氨基甲基-4,5-四亚甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-喹
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二乙氨基甲基-4,5-四亚甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-喹
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-甲基-4-(吲哚子基甲基吲哚-2-基)亚甲基)-3-(2-喹
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-喹啶基)-4-[[3-(1-吡咯烷基)甲基-4,5-四亚甲基吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-吲哚子基甲基-4,5-四亚甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-喹
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-喹
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-喹
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二溴-4-羟基亚苯基)-3-(2-喹啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-喹
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氧代-1,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-喹啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-喹啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪
基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[[4-(甲基-1-哒嗪基甲基)吲哚-2-基]亚甲
基)-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基甲基-3, 5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-嘧啶子甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙醇氨基甲基-3, 5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基甲基-4, 5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基甲基-4, 5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(4-甲基-1-哌嗪基)甲基-4, 5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-哒嗪基)-4-[(3-(1-吡咯烷基)甲基-4, 5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基-4, 5, 6, 7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基乙基-3, 5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-(3, 5-二溴-4-羟基亚苄基)-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氧代-1, 5, 6, 7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基喹啉-2-基)甲基基]-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(4-甲基-1-吡嗪基甲基)喹啉-2-基)亚甲基]-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(1-吡啶基甲基喹啉-2-基)亚甲基]-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙基氨基甲基-3,5-二甲基-喹啉-2-基)亚甲基]-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(哌啶子基甲基喹啉-2-基)亚甲基]-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙醇氨基甲基-3,5-二甲基-喹啉-2-基)亚甲基]-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基甲基-4,5-四亚基喹啉-2-基)亚甲基]-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-吗啉代甲基-4,5-四亚基喹啉-2-基)亚甲基]-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二乙氨基甲基-4,5-四亚基喹啉-2-基)亚甲基]-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(4-甲基-1-哌嗪基)甲基-4,5-四亚基喹啉-2-基)亚甲基]-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-咕嗪基)-4-[(3-(1-吡啶基甲基-4,5-四亚基喹啉-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-哌啶子基甲基-4,5-四亚基喹啉-2-基)亚甲基]-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基甲基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基-喹啉-2-基)亚甲基]-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-(3,5-二溴-4-羟基亚苄基)-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲基氨基甲基喹啉-2-基)亚甲基]-3-(4-咕嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲基-1,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(4-咕嗪基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲基氨基甲基-5-甲基吗唑-2-基)亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吗唑-2-基)亚甲基]-3-(5-异唑唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[[4-甲基-1-哌嗪基甲基]吗唑-2-基]亚甲基]-3-(5-异唑唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[[1-吡咯烷基甲基吗唑-2-基]亚甲基]-3-(5-异唑唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲基氨基甲基-3,5-二甲基吗唑-2-基)亚甲基]-3-(5-异唑唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙酰氨基甲基-3,5-二甲基吗唑-2-基)亚甲基]-3-(5-异唑唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲基氨基甲基-4,5-二亚甲基吗唑-2-基)亚甲基]-3-(5-异唑唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-异唑唑基)-4-[[3-吗啉代甲基-4,5-二亚甲基吗唑-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-二亚甲基氨基甲基-4,5-二亚甲基吗唑-2-基]亚甲基]-3-(5-异唑唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-异唑唑基)-4-[[3-(4-甲基-1-哌嗪基)亚甲基-4,5-二亚甲基吗唑-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-异唑唑基)-4-[[3-(1-吡咯烷基)亚甲基-4,5-二亚甲基吗唑-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-异唑唑基)-4-[[3-吗啡子基甲基-4,5-二亚甲基吗唑-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲基甲基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-异唑唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氧基乙基-3,5-二甲基吗唑-2-基)亚甲基]-3-(5-异唑唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二碳-4-羟基亚菲基)-3-(5-异唑唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氧化-1,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-异唑唑
基）-2-咪唑啉-5-酮，
4-((4-二甲氨基甲基-5-甲基吲哚-2-基)亚甲基)-3-(5-异喹啉基)-2-咪唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异喹啉基)-2-咪唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(4-甲基-1-哌嗪基甲基)吲哚-2-基]亚甲基)-3-(5-甲基-3-异喹啉基)-2-咪唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(1-吲哚烷基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异喹啉基)-2-咪唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异喹啉基)-2-咪唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-哌啶子基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异喹啉基)-2-咪唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙醇氨基甲基-3,5-二甲基-吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异喹啉基)-2-咪唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基甲基-4,5-四亚甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异喹啉基)-2-咪唑啉-5-酮，
3-(5-甲基-3-异喹啉基)-4-[(3-吗啉代甲基-4,5-四亚甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-咪唑啉-5-酮，
4-[(3-二乙氨基甲基-4,5-四亚甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异喹啉基)-2-咪唑啉-5-酮，
3-(5-甲基-3-异喹啉基)-4-[(3-吗啉代甲基-4,5-四亚甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-咪唑啉-5-酮，
3-(5-甲基-3-异喹啉基)-4-[(3-吗啉代甲基-4,5-四亚甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-咪唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异喹啉基)-2-咪唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异喹啉基)-2-咪唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二溴-4-羟基亚苄基)-3-(5-甲基-3-异喹啉基)-2-咪唑啉-5-酮，
啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-二甲氨基甲基异唑-2-基)甲基]-3-(5-甲基-3-异唑基)-2-嘧啶啉-5-酮，
3-(5-甲基-3-异唑基)-4-[(4-氧代-1, 5, 6, 7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-2-嘧啶啉-5-酮，
亚甲基]-2-嘧啶啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基异唑-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异唑基)-2-嘧啶啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(1-3-[(二甲氨基)甲基]-4, 5, 6, 7-四氢-1H-2-吲哚基亚甲基)-4, 5-二氢-1H-5-吡唑酮，
3-环丙基-4-[(1-4-[(1, 1-二甲基醚)甲基]-3, 5-二甲基-1H-2-吡咯基亚甲基)]-4, 5-二氢-1H-5-吡唑酮马来酸盐，
4-[[1-4-[(2-二甲氨基)乙基]氨基]甲基]-3, 5-二甲基-1H-2-吡咯基亚甲基]-3-(2-吡唑基)-4, 5-二氢-1H-5-吡唑酮，
4-[(1-4-[(2-二甲氨基)乙基]-3, 5-二甲基-1H-2-吡咯基亚甲基)]-3-(2-吡唑基)-4, 5-二氢-1H-5-吡唑酮，
4-1-[(4-3-氯丙酰基)-3, 5-二甲基-1H-2-吡咯基]亚甲基]-3-(2-吡唑基)-4, 5-二氢-1H-5-吡唑酮，
4-(1-3-[(二甲氨基)甲基]-4, 5, 6, 7-四氢-1H-2-吲哚基亚甲基)]-3-(2-吡唑基)-4, 5-二氢-1H-5-吡唑酮，
4-(1-4-[(二甲氨基)甲基]-3, 5-二甲基-1H-2-吡咯基亚甲基)]-3-(5-甲基-3-异唑基)-4, 5-二氢-1H-5-吡唑酮，
3-环丙基-4-[(4, 5-二甲基异唑-2-基)亚甲基]-2-嘧啶啉-5-酮，
3-苄基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-嘧啶啉-5-酮，
3-(4-甲氧基苯氧基)甲基]-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-嘧啶啉-5-酮，
3-苯氧基甲基]-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-嘧啶啉-5-酮，
3-(4-氯苯氧基)甲基]-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-嘧啶啉-5-酮，
3-(4-甲氧基苄基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-嘧啶啉-5-酮，
3-苄基-4-[[4-(2-酯基)-3-甲基异唑-2-基]亚甲基]-2-嘧啶啉-5-酮，
3-苄基-4-[(3-(2-羧乙基)-4-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲基苯氧基甲基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
2-氨基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-苯乙基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-苯基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲基苯氧基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲基苯氧基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苄基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苯基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-氯苯氧基甲基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(吲哚-3-基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-甲氧基苄基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3,4-二甲氧基苄基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲氧基苯乙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-苯基苯氧基甲基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-苯基丙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-苯基丙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-羰基苯乙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-苯乙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲基苯乙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-(4-硝基苯乙基)-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-(4-氯苯基)-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-(4-氯苯乙基)-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
4-[(4,5-二甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮；
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吲哚-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮；
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吲哚-2-基)亚甲基]-3-苯乙基-2-吡唑啉-5-酮；
4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮；
3-环戊基-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-叔丁基环基-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-异丙氧基-4-[(4-甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-(4-氯苯基乙基)-4-[(4-甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-异丙氧基-4-[(1-甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-异丙氧基-4-[(5-甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-(4-氯苯基乙基)-4-[(3,5-二甲基-4-乙基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-乙氧基-4-[(5-甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
3-(4-氯苯甲酰基苯乙基)-4-[(3,5-二甲基-4-乙基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(4-甲氧基基苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮；
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吲哚-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮；
3-(4-氯苯基乙基)-4-[(3,5-二甲基-4-乙基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
4-[(5-乙基吲哚-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮；
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(4-羟基苯乙
基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(乙氧羰基甲基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(4-甲基苯氧基甲基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
5-4-[(3-[(2-羧乙基)-4-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-异丙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二氯苯基)吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
10-4-[(4,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-4-[(3-吡啶基)]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环戊基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-甲基环丙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(苯并噻唑-2-基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-4-[(3-吡啶基)]-2-吡唑啉-5-酮，
20-3-环丙基-4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(吡咯-2-基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(苯并噻唑-2-基)-4-[(4-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
25-4-[(3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-[(3-吡啶基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-[(3-吡啶基)]-2-吡唑啉-5-酮，
30-3-环丙基-4-[(5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-[(3-吡啶基)]-2-吡唑啉-5-酮，
酮，

\[ 3\text{-} \text{环丙基}-4\text{-}[ (5\text{-} \text{乙基呫咯}-2\text{-} \text{基}) \text{亚甲基}]\text{-}2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 3\text{-} \text{环丙基}-4\text{-}[ (3,5\text{-} \text{二甲基}-4\text{-} \text{乙氧羰基呫咯}-2\text{-} \text{基}) \text{亚甲基}]\text{-}2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 3\text{-} \text{异丙基}-4\text{-}[ (5\text{-} \text{苯基呫咯}-2\text{-} \text{基}) \text{亚甲基}]\text{-}2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 3\text{-} \text{丙基}-4\text{-}[ (呫咯-2\text{-} \text{基}) \text{亚甲基}]\text{-}2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 3\text{-} \text{甲基}-4\text{-}[ (呫咯-2\text{-} \text{基}) \text{亚甲基}]\text{-}2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 3\text{-} \text{异丙基呫基氨基}]-4\text{-}[ (呫咯-2\text{-} \text{基}) \text{亚甲基}]\text{-}2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 4\text{-} \{4\text{-} (2\text{-} \text{亚乙基}-3\text{-} \text{甲基呫咯}-2\text{-} \text{基}) \text{亚甲基}]\text{-}3\text{-} \text{异丙氧基}]-2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 4\text{-} \{4\text{-} (2\text{-} \text{亚乙基})\text{-}3\text{-} \text{甲基呫咯}-2\text{-} \text{基} \text{亚甲基}]\text{-}3\text{-} \text{异丙氧基}]-2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 4\text{-} \{4\text{-} \text{羧基}-3,5\text{-} \text{二甲基呫咯}-2\text{-} \text{基} \text{亚甲基}]\text{-}3\text{-} \text{异丙氧基}]-2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 3\text{-} \text{异丙基}-4\text{-}[ (4,5\text{-} \text{四亚甲基呫咯}-2\text{-} \text{基}) \text{亚甲基}]\text{-}2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 4\text{-} \{3,5\text{-} \text{二甲基}-4\text{-} \text{吗啉代甲基呫咯}-2\text{-} \text{基} \text{亚甲基}]\text{-}3\text{-} \text{异丙氧基}]-2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 4\text{-} \{3,5\text{-} \text{二甲基}-4\text{-} \text{二甲氨基甲基呫咯}-2\text{-} \text{基} \text{亚甲基}]\text{-}3\text{-} \text{异丙氧基}]-2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 4\text{-} \{4\text{-} \text{乙酰基}-3,5\text{-} \text{二甲基呫咯}-2\text{-} \text{基} \text{亚甲基}]\text{-}3\text{-} \text{异丙氧基}]-2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 4\text{-} \{3,5\text{-} \text{二甲基}-4\text{-} (2\text{-} \text{二甲氨基乙氧羰基} \text{呫咯}-2\text{-} \text{基}) \text{亚甲基}]\text{-}3\text{-} \text{异丙氧基}]-2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 4\text{-} \{3,5\text{-} \text{二甲基}-4\text{-} (2\text{-} \text{二甲氨基乙氧羰基} \text{呫咯}-2\text{-} \text{基}) \text{亚甲基}]\text{-}3\text{-} \text{异丙氧基}]-2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 4\text{-} \{5\text{-} \text{乙氧羰基呫咯}-2\text{-} \text{基} \text{亚甲基}]\text{-}3\text{-} \text{异丙氧基}]-2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 4\text{-} \{5\text{-} \text{羧基呫咯}-2\text{-} \text{基} \text{亚甲基}]\text{-}3\text{-} \text{异丙氧基}]-2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]

\[ 3\text{-} (4\text{-} \text{氯苯基氨基氨基} \text{甲基})\text{-}4\text{-}[ (呫咯-2\text{-} \text{基}) \text{亚甲基}]\text{-}2\text{-} \text{吡唑啉}-5\text{-} \text{酮}, \]
5-酮，
3-环丙基-4-[(5-苯基哒咯-2-基)亚甲基]-2-哒唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基哒咯-2-基)亚甲基]-3-(四氨呋喃-3-基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-[(4-羧基-3,5-二甲基哒咯-2-基)亚甲基]-3-环丙基-2-哒唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧羰基哒咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒唑基)-2-哒唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基哒咯-2-基)亚甲基]-2-哒唑啉-5-酮，
4-[(3,4-二甲基哒咯-2-基)亚甲基]-3-哒嗪基-2-哒唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-羧乙基)-3-甲基哒咯-2-基)亚甲基]-3-环丙基-2-哒唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基哒咯-2-基)亚甲基]-2-哒唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(5-乙氧羰基哒咯-2-基)亚甲基]-2-哒唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4,5-四亚甲基哒咯-2-基)亚甲基]-2-哒唑啉-5-酮，
3-(2-甲氧羰基乙基)-4-[(哒咯-2-基)亚甲基]-2-哒唑啉-5-酮，
3-乙氧羰基-4-[(哒咯-2-基)亚甲基]-2-哒唑啉-5-酮，
3-异丙基-4-[(哒咯-2-基)亚甲基]-2-哒唑啉-5-酮，
3-反-2-苯基环丙基)-4-[(哒咯-2-基)亚甲基]-2-哒唑啉-5-酮，
3-环乙基-4-[(哒咯-2-基)亚甲基]-2-哒唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4,5-四亚甲基哒咯-2-基)亚甲基]-2-哒唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(5-吗啉代甲基哒咯-2-基)亚甲基]-2-哒唑啉-5-酮，
4-[(5-羧基哒咯-2-基)亚甲基]-3-环丙基-2-哒唑啉-5-酮，
4-[(4-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-溴吡咯-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-溴吡咯-2-基)亚甲基]-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-吡唑基-4-[(4, 5-二亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4, 5-二亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3, 5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-甲基-3, 5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3, 5-二甲基-4-环丙基乙氧基基)吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-环丙基乙氧基基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-二甲基氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-二甲基氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-2-吡啶基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-2-吡啶基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4, 5-二亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-2-吡啶基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-2-吡啶基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-环丙基乙氧基基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-2-吡啶基]-2-吡唑啉-5-酮，
5-酮，
3-环丙基-4-[(4-乙氧酰基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二甲基-4-三氟乙酰氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(苯并噻唑-2-基)-4-[(3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(苯并噻唑-2-基)-4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-乙氧酰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二乙酰氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-三氟乙酰氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-乙氧酰基-3-苯基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-吡喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧酰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-苯基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-苯基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,4-二(乙氧羰基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡咯啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-吡啶基乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基-2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-羧基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(5-硝基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(4-硝基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-羧基吡咯-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-二甲基氨基乙基氨基甲基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氯-3-甲氧羰基-4-甲氧羰基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-羧基乙基)-4-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-三氟甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-氨基苯基)-4-[(3,5-二甲基-4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[[2-(4-喹啉代乙基)氨基羰基吡咯-2-基]亚甲基]-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-乙氧苯基-3-苯基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-甲基-1-哌嗪基甲基)-3, 5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-乙氧苯基甲基-3, 5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-哌啶子基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-哌啶子基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-异喹啉基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-异喹啉基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4- [N-(2-二甲氨基乙基)-N-甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-二甲氨基甲基-4, 5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基甲基-4, 5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3, 5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮马来酸盐，
4-[(4-(3-氯丙酰基)-3, 5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-二甲氨基乙基)-3, 5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异喹啉基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3, 5-二甲基-4-(4-羟基哌啶子基甲基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氨基甲基-3, 5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-
吡唑啉-5-酮马来酸盐，
4-[[4-(4-苄基哌啶子基)甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-羟基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基
2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[3,5-二甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[3,5-二甲基-4-(2-羟基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-乙氧基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(3-二乙氧基丙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(3-羟丙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-二甲氨基乙酰基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-二甲氨基乙酰基吡咯-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[2-二乙氧基乙基)-3,5-二甲基-4-吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(4-羟基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(4-二乙氧基丁基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氧基乙基-N-氧化物)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基乙酰基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡嗪基-2-吡咯啉-5-酮，

4-[(4-乙氧基-2基-3, 5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡咯啉-5-酮，

4-[(3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡咯啉-5-酮，

4-[[3, 5-二甲基-4-[3-(1-吡咯烷基丙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡咯啉-5-酮，

4-[(二甲氧基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡咯啉-5-酮，

3-环丙基-4-[(二甲氧基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡咯啉-5-酮，

4-[[3, 5-二甲基-4-(2-乙氧基丙酰基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡咯啉-5-酮，

3-苄基-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡咯啉-5-酮，

3-苄基-4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡咯啉-5-酮，

4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-甲氧基苯氧基甲基)-2-吡咯啉-5-酮，

4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-苯氧基甲基-2-吡咯啉-5-酮，

3-(4-氯苯氧基甲基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡咯啉-5-酮，

4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-甲氧基苄基)-2-吡咯啉-5-酮，

4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-甲氧基苄基)-2-吡咯啉-5-酮，

3-(4-氯苄基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[1-（4-羟基丁基）吲哚-3-基]亚甲基]-3-（4-甲氧基苄基）-2-吡唑啉-5-酮，
3-（4-氟苯基）-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-（3-甲氧基苯基）-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3,4-二甲氧基苄基)-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-（4-羟基苄基）-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-（3-氟苯基甲基）-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-（吲哚-3-基）-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-（4-甲氧基苯乙基）-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-（4-苯基甲氧基甲基）-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-（2-苯基丙基）-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-（3-苯基丙基）-2-吡唑啉-5-酮，
3-（4-羟基苄基）-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-（4-甲氧基苯乙基）-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-（4-羟基丁基）吲哚-3-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-（4-羟基丁基）吲哚-3-基]亚甲基]-3-苯乙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-（4-硝基苯乙基）-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-（4-氟苯基）-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-（4-氨基苯乙基）-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[[2-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[[7-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-3-苯乙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环戊基-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[[1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4- [(吲哚-3-基)亚甲基]-3- (4-甲氧基苯基乙基)-2- 吡唑啉-5-酮，
3- 异丙氧基-4- [(1- 异丙基吲哚-3-基) 亚甲基]-2- 吡唑啉-5-酮，
3- (4- 苯基苯乙基)-4- [(1- 甲基吲哚-3-基) 亚甲基]-2- 吡唑啉-5-酮，
3- 异丙基-4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-2- 吡唑啉-5-酮，
3- (4- 氨基苯基苯基甲基)-4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-2- 吡唑啉-5-酮，
3- 乙氧基苯基甲基]-4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-2- 吡唑啉-5-酮，
4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-3- (4- 甲氧基苯基苯基甲基)-2- 吡唑啉-5-酮，
3- 环丙基-4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-2- 吡唑啉-5-酮，
4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-3- (3- 吡啶基)-2- 吡唑啉-5-酮，
3- (2- 氨基苯基乙基)-4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-2- 吡唑啉-5-酮，
3- 环丁基-4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-2- 吡唑啉-5-酮，
3- (2- 二甲基氨基乙基)-4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-2- 吡唑啉-5-酮，
3- 环丙基-4- [(1- (4- 羟基丁基) 吲哚-3-基) 亚甲基]-2- 吡唑啉-5-酮，
4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-3- (4- 吡啶基)-2- 吡唑啉-5-酮，
3- 环戊基-4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-2- 吡唑啉-5-酮，
4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-3- (2, 2, 3, 3- 四甲基环丙基)-2- 吡唑啉-5-酮，
4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-3- (2- 甲氧基环丙基)-2- 吡唑啉-5-酮，
3- 环己基-4- [(1- (4- 羟基丁基) 吲哚-3-基) 亚甲基]-2- 吡唑啉-5-酮，
4- [(1- (4- 羟基丁基) 吲哚-3-基) 亚甲基]-3- (4- 吡啶基)-2- 吡唑啉-5-酮，
3- (苯并噻唑-2-基)-4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-2- 吡唑啉-5-酮，
4- [(吲哚-3-基) 亚甲基]-3- (2- 吡啶基)-2- 吡唑啉-5-酮，
3-二甲氨基-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(吡咯-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(6-甲氧基苯并噻唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(7-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-丙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-三氟甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-3-甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-3-三氟甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-3-(叔丁基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基基-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(2-甲氧基苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(反-2-苯基-1-环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丁基-4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[6-羟基-1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[5-甲氧基-1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[5-甲氧基-1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[1,7-二甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-3-(四氢呋喃-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基氨基-4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(6-羧基-1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1,7-二甲基吲哚-3-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(5-甲氧基-1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苯氨基)-4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-3-三氯乙酰氨基-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苯基乙基)-4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-氨基-4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苯乙基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-异噁唑基)-4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-3-叔丁基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(6-羧基-1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-3-咪唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1-甲基-6-[(2-(4-吗啉代)乙基)氨基苯基吲哚-3-基)亚甲基]-3-咪唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-羟基苯乙基)-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氨基苯乙基)-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲氧基苯乙基)-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氨基甲酰基苯乙基)-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-
5-酮，
3-环丙基-4-[(吲哚-2-基)环亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-二甲氨基代甲基吲哚-2-基)环亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-2-基)环亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(5-甲氧基代吲哚-2-基)环亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(1-甲氧基代吲哚-2-基)环亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-2-基)环亚甲基]-3-(四氢呋喃-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(5-甲氧基代吲哚-2-基)环亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(5-硝基代吲哚-2-基)环亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-2-基)环亚甲基]-3-异丙基氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-羧基代苯乙基)-4-[(吲哚-2-基)环亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-2-基)环亚甲基]-3-苯基-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(3-甲氧基代吲哚-2-基)环亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(3-2-甲氧基代基-2-乙酰基代苯环乙基)吲哚-2-基]环亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(吲哚-2-基)环亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(3-(4-吗啉代甲基)吲哚-2-基)环亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-(4-吗啉代甲基)吲哚-2-基)环亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-甲氧基代吲哚-2-基)环亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-甲氧基代吲哚-2-基)环亚甲基]-3-(2-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氯-6,7-二氯吲哚-2-基)环亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氯-6,7-二氯吲哚-2-基)环亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氯-1,5,6,7-二氯吲哚-2-基)环亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基代甲基吲哚-2-基)环亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-苄基-2-吡唑啉-5-酮，
3-苄基-4-[(1-(4-羟基丁基)-7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-甲氧基苯氧基甲基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-氧基-4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-甲氧基苄基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-苯氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-甲基苄基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-羟基苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1-(4-羟基丁基)-7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-羟基苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-异丙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-环丁基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-苯基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-氯苯氧基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-丙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-三氟甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-(叔丁基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1-(4-羟基丁基)-7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-三氟甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-异丙基苯氧基)-2-吡唑啉-5-酮，
-5-酮，
4-[(7-氯杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-(3-甲基苯氧基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-乙氧基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-甲基苯氧基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氯杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-苯乙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-苄基-4-[(4-二甲氧基苯基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氧基苯基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氧基苯基)亚甲基]-3-苯乙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-二甲氧基苯基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(3-甲基吡唑-4-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-甲基吡唑-4-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(咪唑-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(咪唑-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(咪唑-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(咪唑-4-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(噻吩-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[2-(吲哚-3-基)亚甲基]-3-异丙基-1-甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(8-羟基喹啉-5-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氧基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-咪唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氧基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-咔唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氧基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氧基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-咔唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氧基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氧基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氧基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氧基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-
(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-{[(3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-{[(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-{[(3,5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二甲基-4-[(2-4-吡啶基甲氨基)乙基]吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-酰乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-{[(4-二乙氨基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-{[(4-(1-吡咯烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-异丙基-5-甲基-4-[(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-(2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-{[(4-[3-(1-吡咯烷基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-异丙基-5-甲基-4-(4-哌啶子基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-{[(4-[3-(4-吡啶基甲氨基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-{[(4-(4-二甲氨基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-{[(3-环丙基-4-二乙氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-{[(3-环丙基-4-(1-吡咯烷基甲基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
基]亚甲基)-2-吡唑啉-5-酮；
3-环丙基-4-\{(3-环丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基)乙基]吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮；
3-环丙基-4-\{(3-环丙基-4-[2-二(甲氨基乙基)氨基乙基]-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮；
3-环丙基-4-\{(3-环丙基-4-\{(3-二乙氨基丙基)-5-甲基吡咯-2-基\}乙甲基\}-2-吡唑啉-5-酮；
3-环丙基-4-\{(3-环丙基-4-[3-(2,5-二甲基-1-吡咯烷基)丙基]-5-甲基吡咯-2-基\}亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮；
3-环丙基-4-\{(3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基甲氧基丙基)吡咯-2-基\}亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮；
3-环丙基-4-\{(3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-吡咯烷基)丁基]吡咯-2-基\}亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮；
3-环丙基-4-\{(3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基\}亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮；
4-\{(4-2-环丙基氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮；
4-\{(3,5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基)吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮；
4-\{(3-5-二甲基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基)乙基]吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮；
4-\{(4-2-氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮；
4-\{(4-二乙氨基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮；
4-\{(4-1-吡咯烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮；
4-\{(3-异丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮；
4-\{(4-2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮；
3-吡嗪基-4-\{(4-[3-(1-吡咯烷基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯
-2-基)亚甲基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-丙基-5-甲基-4-(4-哌啶基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
3-吡嗪基-4-[[4-[[3-(4-吡啶基甲基)丙基]-3-异丙基-5-甲基
吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(4-二甲氨基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-二乙氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[2-(1-甲氨基乙基)氨乙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-(3-乙氨基丙基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[3-(2,5-二甲基-1-吡咯烷基)丙基]-5-甲基吡
咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基甲氨基丙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-{4-(1-吡咯烷基)丁基]吡咯-2-基}亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]
-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-
呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-
呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-
(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-乙氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-
呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3, 5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基) 吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-
吡喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3, 5-二甲基-4-[2-(4-吡啶基甲基乙基) 吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2 吡喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-二氧基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-
(2 吡喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(1-吡咯烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基-
)-3-(2 吡喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-烷乙基)-3, 5-二甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2 吡喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-异丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基) 吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2 吡喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基-
)-3-(2 吡喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2 吡喃基)-4-{{4-[3-(1-吡咯烷基) 丙基]-3-异丙基-5-甲基-
吡咯-2-基}亚甲基}-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2 吡喃基)-4-{{3-异丙基-5-甲基-4-(4-哌啶子基丁基) 吡咯-
-2-基}亚甲基}-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2 吡喃基)-4-{{4-[3-(4-吡啶基甲基) 丙基]-3-异丙基-5-
甲基吡咯-2-基}亚甲基}-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(4-二氧基甲基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基-
)-3-(2 吡喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-(3-环丙基-4-二氧基甲基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-
(2 吡喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-(3-环丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基) 乙基) 吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2 吡喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-(环丙基-4-[2-(二甲氧基乙基) 氨基乙基) 5-甲基吡咯-2-
-基}亚甲基}-3-(2 吡喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-(环丙基-4-[(3-二氧基丙基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基-
)-3-(2 吡喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-(环丙基-4-[3-(2, 5-二甲基-1-吡咯烷基) 丙基]-5-甲基吡咯-
-2-基}亚甲基}-3-(2 吡喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基甲氧基丙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(1-吡咯烷基)丁基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氧基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-乙氨基乙基)-吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-羟基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氧基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(1-吡咯烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-[[2-1-吡咯烷基乙基]]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[3-1-吡咯烷基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-(4-哌啶子基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{(4-\{(4-[3-(4-哒啶基甲氨基)丙基]-3-异丙基-5-甲基哒咯-2-基\}亚甲基)-3-(2-嘿吩基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{4-\{4-2-甲氧基丁基]-3-异丙基-5-甲基哒咯-2-基\}亚甲基]-3-(2-嘿吩基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{(3-环丙基-4-二乙氨基甲基-5-甲基哒咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘿吩基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{(3-环丙基-5-甲基-4-\{2-(1-哒咯烷基)乙基\}哒咯-2-基\}亚甲基]-3-(2-嘿吩基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{(3-环丙基-4-\{2-二(甲氧基乙基)氨基乙基\}-5-甲基哒咯-2-基\}亚甲基]-3-(2-嘿吩基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{3-环丙基-4-\{(3-二乙氨基丙基)-5-甲基哒咯-2-基\}亚甲基]-3-(2-嘿吩基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{3-环丙基-4-\{(3-2, 5-二甲基-1-哒咯烷基)丙基\}-5-甲基哒咯-2-基\}亚甲基]-3-(2-嘿吩基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{3-环丙基-5-甲基-4-\{(3-苯基甲氨基丙基)哒咯-2-基\}亚甲基]-3-(2-嘿吩基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{3-环丙基-5-甲基-4-\{4-(1-哒咯烷基)丁基\}哒咯-2-基\}亚甲基]-3-(2-嘿吩基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{3-环丙基-5-甲基-4-\{(4-环丁基氨基丁基)哒咯-2-基\}亚甲基]-3-(2-嘿吩基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{(3, 5-二甲基-4-(1-哒咯烷基甲基哒咯-2-基)亚甲基]-3-(4-哒啶基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{(4-二乙氨基甲基-3, 5-二甲基哒咯-2-基)亚甲基]-3-(4-哒啶基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{(4-2-环丙基氨基乙基)-3, 5-二甲基哒咯-2-基\}亚甲基]-3-(4-哒啶基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{3, 5-二甲基-4-(2-乙氨基乙基)-哒咯-2-基\}亚甲基]-3-(4-哒啶基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{3, 5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基)哒咯-2-基\}亚甲基]-3-(4-哒啶基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-\{3, 5-二甲基-4-(2-4-哒啶基甲氨基)乙基]哒咯-2-基\}亚甲基]-3-(4-哒啶基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-[[4-（2-羧乙基）-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[4-（二乙氧基甲基）-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[4-(1-吡咯烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
3-(4-嘧啶基)-4-[[4-[3-(1-吡咯烷基丙基)]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-(4-嘧啶子基丁基) 吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[4-[3-(4-吡啶基甲氨基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[4-(4-二甲氨基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-二乙氧基甲基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-二乙氧基甲基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[2-(二甲氧基乙基)氨乙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[3-(二乙氧基丙基)]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[3-(2,5-二甲基-1-吡咯烷基)丙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基甲氨基丙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-吡咯烷基丁基) 吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡咯啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁酰氧基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氨基乙基]-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-乙氨基乙基)-吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-羧基苯基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-羧基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(1-吡咯烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基)-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-嘧啶基)-4-[[4-[3-(1-吡咯烷基)甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基)-4-(4-哌啶子基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[3-(4-吡啶基甲氨基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(4-二甲氨基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-环丙基-4-二乙氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[(1-吡咯烷基)乙基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[(2-二甲氨基乙基)氨基乙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[(3-二乙氨基丙基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[(3-二乙氨基丙基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[(3-二乙氨基丙基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[(3-苯基甲氨基丙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[(1-吡咯烷基)丁基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3, 5-二甲基-4-[(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基甲基-3, 5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基甲基-3, 5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3, 5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3, 5-二甲基-4-[(2-乙氨基乙基)-吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3, 5-二甲基-4-[(2-乙氨基乙基)-吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3, 5-二甲基-4-[(2-乙氨基乙基)-吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-羧乙基)-3, 5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(二乙氨基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(1-吡咯烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-噻啶基)-4-[[4-[[3-(1-吡咯烷基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-(4-哌啶子基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[[3-(4-吡啶基甲基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[[4-(二甲基氨基)丁基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-二乙氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基)乙基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[2-(甲氨苯基)乙烯基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-(3-二乙氨基丙基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[3-(2,5-二甲基-1-吡咯烷基)丙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基氨基丙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-吡咯烷基)丁基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-噻嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二氯基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-环丙基氨乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-乙基氨乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-苯氨乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[2-(4-吡啶基甲基)乙基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-环丙基-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二氯基甲基-3-环丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(1-吡啶烷基甲基)-3-环丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-环丙基-5-甲基-4-[2-(1-环丙基甲基)乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-环丙基氨乙基)-3-环丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-哒嗪基)-4-[(4-[3-(1-环丙基甲基)丙基]-3-环丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-环丙基-5-甲基-4-(4-嘧啶子丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-环丙基-5-甲基-4-(4-嘧啶子丁基)丙基]-3-环丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(4-环丙基甲基)-3-环丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-环丙基-4-二氯基甲基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(3-环丙基-4-[2-二(甲氧基乙基)氨基乙基]-5-甲基吲哚-2-基)亚甲基}-3-(3-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-4-(3-二乙氨基丙基)-5-甲基吲哚-2-基}亚甲基}-3-(3-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-4-[3-(2,5-二甲基-1-哒唑烷基)丙基]-5-甲基吲哚-2-基}亚甲基}-3-(3-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基甲基氨基丙基)吲哚-2-基}亚甲基}-3-(3-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-哒唑烷基)丁基]吲哚-2-基}亚甲基}-3-(3-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁基氨基丁基)吲哚-2-基}亚甲基}-3-(3-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{3,5-二甲基-4-(1-哒唑烷基甲基吲哚-2-基)亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吲哚-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-环丙基氨基乙基)-3,5-二甲基吲哚-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{3,5-二甲基-4-(2-乙氨基乙基)-吲哚-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{3,5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基)吲哚-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{3,5-二甲基-4-[2-(4-哒唑烷基甲基)乙基]吲哚-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{4-二乙氨基甲基-3-异丙基-5-甲基吲哚-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{4-(1-哒唑烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吲哚-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-亚乙基)-3,5-二甲基吲哚-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4-{{3-异丙基-5-甲基-4-[2-(1-哒唑烷基乙基)]吲哚-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-哒唑啉-5-酮，
4- \{[4-\text{-}(2-\text{环丙基氨基乙基})-3-\text{-}\text{异丙基}-5-\text{甲基呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(4-呫嗪基)-2-呫唑嗪-5-酮},\
3-\text{-} \{\text{(4-呫嗪基)-4-\{[4-\text{-}(3-\text{一呫咯烷基}) \text{丙基}\}-3-\text{-} \text{异丙基}-5-\text{甲基呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 2-\text{-} \text{呫唑嗪-5-酮},\
4-\{[3-\text{-} \text{异丙基}-5-\text{甲基}-4-\{\text{(4-呫啶子基丁基}) \text{呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(4-呫嗪基)-2-呫唑嗪-5-酮},\
4-\{[4-3-\{\text{(4-呫啶基甲氨基}) \text{丙基}\}-3-\text{-} \text{异丙基}-5-\text{甲基呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(4-呫嗪基)-2-呫唑嗪-5-酮},\
4-\{[4-\{4-\text{-} \text{二甲氨基丁基}-3-\text{-} \text{异丙基}-5-\text{甲基呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(4-呫嗪基)-2-呫唑嗪-5-酮},\
4-\{[3-\text{-} \text{环丙基}-4-\text{-} \text{二乙氨基甲基}-5-\text{甲基呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(4-呫嗪基)-2-呫唑嗪-5-酮},\
4-\{[3-\text{-} \text{环丙基}-5-\text{甲基}-4-\{\text{2-\(1\)-呫咯烷基}) \text{乙基}] \text{呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(4-呫嗪基)-2-呫唑嗪-5-酮},\
4-\{[3-\text{-} \text{环丙基}-4-\text{-} \text{二甲氨基乙基)-氨基乙基})-5-\text{甲基呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(4-呫嗪基)-2-呫唑嗪-5-酮},\
4-\{[3-\text{-} \text{环丙基}-4-\text{-} \text{(3-二乙氨基丙基})-5-\text{甲基呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(4-呫嗪基)-2-呫唑嗪-5-酮},\
4-\{[3-\text{-} \text{环丙基}-4-\text{-} \text{[3-\(2,5\)-二甲基-1-呫咯烷基})丙基]-5-\text{甲基呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(4-呫嗪基)-2-呫唑嗪-5-酮},\
4-\{[3-\text{-} \text{环丙基}-5-\text{甲基}-4-\{3-\text{-} \text{苯基甲氨基丙基}) \text{呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(4-呫嗪基)-2-呫唑嗪-5-酮},\
4-\{[3-\text{-} \text{环丙基}-5-\text{甲基}-4-\{\text{4-\(1\)-呫咯烷基}) \text{丁基}] \text{呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(4-呫嗪基)-2-呫唑嗪-5-酮},\
4-\{[3-\text{-} \text{环丙基}-5-\text{甲基}-4-\{\text{4-\(4\)-呫咯烷基氨基丁基}) \text{呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(4-呫嗪基)-2-呫唑嗪-5-酮},\
4-\{[3,5-\text{-} \text{二甲基}-4-\{\text{(1-呫咯烷基甲基呫咯}-2-\text{基}) \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呫唑嗪-5-酮},\
4-\{[4-\text{-} \text{二乙氨基甲基}-3,5-\text{-} \text{二甲基呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呫唑嗪-5-酮},\
4-\{[4-\text{-} \text{环丙基氨基乙基})-3,5-\text{-} \text{二甲基呫咯}-2-\text{基}] \text{亚甲基}\} - 3- \{\text{(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呫唑嗪-5-酮},
4- {{[3,5-二甲基-4-(2-乙氧基乙基)-呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[3,5-二甲基-4-(2-苯氧基乙基) 呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[3,5-二甲基-4-[2-(4-吡啶基甲基)乙基] 呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[4-(2-羧乙基)-3,5-二甲基呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[4-(二乙氨基甲基]-3-异丙基-5-甲基呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[4-(1-吡啶烷基氨基]-3-异丙基-5-甲基呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[3-异丙基-5-甲基]-4-[2-(1-吡啶烷基乙基)] 呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[4-(2-环丙基氨基乙基)]-3-异丙基-5-甲基呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[4-[3-(1-吡啶烷基) 丙基]-3-异丙基-5-甲基呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[3-异丙基-5-甲基]-4-(4-哌啶子基丁基) 呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[4-3-(4-吡啶基甲基) 丙基]-3-异丙基-5-甲基呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[4-(二甲氧基丁基)-3-异丙基-5-甲基呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[3-环丙基-4-二乙氨基甲基]-5-甲基呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[3-环丙基-5-甲基]-4-[2-(1-吡啶烷基) 乙基)] 呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[3-环丙基-4-[2-(二甲氧基乙基) 氨基乙基)]-5-甲基呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4- {{[3-环丙基-4-(3-二乙氨基丙基)-5-甲基呋喃-2-基}亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-呋喃啉-5-酮，
4-{(3-环丙基-4-[3-(2,5-二甲基-1-吡咯烷基)丙基]-5-甲基肟-2-基}亚甲基)-3-(1, 2, 4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基甲氨基丙基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-(1, 2, 4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-吡咯烷基)丁基]吡咯-2-基}亚甲基)-3-(1, 2, 4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基}亚甲基)-3-(1, 2, 4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基}亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]-3-三氟甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-乙基基乙基)-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基}亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{5-甲基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基乙基)]-3-三氟甲基吡咯-2-基}亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基}亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基}亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]-3-叔丁基吡咯-2-基}亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-乙基基乙基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基}亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{[4-(2-二甲基氧乙基)-3-乙基-5-甲基吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{3-乙基-5-甲基-4-[2-(1-吡啶烷基乙基)]吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{3-乙基-4-(2-氧代乙基乙基)-5-甲基吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{3-乙基-5-甲基-4-[2-(4-吡啶啶基甲氧基乙基)]吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{4-[2-(1-吗唑乙基)]乙基]-5-甲基-3-乙基吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{4-(2-氧代乙基乙基)-5-甲基-3-乙基吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{3-环丁基-4-(2-二甲基氧乙基)-5-甲基吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{3-环丁基-5-甲基-4-[2-(1-吡啶烷基乙基)]吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{3-环丁基-4-(2-氧代乙基乙基)-5-甲基吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{3-环丁基-5-甲基-4-[2-(4-吡啶啶基甲氧基乙基)]吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{4-[2-(1-吗唑乙基)]乙基]-5-甲基-3-环丁基吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{4-(2-氧代乙基乙基)-5-甲基-3-环丁基吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{3-环戊基-4-(2-二甲基氧乙基)-5-甲基吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{3-环戊基-5-甲基-4-[2-(1-吡啶烷基乙基)]吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{3-环戊基-4-(2-氧代乙基乙基)-5-甲基吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{{3-环戊基-5-甲基-4-[2-(4-吡啶啶基甲氧基乙基)]吲哚-2-基}甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-[(2-环己基)乙基]-5-甲基-3-环戊基吲哚-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[4-[(2-二氯基乙基)-5-甲基-3-环戊基吲哚-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[(2-二氯基乙基)-5-甲基吲哚-2-基]甲基]-3-吲哚基-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[(2-二氯烷基乙基)]吲哚-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[(2-二氯基乙基)-5-甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[(2-二氯烷基乙基)]吲哚-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[(2-二氯基乙基)-5-甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[(2-二氯烷基乙基)]吲哚-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[4-(2-乙氧基乙基)-5-甲基-3-(4-甲氧基苯)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡咯基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{5-甲基-3-(4-甲氧基苯)-4-[[2-(4-吲哚基甲氧基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]}-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(4-甲氧基苯)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[[4-(2-氯乙基)乙基]-5-甲基-3-(4-甲氧基苯)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[[4-(2-二氯乙基)乙基]-5-甲基-3-(2-吲哚基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[[5-甲基-3-(2-吲哚基)-4-[[2-(1-吲哚烷基乙基)]吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[[4-(2-氯乙基)乙基]-5-甲基-3-(2-吲哚基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[[4-(2-氯乙基)乙基]-5-甲基-3-(2-吲哚基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[[5-甲基-3-(2-吲哚基)-4-[[2-(1-吲哚烷基乙基)]吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[[4-(2-氯乙基)乙基]-5-甲基-3-(2-吲哚基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[[4-(2-氯乙基)乙基]-5-甲基-3-(2-吲哚基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[[5-甲基-3-(2-吲哚基)-4-[[2-(1-吲哚烷基乙基)]吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[[4-(2-氯乙基)乙基]-5-甲基-3-(2-吲哚基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[[5-甲基-3-(2-吲哚基)-4-[[2-(1-吲哚烷基乙基)]吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基-3-(2-咪唑基)-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基-3-(2-咪唑基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-嘧啶基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基-3-(2-嘧啶基)-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(2-嘧啶基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(2-嘧啶基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-5-甲基-3-(2-嘧啶基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[(3-(3-异嗯唑基)乙基)-5-甲基-3-(3-异嗯唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基-3-(3-异嗯唑基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吲哚基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([4-2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(3-异咦唑基)吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([4-(2-环丙基氨基乙基)]-5-甲基-3-(3-异咦唑基)吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([4-(2-二乙氨基乙基)]-5-甲基-3-(2-呋喃基)吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([5-甲基-3-(2-呋喃基)]-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([4-(2-乙氨基乙基)]-5-甲基-3-(2-呋喃基)吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([5-甲基-3-(2-呋喃基)]-4-[2-(4-吡啶基甲氨基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([4-(2-环丙基氨基乙基)]-5-甲基-3-(2-呋喃基)吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([4-(2-二乙氨基乙基)]-5-羟基甲基-3-异丙基吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([5-羟基甲基-3-异丙基]-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([4-(2-环丙基氨基乙基)]-5-羟基甲基-3-异丙基吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([5-羟基甲基-3-异丙基]-4-[2-(4-吡啶基甲氨基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([4-(2-乙氨基乙基)]-5-羟基甲基-3-异丙基吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([5-羟基甲基-3-异丙基]-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([5-环丙基-3-羟基]-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([4-(2-环丙基氨基乙基)]-5-羟基甲基-3-异丙基吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([5-羟基甲基-3-异丙基]-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-([5-环丙基-3-羟基]-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-[[4-(2-乙氨基甲基)-3, 5-二环丙基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3, 5-二环丙基-4-[2-(4-吡啶基甲基甲基乙基)] 吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[2-(1-咪唑基)乙基]-3, 5-二环丙基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3, 5-二环丙基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙基甲基)-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二甲基氨基甲基)-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基甲基)]-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基-4-[2-(4-吡啶基甲基甲基乙基)]-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-丙基甲基)-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙基甲基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二甲基氨基甲基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基甲基)]-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基-4-[2-(4-吡啶基甲基甲基乙基)]-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙基甲基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{4-\{2-(1-咪唑基)甲基\}-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基\}亚甲基)-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{4-\{2-(4-氯基甲基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{4-\{4-(2-氯基氨基)-3-乙基-5-甲基吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{4-\{4-(2-氯基氨基)-3-乙基-5-甲基吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{3-乙基-5-甲基-4-\{2-(1-吡咯烷基甲基)\}吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{3-乙基-4-(2-氯基氨基)-5-甲基吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{3-乙基-5-甲基-4-\{2-(4-吡啶基甲基氨基甲基)\}吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{4-\{2-(1-咪唑基)甲基\}-5-甲基-3-乙基吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{4-(2-氯基氨基)-5-甲基-3-乙基吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{3-环丁基-4-(2-氯基氨基)-5-甲基吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{3-环丁基-4-(2-氯基氨基)-5-甲基吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{3-环丁基-5-甲基-4-\{2-(1-吡咯烷基甲基)\}吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{4-\{4-(2-氯基氨基)-5-甲基-3-环丁基吡咯-2-基\}亚甲基\}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环戊基-4-(2-二乙氨基甲基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环戊基-4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环戊基-5-甲基-4-[2-(1-吡唑烷基甲基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环戊基-4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环戊基-5-甲基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-环戊基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-氯基甲基)-5-甲基-3-环戊基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环己基-4-(2-二乙氨基甲基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环己基-4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环己基-5-甲基-4-[2-(1-吡唑烷基甲基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环己基-4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环己基-5-甲基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-环己基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-氯基甲基)-5-甲基-3-环己基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(5-甲基-3-苯基-4-[2-(1-吡咯烷基甲基)]吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-苯基吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-[2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-苯基吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-(2-氨基甲基)-5-甲基-3-苯基吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-(4-甲氧基苯基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-[2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-(4-甲氧基苯基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(5-甲基-3-(4-甲氧基苯基)-4-[2-(1-吡咯烷基甲基)]吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-(4-甲氧基苯基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(5-甲基-3-(4-甲氧基苯基)-4-[2-(4-吡啶基甲基甲基)基]吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-[2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-(4-甲氧基苯基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-(4-甲氧基苯基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-[2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(5-甲基-3-(2-吡啶基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-(1-嘧啶基)甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-(2-氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-(二乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-(二甲氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-(乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(5-甲基-3-吡啶基-4-[2-(1-吡啶基甲基)]吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-(1-嘧啶基)甲基)-5-甲基-3-吡啶基吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-(环丙基氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-(二乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-(二甲氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-(乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(5-甲基-3-(2-嘧啶基)-4-[2-(1-吡啶基甲基)]吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-(乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-嘧啶基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(5-甲基-3-(2-嘧啶基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-(乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-嘧啶基)吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
权利要求书 第88/92页

4-{(4-2-环丙基氨基甲基)-5-甲基-3-(2-喹唑基)吡咯-2-基}
亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-二乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-喹唑基)吡咯-2-基}
亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-(2-喹唑基)吡咯-2-基}
亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(5-甲基-3-(2-喹唑基)-4-[2-(1-吡啶烷基甲基)]吡咯-2-基)
亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-喹唑基)吡咯-2-基}
亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(5-甲基-3-(2-喹唑基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-
基) 亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-(1-咪唑基)甲基)-5-甲基-3-(2-喹唑基)吡咯-2-基)
亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-环丙基氨基甲基)-5-甲基-3-(2-喹唑基)吡咯-2-基)
亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-(3-异喹唑基)吡咯-2-基)
亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-二甲氨基乙基)-5-甲基-3-(3-异喹唑基)吡咯-2-基)
亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(5-甲基-3-(3-异喹唑基)-4-[2-(1-吡啶烷基甲基)]吡咯-2-
基) 亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-(3-异喹唑基)吡咯-2-基)
亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(5-甲基-3-(3-异喹唑基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-
基) 亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-(1-咪唑基)甲基)-5-甲基-3-(3-异喹唑基)吡咯-2-基)
亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-环丙基氨基甲基)-5-甲基-3-(3-异喹唑基)吡咯-2-基)
亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-二乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-喹唑基)吡咯-2-基) 亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-(2-喹唑基)吡咯-2-基) 亚甲基)-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-(2-呋喃基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基-3-(2-呋喃基)-4-[[2-(1-吡咯烷基甲基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-呋喃基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基-3-(2-呋喃基)-4-[[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[[2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-(2-呋喃基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基甲基)-5-甲基-3-(2-呋喃基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氨基甲基)-5-羟甲基-3-异丙基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-羟甲基-3-异丙基-4-[[2-(1-吡咯烷基甲基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-乙氨基甲基)-5-羟甲基-3-异丙基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-羟甲基-3-异丙基-4-[[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[[2-(1-咪唑基)甲基]-5-羟甲基-3-异丙基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基甲基)-5-羟甲基-3-异丙基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氨基甲基)-5-二环丙基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二甲氨基甲基)-5-二环丙基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二环丙基-4-[[2-(1-吡咯烷基甲基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-乙氨基甲基)-3,5-二环丙基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
5-[[3,5-二环丙基-4-[2-(4-吡啶基甲氧基甲基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[2-(1-咪唑基)甲基]-3,5-二环丙基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-环丙基氨基甲基-3,5-二环丙基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基氨基甲基-5-甲基-4-(2-二乙氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基氨基甲基-5-甲基-4-(2-羟基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-二甲氨基甲基-5-甲基-4-(2-二乙氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，和
4-[[3-羟基甲基-5-甲基-4-(2-二乙氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮。
22. 权利要求 17 的化合物，其中的化合物为立体异构体的混合物。
23. 权利要求 22 的化合物，其中的立体异构体是对映体。
24. 权利要求 23 的方法，其中的立体异构体是 R 和 S 异构体。
25. 权利要求 17 的方法，其中的化合物是结构异构体的混合物。
26. 权利要求 25 的方法，其中的结构异构体是互变异构体。
27. 权利要求 17 的化合物，其中 R 被彼此独立的一个或多个选自下列一组的取代基取代：卤素、C1-C6烷基、R3O-、羟基、HOC(O)-、R3OC(O)-、R3OOC(O)R6-、R3OR6-、硝基、-NR4R5、R3CO-、-(CH2)h-R7、-C(O)(CH2)h-C(O)-R7、-C(O)NR4(CH2)hR7、-C(O)O(CH2)hR7、-R6NR4R5、-R6N(R4)-R6R7、-R6OC(O)(CH2)hR7、未
取代的或者取代的苯基、吗啉基、苯并噻唑基或吡嗪基；
其中取代的苯基、吗啉基、苯并噻唑基或吡嗪基被一个或多个选自下列一组的取代基取代：卤素、羟基、-NR4R5、硝基、C1-C6烷基或
R³O;

R⁶是C₁-C₆烷基或吗啉基；
R⁷是烷氧基、C₁-C₆烷基哌嗪、羟基、R³O⁻、R³C(O)-或-NR⁴R⁵⁻。

28. 权利要求27的化合物，其中R是吡咯基、吲哚基、氮杂吲哚基、苯胺基、吲哚基、咪唑基、噻唑基、二苯基、4,5,6,7-四氢吡啶基或噻啉基。
29. 权利要求28的化合物，其中R是吡咯-2-基、吡咯-3-基、吲哚-2-基、吲哚-3-基、氮杂吲哚-3-基、吲唑-4-基、咪唑-2-基、咪唑-4-基、噻唑-2-基或噻啉-5-基。

30. 权利要求17或29的化合物，其中R¹是三氟甲基、氨基、环丙基、甲基、乙基、丙基、异丙基、环丙基、2-甲基环丙基、2,2,3,3-四甲基环丙基、2-苯基环丙基、环丁基、环戊基、环己基、-(CH₂)ₚ-O-苯基、-(CH₂)ₚ-O-(4-甲氧苯基)、-(CH₂)ₚ-O-(4-氰基苯基)、-(CH₂)ₚ-O-(4-甲基苯基)、-(CH₂)ₚ-O-(3-甲基苯基)、-(CH₂)ₚ-O-(4-苯基苯基)、-(CH₂)ₚ-O-(4-羟基苯基)、-(CH₂)ₚ-O-(4-硝基苯基)、-(CH₂)ₚ-O-(4-氨基苯基)、-(CH₂)ₚ-O-(4-氨基甲酰苯基)、-(CH₂)ₚ-O-(4-甲氧基苯基)、-NH-苯基、-NH-(4-甲氧基苯基)、-NH-(4-氰基苯基)、-NH-(4-氨基苯基)、-NH-(4-异丙基苯基)、异丙基、苯基、环戊基、-(CH₂)ₚ-吲哚基、-(CH₂)ₚ-吡啶基、-(CH₂)ₚ-苯并噻唑基、-(CH₂)ₚ-吲哚基、-(CH₂)ₚ-四氢呋喃基、-(CH₂)ₚ-吡啶基、-(CH₂)ₚ-吡啶基、-(CH₂)ₚ-吲哚基、-(CH₂)ₚ-吲哚基、-(CH₂)ₚ-苯基、-(CH₂)ₚ-苯基、-(CH₂)ₚ-异丙基、-(CH₂)ₚ-(5-甲基异嗯唑基)、-(CH₂)ₚ-喹唑基、-(CH₂)ₚ-喹唑基、-(CH₂)ₚ-C(O)-OMe、-(CH₂)ₚ-C(O)-OEt 和未取代的或者被一个或多个Cl、F、OMe、甲基或氨基取代的苯基，
其中p是1-3的整数。

31. 权利要求30的化合物，其中R是未取代的或者被一个或多个选自下列的基团取代：Br、Cl、F、氨基甲基、N₃、N=二甲氨基甲基、亚基、亚基甲基、亚基乙基、亚基甲基、亚基乙基、甲氧基、乙氧基、苯基、4-吗啉代甲基、-C(O)-O-(CH₂)ₚ-N(Me)₂、-C(O)-O-(CH₂)ₚ-N(ethyl)₂、-C(O)-O-(CH₂)ₚ-N(Me)₂，-C(O)-O-(CH₂)ₚ-N(Me)₂、-CH₂-NH-C(O)-CF₃ 和选自未取代的或者被一个或多个Br、Cl、F、羟基、硝基、氨基或C₁-C₆烷基取代的下列基团：甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基和苯基。
32. 权利要求 17 的化合物在制备用于影响接受治疗者过度增殖疾病的药物中的应用。
33. 药物组合物，其中含有权利要求 17 的化合物和可药用载体或稀释剂。
34. 权利要求 33 的药物组合物，其中含有权利要求 21 的化合物和可药用载体或稀释剂。
2-吡唑啉-5-酮

技术领域

本申请要求 1999 年 7 月 30 日提交的美国临时申请 60/146,563 的利益，该临时申请的全部内容结合在本发明中作为参考。

本发明涉及一些 2-吡唑啉-5-酮，它们是蛋白激酶、特别是酪氨酸激酶和丝氨酸/苏氨酸激酶的抑制剂，其中一些是新化合物，本发明还涉及含有这些吡唑啉酮的药物组合物以及这些吡唑啉酮的制备方法。

背景技术

已经被识别的蛋白激酶至少有 400 种，这些酶催化靶蛋白底物的磷酸化作用。磷酸化作用通常是由磷酸基团转移反应。向其上转移磷酸的靶底物的特定结构是酪氨酸、丝氨酸或苏氨酸残基。由于这些氨基酸残基是磷酸基转移的靶底物，这些蛋白激酶通常被称作酪氨酸激酶或丝氨酸/苏氨酸激酶。

在酪氨酸、丝氨酸和苏氨酸残基上进行的磷酸化反应和抗凝的磷酸酶反应涉及无数细胞过程，这些细胞过程以对不同的细胞内信号的应答为基础(通常是细胞受体介导的)，涉及细胞功能的调节以及细胞过程的激活或灭活。蛋白激酶的级联经常参与细胞内信号的传导，并且对于实现这些细胞过程是必须的。由于它们在这些过程中普遍存在，可以发现蛋白激酶作为质膜的整体部分或者作为细胞质酶存在或者定位在核中，经常作为酶配物的组分。在许多情况下，这些蛋白激酶是酶和结构蛋白配物的基本元素，它决定了是否或者何时在细胞中发生细胞过程。

蛋白酪氨酸激酶。蛋白酪氨酸激酶(PTKs)是催化细胞蛋白中特定的酪氨酸残基磷酸化的酶。这些底物蛋白的后移修饰，经常是酶本身，起着控制细胞增殖、激活或分化的分子转换器的作用(有关综述，参见 Schlessinger 和 Ulrich, 1992, Neuron 9: 383-391)。在许多疾病、包括良性和恶性增殖疾病以及由不适当的免疫系统活化导致的疾病（例如自身免疫疾病）、同种移植物排斥和移植物对宿主排斥疾病中都观察到了异常的或过度的 PTKs 活动。此外，内皮细胞特异性受体 PTKs 如 KDR 和 Tie-2 介导了血管生成过程，并因此涉及支持癌和其他与不
适当的血管形成有关疾病(例如糖尿病性视网膜脱、因老化斑状退化导致的脉络膜新生血管、牛皮癣、关节炎、早熟视网膜病、婴儿血管瘤)的进行。

酪氨酸激酶可以是受体型(具有细胞外、跨膜和细胞内区)或非受体型(完全是细胞内的)。


酪氨酸激酶的功能不仅仅由其表达模式和配体有效性决定，也由被特定的受体活化的下游信号传导路径的排列、那些刺激的定时和持续时间决定。因此，磷酸化作用提供了重要的调控步骤，这决定了由特定的生长因子受体以及分化因子受体补充的信号传导路径的选择性。


另一种被命名为“鳍样酪氨酸激酶-1”(Flt1)的 III 型 RTK 与 FLK-1/KDR 有关 (DeVries 等, Science 255; 989-991, 1992; Shibuya 等, Oncogene 5: 519-524, 1990)。Flt-1 的另一种称谓是“血管内皮细胞生长因子受体 1”(VEGFR-1)。迄今为止，已经发现了许多主要在内皮细胞上表达的 FLK-1/KDR/VEGFR-2 和 Flt-1/VEGFR-1 亚族。这些亚族成员特定地受许多血管内皮细胞生长因子 (VEGF) 配体的刺激 (Klagsburn 和 D'Amore, Cytokine & Growth Factor Reviews 7: 259-270, 1996)。与 FLK-1/KDR 相比，血管内皮细胞生长因子 (VEGF) 与 Flt-1 的结合具有高度亲合性，并且使血管内皮细胞有丝分裂 (Terman 等, 1992, 上文; Mustonen 等, 上文; DeVries 等, 上文)。据信在血管发育中 Flt-1 对内皮组织是必需的。Flt-1 表达与小鼠胚胎中早期血管发展有关，并且与创
伤愈合过程中的新血管生成有关（Mustonen 和 Alitalo，上文）。Flt-1 在成熟器官如肾小球中的表达暗示了该受体另外的功能，这些功能与细胞生长无关（Mustonen 和 Alitalo，上文）。


近来已经识别几种相关的 VEGF 同系物。但是，其在正常生理和疾病过程中的作用尚未说明。此外，VEGF 中的许多成员经常在许多组织中与 VEGF 一同表达，并且通常能够与 VEGF 形成杂二聚体。这种性质或许改变了受体的特异性以及杂二聚体的生物作用，并且进一步阐明其如下所述的特定功能复杂化（Korpelainen 和 Alitalo，Curr. Opin. Cell Biol., 159-164,1998，该参考文献引本文做为参考）。

胚盘生长因子（P1GF）所具有的氨基酸序列显示出与 VEGF 序列重要的同源性（Park 等，J. Biol. Chem. 269: 25646-54,1994; Magliione 等 Oncogene 8: 925-31,1993）。与 VEGF 一样，不同种类的 P1GF 由另一种 mRNA 的剪接产生，并且该蛋白质以二聚物的形式存在（Park 等，上文）。P1GF-1 和 P1GF-2 与 Flt-1 高度亲合地结合，并且 P1GF-2 也热切地与 neuropilin-1 结合（Migdal 等，J. Biol. Chem. 273 (35): 22272-22278)，但是不与 FLK-1/KDR 结合（Park 等，上文）。已有报道，当存在低浓度 VEGF 时，P1GF 对血管的透过性和内皮细胞上 VEGF 的致有丝分裂的作用具有加强作用（据称是因为杂二聚体的形成所致）（Park 等，上文）。

VEGF-B 的产生有两种同种型（167 和 185 残基），它们还与 Flt-


像 VEGF 一样，已经声称，当对皮肤组织注射时，VEGF-C 和 VEGF-D 在 Miles 分析中引起血管透过性增加 (PCT/US97/14696; W098/07832, Witzenbichler 等, 上文)。这些配体在其被表达的组织中在调节血管渗透性过高和内皮应答方面的生理学作用和重要性是不确定的。

近来报道了病毒编码的、新的血管内皮生长因子 VEGF-E (NZ-7 VEGF)，它优先利用 KDR/Flik-1 受体并带有有效的有丝分裂活性，而非肝素结合区 (Meyer 等, EMBO J. (1999), 18 (2), 363-374; Ogawa 等, J. Biol. Chem. (1998), 273 (47), 31273-31282)。VEGF-E 序列具有与哺乳动物 VEGF 约 25% 的同源性，并且由 parapoxvirus Orf 病毒(OV)编码。该 parapoxvirus 影响绵羊和山羊，并且偶尔影响人，因而造成伴有血管生成的损害。VEGF-E 是既无碱性区、又对肝素没有亲和性的约 20 kDa 的二聚物，但是具有存在于所有哺乳动物 VEGF 中的特征胱氨酸结基元，并且出人意料地发现其具有与 VEGF-A 肝素结合
VEGF165 同种型类似的效能和生物活性，即两种因子均刺激组织因子(TF)的释放，体外培养的血管内皮细胞的增殖、趋化性和抽芽以及体内血管生成。与 VEGF165 一样，已发现 VEGF-E 与 VEGF 受体-2 (KDR) 高度亲合体结合，导致受体自磷酸化以及游离细胞内 Ca2+ 浓度二相性升高，同时与 VEGF165 相反，VEGF-E 不与 VEGF 受体-1 (Flt-1) 结合。


非受体酪氨酸激酶，非受体酪氨酸激酶代表缺乏细胞外和跨膜序列的细胞酶的集合。目前，已经识别出超过 24 种个的非受体酪氨酸激酶，包括 11 个亚族 (Src, Frk, Btk, Csk, Abl, Zap70, Fes/Fps, Fak, Jak, Ack 和 LIMK)。目前 Src 亚族非受体酪氨酸激酶由大量量的 PTK 组成，并且包括 Src, Yes, Fyn, Lyn, Lck, Btk, Hck, Fgr 和 Yrk。Src 亚族的酶已经与癌形成和免疫应答联系在一起。在 Bolen, 1993, Oncogene 8: 2025-2031 中提供了有关非受体酪氨酸激酶的更详细讨论，该文献引入本文作为参考。

已经发现，许多酪氨酸激酶，无论是 RTK 或是非受体酪氨酸激酶都与很多致病状况包括癌、牛皮癣和其他过度增殖疾病或超免疫应答中涉及的细胞信号传导路径有关。


此外，已经成功地识别了用作丝氨酸/苏氨酸激酶抑制剂的小分子。例如，已经描述了二 (吲哚基马来酰亚胺) 化合物抑制特定 PKC 丝氨酸/苏氨酸激酶同种型，该同种型的信号传导功能在 VEGF-有关的疾病中与改变的血管透过性有关 (PCT WO97/40830; PCT WO97/40831)。

**Plk-1 激酶抑制剂**

Plk-1 是丝氨酸/苏氨酸激酶，它是重要的细胞周期进行的调节剂。它在有丝分裂纺锤体装置的装配和动力功能中起着决定性的作用。Plk-1 和相关的激酶还显示出与其他细胞周期调节剂如细胞周期蛋白依赖性激酶的活化和灭活密切相关。高水平 Plk-1 表达与细胞增殖活性有关。它经常可见于各种起源的恶性肿瘤中。

预期 Plk-1 抑制剂通过中断与有丝分裂纺锤体和不适当活化的细胞周期蛋白依赖性激酶的过程而阻断癌细胞增殖。

*Cdc2/细胞周期蛋白 B 激酶抑制剂 (Cdc2 也称作 cdki)*

*Cdc2/细胞周期蛋白 B 是另一种丝氨酸/苏氨酸激酶，它属于细胞周期蛋白依赖性激酶 (cdks)。这些酶涉及细胞周期进行各期之间的决定性的转变。据信不受控制的细胞增殖是癌的标志，它取决于在这些细胞
中升高的 cdk 活性。通过 cdc2/细胞周期蛋白 B 激酶抑制剂抑制癌细胞中升高的 cdk 活性，可以抑制增殖，并且可以恢复细胞周期进行的正常控制。

因此需要识别有效的小化合物，这些化合物通过调控受体和非受
体酪氨酸和丝氨酸/苏氨酸激酶以调节和调整异常或不适当的细胞增
殖、分化或代谢，而专门抑制信号传导和细胞增殖。尤其是，识别方
法和专门抑制酪氨酸激酶功能的化合物是有效的，所述酪氨酸激酶对
于血管生成过程或血管渗透性过高形成从而导致水肿、腹水、渗漏、
渗出物和大分子外渗和基质沉积以及相关疾病是必需的。

发明内容

本发明涉及下式化合物及其生理上可接受的盐

![化合物结构式](image)

其中 R 是取代或未取代的脂肪族、芳族、杂环或芳烃基，并且 R^2 是
氢、低级烷基或芳基。R^1 是氢或-A-Z，其中 A 是 -(CH\_2)\_n^-、-(CH\_2)\_nNH^-、
-(CH\_2)\_nO^-、-(CH\_2)\_nS^-、-(CH\_2)\_nS(O)-或-(CH\_2)\_nS(O)_2^-；并且 Z 是 H、低
级烷基、芳烃基、三卤代甲基、R^3CO^-、三卤代甲基羰基、R^3OC(O)-、
-NR^4R^5、-C(O)NR^4R^5、R^3O-或选自下列一组的环系：C\_3-C\_6 环烷烃、
苯、吡咯、异噁唑、异噻唑、吲哚、吡啶、噻啶、噻吩、咪唑、喹啉、苯并
噻唑、苯并异噁唑、哒嗪、噁唑啉、吡唑、噻唑、苯并噻唑、四氢
呋喃、三嗪及其可应用的 N-氧化物，这些环系可以任选地被一个或多
个卤素、低级烷基、R^3O-、HO-、HOC(O)-、R^3OC(O)-、三卤代甲基、
硝基、芳基、-CN、-C(O)NR^4R^5 或-NR^4R^5 取代。每处出现的 R^3 独立地
选自取代或未取代的：低级烷基、低级烷氧基低级烷基、芳族基团、
(C\_3-C\_6)环烷基、杂环基、芳烃基、(C\_3-C\_6)环烷基-烷基和杂环基-烷基。
每处出现的 $R^4$ 和 $R^5$ 彼此独立地为氢或选自取代或未取代的：低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基和杂环基-烷基；$R^4$ 和 $R^5$ 可以任选地与和其相连的氮结合在一起表示吗啉代、吡咯烷子基 (pyrrolidino)、哌啶子基、咪唑-1-基、哌嗪子基 (piperazino)、硫吗啉代、吖庚因子基 (azepino) 或全氢化-1,4-二氮杂环庚三烯 (diazepin)-1-基，其中每个基团任选地被一个或多个选自下列一组的基团取代：低级烷基、羟基、低级烷氧基、低级烷基、芳基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基和杂环基-烷基；数字下标 $n$ 是 0-3 的整数。对于 $R$ 来说，合适的取代基包括卤素、低级烷基、R³O-、羟基、HOC(O)-、R³OC(O)-、R³OC(O)R⁶-、R³OR⁶-、三卤代甲基、三卤代甲基羧基、硝基、-C(O)NR⁴R⁵、-NR⁴R⁵、R³CO-、-(CH₂)ₙR⁷、-C(O)(CH₃)ₙR⁷、-C(O)(CH₃)nR⁷、-C(O)C(O)CH₃nR⁷、C(O)O(CH₂)ₙR⁷、-OC(O)(CH₃)nR⁷、-NR⁴C(O)(CH₂)nR⁷、-R⁶NR⁴R⁵、-R⁶N(R⁴)-R⁶R⁷、-R⁶NR[R⁶-R⁷]₂、-R⁶C(O)NR⁴(CH₃)nR⁷、-R⁶C(O)O(CH₂)nR⁷、-R⁶OC(O)(CH₂)nR⁷、R⁶NR⁴C(O)(CH₂)nR⁷、-R⁶CH[C(O)OR⁴][NR⁵C(O)R⁴]或取代的芳基或芳烷基，其中取代基选自卤素、三卤代甲基、羟基、-NR⁴R⁵、硝基、-CONR⁴R⁵、低级烷基、R³O-、C(O)OR⁴-或-OC(O)R³。R⁶是低级烷基或芳基。R⁷是烷氧基、卤代烷基、低级烷基哌嗪、羟基、R³O-、R³C(O)-或-NR⁴R⁵。对于 $R^3$、$R^4$ 和 $R^5$ 来说，合适的取代基包括一个或多个选自下列的基团：卤素、低级烷基、羟基、低级烷氧基、羟基、低级烷基酯、三卤代甲基优选三氟甲基、硝基、苯基、苯基低级烷基、(C₃-C₆)环烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基、CN、氨基、烷氧基、二烷氧基、-C(O)NH₂、-C(O)NH(烷基) 和-C(O)N烷基。脂族基团包括直链或支链 C₁-C₁₈烃或环 C₃-C₁₈烃，它们是完全饱和的，或者含有一个或多个不饱和单元。低级烷基是完全饱和的直链或支链 C₁-C₆烃或 C₃-C₆环烃。

本文所用的芳族基团一词包括碳环系 (例如苯基和亚甲基基) 以及稠合多环芳环系 (例如萘基)。此外，芳族基团包括杂环基系 (例如吡啶、嘧啶、呋喃、咪唑、噻唑、吡唑、三唑、喹唑和吲哚) 以及杂芳基系，其中碳环芳环、碳环芳环或杂环芳环与一个或多个其
他的杂环芳(例如苯并咪唑、苯并噻唑、吲哚、四氢吲哚、氮杂吲哚、
吲哚、异𫫇唑、异噻唑、咪唑和噻唑)稠合。本文所用的芳基一词是指
具有 5 或 6 个原子的芳族基团。芳烷基是通过具有 1-6 个碳原子的脂
族基团与化合物相连的芳族取代基。本文所用的杂环基一词是指单-,、
二-或三-环杂环基，它们不是芳族的或者具有一定的不饱和程度，该不
饱和不构成芳族基团。

互变异构体、立体异构体、对映体以及这些化合物的混合物包括
在本发明中。这些化合物的可药用加成物也包括在本发明中。

具体实施方案

在一个实施方案中，R^2 是氢，并且 R 优选为取代的吲哚或取代或
未取代的咪唑、1,2,3-三唑、1,2,4-三唑、苯并咪唑、吲哚、吲哚、4,5,6,7-
四氢吲哚、苯并吲哚、氮杂吲哚、吲哚、吲哚、噻唑、嘧啶、苯或吲哚。

在一个优选的实施方案中，R^2 是氢，n 是 0，并且 Z 是环丙基、3-
吡啶基或吡唑基。在另一个优选的实施方案中，R^2 是氢，A 是-O-, n
是 0，并且 Z 是乙基、丙基或异丙基。在又一个优选的实施方案中，R^2
是氢，A 是 CH_2, n 是 2, 并且 Z 是任选地被卤素、三卤代甲基、羟基、
-NR^4R^5、硝基、-C(O)NR^4R^5、低级烷基、R^3O-, -C(O)OR^4 或-OC(O)R^3
取代的苯。

在一个优选的实施方案中，本发明涉及下式表示的化合物的及其
生理上可接受的盐:

![化学结构式]

其中:

R 选自取代或未取代的：吲哚、咪唑、1,2,3-三唑、1,2,4-三唑、苯
并咪唑、4,5,6,7-四氢吲哚、苯并吲哚、氮杂吲哚、吲哚、吲哚、噻唑、
嘧啶、苯、吡唑、吲哚、吲哚、噻唑和噻唑；

R^1 是氢或-A-Z；

A 是-(CH_2)_n-、-(CH_2)_nNH-、-(CH_2)_nO-、-(CH_2)_nS-、-(CH_2)_nS(O)-
或-(CH₃)nS(O)₂-；

Z 是-H、低级烷基、芳烷基、三卤代甲基、三卤代甲基羰基、R³OC(O)-、-NR⁴R⁵、-C(O)NR⁴R⁵、R³CO-、R³O-或选自下列一系的环系：C₃-C₆ 环烷烃、异噁唑、异噻唑、咪唑、苯、吡咯、吲哚、吡啶、吡嗪、喹啶、苯并噻唑、四氢呋喃、噻吩、咪唑、呋喃、三唑、苯并咪唑、哒嗪、喹啉环、吲唑、噻唑、噻唑及其 N-氧化物，其中所述环系可以任选地被一个或多个选自下列一系的基团取代：卤素、低级烷基、R³O-、HO-、HOC(O)-、R³OC(O)-、三卤代甲基、硝基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基、杂环基-烷基、-CN、-C(O)NR⁴R⁵ 或-NR⁴R⁵；

每处出现的 R³ 彼此独立地选自取代或未取代的：低级烷基、低级烷氧基低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基和杂环基-烷基；

每处出现的 R⁴ 和 R⁵ 彼此独立地为氢或选自取代或未取代的：低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基和杂环基-烷基；

任选地，R⁴ 和 R⁵ 与和其相连的氮结合在一起表示吗啉代、吡咯烷基、哌啶子基、咪唑-1-基、哌嗪子基、硫吗啉代、吖啶子基或全氢化-1,4-二氧杂环庚三烯-1-基，其中每个基团任选地被一个或多个选自下列一系的基团取代：低级烷基、羟基、低级烷氧基低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基和杂环基-烷基；并且

n 是 0-3 的整数；

条件是当 R 是未取代的吲哚-3-基时，R¹ 不是-NH₂。

在另一个优选的实施方案中，本发明涉及下列结构式表示的化合物及其生理学上可接受的盐：

![化合物结构式](image)

104
其中:
R 选自取代或未取代的：吲唑、咪唑、1,2,3-三唑、1,2,4-三唑、苯并
咪唑、4,5,6,7-四氢吲唑、苯并吲唑、氮杂吲唑、吲唑、吡啶、喹啉、
噻啶、苯、吡嗪、吡咯、吡唑、噁唑和噻唑；
R₁ 是氢或-AZ；
A 是-(CH₂)ₙH⁻、(CH₂)ₙNH⁻、-(CH₂)ₙO⁻、-(CH₂)ₙS⁻、-(CH₂)ₙS(O)⁻
或-(CH₂)ₙS(O)₂⁻；
Z 是-H、低级烷基、芳烷基、三卤代甲基、三卤代甲基羰基、
R₃OC(O)⁻、-NR⁴R⁵⁻、-C(O)NR⁴R⁵⁻、R³CO⁻、R³O⁻或选自下列一组的环
系：C₃-C₆ 环烷烃、异噻唑、异噻唑、咪唑、苯、吡咯、吲唑、吡啶、
吡嗪、噻啶、苯并噻唑、四氢呋喃、噻吩、咪唑、呋喃、三唑、苯并
咪唑、哒嗪、喹啉、吡唑、嘧啶、噻唑及其 N-氧化物，其中所述环
系可以任选地被一个或多个选自下列一组的基团取代：卤素、低级烷
基、R³O⁻、HO⁻、HOC(O)⁻、R³OC(O)⁻、三卤代甲基、硝基、芳族基
团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基、杂环基-
烷基、-CN、-C(O)NR⁴R⁵⁻或-NR⁴R⁵⁻；
每处出现的 R³ 彼此独立地选自取代或未取代的：低级烷基、低级
烷氧基低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-
C₆)环烷基-烷基和杂环基-烷基；
每处出现的 R⁴ 和 R⁵ 彼此独立地为氢或选自取代或未取代的：低级
烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷
基和杂环基-烷基；任选地，R⁴ 和 R⁵ 与和其相连的氮结合在一起表示
吗啉代、吡咯烷基、哌啶子基、咪唑-1-基、哌嗪子基、硫吗啉代、
吲哚子基或全氢化-1,4-二氨杂环庚三烯-1-基，其中每个基团任选地
被一个或多个选自下列一组的基团取代：低级烷基、羟基、低级烷氧
基低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环
烷基-烷基和杂环基-烷基；并且
n 是 0 – 3 的整数；
条件是：
当 R 是未取代的吲哚-3-基时，R¹ 不是-NH₂；和
当 R 是取代或未取代的苯或未取代的咪唑、1,2,3-三唑、1,2,4-三
唑、吡啶、嘧啶、吡嗪、吡咯、吡唑、噁唑或噻唑时，R¹ 不是低级烷
基、(C₃-C₆)环烷基、苯或-C(O)NR¹R⁵，其中R⁴和R⁵彼此独立地为H、低级烷基或碳环芳基。

在另一个优选的实施方案中，本发明涉及下列表示的化合物及其生理上可接受的盐：

![化学结构式]

其中：

R 选自取代或未取代的：吲哚、咪唑、1,2,3-三唑、1,2,4-三唑、苯并咪唑、4,5,6,7-四氢吲哚、苯并喹唑、氮杂吲哚、吲唑、吡啶、喹啉、噻啶、苯、吲哚、吡咯、吡唑、噻唑和噻唑；

R¹是氢或-A-Z；

A 是-(CH₂)ₙ-、(CH₂)ₙNH-、-(CH₂)ₙO-、-(CH₂)ₙS-、-(CH₂)ₙS(O)-或-(CH₂)ₙS(O)₂-；

Z 是-H、低级烷基、芳烷基、三卤代甲基、三卤代甲基烯基、

R³O(C(O))-、-NR⁴R⁵、-C(O)NR⁴R⁵、R³CO-、R³O-或选自下列一组的环系：C₃-C₆环烷烃、异噻唑、异噻唑、咪唑、苯、吡咯、吲哚、吡啶、吡啶、噻啶、苯并噻唑、四氢呋喃、噻吩、咪唑、呋喃、三唑、苯并

R⁴R⁵R⁶R⁷-、R⁴R⁵R⁶-、R⁴R⁵R⁶R⁷-、R⁴R⁵R⁶R⁷-或选自下列一组的基团取代：卤素、低级烷

基、R³O-、HO-、HOC(O)-、R³OC(O)-、三卤代甲基、硝基、芳基基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基、杂环基-烷基、-CN、-C(O)NR⁴R⁵或-NR⁴R⁵；

每处出现的R³彼此独立地选自取代或未取代的：低级烷基、低级烷氧基低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基和杂环基-烷基；

每处出现的R⁴和R⁵彼此独立地为氢或选自取代或未取代的：低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基和杂环基-烷基；

任选地，R⁴和R⁵与和其相连的氮结合在一起表示吗啉代、吡咯烷...
子基、哌啶子基、咪唑-1-基、哌嗪子基、硫吗啡代、吲哚因子基或全氯化-1,4-二氯杂环庚三烯-1-基，其中每个基团任选地被一个或多个选自下列一组的基团取代：低级烷基、羟基、低级烷氧基低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基和杂环基-烷基；并且
n 是 0 - 3 的整数；
条件是：
a) R 不是吡咯-3-基或被烷基或碳环芳基取代的吡咯-3-基；
b) R 不是吲哚-3-基或被烷基或碳环芳基取代的吲哚-3-基；和
c) R 不是氮杂吲哚或在 2-位被烷基或碳环芳基取代的氮杂吲哚。
在另一个优选的实施方案中，本发明涉及下列结构式表示的化合物及其生理上可接受的盐：

其中：
R 是取代的吡咯或者选自取代或未取代的：吲哚、咪唑、1,2,3-三唑、1,2,4-三唑、苯并咪唑、4,5,6,7-四氢吲哚、苯并吲哚、氮杂吲哚、吲哚、吡啶、喹啉、噻啶、苯、吡啶、吲哚、吲哚和噻唑；
R¹ 是氢或-A-Z；
A 是-(CH₂)n⁻、(CH₂)nNH⁻、-(CH₂)nO⁻、-(CH₂)nS⁻、-(CH₂)nS(O)⁻或-(CH₂)nS(O)₂⁻；
Z 是-H、低级烷基、芳烷基、三卤代甲基、三卤代甲基羰基、R³OC(O)⁻、-NR⁴R⁵⁻、-C(O)NR⁴R⁵⁻、R³CO⁻、R³O⁻或选自下列一组的环系：C₃-C₆环烷烃、异嗯唑、异噻唑、咪唑、苯、吡咯、吲哚、吡啶、吡嗪、嘧啶、苯并咪唑、四氢呋喃、噻吩、咪唑、呋喃、三嗪、苯并\n咪唑、哒嗪、喹啉、嘧啶、吡啶、噻唑、嗯唑、噻唑及其 N-氧化物，其中所述环系可以任选地被一个或多个选自下列一组的基团取代：卤素、低级烷基、R⁴O⁻、HO⁻、HOC(O)⁻、R³OC(O)⁻、三卤代甲基、硝基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基、杂环基-
烷基、-CN、-C(O)NR^4R^5或-NR^4R^5；

每处出现的 R^3彼此独立地选自：低级烷基、低级烷氧基低级烷基、芳族基团、(C_3-C_6)环烷基、杂环基、芳烷基、(C_3-C_6)环烷基-烷基和杂环基-烷基；

每处出现的 R^4和 R^5彼此独立地为氢或选自取代或未取代的：低级烷基、芳族基团、(C_3-C_6)环烷基、杂环基、芳烷基、(C_3-C_6)环烷基-烷基和杂环基-烷基；

任选地，R^4和 R^5与和其相连的氮结合在一起表示咪唑代、吡咯烷子基、哌啶子基、咪唑-1-基、哌嗪子基、硫咪唑代、吲哚因子子基或全氢化-1,4-二氮杂环庚三烯-1-基，其中每个基团任选地被一个或多个选自下列一组的基团取代：低级烷基、烃基、低级烷氧基低级烷基、芳族基团、(C_3-C_6)环烷基、杂环基、芳烷基、(C_3-C_6)环烷基-烷基和杂环基-烷基；并且

n 是 0 - 3 的整数；

条件是：

a) 当 R 是取代的吡咯时，该吡咯被 R^3OC(O)R^6、R^3OR^6-、三卤代甲基、三卤代甲基羧基、-(CH_2)_p-R^7、-O(CH_2)_p-R^7、-C(O)N(R^4)(CH_2)_p-R^7、-C(O)O(CH_2)_p-R^7、-OC(O)(CH_2)_p-R^7、-N(R^4)C(O)(CH_2)_p-R^7、-R^6NR^4R^5、-R^6N(R^4)-R^6-R^7、-R^6N(R^6-R^7)_2、R^6C(O)N(R^4)(CH_2)_p-R^7、-R^6C(O)O(CH_2)_p-R^7、-R^6OC(O)(CH_2)_p-R^7、-R^6N(R^4)C(O)(CH_2)_p-R^7、-R^6CH(C(O)OR^4)(N(R^4)C(O)R^4)、取代的芳基或芳烷基取代，其中每处出现的 R^6独立地为低级烷基或芳基；

每处出现的 R^7独立地为烷氧基、卤代烷基、低级烷氧基哌嗪、烃基、R^3O-、R^2C(O)-或 NR^4R^5；和

p 是 1-3 的整数；

b) 当 R 是吲哚-3-基时，该吲哚-3-基被下列基团取代：R^2OC(O)R^6、R^3OR^6-、三卤代甲基、三卤代甲基羧基、-(CH_2)_p-R^7、-O(CH_2)_p-R^7、-C(O)N(R^4)(CH_2)_p-R^7、-C(O)O(CH_2)_p-R^7、-OC(O)(CH_2)_p-R^7、-N(R^4)C(O)(CH_2)_p-R^7、-R^6NR^4R^5、-R^6N(R^4)-R^6-R^7、-R^6N(R^6-R^7)_2、R^6C(O)N(R^4)(CH_2)_p-R^7、-R^6C(O)O(CH_2)_p-R^7、-R^6OC(O)(CH_2)_p-R^7、-R^6N(R^4)C(O)(CH_2)_p-R^7、-R^6CH(C(O)OR^4)(N(R^4)C(O)R^4)、取代的芳基或芳烷基，和
c) 当 R 是吡啶-3-基时，该吡啶-3-基被下列基团取代：R^3OC(O)R^6、R^3OR^6-、三卤化甲基、三卤化甲基羧基、-(CH_2)_p-R^7、-O(CH_2)_pR^7、-C(O)N(R^4)(CH_2)_pR^7、-C(O)O(CH_2)_pR^7、-OC(O)(CH_2)_pR^7、-N(R^4)C(O)(CH_2)_pR^7、-R^6NR^4R^5、-R^6N(R^4)-R^6-R^7、-R^6N(R^6-R^7)_2、R^6C(O)N(R^4)(CH_2)_pR^7、-R^6C(O)O(CH_2)_pR^7、-R^6OC(O)(CH_2)_pR^7、-R^6N(R^4)C(O)(CH_2)_pR^7、-R^6CH(C(O)OR^4)(N(R^4)C(O)R^4)、取代的芳基或芳烷基。

在另一个优选的实施方案中，本发明涉及下列结构式表示的化合物及其生理上可接受的盐：

![结构式](attachment:image)

其中：

R 是取代的吡咯或者选自取代或未取代的：吲哚、咪唑、1,2,3-三唑、1,2,4-三唑、苯并咪唑、4,5,6,7-四氢吲哚、苯并吲哚、氨杂吲哚、吲哚、吡啶、噻唑、嘧啶、苯、吡啶、吡唑、噻唑和喹唑；

R^1 是氢或-A-Z；

A 是-(CH_2)_n-、-(CH_2)_nNH-、-(CH_2)_nO-、-(CH_2)_nS-、-(CH_2)_nS(O)或-(CH_2)_nS(O)_2-；

Z 是-H、低级烷基、芳烷基、三卤化甲基、三卤化甲基羧基、R^3OC(O)-、NR^4R^5、C(O)NR^4R^5、R^3CO-、R^3O-或选自下列一组的环系：C_3-C_6 环烷烃、异嘌呤、异噻唑、咪唑、苯、吡咯、吲哚、吡啶、嘧啶、苯并噻唑、四氢呋喃、噻吩、咪唑、呋喃、三唑、苯并咪唑、哒嗪、喹啉、吡唑、噻唑、噻唑及其 N-氧化物，其中所述环系可以任选地被一个或多个选自下列一组的基团取代：卤素、低级烷基、R^3O-、HO-、HOC(O)-、R^3OC(O)-、三卤化甲基、硝基、芳族基团、(C_3-C_6)环烷基、杂环基、芳烷基、(C_3-C_6)环烷基-烷基、杂环基-烷基、-CN、-C(O)NR^4R^5 或-NR^4R^5；

每处出现的 R^3 彼此独立地选自取代或未取代的：低级烷基、低级
烷氧基低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基和杂环基-烷基；

每处出现的 R⁴ 和 R⁵ 彼此独立地为氢或选自取代或未取代的：低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基和杂环基-烷基；

任选地，R⁴ 和 R⁵ 与和其相连的氮结合在一起表示嗎啉代、吡咯烷子基、哌啶子基、咪唑-1-基、哌嗪子基、硫吗啉代、吖啶子基或全氯化-1,4-二氯杂环庚三烯-1-基，其中每个基团任选地被一个或多个选自下列一组的基团取代：低级烷基、羟基、低级烷氧基低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基和杂环基-烷基；并且

n 是 0 - 3 的整数；

条件是：

a) 当 R 是未取代的吲哚-3-基时，R¹ 不是-NH₂；

b) 当 R 是取代或未取代的苯或未取代的哌唑、1,2,3-三唑、1,2,4-三唑、吡啶、嘧啶、吡嗪、吡咯、吡唑、噻唑或噻唑时；R¹ 不是低级烷基、(C₃-C₆)环烷基、苯或-C(O)NR⁴R⁵，其中 R⁴ 和 R⁵ 彼此独立地为 H、低级烷基或碳环芳基；

c) R 不是吡咯-3-基或被烷基或碳环芳基取代的吡咯-3-基；

d) R 不是吲哚-3-基或被烷基或碳环芳基取代的吲哚-3-基；

e) R 不是氮烷吲哚或在 2-位被烷基或碳环芳基取代的氮杂吲哚；

f) 当 R 是取代的吲哚时，该吲哚被下列基团取代： R³OC(O)R⁶、

R²OR⁵-, 三卤代甲基、三卤代甲基氨基、-(CH₂)ₚ-R⁷、-O(CH₂)ₚ-R⁷、
-C(O)N(R⁴)(CH₂)ₚ-R⁷、-C(O)O(CH₂)ₚ-R⁷、-OC(O)(CH₂)ₚ-R⁷、
-N(R⁴)C(O)(CH₂)ₚ-R⁷、-R⁶NR⁴R⁵、-R⁶N(R⁴)-R⁶-R⁷、-R⁶N(R⁶-R⁷)₂、
-R⁶C(O)N(R⁴)(CH₂)ₚ-R⁷、-R⁶C(O)O(CH₂)ₚ-R⁷、-R⁶OC(O)(CH₂)ₚ-R⁷、
-R⁶N(R⁴)C(O)(CH₂)ₚ-R⁷、-R⁶CH(C(O)OR⁴)(N(R⁴)C(O)R⁴)、取代的
芳基或芳烷基，其中

每处出现的 R⁷ 独立地为低级烷基或芳基；

每处出现的 R⁷ 独立地为烷氧基、卤代烷基、低级烷基哌嗪、羟基、
R³O-、R³C(O)-或 NR⁴R⁵；和

p 是 1-3 的整数；
g) 当 R 是吲哚-3-基时，该吲哚-3-基被下列基团取代：\( R^3 \text{OC(O)R}^6 \),
\( R^3 \text{OR}^6 \)-, 三卤代甲基、三卤代甲基醚基、\(-(\text{CH}_2)_p\text{-R}^7\), \(-\text{O}(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\),
\(-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^4)(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\), \(-\text{C}(\text{O})\text{O}(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\), \(-\text{OC}(\text{O})(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\),
\(-\text{N}(\text{R}^4)\text{C}(\text{O})(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\), \(-\text{R}^6\text{NR}^4\text{R}^5\), \(-\text{R}^6\text{N}(\text{R}^4)\text{-R}^6\text{-R}^7\), \(-\text{R}^6\text{N}(\text{R}^6\text{-R}^7)_2\),
\(-\text{R}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^4)(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\), \(-\text{R}^6\text{C}(\text{O})\text{O}(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\), \(-\text{R}^6\text{OC}(\text{O})(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\),
\(-\text{R}^6\text{N}(\text{R}^4)\text{C}(\text{O})(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\), \(-\text{R}^6\text{CH}(\text{C}(\text{O})\text{OR}^4)(\text{N}(\text{R}^4)\text{C}(\text{O})\text{R}^4)\), 取代的
芳基或芳烷基，和

h) 当 R 是吡唑-3-基时，该吡唑-3-基被下列基团取代：\( R^3 \text{OC(O)R}^6 \),
\( R^3 \text{OR}^6 \)-, 三卤代甲基、三卤代甲基醚基、\(-(\text{CH}_2)_p\text{-R}^7\), \(-\text{O}(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\),
\(-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^4)(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\), \(-\text{C}(\text{O})\text{O}(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\), \(-\text{OC}(\text{O})(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\),
\(-\text{N}(\text{R}^4)\text{C}(\text{O})(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\), \(-\text{R}^6\text{NR}^4\text{R}^5\), \(-\text{R}^6\text{N}(\text{R}^4)\text{-R}^6\text{-R}^7\), \(-\text{R}^6\text{N}(\text{R}^6\text{-R}^7)_2\),
\(-\text{R}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^4)(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\), \(-\text{R}^6\text{C}(\text{O})\text{O}(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\), \(-\text{R}^6\text{OC}(\text{O})(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\),
\(-\text{R}^6\text{N}(\text{R}^4)\text{C}(\text{O})(\text{CH}_2)_p\text{R}^7\), \(-\text{R}^6\text{CH}(\text{C}(\text{O})\text{OR}^4)(\text{N}(\text{R}^4)\text{C}(\text{O})\text{R}^4)\), 取代的
芳基或芳烷基。

在更优选的实施方案中，本发明涉及任何上述化合物，其中 A 是
\(-\text{NH}-\), \(-\text{O}-\), \(-\text{S}-\), \(-\text{S(O)}\text{-或-S(O)}_2\text{-}; 并且 Z 是环丙基、3-吡啶基或吡嗪
基。

在另一更优选的实施方案中，本发明涉及任何上述化合物，其中 A
是\(-\text{O}-\); 并且 Z 是乙基、正丙基或异丙基。

在另一更优选的实施方案中，本发明涉及任何上述化合物，其中 A
是\(-\text{CH}_2\text{-}; 并且 Z 是苯基，其中所述苯基任选地被一个或多个选自下列
的基团取代：卤素、三卤代甲基、羟基、\(-\text{NR}^4\text{R}^5\), 硝基、\(-\text{CONR}^4\text{R}^5\),
低级烷基、\( R^3 \text{O}-\), \(-\text{C}(\text{O})\text{OR}^4\) 和 \(-\text{OC}(\text{O})\text{R}^4\)。

在另一更优选的实施方案中，本发明涉及任何上述化合物，其中 R
彼此独立地被一个或多个选自下列的基团取代：卤素、低级烷基、
\( R^3 \text{O}-\), 羟基、\( \text{HOC}(\text{O})-\), \( R^3 \text{OC(O)}\text{-}\), \( R^3 \text{OC(O)}\text{R}^6\)-, \( R^3 \text{OR}^6\)-, 三卤代甲
基、三卤代甲基醚基、硝基、\(-\text{C}(\text{O})\text{NR}^4\text{R}^5\), \(-\text{NR}^4\text{R}^5\), \(-\text{R}_3\text{CO}-\), \(-(\text{CH}_2)_n\text{-R}^7\),
\(-\text{C}(\text{O})(\text{CH}_2)_n\text{R}^7\), \(-\text{C}(\text{O})(\text{CH}_2)_n\text{-C}(\text{O})\text{-R}^7\), \(-\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{R}^7\), \(-\text{C}(\text{O})\text{NR}(\text{CH}_2)_n\text{R}^7\),
\(-\text{C}(\text{O})\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{R}^7\), \(-\text{OC}(\text{O})(\text{CH}_2)_n\text{R}^7\), \(-\text{NR}^4\text{C}(\text{O})(\text{CH}_2)_n\text{R}^7\), \(-\text{R}^6\text{NR}^4\text{R}^5\), \(-\text{R}^6\text{N}(\text{R}^4\text{-R}^6\text{-R}^7\), \(-\text{R}^6\text{C}(\text{O})\text{NR}(\text{CH}_2)_n\text{R}^7\), \(-\text{R}^6\text{C}(\text{O})\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{R}^7\),
\(-\text{R}^6\text{OC}(\text{O})(\text{CH}_2)_n\text{R}^7\), \(-\text{R}^6\text{NR}^4\text{C}(\text{O})(\text{CH}_2)_n\text{R}^7\), \(-\text{R}^6\text{CH}(\text{C}(\text{O})\text{OR}^4)(\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^4)\),
和任选取代的芳基和任选取代的芳烷基。任选取代的芳基和任选取代的芳烷基任选地被一个或多个选自下列的取代基取代：卤素、三卤代甲基、烃基、-NR^4R^5、硝基、-CONR^4R^5、低级烷基、R^3O-、C(O)OR^4或-OC(O)R^3。R^6是低级烷基或芳基。R^7是烷氧基、卤代烷基、低级烷基

哌嗪、羟基、R^3O-、R^3C(O)-或-NR^4R^5。在该实施方案的一个方面中，R 是吡咯基、吲哚基、氮杂吲哚基、苯基、吡唑基、咪唑基、噻吩基、4,5,6,7-四氢吲哚基或喹啉基。在该实施方案的另一方面中，R 是吲哚-2基、吡唑-3基、吲哚-2基、吲哚-3基、氮杂吲哚-3基、吡唑-4基、喹啉-2基、咪唑-4基、噻吩-2基或喹啉-5基。

在又一优选的实施方案中，本发明涉及任何上述化合物，其中 R^1 是三氟甲基、氨基、环丙氨基、甲基、乙基、丙基、异丙基、环丙基、2-甲基环丙基、2,2,3,3-四甲基环丙基、2-苯基环丙基、环丁基、环戊基、环己基、-(CH₂)p-O-苯基、-(CH₂)p-O-(4-甲氧基苯基)、-(CH₂)p-O-(4-氯苯基)、-(CH₂)p-O-(4-甲基苯基)、-(CH₂)p-O-(4-硝基苯基)、-(CH₂)p-O-(3-甲基苯基)、-(CH₂)p-O-(4-苯基苯基)、-(CH₂)p-O-(4-羟基苯基)、-(CH₂)p-O-(4-硝基苯基)、-(CH₂)p-O-(4-氯苯基)、-(CH₂)p-O-(4-甲氧基苯基)、-(CH₂)p-O-(4-甲基苯基)、-(CH₂)p-O-(4-甲氧基甲基苯基)、-(CH₂)p-O-(4-甲氧基乙基苯基)、NH-苯基、NH-(4-甲氧基苯基)、NH-(4-氯苯基)、NH-(4-氟苯基)、NH-(4-异丙基苯基)、异丙氧基、乙氧基、环戊氧基、-(CH₂)p-吲哚基、-(CH₂)p-吡啶基、-(CH₂)p-苯并噻唑基、-(CH₂)p-吲哚基、-(CH₂)p-四氢呋喃基、-(CH₂)p-呋喃基、-(CH₂)p-呋喃基、-(CH₂)p-噻吩基、-(CH₂)p-季戊基、-(CH₂)p-异亚甲基基、-(CH₂)p-5-甲基异亚甲基基、-(CH₂)p-噻啶基、-(CH₂)p-哌嗪基、-(CH₂)p-C(O)-OMe、-(CH₂)p-C(O)-OEt 或任选地被一个或多个 Cl、F、OMe、甲基或氨基取代的苄基。P 是 1-3 的整数。

在该实施方案的一个方面中，R 任选地被一个或多个选自下列的基团取代：Br、Cl、F、氨基甲基、N,N-二甲氨基甲基、羧基、羧甲基、羧乙基、羟基甲基、羟基乙基、甲氧羰基、乙氧羰基、苄基、4-吗啡代甲基、-C(O)-O-(CH₂)₂-N(Me)₂、-C(O)-O-(CH₂)₂-N(Et)₂、-C(O)-O-CH₂-N(Me)₂、-C(O)-O-(CH₂)₂-N(Me)₂、-C(O)-NH-(CH₂)₂-N(Me)₂、-C(O)-NH-(CH₂)₂-N(Me)₂、-NH-C(O)-CF₃ 以及选自下列的任选被取代的部分：甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基和苯基，其中所述任选被取代的部分任选地被一个或多个 Br、Cl、F、羟基、硝基、氨基或低级烷基取代。

另一方面，本发明提供了药物组合物，其中含有一种或多种如本
文所定义的本发明化合物与可药用载体或稀释剂。
另一方面，本发明提供了抑制一种或多种蛋白激酶活性的方法，该方法包括施用下式所示的化合物及其生理上可接受的盐和生物活性代谢物：

其中：
- R 选自取代或未取代的：脂族基团、芳族基团、(C₃-C₆)烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基和杂环基-烷基；
- R¹ 是氢或-A-Z；
- R² 是氢或选自取代或未取代的：低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基、杂环基-烷基；
- A 是-(CH₂)ₙ-、-(CH₂)ₙNH-、-(CH₂)ₙO-、-(CH₂)ₙS-、-(CH₂)ₙS(O)-或-(CH₂)ₙS(O)₂-；
- Z 是-H、低级烷基、芳烷基、三卤代甲基、三卤代甲基基团、R³CO-、R³OC(O)-、-NR⁴R⁵、-C(O)NR⁴R⁵、R³O-或选自下列一组的环系：(C₃-C₆)环烷基、苯、吲哚、异噁唑、异噻唑、吲哚、吡啶、嘧啶、苯并噻唑、四氢呋喃、噻吩、三嗪、咪唑、呋喃、苯并咪唑、哒嗪、喹啉等、吲哚、噻唑、噻唑及其-N-氧化物，其中所述环系可以任选地被一个或多个选自下列一组的基团取代：卤素、低级烷基、R³O-、HO-、HOC(O)-、R³OC(O)-、三卤代甲基、硝基、芳基、-CN、-C(O)NR⁴R⁵和-NR⁴R⁵；

每处出现的 R³ 彼此独立地选自取代或未取代的：低级烷基、低级烷氧基低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基和杂环基-烷基；

每处出现的 R⁴ 和 R⁵ 彼此独立地为氢或选自取代或未取代的：低级烷基、芳族基团、(C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环烷基-烷基；
基和杂环基-烷基；任选地，R₁和 R₂与和其所相连的氨结合在一起表示
吗啉代、吡啶环基、哌啶环基、咪唑-1-基、哌嗪基、硫吗啉代、
叮啶子基或全氢化-1,4-二氧杂环庚三烯-1-基，其中每个基团任选地
被一个或多个自下列一组的基团取代；低级烷基、羟基、低级烷氧
基低级烷基、芳基或 (C₃-C₆)环烷基、杂环基、芳烷基、(C₃-C₆)环
烷基-烷基和杂环基-烷基；并且

n 是 0-3 的整数。

上述方法中优选的方法是其中在需要的接受治疗者中抑制蛋白激
酶。

任何上述方法中优选的方法是其中的化合物为立体异构体的混合
物。

任何上述方法中优选的方法是其中的立体异构体是对映体。

任何上述方法中优选的方法是其中的立体异构体是 E 和 Z 异构
体。

任何上述方法中优选的方法是其中的化合物为结构异构体的混合
物。

任何上述方法中优选的方法是其中的结构异构体是互变异构体。

任何上述方法中优选的方法是其中所述蛋白激酶是受体酪氨酸激
酶或非受体酪氨酸激酶。

任何上述方法中优选的方法是其中所述酪氨酸激酶选自 KDR、
Flt-1、TIE-2、FGFR、PDGFR、IGF-1-R、c-Met、Lck、Src、fyn、
Lyn、Blk 和 yes。

另一方面，本发明涉及治疗或根本上抑制需治疗者的过度增殖疾
病或炎性疾病的方法，该方法包括对所述接受治疗者施用任何如本文
定义的本发明化合物。

另一方面，本发明涉及治疗或抑制需治疗者血管生成的方法，该
方法包括对所述接受治疗者施用任何如本文定义的本发明化合物。

另一方面，本发明涉及诱导需治疗者抗血管生成作用的方法，该
方法包括对所述接受治疗者施用任何如本文定义的本发明化合物。

另一方面，本发明涉及治疗或抑制需治疗者疾病或病症进行的方
法，该方法包括对所述接受治疗者施用任何如本文定义的本发明化合
物，其中所述疾病或病症选自癌、关节炎、动脉粥样硬化、再狭窄、
牛皮癣、血管瘤、心肌血管生成、冠状和脑侧突、局部缺血性四肢血管生成、角膜疾病、潮红、新生血管性青光眼、黄斑变性、创伤愈合、消化性溃疡、与螺旋杆菌有关的疾病、病毒引起的血管生成疾病、骨折、糖尿病性视网膜病、节段性回肠炎、炎症性肠疾病、猫抓伤引起的发烧、视网膜病或软化、溃疡、甲状腺增生、灼伤、外伤、急性肺损伤、慢性肺病、中风、息肉、囊肿、滑膜炎、慢性支气管性炎疾、卵巢过度刺激综合征、肺和脑水肿、疤痕瘤、纤维性、肝硬化、腕管综合征、腺毒症、成人呼吸窘迫综合征、多器官机能障碍综合征、腹水和与肿瘤有关的渗漏积液以及水肿。

另一方面，本发明涉及影响血管生成的方法，该方法包括对所述受阻的血管生成施用任何如本文定义的本发明化合物。该方法中优选的方法是，其中对肿瘤产生作用为抗水肿。

上述任何方法中优选的方法是，其中蛋白激酶是丝氨酸激酶。

上述任何方法中的优选方法是，其中蛋白激酶是苏氨酸激酶。

本发明特别优选的化合物是：

3-环丙基-4-[[3,5-二甲基-4-(4-甲基-1-哌嗪基甲基)吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，

3-环丙基-4-[[3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，

3-环丙基-4-[[4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，

3-环丙基-4-[[3,5-二甲基-4-哌啶子基甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，

3-环丙基-4-[[4-二乙醇氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，

3-环丙基-4-[[3-二甲氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，

3-环丙基-4-[[3-吗啶代甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，

3-环丙基-4-[[3-二甲氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，

3-环丙基-4-[[3-(4-甲基-1-哌嗪基甲基)-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚
甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[3-(1-吡咯烷基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-哌啶子基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-(3,5-二溴-4-羟基亚苄基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-氧化-1,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(5-三氟甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-二甲氨基乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-二甲氨基乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-二甲氨基乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(2-二甲氨基乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-吗啉代乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-吗啉代乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-吗啉代乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-吗啉代乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-
5-酮，
3-环丙基-4-[(3,4-二氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-环丙基-2-羧乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(5-乙氧基-4-甲氧基基甲基-3-甲氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(5-氧-4-甲氧基基甲基-3-甲氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(4-甲基-1-哌啶基甲基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二氧基甲基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-哌啶子甲基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二氧基甲基甲基-3,5-二甲基-吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二氧基甲基甲基-4,5-四亚基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-吗啉代甲基-4,5-四亚基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二氧基甲基甲基-4,5-四亚基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-4甲基-1-哌啶基甲基)-4,5-四亚基基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-吡啶基)-4-[(3-1-吡咯烷基)甲基-4,5-四亚基基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-哌啶子甲基甲基-4,5-四亚基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氯基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二氯基乙基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氧代-1,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲基氯甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲基氯基甲基-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氧代-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-乙氧酰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氯基乙氧酰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二氯基乙氧酰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-氧代-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-氧代-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-2-甲氯基乙氧酰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
酮，
4-{[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧亚乙基)吲哚-2-基]亚甲基}-3-(3-吡啶基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-{[3-(2-氨基-2-甲基)吲哚-2-基]亚甲基}-3-(3-吡啶基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-{(5-乙氧基-4-甲氧亚乙基)甲基-3-甲氧亚乙基吡咯-2-基]亚甲基}-3-(3-吡啶基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-{(5-氯-4-甲氧亚乙基)甲基-3-甲氧亚乙基吡咯-2-基]亚甲基}-3-(3-吡啶基)-2-吡啶啉-5-酮，
4-{[3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{[3,5-二甲基-4-{[(4-甲基-1-哌嗪基甲基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{[3,5-二甲基-4-{(1-吡咯烷基甲基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{[4-二乙氧基甲基-3,5-二甲基-吡咯-2-基]亚甲基}-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{[3,5-二甲基-4-{(哌啶子基甲基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{[4-二乙氧基甲基-3,5-二甲基-吡咯-2-基]亚甲基}-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
4-{(3-二甲氧基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基}-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-{[(3-吗啉代甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基}-2-吡啶啉-5-酮，
4-{(3-二乙氧基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基}-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-{[(3-(4-甲基-1-哌嗪基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基)-2-吡啶啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-{[(3-哌啶子基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基}-2-吡啶啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-{[(3-哌啶子基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基}-2-
吡唑咪-5-酮，
4-[[4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑咪-5-酮，
4-[[4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑咪-5-酮，
4-[[3,5-二溴-4-羟基亚苄基]-3-异丙氧基-2-吡唑咪-5-酮，
3-异丙氧基-4-[[4-氧代-1,5,6,7-四氢吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑咪-5-酮，
4-[[4-二甲氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑咪-5-酮，
4-[[4-溴吡咯-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑咪-5-酮，
4-[[4-氯吡咯-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑咪-5-酮，
4-[[5-氯吡咯-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑咪-5-酮，
3-异丙氧基-4-[[5-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑咪-5-酮，
4-[[4-乙氧羰基吡咯-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑咪-5-酮，
4-[[2-二甲氨基乙氧羰基吡咯-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑咪-5-酮，
4-[[4-二甲氨基乙氧羰基吡咯-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑咪-5-酮，
4-[[3-乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑咪-5-酮，
4-[[3-(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑咪-5-酮，
4-[[3-(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑咪-5-酮，
3-异丙氧基-4-[[4-(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑咪-5-酮，
3-异丙氧基-4-[[4-(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑咪-5-酮，
3-异丙氧基-4-[[3-(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑咪-5-酮，
3-异丙氧基-4-[[3-(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑咪-5-酮，
4-[[3,4-二乙氧羰基吡咯-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[3-(2-氨基-2-羧基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-乙氧基-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吡咯-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-氯-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吡咯-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-[[4-甲基-1-哌嗪基甲基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-[[1-吡啶烷基甲基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氧基甲基-3,5-二甲基-吡咯-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-1-哌啶子基甲基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氧基甲基-3,5-二甲基-吡咯-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-二乙氧基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[[3-吗啉代甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-二乙氧基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[[3-(4-甲基-1-哌嗪基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[[3-1-吡啶烷基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[[3-哌啶子基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二甲氧基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-
5-酮，
4-[(4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二溴-4-羟基亚苄基)-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(4-氧代-1,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(5-三氟甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(2-二甲氨基乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(2-二甲氨基乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(4-吗啉代乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(4-吗啉代乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(4-吗啉代乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(5-甲氧基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基乙基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-氨基-2-巯基乙基)吡唑-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-乙氧基-4-甲氧基甲基-3-甲氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-二甲氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-吗啉代甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-二乙氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(4-甲基-1-哌嗪基甲基)-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
3-吡唑基-4-[[3-(1-吡啶烷基)甲基]-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-哌啶子基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-(3,5-二溴-4-羟基亚基基)-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-溴吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-氯吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-氯吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
3-吡唑基-4-[[5-三氯甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-乙氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二甲氨基乙氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二甲氨基乙氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-乙氧基基吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-二甲氨基乙氧基基吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
5-酮，
4-[3-(2-二甲氨基乙氧基基吲哚-2基)亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[4-(4-吗啉代乙氧基基吲哚-2基)亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[4-(4-吗啉代乙氧基基吲哚-2基)亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(4-吗啉代乙氧基基吲哚-2基)亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(4-吗啉代乙氧基基吲哚-2基)亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3,5-二甲基-4-乙氧基基吲哚-2基)亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基基吲哚-2基)亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3,5-二甲基-4-乙氧基基吲哚-2基)亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基基吲哚-2基)亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-吲哚-3-基)亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-吲哚-3-基)亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-吲哚-3-基)亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
3-吡啶基-4-[[4-吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3,4-二乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，

3-(咪唑-2-基)-4-[(4-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(2-二甲氨基乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(2-二甲氨基乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[(4-吗啉代乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[(4-吗啉代乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[(3-吗啉代乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[(3-吗啉代乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[(5-甲氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[(4,5-四亚甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(二甲氨基乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(二甲氨基乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(咪唑-2-基)-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮,
4-[(3,4-二乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(2-乙酰氨基-2-甲氧羰基乙基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(2-氨基-2-羧乙基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-乙氧基-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氯-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(咪唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-溴吡咯-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(1-甲基环丙基)-4-[(5-三氯甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(2-二甲氨基乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(2-二甲氨基乙氧羰基环丁基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(1-甲基环丙基)-4-[(4-吗啉代乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(1-甲基环丙基)-4-[(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(1-甲基环丙基)-4-[(3-4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
喹啉-5-酮，
3-(1-甲基环丙基)-4-[3-(4-吗啉代乙氧基羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(1-甲基环丙基)-4-[[1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-乙氧基羰基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲氧基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(1-甲基环丙基)-4-[[4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-二甲基乙氧基羰基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-二甲基乙氧基羰基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吡咯-2-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,4-二乙氧基羰基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-氯基-2-羧乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-乙氧基-4-甲氧基羰基甲基-3-甲氧基羰基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-氯-4-甲氧基羰基甲基-3-甲氧基羰基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(1-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(4-甲基-1-哌嗪基甲基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-吲哚基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二氟氨基甲基]-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-哌啶子基甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氨基甲基]-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-二甲氨基甲基]-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[[3-吗啉代甲基]-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-二乙氨基乙基]-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[[3-(4-甲基-1-哌嗪基甲基)-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[[3-(1-吡咯烷基)甲基]-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[[3-哌啶子基甲基]-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氨基乙基]-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二溴-4-羟基亚苄基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[[4-氧代-1,5,6,7-四氢吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[[4-二甲氨基甲基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-溴吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-氯吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-氯吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(5-三氯甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-乙氧基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(2-二甲氨基乙氧基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-[(2-二甲氨基乙氧基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-[(2-二甲氨基乙氧基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(4-吗啉代乙氧基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(4-吗啉代乙氧基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(3-4-吗啉代乙氧基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(3-4-吗啉代乙氧基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，

4-[(3,5-二甲基-4-乙基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，

3-(2-呋喃基)-4-[(5-甲氧基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(4,5-二甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基乙氧基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-呋喃基)-4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮；
4-[(3,4-二乙氧基基咪唑-2-基)亚甲基]-3-(3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙酰氨基-2-甲氧基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-2-氨基-2-烷基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-乙基基-4-甲氧基基甲基-3-甲氧基基咪唑-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氟-4-甲氧基基甲基-3-甲氧基基咪唑-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[[吗啉代甲基咪唑-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(4-甲基-1-哌嗪基)甲基咪唑-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(1-吡啶基基甲基咪唑-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氧基基甲基-3,5-二甲基咪唑-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-哌啶子基甲基咪唑-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氧基基甲基-3,5-二甲基咪唑-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氧基甲基-4,5-四亚基甲基咪唑-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-吗啉代甲基-4,5-四亚基甲基咪唑-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二乙氧基基甲基-4,5-四亚基甲基咪唑-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-甲基-1-哌嗪基基甲基)-4,5-四亚基甲基咪唑-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(1-吡啶基基甲基)-4,5-四亚基甲基咪唑-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(3-哌啶子基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-(3,5-二溴-4-羟基亚烷基)-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(4-氧化-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(4-溴吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(4-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(5-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
3-(2-噻吩基)-4-[(5-三氟甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基乙氧基烷基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基乙氧基烷基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(4-吗啉代乙氧基烷基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(4-吗啉代乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-[(3-4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吲唑啉-5-酮，
4-(3-(4-吗啉代乙氨基羧基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-甲氧基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4,5-四亚甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧羰基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧羰基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,4-二乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(2-乙酰氨基-2-甲氧羰基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(2-氨基-2-羧乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-乙氧基-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氯-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-溴吲哚-2-基)亚甲基]-3-环丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氯吲哚-2-基)亚甲基]-3-环丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氯吲哚-2-基)亚甲基]-3-环丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(5-三甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(4-乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙氧基-4-[(4-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉
-5-酮，
    3-环丙氧基-4-{4-(2-二甲氨基乙氧基羧基呫喀-2-基)亚甲基}2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙氧基-4-{[(3-乙氧基呫喀-2-基)亚甲基]}2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙氧基-4-{[3-(2-二甲氨基乙氧基呫喀-2-基)亚甲基]}2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙氧基-4-{[3-(2-二甲氨基乙氧基羧基呫喀-2-基)亚甲基]}2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙氧基-4-{[4-(4-吗啉代乙氧基羧基呫喀-2-基)亚甲基]}2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙氧基-4-{[4-(4-吗啉代乙氧基呫喀-2-基)亚甲基]}2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙氧基-4-{[3-(4-吗啉代乙氧基呫喀-2-基)亚甲基]}2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙氧基-4-{[3,5-二甲基-4-乙基呫喀-2-基)亚甲基]}2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙氧基-4-{[(1-甲基呫喀-3-基)亚甲基]}2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙氧基-4-{[3,5-二甲基-4-乙氧基呫喀-2-基)亚甲基]}2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙氧基-4-{[(5-甲基呫喀-2-基)亚甲基]}2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙氧基-4-{[(4,5-四亚甲基呫喀-2-基)亚甲基]}2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙氧基-4-{[3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基呫喀-2-基)亚甲基]}2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙氧基-4-{[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基羧基呫喀-2-基)亚甲基]}2-吡唑啉-5-酮，
4-{[3-(2-氨基-2-羰乙基)吲哚-2-基]亚甲基}-3-环丙氧基-2-吡唑啉-5酮，
3-环丙氧基-4-{[5-乙氧基-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吲哚-2-基]亚甲基}-2-吡唑啉-5酮，
4-{[5-氯-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吲哚-2-基]亚甲基}-3-环丙氧基-2-吡唑啉-5酮，
4-{[4-溴吲哚-2-基]亚甲基}-3-{2-(5-吲哚基乙基)]-2-吡唑啉-5酮，
4-{[4-氯吲哚-2-基]亚甲基}-3-{2-(5-吲哚基乙基)]-2-吡唑啉-5酮，
4-{[5-氯吲哚-2-基]亚甲基}-3-{2-(5-吲哚基乙基)]-2-吡唑啉-5酮，
3-{2-(5-吲哚基乙基)]-4-{[5-三氟甲基吲哚-2-基]亚甲基}-2-吡唑啉-5酮，
4-{[4-乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基}-3-{2-(5-吲哚基乙基)]-2-吡唑啉-5酮，
4-{[4-(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-3-{2-(5-吲哚基乙基)]-2-吡唑啉-5酮，
4-{[4-(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-3-{2-(5-吲哚基乙基)]-2-吡唑啉-5酮，
4-{[3-乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-3-{2-(5-吲哚基乙基)]-2-吡唑啉-5酮，
4-{[3-(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-3-{2-(5-吲哚基乙基)]-2-吡唑啉-5酮，
4-{[3-(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-3-{2-(5-吲哚基乙基)]-2-吡唑啉-5酮，
4-{[4-(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-3-{2-(5-吲哚基乙基)]-2-吡唑啉-5酮，
4-{[4-(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-3-{2-(5-吲哚基乙基)]-2-吡唑啉-5酮，
4-{[3-(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-3-{2-(5-吲哚基乙基)]-2-吡唑啉-5酮，
4-{[3-(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-3-{2-(5-吲哚基乙基)]-2-吡唑啉-5酮，
4-\{(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基\}-3-\{2-(5-嘧啶基乙基)\}-2-吡
唑啉-5-酮，
4-\{(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基\}-3-\{2-(5-嘧啶基乙基)\}-2-吡唑啉-5-
酮，
4-\{3,5-二甲基-4-乙氧羰基吡咯-2-基\}亚甲基]-3-\{2-(5-嘧啶基乙基)\}-
2-吡唑啉-5-酮，
4-\{(5-甲氧基吲哚-2-基)亚甲基\}-3-\{2-(5-嘧啶基乙基)\}-2-吡唑啉-5-
酮，
3-\{2-(5-嘧啶基乙基)\}-4-\{(4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉
-5-酮，
4-\{3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧羰基)叮咯-2-基\}亚甲基]-3-\{2-(5-
嘧啶基乙基)\}-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧羰基)叮咯-2-基\}亚甲基]-3-\{2-
(5-嘧啶基乙基)\}-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{(吲哚-3-基)亚甲基\}-3-\{2-(5-嘧啶基乙基)\}-2-吡唑啉-5-酮，
3-\{2-(5-嘧啶基乙基)\}-4-\{(吲哚-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{(吲哚-2-基)亚甲基\}-3-\{2-(5-嘧啶基乙基)\}-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{(3,4-二乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基\}-3-\{2-(5-嘧啶基乙基)\}-2-吡唑
啉-5-酮，
4-\{3-(2-乙酰氨基-2-甲氧羰基乙基)吲哚-2-基\}亚甲基]-3-\{2-(5-嘧
啶基乙基)\}-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{3-(2-氰基-2-甲基)吲哚-2-基\}亚甲基]-3-\{2-(5-嘧啶基乙基)\}-2-
吡唑啉-5-酮，
4-\{(5-乙氧基-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吡咯-2-基)亚甲基\}-3-\{2-
(5-嘧啶基乙基)\}-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{(5-氯-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基吡咯-2-基)亚甲基\}-3-\{2-(5-嘧
啶基乙基)\}-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{(4-溴吡咯-2-基)亚甲基\}-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{(4-氯吡咯-2-基)亚甲基\}-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{(5-氯吡咯-2-基)亚甲基\}-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-苯乙基)-4-\{(5-三氟甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{(4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基\}-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(2-二甲氨基乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(2-二甲氨基乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(2-二甲氨基乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-吗啉代乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-吗啉代乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-甲氧基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-苯乙基)-4-[(4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧羰基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧羰基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,4-二乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二酰氨基-2-甲氧羰基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-氯基-2-羰乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-
5-酮，
4-[(5-乙氧基-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基呲咯-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氟-4-甲氧羰基甲基-3-甲氧羰基呲咯-2-基)亚甲基]-3-(2-苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-溴呲咯-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氯呲咯-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-氯呲咯-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-羟苯基)乙基]-4-[(5-三氟甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-羟苯基)乙基]-4-[(4-吗啉代乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-羟苯基)乙基]-4-[(4-吗啉代乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-羟苯基)乙基]-4-[(3-4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[2-(4-羟苯基)乙基]-4-[(3-4-吗啉代乙氧羰基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3,5-二甲基-4-乙氧羰基吡咯-2-基)亚甲基]-3-[2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-2-(4-羟苯基)乙基]-4-[(5-甲氧基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-2-(4-羟苯基)乙基]-4-[(4,5-二亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,4-二乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-乙酰氨基-2-甲氧基基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-(2-氨基-2-羧乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-乙氧基-4-甲氧氨基基甲基-3-甲氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-3-2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-氯-4-甲氧氨基基甲基-3-甲氧基基吡咯-2-基]亚甲基]-3-2-(4-羟苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(4-溴吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(4-氯吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(4-氟吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(5-氯吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(5-三氯甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(4-乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(4-2-二甲氨基乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-2-(4-氨基苯基)乙基]-4-[(4-2-二甲氨基乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-4-[(3-乙氧喹啉基吲哚-2基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-4-[(2-2-二甲氨基乙氧喹啉基吲哚-2基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-4-[(2-2-二甲氨基乙氧喹啉基吲哚-2基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-4-[(3-4-吗啉代乙氧喹啉基吲哚-2基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-4-[(3-4-吗啉代乙氧喹啉基吲哚-2基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-4-[(5-甲氧基吲哚-2基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-4-[(4,5-四亚甲基吲哚-2基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-4-[(3,5-二甲基-4-2-二甲氨基乙氧喹啉基吲哚-2基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-4-[(3,5-二甲基-4-2-二甲氨基乙氧喹啉基吲哚-2基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-4-([(吲哚-2基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-4-[(吲哚-2基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-4-[(3,4-二乙氧喹啉基吲哚-2基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-2-乙酰氨基-2-甲氧基基基乙基)吲哚-2基]亚甲基]-3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-2-氨基-2-羧基)吲哚-2基]亚甲基]-3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-4-氨基苯基)乙基]-4-[(5-乙氧基-4-甲氧基基基-3-甲氧基基吲哚-2基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(2-(4-氨基苯基)乙基)-4-[(5-氯-4-甲氧羰基甲基)-3-甲氧羰基吡咯-2基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(4-甲基-1-哌嗪基甲基)吡咯-2基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基甲基)-3,5-二甲基吡咯-2基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(哌啶子基甲基吡咯-2基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙醇氨基甲基)-3,5-二甲基吡咯-2基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二甲氨基甲基)-4,5-四亚甲基吡咯-2基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-吗啉甲基)-4,5-四亚甲基吡咯-2基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二乙氨基甲基)-4,5-四亚甲基吡咯-2基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-4甲基-1-哌嗪基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-嘧啶基)-4-[(3-(1-吡咯烷基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-哌啶子基甲基)-4,5-四亚甲基吡咯-2基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基-4,5,6,7-四氮吲哚-2基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基吡咯-2基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-(3,5-二溴-4-羟基亚苄基)-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-
吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氧代-1,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(4-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(4-甲基-1-哌嗪基甲基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(1-吡咯烷基甲基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(1-吡咯烷基甲基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(4-乙氧基环己基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(2-甲基-4-亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(2-甲基-4-亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(4-乙氧基环己基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-吗啉代甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二乙氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,4-甲基-1-哌嗪基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-噻啶基)-4-[[3-(1-吡咯烷基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-哌啶子基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-噻啶基)-2-
吡唑啉-5-酮，
4-(3,5-二溴-4-羟基亚苄基)-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-
吡唑啉-5-酮，
5
4-[(4-氧化-1,5,6,7-四氢吖啶-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-
5-酮，
4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑
啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡
唑啉-5-酮，
10
4-[(3,5-二甲基-4-[[4-甲基-1-哌嗪甲基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[[1-吡唑烷基甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
15
4-[(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-
吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[[1-哌啶子基甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-
吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙醇氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
20
4-[(3-二甲氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-吗啉代甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-
吡唑啉-5-酮，
25
4-[(3-二乙氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-[4-甲基-1-哌嗪基]甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-嘧啶基)-4-[[3-(1-吡咯烷基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲
基]-2-吡唑啉-5-酮，
30
4-[(3-哌啶子基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[4-(二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[4-(二乙氨基乙基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-(3,5-二溴-4-烃基亚芐基)-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[4-(氧代-1,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[4-(二甲氧基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3,5-二甲基-4-{[(4-甲基-1-哒嗪基甲基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[4-(二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3,5-二甲基-4-哌啶子基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[4-(二乙醇氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-二甲氨基甲基-4,5-亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-吗啉代甲基-4,5-亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3-二乙氨基甲基-4,5-亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{3-[4-(甲基-1-哒嗪基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-哒嗪基)-4-{3-[1-吡咯烷基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲
基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[[3-哌啶子基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[(4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[(4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-(3,5-二溴-4-羟基亚苄基)-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[(4-氧代-1,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[(3,5-二甲基-4-[[4-甲基-1-哌嗪基甲基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[(3,5-二甲基-4-[[1-吡咯烷氨基甲基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[(3,5-二甲基-4-[[3-哌啶子基甲基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基-吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[(3-二甲氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[(3-吗啉代甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
  4-[(3-二乙氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(4-甲基-1-哌嗪基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-哒嗪基)-4-[(3-(1-哌嗪烷基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-哌啶子基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氧基乙基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-(3,5-二溴-4-羟基亚苯基)-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氧代-1,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[[4-甲基-1-哌嗪基甲基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[[1-哌嗪烷基甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-异噁唑基)-4-[[3-(4-甲基-1-哌嗪基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-异噁唑基)-4-[[3-(1-吡咯烷基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基]亚甲基]-3-(5-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二甲氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-甲基-3-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-[[4-甲基-1-哌嗪基甲基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-甲基-3-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-[[1-吡咯烷基甲基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-甲基-3-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-甲基-3-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-哌啶子基甲基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-甲基-3-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-甲基-3-异噁唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-吗啉代甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-二乙氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异噻唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-甲基-3-异噻唑基)-4-[(3-(4-甲基-1-哌嗪基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-甲基-3-异噻唑基)-4-[(3-(1-吡咯烷基)甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-甲基-3-异噻唑基)-4-[(3-哌啶子基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基-4,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异噻唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基乙基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异噻唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-(3,5-二溴-4-羟基亚苄基)-3-(5-甲基-3-异噻唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异噻唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-甲基-3-异噻唑基)-4-[(4-氧代-1,5,6,7-四氢吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异噻唑基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-(1-3-[(二甲氨基)甲基]-4,5,6,7-四氢-1H-2-吲哚基亚甲基)-4,5-二氢-1H-5-吡唑酮，
3-环丙基-4-(1-4-[(1,1-二甲基铵)甲基]-3,5-二甲基-1H-2-吡咯基亚甲基)-4,5-二氢-1H-5-吡唑酮马来酸盐，
4-1-(4-[(2-(二甲氨基)乙基)(甲基)氨基]甲基-3,5-二甲基-1H-2-吡咯基)亚甲基]-3-(2-吡啶基)-4,5-二氢-1H-5-吡唑酮，
4-(1-4-[2-(二乙氨基)乙基]-3,5-二甲基-1H-2-吡咯基亚甲基)-3-(2-吡啶基)-4,5-二氢-1H-5-吡唑酮，
4-(1-4-[3-氯丙酰基]-3,5-二甲基-1H-2-吡咯基]亚甲基]-3-(2-吡啶基)-4,5-二氢-1H-5-吡唑酮，
4-(1-3-[(二甲氨基)甲基]-4,5,6,7-四氢-1H-2-吲哚基亚甲基]-3-(2-吡啶基)-4,5-二氢-1H-5-吡唑酮，
4-(1-4-[(二甲氨基)甲基]-3,5-二甲基-1H-2-吡咯基亚甲基]-3-(5-甲
基-3-异吲哚基)-4,5-二氢-1H-5-吡唑酮，
3-环丙基-4-[(4,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-苄基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲氧基苯氧甲基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-苯氧甲基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苯氧甲基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲氧基苄基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-苄基-4-[(4-(2-羧乙基)-3-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-苄基-4-[(3-(2-羧乙基)-4-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲基苯氧甲基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
2-氨丙基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-苯乙基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-苯氧基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲基苄基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲基苯氧基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲氧基苯氧基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苯氧基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苯氧基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-氯苯氧基甲基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(吲哚-3-基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-甲氧基苄基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3,4-甲氧基苄基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3,4-二甲氧基苄基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲氧基苯乙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-苯基苯氧甲基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-苯基丙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-苯基丙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-羟基苯乙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-苯乙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3,4-二甲基苯基-乙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-硝基苯乙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苯氨基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苯乙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-苯乙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-(4-烃基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环戊氧基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-叔丁基甲基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(4-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯基苯乙基)-4-[(4-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(1-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯基苯乙基)-4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氨基甲基苯乙基)-4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-4-甲氧基基苯乙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯基苯乙基)-4-[(3,5-二甲基-4-乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-4-羟基苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(乙氧基基甲基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-甲氧基基苯氨基基甲基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-(2-羧乙基)-4-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丁基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[(3-吡啶基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[1-(3,5-二氯苯基)吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2,2,3,3-四甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环戊基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
10 3-(2-甲基环丙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-(苯并噻唑-2-基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-4-(3-吡啶基)]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
15 3-(吡咯-2-基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(苯并噻唑-2-基)-4-[(4-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
20 酮，
3-环丙基-4-[(5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(5-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二甲基-4-乙氧基基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
25 3-异丙氧基-4-[(5-苯基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-丙基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-甲基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-异丙基氧基基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-苯氧基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[1-(4-羟基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-羧乙基)-3-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮
酮，

4-[(4-羧基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(4,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-乙酰基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-乙氧基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-羧基吡咯-2-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(四氢呋喃-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-羧基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,4-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-羧乙基)-3-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(5-乙氧基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4,5-二亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-甲氧羰基乙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧羰基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(反-2-苯基环丙基)-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环己基-4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(5-吗啉代甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-羧基吡咯-2-基)亚甲基]-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-溴吡咯-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-溴吡咯-2-基)亚甲基]-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氯吡咯-2-基)亚甲基]-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-吡唑基-4-[(4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-吡啶基)-4-[(4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-羧基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧羰基)吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧羰基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[4-乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[3,5-二甲基-4-三氟乙酰氨基甲基吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[4-氨基甲基-3,5-二甲基吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(苯并噻唑-2-基)-4-[[3,5-二甲基吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(苯并噻唑-2-基)-4-[[3,5-二甲基-4-吗啉代甲基吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-乙基吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-羧基吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-二乙酰氨基甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-三氟乙酰氨基甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[4-乙氧羰基-3-苯基吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-乙氧羰基吲哚-2-基]亚甲基]-3-苯基-2-吡唑啉-5-
酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙基吲哚-2-基)亚甲基]-3-苯基-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[(3,4-二(乙氧基基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡啶嗪-5-酮，
3-乙氧基-4-[(4-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(2-吲哚基乙基)-2-
吡啶嗪-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(1-甲基-2-苯乙基)-
2-吡啶嗪-5-酮，
4-[(4-羧基-3,5-二甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡啶嗪-5-
酮，
3-乙氧基-4-[(5-硝基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡啶嗪-5-酮，
3-乙氧基-4-[(4-硝基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[(4-羧基吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基基)吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙
氧基-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[(5-氯-3-甲氧基基-4-甲氧基基甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-
2-吡啶嗪-5-酮，
4-[(3-(2-羧基乙基)-4-甲基吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡啶嗪-5-
酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-乙氧基-2-吡啶嗪-
5-酮，
3-乙氧基-4-[(4,5-四甲基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-三氟甲基-2-吡啶嗪-
5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-3-(5-异噻唑基)-2-
吡啶嗪-5-酮，
3-(3-氨基苯基)-4-[(3,5-二甲基-4-乙氧基基吲哚-2-基)亚甲基]-2-
吡啶嗪-5-酮，
3-乙氧基-4-[(2-(4-吗啉代乙基)氨基羧基吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡啶
嗪-5-酮，
4-[(4-乙氧基基-3-苯基吲哚-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡啶嗪-5-
酮，
4-[(4-(4-甲基-1-哌嗪基甲基)-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-哌啶子基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-哌啶子基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-异喹唑啉基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-异喹唑啉基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(5-甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[N-(2-二甲氨基乙基)-N-甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二甲氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮马来酸盐，
4-[(4-(3-氯丙酰基)-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-二乙氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-甲基-3-异喹唑啉基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-(4-羰基哌啶子基甲基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮马来酸盐，
4-[(4-(4-苄基哌啶子基)甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{\[3,5\-二甲基-4-(2-羟基乙基)吡咯-2-基\]亚甲基}}-3-吡嗪基-2-吡啶甲基-5-酮，
4-{{\[3,5\-二甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基\]亚甲基}}-3-吡嗪基-2-吡啶甲基-5-酮，
3-环丙基-4-{{\[3,5\-二甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基\]亚甲基}}-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-{{\[3,5\-二甲基-4-(2-羟基乙基)吡咯-2-基\]亚甲基}}-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{\[3,5\-二甲基-4-(2-羟基乙基)吡咯-2-基\]亚甲基}}-3-吡嗪基-2-吡啶甲基-5-酮，
4-{{\[4-(2-二乙氨基丙基)-3,5\-二甲基吡咯-2-基\]亚甲基}}-3-吡嗪基-2-吡啶甲基-5-酮，
4-{{\[3,5\-二甲基-4-(3-羟丙基)吡咯-2-基\]亚甲基}}-3-吡嗪基-2-吡啶甲基-5-酮，
4-{{\[3,5\-二甲基-4-(2-甲氨基乙酰基吡咯-2-基\]亚甲基}}-3-吡嗪基-2-吡啶甲基-5-酮，
4-{{\[3,5\-二甲基-4-(2-甲氨基乙酰基吡咯-2-基\]亚甲基}}-3-乙氧基-2-吡啶甲基-5-酮，
3-环丙基-4-{{\[(2-二乙氨基乙基)-3,5\-二甲基-4-吡咯-2-基\]亚甲基}}-2-吡啶甲基-5-酮，
4-{{\[3,5\-二甲基-4-(2-二甲氨基乙基)吡咯-2-基\]亚甲基}}-3-吡嗪基-2-吡啶甲基-5-酮，
4-{{\[3,5\-二甲基-4-(4-羟基丁基)吡咯-2-基\]亚甲基}}-3-吡嗪基-2-吡啶甲基-5-酮，
4-{{\[4-(4-二乙氨基丁基)-3,5\-二甲基吡咯-2-基\]亚甲基}}-3-吡嗪基-2-吡啶甲基-5-酮，
4-{{\[4-(2-二乙氨基乙基-N-氧化物)-3,5\-二甲基吡咯-2-基\]亚甲基}}-3-吡嗪基-2-吡啶甲基-5-酮，
4-{{\[3,5\-二甲基-4-(1-吡咯烷基乙酰基)吡咯-2-基\]亚甲基}}-3-吡嗪基-2-吡啶甲基-5-酮，
4-{{\[4-(2-二乙氨基乙酰基-3,5\-二甲基吡咯-2-基\]亚甲基}}-3-吡嗪基-2-吡啶甲基-5-酮，
4-[(3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-[3-(1-吡咯烷基丙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(二甲基氨基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(二甲基氨基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-乙氧基草酰基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
3-苯基-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-苯基-4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-甲氧基苯基甲基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-苯乙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-甲氧基苄基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-甲基苄基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-苯氨基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-甲氧基苯基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-甲氧基丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苄基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苯基甲基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-3-(4-甲氧基苄基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-苯基-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苯甲基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(3-甲氧基苄基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3,4-二甲氧基苄基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-羟基苄基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-氯苯基甲基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(吲哚-3-基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-甲氧基苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-苯基苯氧基甲基)]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(2-苯基丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(3-苯基丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-羟基苯乙基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-苯基苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基)亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基)亚甲基]-3-苯乙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-硝基苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苯氨基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氨基苯乙基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(2-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(7-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-3-苯乙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环戊基-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-甲氧羰基苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[(1-异丙基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-羟基苯乙基)-4-[(1-甲基吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙基-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-氯苯氨基羰基甲基)-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧羰基甲基-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-甲氧羰基苯氧基甲基)]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环戊基-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-(2,2,3,3-四甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-(2-甲基环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环己基-4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-3-(4-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(苯并噻唑-2-基)-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-(2-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-二甲氨基-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-(吡咯-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-(6-甲氧基苯并噻唑-2-基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[7-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-丙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-三氟甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-3-甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-3-三氟甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-3-(叔丁基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧羰基-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-(2-甲氧羰基乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-3-(反-2-苯基-1-环丙基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丁基-4-[[1-(4-羟基丁基)吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[6-羧基-1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[5-甲氧基-1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[1,7-二甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-3-(四氢呋喃-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基氨基-4-[[1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[6-羟基-1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1,7-二甲基吲哚-3-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[[5-甲氧基-1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[[4-氯苯基-4-[[1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[[1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-3-氯乙酰基-2-吡唑啉-5-酮，
3-[[4-氯苯乙基]-4-[[1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-氨基-4-[[1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[[4-氯苯乙基]-4-[[吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[[1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[[5-异噁唑基]-4-[[1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-3-叔丁基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[6-羧基-1-甲基吲哚-3-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-甲基-6-[[2-(4-吗啡代)乙基]氨甲基]吲哚基吲哚-3-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-[[4-羟基苯乙基]-4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[[4-氯基苯乙基]-4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[[4-甲氧基苯乙基]-4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-[[4-氨基甲基苯乙基]-4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[3-二甲氨基甲基吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-3-[[3-哒啶基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[[5-甲氧基吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[[1-甲基吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-3-[[四氢呋喃-3-基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[5-甲氧基吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[5-硝基吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-3-异丙基氨基-2-吡唑啉-5-酮，
3-[[4-羧基苯乙基]-4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-3-苯基-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[[3-甲基吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙氧基-4-[[3-(2-甲氧羰基-2-乙酰氨基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[[吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-乙氧基-4-[[3-(4-吗啡代甲基)吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[[3-(4-吗啡代甲基)吲哚-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(2-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-氯-6,7-二氯吲哚-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-氯-6,7-二氯吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-氧代-1,5,6,7-二氢吲哚-2-基]亚甲基]-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-二甲氧基甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-乙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-苄基-2-吡唑啉-5-酮，
3-苄基-4-[[1-(4-羟基丁基)-7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-(4-甲氧基苯乙氨基甲基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-异丙氧基-2-吡唑啉-5-酮，
3-氨基-4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-(4-甲氧基芳基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-苯氨基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-(4-甲基基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-(4-羟基苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[1-(4-羟基丁基)-7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-(4-羟基苯乙基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-异丙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-环丁基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-(3-吡啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-苯基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-(4-氯苯基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[7-氯杂吲哚-3-基]亚甲基]-3-丙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-三氟甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-(叔丁基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1-(4-羟基丁基)-7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-三氟甲基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-(4-异丙基苯氨基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-(3-甲基苯氨基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(1-(4-羟基丁基)-7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-(3-甲基苯氨基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-苯乙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(7-氮杂吲哚-3-基)亚甲基]-3-苯基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基苯基)亚甲基]-3-异丙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二甲氨基苯基)亚甲基]-3-苯基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(4-二甲氨基苯基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙基-4-[(3-甲基吡唑-4-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(3-甲基吡唑-4-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(咪唑-2-基)亚甲基]-3-异丙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(咪唑-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(咪唑-4-基)亚甲基]-3-异丙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-[(噻吩-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-3-异丙基-1-甲基-2-吡唑啉-5-酮，
3-异丙基-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(8-羟基喹啉-5-基)亚甲基]-3-异丙基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-二乙氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-二乙氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-二乙氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-唑喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-二乙氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-二乙氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-嘧啶
基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{(4-(2-二乙氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-3-(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{(4-(2-二乙氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-\{(3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-\{(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-\{(4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-\{(4-(2-环丙基氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-\{(3,5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基)吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-\{(3,5-二甲基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基)乙基]吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
4-\{(4-(2-羧乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-3-环丙基-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-\{(4-二乙氨基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-\{(4-(1-吡咯烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-\{(3-异丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-\{(4-(2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-\{(4-[3-(1-吡咯烷基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-\{(3-异丙基-5-甲基-4-(4-哌啶子基丁基)吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-\{(4-[3-(4-吡啶基甲氨基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
3-环丙基-4-\{(4-(4-二甲氨基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基\}-2-吡唑啉-5-酮，
基}-2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙基-4-{[(3-环丙基-4-二乙氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙基-4-{[(3-环丙基-4-(1-吡咯烷基甲基)-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙基-4-{[(3-环丙基-4-(1-吡咯烷基乙基)-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙基-4-{[(3-环丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基)乙基]吡咯-2-基]亚甲基}-2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙基-4-{[(3-环丙基-4-[2-二甲氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙基-4-{[(3-环丙基-5-甲基-4-(3-二乙氨基丙基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基}-2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙基-4-{[(3-环丙基-5-甲基-4-[3-(2,5-二甲基-1-吡咯烷基)丙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基}-2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙基-4-{[(3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基甲氨基丙基)吡咯-2-基]亚甲基}-2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙基-4-{[(3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-吡咯烷基)丁基]吡咯-2-基]亚甲基}-2-吡唑啉-5-酮，
    3-环丙基-4-{[(3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基]亚甲基}-2-吡唑啉-5-酮，
    4-{[(4-(2-环丙基氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
    4-{[(3,5-二甲基-4-二乙氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
    4-{[(3,5-二甲基-4-[2-(4-吡啶甲氨基甲基)乙基]吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
    4-{[(4-二乙氨基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
    4-{[(4-二乙氨基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
    4-{[(4-1-吡咯烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
    4-{[(3-异丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
3-吡嗪基-4-[[4-3-(1-吡啶基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
5-亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-(4-哌啶子基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
3-吡嗪基-4-[[4-3-(4-吡啶基甲氨基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(4-二甲氨基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-二乙氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[2-二(甲氧基乙基)氨基乙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-(3-二乙氨基丙基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[3-(2,5-二甲基-1-吡咯烷基)丙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基甲氨基丙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-吡咯烷基)丁基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[4-(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(二乙氨基甲基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃
基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3,5-二甲基-4-(2-乙氨基乙基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3,5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3,5-二甲基-4-[[2-(4-吡啶基甲氨基)乙基]吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(1-吡啶烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-烷基)-3,5-二甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-异丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡啶烷基乙基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-环丙基氯基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-{{4-[3-(1-吡啶烷基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-{{3-异丙基-5-甲基-4-(4-哌啶子基丁基)吡咯-2-基}亚甲基}-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-呋喃基)-4-{{4-[3-(4-吡啶基甲氨基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(4-二甲氨基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-4-二乙氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡啶烷基)乙基]吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-4-[2-二(甲氧基乙基)氨基乙基]-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-4-(3-二乙氨基丙基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-呋
喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[3-(2,5-二甲基-1-吡咯烷基)丙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基甲氨基丙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-吡咯烷基)丁基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-呋喃基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3,5-二甲基-4-[(1-吡咯烷基甲基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-二乙氨基甲基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-氨基乙基)-吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-[(2-4-吡啶基甲氨基)乙基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-羧基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(二乙氨基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(1-吡咯烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[3-(1-吡咯烷基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-
(2-噻吩基)-2-吡喃嗪-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-(4-哌啶子基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[4-[3-(4-吡啶甲基氨基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[4-(4-二甲氨基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-二乙氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基)乙基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-2-(甲氧基乙基)氨基乙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-(3-二乙氨基丙基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基)乙基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-3-(2,5-二甲基-1-吡咯烷基)丙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯甲基氨基丙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-吡咯烷基)丁基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-噻吩基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-((1-吡咯烷基甲基)吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[4-(二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡啶嗪-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基)乙基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-烷乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-乙氨基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(1-吡啶烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡啶烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(4-嘧啶基)-4-[[4-[3-(1-吡啶烷基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-[4-(4-哌啶子基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[3-(4-吡啶基甲氨基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(4-二甲氨基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-二乙氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡啶烷基)乙基]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[2-(2-甲氧基乙基)氨基乙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-(3-二乙氨基丙基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[3-(2,5-二甲基-1-吡啶烷基)丙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基甲氨基丙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(4-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-{4-(1-吡唑烷基)丁基}吡咯-2-基]亚甲基]-3-
(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(1-吡唑烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-乙氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-{2-(4-吡啶基甲氨基)乙基}吡咯-2-基]亚甲基]-3-
(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-䉓乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧啶基)-2-吡
唑啉-5-酮，
4-[[4-(二乙氨基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(5-嘧啶
基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(1-吡唑烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-{2-(1-吡唑烷基乙基)}吡咯-2-基]亚甲基]-3-
(5-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(5-嘧啶基)-4-[[4-[[3-(1-吡唑烷基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-
基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-(4-哌啶子基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(5-嘧
啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[[3-(4-吡啶基甲氨基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲
基}-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(4-二甲氨基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(5-
噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-4-二乙烯基甲基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(5-
噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基)乙基]吡咯-2-基}亚甲基}-3-
(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-4-[2-二(甲氧基乙基)氨基乙基]-5-甲基吡咯-2-基}亚
甲基}-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-4-(3-二乙烯基丙基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(5-
噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-4-[3-(2,5-二甲基-1-吡咯烷基)丙基]-5-甲基吡咯-2-基}
亚甲基}-3-(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基甲氨基丙基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-(5-
噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-吡咯烷基)丁基]吡咯-2-基}亚甲基}-3-
(5-噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-吡咯烷基)丁基]吡咯-2-基}亚甲基}-3-(5-
噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-(5-
噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基}-3-(2-噻啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(二乙烯基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基}-3-(2-噻啶基)-2-
吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-环丙基氨基酸乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-噻啶
基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3,5-二甲基-4-(2-乙烯基乙基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-噻啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3,5-二甲基-4-(2-苯氧基乙基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-噻啶基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3,5-二甲基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基)乙基]吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-
噻啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-羧乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(2-噻啶基)-2-吡
唑啉-5-酮，
4-[[4-二乙氨基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(1-吡咯烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(2-嘧啶基)-4-[[4-[3-(1-吡咯烷基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-异丙基-5-甲基-4-(4-嘧啶子基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[3-(4-吡啶基甲氨基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(4-二甲氨基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-二乙氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基)乙基)]吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[2-二(甲氨基乙基)氨基乙基)]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-(3-二乙氨基丙基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[3-(2,5-二甲基-1-吡咯烷基)丙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基甲氨基丙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-吡咯烷基)丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(2-
嘧啶基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-
吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-环丙基氨基乙基}-3,5-二甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{3,5-二甲基-4-(2-乙氨基乙基)-吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{3,5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{3,5-二甲基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基)乙基]吡咯-2-基}亚甲基]-3-
(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-硝乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吡
唑啉-5-酮，
4-{(4-二乙氨基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪基)
2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-(1-吡咯烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒
嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(3-异丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基}亚甲基]-3-
(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-
哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
3-(3-哒嗪基)-4-{4-[3-(1-吡咯烷基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-
基}亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮，
4-{3-异丙基-5-甲基-4-(4-哌啶子基丁基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-(3-哒
嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-[3-(4-吡啶基甲氨基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲
基}-3-(3-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-二甲氨基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-(3-哒
嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(3-环丙基-4-二乙氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(3-哒嗪
基)-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[2-(1-吲哚烷基)乙基]吲哚-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[2-二(甲氧基乙基)氨基乙基]-5-甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[3-二(乙氨基丙基)-5-甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[3-二(乙氨基丙基)-5-甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[3-(2,5-二甲基-1-吲哚烷基)丙基]-5-甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-吲哚烷基)丁基]吲哚-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-5-甲基-4-[4-(环丁基氨基丁基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(3-哒嗪基)-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-[1-吲哚烷基甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[4-(4-环丙基氨基乙基)-3,5-二甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-乙氨基乙基)-吲哚-2-基]亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3,5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基)吲哚-2-基]亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[3-环丙基-4-[2-(4-哒嗪基甲氨基)乙基]吲哚-2-基]亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[4-(1-吲哚烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吲哚啉-5-酮，
4-[[4-(2-羧乙基)-3,5-二甲基吲哚-2-基]亚甲基]-3-(4-哒嗪基)-2-吲哚啉-5-酮，
唑啉-5-酮，

4-{{3-异丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡啶烷基乙基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，

3-(4-哒嗪基)-4-{{4-[3-(1-吡啶烷基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{3-异丙基-5-甲基-4-(4-哌啶子基丁基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-[3-(4-吡啶基甲氨基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(4-二甲氨基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{3-环丙基-4-二乙氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{3-环丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡啶烷基)乙基]吡咯-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{3-环丙基-4-[2-二(甲氧基乙基)氨基乙基]-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{3-环丙基-4-(3-二乙氨基丙基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{3-环丙基-4-[3-(2,5-二甲基-1-吡啶烷基)丙基]-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基甲氨基丙基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-吡啶烷基)丁基]吡咯-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-(4-哒嗪基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{3,5-二甲基-4-(1-吡啶烷基甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-二乙氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-(1,2,4-三嗪-3-
基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[4-(2-环基乙基氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-(1,2,4-
三嗪-3-基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[3,5-二甲基-4-(2-乙氨基乙基)-吡咯-2-基]亚甲基}-3-(1,2,4-三嗪-
3-基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[3,5-二甲基-4-(2-苯氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-(1,2,4-三嗪-
3-基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[3,5-二甲基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基)乙基]吡咯-2-基]亚甲基}-3-(1,2,4-
三嗪-3-基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[4-(2-硝基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-
2-吡喃唑-5-酮，
4-{[4-(乙氨基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-(1,2,4-三嗪-
3-基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[4-(1-吡咯烷基甲基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-(1,2,4-
三嗪-3-基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[3-异丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基}-3-
(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[4-(2-环丙基氨基乙基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-
(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[4-[3-(1-吡咯烷基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基亚甲基]-3-
(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[3-异丙基-5-甲基-4-(4-哌啶子基丁基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-
(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[4-[3-(4-吡啶基甲氨基)丙基]-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲
基}]-3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[4-(4-二甲氨基丁基)-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-
(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[3-环丙基-4-(2-乙氨基甲基-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-(1,2,4-三
嗪-3-基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[3-环丙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基)乙基]吡咯-2-基]亚甲基}-3-
(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡喃唑-5-酮，
4-{[3-环丙基-4-[2-(甲氧基乙基)氨基乙基]-5-甲基吡咯-2-基]亚
甲基}-{3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[3-环丙基-4-(3-二乙氨基丙基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基}-{3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[3-环丙基-4-(3-(2,5-二甲基-1-吡咯烷基)丙基)-5-甲基吡咯-2-基]亚甲基}-{3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，

亚甲基}-{3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[3-环丙基-5-甲基-4-(3-苯基甲氨基丙基)吡咯-2-基]亚甲基}-{3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[3-环丙基-5-甲基-4-[4-(1-吡咯烷基)丁基]吡咯-2-基]亚甲基}-{3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，

亚甲基}-{3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[3-环丙基-5-甲基-4-(4-环丁基氨基丁基)吡咯-2-基]亚甲基}-{3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基}-{3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]-5-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基}-{3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[4-(2-乙氨基乙基)-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基}-{3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[5-甲基-4-[2-(4-吡啶甲氨基乙基)]-5-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基}-{3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

亚甲基}-{3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[4-(2-1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基}-{3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基}-{3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基}-{3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基}-{3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

亚甲基}-{3-(1,2,4-三嗪-3-基)-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基}-{3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[4-(2-乙氨基乙基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基}-{3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基}-{3-吡嗪基-2-
唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-氨基乙基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-
吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-二乙氨基乙基)-3-乙基-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-
2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪
基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙基-4-(2-乙氨基乙基)-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-
吡唑啉-5-酮，
4-[(3-乙基-5-甲基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基乙基)]吡咯-2-基)亚甲基]-
3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪
基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-氨基乙基)-5-甲基-3-乙基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-
吡唑啉-5-酮，
4-[(3-环丁基-4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪
基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-环丁基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基)亚甲基]-3-
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-环丁基-4-(2-乙氨基乙基)-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪
基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-环丁基-5-甲基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基乙基)]吡咯-2-基)亚甲
基]-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-环丁基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪
基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(4-(2-氨基乙基)-5-甲基-3-环丁基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-2-
吡唑啉-5-酮，
4-[(3-环戊基-4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪
基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-环戊基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-基)亚甲基]-3-
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[(3-环戊基-4-(2-乙氨基乙基)-5-甲基吡咯-2-基)亚甲基]-3-吡嗪基-
2-吡唑啉-5-酮，
-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{3-[环戊基-5-甲基-4-[2-(4-吡啶基甲基甲基乙基)]吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-(1-嘧啶基)(乙基)-5-甲基-3-环戊基吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-氨基乙基)-5-甲基-3-环戊基吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环己基-4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环己基-5-甲基-4-[2-(1-吲哚烷基乙基)]吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环己基-4-(2-乙氨基乙基)-5-甲基吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环己基-5-甲基-4-[2-(4-吡啶基甲基甲基乙基)]吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-(1-嘧啶基)(乙基)-5-甲基-3-环己基吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-氨基乙基)-5-甲基-3-环己基吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-苯基吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{5-甲基-3-苯基-4-[2-(1-吲哚烷基乙基)]吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-乙氨基乙基)-5-甲基-3-苯基吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{5-甲基-3-苯基-4-[2-(4-吡啶基甲基甲基乙基)]吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-(1-嘧啶基)(乙基)-5-甲基-3-苯基吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-氨基乙基)-5-甲基-3-苯基吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-苯基吲哚-2-基]亚甲基}-3-吡啶基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-(4-甲氧基苯基)吲哚-2-基]亚甲基}-
3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{5-甲基-3-(4-甲氧苯基)-4-[2-(1-吡啶烷基乙基)] 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(2-乙氨基乙基)-5-甲基-3-(4-甲氧苯基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{5-甲基-3-(4-甲氧苯基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基乙基)] 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(4-甲氧苯基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(2-氨基乙基)-5-甲基-3-(4-甲氧苯基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{5-甲基-3-(2-吡啶基)-4-[2-(1-吡啶烷基乙基)] 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(2-乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{5-甲基-3-(2-吡啶基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基乙基)] 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(2-氨基乙基)-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{5-甲基-3-(2-吡啶基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基乙基)] 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{5-甲基-3-(2-吡啶基)-4-[2-(1-吡啶烷基乙基)] 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(2-乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{5-甲基-3-(2-吡啶基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基乙基)] 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{5-甲基-3-(2-吡啶基)-4-[2-(1-吡啶烷基乙基)] 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(2-乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{5-甲基-3-(2-吡啶基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基乙基)] 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{5-甲基-3-(2-吡啶基)-4-[2-(1-吡啶烷基乙基)] 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(2-乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{5-甲基-3-(2-吡啶基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基乙基)] 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{5-甲基-3-(2-吡啶基)-4-[2-(1-吡啶烷基乙基)] 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(2-乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{5-甲基-3-(2-吡啶基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基乙基)] 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-吡啶基) 吡咯-2-基} 亚甲基-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-5-甲基-3-吡唑嗪基吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡
唑嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氨基乙基)-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基-3-(2-咪唑基)-4-[2-(1-吡唑烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲
基]-3-吡唑嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二氯乙基乙基)-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-吡
唑嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基-3-(2-咪唑基)-4-[2-(1-吡唑烷基甲氧基乙基)]吡咯-2-基]亚甲
基]-3-吡唑嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基乙基)-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-(2-二氯乙基乙基)-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[5-甲基-3-(2-咪唑基)-4-[2-(1-吡唑烷基乙基)]吡咯-2-基]亚甲
基]-3-吡唑嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-[[4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{5-甲基-3-(3-异呫喏基)-4-[2-(4-吡啶基甲基甲基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(3-异呫喏基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-环丙基氨基乙基]-5-甲基-3-(3-异呫喏基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-环丙基氨基乙基]-5-甲基-3-(3-异呫喏基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-乙氨基乙基]-5-甲基-3-(2-呋喃基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-环丙基氨基乙基]-5-甲基-3-(2-呋喃基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-乙氨基乙基]-5-甲基-3-(2-呋喃基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-(2-呋喃基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-环丙基氨基乙基]-5-甲基-3-(2-呋喃基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-乙氨基乙基]-5-甲基-3-(2-呋喃基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-乙氨基乙基]-5-羟基甲基-3-异丙基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{5-羟甲基-3-异丙基-4-[2-(1-吡啶基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-环丙基氨基乙基]-5-羟基甲基-3-异丙基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-环丙基氨基乙基]-5-羟基甲基-3-异丙基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-环丙基氨基乙基]-5-羟基甲基-3-异丙基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-二乙氨基乙基]-3,5-二环丙基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-
2-吡唑啉-5-酮，

4-{{1,3-二环丙基-4-[2-(1-吡唑烷基乙基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-乙氨基乙基)-3,5-二环丙基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{3,5-二环丙基-4-[2-(4-吡啶甲氨基乙基)]吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-[2-(1-咪唑基)乙基]-3,5-二环丙基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{1,2-环丙基氨基乙基)-3,5-二环丙基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基甲基)]-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-[2-(1-咪唑基)乙基]-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{5-甲基-4-[2-(4-吡啶甲氨基甲基)]-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-[2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-氨基甲基)-5-甲基-3-三氟甲基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基甲基)]-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{5-甲基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]-3-叔丁基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-2-(氨基甲基)-5-甲基-3-叔丁基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-2-(二乙氨基甲基)-3-乙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-2-(二乙氨基甲基)-3-乙基-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-乙基-5-甲基-4-[2-(1-吡咯烷基甲基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-乙基-4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-乙基-5-甲基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-乙基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-2-(氨基甲基)-5-甲基-3-乙基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丁基-4-(2-二乙氨基甲基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丁基-4-(2-二乙氨基甲基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丁基-4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丁基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丁基-4-(2-二乙氨基甲基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环丁基-4-[(4-4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-环丁基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-环丁基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑啉-2-吡唑啉-5-酮，
喹基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-氨基甲基)-5-甲基-3-环戊基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑基-2-
吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环戊基-4-(2-二乙烯基甲基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑基-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环戊基-4-(2-二乙烯基甲基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑基-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环戊基-5-甲基-4-[2-(1-吲哚烷基甲基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡-
唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环戊基-4-(2-乙烯基甲基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑基-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环戊基-5-甲基-4-[2-(4-吲哚基甲基)]吲哚-2-基}亚甲基}-3-吡-
唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-(1-吲哚基)甲基]-5-甲基-3-环戊基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡-
唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-乙烯基甲基)-5-甲基-3-环戊基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑基-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环己基-4-(2-二乙烯基甲基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑基-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环己基-4-(2-二乙烯基甲基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑基-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环己基-5-甲基-4-[2-(1-吲哚烷基甲基)]吲哚-2-基}亚甲基}-3-吡-
唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环己基-4-(2-乙烯基甲基)-5-甲基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑基-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{{3-环己基-5-甲基-4-[2-(4-吲哚基甲基)]吲哚-2-基}亚甲基}-3-吡-
唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-[2-(1-吲哚基)甲基]-5-甲基-3-环己基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡-
唑基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-乙烯基甲基)-5-甲基-3-环己基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑基-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-二乙烯基甲基)-5-甲基-3-苯基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡唑基-
2-吡唑啉-5-酮，
-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-苯基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{5-甲基-3-苯基-4-[2-(1-吡啶烷基甲基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-苯基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{5-甲基-3-苯基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-[2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-苯基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-氨基甲基)-5-甲基-3-苯基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-二乙氨基甲基)-5-甲基-3-(4-甲氧基苯基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-(4-甲氧基苯基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{5-甲基-3-(4-甲氧基苯基)-4-[2-(1-吡啶烷基甲基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-[2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-(4-甲氧基苯基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-氨基甲基)-5-甲基-3-(4-甲氧基苯基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-(4-甲氧基苯基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-二乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，

4-{{5-甲基-3-(2-吡啶基)-4-[2-(1-吡啶烷基甲基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{5-甲基-3-(2-吡啶基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基}亚
甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-1-咪唑基)氨基-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-二氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-二乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡啶基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{5-甲基-3-吡嗪基-4-[2-(1-吡咯烷基氨基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡嗪基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-
2-吡唑啉-5-酮，
4-{{5-甲基-3-吡嗪基-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基}亚甲
基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-1-咪唑基)氨基-5-甲基-3-(2-吡嗪基吡咯-2-基}亚甲基}-3-
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-环丙基氨基甲基)-5-甲基-3-(2-吡嗪基吡咯-2-基}亚甲基}-3-
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-二乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-1-吡咯烷基氨基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-
5-酮，
4-{{5-甲基-3-(2-咪唑基)-4-[2-(1-咪唑基甲氨基)]吡咯-2-基}亚甲
基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{5-甲基-3-(2-咪唑基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基}亚甲
基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基}亚甲基}-3-
吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{{5-甲基-3-(2-咪唑基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基}亚甲
甲基)-3-吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-(2-1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基甲基)-5-甲基-3-(2-咪唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-
3-吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-嘧啶基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-(2-嘧啶基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[5-甲基-3-(2-嘧啶基)-4-[2-(1-吡咯烷基甲基)]吡咯-2-基]亚甲基]-
3-吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-嘧啶基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[5-甲基-3-(2-嘧啶基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基]亚
甲基]-3-吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-2-(1-咪唑基)甲基]-5-甲基-3-(2-嘧啶基)吡咯-2-基]亚甲基]-
3-吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基甲基)-5-甲基-3-(2-嘧啶基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氨基甲基)-5-甲基-3-(2-嘧啶基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-(2-嘧啶基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[5-甲基-3-(3-异噁唑基)-4-[2-(1-吡咯烷基甲基)]吡咯-2-基]亚甲
基]-3-吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-(2-乙氨基甲基)-5-甲基-3-(3-异噁唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-(2-二甲氨基甲基)-5-甲基-3-(3-异噁唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[5-甲基-3-(3-异噁唑基)-4-[2-(4-吡啶基甲氨基甲基)]吡咯-2-基]亚
甲基]-3-吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-(2-环丙基氨基甲基)-5-甲基-3-(3-异噁唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-
3-吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-[[4-(2-二乙氨基甲基)-5-甲基-3-(3-异噁唑基)吡咯-2-基]亚甲基]-3-
吡唑基-2-吡啶啉-5-酮，
4-$\{4-(2-\text{乙氨基甲基})-5-\text{羟基}-3-(2-\text{呫喃基})\text{吡咯}-2-\text{基}\}$亚甲基}-3-
呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{4-(2-\text{二甲氨基甲基})-5-\text{羟基}-3-(2-\text{呫喃基})\text{吡咯}-2-\text{基}\}$亚甲基}-3-
呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{5-\text{甲基}-3-(2-\text{呫喃基})-4-[2-(1-\text{呫啶基甲基})]\text{吡咯}-2-\text{基}\}$亚甲基
-3-呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{4-(2-\text{乙氨基甲基})-5-\text{甲基}-3-(2-\text{呫喃基})\text{吡咯}-2-\text{基}\}$亚甲基}-3-
呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{5-\text{甲基}-3-(2-\text{呫喃基})-4-[2-(4-\text{呫啶基甲基甲基})]\text{吡咯}-2-\text{基}\}$亚甲基
-3-呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{4-[2-(1-\text{呫唑基})\text{甲基}]-5-\text{甲基}-3-(2-\text{呫喃基})\text{吡咯}-2-\text{基}\}$亚甲基
-3-呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{4-(2-\text{环丙基氨基甲基})-5-\text{甲基}-3-(2-\text{呫喃基})\text{吡咯}-2-\text{基}\}$亚甲基
-3-呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{4-(2-\text{环丙基氨基甲基})-5-\text{羟基}-3-(2-\text{呫喃基})\text{吡咯}-2-\text{基}\}$亚甲基
-3-呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{4-(2-\text{环丙基氨基甲基})-5-\text{羟基}-3-(2-\text{呫喃基})\text{吡咯}-2-\text{基}\}$亚甲基
-3-呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{5-\text{羟甲基}-3-\text{异丙基}-4-[2-(1-\text{呫啶基甲基})]\text{吡咯}-2-\text{基}\}$亚甲基
-3-呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{4-(2-\text{二甲氨基甲基})-5-\text{羟甲基}-3-\text{异丙基呫咯}-2-\text{基}\}$亚甲基
-3-呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{5-\text{羟甲基}-3-\text{异丙基}-4-[2-(4-\text{呫啶基甲基甲基})]\text{吡咯}-2-\text{基}\}$亚甲基
-3-呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{4-[2-(1-\text{呫唑基})\text{甲基}]-5-\text{羟甲基}-3-\text{异丙基呫咯}-2-\text{基}\}$亚甲基
-3-呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{4-(2-\text{环丙基氨基甲基})-5-\text{羟甲基}-3-\text{异丙基呫咯}-2-\text{基}\}$亚甲基
-3-呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{4-(2-\text{环丙基氨基甲基})-3,5-\text{二环丙基呫咯}-2-\text{基}\}$亚甲基
-3-呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{4-(2-\text{环丙基氨基甲基})-3,5-\text{二环丙基呫咯}-2-\text{基}\}$亚甲基
-3-呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
  4-$\{4-(2-\text{环丙基氨基甲基})-3,5-\text{二环丙基呫咯}-2-\text{基}\}$亚甲基
-3-呫喃基-2-呫喃基-5-酮，
2-吡唑啉-5-酮，
4-{(3,5-二环丙基-4-[2-(1-吡咯烷基甲基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-环丙基甲基)-3,5-二环丙基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(3,5-二环丙基-4-[2-(4-吡啶基甲基甲基)]吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-环丙基氨基甲基)-3,5-二环丙基吡咯-2-基}亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{(4-环丙基氨基甲基)-3,5-二环丙基吡咯-2-基)亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[3-环丙基氨基甲基-5-甲基-4-(2-乙氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[3-环丙基氨基甲基-5-甲基-4-(2-羟基乙基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，
4-{[3-环丙基氨基甲基-5-甲基-4-(2-羟基乙基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮，和
4-{[3-羟甲基-5-甲基-4-(2-二乙氨基乙基)吡咯-2-基]亚甲基}-3-吡嗪基-2-吡唑啉-5-酮。

式 I 化合物可以以与可药用酸的盐形式存在。本发明包括该盐。该盐的实例如盐酸盐、氢溴酸盐、硫酸盐、甲磺酸盐、硝酸盐、马来酸盐、乙酸盐、柠檬酸盐、富马酸盐、酒石酸盐[例如(+)酒石酸盐、(-)酒石酸盐或其混合物]、琥珀酸盐、苯甲酸盐和与氨基酸如谷氨酸的盐。这些盐可以按照本领域专业人员已知的方法制备。

某些具有酸性取代基的式 I 化合物可以以其与可药用碱的盐形式存在。本发明包括这些盐。该盐的实例如钠盐、钾盐、氢氧化钠盐和精氨酸盐。这些盐可以按照本领域专业人员已知的方法制备。

某些式 I 化合物及其盐可以以多于一种晶形存在，并且本发明包括每种晶形及其混合物。

某些式 I 化合物及其盐还可以以溶剂化物、例如水合物的形式存在，并且本发明包括每种溶剂化物及其混合物。
某些式 I 化合物可以含有一个或多个手性中心，并且以不同的旋光活性形式存在。当式 I 化合物含有一个手性中心时，该化合物以两种对映体的形式存在，并且本发明包括这两种对映体以及它们的混合物。该两种对映体可以通过本领域专业人员已知的方法拆分，例如通过形成可以分离的非对映异构的盐，如通过结晶法；形成可以分离的非对映异构的衍生物或配合物，例如通过结晶法、气-液色谱或液相色谱；一种对映体与对映体专一的试剂进行选择性反应，例如酶促酯化；或在手性环境中进行气-液或液相色谱，例如在手性载体上，如结合有手性配体的硅胶，或者在手性溶剂存在下。显然，如果所需的对映体通过上述一种分离方法转化为另一种化学实体，则接下来的步骤必须是释放出所需的对映体形式。或者，可以通过使用旋光活性试剂、底物、催化剂或溶剂进行不对称合成，或者通过不对称转化将一种对映体转化为另一种对映体，合成特定的对映体。

当式 I 化合物含有多于一个手性中心时，它可以以非对映异构形式存在。该非对映异构可以按照本领域专业人员已知的方法分离，例如色谱或结晶，并且每一对中的单个对映体可以如上所述进行分离。本发明包括式 I 化合物的每个非对映异构体及其混合物。

某些式 I 化合物可以以不同的互变异构形式或不同的几何异构形式存在，并且本发明包括式 I 化合物的每种互变异构体和/或几何异构体及其混合物。

某些式 I 化合物可以以不同的可分离的稳定构象形式存在。扭曲不对称是由于不对称键周围受限制的旋转、例如由于位阻或环张力所致，它使得可以分离不同的构象异构体。本发明包括式 I 化合物的每种构象异构体及其混合物。

某些式 I 化合物可以以两性离子形式存在，并且本发明包括式 I 化合物的每种两性离子形式及其混合物。

本发明化合物适于用作丝氨酸/苏氨酸和酪氨酸激酶抑制剂。具体地说，本发明化合物适于用作酪氨酸激酶抑制剂，酪氨酸激酶在过度增殖疾病、特别是在血管生成的过程中是重要的。例如，其中一些化合物是受体激酶如 KDR、Flt-1、FGFR、PDGFR、c-Met 或 IGF-1-R 的抑制剂。由于这些化合物是抗-血管生成药，它们对于抑制其中血管生成是重要组成的进行性疾病是重要物质。某些本发明的化合物是有
效的丝氨酸/苏氨酸激酶如 erk、MAP 激酶、cdks、Plk-1 或 Raf-1 抑制剂。这些化合物适用于治疗癌和过度增殖疾病。此外，某些化合物是有效的非受体激酶如 src、lyn、lck、fyn、blk、hck 抑制剂。这些化合物适用于治疗癌、过度增殖疾病和免疫疾病。

本发明提供了抑制酪氨酸激酶和丝氨酸/苏氨酸激酶活性的方法，该方法包括将足以抑制所述激酶活性浓度的式 I 化合物施用到所述激酶上。

本发明还包括这些化合物在含有药学有效量的上述化合物和可药用载体或赋形剂的药物组合物中的应用。这些药物组合物可以对个体给药以减缓或停止血管生成帮助的疾病中的血管生成过程，或者治疗水肿、渗漏、渗出液或腹水以及其他与血管渗透性过高的有关疾病，某些药物组合物可以对个体给药，以通过抑制丝氨酸/苏氨酸激酶如 cdk、Plk-1、erk 等治疗癌和过度增殖疾病。

发明详述

本发明化合物具有抗血管生成性质。这些抗血管生成性质是由于至少部分抑制血管生成过程必需的蛋白质酪氨酸激酶产生的。因此，这些化合物可以用作对抗这些疾病的活性药物，所述疾病是例如关节炎、动脉粥样硬化、牛皮癣、血管瘤、心肌血管生成、冠状和脑侧突、局部缺血性四肢血管生成、创伤愈合、消化性溃疡、与螺旋杆有关的疾病、病毒引起的血管生成疾病、骨折、Crow-Fukase 综合征（POEMS）、先兆子痫、月经过多、猫抓病引起的发烧、潮红、新血管青光眼和视网膜病如与糖尿病性视网膜病、早熟视网膜病或与年龄相关的黄斑病变性改变有关的疾病。此外，其中一些化合物可用作抗实体瘤、恶性腹水、造血癌（hematopoietic cancers）和过度增殖疾病如 甲状腺增生（特别是格雷夫斯病）和囊肿（如卵巢囊肿特征的多囊性卵巢综合征（多-卵综合征））的活性药物，因为这些疾病需要血管细胞的增殖以供其生长和/或转移。

再者，某些化合物可以用作治疗下述疾病的活性药物：灼伤、慢性肺病、中风、息肉、过敏症、慢性和变应性炎症、延迟型过敏、卵巢过度刺激综合征、与脑肿瘤有关的脑水肿、high-altitude、创伤或氧不足引起的脑或肺水肿、眼和黄斑水肿、腹水和其他其中以血管渗透
性过高、渗漏、渗出液、蛋白质外渗或水肿为疾病表现的疾病。这些化合物还适用于治疗其中蛋白质外渗导致纤维蛋白和细胞外基质沉积、促进基质增殖的疾病(例如瘢痕瘤，纤维变性，肝硬变和脱管综合征)。VEGF 产生增加导致炎性过程加强，例如单核细胞聚集与活化。因此，本发明化合物还适用于治疗炎性疾病如炎性肠疾病(IBD)和节段性回肠炎。

VEGF 是独一无二的，它们是目前仅知的导致血管渗透性过高和水肿形成的一个重要生长因子。实际上，与许多其他生长因子的表达和给药有关的血管渗透性过高和水肿的出现，是由 VEGF 产生介导的。炎性细胞因子刺激 VEGF 产生。氧不足导致在多种组织中 VEGF 的明显上调，因此与梗塞、闭塞、局部缺血、贫血或循环减少有关的情境通常引起 VEGF/VPF 介导的反应。血管渗透性过高、联合水肿，改变的透皮交换和大分子外渗(其中经常伴随有血细胞渗出)可以导致基质过度沉积、异常的间质增殖、纤维变性等。因此，VEGF 介导的渗透性过高对具有这些病因学特征的病症有重要的贡献。

应该看到，上面列出的疾病由涉及 KDR/VEGFR-2 和/or Flt-1/VEGFR-1 酪氨酸激酶的蛋白质酪氨酸激酶活性介导至重要的程度。通过抑制这些酪氨酸激酶的活性，上述疾病的进行得以抑制，因为疾病状况的血管生成或血管渗透性过高成分被严格缩减。某些本发明化合物的作用，通过其对特定酪氨酸激酶的选择性，使得使用低选择性酪氨酸激酶抑制剂出现的副作用减到最小限度。某些本发明化合物还是有效的 FGFR、PDGFR、c-Met 和 IGF-1-R 抑制剂。这些受体激酶可以直接或间接加强各种疾病中的血管生成和过度增殖应答，因而其抑制作用可以阻止疾病进行。

本发明化合物对蛋白激酶具有抑制活性。即，这些化合物通过蛋白激酶调控信号传导。本发明化合物抑制丝氨酸/苏氨酸和酪氨酸激酶类的蛋白激酶。尤其是，这些化合物选择性地抑制 KDR/FLK-1/VEGFR-2 酪氨酸激酶活性。某些本发明化合物还抑制其他酪氨酸激酶如 Flt-1/VEGFR-1、FGFR、PDGFR、IGF-1R、c-Met、Src-亚族的激酶如 Lck、Sak、fyn、yes 等的活性。另外，某些本发明化合物显著抑制在细胞增殖和细胞周期进行中起重要作用的丝氨酸/苏氨酸激酶如 PKC、MAP 激酶、erk、CDKs、Plk-1 或 Raf-1。本发明通式化合物针
对特定蛋白激酶的功效和特异性通常可以通过改变取代基（即 R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆ 和 R₇）的性质、数量和排列和构象限制而变化或最佳化。另外，某些化合物的代谢物也具有显著的蛋白质激酶抑制活性。

当对需要的个体施用本发明化合物时，本发明化合物抑制这些个体的血管渗透性过高和水肿形成。据信这些化合物通过抑制与血管渗透性过高和水肿形成过程有关的 KDR 酪氨酸激酶活性发生作用。KDR 酪氨酸激酶又可称作 FLK-1 酪氨酸激酶、NYK 酪氨酸激酶或 VEGFR-2 酪氨酸激酶。当血管内皮细胞生长因子（VEGF）或另一种活化的配体（例如 VEGF-C、VEGF-D、VEGF-E 或 HIV Tat 蛋白）与血管内皮细胞表面上的 KDR 酪氨酸激酶受体结合时，KDR 酪氨酸激酶被活化。在该 KDR 酪氨酸激酶活化后，血管渗透性过高发生，液体从血液中经血管壁进入间质腔，从而形成水肿区域。血细胞渗出也经常伴有该反应。类似地，过度血管渗透性过高可以打破危象组织和器官（例如肺和肾）中通过内皮的正常分子交换，从而引起大分子外渗和沉积。在对 KDR 刺激的急性应答（据信这促进了随后的血管生成过程）后，延长的 KDR 酪氨酸激酶活性，或者通过阻断活化配体的产生、通过阻断活化配体与 KDR 酪氨酸激酶受体结合、通过阻断受体二聚和磷酸根转移、通过阻断 KDR 酪氨酸激酶活性（抑制酶的磷酸化功能）或者通过某些其他阻断其下游信号传导的机理（D. Mukhopedhyay 等，Cancer Res. 58: 1278-1284 (1998)，该文献结合在本文中作为参考），渗透性过高和有关的外渗、随后的水肿形成和基质沉积以及血管生成反应可以被抑制或最小化。

一组优选的本发明化合物具有抑制 KDR 酪氨酸激酶活性、而不显著抑制 Flt-1 酪氨酸激酶活性（Flt-1 酪氨酸激酶也称作 VEGFR-1 酪氨酸激酶）。KDR 酪氨酸激酶和 Flt-1 酪氨酸激酶分别被与 KDR 酪氨酸激酶受体和与 Flt-1 酪氨酸激酶受体结合的 VEGF 活化。由于 Flt-1 酪氨酸激酶活性在内皮养护和血管功能中可以介导重要的结果，因此该酶活性的抑制可以导致毒性或不利的作用。至少该抑制对于阻断血管生成应答、诱导血管渗透性过高和水肿形成是不必要的，因此对于个体是不经济和没有价值的。某些优选的本发明化合物是独特的，因为它们抑制通过活化配体活化的 VEGF-受体酪氨酸激酶（KDR）活性，而不抑
制其他也被某些活化配体活化的受体酪氨酸激酶，例如 Flt-1。因此，优选的本发明化合物在其酪氨酸激酶抑制活性上具有选择性。

本发明化合物还适用于治疗溃疡—细菌、真菌、莫伦氏溃疡和溃疡性结肠炎。

本发明化合物还适用于治疗其中在病毒感染中出现不希望的血管生成、水肿或间质沉积的疾病，例如单纯性疱疹、带状疱疹、AIDS、parapoxivirus、牛皮癣、卡波济氏肉瘤、原生动物感染和弓形体病、子宫内膜异位、卵巢过度刺激综合征、先兆子痫、月经过多、全身性红斑狼疮、肉样瘤病、滑膜炎、炎性肠疾病、节段性回肠炎、镰刀细胞贫血、莱姆病、类天疱疮、佩吉特氏病、粘滞性过高综合征、Osler-Weber-Rendu 病、慢性炎症、慢性闭合性肺病、气喘、类风湿性关节炎和骨关节炎，以及灼伤、外伤、放射或中风后水肿。

除了视网膜病和黄斑变性之外，本发明化合物还适用于治疗眼病例如眼和黄斑水肿、眼新血管病、巩膜炎、放射状角膜切开术、眼色素层炎、玻璃体炎、近视、眼凹、慢性视网膜剥离、激光术后并发症、结膜炎、眼底黄色斑点病和伊耳斯氏病。

本发明化合物还适用于治疗心血管疾病例如动脉粥样硬化、再狭窄、血管闭合和颈动脉阻塞疾病。

本发明化合物还适用于治疗与癌有关的适应症例如实体瘤、肉瘤(特别是尤因氏肉瘤和骨肉瘤)、成视网膜细胞瘤、横纹肌肉瘤、成神经细胞瘤、造血恶性肿瘤包括白血病和淋巴瘤、肿瘤引起的胸膜或心包积液以及恶性腹水。

本发明化合物还适用于治疗 Crow-Fukase (POEMS)综合征和糖尿病性疾病如青光眼、糖尿病性视网膜病和微血管病。

应该看到，上面列出的疾病由涉及 VEGF 受体（例如 KDR 和 Flt-1）的蛋白质酪氨酸激酶活性介导至重要的程度。通过抑制这些受体酪氨酸激酶的活性，上述疾病的进行得以抑制，因为疾病状况的血管生成成分被严格缩减。本发明化合物的作用，通过其对特定酪氨酸激酶的选择性，使得使用低选择性酪氨酸激酶抑制剂出现的副作用减到最小限度。

另一方面，本发明提供了用作药物，特别是用作蛋白激酶活性，例如酪氨酸激酶活性、丝氨酸激酶活性和苏氨酸激酶活性抑制剂的上
面开始时定义的式 I 化合物 (包括附带条件)。再一方面，本发明提供了上述开始时定义的式 I 化合物 (包括附带条件)在制备用于抑制蛋白激酶活性的药物中的应用。

在本发明中，使用下列定义：

"生理上可接受的盐"是指那些保持了游离碱的生物效力和性质，并且通过与无机酸如盐酸、氢溴酸、硫酸、硝酸、磷酸或有机酸如磷酸、羧酸、有机磷酸、甲磺酸、乙磺酸、对甲苯磺酸、水杨酸、乳酸和酒石酸等反应得到的盐。

"烷基"是指饱和脂肪族烃，包括具有 1-6 个碳原子的直链和支链基团或具有 3-6 个碳原子的环烃。

"烷氧基"是指"O-烷基"，其中"烷基"如上所定义。

药物制剂

本发明化合物可以以其本身或者在药物组合物中对人类患者给药，在药物组合物中该化合物与合适的载体或赋形剂以治疗或改善血管渗透性过缓、水肿和有关疾病的剂量混合。还可以将这些化合物的混合物以单纯的混合物或在合适的经配制的药物组合物中对患者给药。治疗有效剂量进一步是指足以预防或减弱不适当的新血管形成、过度增殖疾病进行，水肿、VEGF 有关的渗透性过缓和或 VEGF 有关的低血压的化合物的量。配制和施用本申请化合物的技术可见于"Remington's Pharmaceutical Sciences," Mack Publishing Co., Easton, PA, 最近的版本。

给药途径

合适的给药途径可以例如包括经口、滴眼、直肠、经粘膜、局部或经肠给药；非肠道给药包括肌内、皮下、髓内注射以及鞘内、心室内直接注射、静脉内、腹膜内、鼻内或眼内注射。

或者，可以局部而非全身施用该化合物，例如将化合物直接注射到水肿部位，通常是以长效制剂或持续释放制剂的形式给药。

再者，可以将药物以靶向药物释放系统给药，例如用内皮细胞特异性抗体包衣的脂质体。
组合物/制剂

本发明药物组合物可以按照本身已知的方式制备，例如通过常规混合、溶解、造粒、制糖衣丸、磨细、乳化、装入胶囊、包栽或冻干方法。

因此，用于本发明的药物组合物可以按照常规方式，使用一种或多种生理上可接受的载体进行配制，载体包括赋形剂和助剂以利于将活性化合物加工成可药用的制剂。适当的制剂取决于所选择的给药途径。

对于注射剂，本发明药物可以在含水溶液、优选在生理相容的缓冲剂如 Hanks'溶液、林格氏溶液或生理盐水缓冲剂中配制。对于经粘膜给药来说，在制剂中使用对渗透屏障适当的渗透剂。该渗透剂通常是本领域已知的。

对于口服给药，可以容易地通过将活性化合物与本领域公知的可药用载体混合对该化合物进行配制。对于由接受治疗的患者经口摄食来说，该载体使得本发明化合物可以配制成片剂、丸剂、糖衣丸、胶囊、液体、凝胶、糖浆、浆液和悬浮液等。口服药物制剂可以通过下述方法获得：将活性化合物与固体赋形剂混合，任选地研磨所得混合物，并根据需要加入合适的助剂后将该混合物造粒，得到片剂或糖衣丸芯。合适的赋形剂尤其是填料例如糖包括乳糖、蔗糖、甘露醇或山梨糖醇；纤维素制剂例如玉米淀粉、小麦淀粉、大米淀粉、土豆淀粉、明胶、黄蓍胶、甲基纤维素、羟丙基甲基纤维素、羧甲基纤维素钠和/和聚乙烯吡咯烷酮(PVP)。如果需要，可以加入崩解剂，例如交联聚乙烯吡咯烷酮，琼脂或藻酸或其盐如藻酸钠。

糖衣丸芯用合适的包衣层包衣。为此，可以使用浓缩糖溶液，其中可以任选地含有阿拉伯胶、滑石、聚乙烯吡咯烷酮、卡波普(carbopol)胶、聚乙二醇和/或二氧化钛、紫胶漆溶液和适宜的有机溶剂或溶剂混合物。可以向片剂或糖衣丸包衣中加入染料或色素以识别或区分不同组合活性化合物剂量的特征。

可以经口服给药的药物制剂包括由明胶制备的推-合式(push-fit)胶囊以及由明胶和增塑剂例如甘油或山梨醇制成的软密封胶囊。推-合式胶囊可以含有与填料如乳糖、粘合剂如淀粉和/或润滑剂如滑石或硬脂酸镁以及任选地与稳定剂混合的活性成分。在软胶囊中，活性化合物
可以溶解或悬浮在合适的液体例如脂肪油、液体石蜡或液体聚乙二醇中。此外可以加入稳定剂。所有口服制剂均应为适于该给药形式的剂量。

对于颊给药来说，该组合物可以是以常规方式配制的片剂或锭剂。

对于通过吸入给药来说，用于本发明的化合物通常以气溶胶喷雾剂的形式由加压包装剂或喷雾器给药，其中使用合适的抛射剂例如二氟甲烷、三氯氟甲烷、二氟四氟乙烷、二氧化碳或其他适宜的气体。对于加压气溶胶来说，剂量单位可以通过装满量以确定释放计量。用于吸入器或吹入器的例如明胶胶囊和药筒可以配制成含有该化合物粉末混合物和适宜粉末基质如乳糖或淀粉的形式。可以将该化合物配制成用于非肠道给药的注射形式，例如浓缩药团(bolus)注射剂或连续输注液。注射剂可以是单位剂型，例如安瓿或多剂量容器，其中含有防腐剂。该组合物可以是在油或水载体中的悬浮液、溶液或乳液，并且可以含有制剂用试剂例如悬浮剂、稳定剂和/或分散剂。

非肠道给药的药物制剂包括水溶液形式的活性化合物水溶液。此外，活性化合物的悬浮液可以制备成适当的含油注射悬浮液。合适的亲脂性溶剂或载体包括脂肪油如芝麻油或合成脂肪酸酯如油酸乙酯或甘油三酯或脂质体。含水注射悬浮液可以含有增加悬浮液粘度的物质，例如羧甲基纤维素钠、山梨醇或蔗糖。任选地，该悬浮液还可以含有合适的稳定剂或增加化合物的稳定性以允许制备高度浓缩溶液的试剂。

或者，活性成分可以是在使用前用合适的载体例如无菌无热原水配制的粉末形式。

该化合物还可以配制成分直肠给药组合物例如栓剂或保留灌肠剂，例如含有常规栓剂基质如可可脂或其他甘油酯。

除了上述制剂之外，该化合物还可以配制成长效制剂。该长效制剂可以通过植入法给药(例如皮下或肌肉植入或通过肌肉注射给药)。因此，例如，该化合物可以与合适的聚合或疏水材料或离子交换树脂一起配制(例如在可接受油中的乳液)，或者配制成不易溶的衍生物例如不易溶的盐。

用于本发明疏水化合物的可药用载体的实例是助溶剂系统，包括
苄醇、非极性表面活性剂、可与水混溶的有机聚合物和水相。该助溶剂系统可以是 VPD 助溶剂系统。VPD 是3% w/v 苄醇、8% w/v 非极性表面活性剂吐温 80 和 65% w/v 聚乙二醇 300 在无水乙醇中配制成所需体积的溶液。该 VPD 助溶剂系统 (VPD: 5W) 由用 5% 葡萄糖水溶液进行 1:1 稀释的 VPD 组成。该助溶剂系统完全溶解疏水的化合物，并且其本身经系统给药产生的毒性很低。当然，只要不破坏其溶解性和毒性特性，助溶剂系统的比例可以有很大的改变。此外，助溶剂组分的特性可以改变：例如可以使用其他低毒、非极性表面活性剂代替吐温 80；聚乙二醇的份数大小可以改变；可以用其他生物相容性聚合物代替聚乙二醇，例如聚乙烯吡咯烷酮；并且可以用其他糖或糖代替葡萄糖。

或者，可以使用供疏水药物化合物用的其他给药系统。脂质体和乳液是公知的疏水药物给药赋形剂和载体。也可以使用某些有机溶剂例如二甲基亚砜，尽管其毒性成本通常更大。此外，该化合物可以使用持续释放系统给药，例如含有治疗剂的固体疏水聚合物的半透基质。各种持续释放材料是已经确定的，并且是本领域专业人员公知的。根据其化学性质，持续释放胶囊释放化合物数周至长达 100 天。根据治疗剂的化学性质和生物稳定性，可以使用稳定蛋白质的其他策略。

药物组合物还可以含有合适的固体或凝胶相载体或赋形剂。所述载体或赋形剂的实例包括但不限于碳酸钙、磷酸钙、各种糖、淀粉、纤维素衍生物、明胶和聚合物如聚乙二醇。

许多本发明的有机分子化合物可以以其与药物相容性抗衡离子的形式使用。可以与许多酸形成药物相容性盐，所述酸包括但不限于盐酸、硫酸、乙酸、乳酸、酒石酸、苹果酸、琥珀酸等。与相应的游离酸相比，盐更易溶于水或其他质子溶剂。

有效剂量

适用于本发明的药物组合物包括其中含有达到其预期目有效量的活性成分的组合物。尤其是，治疗的有效量意味着有效预防现有症状发展或减轻接受治疗者现有症状的量。有效量的确定在本领域专业人员的能力范围内。

对于本发明方法中所用的许多化合物，可以首先由细胞分析估计治疗有效量。例如，可以在细胞和动物模型中制订剂量以达到循环浓
度范围，包括在细胞分析中测定的 IC₅₀ 值（即达到指定蛋白激酶活性半数最大抑制的试验化合物浓度）。在某些情况下，在 3-5%血清白蛋白存在下测定 IC₅₀ 值是适当的，因为该测定接近血浆蛋白对化合物的结合作用。该信息可用于更精确地确定人的有效剂量。此外，在血浆中可达到安全水平的最优选全身给药化合物有效地抑制蛋白激酶在完整细胞中的信号传导。

治疗有效剂量是指导致患者症状改善的化合物的量。该化合物的毒性和治疗效果可以通过标准药学方法在细胞培养物或试验动物中测定，例如测定最大耐受剂量（MTD）和 ED₅₀ 值（50%最大反应的有效剂量）。毒性与治疗效果之间的剂量比是治疗指数，它可以表示为 MTD 与 ED₅₀ 之比。优选治疗指数高的化合物。由这些细胞培养物分析和动物研究得到的数据可用于配制人用剂量范围。该化合物的这些剂量优选落入循环浓度范围，包括小的或无毒性的 ED₅₀ 值。根据使用的剂型和给药途径，该剂量可以在该范围内变化。精确的制剂、给药体积和剂量可以由医师根据患者的状况进行选择。[参见例如 Fingl 等，1975, ”The Pharmacological Basis of Therapeutics”, Ch. 1 pl]。在危象治疗中，可能需要以急性浓缩药团形式或通过输注途径使用 MTD 以实现快速反应。

可以对剂量和时间间隔逐一调节，以使活性物质的血浆水平足以保持激酶调控作用或最小有效浓度（MEC）。每一化合物的 MEC 不同，但是可以由体外数据估计；例如使用上文所述的分析估计达到 50-90%蛋白激酶抑制所需的浓度。达到 MEC 所需的剂量取决于个体特征和给药途径。然而，可以使用 HPLC 分析或生物测定来确定血浆浓度。

给药间隔也可以使用 MEC 值确定。应该采用保持血浆水平高于 MEC 10-90%的时间，优选 30-90%，最优选 50-90%的时间直至达到所需的症状改善的给药方案施用化合物。如果局部给药或选择性摄取，则药物的局部有效浓度可以不与血浆浓度相关。

当然，聚合物给药量取决于接受治疗的对象、患者的体重、病症的严重程度、给药方式和处方医师的判断。

包装

如果需要，该组合物可以以含有一个或多个含活性成分的单位剂
型的包装或分配器装置形式提供。该包装可以例如包括金属或塑料箔，例如泡罩包装。该包装或分配器装置可以附带用药说明。也可以制备含有配制在相容性可用药用载体中的本发明化合物的组合物，将其置于适当的容器中，并贴上治疗所示疾病的标签。

在某些制剂中，将本发明化合物以非常小的颗粒形式使用是有利的，例如通过液能磨获得该小颗粒。

通过下列描述说明本发明化合物在制备药物组合物中的应用。在该描述中，术语"活性化合物"是指任何本发明化合物，但是尤其是指任何在前的一个实施例的最终产物化合物。

a) 胶囊

在胶囊制备中，可以将10重量份的活性化合物与240重量份的乳糖解聚并混合。将该混合物填充到硬凝胶胶囊中，每粒胶囊含有单位剂量或部分单位剂量的活性化合物。

b) 片剂

可以由下列成分制备片剂。

<table>
<thead>
<tr>
<th></th>
<th>重量份</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>活性化合物</td>
<td>10</td>
</tr>
<tr>
<td>乳糖</td>
<td>190</td>
</tr>
<tr>
<td>玉米淀粉</td>
<td>22</td>
</tr>
<tr>
<td>聚乙烯吡咯烷酮</td>
<td>10</td>
</tr>
<tr>
<td>硬脂酸镁</td>
<td>3</td>
</tr>
</tbody>
</table>

将活性化合物、乳糖和一些淀粉解聚、混合，并用聚乙烯吡咯烷酮的乙醇溶液将所得混合物造粒。将干燥的颗粒与硬脂酸镁和剩余的淀粉混合。然后在压片机中将该混合物压制成片，每片含单位剂量或部分单位剂量的活性化合物。

c) 肠溶衣片

可以按照上述(b)的方法制备片剂。可以使用20%乙酸邻苯二甲酸
纤维素和3%邻苯二甲酸二乙酯在乙醇:二氯甲烷(1:1)中的溶液，按照常规方法将片剂包肠溶衣。

d) 株剂

在制备栓剂中，可以将100重量份的活性化合物掺入1300重量份的甘油三酯栓剂基质中，并使该混合物形成栓剂，每粒栓剂含有治疗有效量的活性成分。

如果需要，在本发明的组合物中，活性化合物可以与其他相容的药理活性成分联合。例如，本发明化合物可以与一种或多种附加的药物活性物质组合给药，所述药物活性物质抑制或预防VEGF产生、减弱细胞内对VEGF的应答、阻断细胞内信号传导、抑制血管渗透性过高、减少炎症或抑制或预防水肿形成或新血管形成。本发明化合物可以在附加的药物活性物质之前、之后或同时给药，任何一种给药过程都是适当的。附加的药物活性物质包括但不限于抗水肿类固醇、NSAIDS、ras抑制剂、抗TNF剂、抗IL-1剂、抗组胺药、PAF-拮抗剂、COX-1抑制剂、COX-2抑制剂、NO合酶抑制剂、PKC抑制剂和PI3激酶抑制剂。本发明化合物与附加的药物活性物质累加或协同发生作用。因此，与单独施用每种物质相比，将抑制血管生成、血管渗透性过高和/或抑制水肿形成的物质组合给药可以大大减轻过度增殖疾病、血管生成、血管渗透性过高或水肿的有害作用。在恶性疾病的发生中，预期可以与抗增殖或细胞毒素化疗组合。

本发明还包括式I化合物作为药物的用途。

Src和Syk家族激酶在调节免疫功能中起着关键作用。Src家族目前包括Fyn、Lck、Fgr、Fes、Lyn、Src、Yes、Hck和Blk。目前应该理解，Syk家族只包括Zap和Syk。Janus家族激酶涉及生长因子和原炎性细胞因子信号通过许多受体的传导。尽管Tec家族激酶的成员BTK和ITK在免疫生物学中起着少为人知的作用，但是用抑制剂对其进行调节却证明有治疗益处。激酶RIP、IRAK-1、IRAK-2、NIK、TPL-2/COT、IKK-1和IKK-2涉及关键的原炎性细胞因子TNF和IL-1信号传导途径。由于式I化合物能够抑制这些激酶中的一种或多种，因此它们可以用作用于保持同种移植和治疗自身免疫疾病的免疫调节剂。通过调节T细胞活性或加强炎性过程的能力，这些化合物可用于治疗该自身免疫疾病。
于排斥现象，或者是宿主对实体器官的移植物排斥，或者是骨髓移植物对宿主的排斥，移植物目前有效的免疫抑制剂毒性的限制，并且将得益于治疗指数改进的有效药物。基因靶向试验已证明Src在对骨吸收负有责任的破骨细胞的生物学中起着重要作用。通过其调节Src的能力，式I化合物还可以用于治疗骨质疏松、骨硬化病、佩吉特氏病、肿瘤引起的高钙血和治疗骨转移瘤。

已经证明许多蛋白激酶是原癌基因。染色体断裂(在染色体5的ltk激酶断点)、易位例如带有BCR的Abl基因(Philadelphia染色体)、截断例如c-Kit或EGFR或突变(例如Met)导致失控蛋白产生，将其由原癌基因转化为致癌基因产物。在其他肿瘤中，由自分泌或旁分泌配体/生长因子受体相互作用推进癌形成。许多src-族激酶通常与下游信号传导有关，因而加强了癌形成，并且其本身通过过分表达或突变可以变成致癌基因。通过抑制这些蛋白的蛋白激酶活性，可以使疾病过程中断。血管再狭窄可能涉及FGF和或PDGF促进的平滑肌和内皮细胞增殖。FGFR、PDGFR、IGF1-R和c-Met的体内配体刺激是原血管生成的，并且加强了血管生成依赖性疾病。抑制FGFr、PDGFr、c-Met或IGF1-R激酶活性可以是抑制这些现象有效的策略。因此，抑制正常或异常c-kit、c-met、c-fms、src-族成员、EGFr、erbB2、erbB4、BCR-Ab1、PDGFr、FGFr、IGF1-R和其他受体或胞质酪氨酸激酶在治疗良性和新生物增殖疾病中是有价值的。

在许多病理情况下（例如实体原发癌和转移癌、卡波济氏肉瘤、类风湿性关节炎、由于不适当的眼新血管生成导致的视觉缺失、牛皮癣和动脉粥样硬化），一旦持续血管形成，疾病的进行是偶然的。通常由疾病组织或相关的炎性细胞产生的多肽生长因子及其相应的内皮细胞特异性受体酪氨酸激酶(例如KDR/VEGFR-2、Flt1/VEGFR-1、Tie-2/Tek和Tie)对于刺激内皮细胞生长、迁移、机化、分化和建立必要的新功能脉管系统是重要的。据信，VEGF“血管渗透性因子”在介导血管渗透性过高、VEGFR激酶的VEGF刺激中的活性在以下病症中起着重要作用：肿瘤腹水形成、脑和肺水肿、胸膜和心包渗液积液、延迟型过敏反应、外伤后的组织水肿和器官机能障碍、灼伤、局部缺血、糖尿病并发症、子宫内膜异位、成人呼吸窘迫综合征(ARDS)、心肺搭桥后有关的低血压和渗透性过高、以及眼水肿导致的青光眼或由
于不适当的新血管生成引起的视网膜缺血。除了 VEGF 之外，最近识别的 VEGF-C 和 VEGF-D 以及病毒编码的 VEGF-E 或 HIV-Tat 蛋白还可以通过刺激 VEGFR 激酶引起血管渗透性过高反应。Tie-2 也在选择种群的造血干细胞中表达，其中 Tie-2 在其募集、粘着、调节和分化中起重要作用 (Blood, 4317-4326 (1997)); 该表达种群 Tie-2 可以作为循环血管生成内皮祖代。因此，某些能够阻断内皮细胞特异性激酶的激酶活性的式 I 药物能够抑制涉及这些情境的疾病进行。

式 I 化合物或其盐或含有治疗有效量该化合物或其盐的药物组合物可用于治疗良性和新生物增殖疾病和免疫系统疾病。所述疾病包括自身免疫疾病例如类风湿性关节炎、甲状腺炎、I 型糖尿病、多发性脓硬化、肉样瘤病、炎症性肠疾病、节段性回肠炎、重症肌无力和全身性红斑狼疮、牛皮癣、器官移植排斥 (例如肾排斥、移植物对宿主疾病排斥)、良性和新生生物增殖疾病、人类癌症例如肺、乳腺、胃、膀胱、结肠、胰腺、卵巢、前列腺和直肠癌以及造血恶性肿瘤(白血病和淋巴瘤)、以及涉及不适当血管形成的疾病例如糖尿病性视网膜病、早熟视网膜病、由于与年龄有关的黄斑变性导致的脉络膜新血管形成、和人的婴儿血管瘤。此外，该抑制剂可用于治疗与 VEGF 介导的水肿有关的疾病、腹水、渗漏和渗出物，包括例如黄斑水肿、脑水肿、急性肺损伤和成人呼吸窘迫综合征 (ARDS)。

本发明化合物还适用于预防上述疾病。

本发明另一方面提供了式 I 化合物或其盐在制备治疗哺乳动物，特别是人的血管渗透性过高、血管生成依赖性疾病、增殖疾病和/或免疫系统疾病的药物中的应用。

本发明还提供了治疗血管渗透性过高、不适当的新血管形成、增殖疾病和/或免疫系统疾病的方法，该方法包括将需要的哺乳动物、特别是人施用治疗有效量的式 I 化合物。

化合物抑制这些蛋白激酶的体外效能可以通过下述方法测定。通过试验化合物相对于对照的抑制外原底物 (例如合成肽) 磷酸化的量可以测定化合物的效能 (Z. Songyang 等, Nature. 373: 536-539)。

使用杆状病毒系统产生 KDR 酪氨酸激酶。

使用由 HUVEC 细胞分离的 cDNAs，通过 PCR 产生人 KDR 细胞
内区域编码序列(aa789-1354)。还在该蛋白的 N-末端引入多-His6 序列。将该片段克隆到转染载体 pVL1393 的 Xba 1 和 Not 1 位点。使用 BaculoGold 转染试剂(PharMingen)，通过共转染产生重组杆状病毒(BV)。将重组 BV 噬斑纯化，并通过 Western 分析进行检验。为了纯化蛋白，使 2 x 106/ml SF-9 细胞在 SF-900-II 培养基中生长，并以 0.5 噬斑形成单位/细胞(MOI)感染。在感染后 48 小时收获细胞。

纯化 KDR

通过向 1L 细胞培养物的细胞沉淀物中加入 50 ml Triton X-100 溶
10 胶缓冲剂(20 mM Tris, pH 8.0, 137 mM NaCl, 10%甘油, 1% Triton X-
100, 1mM PMSF, 10μg/ml 抑肽酶, 1μg/ml 亮抑肽酶)，使表达(His)6KDR
(aa789-1354)的 SF-9 细胞溶解。溶胶产物以 19,000 rpm 的转速、在
Sorval SS-34 旋筒中、在 4℃离心 30 分钟。将细胞溶解产物装 5 ml NiCl2
螯合琼脂糖柱，用 50 mM HEPES, pH7.5, 0.3 M NaCl 平衡。用含有 0.25
M 咪唑的相同缓冲剂洗脱 KDR。用 SDS-PAGE 和测量酶活性的
ELISA 分析(下文)对柱分段进行分析。纯化的 KDR 在 25mM HEPES,
15 pH7.5, 25mM NaCl, 5 mM DTT 缓冲剂中交换并在-80℃贮藏。

人 Tie-2 激酶的产生与纯化

使用由人胎盘分离的 cDNAs 模板，通过 PCR 产生人 Tie-2 细胞内
20 区域编码序列(aa775-1124)。在 N-末端引入多-His6 序列，并将该装配
克隆到转染载体 pVL1939 的 Xba 1 和 Not 1 位点。使用 BaculoGold 转
染试剂(PharMingen)，通过共转染产生重组 BV。将重组 BV 噬斑纯化，
并通过 Western 分析进行检验。为了纯化蛋白，使 2 x 106/ml SF-9 细
胞在 SF-900-II 培养基中生长，并以 0.5 MOI 感染。按照与对 KDR 所
述类似的方法，纯化筛选中使用的 His-标记的激酶。

人 Flt-1 酪氨酸激酶的产生与纯化

使用杆状病毒表达载体 pVL1393 (Phar Mingen, Los Angeles,
25 CA)。将编码多-His6 的核苷酸序列置于编码整个人 Flt-1 (氨基酸 786-
1338)细胞内激酶区的核苷酸区的 5'端。使用由 HUVEC 细胞分离的
cDNA 文库，通过 PCR 产生编码激酶区的核苷酸序列。组氨酸残基使
得该蛋白按照与 KDR 和 ZAP70 类似的方法进行亲合纯化可行。SF-9 昆虫细胞以 0.5 的多重性感染，并在感染后 48 小时收获。

EGFR 酪氨酸激酶来源

EGFR 购自 Sigma (Cat # E-3641; 500 单位/50 μl)，并且 EGF 配体得自 Oncogene Research Products/Calbiochem (Cat # PF011-100)。

ZAP70 的表达

所用杆状病毒表达载体是 pVL1393 (Pharmingen, Los Angeles, Ca.)。将编码氨基酸 M(H)6 LVPR9S 的核苷序列置于编码整个 ZAP70 (氨基酸 1-619)的区的 5'端。使用由 Jurkat 无限增殖化 T-细胞分离的 cDNA 文库，通过 PCR 产生编码 ZAP70 编码区的核苷酸序列。组氨酸残基使得该蛋白的进行亲合纯化可行 (参见下文)。LVPR9S 桥构成了通过凝血酶蛋白水解裂解的识别序列，使得从酶中除去亲合标记可行。SF-9 昆虫细胞以 0.5 的多重性感染，并在感染后 48 小时收获。

ZAP70 的提取与纯化

在由 20 mM Tris pH 8.0, 137 mM NaCl, 10% 甘油, 1% Triton X-100, 1 mM PMSF, 1μg/ml 咪唑肽酶, 10μg/ml 抑肽酶和 1 mM 原酸钠组成的缓冲液中，将 SF-9 细胞溶解。将可溶性溶酶产物装入螯合琼脂糖 HiTrap 柱 (Pharmacia)，用 50 mM HEPES pH 7.5, 0.3 M NaCl 平衡。融合蛋白用 250 mM 咪唑洗脱。该酶在含有 50 mM HEPES pH 7.5, 50 mM NaCl 和 5 mM DTT 的缓冲液中贮藏。

Lck 来源

Lck 或其短形式的 Lck 可以购买到 (例如购自 Upstate Biotechnology Inc. (Saranac Lake, N. Y) 和 Santa Cruz Biotechnology Inc. (Santa Cruz, Ca.) 或者采用常规方法由已知的天然或重组来源纯化获得。

PTKs 的酶联免疫吸附测定 (ELISA)

采用酶联免疫吸附测定 (ELISA) 测定和测量酪氨酸激酶活性的存在。

采用该公开的方案测定特定的PTK活性。例如，下面提供了优选的进行ELISA实验的方案。采用这些方案测定化合物对其他受体PTK族成员和非受体酪氨酸激酶的活性是本领域专业人员力所能及的。为了测定抑制剂的选择性，在分析中，将浓度约为表观K_\text{m}两倍的通用PTK底物（例如聚（Glu_4 Tyr）随机共聚物，20,000-50,000 MW）与ATP（通常为5μM）一起使用。

使用下列步骤分析本发明化合物对KDR、Flt-1、Flt-4/VEGFR-3、Tie-2、EGFR、FGFR、PDGFR、IGF-1-R、c-Met和ZAP70酪氨酸激酶活性的抑制作用：

缓冲剂和溶液：

PGT聚（Glu, Tyr）4:1
在-20°C贮藏粉末。将粉末溶解在磷酸盐缓冲的盐水（PBS）中，制成50mg/ml的溶液。在-20°C贮藏1ml等分试样。当制备板时，将其在Gibco PBS中稀释至250μg/ml。

反应缓冲剂：100mM Hepes，20mM MgCl_2，4mM MnCl_2，5mM DTT，0.02% BSA，200μM NaVO_4，pH 7.10。

ATP：在-20°C贮藏100mM的等分试样。在水中稀释至20μM

洗涤缓冲剂：含0.1% Tween20的PBS

抗体稀释的缓冲剂：在PBS中的0.1%牛血清白蛋白(BSA)

TMB底物：在临用前将TMB底物与过氧化物溶液按9:1混合或者使用得自Neogen的K-Blue底物。

终止溶液：1M磷酸

步骤

1. 制板：

将PGT溶液（50mg/ml，冷冻的）在PBS中稀释至250μg/ml。向Corning改性的平底高度亲合ELISA板(Corning #25805-96)的每孔中加入125μl。加入125μl PBS至空白孔中。用密封带覆盖，并在37°C
培养过夜。用 250μl 洗涤缓冲剂洗涤 1 次，并在 37℃干燥恒温箱中干燥约 2 小时。将包封的板在密封袋中于 4℃贮藏直至使用。

2. 酪氨酸激酶反应：
-制备 4×浓度的在 20% DMSO 水溶液中的抑制剂溶液。

5 -制备反应缓冲剂
-制备酶溶液，使得所需单位为 50μl，例如对于 KDR，制成 1 ng/μl，在反应中每孔中总计 50ng。在冰上贮藏。
-由 100mM 储液制备 4×ATP 水溶液。在冰上贮藏。
-向每孔中加入 50μl 酶溶液(根据激酶的特定活性，通常为 5-50 ng 酶/孔)
-加入 25μl 4×抑制剂
-加入 25μl 4x ATP 用于抑制剂分析
-在室温培养 10 分钟
-向每孔中加入 50μl 0.05N HCl 以终止反应

10 -洗板
**反应的终浓度：5μM ATP，5% DMSO

3. 抗体结合
-通过两步稀释(100x，然后 200x)，将 1mg/ml PY20-HRP (Pierce) 抗体(磷酸酯酶抗体) 的等分试样在 0.1% BSA 的 PBS 溶液中稀释至 50ng/ml
-向每孔中加入 100μl Ab，在室温培养 1 小时。在 4℃培养 1 小时。
-洗涤 4x 板

4. 颜色反应
-制备 TMB 底物并向每孔中加入 100μl
-在 650nm 监测 OD 值，直至达到 0.6
-用 1M 磷酸终止反应。在平板读数器上振摇。
-立即在 450nm 读取 OD 值

最佳培养时间和酶反应条件随酶制剂略有不同，并且大多靠经验决定。对于 Lck，所用反应缓冲剂是 100 mM MOPS，pH 6.5，4 mM MnCl₂，20 mM MgCl₂，5 mM DTT，0.2% BSA，200 mM NaVO₄。在类似的分析条件下。

式 I 化合物可用于治疗与被式 I 化合物抑制的已经确定，包括上面
未提及的和尚未确定的蛋白酪氨酸激酶有关的疾病。所有本文列举的化合物在 50 微摩尔或更低浓度下显著抑制 KDR 激酶。某些本发明化合物在 50 微摩尔或更低浓度下还显著抑制其他 PTKs 如 lck。

5 Cdc2 来源

人重组酶和分析缓冲剂可以购买到 (New England Biolabs, Beverly, MA, USA) 或者采用常规方法从已知的天然或重组来源纯化获得。

Cdc2 测定

所用方案是使用购买的试剂并进行较少的改变。简单地说，在补充有新鲜的 300 μM ATP (31 μCi/ml) 和终浓度 30 μg/ml 组蛋白 IIIss 的，由 50mM Tris pH 7.5、100mM NaCl、1mM EGTA、2mM DTT、0.01% Brij、5% DMSO 和 10mM MgCl₂ 组成的缓冲剂（商品缓冲剂）中进行该反应。在有或无抑制剂存在下，使含有酶单位的 80μL 体积在 25 °C 进行 20 分钟的反应。通过加入 120μL 10% 乙酸使该反应终止。通过将该混合物点在磷酸纤维素纸上，然后用 75mM 磷酸洗涤 3 次，每次洗涤 5 分钟，将底物与未结合的标记分离。在液体闪烁剂存在下，用 β 计数器计数。

某些本发明化合物在低于 50 μM 的浓度显著抑制 cdc2。

20 PKC 激酶来源

催化亚单位 PKC 可以购买到 (Calbiochem)。

PKC 激酶测定

按照公开的方法使用放射活性激酶测定法 (Yasuda, I., Kirshimoto, A., Tanaka, S., Tominaga, M., Sakurai, A., Nishizuka, Y. Biochemical and Biophysical Research Communication 3: 166,1220-1227 (1990))。简单地说，所有反应均在由 50 mM Tris HCl pH7.5、10mM MgCl₂、2mM DTT、1mM EGTA、100 μM ATP、8 μM 肽、5% DMSO 和 ³³P ATP (8Ci/mL) 组成的激酶缓冲剂中进行。将化合物和酶在反应容器中混合，并通过加入 ATP 和底物混合物使反应开始。通过加入 10 μL 终止缓冲剂（在 75mM 磷酸中的 5 mM ATP）终止反应后，将一部分该混合物
点在磷酸纤维素滤纸上。印迹的样品在室温用 75 mM 磷酸洗涤 3 次，
每次洗涤 5 - 15 分钟。通过液体闪烁计数法对放射标记结合进行定量。

Erk2 酶来源

重组鼠酶和分析缓冲剂可以购买到(New England Biolabs, Beverly
MA. USA) 或者可以采用常规方法从已知的天然或重组来源纯化获得。

Erk2 酶测定

简单地说，在供应商建议的条件下，在补充有新鲜的 100 μM ATP
(31 μCi/ml) 和 30 μM 钾磷酸盐碱性蛋白的，由 50 mM Tris pH 7.5、1mM
EGTA、2mM DTT、0.01% Brij、5% DMSO 和 10 mM MgCl₂ 组成的
缓冲剂(商品缓冲剂)中进行该反应。反应体积和结合放射活性的测定方
法如上对 PKC 测定所述(参见上文)。

15 T-细胞活化的体外模型

一旦被促细胞分裂剂或抗原活化，将 T-细胞引入以分泌 IL-2 - 一
种支持其随后增殖期的生长因子。由此，可以测量 IL-2 的产生或初期
T-细胞或适当 T-细胞系的细胞增殖作为 T-细胞活化替代物。所有这些
测定均在文献中有所描述，并且完全引证了其参数 (in Current
Protocols in Immunology, Vol 2,7.10.1-7.11.2)。

简单地说，通过与同种异型刺激器细胞一同培养，可以使 T-细胞
活化，这是被称作单向混合淋巴细胞反应的方法。按照制造商的指导，
通过 Ficoll-Hypaque 梯度 (Pharmacia)，纯化效应器和刺激器外周血管
单核细胞。通过用丝裂霉素 C (Sigma) 或 γ 照射法处理使刺激器细胞有
丝分裂灭活。在有或无试验化合物存在下，将效应器和刺激器细胞按
2:1 的比例一同培养。通常在 U 形底微滴板(Costar Scientific)中将 10⁵
效应器与 5 x 10⁴ 刺激器混合并涂板(200 μl 体积)。该细胞在补充有加热
灭活的胎牛血清(Hyclone Laboratories)或得自男性供血者混合人 AB
血清、5 x 10⁻⁵ M 2-硫基乙醇和 0.5% DMSO 的 RPMI 1640 中培养。该
培养物在收获前一天(通常是第 3 天)用 0.5 μCi 的 ³H-胸苷 (Amersham)
进行脉冲。收获培养物(Betaplate harvester, Wallac)，并通过液体闪烁
法(Betaplate, Wallac)估价同位素吸收。
可以使用同样的培养系统，通过测量 IL-2 的产生评价 T-细胞活化。在开始培养的 18-24 小时，除去上清液，并按照制造商的指导，通过 ELISA (R 和 D 系统) 测量 IL-2 浓度。

5 T-细胞活化的体内模型

化合物的体内功效可以在直接测量 T-细胞活化或者证明其为 T-细胞效应器的抑制动物模型中进行检验。通过恒定比例的 T-细胞受体与单克隆抗-CD3 抗体 (Ab) 结合可以促使 T-细胞在体内活化。在该模型中，在放血前 2 小时，给 BALB/c 小鼠腹膜内注射 10μg 抗-CD3 Ab。在注射抗-CD3 Ab 之前 1 小时，预先使动物接受单剂量化合物药物。通过 ELISA 测定原炎性细胞因子干扰素-γ (IFN-γ) 和肿瘤坏死因子-α (TNF-α) 的血清水平，这些因子是 T-细胞活化指示剂。使用类似的模型，在体内用特定抗原如硫虫血清蛋白 (KLH) 引发 T-细胞，继而用同样的抗原耗尽淋巴结细胞进行体外激发。如上所述，测量细胞因子产量以评估培养细胞的激活状态。简单地说，在第 0 天，用在完全弗氏佐剂 (CFA) 中乳化的 100 μg KLH 皮下免疫 C57BL/6 小鼠。在免疫前一天预先用化合物对动物进行处理，并且在免疫后第 1、2 和 3 天用化合物对动物进行处理。在第 4 天收获耗尽的淋巴结，并在组织培养基 (补充有加热灭活胎牛血清 (Hyclone Laboratories)、5 x 10^{-5} M 2-硫基乙醇和 0.5% DMSO 的 RPMI 1640) 其中以 6 x 10^6/ml 的浓度对其细胞进行 24-28 小时的培养。然后通过 ELISA，对培养物上清液进行自分泌 T-细胞生长因子白介素-2 (IL-2) 和或 IFN-γ水平的的评估。将有则示化合物进行人体疾病动物模型试验。例如实验性自免疫脑脊髓炎 (EAE) 和胶原诱导的关节炎 (CIA)。模拟人多发性硬化的 EAE 模型在大鼠和小鼠中均有描述 (综述 FASEB J. 5:2560-2566, 1991; murine model: Lab. Invest. 4 (3): 278,1981; rodent model: J. Immunol 146 (4): 1163-8, 1991)。简单地说，用髓磷脂碱性蛋白 (MBP) 或其神经肽衍生物和 CFA 的乳液免疫小鼠或大鼠。通过加入细菌毒素例如百日咳杆菌可以引起急性疾病。通过 T-细胞从 MBP/肽免疫的动物上过继转移，引起复发的/缓解的疾病。

通过用 II 型胶原免疫，可以在 DBA/1 小鼠上引起 CIA (J. Immunol: 142 (7): 2237-2243)。早在抗原激发后 10 天小鼠即出现关节炎迹象，并
且可以在免疫后长达 90 天进行评分。在 EAE 和 CIA 模型中，预防性地或在疾病开始时施用化合物。有效的药物应该减少疾病的严重性和/或发生率。

抑制一种或多种血管生成受体 PTK 和/或蛋白激酶如介导炎性反应的 lck 的本发明化合物可以在这些动物模型中减轻关节炎的严重程度和发生率。


细胞受体 PTK 分析

下列细胞分析用于测定不同的本发明化合物对 KDR/VEGFR2 的活性和作用水平。可以采用本领域公知的技术，按照与其他酪氨酸激酶同源的方案，设计使用特异性配体刺激物的类似受体 PTK 分析。

通过 Western 印迹法测量 VEGF-诱导的在人脐静脉内皮细胞 (HUVEC) 中的 KDR 磷酸化作用：

1. HUVEC 细胞 (来自混合供血者) 购自 Clonetics (San Diego, CA)，并按照制造商的指导进行培养，仅仅使用早期的传代 (3-8 代) 进行该分析。使用完全 EBM 培养基 (Clonetics)，将细胞在 100 mm 培养皿 (组织培养用的 Falcon; Becton Dickinson; Plymouth, England) 中培养。

2. 为了评价化合物的抑制活性，将胰蛋白酶作用于细胞，并将细胞以 0.5-1.0 x 10^5 细胞/孔的量接种在 6 孔板 (Costar; Cambridge, MA) 的每一孔中。

3. 接种 3-4 天后，该板达到 90-100% 融合。从所有孔中移出培养基，用 5-10 ml PBS 洗涤细胞，并用无添加物 (即无血清) 的 5ml EBM 基础培养基培养 18-24 小时。
4. 向1ml EBM培养基(25μM、5μM或1μM细胞终浓度)中加入系列稀释的抑制剂，并在37℃培养1小时。然后向所有孔中加入在2ml EBM培养基中，终浓度为50ng/ml的人重组VEGF165(R&D Systems),并在37℃培养10分钟。未处理或者仅用VEGF处理的对照细胞用于评价背景磷酸化作用和由VEGF引起的磷酸化作用。然后用含有1mM原尿酸钠(Sigma)的5-10ml冷水的PBS淋洗所有孔，使细胞溶解，并在含有蛋白酶抑制剂(PMSF 1mM、抑肽酶1μg/ml、胃酶抑制素1μg/ml、壳抑肽酶1μg/ml、氨基酸1mM、氯化钠1mM)和1μg/ml Dnase的200μl RIPA缓冲液(50mM Tris-HCl pH7、150mM NaCl、1%NP-40、0.25%脱氧胆酸钠、1mM EDTA)中捣碎(所有化学品均得自Sigma Chemical Company, St Louis, MO)。所有产物以14,000 rpm的转速旋转以除去核。

然后通过加入冷(-20℃)乙醇(2倍体积)最少1小时或最多过夜，使等量的蛋白沉淀。沉淀物在含有5%巯基乙醇的Laemli样品缓冲液(BioRad; Hercules, CA)中重新配制，并于5分钟。通过聚丙烯酰胺凝胶电泳(6%，1.5mm Novex, San Deigo, CA)解析蛋白，并使用Novex系统将其转移到硝酸纤维素膜上。用牛血清白蛋白(3%)封闭后，该蛋白在4℃用抗-KDR多克隆抗体(C20, Santa Cruz Biotechnology; Santa Cruz, CA)或者用抗磷酸酶氨酸单克隆抗体(4G10, Upstate Biotechnology, Lake Placid, NY)探针过夜。洗涤并用HRP-共轭的F(ab)_2山羊抗-兔或山羊抗-小鼠IgG培养1小时后，使用发射化学发光(ECL)系统(Amersham Life Sciences, Arlington Height, IL)目测检验谱带。某些本发明的实例在小于50 μM的浓度显著抑制了细胞VEGF诱导的KDR酪氨酸激酶磷酸化。

体内子宫水肿模型

该分析测量了化合物在小鼠中抑制子宫重量急性增加的能力，小鼠子宫重量急性增加发生在用雌激素刺激后的头几个小时内。这种早期发生的子宫重量增加已知是由于子宫脉管系统透过性增加引起的水肿造成的。Cullinan-Bove和Koss(Endocrinology (1993), 133: 829-837)证明了雌激素刺激的子宫水肿与子宫中VEGF mRNA表达增加的亲密的暂时关系。这些结果已经通过使用中和VEGF的单克隆抗体得以证
实，而中和 VEGF 的单克隆抗体明显减少了雌激素刺激后子宫重量的急性增加(WO 97/42187)。因此，该系统可以用作体内抑制 VEGF 信号传递以及相关的渗透性过高的水肿模型。

材料：所有激素均以冻干粉末的形式购自 Sigma (St. Louis, MO) 或 Cal Biochem (La Jolla, CA) 并按照供应商的说明制备。

载体组分(DMSO, Cremaphor EL)购自 Sigma (St. Louis, MO)。

小鼠(Balb/c, 8-12 周龄)购自 Taconic (Germantown, NY), 并按照公共的动物保护与使用委员会指南(Animal Care and Use Committee Guidelines)将其饲养在无病原体的动物饲养设施中。

方法：

第 1 天：给 Balb/c 小鼠腹膜内(i.p.)注射 12.5 单位怀孕母马的血清促性腺激素(PMSG)。

第 3 天：小鼠腹膜内接受 15 单位的人绒毛膜的促性腺激素(hCG)。

第 4 天：将小鼠随机分成 5-10 只一组。根据溶解度和载体，通过腹膜内或静脉内或口服途径施用 1-100 mg/kg 的试验化合物。载体对照组只接受载体，并且有两组不做处理。

30 分钟后，对实验组、载体组和 1 个未处理组动物腹膜内注射 17-雌二醇 (500 μg/kg)。2-3 小时后，通过吸入 CO₂ 处死动物。沿中线切开，分离每只子宫，并在子宫颈下和子宫与输卵管的接合处切除。小心而不破坏子宫完整性地除去脂肪和结缔组织，然后称重(湿重)。通过将子宫在两张滤纸之间用一只装满水的 1 升玻璃瓶压榨，吸干子宫的液体。吸干后再对子宫称重(吸干后重量)。吸干与吸干后重量的差别为子宫的液体含量。将处理组的平均液体含量与未处理组或载体处理组进行比较。通过学生试验(Student's test)测定显著性。未刺激的对照组用于监测雌二醇反应。

结果表明，当通过各种途径系统给药时，某些本发明化合物抑制水肿形成。

抑制一种或多种癌基因、原癌基因或增殖依赖性蛋白激酶或血管生成受体 PTK 的某些本发明化合物还抑制原发小鼠、大鼠或人的异种皮移植肿瘤在小鼠中的生长或者抑制其在小鼠模型中的转移。

示例

通过碱催化羟醛缩合，然后进行消除反应合成本发明化合物的核心结构。反应方案 I 是该反应的一般表示。按照一般反应方案 I 合成本发明通式 IV 化合物的合适的原料 II 和 III 是可以买到的和或可以按照本领域公知的方法制备和或按照本文所述方法制备。

反应方案 I: 4-[(取代的)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮的一般合成方法。

1. 4-[(吡咯-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮 (V)。
实施例 1：3-环丙基-4-{[4,5-二甲基吲哚-2-基]亚甲基}-2-吲哚啉-5-酮。

将3-环丙基-2-吲哚啉-5-酮（790 mg, 6.3 mmol）、4,5-二甲基吲哚-2-甲醛（800 mg, 6.5 mmol）和100 mg 咪啶在50 mL 乙醇中的反应混合物在90℃搅拌3.5小时。减压除去溶剂。固体残余物经闪式柱色谱纯化，使用（3：7）乙酸乙酯：乙烷作流动相，然后通过从甲苯中重结晶进一步纯化。

实施例 40：3-叔丁基吲哚-4-{[吲哚-2-基]亚甲基}-2-吲哚啉-5-酮。

将3-氨基-4-{[吲哚-2-基]亚甲基}-2-吲哚啉-5-酮（1.7 mmol）和异氧酸叔丁酯（1 mL）在5 mL 乙酸乙酯中的反应混合物在80℃搅拌2小时。过滤收集产物并从乙醇中重结晶。

实施例 88：4-{[4-(2-二甲氨基乙氧基基)-3,5-二甲基吲哚-2-基]亚甲基}-3-异丙氧基-2-吲哚啉-5-酮。

将4-{[4-羧基-3,5-二甲基吲哚-2-基]亚甲基}-3 异丙氧基-2-吲哚啉-5-酮（200 mg, 0.68 mmol）在二氯甲烷（20 ml）和1 滴 DMF 中的混合物用草酰氯（0.2 ml）处理。继续搅拌24小时，并加入二甲氨基乙醇（0.6g, 6.7 mmol）在二氯甲烷（5 ml）中的溶液。继续搅拌24小时。蒸发溶剂至干，固体残余物用NaHCO₃（5%）处理并用二氯甲烷萃取。除去溶剂后得到的固体从正庚烷中重结晶。

实施例 194：4-{[4-(2-二甲氨基乙基)-3,5-二甲基吲哚-2-基]亚甲基}-3-吲哚嗪基-2-吲哚啉-5-酮 N-氧化物。

将实施例 176（0.2 g, 0.54 mmol）和间氯过苯甲酸（0.2 g, 1.1 mmol）在氯仿（50 ml）中的混合物在室温搅拌48小时。除去溶剂至干，残余物经闪式柱色谱纯化（二氯甲烷/乙醇 9: 1），产率30%，熔点192℃（乙醇）。
<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>环 A 上的取代基</th>
<th>R^1</th>
<th>重结晶溶剂</th>
<th>产率 %</th>
<th>方法</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>1</td>
<td>4,5-二甲基基</td>
<td>环丙基</td>
<td>甲苯</td>
<td>30</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>2</td>
<td>无</td>
<td>甲苯基</td>
<td>甲苯；庚烷</td>
<td>64</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>3</td>
<td>无</td>
<td>4-甲氧基苯并氧基甲基</td>
<td>甲醇</td>
<td>36</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>4</td>
<td>无</td>
<td>苯氧基甲基</td>
<td>NA</td>
<td>33</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>5</td>
<td>无</td>
<td>4-氯苯氧基甲基</td>
<td>乙醇</td>
<td>33</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>6</td>
<td>无</td>
<td>4-甲氧基苄基</td>
<td>乙醇</td>
<td>21</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>7</td>
<td>4-(2-氟乙基)-3-甲基</td>
<td>甲苯基</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 1</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>8</td>
<td>3-(2-氟乙基)-4-甲基</td>
<td>甲苯基</td>
<td>异丙醇</td>
<td>见实施例 1</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>9</td>
<td>无</td>
<td>4-甲氧基苯并氧基甲基</td>
<td>甲醇</td>
<td>42</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>10</td>
<td>无</td>
<td>氯基</td>
<td>异丙醇</td>
<td>90</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>11</td>
<td>无</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>异丙醇</td>
<td>52</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>12</td>
<td>无</td>
<td>苯乙基</td>
<td>NA</td>
<td>86</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>13</td>
<td>无</td>
<td>苯氧基</td>
<td>异丙醇</td>
<td>86</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>14</td>
<td>无</td>
<td>4-甲基苄基</td>
<td>甲醇</td>
<td>60</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>15</td>
<td>无</td>
<td>4-甲氧基苯基</td>
<td>甲醇</td>
<td>86</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>16</td>
<td>无</td>
<td>4-甲氧基苯并氧基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>92</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>17</td>
<td>无</td>
<td>4-氯苄基</td>
<td>乙醇</td>
<td>56</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>18</td>
<td>无</td>
<td>4-氯苯基</td>
<td>乙醇</td>
<td>90</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>19</td>
<td>无</td>
<td>3-氯苯氧基甲基</td>
<td>NA</td>
<td>50</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>20</td>
<td>无</td>
<td>咪唑-3-基</td>
<td>乙醇</td>
<td>90</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>21</td>
<td>无</td>
<td>3-甲氧基苄基</td>
<td>甲醇</td>
<td>21</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>22</td>
<td>无</td>
<td>3,4-二甲氧基苄基</td>
<td>乙醇</td>
<td>83</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>23</td>
<td>无</td>
<td>4-乙氧基苯基</td>
<td>乙醇</td>
<td>91</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>24</td>
<td>无</td>
<td>4-苯基苯氧基甲基</td>
<td>甲醇</td>
<td>72</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>25</td>
<td>无</td>
<td>2-苯基丙基</td>
<td>庚烷</td>
<td>10</td>
<td>见实施例 1</td>
</tr>
<tr>
<td>26</td>
<td>无</td>
<td>3-苯基丙基</td>
<td>甲苯:庚烷</td>
<td>60</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>27</td>
<td>无</td>
<td>4-羟基苯乙基</td>
<td>甲醇</td>
<td>76</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>28</td>
<td>3,5-二甲基</td>
<td>苯乙基</td>
<td>甲醇</td>
<td>51</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>29</td>
<td>无</td>
<td>4-甲基苯乙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>53</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>30</td>
<td>3,5-二甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>庚烷</td>
<td>55</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>31</td>
<td>无</td>
<td>乙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>76</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>32</td>
<td>无</td>
<td>4-硝基苯乙基</td>
<td>甲苯</td>
<td>48</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>33</td>
<td>无</td>
<td>4-氯苯氨基</td>
<td>异丙醇</td>
<td>66</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>34</td>
<td>无</td>
<td>4-氯苯乙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>60</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>35</td>
<td>4,5-二甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲醇</td>
<td>55</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>36</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲苯</td>
<td>47</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>37</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙基</td>
<td>苯乙基</td>
<td>庚烷</td>
<td>49</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>38</td>
<td>1-(4-羟基丁基)</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>NA</td>
<td>80</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>39</td>
<td>无</td>
<td>环戊氧基</td>
<td>甲醇</td>
<td>75</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>40</td>
<td>无</td>
<td>丙丁基醚基</td>
<td>乙醇</td>
<td>87</td>
<td>见实施例40</td>
</tr>
<tr>
<td>41</td>
<td>4-甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲苯</td>
<td>34</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>42</td>
<td>4-甲基</td>
<td>4-氯基苯乙基</td>
<td>NA</td>
<td>27</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>43</td>
<td>1-甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲苯</td>
<td>55</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>44</td>
<td>5-甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲醇:水</td>
<td>30</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>45</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙基</td>
<td>4-氯基苯乙基</td>
<td>甲苯</td>
<td>50</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>46</td>
<td>5-甲基</td>
<td>乙氧基</td>
<td>甲醇</td>
<td>58</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>47</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙基</td>
<td>4-氯基甲酰基苯乙基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>82</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>48</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙基</td>
<td>4-甲氧基苯乙基</td>
<td>甲醇</td>
<td>70</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>49</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>81</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>50</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙基</td>
<td>4-氯基苯乙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>62</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>51</td>
<td>5-乙基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>庚烷</td>
<td>48</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>52</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙基</td>
<td>4-羟基苯乙基</td>
<td>异丙醇</td>
<td>35</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>序号</td>
<td>无</td>
<td>4-乙氧亚基苯甲基</td>
<td>乙醇</td>
<td>35</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
</tr>
<tr>
<td>54</td>
<td>无</td>
<td>4-甲氧基苯氨基</td>
<td>乙醇</td>
<td>46</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>55</td>
<td>3-(2-甲基乙基)-4-甲基</td>
<td>异丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>32</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>56</td>
<td>无</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>50</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>57</td>
<td>无</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>65</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>58</td>
<td>无</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>50</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>59</td>
<td>1-(3,5-二氯苯基)</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>30</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>60</td>
<td>无</td>
<td>2,2,3,3-四甲基环丙基</td>
<td>甲苯</td>
<td>55</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>61</td>
<td>3,5-二甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>甲苯</td>
<td>33</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>62</td>
<td>无</td>
<td>环己基</td>
<td>甲苯</td>
<td>66</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>63</td>
<td>无</td>
<td>2-甲基环丙基</td>
<td>己烷</td>
<td>44</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>64</td>
<td>无</td>
<td>苯并噻唑-2-基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>60</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>65</td>
<td>4,5-二甲基</td>
<td>3-吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>35</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>66</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>50</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>67</td>
<td>无</td>
<td>吡啶-2-基</td>
<td>甲醇</td>
<td>88</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>68</td>
<td>4-甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>35</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>69</td>
<td>4-甲基</td>
<td>苯并噻唑-2-基</td>
<td>乙醇</td>
<td>48</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>70</td>
<td>3,5-二甲基</td>
<td>3-吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>24</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>71</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙基</td>
<td>3-吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>51</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>72</td>
<td>5-甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>50</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>73</td>
<td>5-甲基</td>
<td>3-吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>47</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>74</td>
<td>5-乙基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇:水</td>
<td>21</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>75</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙氧基苯</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>83</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>76</td>
<td>5-苯基</td>
<td>异丙基</td>
<td>甲醇</td>
<td>66</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>77</td>
<td>无</td>
<td>丙基</td>
<td>NA</td>
<td>49</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>78</td>
<td>无</td>
<td>甲基</td>
<td>NA</td>
<td>6</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>79</td>
<td>无</td>
<td>4-异丙基苯基</td>
<td>NA</td>
<td>50</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>80</td>
<td>无</td>
<td>3-苯胺基</td>
<td>NA</td>
<td>80</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>序号</td>
<td>基团</td>
<td>溶剂</td>
<td>级别</td>
<td>实施例</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>------</td>
<td>------</td>
<td>------</td>
<td>------</td>
<td>--------</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>81</td>
<td>1-(4-烷基丁基)</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>34</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>82</td>
<td>4-(2-羧乙基)-3-甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>46</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>83</td>
<td>4-羧基-3,5-二甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>NA</td>
<td>41</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>84</td>
<td>4,5-四亚甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>77</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>85</td>
<td>3,4-二甲基-4-吗啉代甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>NA</td>
<td>30</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>86</td>
<td>3,5-二甲基-4-二甲基氨基甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>戊烷</td>
<td>30</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>87</td>
<td>4-乙酰基-3,5-二甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>62</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>88</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基基)</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>戊烷</td>
<td>40</td>
<td>见实施例88</td>
</tr>
<tr>
<td>89</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基基)</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲苯; 戊烷</td>
<td>41</td>
<td>见实施例88</td>
</tr>
<tr>
<td>90</td>
<td>5-乙氧基基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲醇</td>
<td>79</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>91</td>
<td>5-羧基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲苯</td>
<td>83</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>92</td>
<td>无</td>
<td>4-氯苯氨基烷基甲基</td>
<td>DMF/水</td>
<td>50</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>93</td>
<td>5-苯基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>72</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>94</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙基</td>
<td>四氢呋喃-3-基</td>
<td>甲苯</td>
<td>44</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>95</td>
<td>4-羧基-3,5-二甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>69</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>96</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙氧基烷基</td>
<td>3-吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>86</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>97</td>
<td>3,5-二甲基-4-吗啉代甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>NA</td>
<td>34</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>98</td>
<td>3,4-二甲基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲醇</td>
<td>60</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>99</td>
<td>4-(2-羧乙基)-3-甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>甲醇</td>
<td>51</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>100</td>
<td>3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>NA</td>
<td>67</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>101</td>
<td>5-乙氧基基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>91</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>102</td>
<td>4,5-四亚甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>84</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>103</td>
<td>无</td>
<td>2-甲氧基烷基乙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>56</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>序号</td>
<td>基团</td>
<td>乙氧基基</td>
<td>状态</td>
<td>见实施例</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>----</td>
<td>------</td>
<td>---------</td>
<td>------</td>
<td>----------</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>104</td>
<td>无</td>
<td>乙氧基基</td>
<td>NA</td>
<td>40</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>105</td>
<td>无</td>
<td>异丙基基</td>
<td>NA</td>
<td>44</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>106</td>
<td>无</td>
<td>反-2-苯基环丙基</td>
<td>甲苯</td>
<td>46</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>107</td>
<td>无</td>
<td>环己基基</td>
<td>甲苯</td>
<td>32</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>108</td>
<td>4,5-二亚甲基</td>
<td>环丙基氯基</td>
<td>乙醇</td>
<td>50</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>109</td>
<td>5-吗啉代甲基</td>
<td>环丙基基</td>
<td>乙酸乙酯</td>
<td>72</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>110</td>
<td>5-烯基基</td>
<td>环丙基基</td>
<td>乙醇</td>
<td>50</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>111</td>
<td>4-氯基基</td>
<td>乙氧基基</td>
<td>乙醇</td>
<td>88</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>112</td>
<td>4-溴基基</td>
<td>乙氧基基</td>
<td>乙醇</td>
<td>70</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>113</td>
<td>5-氯基基</td>
<td>乙氧基基</td>
<td>NA</td>
<td>37</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>114</td>
<td>4-氯基基</td>
<td>环丙基基</td>
<td>乙醇</td>
<td>42</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>115</td>
<td>4-溴基基</td>
<td>环丙基基</td>
<td>乙醇</td>
<td>50</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>116</td>
<td>4,5-二亚甲基</td>
<td>吡啶基基</td>
<td>乙醇</td>
<td>85</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>117</td>
<td>4,5-二亚甲基</td>
<td>3-吡啶基基</td>
<td>乙醇</td>
<td>84</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>118</td>
<td>4-烯基-3,5-二甲基</td>
<td>吡啶基基</td>
<td>DMF</td>
<td>66</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>119</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基基)</td>
<td>环丙基基</td>
<td>NA</td>
<td>71</td>
<td>见实施例88</td>
</tr>
<tr>
<td>120</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙氧基基)</td>
<td>吡啶基基</td>
<td>NA</td>
<td>20</td>
<td>见实施例88</td>
</tr>
<tr>
<td>121</td>
<td>3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基</td>
<td>吡啶基基</td>
<td>甲苯</td>
<td>76</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>122</td>
<td>3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基马来酸盐</td>
<td>吡啶基基</td>
<td>乙醇</td>
<td>98</td>
<td>由实施例121 的游离碱形成的马来酸盐（见脚注）</td>
</tr>
<tr>
<td>123</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-吗啉代乙氧基烷基)</td>
<td>吡啶基基</td>
<td>甲苯</td>
<td>20</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>124</td>
<td>3,5-二甲基</td>
<td>2-吡啶基基</td>
<td>乙醇</td>
<td>36</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>125</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙基</td>
<td>2-吡啶基基</td>
<td>乙醇</td>
<td>50</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>126</td>
<td>4,5-二亚甲基</td>
<td>2-吡啶基基</td>
<td>乙醇</td>
<td>58</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>127</td>
<td>3,5-二甲基</td>
<td>2-呋喃基基</td>
<td>乙醇</td>
<td>51</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>序号</td>
<td>化合物名称</td>
<td>基团</td>
<td>溶剂</td>
<td>浓度</td>
<td>实例</td>
</tr>
<tr>
<td>------</td>
<td>-------------</td>
<td>------</td>
<td>-----</td>
<td>------</td>
<td>------</td>
</tr>
<tr>
<td>128</td>
<td>3,5-二甲基-4-吗啉代甲基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>NA</td>
<td>28</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>129</td>
<td>3,5-二甲基</td>
<td>2-嘧啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>25</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>130</td>
<td>4-乙氧乙基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>68</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>131</td>
<td>3,5-二甲基-4-三氟乙酰氨基甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>70</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>132</td>
<td>4-氨基甲基-3,5-二甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>30</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>133</td>
<td>3,5-二甲基</td>
<td>苯并噻唑-2-基</td>
<td>乙醇</td>
<td>40</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>134</td>
<td>3,5-二甲基-4-吗啉代甲基</td>
<td>苯并噻唑-2-基</td>
<td>乙醇</td>
<td>40</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>135</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>乙醇</td>
<td>74</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>136</td>
<td>4-乙氧乙基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲苯</td>
<td>26</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>137</td>
<td>4-溴基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲苯</td>
<td>70</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>138</td>
<td>3,5-二甲基-4-二乙醇氨基甲基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>乙醇</td>
<td>50</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>139</td>
<td>3,5-二甲基-4-三氟乙酰氨基甲基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>NA</td>
<td>78</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>140</td>
<td>4-乙氧乙基-3-苯基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>68</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>141</td>
<td>3,5-二甲基-4-(1-吡啶基甲基)</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲苯</td>
<td>23</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>142</td>
<td>3,5-二甲基-4-二甲基甲基</td>
<td>2-呋喃基</td>
<td>甲苯</td>
<td>20</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>143</td>
<td>3,5-二甲基-4-二甲基甲基</td>
<td>2-嘧啶基</td>
<td>甲苯</td>
<td>48</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>144</td>
<td>3,5-二甲基-4-二甲基甲基</td>
<td>3-吡啶基</td>
<td>甲苯</td>
<td>51</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>145</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙氧乙基</td>
<td>苯基</td>
<td>乙醇</td>
<td>89</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>146</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙基</td>
<td>苯基</td>
<td>甲醇</td>
<td>34</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>147</td>
<td>3,4-二(乙氧乙基)</td>
<td>乙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>54</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>序号</td>
<td>原料</td>
<td>试剂</td>
<td>浓度</td>
<td>实施例</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>------</td>
<td>------</td>
<td>------</td>
<td>------</td>
<td>--------</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>148</td>
<td>4-乙氧羰基</td>
<td>乙氧基</td>
<td>甲醇</td>
<td>30</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>149</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙氧羰基</td>
<td>2-(3-吲哚基)乙烯基</td>
<td>乙醇</td>
<td>81</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>150</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙氧羰基</td>
<td>1-甲基-2-苯基乙烯基</td>
<td>乙醇</td>
<td>52</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>151</td>
<td>4-羧基-3,5-二甲基</td>
<td>乙氧基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>81</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>152</td>
<td>5-硝基</td>
<td>乙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>64</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>153</td>
<td>4-硝基</td>
<td>乙氧基</td>
<td>甲苯</td>
<td>95</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>154</td>
<td>4-羧基</td>
<td>乙氧基</td>
<td>NA</td>
<td>40</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>155</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙酰氨基)</td>
<td>乙氧基</td>
<td>庚烷</td>
<td>86</td>
<td>见实施例88</td>
</tr>
<tr>
<td>156</td>
<td>5-氯-3-甲氧羰基-4-甲氧羰基甲基</td>
<td>乙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>46</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>157</td>
<td>3-(2-羧基乙基)-4-甲基</td>
<td>乙氧基</td>
<td>NA</td>
<td>54</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>158</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙氧羰基</td>
<td>乙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>82</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>159</td>
<td>4,5-四亚甲基</td>
<td>乙氧基</td>
<td>庚烷</td>
<td>80</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>160</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙氧羰基</td>
<td>三氟甲基</td>
<td>乙醇</td>
<td>45</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>161</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙氧羰基</td>
<td>5-异唑唑基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>74</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>162</td>
<td>3,5-二甲基-4-乙氧羰基</td>
<td>3-氨基苯基</td>
<td>乙醇</td>
<td>76</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>163</td>
<td>4-吗啉代乙氨基甲基</td>
<td>乙氧基</td>
<td>NA</td>
<td>30</td>
<td>见实施例88</td>
</tr>
<tr>
<td>164</td>
<td>4-乙氧羰基-3-苯基</td>
<td>吡啶基</td>
<td>甲苯</td>
<td>70</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>165</td>
<td>4-(4-甲基-1-哌嗪基甲基)-3,5-二甲基</td>
<td>吡啶基</td>
<td>DMF</td>
<td>58</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>166</td>
<td>4-二乙氧羰基甲基-3,5-二甲基</td>
<td>吡啶基</td>
<td>NA</td>
<td>20</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>167</td>
<td>3,5-二甲基-4-哌啶子基甲基</td>
<td>吡啶基</td>
<td>甲苯</td>
<td>25</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>168</td>
<td>3,5-二甲基-4-哌啶子基甲基</td>
<td>5-异噁唑基</td>
<td>NA</td>
<td>35</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>169</td>
<td>3,5-二甲基-4-二甲基甲基甲基</td>
<td>5-异噁唑基</td>
<td>NA</td>
<td>30</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>170</td>
<td>5-甲基-4-二甲氨基甲基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲苯-庚烷</td>
<td>75</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>171</td>
<td>3,5-二甲基-4-[N-(2-二甲氨基乙基)-N-甲氨基甲基]</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲醇</td>
<td>40</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>172</td>
<td>3-二甲氨基甲基-4,5-二亚甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>NA</td>
<td>30</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>173</td>
<td>3-二甲氨基甲基-4,5-二亚甲基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>NA</td>
<td>30</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>174</td>
<td>3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基马来酸盐</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>90</td>
<td>由实施例100的游离碱形成的马来酸盐（见脚注）</td>
</tr>
<tr>
<td>175</td>
<td>4-(3-氯丙酰基)-3,5-二甲基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲苯</td>
<td>88</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>176</td>
<td>4-(2-二乙氨基乙基)-3,5-二甲基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>乙醇</td>
<td>95</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>177</td>
<td>3,5-二甲基-4-(二甲氨基甲基)</td>
<td>5-甲基-3-异噁唑基</td>
<td>甲苯-庚烷</td>
<td>40</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>178</td>
<td>3,5-二甲基-4-(4-羟基哌啶子基甲基)</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲醇</td>
<td>40</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>179</td>
<td>4-氨基甲基-3,5-二甲基马来酸盐</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲醇</td>
<td>76</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>180</td>
<td>4-(4-苄基哌啶子基甲基)-3,5-二甲基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲苯</td>
<td>80</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>181</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-羟基乙基)</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>NA</td>
<td>80</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>182</td>
<td>3,5-二甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲苯</td>
<td>67</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>183</td>
<td>3,5-二甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]</td>
<td>环丙基</td>
<td>甲苯</td>
<td>20</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>184</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-羟基乙基)</td>
<td>环丙基</td>
<td>NA</td>
<td>23</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>185</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-乙基氨基乙基)</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>NA</td>
<td>35</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>186</td>
<td>4-(3-二氧基丙基)-3,5-二甲基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>乙醇</td>
<td>52</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>187</td>
<td>3,5-二甲基-4-(3-羟基丙基)</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>乙醇</td>
<td>82</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>188</td>
<td>3,5-二甲基-4-二甲基氨基乙酰基盐酸盐</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>乙醇/乙醚</td>
<td>51</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>189</td>
<td>3,5-二甲基-4-二甲基氨基乙酰基</td>
<td>乙氧基</td>
<td>乙醇/乙醚</td>
<td>44</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>190</td>
<td>4-(2-二乙氨基乙基)-3,5-二甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>庚烷</td>
<td>54</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>191</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-二乙氨基乙基)</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲苯</td>
<td>48</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>192</td>
<td>3,5-二甲基-4-(4-羟基丁基)</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲醇</td>
<td>58</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>193</td>
<td>4-(4-二乙氨基丁基)-3,5-二甲基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲苯</td>
<td>60</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>194</td>
<td>4-(2-二乙氨基乙基-N-氧化物)-3,5-二甲基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>乙醇</td>
<td>30</td>
<td>见实施例194</td>
</tr>
<tr>
<td>195</td>
<td>3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基乙酰基)</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>NA</td>
<td>57</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>196</td>
<td>4-二乙氨基乙酰基-3,5-二甲基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>NA</td>
<td>52</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>序号</td>
<td>化合物描述</td>
<td>基体</td>
<td>试剂</td>
<td>浓度</td>
<td>参考文献</td>
</tr>
<tr>
<td>------</td>
<td>------------</td>
<td>------</td>
<td>------</td>
<td>------</td>
<td>-----------</td>
</tr>
<tr>
<td>197</td>
<td>3-异丙基-5-甲基</td>
<td>吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>44</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>198</td>
<td>3,5-二甲基-4-[3-(1-吡啶基丙基)]</td>
<td>吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>30</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>199</td>
<td>4-二甲氨基甲基-3-异丙基-5-甲基</td>
<td>吡啶基</td>
<td>甲苯</td>
<td>40</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>200</td>
<td>4-二甲氨基甲基-3-异丙基-5-甲基</td>
<td>异丙基</td>
<td>甲苯</td>
<td>40</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>201</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-乙氧基乙基)</td>
<td>吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>40</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>202</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-乙氧基乙基)</td>
<td>异丙基</td>
<td>NA</td>
<td>60</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>203</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-环丙基乙基)</td>
<td>吡啶基</td>
<td>甲苯</td>
<td>40</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>204</td>
<td>3,5-二甲基-4-[2-(4-吡啶基甲氧基)乙基]</td>
<td>吡啶基</td>
<td>NA</td>
<td>40</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>205</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-环丙基氨基乙基)</td>
<td>异丙基</td>
<td>甲苯</td>
<td>36</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>206</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-二乙氨基乙基)</td>
<td>2-嘧啶基</td>
<td>甲苯</td>
<td>35</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>207</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-二乙氨基乙基)</td>
<td>2-嘧啶基</td>
<td>甲苯</td>
<td>40</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>208</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-二乙氨基乙基)</td>
<td>2-嘧啶基</td>
<td>甲苯</td>
<td>50</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
<tr>
<td>209</td>
<td>3,5-二甲基-4-(2-二乙氨基乙基)</td>
<td>2-嘧啶基</td>
<td>甲苯</td>
<td>30</td>
<td>见实施例1</td>
</tr>
</tbody>
</table>
### 表 1A: 具有结构式 V 的合成化合物的物理数据。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>Mp (℃)</th>
<th>碳计算值</th>
<th>碳实验值</th>
<th>氮计算值</th>
<th>氮实验值</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>1</td>
<td>220-222</td>
<td>68.10</td>
<td>68.27</td>
<td>6.59</td>
<td>6.61</td>
</tr>
<tr>
<td>2</td>
<td>182-184</td>
<td>71.69</td>
<td>72.00</td>
<td>5.21</td>
<td>5.40</td>
</tr>
<tr>
<td>3</td>
<td>172-180</td>
<td>64.63</td>
<td>64.06</td>
<td>5.08</td>
<td>5.02</td>
</tr>
<tr>
<td>4</td>
<td>163-165</td>
<td>67.40</td>
<td>66.88</td>
<td>4.90</td>
<td>4.88</td>
</tr>
<tr>
<td>5</td>
<td>218-222</td>
<td>59.71</td>
<td>59.87</td>
<td>4.00</td>
<td>4.24</td>
</tr>
<tr>
<td>6</td>
<td>179-180</td>
<td>68.55</td>
<td>68.45</td>
<td>5.03</td>
<td>5.44</td>
</tr>
<tr>
<td>7</td>
<td>270-272</td>
<td>67.64</td>
<td>67.17</td>
<td>5.67</td>
<td>5.82</td>
</tr>
<tr>
<td>8</td>
<td>226-228</td>
<td>66.58</td>
<td>66.10</td>
<td>5.72</td>
<td>5.63</td>
</tr>
<tr>
<td>9</td>
<td>207-210</td>
<td>68.31</td>
<td>68.20</td>
<td>5.37</td>
<td>5.44</td>
</tr>
<tr>
<td>10</td>
<td>265-270</td>
<td>54.53</td>
<td>55.07</td>
<td>4.57</td>
<td>4.47</td>
</tr>
<tr>
<td>11</td>
<td>172-174</td>
<td>60.26</td>
<td>60.37</td>
<td>5.97</td>
<td>5.80</td>
</tr>
<tr>
<td>12</td>
<td>145-147</td>
<td>72.43</td>
<td>72.29</td>
<td>5.69</td>
<td>5.70</td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td>285-287</td>
<td>66.65</td>
<td>66.66</td>
<td>4.79</td>
<td>4.71</td>
</tr>
<tr>
<td>---</td>
<td>---------</td>
<td>-------</td>
<td>-------</td>
<td>------</td>
<td>------</td>
</tr>
<tr>
<td>13</td>
<td>254-255</td>
<td>72.43</td>
<td>72.36</td>
<td>5.69</td>
<td>5.53</td>
</tr>
<tr>
<td>14</td>
<td>255-258</td>
<td>67.65</td>
<td>67.31</td>
<td>5.29</td>
<td>5.12</td>
</tr>
<tr>
<td>15</td>
<td>288-290</td>
<td>63.81</td>
<td>63.90</td>
<td>4.99</td>
<td>4.53</td>
</tr>
<tr>
<td>16</td>
<td>178-180</td>
<td>63.05</td>
<td>63.26</td>
<td>4.23</td>
<td>4.10</td>
</tr>
<tr>
<td>17</td>
<td>245-247</td>
<td>57.74</td>
<td>57.69</td>
<td>3.97</td>
<td>3.81</td>
</tr>
<tr>
<td>18</td>
<td>(0.23 H₂O)*</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>19</td>
<td>165-167</td>
<td>59.71</td>
<td>59.69</td>
<td>4.00</td>
<td>4.05</td>
</tr>
<tr>
<td>20</td>
<td>300-303</td>
<td>69.55</td>
<td>69.67</td>
<td>4.37</td>
<td>4.61</td>
</tr>
<tr>
<td>21</td>
<td>169-171</td>
<td>68.31</td>
<td>68.27</td>
<td>5.37</td>
<td>5.36</td>
</tr>
<tr>
<td>22</td>
<td>164-165</td>
<td>65.58</td>
<td>65.58</td>
<td>5.50</td>
<td>5.63</td>
</tr>
<tr>
<td>23</td>
<td>137-139</td>
<td>69.13</td>
<td>69.15</td>
<td>5.80</td>
<td>5.89</td>
</tr>
<tr>
<td>24</td>
<td>192-194</td>
<td>72.50</td>
<td>72.56</td>
<td>5.07</td>
<td>5.36</td>
</tr>
<tr>
<td>25</td>
<td>(0.23 H₂O)*</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>26</td>
<td>130-131</td>
<td>73.05</td>
<td>73.16</td>
<td>6.13</td>
<td>6.25</td>
</tr>
<tr>
<td>27</td>
<td>169-170</td>
<td>73.09</td>
<td>73.46</td>
<td>6.13</td>
<td>6.32</td>
</tr>
<tr>
<td>28</td>
<td>253-255</td>
<td>68.51</td>
<td>68.48</td>
<td>5.37</td>
<td>5.01</td>
</tr>
<tr>
<td>29</td>
<td>186-187</td>
<td>73.69</td>
<td>73.89</td>
<td>6.52</td>
<td>6.49</td>
</tr>
<tr>
<td>30</td>
<td>153-154</td>
<td>71.09</td>
<td>73.38</td>
<td>6.13</td>
<td>5.95</td>
</tr>
<tr>
<td>31</td>
<td>176-177</td>
<td>63.14</td>
<td>63.20</td>
<td>6.93</td>
<td>6.77</td>
</tr>
<tr>
<td>32</td>
<td>211-213</td>
<td>58.53</td>
<td>58.81</td>
<td>5.40</td>
<td>5.27</td>
</tr>
<tr>
<td>33</td>
<td>224-226</td>
<td>61.92</td>
<td>62.02</td>
<td>4.54</td>
<td>4.75</td>
</tr>
<tr>
<td>34</td>
<td>272-273</td>
<td>62.21</td>
<td>62.45</td>
<td>4.10</td>
<td>4.33</td>
</tr>
<tr>
<td>35</td>
<td>191-194</td>
<td>64.11</td>
<td>64.27</td>
<td>4.71</td>
<td>4.83</td>
</tr>
<tr>
<td>36</td>
<td>195-197</td>
<td>63.14</td>
<td>63.26</td>
<td>6.93</td>
<td>6.75</td>
</tr>
<tr>
<td>37</td>
<td>198-199</td>
<td>65.43</td>
<td>65.59</td>
<td>7.68</td>
<td>7.00</td>
</tr>
<tr>
<td>38</td>
<td>168-170</td>
<td>74.73</td>
<td>74.40</td>
<td>7.21</td>
<td>7.17</td>
</tr>
<tr>
<td>39</td>
<td>138-140</td>
<td>61.84</td>
<td>61.87</td>
<td>7.27</td>
<td>7.17</td>
</tr>
<tr>
<td>40</td>
<td>201-203</td>
<td>63.65</td>
<td>63.65</td>
<td>6.16</td>
<td>6.19</td>
</tr>
<tr>
<td>41</td>
<td>265-268</td>
<td>56.71</td>
<td>57.04</td>
<td>6.22</td>
<td>6.05</td>
</tr>
<tr>
<td>42</td>
<td>215-217</td>
<td>61.78</td>
<td>61.77</td>
<td>6.48</td>
<td>6.40</td>
</tr>
<tr>
<td>43</td>
<td>(0.75 H₂O)*</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>44</td>
<td>192-201</td>
<td>61.78</td>
<td>61.97</td>
<td>6.48</td>
<td>6.36</td>
</tr>
<tr>
<td>45</td>
<td>128-130</td>
<td>61.78</td>
<td>61.42</td>
<td>6.48</td>
<td>6.32</td>
</tr>
<tr>
<td>46</td>
<td>183-185</td>
<td>71.40</td>
<td>71.38</td>
<td>7.19</td>
<td>7.28</td>
</tr>
<tr>
<td>47</td>
<td>197-199</td>
<td>64.35</td>
<td>64.69</td>
<td>7.33</td>
<td>6.96</td>
</tr>
<tr>
<td>48</td>
<td>297-299</td>
<td>69.21</td>
<td>69.68</td>
<td>6.64</td>
<td>6.68</td>
</tr>
<tr>
<td>49</td>
<td>177-179</td>
<td>69.64</td>
<td>69.70</td>
<td>6.64</td>
<td>6.57</td>
</tr>
<tr>
<td>50</td>
<td>226-228</td>
<td>60.18</td>
<td>60.06</td>
<td>6.62</td>
<td>6.46</td>
</tr>
<tr>
<td>51</td>
<td>186-188</td>
<td>66.30</td>
<td>66.20</td>
<td>6.36</td>
<td>6.25</td>
</tr>
<tr>
<td>52</td>
<td>119-121</td>
<td>62.14</td>
<td>63.14</td>
<td>6.93</td>
<td>6.95</td>
</tr>
<tr>
<td>53</td>
<td>260-262</td>
<td>71.19</td>
<td>71.01</td>
<td>6.87</td>
<td>6.96</td>
</tr>
<tr>
<td>54</td>
<td>124-126</td>
<td>58.29</td>
<td>58.49</td>
<td>5.29</td>
<td>5.04</td>
</tr>
<tr>
<td>55</td>
<td>240-242</td>
<td>62.95</td>
<td>62.96</td>
<td>4.97</td>
<td>5.00</td>
</tr>
<tr>
<td>57</td>
<td>158-160</td>
<td>65.65</td>
<td>65.78</td>
<td>5.51</td>
<td>5.50</td>
</tr>
<tr>
<td>58</td>
<td>150-152</td>
<td>66.95</td>
<td>67.09</td>
<td>6.03</td>
<td>5.76</td>
</tr>
<tr>
<td>59</td>
<td>223-224</td>
<td>65.53</td>
<td>65.57</td>
<td>4.23</td>
<td>4.29</td>
</tr>
<tr>
<td>60</td>
<td>183-190</td>
<td>58.97</td>
<td>59.06</td>
<td>3.78</td>
<td>3.92</td>
</tr>
<tr>
<td>61</td>
<td>160-162</td>
<td>70.91</td>
<td>70.28</td>
<td>7.44</td>
<td>7.35</td>
</tr>
<tr>
<td>62</td>
<td>193-195</td>
<td>68.06</td>
<td>68.34</td>
<td>6.59</td>
<td>6.39</td>
</tr>
<tr>
<td>62 (0.2 甲苯)*</td>
<td>127-129</td>
<td>69.82</td>
<td>69.73</td>
<td>6.75</td>
<td>6.64</td>
</tr>
<tr>
<td>----------------</td>
<td>---------</td>
<td>-------</td>
<td>-------</td>
<td>-----</td>
<td>-----</td>
</tr>
<tr>
<td>63</td>
<td>132-133</td>
<td>66.95</td>
<td>67.11</td>
<td>6.08</td>
<td>6.03</td>
</tr>
<tr>
<td>64</td>
<td>340-342</td>
<td>61.20</td>
<td>61.38</td>
<td>3.42</td>
<td>3.70</td>
</tr>
<tr>
<td>65</td>
<td>220(d)</td>
<td>67.65</td>
<td>67.47</td>
<td>5.29</td>
<td>5.30</td>
</tr>
<tr>
<td>66</td>
<td>206-210</td>
<td>70.01</td>
<td>69.65</td>
<td>7.44</td>
<td>7.46</td>
</tr>
<tr>
<td>67</td>
<td>245-247</td>
<td>63.70</td>
<td>63.76</td>
<td>6.45</td>
<td>6.64</td>
</tr>
<tr>
<td>68</td>
<td>212-215</td>
<td>66.95</td>
<td>65.72</td>
<td>6.03</td>
<td>5.63</td>
</tr>
<tr>
<td>69</td>
<td>327-329</td>
<td>60.55</td>
<td>60.90</td>
<td>4.12</td>
<td>4.09</td>
</tr>
<tr>
<td>(0.5 H₂O)*</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>70</td>
<td>235-238</td>
<td>67.65</td>
<td>67.66</td>
<td>5.29</td>
<td>5.40</td>
</tr>
<tr>
<td>71</td>
<td>272-272</td>
<td>69.36</td>
<td>69.41</td>
<td>6.16</td>
<td>6.21</td>
</tr>
<tr>
<td>72</td>
<td>170-172</td>
<td>66.95</td>
<td>67.05</td>
<td>6.08</td>
<td>6.08</td>
</tr>
<tr>
<td>73</td>
<td>210-212</td>
<td>66.65</td>
<td>66.73</td>
<td>4.70</td>
<td>4.82</td>
</tr>
<tr>
<td>74</td>
<td>163-165</td>
<td>68.10</td>
<td>68.15</td>
<td>6.59</td>
<td>6.63</td>
</tr>
<tr>
<td>75</td>
<td>240-242</td>
<td>63.77</td>
<td>63.77</td>
<td>6.35</td>
<td>6.35</td>
</tr>
<tr>
<td>76</td>
<td>212-214</td>
<td>69.14</td>
<td>69.27</td>
<td>5.80</td>
<td>5.88</td>
</tr>
</tbody>
</table>

77-80 ºC和'H NMR以及分离LC/MS数据与指定结构一致
| 81             | 134-136 | 65.91 | 65.60 | 7.00 | 6.99 | 15.37 | 15.03 |
| 82             | 267-269 | 59.01 | 59.12 | 6.27 | 6.22 | 13.76 | 13.66 |
| 83             | 210(d)  | 57.72 | 57.81 | 5.88 | 5.84 | 14.28 | 14.23 |
| 84             | 206-207 | 65.91 | 65.94 | 7.01 | 6.78 | 15.37 | 15.34 |
| 85             | 162-164 | 62.41 | 62.36 | 7.56 | 7.46 | 16.17 | 15.94 |
| 86             | 172-175 | 63.13 | 63.27 | 7.95 | 7.73 | 18.41 | 18.34 |
| 88             | 163-167 | 59.65 | 59.82 | 7.23 | 7.05 | 15.46 | 15.34 |
| 89             | 192-194 | 59.82 | 59.92 | 7.53 | 7.26 | 19.38 | 19.21 |
| 90             | 205-207 | 57.72 | 57.96 | 5.88 | 5.67 | 14.42 | 14.43 |
| 91             | 235-237 | 51.24 | 51.78 | 5.38 | 5.49 | 14.94 | 14.95 |
| 92             | 240-242 | 58.45 | 58.07 | 3.98 | 3.96 | 17.04 | 16.64 |
| 93             | 208-210 | 73.62 | 72.60 | 5.45 | 5.62 | 15.15 | 15.14 |
| 94             | 163-165 | 66.87 | 66.70 | 7.36 | 7.10 | 14.62 | 14.59 |
| 95             | 312(d)  | 61.53 | 61.08 | 5.33 | 5.38 | 15.57 | 15.11 |
| 96             | 247-249 | 63.89 | 64.05 | 5.36 | 5.48 | 16.55 | 16.70 |
| 97             | 175-177 | 63.82 | 65.62 | 7.56 | 7.43 | 17.06 | 16.75 |
| 98             | 245-250 | 62.91 | 63.30 | 4.90 | 5.10 | 26.20 | 26.29 |
| 99             | 290(d)  | 62.70 | 62.66 | 5.96 | 5.83 | 14.62 | 14.47 |
| 100            | 176-178 | 67.10 | 67.21 | 7.74 | 7.49 | 19.56 | 19.53 |
| 101            | 250-152 | 61.52 | 61.73 | 5.53 | 5.46 | 15.37 | 15.40 |
| 102            | 237-239 | 70.56 | 70.62 | 6.71 | 6.61 | 16.46 | 16.52 |
| 103            | 134-136 | 58.29 | 58.71 | 5.29 | 5.44 | 16.99 | 17.03 |
| 104            | 177-179 | 56.64 | 56.65 | 4.73 | 4.56 | 18.01 | 17.56 |
| 105            | 130-122 | 65.01 | 65.12 | 6.44 | 6.44 | 20.67 | 20.59 |
| 106            | 173-175 | 74.42 | 74.20 | 5.60 | 5.77 | 14.46 | 14.77 |
| 107            | 176-178 | 69.11 | 69.21 | 7.04 | 7.08 | 17.27 | 17.24 |
| 109            | 184-186 | 63.98 | 64.21 | 6.71 | 6.69 | 18.65 | 18.74 |
| 110            | 210(d)  | 54.75 | 55.17 | 4.97 | 4.90 | 15.96 | 16.21 |
| 111            | 217-239 | 50.12 | 50.54 | 4.21 | 4.29 | 17.53 | 17.59 |
| 112            | 242-244 | 42.28 | 42.45 | 3.55 | 3.39 | 14.79 | 14.58 |
| 113            | 170-172 | 50.12 | 49.98 | 4.21 | 4.21 | 17.53 | 18.10 |
| 114            | 210(d)  | 56.06 | 56.46 | 4.27 | 4.37 | 17.83 | 17.54 |
| 115            | 210(d)  | 47.16 | 47.69 | 3.59 | 3.85 | 15.00 | 14.57 |

229

<table>
<thead>
<tr>
<th></th>
<th>170</th>
<th>193-195</th>
<th>61.92</th>
<th>62.18</th>
<th>5.85</th>
<th>5.74</th>
<th>27.08</th>
<th>26.80</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>171</td>
<td>205-207</td>
<td>62.56</td>
<td>62.48</td>
<td>7.13</td>
<td>6.73</td>
<td>25.70</td>
<td>25.40</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>172</td>
<td>182-185</td>
<td>69.20</td>
<td>69.21</td>
<td>7.94</td>
<td>7.82</td>
<td>17.93</td>
<td>17.41</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>173</td>
<td>210-212</td>
<td>65.12</td>
<td>64.66</td>
<td>6.33</td>
<td>6.02</td>
<td>23.98</td>
<td>23.50</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>174</td>
<td>199-201</td>
<td>59.68</td>
<td>59.31</td>
<td>6.51</td>
<td>6.37</td>
<td>13.92</td>
<td>14.42</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>175</td>
<td>213(0)</td>
<td>57.92</td>
<td>58.32</td>
<td>4.61</td>
<td>4.82</td>
<td>19.08</td>
<td>19.25</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>176</td>
<td>210-212</td>
<td>65.55</td>
<td>65.24</td>
<td>7.15</td>
<td>7.18</td>
<td>22.93</td>
<td>22.94</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>177</td>
<td>242-244</td>
<td>62.37</td>
<td>61.87</td>
<td>6.47</td>
<td>6.55</td>
<td>21.39</td>
<td>21.06</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>179</td>
<td>205-8</td>
<td>54.15</td>
<td>54.27</td>
<td>5.02</td>
<td>4.97</td>
<td>19.94</td>
<td>19.63</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>180</td>
<td>211-14</td>
<td>70.64</td>
<td>70.56</td>
<td>6.69</td>
<td>7.06</td>
<td>18.30</td>
<td>17.93</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>181</td>
<td>306-8</td>
<td>61.72</td>
<td>61.64</td>
<td>5.30</td>
<td>5.45</td>
<td>22.49</td>
<td>22.41</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>182</td>
<td>190-92</td>
<td>65.36</td>
<td>64.97</td>
<td>6.67</td>
<td>6.55</td>
<td>22.85</td>
<td>23.20</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>183</td>
<td>197-200</td>
<td>69.90</td>
<td>69.87</td>
<td>8.02</td>
<td>8.12</td>
<td>17.16</td>
<td>16.86</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>184</td>
<td>244-46</td>
<td>65.91</td>
<td>65.52</td>
<td>7.00</td>
<td>6.98</td>
<td>15.37</td>
<td>15.05</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>185</td>
<td>192-94</td>
<td>HRMN 和 EM 数据与指定结构一致</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>186</td>
<td>268.10</td>
<td>58.05</td>
<td>58.21</td>
<td>7.88</td>
<td>7.39</td>
<td>19.73</td>
<td>19.47</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>187</td>
<td>273-75</td>
<td>62.75</td>
<td>63.01</td>
<td>5.88</td>
<td>5.76</td>
<td>21.52</td>
<td>21.33</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>188</td>
<td>&gt;200(4)</td>
<td>50.83</td>
<td>51.14</td>
<td>5.88</td>
<td>5.70</td>
<td>19.76</td>
<td>20.10</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>189</td>
<td>198</td>
<td>60.36</td>
<td>59.86</td>
<td>6.97</td>
<td>6.90</td>
<td>17.00</td>
<td>17.36</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>190</td>
<td>193</td>
<td>69.48</td>
<td>69.19</td>
<td>8.59</td>
<td>8.47</td>
<td>17.06</td>
<td>16.74</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>191</td>
<td>216</td>
<td>60.60</td>
<td>60.43</td>
<td>6.71</td>
<td>6.32</td>
<td>23.55</td>
<td>23.14</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>192</td>
<td>222</td>
<td>63.70</td>
<td>63.85</td>
<td>6.24</td>
<td>6.23</td>
<td>20.63</td>
<td>20.53</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>193</td>
<td>184</td>
<td>66.90</td>
<td>66.70</td>
<td>7.66</td>
<td>7.40</td>
<td>21.30</td>
<td>20.85</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>194</td>
<td>192</td>
<td>62.75</td>
<td>62.46</td>
<td>6.79</td>
<td>6.73</td>
<td>21.96</td>
<td>21.64</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>195</td>
<td>220</td>
<td>61.94</td>
<td>61.66</td>
<td>5.93</td>
<td>5.72</td>
<td>21.68</td>
<td>21.54</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>196</td>
<td>199</td>
<td>61.62</td>
<td>61.78</td>
<td>6.41</td>
<td>6.13</td>
<td>21.56</td>
<td>22.06</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>197</td>
<td>244</td>
<td>65.07</td>
<td>65.02</td>
<td>5.80</td>
<td>5.79</td>
<td>23.71</td>
<td>23.99</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>198</td>
<td>202-04</td>
<td>66.64</td>
<td>66.24</td>
<td>6.92</td>
<td>6.99</td>
<td>22.20</td>
<td>22.00</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>199</td>
<td>227</td>
<td>64.75</td>
<td>64.90</td>
<td>6.86</td>
<td>6.99</td>
<td>23.85</td>
<td>23.88</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>200</td>
<td>190-92</td>
<td>68.75</td>
<td>68.86</td>
<td>8.33</td>
<td>8.46</td>
<td>17.82</td>
<td>17.51</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>201</td>
<td>223</td>
<td>58.85</td>
<td>58.96</td>
<td>4.66</td>
<td>4.73</td>
<td>19.06</td>
<td>19.03</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>202</td>
<td>150</td>
<td>66.37</td>
<td>66.46</td>
<td>8.12</td>
<td>7.90</td>
<td>18.21</td>
<td>17.80</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>203</td>
<td>210-218</td>
<td>61.81</td>
<td>63.95</td>
<td>6.42</td>
<td>6.45</td>
<td>23.50</td>
<td>23.12</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>204</td>
<td>203-205</td>
<td>61.23</td>
<td>65.05</td>
<td>5.82</td>
<td>5.84</td>
<td>24.20</td>
<td>23.77</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>205</td>
<td>158-160</td>
<td>67.64</td>
<td>67.93</td>
<td>7.81</td>
<td>7.74</td>
<td>17.53</td>
<td>17.40</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>206</td>
<td>144-145</td>
<td>64.91</td>
<td>64.87</td>
<td>7.19</td>
<td>7.30</td>
<td>22.71</td>
<td>22.53</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>207</td>
<td>218-220</td>
<td>64.91</td>
<td>64.79</td>
<td>7.19</td>
<td>7.00</td>
<td>22.71</td>
<td>22.78</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>208</td>
<td>220</td>
<td>65.55</td>
<td>65.45</td>
<td>7.15</td>
<td>7.13</td>
<td>22.93</td>
<td>22.53</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>209</td>
<td>212-216</td>
<td>65.55</td>
<td>65.49</td>
<td>7.15</td>
<td>7.38</td>
<td>22.93</td>
<td>22.31</td>
<td></td>
</tr>
</tbody>
</table>

* 对于元素分析，所计算的分子量包括指示量的溶剂。

脚注：在室温下通过在乙醇中向浓盐酸中加入马来酸的乙醇溶液，形成马来酸盐，然后冷却，并过滤结晶的产品。
II. 4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮 (VI)。

实施例 210: 3-苯基-4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮。

将 3-苯基-2-吡唑啉-5-酮 (905 mg, 5.2 mmol)、3-吲哚甲醛 (800 mg, 5.6 mmol) 和哌啶 (100 mg) 在乙醇 (50 mL) 中的反应混合物在 90℃搅拌 3 小时。冷却过夜后，过滤收集产物，然后从乙醇中重结晶进行纯化。

表 2: 其他具有结构式 VI 的合成化合物。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>吲哚上的取代基</th>
<th>R¹</th>
<th>重结晶溶剂</th>
<th>产率%</th>
<th>方法</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>210</td>
<td>无</td>
<td>苯基</td>
<td>乙醇</td>
<td>76</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>211</td>
<td>1-(4-烃基丁基)</td>
<td>苯基</td>
<td>甲醇</td>
<td>51</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>212</td>
<td>无</td>
<td>4-甲氧基苯氧基</td>
<td>异丙醇</td>
<td>67</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>213</td>
<td>无</td>
<td>苯氧基甲基</td>
<td>异丙醇</td>
<td>94</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>214</td>
<td>无</td>
<td>4-氯苯氧基甲基</td>
<td>乙醇</td>
<td>65</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>215</td>
<td>无</td>
<td>4-甲氧基苯基</td>
<td>乙醇</td>
<td>90</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>216</td>
<td>无</td>
<td>4-甲基苯氧基甲基</td>
<td>乙醇</td>
<td>93</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>217</td>
<td>无</td>
<td>苯乙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>84</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>218</td>
<td>无</td>
<td>异丙基</td>
<td>甲醇</td>
<td>81</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>219</td>
<td>无</td>
<td>4-甲基苯基</td>
<td>乙醇</td>
<td>95</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>220</td>
<td>无</td>
<td>苯氧基甲基</td>
<td>异丙醇</td>
<td>52</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>221</td>
<td>无</td>
<td>4-甲基苯氧基</td>
<td>甲醇</td>
<td>60</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>222</td>
<td>无</td>
<td>4-甲烷基苯氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>96</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>223</td>
<td>无</td>
<td>4-氯苄基</td>
<td>乙醇</td>
<td>77</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>224</td>
<td>1-(4-羟基丁基)</td>
<td>4-甲氧基苄基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>89</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>225</td>
<td>无</td>
<td>4-氯苯氧基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>86</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>226</td>
<td>无</td>
<td>3-甲氧基苄基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>99</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>227</td>
<td>无</td>
<td>3,4-二甲氧基苄基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>88</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>228</td>
<td>无</td>
<td>4-羟基苄基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>56</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>229</td>
<td>无</td>
<td>3-氯苯氧基甲基</td>
<td>异丙醇</td>
<td>89</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>230</td>
<td>无</td>
<td>吡啶-3-基</td>
<td>甲醇</td>
<td>58</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>231</td>
<td>无</td>
<td>4-甲氧基乙基</td>
<td>异丙醇</td>
<td>88</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>232</td>
<td>无</td>
<td>4-苯基苯氧基甲基</td>
<td>NA</td>
<td>91</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>233</td>
<td>无</td>
<td>2-苯基丙基</td>
<td>甲醇</td>
<td>60</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>234</td>
<td>无</td>
<td>3-苯基丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>76</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>235</td>
<td>无</td>
<td>4-羟基苯乙基</td>
<td>甲醇</td>
<td>51</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>236</td>
<td>无</td>
<td>4-甲基苯乙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>86</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>237</td>
<td>无</td>
<td>乙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>90</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>238</td>
<td>1-(4-羟基丁基)</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲苯:庚烷</td>
<td>43</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>239</td>
<td>1-(4-羟基丁基)</td>
<td>苯乙基</td>
<td>甲醇</td>
<td>80</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>240</td>
<td>无</td>
<td>4-硝基苯乙基</td>
<td>异丙醇</td>
<td>83</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>241</td>
<td>无</td>
<td>丙氧基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>43</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>242</td>
<td>无</td>
<td>4-氟苯氧基</td>
<td>乙酸乙酯</td>
<td>65</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>243</td>
<td>无</td>
<td>4-氨基苯乙基</td>
<td>甲醇:水</td>
<td>74</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>244</td>
<td>2-甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲醇</td>
<td>40</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>245</td>
<td>7-甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>98</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>246</td>
<td>7-甲基</td>
<td>苯乙基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>97</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>247</td>
<td>无</td>
<td>环戊基</td>
<td>乙醇</td>
<td>56</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>248</td>
<td>1-甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>81</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>序号</td>
<td>试剂</td>
<td>基团</td>
<td>试剂</td>
<td>浓度</td>
<td>实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>------</td>
<td>------</td>
<td>------</td>
<td>------</td>
<td>------</td>
<td>--------</td>
</tr>
<tr>
<td>249</td>
<td>无</td>
<td>4-甲氧基苯乙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>77</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>250</td>
<td>1-异丙基</td>
<td>异丙基</td>
<td>甲苯/庚烷</td>
<td>71</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>251</td>
<td>1-甲基</td>
<td>4-羟基苯乙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>50</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>252</td>
<td>无</td>
<td>异丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>76</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>253</td>
<td>无</td>
<td>4-氯苯氨基羧基甲基</td>
<td>DMF/水</td>
<td>40</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>254</td>
<td>无</td>
<td>乙氧基甲基</td>
<td>甲醇</td>
<td>40</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>255</td>
<td>无</td>
<td>4-甲氧基苯氧基羧基甲基</td>
<td>DMF/水</td>
<td>40</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>256</td>
<td>无</td>
<td>环丙基</td>
<td>DMF/水</td>
<td>50</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>257</td>
<td>无</td>
<td>3-吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>50</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>258</td>
<td>无</td>
<td>2-氨基羧基乙基</td>
<td>甲醇</td>
<td>55</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>259</td>
<td>无</td>
<td>环丁基</td>
<td>乙醇</td>
<td>79</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>260</td>
<td>无</td>
<td>2-(二甲氨基羧基)乙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>97</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>261</td>
<td>1-(4-羟基丁基)</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>80</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>262</td>
<td>无</td>
<td>4-吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>91</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>263</td>
<td>无</td>
<td>环戊基</td>
<td>乙醇</td>
<td>75</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>264</td>
<td>无</td>
<td>2,2,3,3-四甲基环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>32</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>265</td>
<td>无</td>
<td>2-甲基环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>34</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>266</td>
<td>1-(4-羟基丁基)</td>
<td>环己基</td>
<td>甲苯</td>
<td>41</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>267</td>
<td>1-(4-羟基丁基)</td>
<td>4-吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>50</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>268</td>
<td>无</td>
<td>苯并噻唑-2-基</td>
<td>乙醇</td>
<td>50</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>269</td>
<td>无</td>
<td>2-吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>67</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>270</td>
<td>无</td>
<td>二甲氨基</td>
<td>乙醇</td>
<td>77</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>271</td>
<td>无</td>
<td>吡啶-2-基</td>
<td>乙醇</td>
<td>83</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>272</td>
<td>无</td>
<td>6-甲氧基苯并噻唑-2-基</td>
<td>乙醇</td>
<td>60</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>序号</td>
<td>基团</td>
<td>组合基团</td>
<td>溶剂</td>
<td>浓度</td>
<td>见实施例</td>
</tr>
<tr>
<td>------</td>
<td>------</td>
<td>----------</td>
<td>------</td>
<td>------</td>
<td>---------</td>
</tr>
<tr>
<td>273</td>
<td>1-甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>76</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>274</td>
<td>7-甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>60</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>275</td>
<td>1-甲基</td>
<td>3-吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>64</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>276</td>
<td>无</td>
<td>丙基</td>
<td>NA</td>
<td>63</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>277</td>
<td>无</td>
<td>甲基</td>
<td>NA</td>
<td>68</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>278</td>
<td>无</td>
<td>三氟甲基</td>
<td>NA</td>
<td>14</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>279</td>
<td>1-(4-羟基-丁基)</td>
<td>氢</td>
<td>NA</td>
<td>62</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>280</td>
<td>1-(4-羟基-丁基)</td>
<td>甲基</td>
<td>NA</td>
<td>36</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>281</td>
<td>1-(4-羟基-丁基)</td>
<td>三氟甲基</td>
<td>NA</td>
<td>7</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>282</td>
<td>1-(4-羟基-丁基)</td>
<td>亚丁基</td>
<td>NA</td>
<td>50</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>283</td>
<td>无</td>
<td>乙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>74</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>284</td>
<td>无</td>
<td>2-甲氧基乙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>79</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>285</td>
<td>无</td>
<td>反-2-苯基-1-环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>92</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>286</td>
<td>1-(4-羟基-丁基)</td>
<td>环丁基</td>
<td>乙醇</td>
<td>26</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>287</td>
<td>6-羧基-1-甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>26</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>288</td>
<td>5-甲氧基-1-甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>75</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>289</td>
<td>1-甲基</td>
<td>吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>82</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>290</td>
<td>1,7-二甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>97</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>291</td>
<td>1-甲基</td>
<td>四氯呋喃-3-基</td>
<td>乙醇</td>
<td>78</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>292</td>
<td>1-甲基</td>
<td>环丙基氨基</td>
<td>乙醇</td>
<td>54</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>293</td>
<td>6-羧基-1-甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>45</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>294</td>
<td>1,7-二甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲醇</td>
<td>53</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>295</td>
<td>5-甲氧基-1-甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>72</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>296</td>
<td>1-甲基</td>
<td>4-氟苯氨基</td>
<td>甲醇</td>
<td>80</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>297</td>
<td>1-甲基</td>
<td>三氟乙酰氧基</td>
<td>甲醇</td>
<td>70</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>298</td>
<td>1-甲基</td>
<td>4-氟苯乙基</td>
<td>甲苯</td>
<td>64</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>299</td>
<td>1-甲基</td>
<td>氯基</td>
<td>乙醇</td>
<td>80</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>300</td>
<td>无</td>
<td>4-氟苯乙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>85</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>301</td>
<td>1-甲基</td>
<td>乙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>80</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
</tr>
<tr>
<td>302</td>
<td>1-甲基</td>
<td>5-异嗯唑基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>83</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>303</td>
<td>1-甲基</td>
<td>丙基丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>92</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>304</td>
<td>6-羟基-1-甲基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>DMF</td>
<td>98</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>305</td>
<td>1-甲基-6-[2-(4-吗啉代)乙基]氨基碳基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>NA</td>
<td>20</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
</tbody>
</table>
表 2A: 具有结构式 VI 的合成化合物的物理数据。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>Mp. (℃)</th>
<th>磷</th>
<th>元素分析</th>
<th>硫</th>
<th>氮</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td>计算值</td>
<td>实测值</td>
<td>计算值</td>
<td>实测值</td>
</tr>
<tr>
<td>210</td>
<td>292-295</td>
<td>75.73</td>
<td>75.74</td>
<td>5.02</td>
<td>5.28</td>
</tr>
<tr>
<td>211</td>
<td>217-220</td>
<td>73.97</td>
<td>73.93</td>
<td>5.20</td>
<td>6.14</td>
</tr>
<tr>
<td>212</td>
<td>266-268</td>
<td>69.35</td>
<td>69.23</td>
<td>4.65</td>
<td>5.05</td>
</tr>
<tr>
<td>213</td>
<td>284-286</td>
<td>71.91</td>
<td>71.86</td>
<td>4.76</td>
<td>4.78</td>
</tr>
<tr>
<td>214</td>
<td>264-267</td>
<td>64.87</td>
<td>64.78</td>
<td>4.01</td>
<td>4.12</td>
</tr>
<tr>
<td>215</td>
<td>265-270</td>
<td>72.49</td>
<td>72.64</td>
<td>5.17</td>
<td>5.21</td>
</tr>
<tr>
<td>216</td>
<td>286-291</td>
<td>72.49</td>
<td>72.52</td>
<td>5.17</td>
<td>5.36</td>
</tr>
<tr>
<td>217</td>
<td>268-270</td>
<td>76.17</td>
<td>76.12</td>
<td>5.43</td>
<td>5.55</td>
</tr>
<tr>
<td>218</td>
<td>263-265</td>
<td>66.90</td>
<td>66.75</td>
<td>5.61</td>
<td>5.46</td>
</tr>
<tr>
<td>219</td>
<td>280-282</td>
<td>76.17</td>
<td>76.34</td>
<td>5.43</td>
<td>5.23</td>
</tr>
<tr>
<td>220</td>
<td>265-267</td>
<td>71.50</td>
<td>71.48</td>
<td>4.66</td>
<td>4.62</td>
</tr>
<tr>
<td>221</td>
<td>255-257</td>
<td>69.11</td>
<td>69.30</td>
<td>5.30</td>
<td>5.07</td>
</tr>
<tr>
<td>222</td>
<td>265-267</td>
<td>68.66</td>
<td>68.65</td>
<td>4.85</td>
<td>4.98</td>
</tr>
<tr>
<td>223</td>
<td>274-277</td>
<td>67.96</td>
<td>67.77</td>
<td>4.20</td>
<td>4.39</td>
</tr>
<tr>
<td>224</td>
<td>204-206</td>
<td>71.44</td>
<td>71.39</td>
<td>6.24</td>
<td>6.14</td>
</tr>
<tr>
<td>225</td>
<td>248-250</td>
<td>64.19</td>
<td>64.01</td>
<td>3.89</td>
<td>4.15</td>
</tr>
<tr>
<td>226</td>
<td>288-290</td>
<td>72.49</td>
<td>72.46</td>
<td>5.17</td>
<td>5.16</td>
</tr>
<tr>
<td>227</td>
<td>282-284</td>
<td>69.79</td>
<td>69.68</td>
<td>5.29</td>
<td>5.29</td>
</tr>
<tr>
<td>228</td>
<td>295-300</td>
<td>71.91</td>
<td>71.20</td>
<td>4.76</td>
<td>4.76</td>
</tr>
<tr>
<td>229</td>
<td>265-268</td>
<td>64.87</td>
<td>64.91</td>
<td>4.01</td>
<td>4.16</td>
</tr>
<tr>
<td>230</td>
<td>288-292</td>
<td>71.91</td>
<td>71.45</td>
<td>4.71</td>
<td>4.69</td>
</tr>
<tr>
<td>231</td>
<td>266-268</td>
<td>73.02</td>
<td>72.78</td>
<td>5.54</td>
<td>5.70</td>
</tr>
<tr>
<td>232</td>
<td>295-296</td>
<td>73.78</td>
<td>73.58</td>
<td>5.07</td>
<td>5.21</td>
</tr>
<tr>
<td>233</td>
<td>253-255</td>
<td>76.57</td>
<td>76.06</td>
<td>5.81</td>
<td>6.09</td>
</tr>
<tr>
<td>234</td>
<td>218-220</td>
<td>76.57</td>
<td>76.52</td>
<td>5.81</td>
<td>5.93</td>
</tr>
<tr>
<td>235</td>
<td>271-275</td>
<td>69.40</td>
<td>69.40</td>
<td>5.82</td>
<td>5.72</td>
</tr>
<tr>
<td>236</td>
<td>244-245</td>
<td>76.57</td>
<td>76.73</td>
<td>5.81</td>
<td>5.72</td>
</tr>
<tr>
<td>237</td>
<td>248-250</td>
<td>65.87</td>
<td>65.94</td>
<td>5.13</td>
<td>5.01</td>
</tr>
<tr>
<td>238</td>
<td>210-212</td>
<td>66.84</td>
<td>66.76</td>
<td>6.79</td>
<td>6.83</td>
</tr>
<tr>
<td>239</td>
<td>205-207</td>
<td>74.39</td>
<td>74.32</td>
<td>6.50</td>
<td>6.58</td>
</tr>
<tr>
<td>240</td>
<td>295-297</td>
<td>66.65</td>
<td>66.65</td>
<td>4.47</td>
<td>4.85</td>
</tr>
<tr>
<td>241</td>
<td>246-247</td>
<td>66.30</td>
<td>66.95</td>
<td>5.61</td>
<td>5.56</td>
</tr>
<tr>
<td>242</td>
<td>251-252</td>
<td>65.28</td>
<td>64.88</td>
<td>4.92</td>
<td>4.91</td>
</tr>
<tr>
<td>243</td>
<td>244-246</td>
<td>72.70</td>
<td>72.45</td>
<td>5.49</td>
<td>5.67</td>
</tr>
<tr>
<td>244</td>
<td>262-264</td>
<td>66.99</td>
<td>66.78</td>
<td>6.22</td>
<td>6.09</td>
</tr>
<tr>
<td>245</td>
<td>254-256</td>
<td>67.82</td>
<td>67.78</td>
<td>6.04</td>
<td>5.76</td>
</tr>
<tr>
<td>246</td>
<td>302-304</td>
<td>76.57</td>
<td>75.96</td>
<td>5.81</td>
<td>5.59</td>
</tr>
<tr>
<td>247</td>
<td>277-279</td>
<td>69.13</td>
<td>68.95</td>
<td>5.80</td>
<td>5.79</td>
</tr>
<tr>
<td>248</td>
<td>239-240</td>
<td>67.82</td>
<td>67.75</td>
<td>6.04</td>
<td>6.10</td>
</tr>
<tr>
<td>249</td>
<td>259-260</td>
<td>70.76</td>
<td>70.62</td>
<td>5.13</td>
<td>5.43</td>
</tr>
<tr>
<td>250</td>
<td>161-163</td>
<td>69.43</td>
<td>69.40</td>
<td>6.75</td>
<td>6.80</td>
</tr>
<tr>
<td>251</td>
<td>255-257</td>
<td>73.64</td>
<td>72.89</td>
<td>5.50</td>
<td>5.72</td>
</tr>
<tr>
<td>252</td>
<td>264-266</td>
<td>71.12</td>
<td>71.17</td>
<td>5.96</td>
<td>5.87</td>
</tr>
<tr>
<td>253</td>
<td>303-307</td>
<td>63.41</td>
<td>63.17</td>
<td>3.99</td>
<td>4.07</td>
</tr>
</tbody>
</table>

说明：第 144/167 页
<p>| | | | | | | | | |</p>
<table>
<thead>
<tr>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>254</td>
<td>235-237</td>
<td>64.63</td>
<td>64.81</td>
<td>5.08</td>
<td>5.04</td>
<td>14.13</td>
<td>14.22</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>255</td>
<td>(0.5 H2O)*</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>256</td>
<td>300-305</td>
<td>71.69</td>
<td>71.39</td>
<td>5.21</td>
<td>5.22</td>
<td>16.72</td>
<td>16.75</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>257</td>
<td>305-307</td>
<td>70.82</td>
<td>70.71</td>
<td>4.36</td>
<td>4.36</td>
<td>19.43</td>
<td>19.50</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>258</td>
<td>280-281</td>
<td>61.58</td>
<td>61.86</td>
<td>5.29</td>
<td>5.44</td>
<td>18.36</td>
<td>18.12</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>259</td>
<td>&gt; 300</td>
<td>72.43</td>
<td>72.30</td>
<td>5.69</td>
<td>5.71</td>
<td>15.84</td>
<td>15.85</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>260</td>
<td>258-260</td>
<td>65.79</td>
<td>65.66</td>
<td>5.84</td>
<td>5.50</td>
<td>18.05</td>
<td>17.82</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>261</td>
<td>215-216</td>
<td>70.56</td>
<td>70.22</td>
<td>6.54</td>
<td>6.45</td>
<td>12.99</td>
<td>12.99</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>262</td>
<td>&gt; 300</td>
<td>70.83</td>
<td>70.76</td>
<td>4.19</td>
<td>4.78</td>
<td>19.43</td>
<td>19.29</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>263</td>
<td>300-304</td>
<td>73.09</td>
<td>72.79</td>
<td>6.13</td>
<td>6.06</td>
<td>15.04</td>
<td>14.98</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>264</td>
<td>296-298</td>
<td>73.16</td>
<td>73.43</td>
<td>6.86</td>
<td>6.89</td>
<td>13.47</td>
<td>13.36</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>265</td>
<td>(0.25 H2O)*</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>266</td>
<td>294-296</td>
<td>72.43</td>
<td>72.57</td>
<td>5.69</td>
<td>5.73</td>
<td>15.84</td>
<td>15.85</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>267</td>
<td>224-227</td>
<td>72.29</td>
<td>72.10</td>
<td>7.44</td>
<td>7.56</td>
<td>11.49</td>
<td>11.54</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>268</td>
<td>&gt; 300</td>
<td>68.27</td>
<td>68.65</td>
<td>5.73</td>
<td>5.91</td>
<td>15.16</td>
<td>15.25</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>269</td>
<td>224-225</td>
<td>66.26</td>
<td>65.96</td>
<td>3.51</td>
<td>3.64</td>
<td>16.27</td>
<td>16.25</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>270</td>
<td>278-280</td>
<td>70.82</td>
<td>71.07</td>
<td>4.19</td>
<td>4.35</td>
<td>19.43</td>
<td>19.53</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>271</td>
<td>258-260</td>
<td>66.12</td>
<td>66.26</td>
<td>5.54</td>
<td>5.50</td>
<td>22.03</td>
<td>21.87</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>272</td>
<td>&gt; 300</td>
<td>69.55</td>
<td>68.91</td>
<td>4.37</td>
<td>4.54</td>
<td>20.28</td>
<td>20.23</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>273</td>
<td>245-247</td>
<td>72.43</td>
<td>72.34</td>
<td>5.69</td>
<td>5.72</td>
<td>15.83</td>
<td>15.78</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>274</td>
<td>286-288</td>
<td>72.73</td>
<td>72.14</td>
<td>5.69</td>
<td>5.91</td>
<td>15.83</td>
<td>15.60</td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>275</td>
<td>230-232</td>
<td>69.44</td>
<td>69.89</td>
<td>4.85</td>
<td>4.84</td>
<td>17.99</td>
<td>18.10</td>
<td></td>
</tr>
</tbody>
</table>

| 276-282 | \(^{13}C\) 和 \(^{1}H\) NMR 以及分析 | LOMS 数据与指定结构一致 |
| 273 | 230(d) | 63.39 | 63.42 | 4.62 | 5.00 | 14.83 | 14.83 |
| 274 | 267-269 | 64.63 | 64.58 | 5.08 | 5.29 | 14.13 | 14.14 |
| 275 | 280-282 | 75.99 | 76.11 | 5.31 | 5.32 | 12.66 | 12.65 |
| 276 | 220-222 | 71.19 | 71.16 | 6.87 | 6.85 | 12.45 | 12.46 |
| 277 | 237-240(d) | 66.00 | 66.00 | 4.88 | 4.85 | 13.58 | 13.43 |
| 278 | 236-238 | 67.09 | 67.48 | 5.96 | 6.00 | 13.80 | 13.76 |
| 279 | 263-265 | 67.31 | 67.58 | 4.32 | 4.48 | 23.09 | 23.31 |
| 280 | 258-260 | 72.15 | 72.33 | 6.22 | 6.06 | 14.85 | 15.11 |
| 281 | 208-210 | 69.13 | 69.18 | 5.80 | 5.85 | 14.23 | 14.25 |
| 282 | 160-164(d) | 68.55 | 68.25 | 5.75 | 5.86 | 19.98 | 19.71 |
| 283 | 330-332 | 62.30 | 62.37 | 5.23 | 5.31 | 12.84 | 12.87 |
| 284 | 245-247 | 68.67 | 68.86 | 6.44 | 6.21 | 14.13 | 14.14 |
| 285 | 238-239 | 65.16 | 65.31 | 6.11 | 6.10 | 13.41 | 13.46 |
| 286 | 218-219 | 67.09 | 66.65 | 4.82 | 4.99 | 16.12 | 16.10 |
| 287 | 252-253 | 53.58 | 53.80 | 3.30 | 3.51 | 16.66 | 16.67 |
| 288 | 192-193 | 74.29 | 74.26 | 5.98 | 5.85 | 15.27 | 15.38 |
| 289 | 246-247 | 63.17 | 63.51 | 5.10 | 5.32 | 22.88 | 22.54 |
5

III. 4-[(吲哚-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮 (VII).

![VII](image)

10

表3：具有结构式VII的合成化合物。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>吩噪上的取代基</th>
<th>R&lt;sup&gt;1&lt;/sup&gt;</th>
<th>重结晶溶剂</th>
<th>产率%</th>
<th>方法</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>306</td>
<td>无</td>
<td>异丙羟基</td>
<td>乙醇</td>
<td>81</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>307</td>
<td>无</td>
<td>4-硝基苯乙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>45</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>308</td>
<td>无</td>
<td>4-氨基苯乙基</td>
<td>NA</td>
<td>20</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>309</td>
<td>无</td>
<td>4-甲氧基苯乙基</td>
<td>甲苯</td>
<td>75</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>310</td>
<td>无</td>
<td>4-氨基甲酰基苯乙基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>90</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>311</td>
<td>无</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>35</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>312</td>
<td>3-二甲氧基甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>NA</td>
<td>20</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>313</td>
<td>无</td>
<td>3-吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>62</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>314</td>
<td>5-甲氧基</td>
<td>异丙氨基</td>
<td>甲醇</td>
<td>78</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>315</td>
<td>1-甲基</td>
<td>异丙氨基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>89</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>316</td>
<td>无</td>
<td>四氢呋喃-3-基</td>
<td>乙酸乙酯</td>
<td>30</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>317</td>
<td>5-甲氧基</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>33</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td>5-硝基</td>
<td>环丙基</td>
<td>DMF</td>
<td>84</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
</tr>
<tr>
<td>319</td>
<td>无</td>
<td>异丙氨基</td>
<td>甲醇</td>
<td>80</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>320</td>
<td>无</td>
<td>4-羧基苯乙基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>65</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>321</td>
<td>无</td>
<td>苯基</td>
<td>乙醇</td>
<td>55</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>322</td>
<td>3-甲基</td>
<td>异丙基</td>
<td>甲醇</td>
<td>76</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>323</td>
<td>3-(2-甲氧基-2-乙酰氨基乙基)</td>
<td>异丙基</td>
<td>甲苯:庚烷</td>
<td>40</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>324</td>
<td>无</td>
<td>乙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>55</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>325</td>
<td>3-(4-吗啉代甲基)</td>
<td>乙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>65</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>326</td>
<td>3-(4-吗啉代甲基)</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙酸乙酯</td>
<td>46</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>327</td>
<td>5-甲氧基</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>NA</td>
<td>91</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>328</td>
<td>5-甲氧基</td>
<td>2-吡啶基</td>
<td>NA</td>
<td>90</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>329</td>
<td>4-氯-6,7-二氢</td>
<td>乙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>54</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>330</td>
<td>4-氯-6,7-二氢</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲苯</td>
<td>83</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>331</td>
<td>4-氧代-1,5,6,7-四氢</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>甲苯</td>
<td>40</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>332</td>
<td>3-二甲氨基甲基</td>
<td>乙氧基</td>
<td>甲苯-庚烷</td>
<td>41</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
</tbody>
</table>
表 3A：具有结构式 VII 的合成化合物的物理数据。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>Mp. (°C)</th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>306</td>
<td>221-223</td>
<td>66.90</td>
<td>67.11</td>
<td>5.61</td>
<td>5.53</td>
<td>15.60</td>
<td>15.68</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>307</td>
<td>242-245</td>
<td>72.49</td>
<td>72.34</td>
<td>5.17</td>
<td>5.15</td>
<td>12.68</td>
<td>12.36</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>308</td>
<td>187-189</td>
<td>72.71</td>
<td>72.99</td>
<td>5.40</td>
<td>5.48</td>
<td>16.96</td>
<td>16.35</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>309</td>
<td>210-212</td>
<td>70.76</td>
<td>70.99</td>
<td>5.13</td>
<td>5.00</td>
<td>11.25</td>
<td>11.11</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>310 (0.25 H₂O)*</td>
<td>263-265</td>
<td>69.44</td>
<td>69.51</td>
<td>5.09</td>
<td>5.05</td>
<td>15.43</td>
<td>15.21</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>311 (0.75 H₂O)*</td>
<td>238-240</td>
<td>68.04</td>
<td>67.68</td>
<td>5.55</td>
<td>5.11</td>
<td>15.87</td>
<td>15.75</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>312 (0.25 H₂O)*</td>
<td>202(d)</td>
<td>69.10</td>
<td>69.13</td>
<td>6.60</td>
<td>5.46</td>
<td>17.91</td>
<td>17.56</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>313 (0.5 H₂O)*</td>
<td>155-157</td>
<td>68.67</td>
<td>68.68</td>
<td>4.40</td>
<td>4.48</td>
<td>18.84</td>
<td>18.56</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>314</td>
<td>219-220</td>
<td>64.20</td>
<td>64.48</td>
<td>5.72</td>
<td>5.76</td>
<td>14.04</td>
<td>14.08</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>315</td>
<td>254-255</td>
<td>67.83</td>
<td>67.89</td>
<td>6.05</td>
<td>6.09</td>
<td>14.83</td>
<td>14.83</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>316</td>
<td>180-183</td>
<td>68.31</td>
<td>68.49</td>
<td>5.37</td>
<td>5.57</td>
<td>14.94</td>
<td>14.80</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>317</td>
<td>221-224</td>
<td>68.31</td>
<td>68.34</td>
<td>5.37</td>
<td>5.35</td>
<td>14.94</td>
<td>14.82</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>318</td>
<td>316-320</td>
<td>60.80</td>
<td>60.70</td>
<td>4.08</td>
<td>4.35</td>
<td>18.91</td>
<td>19.01</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>319</td>
<td>245-247</td>
<td>67.14</td>
<td>67.08</td>
<td>6.01</td>
<td>6.03</td>
<td>20.88</td>
<td>20.94</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>320</td>
<td>&gt;305</td>
<td>70.18</td>
<td>69.87</td>
<td>4.77</td>
<td>4.87</td>
<td>11.69</td>
<td>11.76</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>321</td>
<td>210-211</td>
<td>75.25</td>
<td>75.17</td>
<td>4.56</td>
<td>4.75</td>
<td>14.62</td>
<td>14.62</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>322</td>
<td>241-243</td>
<td>67.83</td>
<td>67.97</td>
<td>6.05</td>
<td>6.05</td>
<td>14.83</td>
<td>14.89</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>323</td>
<td>205-206</td>
<td>61.16</td>
<td>61.51</td>
<td>5.87</td>
<td>5.93</td>
<td>13.58</td>
<td>13.27</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>324</td>
<td>263-267</td>
<td>65.87</td>
<td>65.91</td>
<td>5.13</td>
<td>5.27</td>
<td>16.46</td>
<td>16.52</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>325</td>
<td>205-206</td>
<td>64.39</td>
<td>64.64</td>
<td>6.26</td>
<td>6.35</td>
<td>15.81</td>
<td>15.82</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>326</td>
<td>203-180</td>
<td>68.55</td>
<td>68.53</td>
<td>6.32</td>
<td>6.31</td>
<td>15.99</td>
<td>15.80</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>327</td>
<td>272-274</td>
<td>63.94</td>
<td>64.29</td>
<td>4.10</td>
<td>4.00</td>
<td>21.93</td>
<td>22.10</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>328</td>
<td>170-172</td>
<td>67.91</td>
<td>68.06</td>
<td>4.43</td>
<td>4.43</td>
<td>17.60</td>
<td>17.74</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>329</td>
<td>177-203</td>
<td>57.64</td>
<td>57.87</td>
<td>4.84</td>
<td>4.79</td>
<td>14.40</td>
<td>14.35</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>330 (0.4甲苯)*</td>
<td>206-209</td>
<td>62.27</td>
<td>62.20</td>
<td>4.22</td>
<td>4.47</td>
<td>19.31</td>
<td>19.27</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>331 (0.1甲苯)*</td>
<td>300-303</td>
<td>63.36</td>
<td>63.49</td>
<td>4.36</td>
<td>4.41</td>
<td>22.12</td>
<td>21.96</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>332</td>
<td>185-187</td>
<td>65.37</td>
<td>65.13</td>
<td>6.45</td>
<td>6.35</td>
<td>17.94</td>
<td>17.70</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
</tbody>
</table>

* 对于元素分析，所计算的分子量包括所述量的溶剂。
### 表 4: 具有结构式 VIII 的合成化合物。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>氮杂吲哚上的取代基</th>
<th>R¹</th>
<th>重结晶溶剂</th>
<th>产率%</th>
<th>方法</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>333</td>
<td>无</td>
<td>苄基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>71</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>334</td>
<td>1-(4-羟基丁基)</td>
<td>苄基</td>
<td>乙酸乙酯</td>
<td>30</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>335</td>
<td>无</td>
<td>4-甲氧基苯氧基甲基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>80</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>336</td>
<td>无</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲醇</td>
<td>61</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>337</td>
<td>无</td>
<td>氨基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>92</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>338</td>
<td>无</td>
<td>4-甲氧基苄基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>96</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>339</td>
<td>无</td>
<td>苯氧基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>77</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>340</td>
<td>无</td>
<td>4-甲基苄基</td>
<td>乙醇</td>
<td>95</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>341</td>
<td>无</td>
<td>4-羟基苯乙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>84</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>342</td>
<td>1-(4-羟基丁基)</td>
<td>4-羟基苯乙基</td>
<td>甲醇</td>
<td>80</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>343</td>
<td>无</td>
<td>异丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>30</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>344</td>
<td>无</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>50</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>345</td>
<td>无</td>
<td>环丁基</td>
<td>乙醇</td>
<td>74</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>346</td>
<td>无</td>
<td>3-吡啶基</td>
<td>乙醇</td>
<td>40</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>347</td>
<td>无</td>
<td>苯基</td>
<td>NA</td>
<td>56</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>348</td>
<td>无</td>
<td>4-氯苯氧基</td>
<td>NA</td>
<td>14</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>349</td>
<td>无</td>
<td>丙基</td>
<td>NA</td>
<td>24</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>实施例</td>
<td>Mp (°C)</td>
<td>硝基</td>
<td>4-硝基苯基</td>
<td>3-硝基苯基</td>
<td>1-(4-硝基丁基)</td>
</tr>
<tr>
<td>-------</td>
<td>--------</td>
<td>------</td>
<td>-----------</td>
<td>----------</td>
<td>----------------</td>
</tr>
<tr>
<td>350</td>
<td>无</td>
<td>甲基</td>
<td>NA</td>
<td>NA</td>
<td>77</td>
</tr>
<tr>
<td>351</td>
<td>无</td>
<td>三氟甲基</td>
<td>NA</td>
<td>17</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>352</td>
<td>无</td>
<td>乙基</td>
<td>NA</td>
<td>80</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>353</td>
<td>1-(4-硝基丁基)</td>
<td>三氟甲基</td>
<td>NA</td>
<td>6</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>354</td>
<td>无</td>
<td>4-异丙基苯基</td>
<td>NA</td>
<td>30</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>355</td>
<td>无</td>
<td>3-甲基苯氧基</td>
<td>NA</td>
<td>70</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>356</td>
<td>1-(4-硝基丁基)</td>
<td>3-甲基苯氧基</td>
<td>NA</td>
<td>30</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>357</td>
<td>无</td>
<td>苯乙基</td>
<td>DMF:水</td>
<td>63</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
</tbody>
</table>

表 4A: 具有结构式 VIII 的合成化合物的物理数据。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>Mp (°C)</th>
<th>硝基</th>
<th>4-硝基苯基</th>
<th>3-硝基苯基</th>
<th>1-(4-硝基丁基)</th>
<th>3-硝基苯基</th>
<th>1-(4-硝基丁基)</th>
<th>无</th>
<th>甲基</th>
<th>2H NMR 以及分析</th>
<th>LC/MS 数据与指定结构一致</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>333</td>
<td>274-277</td>
<td>71.50</td>
<td>71.63</td>
<td>4.66</td>
<td>4.88</td>
<td>18.53</td>
<td>18.17</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>334</td>
<td>176-179</td>
<td>70.36</td>
<td>70.67</td>
<td>5.92</td>
<td>5.87</td>
<td>14.96</td>
<td>14.78</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>335</td>
<td>300-302</td>
<td>65.69</td>
<td>65.62</td>
<td>4.35</td>
<td>4.85</td>
<td>16.12</td>
<td>15.77</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>336</td>
<td>258-260</td>
<td>62.21</td>
<td>61.57</td>
<td>5.22</td>
<td>5.12</td>
<td>20.72</td>
<td>20.57</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>337</td>
<td>&gt; 300</td>
<td>53.82</td>
<td>53.92</td>
<td>4.48</td>
<td>4.34</td>
<td>28.54</td>
<td>28.22</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td>(1 H2O)</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>338</td>
<td>273-276</td>
<td>68.66</td>
<td>68.05</td>
<td>4.85</td>
<td>4.89</td>
<td>16.85</td>
<td>16.67</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>339</td>
<td>249-252</td>
<td>63.54</td>
<td>63.45</td>
<td>4.70</td>
<td>4.75</td>
<td>21.79</td>
<td>21.68</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td>(1 H2O)</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>340</td>
<td>&gt; 300</td>
<td>70.07</td>
<td>70.54</td>
<td>5.22</td>
<td>5.07</td>
<td>17.21</td>
<td>17.24</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td>(0.5 H2O)</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>341</td>
<td>270-272</td>
<td>68.66</td>
<td>68.25</td>
<td>4.85</td>
<td>5.04</td>
<td>16.86</td>
<td>16.71</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>342</td>
<td>211-212</td>
<td>68.30</td>
<td>67.97</td>
<td>5.98</td>
<td>6.11</td>
<td>13.85</td>
<td>13.80</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>343</td>
<td>300(d)</td>
<td>66.12</td>
<td>65.91</td>
<td>5.54</td>
<td>5.57</td>
<td>22.03</td>
<td>21.89</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>344</td>
<td>245-246</td>
<td>65.48</td>
<td>65.20</td>
<td>4.90</td>
<td>4.76</td>
<td>21.82</td>
<td>21.47</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td>(0.25 H2O)</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>345</td>
<td>300-302</td>
<td>66.52</td>
<td>66.51</td>
<td>5.39</td>
<td>5.22</td>
<td>20.69</td>
<td>20.88</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>346</td>
<td>212-215</td>
<td>66.50</td>
<td>65.84</td>
<td>3.83</td>
<td>4.07</td>
<td>24.20</td>
<td>23.93</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>347</td>
<td>280-282</td>
<td>70.80</td>
<td>70.50</td>
<td>4.20</td>
<td>4.10</td>
<td>19.40</td>
<td>19.10</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>348-356</td>
<td>13C 和 1H NMR 以及分析</td>
<td>LC/MS 数据与指定结构一致</td>
<td>357</td>
<td>317-319</td>
<td>72.13</td>
<td>71.69</td>
<td>5.09</td>
<td>5.04</td>
<td>17.70</td>
<td>17.65</td>
<td></td>
</tr>
</tbody>
</table>

* 对于元素分析，所计算的分子量包括所示量的溶剂。

脚注：在室温下通过在乙醇中向偏禹盐中加入马来酸的乙醇溶液，形成马来酸

盐，然后冷却，并过滤结晶的产品。
V. 4-(苯基亚甲基)-2-哌唑啉-5-酮 (IX)。

![化合物IX的结构式]

表5: 具有结构式IX的合成化合物。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>环A上的取代基</th>
<th>R¹</th>
<th>重结晶溶剂</th>
<th>产率%</th>
<th>方法</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>358</td>
<td>4-二甲氨基</td>
<td>苯基</td>
<td>乙醇</td>
<td>32</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>359</td>
<td>4-二甲氨基</td>
<td>异丙基</td>
<td>甲苯/庚烷</td>
<td>51</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>360</td>
<td>4-二甲氨基</td>
<td>苯乙基</td>
<td>NA</td>
<td>45</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
<tr>
<td>361</td>
<td>4-二甲氨基</td>
<td>异丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>77</td>
<td>见实施例210</td>
</tr>
</tbody>
</table>

表5A: 具有结构式IX的合成化合物的物理数据。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>Mp.(℃)</th>
<th>碳</th>
<th>碳</th>
<th>氢</th>
<th>氢</th>
<th>氮</th>
<th>氮</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td>计算值</td>
<td>实测值</td>
<td>计算值</td>
<td>实测值</td>
<td>计算值</td>
<td>实测值</td>
</tr>
<tr>
<td>358</td>
<td>253-255</td>
<td>74.73</td>
<td>74.20</td>
<td>6.27</td>
<td>6.13</td>
<td>13.75</td>
<td>13.34</td>
</tr>
<tr>
<td>359</td>
<td>197-198</td>
<td>65.91</td>
<td>66.33</td>
<td>7.01</td>
<td>6.86</td>
<td>15.37</td>
<td>15.27</td>
</tr>
<tr>
<td>360</td>
<td>224-225</td>
<td>75.20</td>
<td>75.08</td>
<td>6.62</td>
<td>6.56</td>
<td>13.15</td>
<td>13.19</td>
</tr>
<tr>
<td>361</td>
<td>280-289</td>
<td>70.56</td>
<td>70.33</td>
<td>6.71</td>
<td>6.80</td>
<td>16.46</td>
<td>16.20</td>
</tr>
</tbody>
</table>

VI. 4-[(哒唑-4-基)亚甲基]-2-哌唑啉-5-酮 (X)。

![化合物X的结构式]
表 6：具有结构式 X 的合成化合物。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>环 A 上的取代基</th>
<th>R¹</th>
<th>重结晶溶剂</th>
<th>产率%</th>
<th>方法</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>362</td>
<td>3-甲基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>乙酸乙酯</td>
<td>80</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>363</td>
<td>3-甲基</td>
<td>环丙基</td>
<td>甲苯</td>
<td>51</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
</tbody>
</table>

表 6A：具有结构式 X 的合成化合物的物理数据。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>M.p. (℃)</th>
<th>元素分析</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td>碳</td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td>计算值</td>
</tr>
<tr>
<td>362</td>
<td>228-230</td>
<td>56.39</td>
</tr>
<tr>
<td>363</td>
<td>265-267</td>
<td>61.09</td>
</tr>
</tbody>
</table>

5 VII. 4-[(咪唑-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮 (XI).

![XI](image)

表 7：具有结构式 XI 的合成化合物。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>环 A 上的取代基</th>
<th>R¹</th>
<th>重结晶溶剂</th>
<th>产率%</th>
<th>方法</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>364</td>
<td>无</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲苯</td>
<td>45</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
<tr>
<td>365</td>
<td>无</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>42</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
</tbody>
</table>

表 7A：具有结构式 XI 的合成化合物的物理数据。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>M.p. (℃)</th>
<th>元素分析</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td>碳</td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td>计算值</td>
</tr>
<tr>
<td>364</td>
<td>212-214</td>
<td>54.53</td>
</tr>
<tr>
<td>365</td>
<td>264-266</td>
<td>59.39</td>
</tr>
</tbody>
</table>
VIII. 4-[(咔唑-4-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮 (XII)。

```
\begin{align*}
\text{N} & \text{H} \\
\text{A} & \\
\text{N} & \text{C} \\
\text{O} & \\
\text{R}^1 & \\
\end{align*}
```

XII.

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>环 A 上的取代基</th>
<th>R$^1$</th>
<th>重结晶溶剂</th>
<th>产率%</th>
<th>方法</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>366</td>
<td>无</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>乙醇</td>
<td>81</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
</tbody>
</table>

表 8: 具有结构式 XII 的合成化合物。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>M.p. (°C)</th>
<th>元素分析</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td></td>
<td>碳-实际值</td>
<td>碳-计算值</td>
</tr>
<tr>
<td>366</td>
<td>54.53</td>
<td>54.84</td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td>钠-实际值</td>
<td>钠-计算值</td>
</tr>
</tbody>
</table>

IX. 4-[(噻唑-2-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮 (XIII)。

```
\begin{align*}
\text{S} & \\
\text{A} & \\
\text{N} & \text{C} \\
\text{O} & \\
\text{R}^1 & \\
\end{align*}
```

XIII.

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>环 A 上的取代基</th>
<th>R$^1$</th>
<th>重结晶溶剂</th>
<th>产率%</th>
<th>方法</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>367</td>
<td>无</td>
<td>环丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>20</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
</tbody>
</table>

表 9: 具有结构式 XIII 的合成化合物。
表 9A: 具有结构式 XIII 的合成化合物的物理数据。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>M.p.  (°C)</th>
<th>元素分析</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td>碳</td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td>计算值</td>
</tr>
<tr>
<td>367</td>
<td>275-277</td>
<td>60.53</td>
</tr>
</tbody>
</table>

X. 4-[(吲哚-3-基)亚甲基]-1-甲基-2-吡唑啉-5-酮 (XIV)。

![化合物结构式](chinese_text)

表 10: 具有结构式 XIV 的合成化合物。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>吲哚上的取代基</th>
<th>$R^1$</th>
<th>重结晶溶剂</th>
<th>产率%</th>
<th>方法</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>368</td>
<td>无</td>
<td>异丙基</td>
<td>乙醇</td>
<td>54</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
</tbody>
</table>

表 10A: 具有结构式 XIV 的合成化合物的物理数据。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>M.p.  (°C)</th>
<th>元素分析</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td>碳</td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td>计算值</td>
</tr>
<tr>
<td>368</td>
<td>241-242</td>
<td>71.88</td>
</tr>
</tbody>
</table>
XI. 4-[(吡咯-3-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮 (XV).

![化学结构式](attachment:structure15.png)

表 11：具有结构式 XV 的合成化合物。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>吡咯上的取代基</th>
<th>R¹</th>
<th>重结晶溶剂</th>
<th>产率%</th>
<th>方法</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>369</td>
<td>无</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲醇</td>
<td>70</td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
</tbody>
</table>

表 11A：具有结构式 XV 的合成化合物的物理数据。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>M.p. (°C)</th>
<th>元素分析</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td>碳</td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td>计算值</td>
</tr>
<tr>
<td>369</td>
<td>252-255</td>
<td>60.26</td>
</tr>
</tbody>
</table>

XII. 4-[(喹啉-5-基)亚甲基]-2-吡唑啉-5-酮 (XVI).

![化学结构式](attachment:structure16.png)
表 12: 具有结构式 XVI 的合成化合物。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>喹啉上的取代基</th>
<th>R^1</th>
<th>重结晶溶剂</th>
<th>产率%</th>
<th>方法</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>370</td>
<td>8-羟基</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>甲醇</td>
<td></td>
<td>见实施例 210</td>
</tr>
</tbody>
</table>

表 12A: 具有结构式 XVI 的合成化合物的物理数据。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>M.p. (°C)</th>
<th>元素分析</th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
<th></th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td>碳</td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td>计算值</td>
<td>实测值</td>
<td>计算值</td>
<td>实测值</td>
<td>计算值</td>
</tr>
<tr>
<td>370</td>
<td>&gt;300</td>
<td>64.64</td>
<td>64.43</td>
<td>5.09</td>
<td>5.01</td>
<td>14.13</td>
</tr>
</tbody>
</table>

5 X. 原料合成。

A. 合成 3-酮基酯 (XIX)。

反应方案 II 中示出了采用一般方法合成 3-酮基酯。

反应方案 II: 合成 3-酮基酯

实施例 371: 3-(2,2,3,3-四甲基环丙基)-3-氧代丙酸乙酯。

在氮气氛下，向冰冷却的 2,2-二甲基-1,3-二嗯烷-4,7-二酮 (4.7 g, 0.032 mol) 在无水二氯甲烷 (37 mL) 中的溶液中加入吡啶 (5 g, 0.063 mol)
和2,2,3,3-四甲基环丙基碳基氮(5 g, 0.031 mol)。在0℃保持1小时，然
后使其升至室温过夜。然后将该混合物转入分液漏斗，用3%盐酸洗涤
两次，并用水洗涤两次。有机层用硫酸镁干燥，然后过滤并减压浓缩，
得到5 g深红色油。该油在无水乙醇(60 mL)中回流3小时。蒸发溶剂，
产物经蒸馏纯化。

实施例377: 3-(6-甲氧基苯并噻唑-2基)-3-氧代丙酸乙酯。

向氯化钠(1.5 g, 50%油分散液, 0.032 mol)中加入乙酸乙酯(7.2 g, 0.082 mol)，保持温度低于25℃。加入2-氧代羰基-2-(6-甲氧基)苯并噻
唑(5.25 g, 0.022 mol)。温热该混合物至轻轻回流，然后在室温搅拌过
夜。用冰水(50 mL)终止反应，并用浓盐酸调节至pH 7.7。产物沉淀，
过滤收集，用水洗涤，然后干燥。

实施例378: 4-(4-苯基苯氧基)-3-氧代丁酸乙酯。

在0℃，用2小时，向75 mL二甲基甲酰胺(在下文中称作"DMF")中加入氯化钠(5.0 g, 0.114 mol)和4-苯基苯醇(15.3 g, 0.09 mol)。加入在
DMF (75 mL)中的4-氯乙酰乙酸乙酯(5.0 g, 0.03 mol)。该混合物在0℃
搅拌1小时，并在室温搅拌12小时，然后用50%磷酸中和，并用二氯
甲烷萃取。该产物经硅胶色谱纯化，用(8:2)甲苯:乙醇作流动相。

表13: 具有结构式XIX的合成化合物。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>R¹</th>
<th>产率%</th>
<th>b.p.(°C)</th>
<th>m.p.(°C)</th>
<th>方法</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>371</td>
<td>2,2,3,3-四甲基环丙基</td>
<td>67</td>
<td>68 (0.2 mmHg)</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例371</td>
</tr>
<tr>
<td>372</td>
<td>2-甲基环丙基</td>
<td>50</td>
<td>62-4 (0.2 mmHg)</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例371</td>
</tr>
<tr>
<td>373</td>
<td>反-2-苯基环丙基</td>
<td>64</td>
<td>138-40 (0.2 mmHg)</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例371</td>
</tr>
<tr>
<td>374</td>
<td>四氢呋喃-3基</td>
<td>60</td>
<td>82-6 (0.2 mmHg)</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例371</td>
</tr>
<tr>
<td>375</td>
<td>3-甲基苯基</td>
<td>62</td>
<td>132 (0.2 mmHg)</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例371</td>
</tr>
<tr>
<td>376</td>
<td>苯乙基</td>
<td>55</td>
<td>110 (0.2 mmHg)</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例371</td>
</tr>
<tr>
<td>377</td>
<td>6-甲氧基苯并噻唑-2基</td>
<td>65</td>
<td>NA</td>
<td>160</td>
<td>见实施例377</td>
</tr>
<tr>
<td>378</td>
<td>4-苯基苯氧基甲基</td>
<td>33</td>
<td>NA</td>
<td>83</td>
<td>见实施例378</td>
</tr>
<tr>
<td>379</td>
<td>3-氯苯氧基甲基</td>
<td>32</td>
<td>147 (8 mmHg)</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例378</td>
</tr>
<tr>
<td>380</td>
<td>吡啶基</td>
<td>71</td>
<td>NA</td>
<td>82</td>
<td>见实施例377</td>
</tr>
</tbody>
</table>
B. 合成环戊基硫代羰基乙酸乙酯。

\[
\text{XX.} + \text{HO-R}^9 \xrightarrow{\text{HCl}} \text{XXI.} \rightarrow \text{XXII.}
\]

5 反应方案 III：合成烷氧基或芳氧基亚胺代羰基乙酸乙酯盐酸盐（R^9 是取代或未取代的脂族或芳族基团）。

实施例 381：合成环戊氧基亚胺代羰基乙酸乙酯盐酸盐（XXII）。

将无水氯化乙酸乙酯（14 g，0.12 mol）和无水环戊醇（12 g，0.15 mol）的混合物在 0℃用氯化氢气饱和 3 小时，在 0℃保持过夜，然后用乙醚稀释。产物沉淀，过滤收集并用乙醚洗涤。

产量 22.4 g，(77%)，熔点 110-112℃

\[
\text{XXII.} \xrightarrow{\text{H}_2\text{S}} \text{XXIV.}
\]

15 反应方案 IV：合成烷氧基硫代或芳氧基硫代羰基乙酸乙酯。

实施例 382：环戊氧基硫代羰基乙酸乙酯（XXIV）

将环戊氧基亚胺代羰基乙酸乙酯盐酸盐（22 g，0.09 mol）在无水吡啶 (150 ml) 中的混合物用硫化氢处理 8 小时，在室温保持 48 小时。该反应混合物用浓盐酸酸化，并用乙醚萃取。醚相用水洗涤，干燥并经蒸馏纯化。

产量 15 g，(75%)，熔点 140-142℃ (15 mm Hg)。
C. 合成 2-吡唑啉-5-酮
通过以下四种方法合成 2-吡唑啉-5-酮。

反应方案 V: 合成 2-吡唑啉-5-酮的方法 1。

反应方案 VI: 合成 2-吡唑啉-5-酮的方法 2。
反应方案Ⅶ：合成 2-呋喃啉-5-酮的方法 3。

\[
\begin{align*}
\text{XXXI.} & \quad \text{NH}_2 \\
\text{O} \quad \text{N} & \\
\quad \text{XXXII.} & \quad \text{H}_2\text{N} - \text{C}_8\text{H}_8\text{N} \\
\quad \text{Acetic acid} & \\
\quad & \quad \text{XXXIII.} \\
\end{align*}
\]

5 反应方案Ⅷ：合成 2-呋喃啉-5-酮的方法 4。
实施例 383: 3-(2,2,3,3-四甲基环丙基)-2-呋喃啉-5-酮。

向 3-(2,2,3,3-四甲基环丙基)-3-氨代丙酸乙酯(4.41 g, 0.020 mol)在无水乙酸(60 ml)中的溶液中加入水合肼(1.1 g, 0.024 mol)。使反应混合物回流 3 小时。冷却后，蒸发溶剂，残留物用乙烷研制，得到白色固体。

10 实施例 411: 3-(4-羟基苄基)-2-呋喃啉-5-酮

将搅拌着的 3-(4-甲氧基苄基)-2-呋喃啉-5-酮(2.5 mmol)在 100 ml 二氯甲烷中的悬浮液在-78℃冷却，用 7.5 ml 三溴化硼(1M 二氯甲烷溶液)处理。在-78℃保持 1 小时后，在室温搅拌反应混合物 12 小时。用 50 ml 水使该混合物终止反应。分离水相，用 5% 碳酸氢钠溶液碱化。过滤形成的沉淀，并从甲醇中结晶。

实施例 413: 3-(4-氨基甲酰基乙基)-2-呋喃啉-5-酮

将 3-(4-甲氧基苄基乙基)-2-呋喃啉-5-酮(7.7 mmol)在 25% 氢氧化铵 (30 ml)中的混合物在室温搅拌 12 小时。真空浓缩溶剂，过滤形成的固体产物并干燥。

20 实施例 414: 3-(2-氨基甲基乙基)-2-呋喃啉-5-酮

将 3-(乙氧基甲基)-2-呋喃啉-5-酮(1g, 5.8 mmol)和 NaCN (28 mg, 0.58 mmol)在 30 ml 9M 氨的甲醇溶液中的混合物在密封管中于 45℃ 加热 3 天。冷却后，蒸发溶剂，将残余物悬浮在水中。过滤收集沉淀的固体。

25 实施例 416: 3-(4-甲氧基苯基)-2-呋喃啉-5-酮

使 3-氨基-2-呋喃啉-5-酮(20 mmol)、4-甲氧基苯胺(25 mol)在 50ml
乙酸中的混合物回流 4 小时。蒸发溶剂，将残余物悬浮在水中。过滤固体并从甲醇中结晶。

表 14：具有结构式 XXVI 的合成化合物。

<table>
<thead>
<tr>
<th>实施例</th>
<th>R1</th>
<th>产率%</th>
<th>M.p. (°C)</th>
<th>重结晶溶剂</th>
<th>方法</th>
</tr>
</thead>
<tbody>
<tr>
<td>383</td>
<td>2,2,3,3-四甲基环丙基</td>
<td>44</td>
<td>195-7</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>384</td>
<td>乙氧基甲基甲基</td>
<td>44</td>
<td>115-6</td>
<td>甲苯</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>385</td>
<td>吡咯-2-基</td>
<td>30</td>
<td>205-8</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>386</td>
<td>吡唑-3-基</td>
<td>69</td>
<td>250-3</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>387</td>
<td>6-甲氧基苯并噻唑-2-基</td>
<td>40</td>
<td>269-70</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>388</td>
<td>2-甲基环丙基</td>
<td>70</td>
<td>196-7</td>
<td>水</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>389</td>
<td>反-2-苯基环丙基</td>
<td>65</td>
<td>194-5</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>390</td>
<td>四氢呋喃-3-基</td>
<td>36</td>
<td>204-5</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>391</td>
<td>4-甲氧基苯基</td>
<td>73</td>
<td>192-5</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>392</td>
<td>4-甲基苯基</td>
<td>80</td>
<td>212-4</td>
<td>乙醇;水</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>393</td>
<td>4-氯苯基</td>
<td>67</td>
<td>206-8</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>394</td>
<td>4-甲氧基苯基</td>
<td>72</td>
<td>163-5</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>395</td>
<td>3,4-二甲氧基苯基</td>
<td>69</td>
<td>193-5</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>396</td>
<td>苯乙基</td>
<td>72</td>
<td>204-7</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>397</td>
<td>2-苯基环丙基</td>
<td>72</td>
<td>215</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>398</td>
<td>2-苯基环丙基</td>
<td>76</td>
<td>200-1</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>399</td>
<td>4-甲氧基苯乙基</td>
<td>85</td>
<td>230</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>400</td>
<td>4-甲基苯乙基</td>
<td>90</td>
<td>251-2</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>401</td>
<td>4-氯苯乙基</td>
<td>63</td>
<td>243</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>402</td>
<td>4-硝基苯乙基</td>
<td>69</td>
<td>247</td>
<td>DMF;水</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>403</td>
<td>4-氯基苯乙基</td>
<td>61</td>
<td>220-2</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>404</td>
<td>4-氯基苯乙基</td>
<td>77</td>
<td>259-60</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>405</td>
<td>4-氯苯苯氧基甲基</td>
<td>50</td>
<td>250</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>406</td>
<td>4-氯苯苯氧基甲基</td>
<td>70</td>
<td>216-8</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>407</td>
<td>4-氯苯氧基甲基</td>
<td>38</td>
<td>224-6</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
<td></td>
</tr>
<tr>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
<td>---</td>
</tr>
<tr>
<td>408</td>
<td>3-氯苯氧基甲基</td>
<td>40</td>
<td>232-4</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>409</td>
<td>4-甲基苯氧基甲基</td>
<td>77</td>
<td>207-10</td>
<td>甲醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>410</td>
<td>环己氧基</td>
<td>75</td>
<td>180-1</td>
<td>甲苯</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>411</td>
<td>4-羟基苄基</td>
<td>75</td>
<td>233</td>
<td>甲醇</td>
<td>见实施例 411</td>
</tr>
<tr>
<td>412</td>
<td>4-羟基苯乙基</td>
<td>70</td>
<td>205-6</td>
<td>水</td>
<td>见实施例 411</td>
</tr>
<tr>
<td>413</td>
<td>4-氨基甲酰胺苯乙基</td>
<td>90</td>
<td>&gt;270</td>
<td>DMF:水</td>
<td>见实施例 413</td>
</tr>
<tr>
<td>414</td>
<td>2-氨基羧基乙基</td>
<td>66</td>
<td>193-6</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 414</td>
</tr>
<tr>
<td>415</td>
<td>2-苯氧基羧基乙基</td>
<td>38</td>
<td>203-9</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 414</td>
</tr>
<tr>
<td>416</td>
<td>4-甲基氧基苯基</td>
<td>30</td>
<td>232-4</td>
<td>甲醇</td>
<td>见实施例 416</td>
</tr>
<tr>
<td>417</td>
<td>4-氯苯氧基</td>
<td>28</td>
<td>262-4</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 416</td>
</tr>
<tr>
<td>418</td>
<td>4-氟苯氧基</td>
<td>35</td>
<td>259-60</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 416</td>
</tr>
<tr>
<td>419</td>
<td>环丙氧基</td>
<td>82</td>
<td>155-158</td>
<td>NA</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>420</td>
<td>吡嗪基</td>
<td>86</td>
<td>193(d)</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>421</td>
<td>异丙氧基</td>
<td>20</td>
<td>123-25</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>422</td>
<td>2-嘧啶基</td>
<td>55</td>
<td>278-80</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>423</td>
<td>3-哒嗪基</td>
<td>83</td>
<td>294-95</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>424</td>
<td>4-嘧啶基</td>
<td>72</td>
<td>290-300</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
<tr>
<td>425</td>
<td>4-嘧啶基</td>
<td>60</td>
<td>288-291</td>
<td>乙醇</td>
<td>见实施例 383</td>
</tr>
</tbody>
</table>

D. 合成例

实施例 426: 1-(4-乙酰氧基丁基)-氮杂吲哚-3-甲酸

保持温度在 5 - 10°C，向搅拌着的 60%氢化钠(油分散液) (1.2 g, 30 mmol) 在无水 DMF (65 ml) 中的悬浮液中滴加 7-氮杂吲哚-3-甲酸 (4.19 g, 28 mmol) 在无水 N,N-二甲基甲酰胺 (50 ml) 中的溶液。添加完成后，在同样的温度下继续搅拌 30 分钟，然后滴加乙酸 4-溴丁酯 (6.16 g, 31 mmol) 在无水 N,N-二甲基甲酰胺 (15 ml) 中的溶液，使该混合物温热至室温。在室温搅拌反应混合物 137 小时，然后加入水 (100 ml)，并用二氯甲烷 (2 x 100 ml) 萃取该混合物。有机相用水 (3 x 100 ml) 洗涤，用无水硫酸镁干燥，过滤并减压除去溶剂，得到油 (6.8 g, 93%)，该油无需进一步纯化即可使用。
实施例 427: 1-(4-羟基丁基)-7-氯杂吲哚-3-甲醛

向 1-(4-乙酰氧基丁基)-7-氯杂吲哚-3-甲醛(2.3 g, 8.8 mmol)在甲醇 (40 ml)中的溶液中加入氢氧化钠(0.2 g, 17.5 mmol)在水(35 ml)中的溶液。该混合物在 60℃加热 0.5 小时，然后蒸发溶剂至干。将残余物溶
5 解在乙酸乙酯和水的混合物(50 ml: 50 ml)中，分离水层。有机相用水洗涤，用硫酸镁干燥，过滤并蒸发至干。残余物无需进一步纯化即可使用。产率 78%。熔点 90℃。

实施例 428: 1-(4-羟基丁基)吲哚-2-甲醛

按照实施例 51 的方法得到产物，不同的是用吲哚-2-甲醛代替 7-氯杂吲哚-3-甲醛。该产物经硅胶色谱纯化，用(5:5)乙酸乙酯:己烷洗脱。产率 67%。

实施例 429: 3-异丙基-5-甲基吲哚-2-甲醛

在 0℃和氮气气氛下，向无水 DMF (2.1 ml, 27 mmol)在无水二氯乙烷 (50 ml)中的溶液中滴加 POCl₃ (2.1 ml, 23 mmol)。将该溶液温热至室温 1 小时。然后，将该悬浮液冷却至 0℃，并用 20 分钟滴加 3-异丙基-5-甲基吲哚(2g, 16 mmol)在二氯乙烷(20 ml)中的溶液。在室温搅拌 24 小时后，加入水，然后加入 NaOH 至 pH: 8。萃取有机层，干燥并除去溶
15 剂至干燥。残余物经闪式色谱纯化。产率 67%，熔点 90-93℃。

实施例 430: 3,5-二甲基-4-吗啡代甲基吲哚-2-甲醛

向吗啡(0.35 g, 4 mmol)、37%的甲醛(0.32 g, 4 mmol)和乙酸(2ml)的溶液中加入 3,5-二甲基吲哚-2-甲醛(0.5g, 4 mmol)。该混合物在室温
25 和氮气气氛下搅拌过夜，然后用 NaHCO₃ 稀释反应物至 pH 8，用水溶液用
乙酸乙酯萃取，有机层用硫酸镁干燥，真空蒸发乙酸乙酯，得到 0.4 g
纯的固体。

按照与实施例 430 所述类似的方法合成下列化合物:

3,5-二甲基-4-二甲氨基甲基吲哚-2-甲醛，

3-(4-吗啡代)甲基-吲哚-2-甲醛，
3,5-二甲基-4-二乙氨基甲基吲哚-2-甲醛，
3,5-二甲基-4-哌啶子甲基吲哚-2-甲醛，
3,5-二甲基-4-[(4-甲基-1-哌嗪基)甲基]吡咯-2-甲醛，
3,5-二甲基-4-(1-吡咯烷基甲基)吡咯-2-甲醛，
5-甲基-4-二甲氨基甲基吡咯-2-甲醛，
3,5-二甲基-4-[N-甲基-N-(2-二甲氨基乙基)氨基甲基]吡咯-2-甲醛，
3,5-二甲基-4-二乙醇氨基甲基吡咯-2-甲醛，
4-(4-苯基哌啶子基甲基)-3,5-二甲基吡咯-2-甲醛，
4-二甲氨基甲基-3-异丙基-5-甲基吡咯-2-甲醛，
3,5-二甲基-4-(4-羟基哌啶子基甲基) 吡咯-2-甲醛，和
3-二甲氨基甲基-4,5-四亚甲基吡咯-2-甲醛。

实施例431：3,5-二甲基-4-三氟乙酰氨甲基吡咯-2-甲醛

保持温度低于 10℃，将 3,5-二甲基吡咯-2-甲醛(2.6g, 0.02 mol)和N-(羟甲基)三氟乙酰胺(3g, 0.02 mol)的混合物分批加入硫酸(15 ml)中。使反应混合物温热至室温 4 小时，将反应物倒入冰水(100 ml)中，过滤沉淀的固体并用水洗涤。所得白色固体(产率 78%)无需进一步纯化即可使用。M. p. 200℃。

实施例432：4-氨基甲基-3,5-二甲基吡咯-2-甲醛

将 3,5-二甲基-4-三氟乙酰氨基甲基吡咯-2-甲醛(3.9 g, 15.7 mmol)、NaOH 10% (19 ml)和甲醇(100 ml)的混合物加热回流 1 小时。减压浓缩该溶液至一半体积。加入水，过滤沉淀的固体。产率 72%，m. p. 210-20℃ (d)。

实施例433：乙酸 3-乙酰基-4-氧代戊基酯

在机械搅拌下，将戊烷-2,4-二酮(60 g, 0.6 mol)、乙酸 2-溴乙酯(100 g, 0.6 mol)、无水碳酸钾(83 g, 0.6 mol)、IK (99.6 g, 0.6 mol)和无水丙酮 (500 ml)的混合物加热回流 24 小时。减压浓缩该混合物，并将其倒入盐酸(1.7 M, 400 ml)中。通过连续用乙醚、乙酸乙酯和二氯甲烷萃取，分离该产物。合并的有机提取液用盐水洗涤，除去溶剂至干，并蒸馏残余物，得到 38 g 乙酸盐，b. p. 75-80℃ (0.1 mm Hg)。

按照与实施例 433 所述类似的方法，制备乙酸 4-乙酰基-5-氧代己
基酯[产率 60%，b. p. 110℃ (0.2 mm Hg)]和乙酸-5-乙酰基-6-氧代己基酯[产率 77%，b. p. 102℃ (0.2 mm Hg)]。

实施例 434：4-(2-乙酰氧基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-甲酸叔丁酯

在低于 20℃温度和搅拌下，通过向乙酰乙酸叔丁酯（26 g, 0.165 mol）在乙酸（48 ml）中的溶液中滴加亚硝酸钠（11.3 g, 0.165 mol）在水中（17 ml）中的溶液对其进行处理，并放置过夜。将乙酸 3-乙酰基-4-氧代戊基酯（30 g, 0.161 mol）在乙酸（56 ml）中的溶液加热至 80℃，此时分批加入锌粉（26.2 g, 0.40 mol）和乙酸钠（26.3 g, 0.32 mol）的混合物，同时滴加上述羟基亚氨基衍生物（97 ml, 0.165 mol）。在添加期间剧烈搅拌反应混合物，使锌总是过量，并且保持温度在 90-100℃。添加完成时，将该混合物轻轻煮沸 15 分钟，并在室温搅拌过夜。将反应混合物倒入冰水中，放置 2hr。过滤固体并从乙醇水溶液中重结晶。产率 78%，熔点 92℃。

按照与实施例 434 所述类似的方法，制备 4-(3-乙酰氧基丙基)-3,5-二甲基吡咯-2-甲酸叔丁酯[产率 60%，m. p. 73℃ (乙烷)]和 4-(4-乙酰氧基丁基)-3,5-二甲基吡咯-2-甲酸叔丁酯[产率 52%，m. p. 62℃ (乙烷)]。

实施例 435：3,5-二甲基-4-(2-羟基乙基)吡咯-2-甲醛。

将 4-(2-乙酰氧基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-甲酸叔丁酯（15g, 53 mmol）溶解在 TFA（40ml）中，并在 40℃和氮气下搅拌该溶液 10 分钟。然后将反应混合物冷却至 0℃，并滴加原甲酸三乙酯（9.6 ml, 58 mmol）。使该混合物温热至 20℃，并搅拌 1 小时，然后倒入冰水中。用氯甲烷萃取，依次用 10% 氨水和水洗涤该提取液，并用硫酸镁干燥。4-(2-乙酰氧基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-甲醛经硅胶色谱纯化，用（7: 3）乙酸乙酯-己烷洗脱。产率 45%，m. p. 125-27℃ (水)。

向上述化合物（5g, 23 mmol）在乙醇（20 ml）中的溶液中加入 NaOH 10%（10 ml）。在室温搅拌该混合物 30 分钟，浓缩最终的溶液，用水稀释，并用氯甲烷萃取。干燥有机提取液，并除去溶剂至干。产率 98%，m. p. 100℃ (乙酸乙酯)。

按照与实施例 435 所述类似的方法，制备 3,5-二甲基-4-(3-羟丙基)吡咯-2-甲醛[产率 60%，m. p. 85℃ (乙酸乙酯/己烷)]和 3,5-二甲基-4-(4-羟基丁基)吡咯-2-甲醛[产率 38%，m. p. 99℃ (己烷)]。
实施例 436: 4-(2-二乙氨基乙基)-3,5-二甲基吡咯-2-甲醛。

在 0–5℃，向搅拌着 3,5-二甲基-4-(2-羟基乙基)吡咯-2-甲醛 (4.3 g, 25.7 mmol) 和三乙胺 (5.2 g, 51 mmol) 在无水 THF (60 ml) 中的溶液中加入在无水 THF (4 ml) 中的甲磺酰氯 (4 ml, 51 mmol)，并在室温搅拌该混合物 1 小时。然后向该混合物中加入水，过滤沉淀的固体。产率 89%，m. p. 142-44℃。

将上述甲磺酸酯 (23 mmol)、K₂CO₃ (23 mmol)、二乙胺 (90 mmol) 和 2-丙醇 (70 ml) 的混合物加热至 100℃，保持 0.5 小时。除去溶剂至干，残余物用水洗涤，并用二氯甲烷萃取。干燥有机提取液，并蒸发溶剂至干。产率 70%，m. p. 70℃ (正庚烷)。

按照与实施例 436 所述类似的方法，以油的形式分离并制备 3,5-二甲基-4-[2-(1-吡咯烷基乙基)]吡咯-2-甲醛、3,5-二甲基-4-(2-乙氨基乙基) 吡咯-2-甲醛、4-(3-二乙氨基丙基)-3,5-二甲基吡咯-2-甲醛、4-(4-二乙氨基丁基)-3,5-二甲基吡咯-2-甲醛、3,5-二甲基-4-[3-(1-吡咯烷基丙基)] 吡咯-2-甲醛。

实施例 437: 4-(2-氯乙酰基)-3,5-二甲基吡咯-2-甲醛

在室温和氮气下，用 30 分钟，向 3,5-二甲基吡咯-2-甲醛 (5 g, 40 mmol) 在 1,2-二氯乙烷 (50 ml) 中的溶液中分批加入无水氯化铝 (42 g, 315 mmol)。搅拌 15 分钟后，用 1 小时滴加氯乙酰氯 (17 g, 150 mmol)。添加完成后，在室温搅拌该混合物 16 小时。将该混合物倒入碎冰中，分离有机层，用无水硫酸镁干燥，并减压除去溶剂。产率 57%，m. p. 205-09℃ (甲苯)。

实施例 438: 3,5-二甲基-4-(2-二乙氨基乙酰基)吡咯-2-甲醛

向 4-(2-氯乙酰基)-3,5-二甲基吡咯-2-甲醛 (1 g, 5 mmol) 在 THF (20 ml) 中的溶液中加入二乙胺 (5 ml)。在室温搅拌该混合物 24 小时。减压除去溶剂，残余物用水、NaHCO₃ (5%) 处理，并用二氯甲烷萃取。干燥并过滤后，除去溶剂，残余物无需进一步纯化即可使用。

按照与实施例 438 所述类似的方法，合成 3,5-二甲基-4-(2-二甲氨基乙酰基) 吡咯-2-甲醛和 3,5-二甲基-4-[2-(1-吡咯烷基)乙酰基] 吡咯-2-甲醛。
实施例 439: 3,5-二甲基-4-乙氧基苯酰基吡咯-2-甲醛

在室温和氨气氛下，用 30 分钟，向 3,5-二甲基吡咯-2-甲醛 (7.6 g, 62 mmol) 在 1,2-二氯乙烷 (140 ml) 中的溶液中分批加入无水氯化铝 (37 g, 277 mmol)。搅拌 30 分钟后，加入硝基甲烷 (11.2 ml, 179 mmol)。该混合物在 0℃冷却，并用 1 小时滴加氯乙醛酸乙酯 (12.8 g, 94 mmol)。添加完成后，在室温搅拌该混合物 4 小时。将该混合物倒入碎冰中，分离有机层，干燥并蒸发，得到白色固体。产率 45%，m. p. 125-127℃ (甲苯)。

前面实施例中所有化合物的 NMR 谱数据均与相应的化学结构一致。

尽管参照其优选的实施方案详细地描述了本发明，但是本领域专业人员应该理解，在不背离权利要求书所定义的本发明精神和范围的条件下，可以对其形式和细节进行许多改变。