



[12] طلب براءة اختراع

التصنيف الدولي : Int. CL.: A61K 031/415 بيانات الأسبقية : US 60/380,735 2002/05/15	[51] اسم المخترع : تشيه يونج هو، بنجت اندرس برونمارك، ستوارت ايمانويل، روبيرت ايه. جالمو، جيه آر، دانا ال. جونسون، دونالد دبليو لودفيكي، اومار ماهاروف، جاي ام. مي، جان ال. سيتشيلر، ايريك دي. ستروبل، روبيرت دبليو. تومان، هوا كوو بين	[72]
	[30] مقدم الطلب : جانسن فارماسيوتيكس ان.في. العنوان : 30 تورنهاوتسويج بيرس الرمز البريدي: بي-2340، بلجيكا الجنسية : بلجيكية	[71]
	الوكيل : مكتب سعود محمد علي الشواف للمحاماة والاستشارات القانونية ش	[74]
	رقم الطلب : 03240431	[21]
	تاريخ الايداع : 1424/10/13 هـ	[22]
	الموافق : 2003/12/07 م	

[54] **اسم الاختراع :** مركبات 3-امينو بيرازول ثلاثية الحلقة تحمل بدائل عند ذرة النتروجين بصفقتها مثبطات لمعالجه اضطرابات التكاثر الخلوى

N-Substituted Tricyclic 3-Aminopyrazoles As Inhibitors for the Treatment of Cell Proliferative Disorders

[57] **الملخص :** مركبات 3-أمينو بيرازول ثلاثية الحلقة تحمل بدائل عند ذرة النتروجين بصفقتها مثبطات لمعالجة اضطرابات التكاثر الخلوى المخلصيوجه الاختراع الراهن نحو مشتقات 3-أمينو بيرازول ثلاثية الحلقة تحمل بدائل عند ذرة النتروجين، وهي مفيدة كمثبطات لكيناز مستقبل عامل النمو المشتق من الصفائح الدموية (PDGF-R)، وطرق لتحضير المشتقات المذكورة. كما يوجه الاختراع الراهن نحو تراكيب صيدلانية تشتمل على المركبات وفقا للاختراع الراهن ونحو طرق لمعالجة حالات مرضية مثل الأورام واضطرابات تكاثر خلوي أخرى.

بسم الله الرحمن الرحيم

مركبات ٣-أمينو بيرازول ثلاثية الحلقة تحمل بدائل عند ذرة النتروجين بصفاتها مثبطات
لمعالجة اضطرابات التكاثريات الخلوية

الملخص

يوجه الاختراع الراهن نحو مشتقات ٣-أمينو بيرازول ثلاثية الحلقة تحمل بدائل
عند ذرة النتروجين، وهي مفيدة كمثبطات لكيناز مستقبلية عامل النمو المشتق من الصفائح
الدموية (PDGF-R)، وطرق لتحضير المشتقات المذكورة. كما يوجه الاختراع الراهن نحو
تراكيب صيدلانية تشتمل على المركبات وفقاً للاختراع الراهن ونحو طرق لمعالجة حالات
مرضية مثل الأورام واضطرابات تكاثريات خلوية أخرى.

مركبات ٣-أمينو بيرازول ثلاثية الحلقة تحمل بدائل عند ذرة النتروجين بصفتها مثبطات

لمعالجة اضطرابات التكاثُر الخلوي

الوصف الكامل

خلفية الاختراع :

يطالب الطلب الراهن بحماية الأسبقية بموجب الدستور الأمريكي ٣٥ الجزء ١١٩ (هـ) (35 U.S.C. § 119 (e)) من طلب براءة الاختراع الأمريكي قيد النظر بالرقم المتسلسل ٦٠/٣٨٠,٧٣٥، المودع في ١٥ مايو، ٢٠٠٢م، والمذكور في هذا البيان بكامل محتواه للإحالة إليه كمرجع ولكافة الأغراض.

يتعلق هذا الاختراع بسلسلة جديدة من مركبات ٣-أمينو بيرازول ثلاثية الحلقة تحمل بدائل عند ذرة النتروجين وباستخدام مركبات من هذا القبيل لمعالجة اضطرابات التكاثُر الخلوي، مثل الأورام، معاودة التضيق، التهاب المفاصل شبه الروماتزمي، اعتلال الشبكية الديابيطي وما أشبه. وبعبارة أدق، تكون هذه المركبات عبارة عن مثبطات لكيناز تيروزين مستقبلية PDGF.

تؤازر الأدلة المتراكمة المفهوم المتمثل في أنه يتضمن فقد التحكم بنمو الخلايا السرطانية اضطراب لمسارات إرسال الإشارات التي تُضبط في الخلية السوية عن طريق عوامل منظّمة للنمو. وعامل النمو المشتق من الصفائح الدموية (PDGF) هو عبارة عن مسبب للانقسام الفتيلي لخلايا النسيج الضام يشترك في توليد الأورام (انظر ما جاء عن أوستمان وهيلدين في مجلة أبحاث السرطان المتقدمة (أدفانس كانسر ريسيرتشز)، المجلد ٨٠، ص ١-٣٨، ٢٠٠١م، والمراجع المذكورة فيها) بالإضافة إلى أنه يلعب دوراً رئيسياً في العملية المعقدة لتولد الأوعية التي تعتبر هامة لنمو الورم.

ويحدث PDGF تأثيراته الخلوية من خلال ارتباطه بمستقبلته الخاصة، التي يرمز لها بـ PDGF-R. وتكون PDGF-R عبارة عن كيناز تيروزين من النوع المستقبل المحتوي على حقول عبر الغشاء (RTK). وتتكون هذه المستقبلية من أنزيمين إسويين، ألفا وبيتا.

ويكون لكل من هاتين المستقبلتين جزء يقع خارج الخلايا يميز خمسة حقول شبيهة بالجلوبولين المناعي وجزء يقع داخل الخلايا له حقل كيناز تيروزين. ويرافق كلتا المستقبلتين المحتويتين على الأنزيمين الإسويين ألفا وبيتا فعالية مسببة للانقسام الفتيلي، تنبيه للأقدام الصُفاحية وفقدان للألياف الشاذة. والمستقبلات التي تحتوي على الأنزيم الإسوي بيتا هي وحدها التي يرافقها انجذاب كيميائي وإعادة ترتيب للأكتين (انظر ما جاء عن سي-إتش هيلدين في مجلة المنظمة الأوروبية لعلم الأحياء الجزيئية (EMBO Journal)، المجلد ١١، ص ٤٢٥١-٤٢٥٩، ١٩٩٢م).

ويؤدي ارتباط PDGF بـ PDGF-R إلى ديمرة الوحدتين الفرعيتين لمستقبلات PDGF، مما يسمح بالأسطرة الفسفورية الذاتية لكل وحدة فرعية على شقات تيروزين معينة في الحقل السيتوبلازمي. وتؤدي الأسطرة الفسفورية الذاتية إلى زيادة فعالية الكيناز وتكون مواقع اقتران لأعداد كبيرة من جزيئات ترسل إشارات تحتوي على حقول SH2، مثل Grb2/Sos1، PLC-جاما، GAP، كيناز PI-3 و Src (انظر ما جاء عن هيلدين ومعاونيه في مجلة أكتا للكيماويات الحيوية والفيزياء الحيوية (بيوكيمستري أند بيو فيزيكس أكتا)، والمراجع المذكورة فيها). وعند ارتباط الجزيئات التي ترسل إشارات والمحتوية على حقل SH2 بـ PDGF-R فإنها تبدأ بعمل مسارات الانتقال العارض للإشارة التي تشترك في الاستجابات الخلوية المختلفة مثل التكاثر الخلوي، حركة الخلايا، إنفاذية الخلايا أو موت الخلايا المبرمج.

ولـ PDGF تأثيرات خلوية هامة عديدة في الجسم الحي. فهو يعمل على تنظيم نمو، تمايز وانتقال الخلايا أثناء التطور الجنيني، ويلعب دوراً محتملاً في الوقاية العصبية والتجديد. كما أنه ينبّه التئام الجرح في البالغين. وإضافة إلى ذلك، يكون لـ PDGF أيضاً وظائف متخصصة في النظام الوعائي وأيضاً في الاستقرار المتجانس للنسيج الضام (انظر ما جاء عن أوستمان وهيلدين في مجلة أبحاث السرطان المتقدمة، المجلد ٨٠، ص ١-٣٨، ٢٠٠١م، والمراجع المذكورة فيها).

ولقد أسهمت الفعالية الزائدة لـ PDGF في نشوء العديد من الأمراض الخطيرة، بما في ذلك السرطانات (مثل الورم الدبقي، سرطان الرئة، سرطان الثدي، سرطان القولون والمستقيم، سرطان البروستات، سرطان المعدة وسرطان المريء، سرطانات الدم (اللوكيميا) والأورام الليمفية)، واضطرابات تكاثر خلوي أخرى، مثل تصلب العصيد، أمراض الأوعية المستحثة بزرع الأعضاء، تكوين بطانة جديدة، تليف الرئة، معاودة التضيق، التليف الرئوي، التهاب كبيبات الكلى، تصلب

كبيبات الكلى، سوء النمو الخلقي للكلية متعددة الأكياس، تليف الكلية والتهاب المفاصل شبيه الروماتزمي (انظر ما جاء عن إيه. أوستمان وسي إتش. هيلدين في مجلة أبحاث السرطان المتقدمة، المجلد ٨٠، ص ١-٣٨، ٢٠٠١م، والمراجع المذكورة فيها).

وبيّنت مجموعة كبيرة من الأدلة التجريبية المباشرة وغير المباشرة أنه يعتمد نمو الورم المعزز وانبثاقه على تولد الأوعية (انظر مثلاً ما جاء عن هاناها في مجلة العلم (سينس)، المجلد: ٢٧٧، ص ٤٨-٥٠، ١٩٩٧م). وتولد الأوعية هو عبارة عن تكوين جهاز وعائي جديد من أوعية دموية موجودة أصلاً و/أو خلايا جذعية بطانية دورانية (انظر مثلاً، ما جاء عن سبرينجر ومعاونيه، ١٩٩٨م). ويلعب تولد الأوعية دوراً حيوياً في عمليات فسيولوجية عديدة، مثل تكوّن الجنين، التئام الجرح والحيض. كما يبدو أنه يكون تولد الأوعية مهماً في حالات مرضية محددة، مثل نمو الورم الصلب وانبثاقه، التهاب المفاصل، الصدفية واعتلال الشبكية الدايابيطي (انظر ما جاء عن هاناها وفولكمان، في مجلة الخلية (سل)، المجلد: ٨٦، العدد (٣)، ص ٣٥٣-٣٦٤، ١٩٩٦م).

وتجرى حالياً دراسة لعلاج مضاد لتولد الأوعية باعتباره طريقة لاعتراض نمو الورم. وفي الواقع، أثبتت دراسات عديدة أجريت على نماذج حيوانية حدوث تأثيرات مدهشة في تثبيط نمو الورم بواسطة عوامل نمو متعلقة بتولد الأوعية هدفية مثل عامل النمو البطاني الوعائي (VEGF)، عامل نمو الأرومة الليفية الحمضي والقاعدي (bFGF، aFGF) و PDGF. وتنتمي مستقبلات VEGF و PDGF لإحدى الفصائل العليا لأنزيمات كيناز تيروزين المستقبلية. ولذلك، وبالإضافة إلى دورها في علاج اضطرابات تكاثر خلوي أخرى، تعتبر مثبطات كيناز تيروزين لـ PDGF-R المفيدة سريرياً مفيدة للعلاج المضاد لتولد الأوعية ولضبط تكاثر خلايا الورم.

وتشكل مثبطات صغيرة الجزيئات لكيناز تيروزين المستقبل صنفًا جديدًا من عقاقير ذات فعالية كبيرة (انظر ما جاء عن دروكر وليدون في مجلة الأبحاث السريرية (جورنال أف كلينيكال إنفيسيتيجيشن)، المجلد: ١٠٥، ص ٣-٧، ٢٠٠٠م، والمراجع المذكورة فيها). ولقد ميز، منذ عام ١٩٩٥م، عدداً من المثبطات صغيرة الجزيئات للأسترة الفسفورية الذاتية لمستقبل PDGF. وتذكر بعض الأمثلة أدناه.

تكشف براءة الاختراع اليابانية رقم ٠٦٠٨٧٨٣٤ (باسم زيميرمان) عن مشتقات N-فينيل-٢-بيريميدين-أمين لها فعالية مثبطة للورم وتكون مفيدة لمعالجة الأورام في الحيوانات نوات الدم الحار

بما فيها الانسان. وتبيّن أن مشتقتين من مجموعة المركبات هذه، وهما المركب CGP53716 (انظر ما جاء عن بوتشدنجر ومعاونيه في محاضر جلسات أكاديمية العلوم الوطنية (PNAS)، بروسيدنجر ناشيونال أكاديميك سينس)، المجلد: ٢٩، ص ٢٥٥٨-٢٥٦٢، ١٩٩٥م) والمركب STI-571 (انظر ما جاء عن بوتشدنجر ومعاونيه في مجلة أبحاث السرطان (كانسر ريسيرتشنز)، المجلد: ٥٦، ص ١٠٠-١٠٤، ١٩٩٦م)، تعملان على تثبيط الأسترة الفسفورية الذاتية لـ PDGF-R.

وتكشف براءة الاختراع اليابانية رقم ١١١٥٨١٤٩ (باسم كويو ومعاونيه) عن مشتقات كينولين لمعالجة أمراض مثل الأورام واعتلال الشبكية الدايبيطي. وتبيّن أن مشتقتين من مجموعة المركبات هذه، وهما المركب Ki6783 (انظر ما جاء عن ياجي ومعاونيه في مجلة الأبحاث الخلوية التجريبية (إكسبريمنتال سيل ريسيرتشنز)، المجلد: ٢٤٣، ص ٢٨٥-٢٩٢، ١٩٩٧م) والمركب Ki6896 (انظر ما جاء عن ياجي ومعاونيه في مجلة علم العقاقير الوراثية (جينتيك فارماكولوجي)، المجلد: ٣١، ص ٧٦٥-٧٧٣، ١٩٩٨م)، تعملان على تثبيط الأسترة الفسفورية الذاتية لـ PDGF-R.

وتكشف براءة الاختراع الأمريكية رقم ٥٩٣٢٥٨٠ (باسم ليفيتزكاوي ومعاونيه) عن مركبات مثبطة لكيناز مستقبلية PDGF من عائلة الكينوكسالين بما فيها تيرفوستين، مثبطات تنافسية لثالث فسفات الأدينوسين (ATP) لكيناز المستقبل.

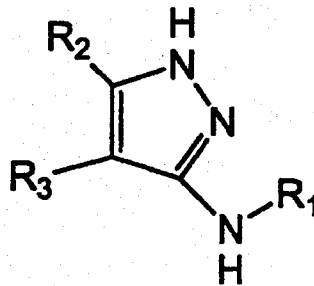
وتكشف براءة الاختراع الأمريكية رقم ٥٤٠٩٩٣٠ (باسم سبادا ومعاونيه) عن مركبات أريل و/أو أريل مخلط ثنائية أحادية و/أو ثنائية الحلقة تظهر فعالية لتثبيط كيناز تيروزين بروتيني. وتبيّن أن المركب RPR101511A، وهو عبارة عن مشتقة من مجموعة المركبات هذه، يعمل على تثبيط الأسترة الفسفورية الذاتية لـ PDGF-R (انظر ما جاء عن بيلدر ومعاونيه في مجلة الدورة الدموية (سيركيوليشن)، المجلد: ٩٩، العدد (٢٥)، ص ٣٢٩٢-٣٢٩٩، ١٩٩٩م).

وتكشف براءة الاختراع الأمريكية رقم ٥٥٦٣١٧٣ (باسم ياتسو ومعاونيه) عن طريقة لتثبيط تكاثر خلايا العضلات الملساء بواسطة بيوتيرات الصوديوم، والذي يعمل على تثبيط فعالية كيناز PDGF-R.

وتكشف براءة الاختراع الأمريكية رقم ٥٤٧٦٨٥١ (باسم مايرز ومعاونيه) عن مركبات بيرازولو [٣،٤-ز] كينوكسالين، مثل مثبطات كيناز تيروزين بروتيني لمستقبلية PDGF.

وتبيّن أن المركب SU-6668، وهو مثبط تنافسي لـ ATP، يعمل على تثبيط الأسترة الفسفورية الذاتية لـ PDGF-R (انظر ما جاء عن ليرد ومعاونيه في مجلة أبحاث السرطان، المجلد: ٦٠، ص ٤١٥٢-٤١٦٠، ٢٠٠٠م).

وتكشف نشرة براءة الاختراع الدولية رقم ١/٧٩١٩٨ (باسم ريتش ومعاونيه) عن مركبات أمينوبيرازول بالصيغة التالية والتي تعمل على تعديل و/أو تثبيط فعالية أنزيمات الكيناز البروتينية.



وتكشف نشرة براءة الاختراع الدولية رقم ٠٢١٢٢٤٢ (باسم فانسيلي ومعاونيه) عن مركبات بيرازول ثنائي حلقي والتي تكون مفيدة في علاج أمراض ترتبط بأنزيمات كيناز بروتينية غير منظمة.

ولغاية الآن يعتبر المركب STI-571 (جليفيك)، المركب الوحيد الذي وصل إلى السوق بفعالية كبيرة لـ PDGF-R، مع أنه ليس مادة مضادة انتقائية لهذا الأنزيم. وعليه، لا تزال PDGF-R هدفاً يشد الانتباه إلى حد بعيد لتصميم مثبطات صغيرة الجزيئات فعالة وانتقائية ستمثل صنفًا جديدًا وهامًا من العوامل العلاجية لعلاج الأورام واضطرابات تكاثر خلوي أخرى.

ومن المراجع المتعلقة بعدد من مشتقات البيرازول ثلاثية الحلقة التي تحمل بدائل تلك المراجع التي تكشف عن استخدام هذه المشتقات بصفاتها: مثبطات لفعالية كيناز تيروزين (انظر نشرة براءة الاختراع الدولية رقم ٩٩/١٧٧٦٩ ونشرة براءة الاختراع الدولية رقم ٩٩/١٧٧٧٠؛ مثبطات أنزيمات كيناز تعتمد على السيكلين (انظر نشرة براءة الاختراع الدولية رقم ٩٩/٥٤٣٠٨؛ معدلات مستقبلية الاستروجين الانتقائية (انظر نشرة براءة الاختراع الدولية رقم ٠٠/٠٧٩٩٦؛ مسكنات (انظر براءة الاختراع الأمريكية رقم ٤,٤٢٠,٤٧٦)؛ مركبات للوقاية من الأمراض التي تسببها الفيروسات

الأنفية وعلاجها (انظر براءة الاختراع الأمريكية رقم ٤,٢٢٠,٧٧٦؛ وبراءة الاختراع الأمريكية رقم ٤,١٤٠,٧٨٥؛ مسكنات ذات فعالية مضادة للالتهاب (انظر براءة الاختراع الأمريكية رقم ٣,٩٢٨,٣٧٨؛ وما جاء عن سيلفيا شينون ومعاونيه في مجلة علم العقاقير (فارماكولوجي)، المجلد ٥٥، العدد (٥)، ص ٣٨٣-٣٨٨ (٢٠٠٠م))؛ قارنات سيان للصبغة الفوتوغرافية (انظر براءة الاختراع الأوروبية رقم ٠٦٢٠٤٨٩ وبراءة الاختراع اليابانية رقم ٨٠٢٢١٠٩؛ مركبات كينولين ونفثيريدين تستخدم كعقاقير (انظر براءة الاختراع اليابانية رقم ٦٠٩٢٩٦٣؛ ومعدلات مناعية (انظر براءة الاختراع اليابانية رقم ٦١٠٠٥٦١)؛ وعوامل مخفضة لجلوكون الدم (انظر ما جاء عن آر. راجا ريدي ومعاونيه في المجلة الهندية لكيمياء المركبات الحلقية المخلطة (انديان جورنال أف هيتروساينكلوك كيمستري)، المجلد: ٧، العدد (٣)، ص ١٨٩-١٩٢، ١٩٩٨م).

الوصف العام للاختراع:

يزود الاختراع الراهن مشتقات ٣-أمينو بيرازول ثلاثية الحلقة تحمل بدائل عند ذرة النتروجين تعمل كمثبطات لكيناز تيروزين مستقبلية PDGF (PDGF-R) واستخدام مثل هذه المركبات لعلاج اضطرابات التكاثر الخلوي أو اضطرابات ترتبط (أي، تقترب - أو تشترك مع) بمستقبلات عامل النمو المشتق من الصفائح الدموية (PDGF-R) مثل الأورام، معاودة التضيق، التهاب المفاصل شبه الروماتزمي، اعتلال الشبكية الدايابيطي وما أشبه.

ويوضح الاختراع تركيباً صيدلياً يشتمل على مادة حاملة مقبولة صيدلياً وأي مركب من المركبات بالصيغتين (I) و (II). كما يوضح الاختراع عملية لتحضير تركيب صيدلي تتضمن خلط أي مركب من المركبات بالصيغتين (I) و (II) ومادة حاملة مقبولة صيدلياً. ويوضح الاختراع الراهن أيضاً تركيباً صيدلياً يحضر بخلط أي مركب من المركبات بالصيغتين (I) و (II) ومادة حاملة مقبولة صيدلياً.

كما يتعلق الاختراع الراهن باستخدام مركب بالصيغتين (I) و (II) لمعالجة اضطراب يرتبط بـ PDGF-R أو اضطراب تكاثر خلوي عند كائن بطريقة تتضمن إعطاء ذلك الكائن مقداراً فعالاً علاجياً من مركب بالصيغتين (I) و (II). ويختار الاضطراب المرتبط بـ PDGF-R أو اضطراب التكاثر الخلوي من اضطرابات ورمية واضطرابات تكاثر خلوي أخرى. ويفضل أن يتمثل الاضطراب الورمي المذكور في سرطان يختار من سرطان ورم دبقي، سرطان رئة، سرطان شدي،

سرطان قولون ومستقيم، سرطان بروسات، سرطان معدي، سرطان مريئي، سرطان قولون، سرطان بنكرياسي، سرطان مبيضي، ورم ميلانيني، سوء نمو نخاعي، ورم نخاعي متعدد، لوكيميا وورم ليمفي، وتختار اضطرابات التكاثر الخلوي المذكورة الأخرى من التصلب العصيدي، أمراض الأوعية المستحثة بزرع الأعضاء، تكوين بطانة جديدة، تليف الرئة، الانتكاس البقي، معاودة التضيق، التليف الرئوي، التهاب كبيبات الكلى، تصلب كبيبات الكلى، سوء النمو الخلقي للكلية متعددة الأكياس، تليف الكلية، التهاب المفاصل شبه الروماتزمي واعتلال الشبكية الديابيطي.

ويوجه الاختراع نحو طريقة لتنشيط بداية حدوث اضطراب مرتبط بـ PDGF-R أو اضطراب تكاثر خلوي عند كائن خاضع للمعالجة تتضمن إعطاء ذلك الكائن الخاضع للمعالجة مقداراً فعالاً وقائياً من مركب بالصيغتين (I) و (II).

كما يشمل الاختراع علاجاً مؤثلاً لعلاج أو تثبيط بداية حدوث اضطراب مرتبط بـ PDGF-R أو اضطراب تكاثر خلوي عند كائن ما خاضع للمعالجة. ويتضمن العلاج المؤثف إعطاء الكائن الخاضع للمعالجة مقداراً فعالاً علاجياً أو وقائياً، بالترتيب، من مركب وفقاً للاختراع وعلاج واحد أو أكثر من العلاجات المضادة للتكاثر الخلوي بما في ذلك، على سبيل المثال لا الحصر، العلاج الكيميائي، العلاج بالأشعة، العلاج بالجينات والعلاج المناعي.

كما يزود الاختراع الراهن طريقة لمعالجة اضطراب تكاثر خلوي، ويفضل معاودة التضيق، التكاثر النسيجي البطاني، التهاب أو التصلب العصيدي في جدران الأوعية، تتضمن التصريف المضبوط لمركب وفقاً للاختراع، عن طريق إطلاقه من أداة طبية داخل تجويف الأنبوبة، بمقادير فعالة علاجياً.

ويزود الاختراع كذلك طريقة لمعالجة اضطراب تكاثر خلوي عند كائن خاضع للمعالجة، ويفضل اضطراب ورمي يختار من سرطان ورم دقي، سرطان رئة، سرطان ثدي، سرطان قولون ومستقيم، سرطان بروسات، سرطان معدي، سرطان مريئي، سرطان قولون، سرطان بنكرياسي، سرطان مبيضي، ورم ميلانيني، سوء نمو نخاعي، ورم نخاعي متعدد، لوكيميا وورم ليمفي، تتضمن إعطاء ذلك الكائن الخاضع للمعالجة مقداراً فعالاً علاجياً من مركب وفقاً للاختراع مقترناً بعامل استهداف.

كما يزود الاختراع طريقة لتقليل أو تثبيط فعالية الكيناز لـ PDGF-R أو c-Abl في خلية تتضمن خطوة ملاسة الخلية مع مركب بالصيغة (I) أو (II). ويزود الاختراع الراهن أيضاً طريقة لتثبيط فعالية الكيناز لـ PDGF-R أو c-Abl عند كائن خاضع للمعالجة تتضمن خطوة إعطائه مركباً بالصيغة (I) أو (II). كما يزود الاختراع الراهن طريقة لتثبيط التكاثر الخلوي في خلية تتضمن خطوة ملاسة الخلية مع مركب بالصيغة (I) أو (II).

ويزود الاختراع الراهن كذلك طريقة لتمييز مثبطات كيناز جديدة لـ PDGF-R. وتتضمن الطريقة الخطوات التالية:

(أ) تحديد بنية ثلاثية الأبعاد للمركب بالصيغة (I) أو (II) في عدم وجود أو وجود متعدد بيتيد يشتمل على الحقل الحفازي لكيناز PDGF-R؛

(ب) تحليل البنية ثلاثية الأبعاد للمركب وحده أو للتفاعل التبادلي بين الجزيئي بين المركب المذكور و PDGF-R؛

(ج) اختيار مركب يحاكي بنية المركب وحده أو يتضمن التفاعل التبادلي المتوقع؛

(د) تخليق المركب المصمم المذكور؛ و

(هـ) تحديد قدرة الجزيء على الارتباط مع كيناز PDGF-R وتثبيط فعاليته.

ويزود الاختراع الراهن كذلك طريقة لتمييز مثبطات كيناز c-Abl جديدة. وتتضمن الطريقة الخطوات التالية:

(أ) تحديد بنية ثلاثية الأبعاد للمركب بالصيغة (I) أو (II) في عدم وجود أو وجود متعدد بيتيد يشتمل على حقل حفازي لكيناز c-Abl؛

(ب) تحليل البنية ثلاثية الأبعاد للمركب وحده أو للتفاعل التبادلي بين الجزيئي بين المركب المذكور و c-Abl؛

(ج) اختيار مركب يحاكي بنية المركب وحده أو يتضمن التفاعل التبادلي المتوقع؛

(د) تخليق المركب المصمم المذكور؛ و

(هـ) تحديد قدرة الجزيء على الارتباط مع كيناز c-Abl وتثبيط فعاليته.

كما يوجه الاختراع الراهن نحو عمليات لتحضير مركبات بالصيغة (I) ومركبات بالصيغة

(II).

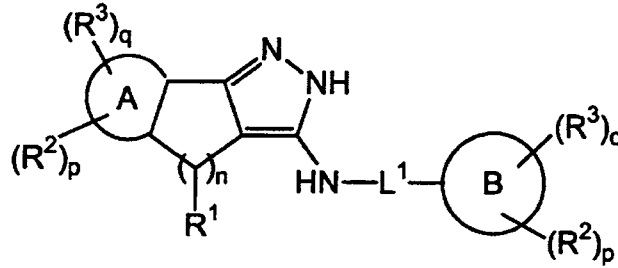
وستتضح سمات ومزايا أخرى للاختراع من خلال الوصف التفصيلي اللاحق للاختراع ومن عناصر الحماية.

الوصف التفصيلي :

يتعلق الاختراع الراهن بمشتقات جديدة لـ ٣-أمينو بيرازول ثلاثية الحلقة وتحمل بدائل عند ذرة النتروجين، تخليقها واستخدام المركبات المذكورة لمعالجة و/أو الوقاية من الإصابة باضطرابات مرتبطة بـ PDGF-R، مثل الأورام، معاودة التضيق، التهاب المفاصل شبه الروماتزمي، اعتلال الشبكية الديابيطي وما أشبه.

١. الصيغة (I)

يوجه الاختراع الراهن نحو مركبات بالصيغة (I):



الصيغة (I)

حيث،

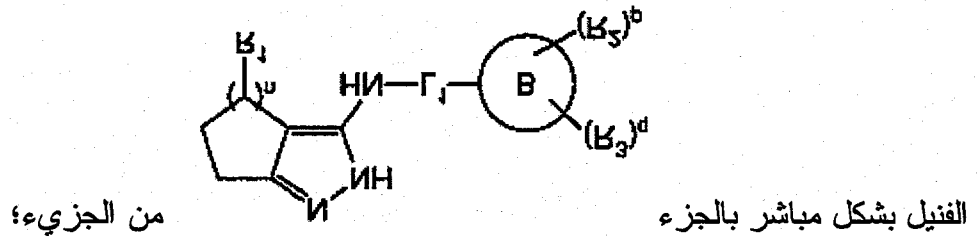
n يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من ١ إلى ٤؛

R^1 يختار من الفئة التي تتكون من هيدروجين، ألكيل منخفض (الوزن الجزيئي)، -OH،

ألكوكسي، أكسو، -NH₂، (ألكيل)-NH و -N(ألكيل)₂؛

A

يختار من الفئة التي تتكون من مجموعة أريل، أريل مخلط أحادي الحلقة به خمسة أو ستة أعضاء، أريل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، ألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث ترتبط مجموعة الأريل المخلط المدمج مع البنزو، الألكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو بالجزء على نحو يكفل ارتباط حلقة



P يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

R^2 يختار من الفئة التي تتكون من $\text{X}-A^1-\text{Y}-A^2$ ؛ حيث،

X و Y غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من -NH-، -O-، -N(ألكيل)-، -C(=O)-، -NHC(=O)-، -C(=O)O-، -OC(=O)-، -SO₂-، -SO-، -S-، -N(ألكيل)-، -C(=O)N(ألكيل)-، -OC(=O)NH-، -NHC(=O)O-، -OC(=O)O-، -C(=O)N(ألكيل)-، -N(ألكيل)C(=O)NH-، -NHC(=O)N(ألكيل)-، -NHC(=O)NH-، -OC(=O)N(ألكيل)-، -N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)-، -SO₂N(ألكيل)-، -N(ألكيل)SO₂-، -SO₂NH-، -NH₂SO₂-، -N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)-، -SO₂N(ألكيل)- و -N(ألكيل)SO₂-؛

A^1 غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛

A^2 يختار من ألكيل، ألكينيل أو H؛ حيث، عندما يمثل A^1 أو A^2 ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من هالوجين، سيانو، هيدروكسي، ألكوكسي، ثيو، ألكوكسي مهلجن، ألكيل-OC(=O)-،

الكيل $OC(=O)O$ ، أمينو، الكيل أمينو، الكيل $NHC(=O)$ ، الكيل $C(=O)N$ (الكيل)، ثاني الكيل أمينو، -
 $NHC(=O)NH_2$ ، الكيل $NHC(=O)NH$ ، الكيل $C(=O)NH$ (الكيل)، الكيل $C(=O)NH_2$ (الكيل)، الكيل-
 $OC(=O)NH$ ، الكيل $NHC(=O)O$ ، الكيل $C(=O)O$ (الكيل)، الكيل $NHSO_2$ ، الكيل SO_2 (الكيل)، ثيو
الكيل، ثيو الكيل مهلجن، الكيل SO_2 ، الكيل SO_2 مهلجن، $NHC(=O)N$ (الكيل) $_2$ ،
 $NHC(=O)N$ (الكيل) $_2$ أو $OC(=O)N$ (الكيل) $_2$ ؛

(D)

يختار من الفئة التي تتكون من أريل، الكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة
جزئياً، أريل مخلط، الكيل حلقي مخلط، الكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء والكيل
حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث يمكن أن يحمل الأريل، الألكيل الحلقي،
الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخلط، الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج
مع البنزو أو الألكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل
على حدة من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، الكيل، الكيل مهلجن، الكوكسي،
الكوكسي مهلجن، الكيل أمينو، الكيل $NHC(=O)$ ، الكيل $C(=O)N$ (الكيل)، أو ثاني الكيل أمينو، -
 $NHC(=O)NH_2$ ، الكيل $NHC(=O)NH$ ، الكيل $C(=O)NH$ (الكيل)، الكيل $OC(=O)NH$ ، الكيل-
 $NHC(=O)O$ ، الكيل $C(=O)O$ (الكيل)، الكيل $NHSO_2$ ، الكيل SO_2 (الكيل)، ثيو الكيل، ثيو الكيل
مهلجن، الكيل SO_2 ، الكيل SO_2 مهلجن، $NHC(=O)N$ (الكيل) $_2$ ، $NHC(=O)N$ (الكيل) $_2$ أو
 $OC(=O)N$ (الكيل) $_2$ ؛

q يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛

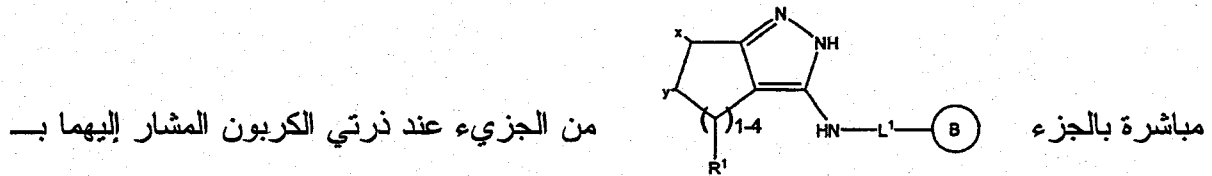
R^3 يختار من الفئة التي تتكون من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، الكيل،
الكيل مهلجن، الكوكسي، الكيلوكسي مهلجن، الكيل أمينو، الكيل $NHC(=O)$ ، الكيل $C(=O)N$ (الكيل)،
أو ثاني الكيل أمينو، الكيل $NHC(=O)NH_2$ ، الكيل $NHC(=O)NH$ ، الكيل $C(=O)NH$ (الكيل)، الكيل-
 $OC(=O)NH$ ، الكيل $NHC(=O)O$ ، الكيل $C(=O)O$ (الكيل)، الكيل $NHSO_2$ ، الكيل SO_2 (الكيل)، ثيو
الكيل، ثيو الكيل مهلجن، الكيل SO_2 ، الكيل SO_2 مهلجن، $NHC(=O)N$ (الكيل) $_2$ ،
 $NHC(=O)N$ (الكيل) $_2$ و $OC(=O)N$ (الكيل) $_2$ ؛

شريطة أن يكون حاصل جمع p و q مساوياً لعدد صحيح تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛
 L^1 غير موجود أو يختار من الفئة التي تتكون من الألكيل؛

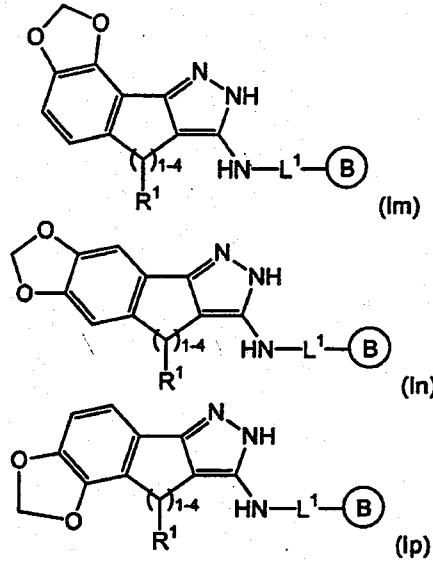
(B) يختار من الفئة التي تتكون من أريل، الألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة جزئياً، أريل
 مخلط، ألكيل حلقي مخلط، الألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء والألكيل حلقي مخلط
 مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛

أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منها، تكون مفيدة لعلاج
 اضطرابات مرتبطة بـ PDGF-R.

(A) يمثل مجموعة أريل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو
 عشرة أعضاء، الألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء أو الألكيل حلقي مدمج مع
 بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، فإنه ترتبط مجموعة الأريل المخلط المدمج مع البنزو، الألكيل الحلقي
 المخلط المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو بالجزء بشكل يكفل ارتباط حلقة الفينيل



(A) "x" و "y". فعلى سبيل المثال، حيثما يمثل
 ٣،٤-مثيلين ديوكسي فنيل يخلو من البدائل،
 فإنه يمكن أن ترتبط مجموعة ١،٣-مثيلين ديوكسي فنيل ببقية المركب بالصيغة (I) لتكوين مركب
 بالصيغة (Im)، (In) أو (Ip):



حيث سوف يتضح الاتجاه الدقيق من خلال البنية أو اسم المركب المحضّر.

١. أ. التجسيّدات المتعلّقة بالصيغة (I)

في تجسيد للاختراع الراهن، ^(A) يختار من الفئة التي تتكون من فنيّل، ثيينيل، بيريديل، بيريميدينيل، فوريل، أيزوكسازوليل، إيميدازوليل، بيرازوليل و ٣،٤-مثيلين ديوكسي

فنيّل. ويفضل أن يختار ^(A) من الفئة التي تتكون من فنيّل، ثيينيل و ٣،٤-مثيلين

ديوكسي فنيّل. وفي تجسيد آخر للاختراع الراهن، ^(A) يختار من الفئة التي تتكون من

أريل مخلط به خمسة أو ستة أعضاء. وفي تجسيد آخر للاختراع الراهن، $\textcircled{A}$ يختار من الفئة التي تتكون من أريل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء. وفي تجسيد مفضل للاختراع الراهن، R^1 يختار من الفئة التي تتكون من هيدروجين، هيدروكسي، مثيل وأكسو، ويفضل أن يمثل R^1 هيدروجين أو مثيل.

وفي تجسيد للاختراع الراهن، n يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من ١ إلى ٢. وفي تجسيد آخر للاختراع الراهن، p يمثل قيمة تساوي صفراً و q يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢. وفي تجسيد آخر أيضاً للاختراع الراهن، p يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من ١ إلى ٢ و q يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ١.

وفي تجسيد للاختراع الراهن، R^2 يمثل $\textcircled{D}$ $\text{---}A^1\text{---}X\text{---}$ حيث X ، A^1 و

$\textcircled{D}$ كما عرفت في هذا البيان. ويفضل أن يمثل X ذرة O . وفي تجسيد آخر للاختراع الراهن، X يمثل O و $\textcircled{D}$ يمثل ألكيل حلقي مخلط أو أريل مخلط، حيث يحمل الألكيل الحلقي المخلط أو الأريل المخلط بشكل اختياري بديلاً واحداً إلى ثلاثة بدائل تختار كل على حدة من هالوجين، ألكوكسي، هيدروكسي، أمينو، ألكيل أمينو أو ثاني ألكيل أمينو.

وفي تجسيد آخر للاختراع الراهن، R^2 يمثل $X-A^1-Y-A^2$ حيث X ، A^1 ، Y ، A^2 كما عرفت في هذا البيان. ويفضل أن يكون X و Y غير موجودين أو يمثل كل منهما على حدة O .

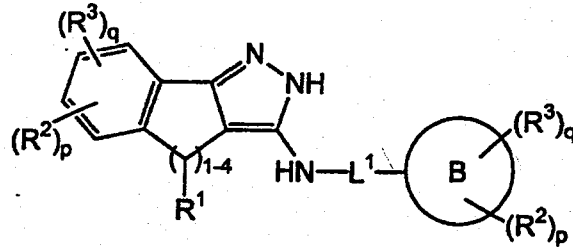
وفي تجسيد للاختراع الراهن، R^3 يختار من الفئة التي تتكون من ألكوكسي، هالوجين أمينو، ثاني ألكيل أمينو، ألكيل منخفض وهيدروكسي. ويفضل أن يمثل R^3 ألكيل منخفض أو ألكوكسي منخفض.

وفي تجسيد للاختراع الراهن، L^1 يمثل ألكيل منخفض، ويفضل مثيلين. وفي تجسيد آخر للاختراع الراهن، يكون L^1 غير موجود.

وفي تجسيد مفضل للاختراع الراهن، $\textcircled{B}$ يمثل أريل، أريل مخلط، ألكيل حلقي

أو ألكيل حلقي مخلط. ويفضل أن يمثل **(B)** أريل أو أريل مخلط.

ويتضمن تجسيد للاختراع الراهن مركباً بالصيغة (Ia):



الصيغة (Ia)

حيث $n, R^1, p, R^2, q, R^3, L^1$ و **(B)** كما عرفت في هذا البيان للصيغة (I)، أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه.

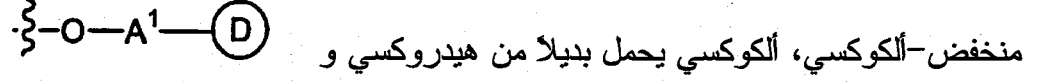
ويتضمن تجسيد مفضل آخر للاختراع الراهن مركباً بالصيغة (I) حيث n يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من ١ إلى ٢؛
 R^1 يمثل هيدروجين؛

(A) يختار من الفئة التي تتكون من مجموعة فنيل، أريل مخلط به خمسة أو ستة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث ترتبط مجموعة الألكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو والذي به تسعة أو عشرة أعضاء بالجزء بشكل

يكفل ارتباط حلقة الفينيل مباشرة بجزء الجزيء؛ ويفضل أن يختار **(A)** من الفئة التي تتكون من فنيل، ثيينيل، و ١،٣-بنزوديوكسوليل؛

P يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

R^2 يختار من الفئة التي تتكون من ثاني (ألكيل منخفض) أمينو-ألكوكسي، ألكيل



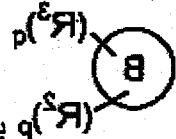
حيث A^1 يختار من الفئة التي تتكون من ألكيل منخفض؛ حيث يحمل الألكيل المنخفض بشكل اختياري بديلاً واحداً أو بديلين يختار كل منهما على حدة من هيدروكسي، أمينو، ألكيل أمينو أو ثاني ألكيل أمينو؛

وحيث D يختار من الفئة التي تتكون من أريل مخلط به خمسة أو ستة أعضاء وألكيل حلقي مخلط به خمسة أو ستة أعضاء؛ حيث يحمل الأريل المخلط أو الألكيل الحلقي المخلط بشكل اختياري بديلاً واحداً أو بديلين يختار كل منهما على حدة من هالوجين، ألكيل منخفض، ألكوكسي منخفض، أمينو، ألكيل منخفض أمينو أو ثاني (ألكيل منخفض) أمينو؛ ويفضل أن يختار R^2 من الفئة التي تتكون من ٣-ثاني ميثيل أمينو-بروبوكسي، ٣-مثنوكسي-بروبوكسي، ٢،٣-ثاني هيدروكسي-بروبوكسي، ٣-هيدروكسي-بروبوكسي، ٢-هيدروكسي-٣-بيروليدينيل (١)-بروبوكسي و ٣-(٤)-مethyl-بييرازينيل (١)-بروبوكسي؛

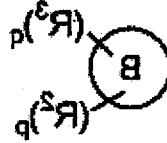
q يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

R^3 يختار من الفئة التي تتكون من ألكيل منخفض وألكوكسي منخفض، وهالوجين؛ ويفضل أن يختار R^3 من الفئة التي تتكون من ميثيل، مثنوكسي، إيثوكسي.

L^1 غير موجود أو يمثل ألكيل منخفض، ويفضل أن يكون L^1 غير موجود أو يمثل CH_2 ؛



$q(R^4)$ يختار من الفئة التي تتكون من مجموعة فنيل وأريل مخلط به خمسة أو ستة أعضاء؛ حيث تحمل مجموعة الفينيل أو الأريل المخلط بشكل اختياري بديلاً واحداً أو بديلين يختار كل منهما على حدة من هالوجين، ألكيل منخفض، ألكوكسي منخفض أو



بنزيلوكسي؛ ويفضل أن يختار R^1 من الفئة التي تتكون من فنيل وبيريديل؛ حيث يحمل الفينيل بشكل اختياري بديلاً واحداً أو بديلين يختار كل منهما على حدة من فلورو، كلورو، ميثيل، ميثوكسي أو بنزيلوكسي؛

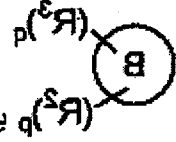
أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه.

ويتضمن تجسيد آخر للاختراع الراهن مركباً بالصيغة (I) حيث R^1 يختار من الفئة التي تتكون من هيدروجين وألكيل منخفض؛ ويفضل أن يختار R^1 من هيدروجين أو ميثيل؛

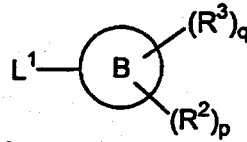
اختار من الفئة التي تتكون من فنيل، أريل مخلط به خمسة أو ستة أعضاء وأريل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث يحمل الفينيل، الأريل المخلط الذي به خمسة أو ستة أعضاء أو الأريل المخلط المدمج مع البنزو والذي به تسعة أو عشرة أعضاء بشكل اختياري بديلاً واحداً أو بديلين يختار كل منهما على حدة من هالوجين، ألكيل منخفض، ألكوكسي منخفض، ثالث فلورو ميثيل، ثالث فلورو ميثوكسي، ثاني فلورو ميثوكسي أو ألكوكسي منخفض-ألكوكسي منخفض؛

ويفضل أن يختار من الفئة التي تتكون من فنيل، ٣،٥-ثاني ميثوكسي فنيل، ٤،٥-ثاني ميثوكسي فنيل، ٤،٥-ثاني (ثالث فلورو ميثوكسي)-فينيل، ٤،٥-ثاني (ميثوكسي إيثوكسي)-فينيل، ٤،٥-ثاني (ميثوكسي بروبوكسي)-فينيل، ٤،٥-ثاني (أيزوبروبوكسي)-فينيل، ٤،٥-ثاني (ثاني فلورو ميثوكسي)-فينيل، ٤-كلورو-٥-ميثوكسي-فينيل، ٤-ميثوكسي إيثوكسي-٥-إيثوكسي-فينيل، بيريدينيل، فوريل، ٥-كلورو-ثيينيل، ٣-إيثوكسي-ثيينيل، أيزوكسازوليل، ٣-ميثيل-أيزوكسازوليل، ٢-ميثيل-٨-إيثوكسي-بنزوكسازوليل، بنزوئينيل،

L^1 غير موجود أو يختار من ألكيل منخفض، ويفضل أن يكون L^1 غير موجود أو يختار من ميثيل أو إيثيل؛



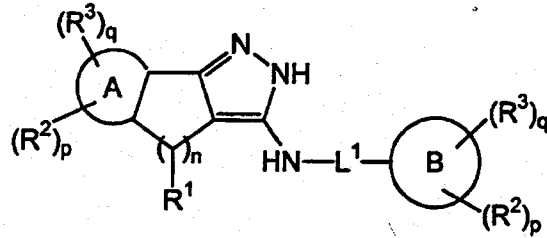
أعضاء؛ حيث تحمل مجموعة الأريل أو الأريل المخطط بشكل اختياري بديلاً واحداً أو بديلين يختار كل منهما على حدة من هالوجين، ألكيل منخفض، ألكيل منخفض يحمل بديلاً من هيدروكسي، ألكوكسي منخفض، أمينو كبريتونيل، (ألكيل منخفض) أمينو، ثاني (ألكيل منخفض) أمينو، ثاني (ألكيل منخفض) أمينو-ألكوكسي كربونيل، ألكوكسي منخفض كربونيل، ألكيل حلقى مخطط-ألكيل منخفض أمينو كربونيل، ثاني (ألكيل منخفض) أمينو-ألكيل منخفض أمينو كربونيل أو أريل مخطط-ألكيل منخفض أمينو كربونيل؛ حيث يحمل جزء الأريل المخطط أو الألكيل الحلقى المخطط في الألكيل الحلقى المخطط-الألكيل المنخفض أمينو الكربونيل أو الأريل المخطط-الألكيل المنخفض أمينو الكربونيل بشكل اختياري بديلاً يختار من ألكيل منخفض، هيدروكسي أو ألكيل منخفض يحمل بديلاً من هيدروكسي؛



ويفضل أن يختار من الفئة التي تتكون من فنيل، بنزيل، فنيل إثيل، هكسيل حلقى، هكسيل حلقى-مethyl، ٣-هيدروكسي-هكسيل حلقى، ٤-هيدروكسي-هكسيل حلقى، ٢-فلورو بنزيل، ٢-كلورو بنزيل، ٣-كلورو بنزيل، ٢،٣-ثاني كلورو بنزيل، ٢،٦-ثاني كلورو بنزيل، ٢-فلورو فنيل إثيل، ٣-فلورو فنيل، ٣-برومو فنيل، ٣-كلورو فنيل، ٢-مethyl بنزيل، ٣-مethyl بنزيل، ٣-مثنوكسي فنيل، ٤-مثنوكسي فنيل، ٣-هيدروكسي مethyl فنيل، ٢-هيدروكسي مethyl بنزيل، ٣-كلورو-٤-فلورو-بنزيل، ٢-أمينو كبريتونيل-بنزيل، ٢-أمينو كبريتونيل-فنيل، ٣-أمينو كبريتونيل-فنيل، ٤-أمينو كبريتونيل-فنيل، ٣-ثاني مethyl أمينو-فنيل، ٣-ثاني مethyl أمينو-إثيل أمينو كربونيل-فنيل، ٣-إيثوكسي كربونيل-فنيل، ٣-بيروليدينيل (١)-إثيل أمينو كربونيل-فنيل، ٣-بيروليدينيل (١)-إثيل أمينو كربونيل-فنيل، ٣-بيروبيد أمينو كربونيل-فنيل، ٣-ثاني مethyl أمينو-إثيل أمينو كربونيل-فنيل، ٣-إيميدازوليل (١)-إثيل أمينو كربونيل-فنيل، ٣-إيثوكسي مethyl بيروليدينيل (١)-إثيل أمينو كربونيل-فنيل، ٣-بيروبيد-إثيل، بيروبيدينيل-مethyl و ٣-مethyl-إيميدازوليل-مethyl؛ أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه.

١. ب تحضير المركبات بالصيغة (I)

يوجه الاختراع الراهن كذلك نحو عملية لتحضير مركبات بالصيغة (I)



الصيغة (I)

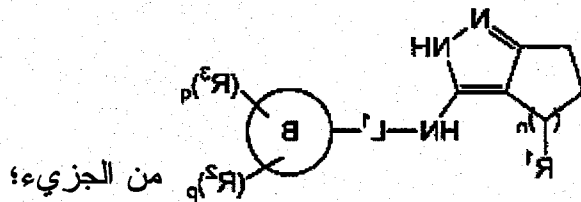
حيث،

n يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من ١ إلى ٤؛

R¹ يختار من الفئة التي تتكون من هيدروجين، ألكيل منخفض، -OH، ألكوكسي، أكسو، -NH₂، (ألكيل)-NH و -N(ألكيل)₂؛

(A)

يختار من الفئة التي تتكون من مجموعة أريل، أريل مخطط أحادي الحلقة به خمسة أو ستة أعضاء، أريل مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، ألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث ترتبط مجموعة الأريل المخطط المدمج مع البنزو، الألكيل الحلقي المخطط المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو بالجزء على نحو يكفل ارتباط حلقة



الفنيل بشكل مباشر بالجزء

من الجزء؛

P يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

R^2 يختار من الفئة التي تتكون من $\begin{array}{c} \text{---} X - A^1 - \text{---} \textcircled{D} \\ \text{---} X - A^1 - Y - A^2 \end{array}$ ؛ حيث،

X و Y غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من -NH-، -O-

-N(ألكيل)C(=O)- ، -NHC(=O)- ، -C(=O)O- ، -OC(=O)- ، -SO₂- ، -SO- ، -S- ، -N(ألكيل)-
 -(ألكيل)C(=O)O- ، -OC(=O)NH- ، -NHC(=O)O- ، -OC(=O)O- ، -C(=O)N(ألكيل)- ، C(=O)NH-
 ، -N(ألكيل)C(=O)NH- ، -NHC(=O)N(ألكيل)- ، -NHC(=O)NH- ، -OC(=O)N(ألكيل)- ، N
 ؛ -SO₂N(ألكيل)- و -N(ألكيل)SO₂- ، -SO₂NH- ، -NH-SO₂ ، -N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)-.

A^1 غير موجود أو يختار من الكيل أو الكينيل؛

A^2 يختار من الكيل، الكينيل أو H؛ حيث، عندما يمثل A^1 أو A^2 الكيل أو الكينيل، فإنه يمكن

أن تحمل مجموعة الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من هالوجين، سيانو، هيدروكسي، ألكوكسي، ثيو، ألكوكسي مهلجن، ألكيل(=O)-OC، ألكيل O(=O)-OC، أمينو، ألكيل أمينو، ألكيل NHC(=O)-، ألكيل C(=O)N(ألكيل)، ثاني ألكيل أمينو، -NHC(=O)NH₂، -(ألكيل)NH(=O)NHC، ألكيل NH(=O)C(=O)N(ألكيل)، ألكيل NH(=O)C(=O)NH₂، ألكيل OC(=O)NH، ألكيل O(=O)NHC، ألكيل C(=O)O(ألكيل)N، ألكيل SO₂N(ألكيل)، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO₂-، ألكيل SO₂-مهلجن، A₂(ألكيل)N(=O)NHC، A₂(ألكيل)N(=O)N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل) أو A₂(ألكيل)N(=O)-OC؛

④

يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة جزئياً،

أريل مخلط، الأكيل حلقي مخلط، الأكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء والكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث يمكن أن يحمل الأريل، الأكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخلط، الأكيل الحلقي المخلط، الأكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الأكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، أكيل، أكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكوكسي مهلجن، أكيل أمينو، أكيل NHC(=O) ، أكيل C(=O)(الكيل)-N ، أو ثاني أكيل أمينو، NHC(=O)NH_2 ، أكيل NHC(=O)NH ، أكيل C(=O)NH(الكيل)-N ، (أكيل OC(=O)NH ، أكيل NHC(=O)O ، أكيل C(=O)O(الكيل)-N ، أكيل NHSO_2 ، أكيل $\text{SO}_2(الكيل)-N$ ، ثيو أكيل، ثيو أكيل مهلجن،

ألكيل-SO₂، ألكيل-SO₂ مهلجن، -NHC(=O)N(ألكيل)₂، -N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل) أو -OC(=O)N(ألكيل)₂؛

q يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛

R³ يختار من الفئة التي تتكون من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نثرو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل-NHC(=O)، ألكيل-N(ألكيل)C(=O)، أو ثاني ألكيل أمينو، -NHC(=O)NH₂، ألكيل-NHC(=O)NH، ألكيل-N(ألكيل)C(=O)NH، ألكيل-OC(=O)NH، ألكيل-NHC(=O)O، ألكيل-N(ألكيل)C(=O)O، ألكيل-NHSO₂، ألكيل-SO₂N(ألكيل)، ألكيل-SO₂ مهلجن، -NHC(=O)N(ألكيل)₂، -N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)₂ و -OC(=O)N(ألكيل)₂؛

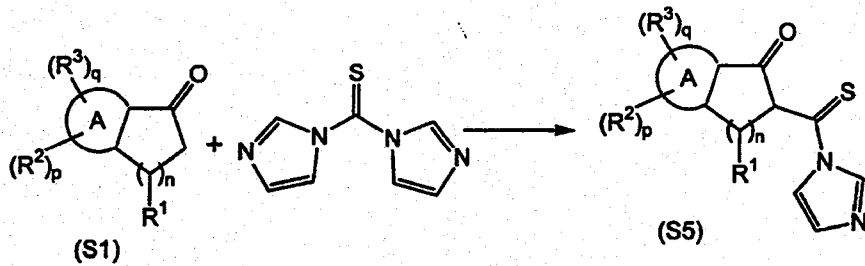
شريطة أن يكون حاصل جمع p و q مساوياً لعدد صحيح تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛

L¹ غير موجود أو يختار من الفئة التي تتكون من ألكيل؛

(B)

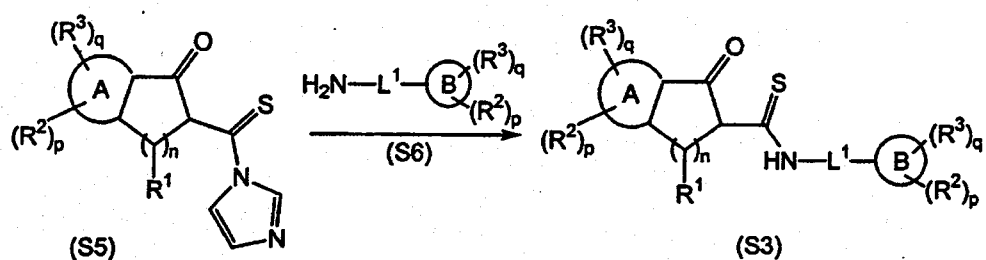
يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة جزئياً، أريل مخطط، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛

أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منها،
تتضمن:

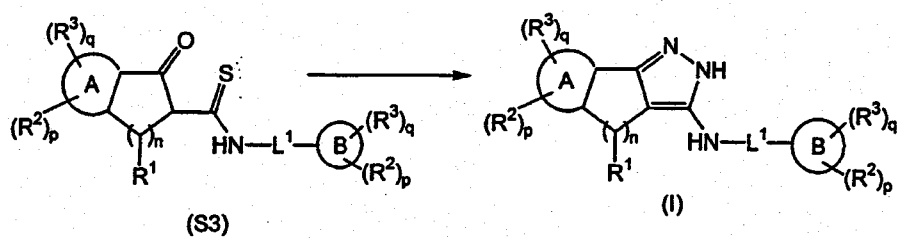


مفاعلة مركب بالصيغة (S1) مع ١،١'-ثيوكربونيل إيميدازول، في وجود قاعدة، في مذيب لا

بروتوني، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (S5)؛



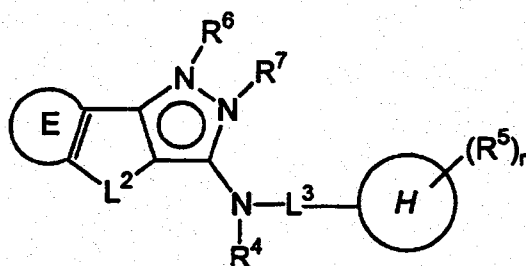
مفاعلة المركب بالصيغة (S5) مع مركب بالصيغة (S6)، في مذيب لا بروتوني، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (S3)؛



مفاعلة المركب بالصيغة (S3) مع هيدرازين، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (I).

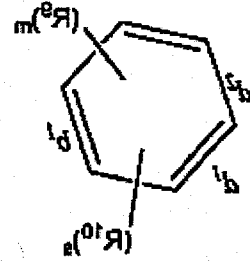
٢. الصيغة (II)

يوجه الاختراع الراهن كذلك نحو مركبات بالصيغة (II):



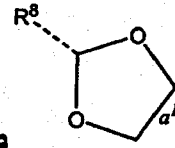
حيث:

(E) يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:



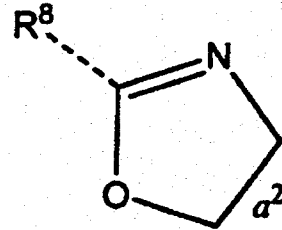
(الصيغة أ-١)،

حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II) وتحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً
 . يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-١-ب و أ-١-ج:



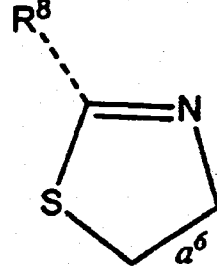
، صيغة أ-١-أ'،

حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ' من جهة a^1 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2
 للصيغة أ-١؛



(الصيغة أ-١-ب)،

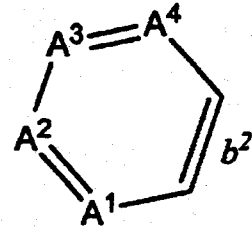
حيث ترتبط الصيغة أ-١ ب من جهة a^2 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و



(الصيغة أ-١-ج)،

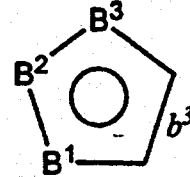
حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

حيث R^8 يمثل H أو ألكيل؛



(الصيغة أ-٢)،

حيث ترتبط الصيغة أ-٢ من جهة b^2 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، ويمثل A^1, A^2, A^3, A^4 (i)-N- أو (ii) C- يحمل بديلاً من H أو ألكوكسي، حيث يمكن أن يحمل الألكوكسي أيضاً بشكل اختياري بديلاً من ألكوكسي على ذرة كربون طرفية أو ما لا يزيد عن ٣ ذرات هالوجين على ذرة كربون طرفية؛ شريطة أن يمثل واحداً على الأقل من A^1, A^2, A^3, A^4 أو اثنين على الأكثر N-؛ و



(الصيغة أ-٣)،

$-\text{OC}(=\text{O})$ ، $-\text{O}-$ ، $-\text{NH}\text{SO}_2-$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{O}-$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})-$ ،
 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، $-\text{SO}_2-$ ، $-\text{SO}-$ ، $-\text{S}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})\text{O}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})\text{NH}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})-$ ،
 $-\text{SO}_2\text{NH}-$

A^{20} غير موجود أو يختار من الكيل أو الكينيل؛ و

A^{21} يختار من الكيل، الكينيل أو H؛

حيث عندما يمثل A^{20} أو A^{21} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل SO_2 -مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل $C(=O)N(ألكيل)$ ، $N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)$ ، $N(ألكيل)C(=O)NH_2$ ، ألكيل $C(=O)NH(ألكيل)$ ، ألكيل $C(=O)O(ألكيل)$ ، ألكيل $SO_2(ألكيل)$ ، ألكيل $NHC(=O)NH_2$ ، ألكيل $NHC(=O)NH(ألكيل)$ ، ألكيل $NHC(=O)N(ألكيل)$ ، ألكيل $NHC(=O)O$ ، ألكيل $OC(=O)N(ألكيل)$ ، ألكيل $OC(=O)O$ ، ألكيل $OC(=O)NH$ ، ثيو أو ثيو ألكيل؛

(G) يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، الأليل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة جزئياً،
أريل مخطط، الأليل حلقي مخطط، الأليل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء والأليل حلقي
مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث يحمل الأريل، الأليل الحلقي، الحلقة الكربونية
غير المشبعة جزئياً، الأريل المخطط، الأليل الحلقي المخطط، الأليل الحلقي المدمج مع البنزو أو
الأليل الحلقي المخطط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من
هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، الأليل، الأليل مهلجن، الكوكسي، الكوكسي مهلجن،
الأليل أمينو، الأليل -NHC(=O)-NH-، الأليل C(=O)(الأليل)-N-، أو ثاني الأليل أمينو، NHC(=O)-NH-
الأليل NH-C(=O)-NH-، الأليل C(=O)NH-(الأليل)-N-، الأليل OC(=O)-NH-، الأليل NH-C(=O)-OH-،
الأليل O=C(=O)-(الأليل)-N-، الأليل SO₂-C(=O)-(الأليل)-N-، ثيو الأليل، ثيو الأليل مهلجن،
الأليل-SO₂-، الأليل-SO₂مهلجن، NHC(=O)-N(الأليل)₂-، الأليل-N(الأليل)-C(=O)-N(الأليل)- أو (الأليل)₂-.

؛OC(=O)N

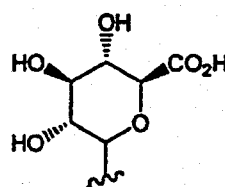
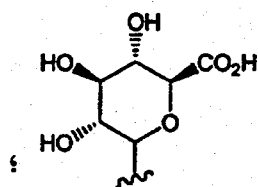
s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

(E) بديلاً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s يساوي

عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤، وعندما يحمل (E) بديلاً واحداً من الصيغة أ-
 ١-أ'، ١-ب أو ١-ج، فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر
 إلى ٢؛

R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

5H (1)



(ب) شريطة أن R^4 لا يمثل $\text{HO}-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{R})_2$

(ج) -CH₂- يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: -H، -مethyl، -alkyl-O، -CH₂OH، -

ألكيل $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OH}$ ، ألكيل $\text{-O}(\text{C}=\text{O})$ ، $\text{-C}(\text{O})\text{OH}$ ، ألكيل $\text{-C}(\text{O})\text{O}$ ، أريل $\text{-C}(\text{O})\text{O}$ ، أريل

مخلوط $-C(=O)O$ ، $-C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-(C=O)NH$ ، $-(C=O)N$ (ألكيل) $_2$ ، ألكيل $-C(=O)$

OCH_3 -فنييل- أو ألكيل $\text{OC}(=\text{O})$ -فنييل-؛

(د) $\text{C}(=\text{O})(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{1-10}$ ينتهي بـ H، مئيل، ائيل أو بنزيل؛

(هـ) $-C(=O)CH_2O(CH_2CH_2O-)_{1-10}$ ينتهي بـ H، مئيل، ائيل أو بنزيل؛

(و) ألكيل $\text{C}(=\text{O})$ أو ألكيل حلقي $\text{C}(=\text{O})(\text{C}_{3-6})$ ، حيث يمكن أن يحمل ألكيل $\text{C}(=\text{O})$ المذكور

والأكيل حلقى $\text{C}(\text{O})(\text{C}_{3-6})$ - المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار

كل على حدة من: -OH، ألكيل-O، أريل ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH، -N(ألكيل)₂، ألكيل

حلقى مخطأ، ألكيل NHC(=O)- ، ألكيل NHSO_2- أو ألكيل OC(=O)- ؛

(ز) أریل $(\text{CH}_2)_{1-3}$ -C(=O)-، أریل -C(=O)-، أریل مخطط $(\text{CH}_2)_{1-3}$ -C(=O)- أو أریل مخطط-

$C(=O)$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $(CH_2)_{1-3}C(=O)$ المذكور، أريل $C(=O)$ - المذكور، أريل

مخاطبات $\text{C}(=\text{O})(\text{CH}_2)_{1-3}$ المذكور وأريل مخاطبات $\text{C}(=\text{O})$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة

على حدة من: OH-، ألكيل-O، NH₂، ألكيل-NH، N(ألكيل)₂، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل-NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂، ألكيل-OC(=O)، ألكينيل-OC(=O)، أريل-ألكيل-NHC(=O)، OH-C(=O)، ألكيل-O-C(=O)، -C(=O)NH₂، ألكيل-C(=O)NH، أو (ألكيل)₂-C(=O)N؛ وحيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل-NHC(=O) المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل-OH، ألكيل-O، NH₂، ألكيل-NH، N(ألكيل)₂، هالوجين أو نتريل؛

(ن) أريل-C(=O)NH(CH₂)₁₋₃، أريل-C(=O)NH(CH₂)₁₋₃ مخطط-C(=O)NH(CH₂)₁₋₃ أو أريل مخطط-C(=O)NH، حيث يمكن أن يحمل أريل-C(=O)NH(CH₂)₁₋₃ المذكور، أريل-NH(=O)-C المذكور، أريل مخطط-C(=O)NH(CH₂)₁₋₃ المذكور، وأريل مخطط-C(=O)NH المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: OH-، ألكيل-O، NH₂، ألكيل-NH، N(ألكيل)₂، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل-NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂، هالوجين، نتريل أو ألكيل-OC(=O)؛

(ع) -C(=O)NHCH₂CH₂NH(CH₂CH₂NH-)₀₋₃ ينتهي بـ H-، ميثيل، اثيل، ألكيل-CH₂CH₂NH، (ألكيل)₂CH₂CH₂N، -CH₂CH₂-1-بيروليدينيل، -CH₂CH₂-1-بيبيريدينيل، -CH₂CH₂-4-مورفولينيل، -CH₂CH₂-1-بيبرازينيل، -CH₂CH₂-1-(4-CH₃)-بيبرازينيل، -CH₂CH₂OH، -CH₂CH₂OCH₃، -CH₂CH₂OCH₂CH₃، ألكيل-CH₂CH₂OC(=O) أو أريل-C(=O)؛ حيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل-C(=O) المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل-OH، ألكيل-O، NH₂، ألكيل-NH، N(ألكيل)₂، هالوجين أو نتريل؛

(ف) -C(=S)NH₂؛

(ق) ألكيل-NH-C(=S)؛

(ر) N(ألكيل)₂-C(=S)؛

(ش) -SO₂NH₂؛

(ت) ألكيل-SO₂NH؛

(ث) N(ألكيل)₂-SO₂؛

٥

١٠

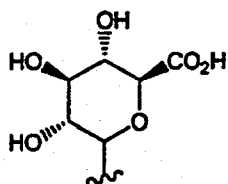
١٥

٢٠

٢٥

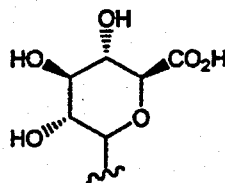
$$\text{!-P(=O)(OCH}_2\text{CH}_3)_2 \quad (\dot{\text{!}})$$

1.



؛ شريطة أنه إذا كان

R^4 يختار من الفئة التي تتكون من: H و



فان R^4 يمثل H ؛

R^6 أو R^7 يمثل

L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من ألكيل دييل، كربونيل

أو -SO₂-؛

يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقى، حلقة كربونية غير مشبعة جزئياً،

أر الكيل، أريـل مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، أريـل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛

r يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ و

R^5 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: الأكيل، الأكيل أمينو، الأكيلوكسي، أمينو،

-C(=O)NH_2 ، الأكيل -C(=O)O ، -C(=O)OH ، $\text{-CH}_2\text{OH}$ ، سيانو، ثاني الأكيل أمينو، هالوجين، الأكيل
 مهلجن، الأكيلوكسي مهلجن، الأكيل- SO_2 مهلجن، ثيو الأكيل مهلجن، هيدروكسي، هيدروكسي
 الأكيل، الأكيل -C(=O)N(الأكيل) ، $\text{-N(الأكيل)C(=O)N(الأكيل)}$ ، الأكيل -C(=O)NH(الأكيل) ،
 الأكيل -C(=O)O(الأكيل) ، الأكيل $\text{-SO}_2(الأكيل)$ ، الأكيل -NHC(=O)N(الأكيل) ،
 -NHC(=O)NH_2 ، الأكيل -NHC(=O)O ، الأكيل -NH_2 ، الأكيل -NHSO_2 ، نثرو، $\text{-N(الأكيل)C(=O)N(الأكيل)}$ ،

OC ، الكيل $\text{OC}(=\text{O})\text{NH}$ ، الكيل SO_2 -

[illegible]

B^{10} غير موجود أو يختار من الكيل أو الكينيل؛

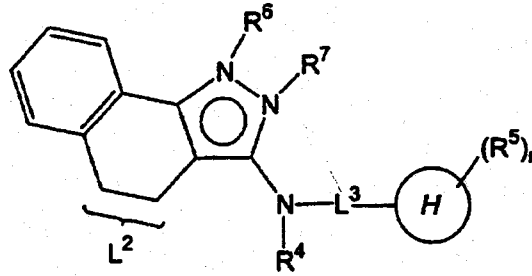
B^{20} غير موجود أو يختار من ألكيل، ألكينيل أو H؛

حيث عندما يمثل B^{10} أو B^{20} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل- SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل $C(=O)N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل) $_2C(=O)N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل) $C(=O)NH_2$ ، ألكيل $C(=O)NH$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل) $C(=O)O$ ألكيل SO_2 (ألكيل)، ألكيل $NHC(=O)NH$ ألكيل $NHC(=O)NH_2$ ، $-NHC(=O)N$ (ألكيل) $_2$ ، ألكيل $NHC(=O)O$ ، ألكيل $NHC(=O)N$ (ألكيل) $_2$ ، ألكيل $OC(=O)NH$ ألكيل $OC(=O)N$ (ألكيل) $_2$ ، ألكيل $NHSO_2$ ، ألكيل $NHC(=O)O$ ، ألكيل $OC(=O)NH$ ، ألكيل $OC(=O)N$ (ألكيل) $_2$ ، ألكيل $OC(=O)O$ ، ألكيل $OC(=O)N$ ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل؛ و

(F) يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة جزئياً، أريل مخطط، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء،

حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخلط، الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو بشكل

L^2 يمثل $-CH_2CH_2-$ و $\textcircled{E}$ يمثل فنيل، فإن نقطة الارتباط كما هي مبينة أدناه:

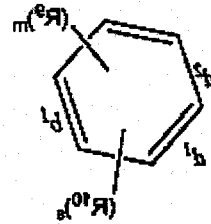


١.٢ تجسيديات الصيغة (II)

١.أ.٢

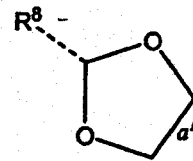
تشمل تجسيديات أخرى للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث يتغير كل من L^2 ، E ، R^6 ، R^7 ، R^4 ، L^3H و $(R^5)_r$ كما هو مبين أدناه على حدة وتوليفات من تغييراتها. ويشمل أحد تجسيديات الاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:



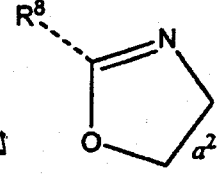
(الصيغة أ-١)،

حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II) وتحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢، أ-٣ و أ-٤-ج:



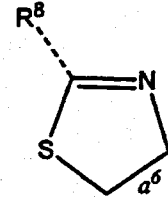
(الصيغة أ-١-أ')، حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ' من جهة a^1 بذرتي

الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛



لصيغة أ-١-ب)، حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2 بذرتي الكربون

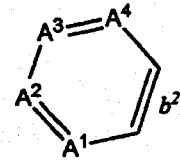
المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و



(الصيغة أ-١-ج)، حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي

الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

حيث R^8 يمثل H أو ألكيل منخفض؛

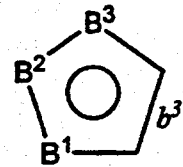


(الصيغة أ-٢)، حيث ترتبط الصيغة أ-٢ من جهة b^2 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)،

ويمثل واحداً أو اثنين من A^1, A^2, A^3, A^4 -N-؛ والبقية تكون عبارة عن -C- يحمل بديلاً من H أو

الكوكسي، حيث يمكن أن يحمل الألكوكسي أيضاً بشكل اختياري بديلاً من الكوكسي على ذرة كربون

طرفية أو ما لا يزيد عن ٣ ذرات هالوجين على ذرة كربون طرفية؛ و



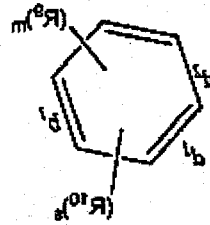
(الصيغة أ-٣)، حيث ترتبط الصيغة أ-٣ من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)،

ويمثل كل من B^1, B^2, B^3 على حدة (i) -CH- يحمل بديلاً بشكل اختياري من ألكيل C_{14} ، أريل،

ألكوكسي، أو هالوجين، (ii) -S-، (iii) -O- أو (iv) -N-؛ شريطة أن واحداً على الأكثر من B^1 ، B^2 أو B^3 يمثل -S- أو -O-، و، شريطة أنه عندما B^1 ، B^2 أو B^3 يمثل -S- أو -O-، فإن أعضاء الحلقة المجاورة لا تمثل -S- أو -O-.

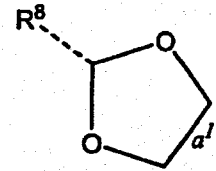
ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

(E) يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:



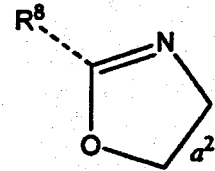
(الصيغة أ-١)،

حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II) وتحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-١-أ، أ-١-ب و أ-١-ج:



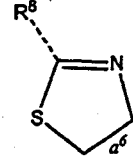
(الصيغة أ-١-أ)، حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ من جهة a^1 بذرتي الكربون

المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛



(الصيغة أ-١-ب)، حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2 بذرتي الكربون

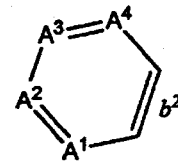
المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و



(الصيغة أ-١-ج)، حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي الكربون

المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

حيث R^8 يمثل H أو ألكيل منخفض؛

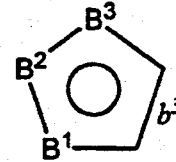


(الصيغة أ-٢)، حيث تختار الصيغة أ-٢ من الفئة التي تتكون من بيريديل

وبيريميدينيل؛ وترتبط من جهة b^2 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)؛ وتحمل بشكل اختياري بديلاً على

عضو حلقة كربونية من H أو ألكوكسي، حيث يمكن أن يحمل الألكوكسي أيضاً بشكل اختياري بديلاً

من ألكوكسي على ذرة كربون طرفية أو ما لا يزيد عن ٣ ذرات هالوجين على ذرة كربون طرفية؛ و



(الصيغة أ-٣)، حيث تختار الصيغة أ-٣ من الفئة التي تتكون من ثيينيل،

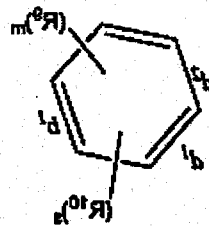
أيزوكسازوليل وفوريل؛ وترتبط من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، وتحمل بشكل اختياري بديلاً

على عضو حلقة كربونية من ألكيل C_{1-4} ، أريل، ألكوكسي أو هالوجين.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

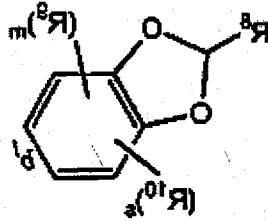


يختار من الفئة التي تتكون من:



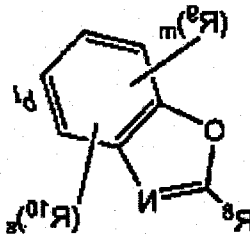
(الصيغة أ-٤)،

حيث ترتبط الصيغة أ-٤ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)؛



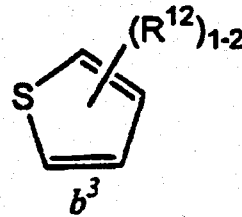
(الصيغة أ-٥)،

حيث ترتبط الصيغة أ-٥ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)؛ و



(الصيغة أ-٦)،

حيث ترتبط الصيغة أ-٦ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)؛ و



(الصيغة أ-٣-أ')،

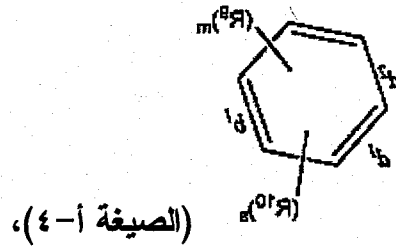
حيث ترتبط الصيغة أ-٣-أ' من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، حيث R^{12} يختار كل على حدة من H، ميثيل، فنييل، اثوكسي، كلورو أو فلورو؛ وحيث

m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما $\textcircled{E}$ يمثل الصيغة أ-٤، فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح

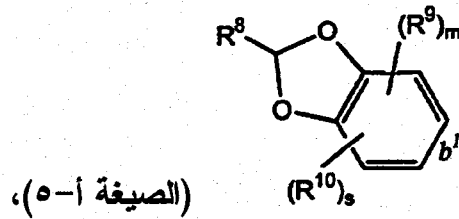
$\textcircled{E}$

قيمته من صفر إلى ٤، وعندما يمثل الصيغة أ-٥ أو الصيغة أ-٦، فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢. ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

(E) يختار من الفئة التي تتكون من:

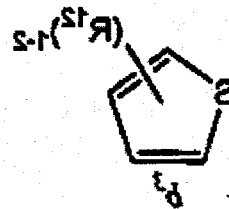


حيث ترتبط الصيغة أ-٤ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II):



حيث ترتبط الصيغة أ-٥ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)؛ حيث R^8 يمثل H وألكيل منخفض؛

و



حيث ترتبط الصيغة أ-٣-أ' من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، حيث R^{12} يختار كل على حدة من H، مثيل، فنييل، اثوكسي، كلورو أو فلورو، وحيث

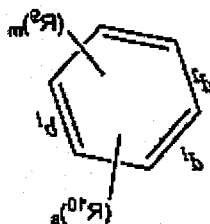
من H، منيل، قبيل، انوكسي، كلورو او فلورو، وحيث
 m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما
 الصيغة أ-٤، فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته

من صفر إلى ٤؛ وعندما $\odot E$ يمثل الصيغة أ-٥، فإن حاصل جمع m و s يساوي

عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث

(E) یمثل:



(الصيغة أ-٤)،

حيث ترتبط الصيغة أ-٤ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)؛ وحيث m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر ٤؛ شريطة أنه عندما

الصيغة أ-٤، فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل C(=O)N(ألكيل)، N_2 (ألكيل)C(=O)N(ألكيل)، ألكيل C(=O)NH(ألكيل)، ألكيل O(=O)N(ألكيل)، ألكيل SO₂(ألكيل)، ألكيل NHC(=O)N(ألكيل)، ألكيل NHC(=O)N(ألكيل)₂

NHC(=O)NH_2 ، ألكيل NHC(=O)NH ، ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل NHSO_2 ، $(\text{ألكيل})_2$ ، OC(=O)N ، ألكيل OC(=O)NH وثيو ألكيل.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي، ألكيل، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، هيدروكسي، ألكيل NHC(=O) ، ألكيل NHC(=O)NH ، ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل NHSO_2 ، وثيو ألكيل.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي، ألكيل، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، هيدروكسي وألكيل NHC(=O) .

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ميثوكسي، إيثوكسي، أيزوبروبوكسي، ميثيل أمينو، سيانو، N,N -ثاني ميثيل-أمينو، برومو، كلورو، فلورو، ثالث فلورو ميثيل، ثالث فلورو ميثوكسي، هيدروكسي و $\text{N-(1-أكسو-اثيل)-أمينو}$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من $-(\text{CH}_2)_{3-4}$ ، $-(\text{CH}_2)-$ ، $-(\text{CH}_2\text{R}^{100})_2$ ، $-\text{OCH}(\text{R}^{100})-$ ، $-\text{O}(\text{CH}_2)_{1-4}-$ ، $-\text{O}-$ ، $-\text{C}(\text{R}^{100})_2-$ ، $-\text{C}(\text{R}^{100})=\text{C}-$ ، $-\text{CH}(\text{R}^{100})-$ ، $-\text{NH}-$ ، $-\text{S}-$ ، $-\text{OC}(\text{R}^{100})_2-$ ، $-\text{OCH}(\text{R}^{100})-$ ، $-\text{O}(\text{CH}_2)_{1-4}-$ ، $-\text{O}-$ ، $-\text{C}(\text{R}^{100})_2-$ ، $-\text{C}(\text{R}^{100})=\text{C}-$ ، $-\text{CH}(\text{R}^{100})-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل منخفض})-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})-\text{CO}$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})-\text{CO}_2$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})-\text{CONH}$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})-\text{SO}_2$ و $-\text{N}(\text{ألكيل})-\text{SO}_2$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: $-(\text{CH}_2)_{1-4}$ ، $-(\text{CH}_2)-$ ، $-(\text{CH}_2\text{R}^{100})_2$ ، $-\text{OCH}(\text{R}^{100})-$ ، $-\text{O}(\text{CH}_2)_{1-4}-$ ، $-\text{O}-$ ، $-\text{C}(\text{R}^{100})_2-$ ، $-\text{C}(\text{R}^{100})=\text{C}-$ ، $-\text{CH}(\text{R}^{100})-$ ، $-\text{NH}-$ ، $-\text{S}-$ ، $-\text{OC}(\text{R}^{100})_2-$ ، $-\text{OCH}(\text{R}^{100})-$ ، $-\text{O}(\text{CH}_2)_{1-4}-$ ، $-\text{O}-$ ، $-\text{C}(\text{R}^{100})_2-$ ، $-\text{C}(\text{R}^{100})=\text{C}-$ ، $-\text{CH}(\text{R}^{100})-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل منخفض})-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})-\text{CO}$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})-\text{CO}_2$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})-\text{CONH}$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})-\text{SO}_2$ و $-\text{N}(\text{ألكيل})-\text{SO}_2$ ؛ حيث R^{200} يختار من: ألكيل، هيدروكسي، ألكيل، أكسو، NH_2 ، $\text{NH}(\text{ألكيل})$ و $\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})=\text{N}(\text{OH})$ أو NH_2OH .

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: $-(CH_2)_{1-4}-$ ، $-CH(R^{100})-$ ، $-C(=R^{100})-$ ، $-C(R^{100})_2-$ ، $-O-$ ، $-O(CH_2)_{1-4}-$ ، $-OCH(R^{100})-$ ، $-OC(R^{100})_2-$ ، $-NH-$ ، $-(\text{الكيل منخفض})-$ ، $-N(\text{الكيل CO})-$ ، $-N(\text{أريل})-$ ، $-N(\text{الكيل CO}_2)-$ ، $-N(\text{الكيل CONH})-$ ، $-N(\text{الكيل SO}_2)-$ و $-N(\text{أريل SO}_2)-$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: $-(CH_2)_{1-4}-$ ، $-CH(R^{100})-$ ، $-C(=R^{100})-$ ، $-C(R^{100})_2-$ ، $-O(CH_2)_{1-4}-$ ، $-OCH(R^{100})-$ ، $-OC(R^{100})_2-$ ، $-NH-$ ، $-(\text{الكيل منخفض})-$ ، $-N(\text{الكيل CO})-$ ، $-N(\text{أريل})-$ ، $-N(\text{الكيل CO}_2)-$ ، $-N(\text{الكيل CONH})-$ ، $-N(\text{الكيل SO}_2)-$ و $-N(\text{أريل SO}_2)-$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: $-(CH_2)_{1-4}-$ ، $-(CH_2)_{3-4}-$ ، $-CH(R^{100})-$ ، $-C(=R^{100})-$ ، $-C(R^{100})_2-$ ، $-O(CH_2)_{1-4}-$ ، $-OCH(R^{200})-$ ، $-OC(R^{100})_2-$ ، $-NH-$ ، $-(\text{الكيل منخفض})-$ ، $-N(\text{الكيل CO})-$ ، $-N(\text{أريل})-$ ، $-N(\text{الكيل CO}_2)-$ ، $-N(\text{الكيل CONH})-$ ، $-N(\text{الكيل SO}_2)-$ و $-N(\text{أريل SO}_2)-$ ؛ حيث R^{200} يختار من: ألكيل، هيدروكسي، أريل، أكسو، NH_2 ، $-(\text{الكيل})-$ ، $-(\text{الكيل})_2-$ ، $-N(OH)=$ أو $-NH_2OH$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: $-(CH_2)_{1-4}-$ ، $-CH(R^{100})-$ ، $-C(=R^{100})-$ ، $-C(R^{100})_2-$ ، $-O-$ ، $-O(CH_2)_{1-4}-$ ، $-OCH(R^{100})-$ ، $-OC(R^{100})_2-$ ، $-S-$ ، $-NH-$ ، $-(\text{الكيل منخفض})-$ ، $-N(\text{الكيل CO})-$ ، $-N(\text{أريل})-$ ، $-N(\text{الكيل CO}_2)-$ ، $-N(\text{الكيل CONH})-$ ، $-N(\text{الكيل SO}_2)-$ و $-N(\text{أريل SO}_2)-$ ؛ شريطة أنه عندما L^2 يمثل $-CH_2CH_2-$ ، فإنه لا يمثل أي من R^6 أو R^7 ألكيل- $CH_2-(C=O)NH$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: $-(CH_2)_{1-4}-$ ، $-CH(R^{100})-$ ، $-C(=R^{100})-$ ، $-C(R^{100})_2-$ ، $-O-$ ، $-O(CH_2)_{1-4}-$ ، $-OCH(R^{100})-$ ، $-OC(R^{100})_2-$ ، $-S-$ ، $-NH-$ ، $-(\text{الكيل منخفض})-$ ، $-N(\text{الكيل CO})-$ ، $-N(\text{أريل})-$ ، $-N(\text{الكيل CO}_2)-$ ، $-N(\text{الكيل CONH})-$ ، $-N(\text{الكيل SO}_2)-$ و $-N(\text{أريل SO}_2)-$.

-CH₂-N(SO₂أريل)؛ شريطة أنه عندما L² يمثل -CH₂CH₂، فإنه لا يمثل أي من R⁶ أو R⁷ ألكيل -CH₂-
 (C=O)NH أو (C=O)N(ألكيل)₂ -CH₂-

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L² يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: -(CH₂)₁₋₄، -CH(R¹⁰⁰)،
 -(R¹⁰⁰)، -C(=R¹⁰⁰)، -C(R¹⁰⁰)₂، -O-، -O(CH₂)₁₋₄، -OCH(R¹⁰⁰)، -OC(R¹⁰⁰)₂، -S-، -NH-، (ألكيل)ل
 -N(أريل)، -N(ألكيل)، -N(CO₂ألكيل)، -N(ألكيل)، -N(SO₂أريل)، -N(ألكيل)، -N(ألكيل)،
 -N(SO₂أريل)؛ شريطة أنه عندما L² يمثل -CH₂CH₂، فإنه لا يمثل أي من R⁶ أو R⁷ ألكيل -
 CH₂C(=O)O

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L² يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: -(CH₂)₁₋₄، -
 -CH(R¹⁰⁰)، -C(=R¹⁰⁰)، -C(R¹⁰⁰)₂، -O-، -O(CH₂)₁₋₄، -OCH(R¹⁰⁰)، -OC(R¹⁰⁰)₂، -S-، -NH-،
 -N(أريل)، -N(ألكيل)، -N(CO₂ألكيل)، -N(ألكيل)، -N(SO₂أريل)، -N(ألكيل)، -N(ألكيل)،
 -N(SO₂أريل)؛ شريطة أنه عندما L² يمثل -CH₂CH₂، فإنه لا يمثل أي من R⁶ أو R⁷ ألكيل -
 CH₂C(=O)O أو -CH₂C(=O)N(ألكيل)₂ -CH₂-

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L² يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: -(CH₂)₁₋₄، -CH(R¹⁰⁰)،
 -(R¹⁰⁰)، -C(=R¹⁰⁰)، -C(R¹⁰⁰)₂، -O-، -O(CH₂)₁₋₄، -OCH(R¹⁰⁰)، -OC(R¹⁰⁰)₂، -S-، -NH-، (ألكيل)ل
 -N(أريل)، -N(ألكيل)، -N(CO₂ألكيل)، -N(ألكيل)، -N(SO₂أريل)، -N(ألكيل)، -N(ألكيل)،
 -N(SO₂أريل)؛ شريطة أنه عندما L² يمثل -OCH(R¹⁰⁰)، R¹⁰⁰ يمثل الكوكسي، و (H) يمثل
 فنيل، فإن R⁵ لا يمثل -C(=O)NH-NH₂

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L² يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: -(CH₂)₁₋₄، -CH(R¹⁰⁰)،
 -(R¹⁰⁰)، -C(=R¹⁰⁰)، -C(R¹⁰⁰)₂، -O-، -O(CH₂)₁₋₄، -OCH(R¹⁰⁰)، -OC(R¹⁰⁰)₂، -S-، -NH-، (ألكيل)ل

منخفض) -N، -N(الكيل CO)، -N(أريل)، -N(الكيل CO₂)، -N(الكيل CONH)، -N(الكيل SO₂) و -N(أريل SO₂)؛ شريطة أنه عندما L² يمثل -O، فإن R⁶ أو R⁷ لا يمثل أي منهما -CH₃.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L² يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: -(CH₂)₁₋₄، -CH(R¹⁰⁰)، -C(=R¹⁰⁰)، -C(R¹⁰⁰)₂، -O، -O(CH₂)₁₋₄، -OCH(R¹⁰⁰)، -OC(R¹⁰⁰)₂، -S، -NH، - (الكيل) -N(منخفض)، -N(الكيل CO)، -N(أريل)، -N(الكيل CO₂)، -N(الكيل CONH)، -N(الكيل SO₂) و -N(أريل SO₂)؛ شريطة أنه عندما L² يمثل -S، فإن R⁶ أو R⁷ لا يمثل أي منهما -CH₃.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L² يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: -(CH₂)₁₋₄، -CH(R¹⁰⁰)، -C(=R¹⁰⁰)، -C(R¹⁰⁰)₂، -O، -O(CH₂)₁₋₄، -OCH(R¹⁰⁰)، -OC(R¹⁰⁰)₂، -S، -NH، - (الكيل) -N(منخفض)، -N(الكيل CO)، -N(أريل)، -N(الكيل CO₂)، -N(الكيل CONH)، -N(الكيل SO₂) و -N(أريل SO₂)؛ شريطة أنه عندما L² يمثل -O أو -S، فإن R⁶ أو R⁷ لا يمثل أي منهما -CH₃.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L² يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: -(CH₂)₁₋₄، -CH(R¹⁰⁰)، -C(=R¹⁰⁰)، -C(R¹⁰⁰)₂، -O، -O(CH₂)₁₋₄، -OCH(R¹⁰⁰)، -OC(R¹⁰⁰)₂، -S، -NH، - (الكيل) -N(منخفض)، -N(الكيل CO)، -N(أريل)، -N(الكيل CO₂)، -N(الكيل CONH)، -N(الكيل SO₂) و -N(أريل SO₂)؛ شريطة أنه عندما L² يمثل -O أو -S، فإن R⁶ أو R⁷ لا يمثل أي منهما -CH₃.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L² يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: -(CH₂)₁₋₄، -CH(R¹⁰⁰)، -C(=R¹⁰⁰)، -C(R¹⁰⁰)₂، -O، -O(CH₂)₁₋₄، -OCH(R¹⁰⁰)، -OC(R¹⁰⁰)₂، -S، -NH، - (الكيل) -N(منخفض)، -N(الكيل CO)، -N(أريل)، -N(الكيل CO₂)، -N(الكيل CONH)، -N(الكيل SO₂) و -N(أريل SO₂)؛ شريطة أنه عندما L² يمثل -O أو -S، فإن R⁶ أو R⁷ لا يمثل أي منهما -CH₃.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

R¹⁰⁰ يختار من: ألكيل، هيدروكسي، أريل، أكسو، أو =N(OH).

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

R¹⁰⁰ يختار من: ألكيل، هيدروكسي، أريل أو أكسو.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

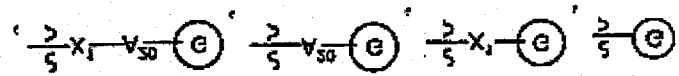
R^{100} يختار من: مثيل، هيدروكسي، فني، أكسو، أو $=N(OH)$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

R^{100} يختار من: مثيل، هيدروكسي، فني، أو أكسو.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

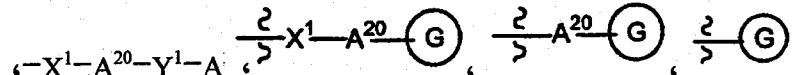
R^{10} يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من



$-A^{21}$ و $-A^{20}-A^{21}$ ، $-X^1-A^{21}$ ، $-X^1-A^{20}-A^{21}$ ، $-X^1-A^{20}-Y^1-A^{21}$

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

R^{10} يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من



$-X^1-A^{20}-Y^1-A^{21}$ ، $-X^1-A^{21}$ و $-X^1-A^{20}-A^{21}$

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II):

حيث X^1 و Y^1 غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من

الفئة التي تتكون من: $-NHC(=O)NH$ ، $-NHC(=O)-$ ، $-NH-$ ، $-C(=O)O-$ ، $-C(=O)NH-$ ،

$-OC(=O)O-$ ، $-OC(=O)NH-$ ، $-OC(=O)-$ ، $-O-$ ، $-NHSO_2-$ ، $-NHC(=O)O-$ ،

$-S-$ ، $-SO-$ ، $-SO_2-$ و $-SO_2NH-$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II):

حيث X^1 و Y^1 غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي

تتكون من: $-NH-$ ، $-O-$ ، $-SO_2-$ و $-SO_2NH-$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II):

حيث X^1 و Y^1 غير موجودين أو يمثل كل منهما على حدة من $-O-$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II)، حيث X^1 غير موجود أو يمثل -O-.
 ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II)، حيث Y^1 غير موجود.
 ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II)، حيث:
 A^{20} غير موجود أو يمثل ألكيل؛ و

حيث عندما A^{20} يمثل ألكيل، يمكن أن يحمل الألكيل اختياريًا مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل-SO₂-مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل-C(=O)(ألكيل)-N،
 $(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)-N$ ، $(ألكيل)C(=O)NH(ألكيل)-N$ ، ألكيل-C(=O)NH(ألكيل)-N،
 ألكيل-C(=O)O(ألكيل)-N، ألكيل-SO₂(ألكيل)-N، ألكيل-NHC(=O)-N،
 $(ألكيل)_2NHC(=O)-N$ ، ألكيل-NHC(=O)O(ألكيل)-N، ألكيل-NHC(=O)NH(ألكيل)-N،
 $(ألكيل)OC(=O)N(ألكيل)-N$ ، ألكيل-OC(=O)NH(ألكيل)-N، ألكيل-OC(=O)O(ألكيل)-N،
 ألكيل-SO₂-ثيو أو ثيو ألكيل.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II)، حيث:

A^{20} غير موجود أو يمثل ألكيل؛ و

حيث عندما A^{20} يمثل ألكيل، يمكن أن يحمل الألكيل اختياريًا مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، هيدروكسي،
 $NHC(=O)NH(ألكيل)-N$ ، ألكيل-NHC(=O)NH(ألكيل)-N، ألكيل-SO₂-ثيو أو ثيو ألكيل.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II)، حيث:

A^{20} غير موجود أو يختار من مثيل، اثيل، بروبيل أو أيزوبروبيل؛ حيث يحمل المثيل، الاثيل، البروبيل أو الأيزوبروبيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ثاني ألكيل أمينو أو هيدروكسي.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II)، حيث:

A^{20} غير موجود أو يختار من مثيل، اثيل، بروبيل أو أيزوبروبيل؛ حيث يحمل المثيل، الاثيل، البروبيل أو الأيزوبروبيل اختياريًا مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: مثوكسي، ثاني مثيل-أمينو أو هيدروكسي.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

A^{21} يختار من الكيل، الكينيل أو H؛ و

[illegible]

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

A^{21} يختار من الكيل، الكينيل أو H؛ و

حيث عندما يمثل A^{21} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: الكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، الكوكسي مهلجن، هيدروكسي، $-NHC(=O)NH_2$ ، ألكيل $-NHSO_2-$ ، أو ثيو ألكيل.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث A^{21} يمثل H.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة

جزئياً، أربل مخطط والكيل حلقي مخطط يحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، الكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل NHC(=O) ، ألكيل C(=O)(الكيل)-N ، أو ثاني ألكيل أمينو، - NHC(=O)NH_2 ، ألكيل NHC(=O)NH ، ألكيل C(=O)NH(الكيل)-N ، ألكيل OC(=O)NH ، ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل C(=O)O(الكيل)-N ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل $\text{SO}_2(الكيل)-N$ ،

ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل-SO₂، ألكيل-SO₂ مهلجن، $(\text{ألكيل})_2\text{N}(\text{C}=\text{O})\text{NHC}=\text{O}$ ،
 $(\text{ألكيل})_2\text{N}(\text{C}=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$ أو $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$.
 ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، أريل مخلط وألكيل حلقي مخلط يحمل

(G)

بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو،
 نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل -
 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$ ، أو ثاني ألكيل أمينو، $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل-
 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}$ ألكيل $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}$ ألكيل $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$ ، ألكيل $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$ ، ألكيل $\text{NHC}(\text{O})\text{O}$ ،
 ألكيل $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$ ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل $\text{SO}_2\text{N}(\text{ألكيل})$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن،
 ألكيل SO_2 ، ألكيل SO_2 مهلجن، $(\text{ألكيل})_2\text{NHC}(\text{O})\text{N}$ ، $(\text{ألكيل})_2\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$ أو $(\text{ألكيل})_2\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$.
 $\text{OC}(\text{O})\text{N}$

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

يختار من الفئة التي تتكون من فنييل، إيميدازوليل، بيروليدينيل، بيريدينيل

(G)

ومورفولينيل يحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من هالوجين، هيدروكسي،
 أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو،
 ألكيل $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$ ، أو ثاني ألكيل أمينو، $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل-
 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}$ ألكيل $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}$ ألكيل $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$ ، ألكيل $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$ ، ألكيل $\text{NHC}(\text{O})\text{O}$ ،
 ألكيل $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$ ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل $\text{SO}_2\text{N}(\text{ألكيل})$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن،
 ألكيل SO_2 ، ألكيل SO_2 مهلجن، $(\text{ألكيل})_2\text{NHC}(\text{O})\text{N}$ ، $(\text{ألكيل})_2\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$ أو $(\text{ألكيل})_2\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$.
 $\text{OC}(\text{O})\text{N}$ أو $(\text{ألكيل})_2\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}=\text{O}$

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

(G)

يختار من الفئة التي تتكون من فئيل، إيميدازوليل، بيروليدينيل، بيريدينيل ومورفولينيل يحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، نترو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ثاني ألكيل أمينو، ألكيل-NHSO₂ أو ألكيل-SO₂.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

(G)

يختار من الفئة التي تتكون من فئيل، إيميدازوليل، بيروليدينيل، بيريدينيل

١٠ ومورفولينيل يحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من كلورو، فلورو، هيدروكسي أو ألكيل.

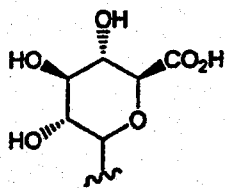
ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

R^9 و R^{10} يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من: ١-بييريدينيل، ٢-(بيروليدينيل، ١٠ ((١))-إثوكسي، ٢، ٣-ثاني هيدروكسي بروبوكسي، ٢-هيدروكسي-٣-بيروليدينيل (١)-بروبوكسي، ٣-(٤)-مثيل-بييرازينيل (١)-بروبوكسي، ٣-(N,N-ثاني مثيل-أمينو)-بروبوكسي، ٣-هيدروكسي-بروبوكسي، ٣-إيميدازوليل (١)-بروبوكسي، ٣-مثوكسي-بروبوكسي، ٣-مورفولينيل (٤)-بروبوكسي، ٣-بيروليدينيل (١)-٢-هيدروكسي-بروبوكسي، ٣-بيروليدينيل (١)-بروبوكسي، ٤-مثيل-بييرازينيل (١)، أمينو، بنزيل، بنزيلوكسي، برومو، كلورو، سيانو، اثوكسي، فلورو، H، هيدروكسي، أيزوبروبوكسي، مثوكسي، مثيل، N-(١-أكسو-اثيل)-أمينو، و N,N-ثاني مثيل-أمينو.

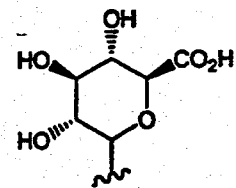
ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H؛



شريطة أن R^4 لا يمثل



(ب)

(ج) -CH₂- يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: -H، مثيل، ألكيل-O، -CH₂OH، -

CH(CH₃)OH، ألكيل-O(C=O)، -C(=O)OH، ألكيل-O(C=O)، أريل-O(C=O)، أريل

مخلوط-O(C=O)، -C(=O)NH₂، ألكيل-NH(C=O)، -C(=O)N(ألكيل)، ألكيل-

C(=O)، OCH₃-فنيل، أو ألكيل-OC(=O)-فنيل؛

(د) -C(=O)(CH₂CH₂O-)₁₋₁₀ ينتهي بـ H؛

(هـ) -C(=O)CH₂O(CH₂CH₂O-)₁₋₁₀ ينتهي بـ H؛

(و) ألكيل-C(=O) يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -

OH، ألكيل-O، أريل ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH، -N(ألكيل)، ألكيل حلقي مخلوط، ألكيل-

NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂، أو ألكيل-OC(=O)؛

(ز) أريل-C(=O)(CH₂)₁₋₃ أو أريل-C(=O)، حيث يمكن أن يحمل أريل-C(=O) المذكور، بشكل

اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-

NH، -N(ألكيل)، ألكيل حلقي مخلوط، ألكيل-NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂، هالوجين،

نتريل أو ألكيل-OC(=O)؛

(ح) -C(=O)(CH₂)₁₋₆ ينتهي بمثيل، اثيل، -OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH، -N(ألكيل) أو

ألكيل حلقي مخلوط؛

(ح ح) ألكيل-ألكيل-OC(=O) ينتهي بـ -OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH، أو -N(ألكيل)؛

(ط) -C(=O)O(CH₂CH₂O-)₁₋₁₀ ينتهي بـ H، مثيل، اثيل أو بنزيل؛

(ي) ألكيل-O(C=O) يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:

-OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH، -N(ألكيل)، ألكيل حلقي مخلوط، ألكيل-

NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂، ألكيل-OC(=O)، -C(=O)OH، ألكيل-O(C=O)، -

C(=O)NH₂، ألكيل-NH(C=O)، أو -C(=O)N(ألكيل)؛

(ك) أريل-C(=O)O(CH₂)₁₋₃ أو أريل-C(=O)O، حيث يمكن أن يحمل أريل-C(=O)O المذكور

بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH، ألكيل-O، -NH₂،

ألكيل-NH₂، (ألكيل-N)، ألكيل حلقي مخط، ألكيل-NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂، هالوجين، نتريل أو ألكيل-OC(=O)؛

[illegible]

(م) $-C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)NH(C_{1-20})$ أو $-C(=O)N(C_{1-20})$ (ألكيل)، حيث يمكن أن يحمل ألكيل $-C(=O)NH(C_{1-20})$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $-N(C_{1-20})$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل $-NHC(=O)$ ، ألكيل $-NHSO_2$ ، ألكيل $-OC(=O)$ ، ألكيل $-OC(=O)N$ ، ألكيل $-C(=O)OH$ ، ألكيل $-C(=O)O$ ، $-C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)NH$ أو $-C(=O)N(C_{1-20})$ ، $-C(=O)N$ ؛ وحيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل $-NHC(=O)$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $-N(C_{1-20})$ ، هالوجين أو نتريل؛

(ن) أربيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2)_{1-3}$ أو أربيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ ، حيث يمكن أن يحمل أربيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: أربيل OH ، أربيل NH_2 ، أربيل NH ، أربيل $\text{N}(\text{أربيل})_2$ ، أربيل حلقي مخلط، أربيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ، أربيل NH_2SO_2 ، هالوجين، نتريل أو أربيل $\text{OC}(=\text{O})$ ؛

(ع) $\text{C}(=\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH})_{0-3}$ ينتهي بـ H ، ميثيل، إيثيل، ألكيل $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}$ ،
 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}$ (ألكيل) $_2$ ، $-\text{CH}_2\text{CH}_2$ ، 1 -بيروليدينيل، 1 - CH_2CH_2 ، 1 -بييريدينيل، 1 - CH_2CH_2 ، 1 - CH_2CH_2 ،
مورفولينيل، 1 - CH_2CH_2 ، 1 -بيبرازينيل، 1 - CH_2CH_2 ، 1 - $(\text{CH}_3-\text{CH}_2)$ ، 1 -بيبرازينيل،
 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ ، $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$ ، $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$ ، ألكيل $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ أو
أريل $\text{C}(=\text{O})$ ؛ حيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل $\text{C}(=\text{O})$ المذكور بشكل اختياري
مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، $-\text{OH}$ ، ألكيل $-\text{O}$ ، $-\text{NH}_2$ ، ألكيل-
 NH ، 2 (ألكيل) $-\text{N}$ ، هالوجين أو نتريل؛

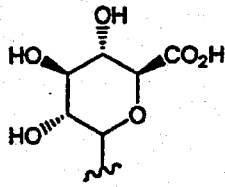
(ف) $-C(=S)NH_2$ ؛(ق) ألكيل $-C(=S)NH$ ؛(ر) $-C(=S)N(ألكيل)_2$ ؛(ش) $-SO_2NH_2$ ؛(ت) ألكيل $-SO_2NH$ ؛(ث) $-SO_2N(ألكيل)_2$ ؛(خ) $-P(=O)(OCH_3)_2$ ؛ و(ذ) $-P(=O)(OCH_2CH_3)_2$ ؛

شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود.

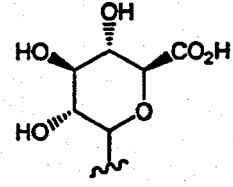
ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث

R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H ؛



شريطة أن R^4 لا يمثل



(ب)

(ج) $-CH_2-$ يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: H ، ميثيل، ألكيل، $-O$ ، $-CH_2OH$ ، -

$CH(CH_3)OH$ ، ألكيل $-O(C=O)$ ، $-(C=O)OH$ ، ألكيل $-(C=O)O$ ، أريل $-(C=O)O$ ، أريل

مخلوط $-(C=O)O$ ، $-(C=O)NH_2$ ، ألكيل $-(C=O)NH$ ، $-(C=O)N(ألكيل)_2$ ، ألكيل-

$C(=O)$ ، $-OCH_3$ فنيل- أو ألكيل $-(C=O)OC$ فنيل-؛

(و) ألكيل $C(=O)$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -

OH، ألكيل-O، أريل ألكيل-O، NH_2 ، ألكيل-NH، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل-
 $NHC(=O)$ ، ألكيل- $NHSO_2$ أو ألكيل- $OC(=O)$ ؛

(ز) أريل $C(=O)(CH_2)_{1-3}$ أو أريل $C(=O)$ -، حيث يمكن أن يحمل أريل $C(=O)$ - المذكور، بشكل

اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: OH، ألكيل-O، NH_2 ، ألكيل-
 NH ، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل- $NHC(=O)$ ، ألكيل- $NHSO_2$ ، هالوجين،
 نتريل أو ألكيل- $OC(=O)$ ؛

(ح) - $C(=O)(CH_2)_{1-6}C(=O)$ ينتهي بمثيل، اثيل، OH، ألكيل-O، NH_2 ، ألكيل-NH، $N(ألكيل)_2$ أو

ألكيل حلقي مخطط؛

(ح ح) -ألكيل-ألكيل $OC(=O)C(=O)$ ينتهي بـ OH، ألكيل-O، NH_2 ، ألكيل-NH، $N(ألكيل)_2$ ؛

(ط) - $C(=O)O(CH_2CH_2O)_{1-10}$ ينتهي بـ H، مثيل، اثيل أو بنزيل؛

(ي) ألكيل $C(=O)O$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:

OH، ألكيل-O، NH_2 ، ألكيل-NH، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل-
 $NHC(=O)$ ، ألكيل- $NHSO_2$ ، ألكيل- $OC(=O)$ ، ألكيل- $C(=O)OH$ ، ألكيل- $C(=O)O$ ، -
 $C(=O)NH_2$ ، ألكيل-NH $C(=O)$ - أو $N(ألكيل)_2C(=O)$ ؛

(ك) أريل $C(=O)O(CH_2)_{1-3}$ أو أريل $C(=O)O$ -، حيث يمكن أن يحمل أريل $C(=O)O$ - المذكور

بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: OH، ألكيل-O، NH_2 ،
 ألكيل-NH، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل- $NHC(=O)$ ، ألكيل- $NHSO_2$ ،
 هالوجين، نتريل أو ألكيل- $OC(=O)$ ؛

(ل) - $C(=O)NH(CH_2CH_2O)_{1-10}$ ينتهي بـ H، مثيل، اثيل، بنزيل، $CH_2CH_2NH_2$ ، ألكيل-

CH_2CH_2NH ، $N(ألكيل)_2CH_2CH_2N$ ، CH_2CH_2 ، ١-بيروليدينيل، CH_2CH_2 ، ١-بيبيرازينيل،
 CH_2CH_2 ، ٤-مورفولينيل، CH_2CH_2 ، ١-بيبيرازينيل، CH_2CH_2 ، ١-٤- (CH_3) -بيبيرازينيل، أو
 ألكيل- $C(=O)$ ؛

(م) $C(=O)NH_2$ ، ألكيل $C(=O)NH$ ، أو $N(ألكيل)C(=O)$ ، حيث يمكن أن يحمل

ألكيل $C(=O)NH$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على

حدة من: -OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH، -N(ألكيل)₂، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل-
 NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂، ألكيل-OC(=O)، ألكيل-نييل-OC(=O)، أرييل-
 NHC(=O)، -C(=O)OH، ألكيل-C(=O)O، -C(=O)NH₂، ألكيل-C(=O)NH، أو (ألكيل)₂-
 C(=O)N؛ وحيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أرييل-NHC(=O) المذكور بشكل اختياري
 مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، -OH، ألكيل-O، -NH₂،
 ألكيل-NH، -N(ألكيل)₂، هالوجين أو نتريل؛

(ن) أرييل -C(=O)NH(CH₂)₁₋₃ أو أرييل -C(=O)NH، حيث يمكن أن يحمل أرييل -C(=O)NH
 المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH، ألكيل-O،
 -NH₂، ألكيل-NH، -N(ألكيل)₂، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل-NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂،
 هالوجين، نتريل أو ألكيل-OC(=O)؛

(ع) -C(=O)NHCH₂CH₂NH(CH₂CH₂NH)_{0.3} ينتهي بـ -H، ميثيل، إيثيل، ألكيل-CH₂CH₂NH،
 (ألكيل)₂-CH₂CH₂N، -CH₂CH₂-1-بيروليدينيل، -CH₂CH₂-1-بيبيريدينيل، -CH₂CH₂-4-
 مورفولينيل، -CH₂CH₂-1-بيبرازينيل، -CH₂CH₂-1-(4-CH₃)-بيبرازينيل، -
 CH₂CH₂OH، -CH₂CH₂OCH₃، -CH₂CH₂OCH₂CH₃، ألكيل-CH₂CH₂OC(=O) أو
 أرييل-C(=O)؛ حيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أرييل-C(=O) المذكور بشكل اختياري
 مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، -OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-
 NH، -N(ألكيل)₂، هالوجين أو نتريل؛

(ف) -C(=S)NH₂؛

(ث) (ألكيل)₂-SO₂N؛ و

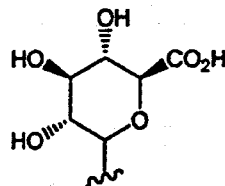
(ذ) (ألكيل)₂-P(=O)(OCH₂CH₃)₂؛

شريطة أنه عندما يكون R⁶ موجوداً، فإن R⁷ يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما يكون R⁷
 موجوداً، فإن R⁶ يكون غير موجود.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث

R⁶ و R⁷ يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H؛



(ج) - CH_2 - يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: -H، ميثيل، -الأكيل-O، CH_2OH ، -

(ز) أريل C(=O)- يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH، -N(ألكيل)₂، ألكيل حلقي مغلط، ألكيل-NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂، هالوجين، نتريل أو ألكيل-OC(=O)؛

(ح) $-C(=O)(CH_2)_{1-6}C(=O)-$ ينتهي بمثيل، اثيل، $-OH$ ، ألكيل $-O-$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH-$ ، $(ألكيل)_2-N-$ أو ألكيل حلقى مخلط؛

(ح) ألكيل-ألكيل OC(=O)C(=O)- ينتهي بـ OH-، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH أو (ألكيل)₂-N؛

(ط) $-C(=O)O(CH_2CH_2O)_{1-10}$ ينتهي بـ H، ميثيل، إيثيل أو بنزيل؛

(ي) الألكيل $C(=O)O$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:

OH-، ألكيل-O، NH₂-، ألكيل-NH، (ألكيل)₂-N، ألكيل حقيقي مخاط، ألكيل-
NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂، ألكيل-OC(=O)-، C(=O)OH، ألكيل-C(=O)O-، -
C(=O)NH₂، ألكيل-C(=O)N(ألكيل)₂ أو -C(=O)N(ألكيل)؛

(ك) أريل C(=O)O- يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -
OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH-، -N(ألكيل)₂، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل-NHC(=O)-،
ألكيل-NHSO₂-، هالوجين، نتريل أو ألكيل-OC(=O)-؛

(ل) $C(=O)NH(CH_2CH_2O-)_{1-10}$ ينتهي بـ H-، مثيل، اثيل، بنزيل، $-CH_2CH_2NH_2$ ، ألكيل-
 CH_2CH_2NH ، $(\text{ألكيل})_2NCH_2CH_2-$ ، $1-CH_2CH_2$ ، $1-\text{بيروليدينيل}$ ، $1-CH_2CH_2$ ، $1-\text{بيبريدينييل}$ ،
 $4-CH_2CH_2$ ، $4-\text{مورفولينيل}$ ، $1-CH_2CH_2$ ، $1-\text{بيبرازينيل}$ ، $1-CH_2CH_2$ ، $4-(CH_3-)$ ، $4-\text{بيبرازينيل}$ ، أو
 ألكيل $C(=O)-$ ؛

(م) ألكيل $C(=O)NH(C_{1-20})$ يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على
 حدة من: OH-، ألكيل-O-، NH_2 ، ألكيل-NH-، $(\text{ألكيل})_2N-$ ، ألكيل حلقي مخط،
 ألكيل $NHC(=O)-$ ، ألكيل $NHSO_2-$ ، ألكيل $OC(=O)-$ ، ألكيل $OC(=O)-$ ، ألكيل $OC(=O)-$ ،
 ألكيل $NHC(=O)-$ ، ألكيل $OH-C(=O)-$ ، ألكيل $O-C(=O)-$ ، ألكيل $NH-C(=O)-$ ، أو
 $(\text{ألكيل})_2N-C(=O)-$ ؛ وحيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل $NHC(=O)-$ المذكور بشكل
 اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، OH-، ألكيل-O-،
 NH_2 ، ألكيل-NH-، $(\text{ألكيل})_2N-$ ، هالوجين أو نتريل؛

(ن) أريل $C(=O)NH$ يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:
 OH-، ألكيل-O-، NH_2 ، ألكيل-NH-، $(\text{ألكيل})_2N-$ ، ألكيل حلقي مخط، ألكيل $NHC(=O)-$ ،
 ألكيل $NHSO_2-$ ، هالوجين، نتريل أو ألكيل $OC(=O)-$ ؛

(ع) $C(=O)NHCH_2CH_2NH(CH_2CH_2NH-)_{0-3}$ ينتهي بـ H-، مثيل، اثيل، ألكيل CH_2CH_2NH- ،
 $(\text{ألكيل})_2NCH_2CH_2-$ ، $1-CH_2CH_2$ ، $1-\text{بيروليدينيل}$ ، $1-CH_2CH_2$ ، $1-\text{بيبريدينييل}$ ، $4-CH_2CH_2$ ،
 مورفولينيل، $1-CH_2CH_2$ ، $1-\text{بيبرازينيل}$ ، $1-CH_2CH_2$ ، $4-(CH_3-)$ ، $4-\text{بيبرازينيل}$ ، -
 CH_2CH_2OH ، $CH_2CH_2OCH_3$ ، $CH_2CH_2OCH_2CH_3$ ، ألكيل $CH_2CH_2OC(=O)-$ ، أو
 أريل $C(=O)-$ ؛ حيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل $C(=O)-$ المذكور بشكل اختياري
 مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، OH-، ألكيل-O-، NH_2 ، ألكيل-
 NH، $(\text{ألكيل})_2N-$ ، هالوجين أو نتريل؛

(ف) $C(=S)NH_2$ ؛

(ث) $(\text{ألكيل})_2N-SO_2-$ ؛ و

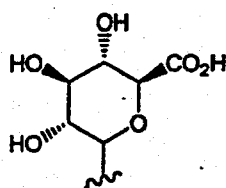
(ذ) $P(=O)(OCH_2CH_3)_2$ ؛

شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود.

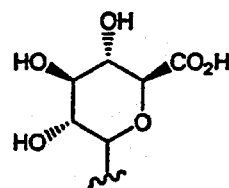
ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث

R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H؛



شريطة أن R^4 لا يمثل



(ب)

(ج) $-CH_2-$ يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: H-، مثيل-، ألكيل-O، $-CH_2OH$ ، -

$CH(CH_3)OH$ ، ألكيل $-O(C=O)-$ ، ألكيل $-(C=O)-$ ، ألكيل $-C(=O)O-$ ، أريل $-C(=O)O-$ ، أريل

مخاط $-C(=O)O-$ ، $-(C=O)NH_2$ ، ألكيل $-(C=O)NH-$ ، $-(C=O)N(ألكيل)_2$ ، ألكيل-، ألكيل-

$C(=O)$ ، OCH_3 فنيل- أو ألكيل $OC(=O)$ فنيل-؛

(و) ألكيل $-C(=O)-$ يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -

OH، ألكيل-O، فنيل-ألكيل-O، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH-$ ، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل حلقي مخاط، ألكيل-

$NHC(=O)-$ ، ألكيل $-NHSO_2-$ أو ألكيل $OC(=O)-$ ؛

(ز) أريل $-C(=O)-$ يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: OH-

ألكيل-O، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH-$ ، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل حلقي مخاط، ألكيل $-NHC(=O)-$ ، ألكيل

ألكيل $-NHSO_2-$ ، كلورو، فلورو، نتريل أو ألكيل $OC(=O)-$ ؛

(ح) $-C(=O)(CH_2)_{1-6}C(=O)-$ ينتهي بمثيل، اثيل، OH-، ألكيل-O، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH-$ ، $N(ألكيل)_2$ أو

بيروليدينيل؛

(ح ح) ألكيل $OC(=O)$ ألكيل $-C(=O)-$ ينتهي بـ OH-، ألكيل-O، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH-$ أو $N(ألكيل)_2$ ؛

(ط) $-C(=O)O(CH_2CH_2O)_{1-10}-$ ينتهي بـ H، مثيل، اثيل أو بنزيل؛

(ي) ألكيل $C(=O)O$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:
 $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل-
 $NHC(=O)$ ، ألكيل $-NHSO_2$ ، ألكيل $-OC(=O)$ ، $-C(=O)OH$ ، ألكيل $-C(=O)O$ ، -
 $C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)NH$ أو $N(ألكيل)_2$ $-C(=O)$ ؛

(ك) أريل $C(=O)O$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -
 $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل $-NHC(=O)$ ،
ألكيل $-NHSO_2$ ، كلورو، فلورو، نتريل أو ألكيل $-OC(=O)$ ؛

(ل) $C(=O)NH(CH_2CH_2O)_{1-10}$ - ينتهي بـ $-H$ ، مثيل، اثيل، بنزيل، $-CH_2CH_2NH_2$ ، ألكيل-
 CH_2CH_2NH ، $N(ألكيل)_2$ ، $-CH_2CH_2N(ألكيل)_2$ ، $-CH_2CH_2$ ، $1-CH_2CH_2$ ، $1-بيروليدينيل$ ، $1-بييريدينيل$ ،
 $4-CH_2CH_2$ ، $4-مورفولينيل$ ، $1-CH_2CH_2$ ، $1-بييرازينيل$ ، $1-CH_2CH_2$ ، $4-بييرازينيل$ ، أو
ألكيل $-C(=O)$ ؛

(م) ألكيل $C(=O)NH(C_{1-20})$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل
على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $N(ألكيل)_2$ ، $1-بيروليدينيل$ ،
 $1-بييريدينيل$ ، ألكيل $-NHC(=O)$ ، ألكيل $-NHSO_2$ ، ألكيل $-OC(=O)$ ، ألكيل-
 $OC(=O)$ ، فنيل $-NHC(=O)$ ، $-C(=O)OH$ ، ألكيل $-C(=O)O$ ، $-C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)NH$ أو
 $N(ألكيل)_2$ $-C(=O)$ ؛ وحيث يمكن أن يحمل جزء الفينيل في فنيل $-NHC(=O)$ المذكور بشكل
اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، $-OH$ ، ألكيل $-O$ ،
 $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $N(ألكيل)_2$ ، هالوجين أو نتريل؛

(ن) أريل $C(=O)NH$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:
 $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل $-NHC(=O)$ ،
ألكيل $-NHSO_2$ ، كلورو، فلورو، نتريل أو ألكيل $-OC(=O)$ ؛

(ع) $C(=O)NHCH_2CH_2NH(CH_2CH_2NH)_{0-3}$ - ينتهي بـ $-H$ ، مثيل، اثيل، ألكيل $-CH_2CH_2NH$ ،
 $N(ألكيل)_2$ ، $-CH_2CH_2N(ألكيل)_2$ ، $-CH_2CH_2$ ، $1-CH_2CH_2$ ، $1-بيروليدينيل$ ، $1-CH_2CH_2$ ، $1-بييريدينيل$ ،
 $4-CH_2CH_2$ ، $4-مورفولينيل$ ، $1-CH_2CH_2$ ، $1-بييرازينيل$ ، $1-CH_2CH_2$ ، $4-بييرازينيل$ ، أو
 CH_2CH_2OH ، $-CH_2CH_2OCH_3$ ، $-CH_2CH_2OCH_2CH_3$ ، ألكيل $-CH_2CH_2OC(=O)$ أو

فنييل $-C(=O)-$ ؛ حيث يمكن أن يحمل جزء الفنييل في فنييل $-C(=O)-$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، $-OH$ ، ألكيل $-O-$ ، $-NH_2$ ، ألكيل- NH ، $N(ألكيل)_2$ ، هالوجين أو نتريل؛

(ف) $-C(=S)NH_2$ ؛

(ث) $(ألكيل)_2SO_2N-$ ؛ و

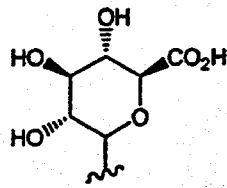
(ذ) $-P(=O)(OCH_2CH_3)_2$ ؛

شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود.

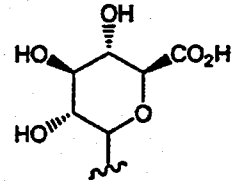
ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث

R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H ؛



شريطة أن R^4 لا يمثل



(ب)

(ج) $-CH_2-$ يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: $-H$ ، ميثيل-، ألكيل $-O-$ ، $-CH_2OH$ ، $CH(CH_3)OH$ ، ألكيل $-O(C=O)-$ ، ألكيل $-C(=O)O-$ ، $-(C=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)-$ ، أو ألكيل- $OC(=O)-$ فنييل-؛

(و) ألكيل $-C(=O)-$ يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O-$ ، فنييل-ألكيل $-O-$ ، أو ألكيل $-OC(=O)-$ ؛

(ز) فنييل $-C(=O)-$ يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O-$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل حلقى مخطط، ألكيل $-NHC(=O)-$ ، ألكيل $-NHSO_2-$ ، كلورو، فلورو، نتريل أو ألكيل $-OC(=O)-$ ؛

(ح) $-(C(=O)(CH_2)_{1-6}C(=O)-)$ ينتهي بـ $-OH$ ، ألكيل $-O-$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $N(ألكيل)_2$ أو بيروليدينيل؛

- (ح ح) - ألكيل OC(=O) ألكيل C(=O) - ينتهي بـ ألكيل -O؛
 (ط ط) - ألكيل C(=O)O(CH₂CH₂O-) ₁₋₁₀ - ينتهي بـ H أو بنزير؛
 (ي ي) - ألكيل C(=O)O - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر من ألكيل -O،
 (ك ك) - فنيل C(=O)O - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:
 -OH، ألكيل -O، -NH₂، ألكيل -NH، -N(ألكيل)₂، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل -NHC(=O)،
 ألكيل -NHSO₂، كلورو، فلورو، نتريل أو ألكيل -OC(=O)؛
 (ل ل) - ألكيل C(=O)NH(CH₂CH₂O-) ₁₋₁₀ - ينتهي بـ -H؛
 (م م) - ألكيل C(=O)NH(C₁₋₂₀) - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل
 على حدة من: -NH₂، ألكيل -NH، -N(ألكيل)₂، بيروليدينيل، مورفولينيل، ألكيل -
 -NHC(=O)، ألكيل -OC(=O)، فنيل -NHC(=O) أو ألكيل -C(=O)O؛ وحيث يمكن أن يحمل
 جزء الفينيل في فنيل -NHC(=O) المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل
 على حدة من: ألكيل، -OH، ألكيل -O، -NH₂، ألكيل -NH، -N(ألكيل)₂، هالوجين أو
 نتريل؛
 (ن ن) - فنيل C(=O)NH - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:
 -OH، ألكيل -O، -NH₂، ألكيل -NH، -N(ألكيل)₂، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل -NHC(=O)،
 ألكيل -NHSO₂، كلورو، فلورو، نتريل أو ألكيل -OC(=O)؛
 (ع ع) - ألكيل C(=O)NHCH₂CH₂NH(CH₂CH₂NH-) ₀₋₃ - ينتهي بـ -H، ميثيل، إيثيل، ألكيل -CH₂CH₂NH،
 -CH₂CH₂N(ألكيل)₂، -CH₂CH₂ - ١ - بيروليدينيل، -CH₂CH₂ - ١ - بييريدينيل، -CH₂CH₂ - ٤ -
 مورفولينيل، -CH₂CH₂ - ١ - بيبرازينيل، -CH₂CH₂ - ١ - (٤-CH₃) - بيبرازينيل، -
 -CH₂CH₂OH، -CH₂CH₂OCH₃، -CH₂CH₂OCH₂CH₃، ألكيل -CH₂CH₂OC(=O) -
 وفنيل C(=O)؛ حيث يمكن أن يحمل جزء الفينيل في فنيل C(=O) - المذكور بشكل اختياري
 مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، -OH، ألكيل -O، -NH₂، ألكيل -
 -NH، -N(ألكيل)₂، هالوجين ونتريل؛
 (ف ف) - C(=S)NH₂؛
 (ث ث) - (ألكيل)₂N-SO₂؛ و

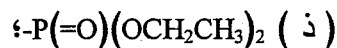
٥

١٠

١٥

٢٠

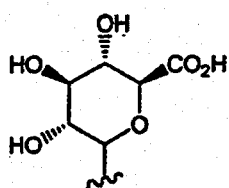
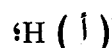
٢٥



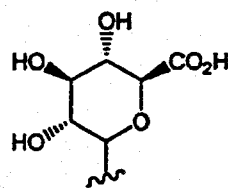
شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث

R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:



شريطة أن R^4 لا يمثل



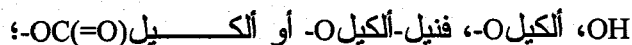
(ب)

(جـ) - CH_2 - يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: -H، مـثـيلـ، ألكـيلـ-O، - CH_2OH ، -

- $CH(CH_3)OH$ ، ألكـيلـ-O(C=O)، ألكـيلـ-O(C=O)-، - $(C=O)NH_2$ ، ألكـيلـ-C(=O)-، أو ألكـيلـ-

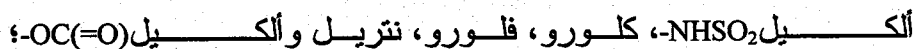


(و) ألكـيلـ-C(=O)- يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -

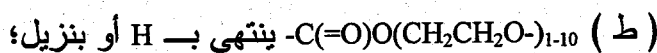
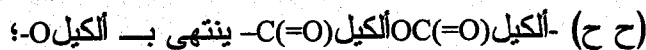


(ز) فنـيـلـ-C(=O)- يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH،

ألكـيلـ-O، - NH_2 ، ألكـيلـ-NH، - $N(ألكـيل)$ ، ألكـيل حلقـي مـخـاطـط، ألكـيلـ-NHC(=O)-،



(ح) - $C(=O)(CH_2)_1-C(=O)-$ ينتهي بـ -OH، ألكـيلـ-O، - NH_2 ، ألكـيلـ-NH، - $N(ألكـيل)$ أو بيروليدينيل؛



(ي) ألكـيلـ-C(=O)O- يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر من ألكـيل-O،

(ك) فنيل $C(=O)O$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -
 OH ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل $-NHC(=O)$ ،
 ألكيل $-NHSO_2$ ، كلورو، فلورو، نتريل وألكيل $-OC(=O)$ ؛

(ل) $C(=O)NH(CH_2CH_2O)_{1-10}$ - ينتهي بـ $-H$ ؛

(م) ألكيل $C(=O)NH(C_{1-20})$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $N(ألكيل)_2$ ، بيروليدينيل، مورفولينيل، ألكيل-
 $-NHC(=O)$ ، ألكينيل $-OC(=O)$ ، فنيل $-NHC(=O)$ أو ألكيل $-C(=O)O$ ، وحيث يمكن أن يحمل جزء الفينيل في فنيل $-NHC(=O)$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $N(ألكيل)_2$ ، هالوجين ونتريل؛

(ن) فنيل $C(=O)NH$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل $-NHC(=O)$ ، ألكيل $-NHSO_2$ ، كلورو، فلورو، نتريل وألكيل $-OC(=O)$ ؛

(ع) $C(=O)NHCH_2CH_2NH(CH_2CH_2NH)_{0-3}$ - ينتهي بـ $-CH_2CH_2OH$ وفنيل $-C(=O)$ ؛ حيث يمكن أن يحمل جزء الفينيل في فنيل $-C(=O)$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $N(ألكيل)_2$ ، هالوجين ونتريل؛

(ف) $-C(=S)NH_2$ ؛

(ث) $(ألكيل)_2N-SO_2$ ؛ و

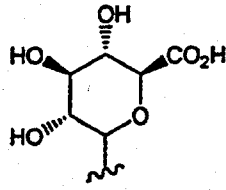
(ذ) $-P(=O)(OCH_2CH_3)_2$ ؛

شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود.

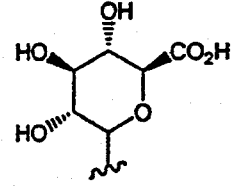
ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث

R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H ؛



شريطة أن R^4 لا يمثل



(ب)

- (جـ) - CH_2 - يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: -H، مـيل، ألكيل-O، $-CH_2OH$ ، - $CH(CH_3)OH$ ، ألكيل $O(C=O)$ ، ألكيل $O(C=O)$ ، ألكيل $(C=O)NH_2$ ، ألكيل $C(=O)$ ، أو ألكيل- $OC(=O)$ فنيل-؛
- (و) ألكيل $C(=O)$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH، ألكيل-O، فنيل-ألكيل-O، أو ألكيل- $OC(=O)$ ؛
- (ز) فنيل $C(=O)$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل-O، كلورو أو فلورو؛
- (ح) - $C(=O)(CH_2)_{1-6}C(=O)$ ينتهي بـ -OH، ألكيل-O، NH_2 ، ألكيل-NH، $N(ألكيل)_2$ أو بيروليدينيل؛
- (ح ح) - ألكيل $OC(=O)$ ألكيل $C(=O)$ ينتهي بـ ألكيل-O؛
- (ط) - $C(=O)O(CH_2CH_2O)_{1-10}$ ينتهي بـ H أو بنزيل؛
- (ي) ألكيل $O(C=O)$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر من ألكيل-O،
- (ك) فنيل $O(C=O)$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر من كلورو أو فلورو؛
- (ل) - $C(=O)NH(CH_2CH_2O)_{1-10}$ ينتهي بـ -H؛
- (م) ألكيل $C(=O)NH(C_{1-20})$ يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: NH_2 ، ألكيل-NH، $N(ألكيل)_2$ ، بيروليدينيل، مورفولينيل، ألكيل- $NHC(=O)$ ، ألكيل- $OC(=O)$ ، فنيل $NHC(=O)$ ، أو ألكيل $O(C=O)$ ، وحيث يمكن أن يحمل جزء الفنيل في فنيل $NHC(=O)$ - المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، -OH، ألكيل-O، NH_2 ، ألكيل-NH، $N(ألكيل)_2$ ، هالوجين ونتريل؛
- (ن) فنيل $C(=O)NH$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر من فلورو؛

(ع) $-C(=O)NHCH_2CH_2NH(CH_2CH_2NH-)_{0-3}$ ينتهي بـ $-CH_2CH_2OH$ وفنيل $-C(=O)-$ ؛ حيث يمكن أن يحمل جزء الفنيل في فنيل $-C(=O)-$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر

تختار من $-OH$ ؛

(ف) $-C(=S)NH_2$ ؛

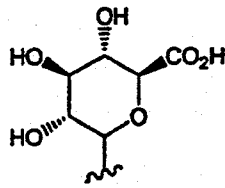
(ث) $(\text{الكيل})_2-SO_2N-$ ؛ و

(ذ) $-P(=O)(OCH_2CH_3)_2$ ؛

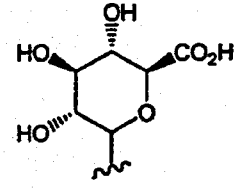
شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث

R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من: H،



شريطة أن R^4 لا يمثل



- ١- ميثوكسي-١-أكسو-إثيل، ١-ميثيل-إثوكسي-كربونيل، ١-أكسو-بيوتوكسي-ميثيل،
- ١-أكسو-إثوكسي-ميثيل، ١-أكسو-إثيل، ١-أكسو-بروبيل،
- ٢-(١-أكسو-إثوكسي)-١-أكسو-إثيل، ٢-(٢-ميثوكسي-١-أكسو-إثوكسي)-١-أكسو-إثيل، ٢-(٢-ميثيل-١-أكسو-بروبوكسي)-١-أكسو-إثيل، ٢-أمينو-٢-أكسو-إثيل،
- ٢،٢-ثاني ميثيل-١-أكسو-بروبوكسي-ميثيل، ٢-إثوكسي-٢-أكسو-إثيل،
- ٢-ميثوكسي-٢-أكسو-إثيل، ٢،٦-ثاني فلورو-بنزويل،
- ٢-[٢-(٢-هيدروكسي-إثوكسي)-إثوكسي]-إثوكسي-كربونيل،
- ٢-بنزيلوكسي-١-أكسو-إثيل، ٢-بنزيلوكسي-إثوكسي-كربونيل،
- ٢-كلورو-فئوكسي-كربونيل، ٢-فلورو-بنزويل، ٢-هيدروكسي-١-أكسو-إثيل،
- ٢-هيدروكسي-إثيل، ٢-هيدروكسي-بروبيل، ٢-ميثوكسي-١-أكسو-إثيل،

- ٢- مٹوكسي-اٲوكسي-كربونيل، ٢-مٲيل-١-اكو-بروبيل، ٢-اكو-بروبيل،
 ٣-(N,N-ٲاني اٲيل امينو)-١،٣-اوكسو-بروبيل،
 ٣-H١-بيروليدينيل (١)-١،٣-اوكسو-بروبيل، ٣-اوكسي-١،٣-اوكسو-بروبيل،
 ٣-H١-بيروليدينيل (١)-١،٣-اوكسو-بروبيل، ٤-(١-اكو-اٲوكسي)-بنزيل،
 ٤-امينو-٤،١-اوكسو-ع-بيوتيل، ٤-اوكسي-٤،١-اوكسو-ع-بيوتيل،
 ٤-هيدروكسي-٤،١-اوكسو-ع-بيوتيل، ٤-مٹوكسي-٤،١-اوكسو-ع-بيوتيل،
 ٤-كلورو-بنزيل، ٤-كلورو-فٹوكسي-كربونيل، ٤-فلورو-بنزيل،
 ٤-فلورو-فٹوكسي-كربونيل، ٤-مٹوكسي-بنزيل،
 ٥-(N-مٲيل-امينو)-١،٥-اوكسو-بنٲيل، ٥-مٹوكسي-١،٥-اوكسو-بنٲيل،
 ١٠ بنزيل، ٲاني اٲوكسي-فسفينيل، اٲوكسي-كربونيل، مٹوكسي-كربونيل،
 مٹوكسي-مٲيل، مٲيل، N-(٢-اٲوكسي-٢-اكو-اٲيل)-امينو-كربونيل،
 N-(٢-H١-بيروليدينيل (١)-اٲيل)-امينو-كربونيل،
 N-(٢-امينو-اٲيل)-امينو-كربونيل،
 N-(٢-مورفولينيل (٤)-اٲيل)-امينو-كربونيل،
 ١٥ N-(٣-اٲوكسي-٣-اكو-بروبيل)-امينو-كربونيل،
 N-(٣-فلورو-فٲيل)-امينو-كربونيل، N-(٢-بنٲاڊيسيل)-امينو-كربونيل،
 N,N-ٲاني مٲيل-امينو-كبريتونيل،
 N-(٢-ٲ-مٲينيل-١-اكو-بروبوكسي)-اٲيل]-امينو-كربونيل،
 N-(٢-٣-مٲيل-١-مٹوكسي-١-اكو)-ع-بيوتيل]-امينو-كربونيل،
 ٢٠ N-(٢-٤-مٲيل-١-مٹوكسي-١-اكو)-بنٲيل]-امينو-كربونيل،
 N-(٢-N,N-ٲاني مٲيل-امينو)-اٲيل]-امينو-كربونيل،
 N-(٢-N-بنزيل-امينو)-اٲيل]-امينو-كربونيل،
 N-(٢-N-مٲيل-امينو)-اٲيل]-امينو-كربونيل،
 N-(٢-٢-٢-هيدروكسي-اٲوكسي)-اٲوكسي]-اٲيل]-امينو-كربونيل،
 ٢٥ N-(٢-N-١-اكو-اٲيل)-امينو]-اٲيل]-امينو-كربونيل،

N-[٢]-N-(٢-هيدروكسي-بنزويل)-أمينو-[إثيل]-أمينو-كربونيل،
 N-[٢]-N-(٢-هيدروكسي-إثيل)-أمينو-[إثيل]-أمينو-كربونيل،
 N-[٢]-N-(٢-مثيل-١-أكسو-بروبيل)-أمينو-[إثيل]-أمينو-كربونيل،
 N-مثيل-أمينو-كربونيل، N-مثيل-أمينو-ثيو-كربونيل، و

فنوكسي-كربونيل، شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من مثيلين، إيثيلين، كربونيل أو - SO_2 .

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من مثيلين، إيثيلين أو كربونيل. ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

(H) يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، أريل مخطط، ألكيل حلقي

مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، أريل مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء. ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

(H) يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، أريل مخطط، ألكيل حلقي

مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

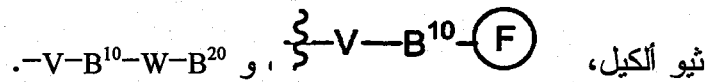
(H)

يختار من الفئة التي تتكون من فنيل، هكسيل حلقي، فوريل، إيميدازوليل،

أيزوكسازوليل، بيريديل، بيريميدينيل، إندوليل، إندازوليل، بيريدينيل، مورفولينيل، إندانيل، ٢،٣-ثاني هيدرو-١-إندوليل وبنزوديوكسوليل.

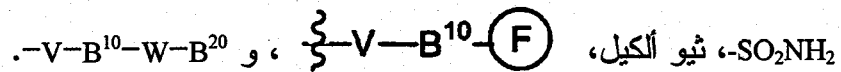
ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

R^5 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكيل، ألكيلوكسي، أمينو، $-C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)O$ ، $-C(=O)OH$ ، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، $-(=O)NH_2$ ، NHC ، ألكيل $NHSO_2$ ، نetro، ألكيل $-SO_2$ ، $-SO_2NH_2$ ، ثيو،



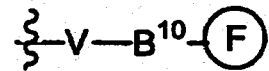
ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

R^5 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكيل، ألكيلوكسي، $-C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)O$ ، $-C(=O)OH$ ، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، نetro،



ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

R^5 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: مثيل، إيثيل، أيزوبروبيل، ثث-بيوتيل، ميثوكسي، إيثوكسي، $-C(=O)NH_2$ ، ميثيل $-C(=O)O$ ، أثيل $-C(=O)O$ ، $-C(=O)OH$ ، سيانو، ثاني ميثيل-أمينو، برومو، كلورو، فلورو، ثالث فلورو ميثيل، ثالث فلورو ميثوكسي، ثيو-ثالث فلورو ميثيل، هيدروكسي، هيدروكسي ميثيل، هيدروكسي إثيل، نetro، $-SO_2NH_2$ ، ثيو



مثيل، ، و $-V-B^{10}-W-B^{20}$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II):

حيث V و W غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من: $-C(=O)-$ ، $-(\text{الكيل})N-C(=O)-$ ، $-C(=O)NH-$ ، $-C(=O)O-$ ، $-NH-$ ، $-NHC(=O)O-$ ، $-NHC(=O)NH-$ ، $-NHC(=O)-$ ، $-O-$ ، $-OC(=O)-$ ، $-OC(=O)NH-$ ، $-SO_2-$ ، $-SO_2NH-$ و $-SO_2$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II):

حيث V و W غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من: $-C(=O)-$ ، $-(\text{الكيل})N-C(=O)-$ ، $-C(=O)NH-$ ، $-C(=O)O-$ ، $-NH-$ ، $-O-$ و $-SO_2$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II)، حيث V غير موجود أو يختار من الفئة التي تتكون من: $-C(=O)-$ ، $-(\text{الكيل})N-C(=O)-$ ، $-C(=O)NH-$ ، $-C(=O)O-$ ، $-NH-$ ، $-O-$ و $-SO_2$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II)، حيث V غير موجود أو يختار من الفئة التي تتكون من: $-C(=O)NH-$ ، $-C(=O)O-$ ، $-NH-$ ، $-O-$ و $-SO_2$.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II)، حيث W غير موجود.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

B^{10} غير موجود أو يمثل الكيل؛ و

حيث عندما B^{10} يمثل الكيل، يمكن أن يحمل الألكيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: الكوكسي، الكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني الكيل أمينو، هالوجين، الكوكسي مهلجن، الكيل SO_2 -مهلجن، ثيو الكيل مهلجن، هيدروكسي، الكيل $C(=O)-$ (الكيل)-، N ، $-(\text{الكيل})N-C(=O)-$ (الكيل)-، $-N-C(=O)NH_2$ ، $-N-C(=O)NH-$ (الكيل)-، $-N-C(=O)O-$ (الكيل)-، $-N-C(=O)SO_2-$ (الكيل)-، $-N-C(=O)NH-$ (الكيل)-، $-NHC(=O)NH_2$ ، $-NHC(=O)NH-$ (الكيل)-، $-NHC(=O)O-$ (الكيل)-، $-NHSO_2-$ (الكيل)-.

OC، $OC(=O)N$ (ألكيل)، ألكيل $OC(=O)NH$ ، ألكيل $OC(=O)O$ ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

B^{10} غير موجود أو يمثل الكيل؛ و

حيث عندما B^{10} يمثل ألكيل، يمكن أن يحمل الألكيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، ثاني الألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهالجن، هيدروكسي، $NHC(=O)NH_2$ ، الألكيل $NHSO_2$ ، الألكيل SO_2 - أو ثيو ألكيل.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

B^{10} غير موجود أو يختار من مثيل أو إثيل؛ حيث يحمل المثل أو الإثيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من ثاني ألكيل أمينو أو هيدروكسي.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

B^{10} غير موجود أو يختار من مثيل أو إيثيل؛ حيث يحمل المثيل أو الإيثيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من ثاني-مثيل-أمينو أو هيدروكسي.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

B^{20} غير موجود أو يختار من ألكيل، ألكينيل أو H؛

[illegible]

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

B^{20} غير موجود أو يختار من الكيل، ألكينيل أو H؛

حيث، عندما يمثل B^{20} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، هيدروكسي، $NHC(=O)NH_2$ ، ألكيل $NHSO_2$ - أو ثيو ألكيل.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

B^{20} غير موجود أو يختار من H.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

(F) يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كـربونية غير مشبعة

جزئياً، أريل مخلط وألكيل حلقي مخلط يحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من ألكوكسي، ألكيل، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين ألكوكسي مهلجن، ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، أريل مخلط، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل $C(=O)N(الـكـيـل)$ ، $N(الـكـيـل)C(=O)N(الـكـيـل)$ ، ألكيل $C(=O)NH(الـكـيـل)$ ، ألكيل $C(=O)O(الـكـيـل)$ ، ألكيل $SO_2(الـكـيـل)$ ، ألكيل $NHC(=O)N(الـكـيـل)$ ، $NHC(=O)NH(الـكـيـل)$ ، ألكيل $NHC(=O)O(الـكـيـل)$ ، ألكيل $NHSO_2$ ، نترو، $N(الـكـيـل)OC(=O)NH(الـكـيـل)$ ، ألكيل $OC(=O)NH(الـكـيـل)$ ، ثيو أو ثيو ألكيل.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

(F) يختار من الفئة التي تتكون من: فنيـل، إيميدازوليـل، بيريدينيـل،

بيريميدينيل، بيروليدينيل، مورفولينيل، بيبيرازينيل وبيبيريدينيل يحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من ألكوكسي، ألكيل، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، أريل مخلط، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل $C(=O)N(الـكـيـل)$ ، $N(الـكـيـل)C(=O)N(الـكـيـل)$ ،

ألكيل $C(=O)NH$ (ألكيل) $-N$ ، ألكيل $C(=O)O$ (ألكيل) $-N$ ، ألكيل SO_2 (ألكيل) $-N$ ، ألكيل $NHC(=O)-$ ،
 $(ألكيل)NHC(=O)-$ ، ألكيل $NHC(=O)NH_2$ ، ألكيل $NHC(=O)NH$ ، ألكيل $NHC(=O)O$ ،
 ألكيل $NHSO_2-$ ، نيترو، $(ألكيل)NOC(=O)-$ ، ألكيل $NHC(=O)O-$ ، ألكيل SO_2- ، ثيو
 أو ثيو ألكيل.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

(F) يختار من الفئة التي تتكون من: فليل، إيميدازوليل، بيريدينيل،

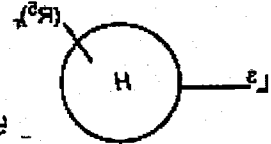
بيريميدينيل، بيروليدينيل، مورفولينيل، بيبيرازينيل وبيبيريدينيل يحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً أو
 أكثر يختار كل على حدة من ألكوكسي، ألكيل، ألكيل أمينو، أمينو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين،
 ألكوكسي مهلجن، ألكيل مهلجن، أريل مخلط، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، NHC ، ألكيل $NHSO_2-$ ، نيترو أو ألكيل SO_2- .

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

(F) يختار من الفئة التي تتكون من: فليل، إيميدازوليل، بيريدينيل، بيريميدينيل،

بيروليدينيل، مورفولينيل، بيبيرازينيل وبيبيريدينيل يحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل
 على حدة من ميثوكسي، إيثوكسي، ميثيل، إيثيل، برومو، كلورو، فلورو، ثالث فلورو ميثيل، بيريدينيل،
 هيدروكسي أو هيدروكسي ميثيل.

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:



يختار من الفئة التي تتكون من: ١- (٣- ميثوكسي-فليل) - (ع*) إيثيل؛ ٢-
 (٣- برومو) بيريديل؛ ٢- (٣- ميثيل) بيريديل؛ ٢- (٣- ميثيل-٥- برومو) بيريديل؛ ٢- (٤،٦- ثاني
 ميثيل) بيريديل؛ ٢- (٤- برومو) بيريديل؛ ٢- (بيبيريدينيل (١)) - إيثيل؛ ٢،٢- ثاني فلورو- ١،٣-

- بنزودیوکسولیل (٤)؛ ٢،٣-ثاني كلورو-بنزىل؛ ٢،٣-ثاني كلورو-فنيل؛ ٢،٣-ثاني هيدرو- H_1 -
 اندولیل (١)؛ ٢،٣-ثاني مٹوكسى-بنزىل؛ ٢،٤،٦-ثالث فلورو-فنيل؛ ٢،٤-ثاني كلورو-فنيل؛ ٢،٤-
 ثاني فلورو-بنزىل؛ ٢،٤-ثاني مٹوكسى-فنيل؛ ٢،٤-ثاني مٹوكسى-فنيل؛ ٢،٥-ثاني كلورو-بنزىل؛
 ٢،٥-ثاني كلورو-فنيل؛ ٢،٥-ثاني فلورو-بنزىل؛ ٢،٥-ثاني فلورو-فنيل؛ ٢،٥-ثاني مٹوكسى-
 بنزىل؛ ٢،٥-ثاني مٹوكسى-فنيل؛ ٢،٦-ثاني كلورو-بنزىل؛ ٢،٦-ثاني فلورو-بنزىل؛ ٢،٦-ثاني
 فلورو-فنيل؛ ٢-برومو-٣-فلورو-فنيل؛ ٢-برومو-بنزىل؛ ٢-برومو-فنيل؛ ٢-كلورو-بنزىل؛ ٢-
 كلورو-فنيل؛ ٢-اثير-فنيل؛ ٢-فلورو-بنزىل؛ ٢-فلورو-فنيل؛ ٢-فوريل؛ ٢-ايزوبروبيل-فنيل؛ ٢-
 مٹوكسى-بنزىل؛ ٢-مٹوكسى-فنيل؛ ٢-مثير-بنزىل؛ ٢-مثير-فنيل؛ ٢-مورفولينيل (٤)-اثير؛ ٢-
 بيريديل؛ ٢-بيريديل-مثير؛ ٢-ثالث فلورو مٹوكسى-بنزىل؛ ٢-ثالث فلورو مٹوكسى-فنيل؛ ٢-ثالث
 فلورو مثير-٤-برومو-فنيل؛ ٢-ثالث فلورو مثير-بنزىل؛ ٢-ثالث فلورو مثير-فنيل؛ ٣-(١)-
 هيدروكسى-اثير-فنيل؛ ٣-(٢،٤-ثاني مٹوكسى)-بيريديل؛ ٣-(٢-كلورو)-بيريديل؛ ٣-(٢)-
 هيدروكسى-اثير-امينو-كربونيل-فنيل؛ ٣-(٤-مٹوكسى)-بيريديل؛ ٣-(٤-مثير-بييرازينيل-
 كربونيل)-فنيل؛ ٣-(٤-ثالث فلورو مثير)-بيريديل؛ ٣-(امينو-كربونيل)-فنيل؛ ٣-(امينو-
 كيريتونيل)-فنيل؛ ٣-(اثيروكسى-كربونيل)-فنيل؛ ٣-(مٹوكسى-كربونيل)-فنيل؛ ٣-(ثالث فلورو
 مثير-٣يو)-فنيل؛ ٣،٤،٥-ثالث مٹوكسى-فنيل؛ ٣،٤-ثاني كلورو-بنزىل؛ ٣،٤-ثاني كلورو-فنيل؛
 ٣،٤-ثاني فلورو-بنزىل؛ ٣،٤-ثاني مٹوكسى-فنيل؛ ٣،٤-ثاني مثير-بنزىل؛ ٣،٤-مثيرين ديوكسى-
 فنيل؛ ٣،٥-ثاني (نث-بيوتيل)-فنيل؛ ٣،٥-ثاني (ثالث فلورو مثير)-فنيل؛ ٣،٥-ثاني كلورو-بنزىل؛
 ٣،٥-ثاني كلورو-فنيل؛ ٣،٥-ثاني فلورو-فنيل؛ ٣،٥-ثاني مٹوكسى-فنيل؛ ٣،٥-ثاني مثير-فنيل؛
 ٣-[N-(٣-بيرويلدينيل (١) برويل)-امينو-كربونيل]-فنيل؛ ٣-بنزىلوكسى-فنيل؛ ٣-برومو-فنيل؛
 ٣-كربوكسى-فنيل؛ ٣-كلورو-٤-فلورو-فنيل؛ ٣-كلورو-٤-مٹوكسى-فنيل؛ ٣-كلورو-٤-مثير-
 بنزىل؛ ٣-كلورو-بنزىل؛ ٣-كلورو-فنيل؛ ٣-سيانو-فنيل؛ ٣-اثيروكسى-فنيل؛ ٣-اثير-فنيل؛ ٣-
 فلورو-بنزىل؛ ٣-فلورو-فنيل؛ ٣-هيدروكسى مثير-فنيل؛ ٣-هيدروكسى-فنيل؛ ٣-ايزوبروبوكسى-
 فنيل؛ ٣-مٹوكسى-٥-ثالث فلورو مثير-فنيل؛ ٣-مٹوكسى-بنزىل؛ ٣-مثير-بنزىل؛ ٣-مثير-فنيل؛
 ٣-مثير ٣يو-فنيل؛ ٣-بيريديل؛ ٣-بيريديل-مثير؛ ٣-ثالث فلورو مٹوكسى-فنيل؛ ٣-ثالث فلورو
 مثير-فنيل؛ ٤-(٤-مثير-بييرازينيل (١))-فنيل؛ ٤-(اثيروكسى-كربونيل)-فنيل؛ ٤-(N,N-ثاني مثير-

أمينو)-فنيـل؛ ٤-(بيبريدينيـل (٤)-كبريتونيـل)-فنيـل؛ ٤-بنزيلوكسي-فنيـل؛ ٤-برومو-فنيـل؛ ٤-كلورو-٣-مئيـل-بنزيـل؛ ٤-كلورو-فنيـل؛ ٤-سيانو-فنيـل؛ ٤-ثاني مئيـل أمينو-فنيـل؛ ٤-فلورو-٣-كلورو-فنيـل؛ ٤-فلورو-٣-نترو-فنيـل؛ ٤-فلورو-٣-ثالث فلورو مئيـل-فنيـل؛ ٤-فلورو-بنزيـل؛ ٤-فلورو-فنيـل؛ ٤-مئوكسي-بنزيـل؛ ٤-مئيـل-٣-[N-(٤-بيريديـل)-بيريميدينيـل (٢)] أمينو]-فنيـل؛ ٤-مئيـل-بنزيـل؛ ٤-مئيـل-فنيـل؛ ٤-ثالث فلورو مئوكسي-فنيـل؛ ٤-ثالث فلورو مئيـل-فنيـل؛ ٥-(فنيـل)-أيزوكسازوليـل (٣)-مئيـل؛ ٥-برومو-٢،٣-ثاني هيدرو-١H-إندوليـل (١)؛ ٥-كلورو-٢-مئوكسي-فنيـل؛ ٥-كلورو-٢-مئيـل-فنيـل؛ ٥-إندانيـل؛ ٥-إندوليـل؛ ٥-ثالث فلورو مئيـل-٢-فلورو-فنيـل؛ ٦-إندازوليـل؛ بنزيـل؛ هكسيل حلقى؛ هكسيل حلقى-مئيـل؛ وفنيـل.

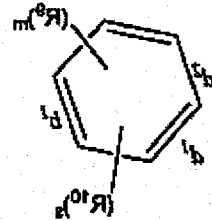
٢.١.٢

ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

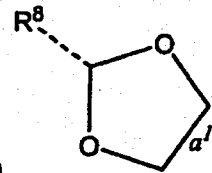
يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:

E

(الصيغة أ-١)،

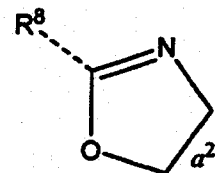


حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II) وتحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-١-أ، أ-١-ب و أ-١-ج:



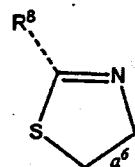
(الصيغة أ-١-أ)، حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ، من جهة a^1 بذرتي الكربون

المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛



(الصيغة أ-١-ب)، حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2 بذرتي الكربون

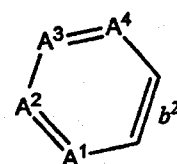
المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛



(الصيغة أ-١-ج)، حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي الكربون

المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

حيث R^8 يمثل H أو ألكيل منخفض؛

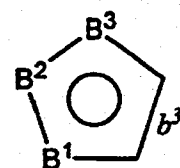


(الصيغة أ-٢)، حيث تختار الصيغة أ-٢ من الفئة التي تتكون من بيريديل

وبيريدينيل؛ وترتبط من جهة b^2 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)؛ وتحمل بشكل اختياري بديلاً من H أو

الكوكسي على عضو حلقة كربونية، حيث يمكن أن يحمل الألكوكسي أيضاً بشكل اختياري بديلاً من

الكوكسي على ذرة كربون طرفية أو ما لا يزيد عن ٣ ذرات هالوجين على ذرة كربون طرفية؛ و



(الصيغة أ-٣)، حيث تختار الصيغة أ-٣ من الفئة التي تتكون من ثيينيل،

أيزوكسازوليل وفوريل؛ وترتبط من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)؛ وتحمل بشكل اختياري بديلاً

من ألكيل C_{1-4} ، أريل، الكوكسي أو هالوجين على عضو حلقة كربونية؛

s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛ و

m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما لا يحمل

(E)

بديلاً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s يساوي

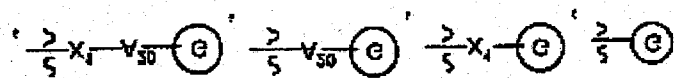
عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤، وعندما يحمل $\textcircled{E}$ بديلاً واحداً

من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي، ألكيل، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، هيدروكسي، ألكيل NHC(=O) ، ألكيل NHC(=O)NH ، ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل NHSO_2 ، وثيو ألكيل؛ L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: - $\text{OCH(R}^{100})$ ، - $\text{O(CH}_2\text{)}_{1-4}$ ، - O- ، - $\text{C(R}^{100})_2$ ، - $\text{C(=R}^{100})$ ، - $\text{CH(R}^{100})$ ، - $\text{(CH}_2\text{)}_{3-4}$ ، - $\text{(CH}_2\text{)}$ ، - $\text{OC(R}^{100})_2$ ، - S- ، - NH- ، - (ألكيل منخفض)، - N- ، - (ألكيل CO)، - N- ، - (أريل)، - N- ، - (ألكيل CO_2)، - N- ، - (ألكيل CONH)، - N- ، - (ألكيل SO_2) و - N- ، - (أريل SO_2)؛ شريطة أنه عندما L^2 يمثل - O- ، فإن R^6 أو R^7 لا يمثل أي منهما CH_3 ؛

R^{100} يختار من: ألكيل، هيدروكسي، أريل، أكسو، =N(OH) ؛

R^{10} يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من:



حيث $-A^{21}$ و $-A^{20}-A^{21}$ ، $-X^1-A^{21}$ ، $-X^1-A^{20}-A^{21}$ ، $-X^1-A^{20}-Y^1-A^{21}$ ؛

X^1 و Y^1 غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة

التي تتكون من: - NH- ، - O- ، - SO_2 ، و - $\text{SO}_2\text{NH-}$ ؛

A^{20} غير موجود أو يمثل ألكيل؛

حيث عندما يمثل A^{20} ألكيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل C(=O) (ألكيل)، - N- ،

٥. ثيو أو ثيو ألكيل؛
 $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}\text{ألكيل}$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ،
 $\text{ألكيلC}(=\text{O})\text{O}(\text{ألكيل})\text{N}$ ، $\text{ألكيلSO}_2(\text{ألكيل})\text{N}$ ، $\text{ألكيلNHC}(=\text{O})$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{ألكيل}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}\text{ألكيل}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ،
 $\text{ألكيلOC}(=\text{O})$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{OC}(=\text{O})$ ، $\text{ألكيلOC}(=\text{O})\text{NH}$ ، $\text{ألكيلOC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيلSO_2 ،

A^{21} يختار من ألكيل، ألكينيل أو H؛

١٠. حيث عندما يمثل A^{21} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، $\text{ألكيلC}(=\text{O})\text{NH}(\text{ألكيل})$ ، $\text{ألكيلC}(=\text{O})\text{O}(\text{ألكيل})\text{N}$ ، $\text{ألكيلSO}_2(\text{ألكيل})\text{N}$ ، $\text{ألكيلNHC}(=\text{O})$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{ألكيل}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}\text{ألكيل}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيلNHSO_2 ، $\text{ألكيلOC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، $\text{ألكيلOC}(=\text{O})$ ، $\text{ألكيلNHOC}(=\text{O})$ ، $\text{ألكيلOC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيلSO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل؛ و

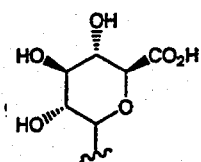
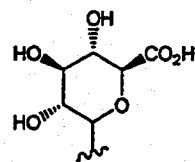
١٥. يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة

G

جزئياً، أريل مخطط وألكيل حلقي مخطط يحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ، $\text{ألكيلNHC}(=\text{O})$ ، $\text{ألكيلC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، أو ثاني ألكيل أمينو، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، $\text{ألكيلNHC}(=\text{O})$ ، $\text{ألكيلC}(=\text{O})\text{NH}(\text{ألكيل})$ ، $\text{ألكيلOC}(=\text{O})\text{NH}$ ، $\text{ألكيلNHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{ألكيلC}(=\text{O})\text{O}(\text{ألكيل})\text{N}$ ، ألكيلNHSO_2 ، $\text{ألكيلSO}_2(\text{ألكيل})\text{N}$ ، $\text{ألكيلNHC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، ألكيلSO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ، $\text{ألكيلNHC}(=\text{O})$ ، $\text{ألكيلOC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ أو $\text{ألكيلNHC}(=\text{O})\text{O}$ ؛

٢٥. R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H؛

شريطة أن R^4 لا يمثل

(ب)

(ج) -CH₂- يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: -H، مثيل، ألكيل-O، -CH₂OH، -CH(CH₃)OH، ألكيل-C(=O)OH، ألكيل-C(=O)O-، أريل-C(=O)O-، أريل-C(=O)N(الكيل)₂، ألكيل-C(=O)NH-، ألكيل-C(=O)NH₂، ألكيل-C(=O)O-، ألكيل-C(=O)OCH₃، ألكيل-C(=O)O-فنيل؛

(د) -C(=O)(CH₂CH₂O-)₁₋₁₀ ينتهي بـ H؛

(هـ) -C(=O)CH₂O(CH₂CH₂O-)₁₋₁₀ ينتهي بـ H؛

(و) ألكيل-C(=O) يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH، ألكيل-O، أريل ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH-، -N(الكيل)₂، ألكيل حلقى مخطط، ألكيل-NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂ أو ألكيل-OC(=O)؛

(ز) أريل-C(=O)(CH₂)₁₋₃ أو أريل-C(=O)، حيث يمكن أن يحمل أريل-C(=O) المذكور، بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH، -N(الكيل)₂، ألكيل حلقى مخطط، ألكيل-NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂، هالوجين، نتريل أو ألكيل-OC(=O)؛

(ح) -C(=O)(CH₂)₁₋₆C(=O)- ينتهي بمثيل، اثيل، -OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH-، -N(الكيل)₂ أو ألكيل حلقى مخطط؛

(ح ح) ألكيل-ألكيل-OC(=O) ينتهي بـ -OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH- أو -N(الكيل)₂؛

(ط) -C(=O)O(CH₂CH₂O-)₁₋₁₀ ينتهي بـ H، مثيل، اثيل أو بنزيل؛

(ي) ألكيل-C(=O) يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH-، -N(الكيل)₂، ألكيل حلقى مخطط، ألكيل-

NHC(=O) ، ألك — يـل NHSO_2 ، ألك — يـل OC(=O) ، ألك — يـل C(=O)OH ، ألك — يـل C(=O)O ،
 C(=O)NH_2 ، ألك — يـل C(=O)NH أو C(=O)N(الكيل)_2 ؛

(ك) أريل $(\text{CH}_2)_{1-3}\text{O}-\text{C}(=\text{O})-$ أو أريل $\text{O}-\text{C}(=\text{O})-$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $\text{O}-\text{C}(=\text{O})-$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: $-\text{OH}$ ، ألكيل $-\text{O}-$ ، $-\text{NH}_2$ ، ألكيل $-\text{NH}-$ ، $(\text{ألكيل})_2\text{-N}-$ ، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})-$ ، ألكيل NHSO_2- ، هالوجين، نتريل أو ألكيل $-\text{OC}(=\text{O})-$ ؛

(ل) $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{1-10}$ ينتهي بـ H ، ميثيل، إيثيل، بنزيل، $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$ ، ألكيل-
 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}$ ، $(\text{ألكيل})_2\text{NCH}_2\text{CH}_2$ ، $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{ألكيل})$ ، CH_2CH_2 -1-بيروليدينيل، CH_2CH_2 -1-بيبيريدينيل،
 CH_2CH_2 -4-مورفولينيل، CH_2CH_2 -1-بيبيرازينيل، CH_2CH_2 -1-(4- CH_3)-بيبيرازينيل، أو
 ألكيل $\text{C}(=\text{O})$ ؛

(م) -C(=O)NH_2 ، ألكيل $\text{-C(=O)NH(C}_{1-20}\text{)}$ أو $\text{-C(=O)N(الكيل}_{1-20}\text{)}$ ، حيث يمكن أن يحمل ألكيل $\text{-C(=O)NH(C}_{1-20}\text{)}$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH ، ألكيل -O ، -NH_2 ، ألكيل -NH ، -N(الكيل) ، ألكيل حلقي مضطرب، ألكيل -NHC(=O) ، ألكيل -NHSO_2 ، ألكيل -OC(=O) ، ألكيل -OC(=O)نيل ، ألكيل -C(=O)OH ، ألكيل -C(=O)O ، ألكيل -C(=O)NH_2 ، ألكيل -C(=O)NH أو -C(=O)N(الكيل) ، C(=O)N ؛ وحيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل -NHC(=O) المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، -OH ، ألكيل -O ، -NH_2 ، ألكيل -NH ، -N(الكيل) ، هالوجين أو نتريل؛

(ن) أريل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2)_{1-3}$ أو أريل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ —، حيث يمكن أن يحمل أريل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ — المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: OH —، الألكيل O —، NH_2 —، الألكيل NH —، N (اللكيل) $_2$ —، الألكيل حلقي مخلط، الألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ —، الألكيل NHSO_2 —، هالوجين، نتريل أو الألكيل $\text{OC}(=\text{O})$ —؛

(ع) $-CH_2CH_2NH$ الكيل، اثيل، مثيل، -H، ينتهي بـ C(=O)NHCH₂CH₂NH(CH₂CH₂NH)₀₋₃
 ٢(الكيل)-CH₂CH₂N، -CH₂CH₂-١-بيروليدينيل، -CH₂CH₂-١-بيريدينيل، -CH₂CH₂-٤-
 مورفولينيل، -CH₂CH₂-١-بيبرازينيل، -CH₂CH₂-١-(٤-CH₃)-بيبرازينيل، -

$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ ، $\text{-CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$ ، $\text{-CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$ ، ألكيل- $\text{-CH}_2\text{CH}_2\text{OC(=O)-}$ أو أريل -C(=O)- ؛ حيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل -C(=O)- المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، -OH ، ألكيل- -O ، -NH_2 ، ألكيل- -NH ، -N(ألكيل) ، هالوجين أو نتريل؛

(ف) -C(=S)NH_2 ؛

(ق) ألكيل -C(=S)NH ؛

(ر) -C(=S)N(ألكيل)_2 ؛

(ش) $\text{-SO}_2\text{NH}_2$ ؛

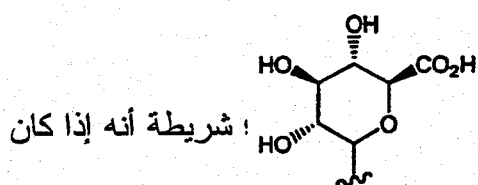
(ت) ألكيل $\text{-SO}_2\text{NH}$ ؛

(ث) $\text{-SO}_2\text{N(ألكيل)}_2$ ؛

(خ) $\text{-P(=O)(OCH}_3)_2$ ؛ و

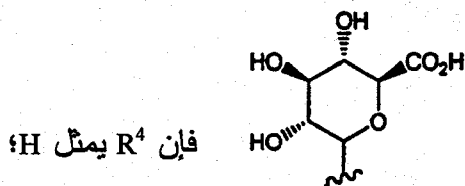
(ذ) $\text{-P(=O)(OCH}_2\text{CH}_3)_2$ ؛

شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود؛



؛ شريطة أنه إذا كان

R^4 يختار من الفئة التي تتكون من: H و



فإن R^4 يمثل H؛

R^6 أو R^7 يمثل

L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من مثيلين، اثيلين،

كربونيل أو -SO_2 ؛



يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، أريل مخطط، ألكيل حلقي

6

6



1

1

Y

B^{20} غير موجود أو يختار من الكيل، ألكينيل أو H؛

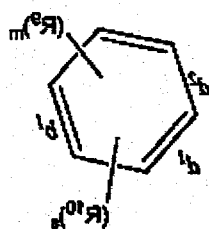
Ⓕ

جزئياً، أريل مخلط والكيل حلقي مخلط يحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من ألكوكسي، ألكيل، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين ألكوكسي مهلجن، ألكيل مهلجن، ألكيل-SO₂-مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، أريل مخلط، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل-C(=O)-N(ألكيل)، -N(ألكيل)-C(=O)-N(ألكيل)، ألكيل-C(=O)-NH(ألكيل)، -N(ألكيل)-C(=O)-O(ألكيل)، ألكيل-SO₂-N(ألكيل)، ألكيل-NHC(=O)-N(ألكيل)، ألكيل-NHC(=O)-NH₂، ألكيل-NHC(=O)-O(ألكيل)، ألكيل-NHCO₂-، ألكيل-OC(=O)-N(ألكيل)، ألكيل-OC(=O)-NH(ألكيل)، ألكيل-SO₂-، ثيو أو ثيو ألكيل.

أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منها.

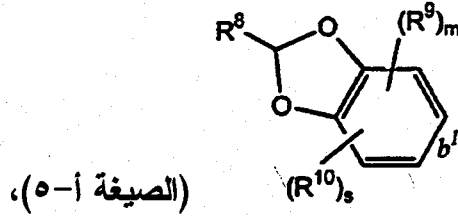
ويشمل تجسيد للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) حيث:

يختار من الفئة التي تتكون من:

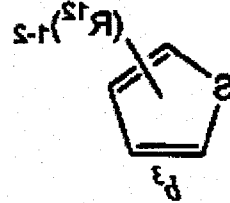
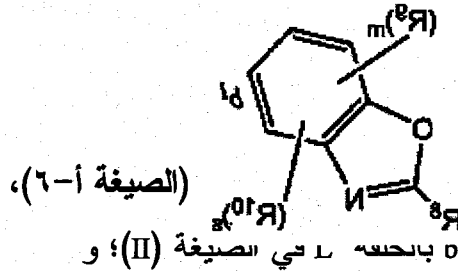


(الصيغة أ-٤)،

حيث ترتبط الصيغة أ-٤ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)؛



حيث ترتبط الصيغة أ-٥ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)؛ حيث R^8 يمثل H وألكيل منخفض؛



حيث ترتبط الصيغة أ-٣-أ' من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، حيث R^{12} يختار كل على حدة

من H، ميثيل، فنييل، إيثوكسي، كلورو أو فلورو؛

s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛ و

m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما

يمثل الصيغة أ-٤، فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح

(E)

R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: الكوكسي، الكيل، أمينو، سيانو، ثاني الكيل

أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، هيدروكسي وألكيل (NHC=O)؛

L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: -

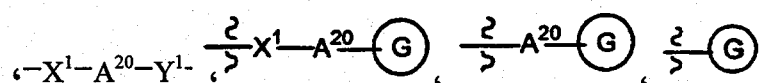
$$-\text{OC(R}^{100})_2-\text{OCH(R}^{100})-\text{O(CH}_2\text{)}_{1-4}-\text{C(R}^{100})_2-\text{C(=R}^{100})-\text{CH(R}^{100})-\text{(CH}_2\text{)}_{3-4}-\text{(CH}_2\text{)}-$$

-NH-، -S-، -N(ألكيل منخفض)، -N(ألكيل CO)، -N(أريل)، -N(ألكيل CO₂)،

- (ألكيل CONH) -N، - (ألكيل SO₂) -N و - (أريل SO₂) -N؛

R^{100} يختار من: ألكيل، هيدروكسي، أريل، ألكسو، $=N(OH)$ ؛

R^{10} يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من:



$-X^1-A^{20}-A^{21}$ و $-X^1-A^{21}$ ، حیث

X^1 و Y^1 غير موجودين أو يمثل كل منهما على حدة: -0؛

A^{20} غير موجود أو يمثل الكيل؛

حيث عندما يمثل A^{20} الأكيل، فإنه يمكن أن يحمل الأكيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر

تختار كل على حدة من: الكوكسي، الكيل أمينو، أمينو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، الكوكسي مهلجن،

هيدروكسي، NHC(=O)NH_2 ، ألكيل -NHSO_2 ، ألكيل -SO_2 ، أو ثيو ألكيل؛

A^{21} يختار من الكيل، الكينيل أو H؛

حيث عندما يمثل A^{21} الكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري

مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: الكوكسي، الكيل أمينو، أمينو، ثاني الكيل

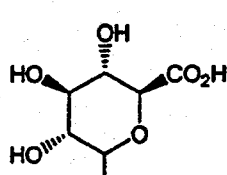
أمينو، هالوجين، الكوكسي مهلجن، هيدروكسي، NHC(=O)NH_2 ، الكيل NHSO_2 - أو ثيو الكيل؛ و

⑥

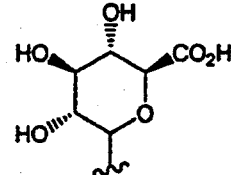
يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، أريل مخلط وألكيل حلقي مخلط يحمل

بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكيل مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل NHC(=O) ، ألكيل C(=O)N(ألكيل) ، أو ثاني ألكيل أمينو، NHC(=O)NH ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل C(=O)O ، ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل C(=O)N(ألكيل) ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل SO_2 ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ، ألكيل SO_2 مهلجن، NHC(=O)N(ألكيل) ، NHC(=O)N(ألكيل) ، NHC(=O)N(ألكيل) ، أو OC(=O)N(ألكيل) ؛ R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H؛



شريطة أن R^4 لا يمثل



(ب)

(ج) CH_2 - يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: H ، CH_2OH ، O ، C(=O)OH ، ألكيل C(=O)OH ، ألكيل C(=O)O ، أريل C(=O)O ، أريل C(=O)N(ألكيل) ، ألكيل C(=O)NH ، ألكيل C(=O)NH_2 ، ألكيل C(=O)O ، ألكيل C(=O)OCH_3 ، ألكيل OC(=O) ؛

(و) ألكيل C(=O) يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: OH ، ألكيل O ، أريل ألكيل O ، NH_2 ، ألكيل NH ، N(ألكيل) ، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل NHC(=O) ، ألكيل NHSO_2 أو ألكيل OC(=O) ؛

(ز) أريل $\text{C(=O)(CH}_2\text{)}_{1-3}$ أو أريل C(=O) ، حيث يمكن أن يحمل أريل C(=O) المذكور، بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: OH ، ألكيل O ، NH_2 ، ألكيل NH ، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل NHC(=O) ، ألكيل NHSO_2 ، هالوجين، نتريل أو ألكيل OC(=O) ؛

(ح) $-C(=O)(CH_2)_{1-6}C(=O)-$ ينتهي بمثيل، اثيل، $-OH$ ، ألكيل $-O-$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $(\text{ألكيل})_2-N-$ أو ألكيل حلقي مغلط؛

(ح ح) ألكيل $-OC(=O)ألكيل$ $-C(=O)-$ ينتهي بـ $-OH$ ، ألكيل $-O-$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ أو $(\text{ألكيل})_2-N-$ ؛

(ط) $-C(=O)O(CH_2CH_2O-)_{1-10}$ ينتهي بـ H ، مثيل، اثيل أو بنزيل؛

(ي) ألكيل $-C(=O)O-$ يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:

$-OH$ ، ألكيل $-O-$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $(\text{ألكيل})_2-N$ ، ألكيل حلقي مغلط، ألكيل-

$-NHC(=O)$ ، ألكيل $-NHSO_2$ ، ألكيل $-OC(=O)-$ ، ألكيل $-C(=O)OH$ ، ألكيل $-C(=O)O-$ ، -

$-C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)NH$ أو $(\text{ألكيل})_2-N$ $-C(=O)-$ ؛

(ك) أريل $-C(=O)O(CH_2)_{1-3}$ أو أريل $-C(=O)O-$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $-C(=O)O-$ المذكور

بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O-$ ، $-NH_2$ ،

ألكيل $-NH$ ، $(\text{ألكيل})_2-N$ ، ألكيل حلقي مغلط، ألكيل $-NHC(=O)-$ ، ألكيل $-NHSO_2$ ،

هالوجين، نتريل أو ألكيل $-OC(=O)-$ ؛

(ل) $-C(=O)NH(CH_2CH_2O-)_{1-10}$ ينتهي بـ H ، مثيل، اثيل، بنزيل، $-CH_2CH_2NH_2$ ، ألكيل-

$-CH_2CH_2NH$ ، $(\text{ألكيل})_2N$ ، $-CH_2CH_2CH_2-$ ، $-CH_2CH_2-$ ، 1 -بيروليدينيل، 1 -بييريدينيل،

4 - $-CH_2CH_2$ مورفولينيل، 1 -بييرازينيل، 1 - $-CH_2CH_2$ ، 1 - (CH_3-4) -بييرازينيل، أو

ألكيل $-C(=O)-$ ؛

(م) $-C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)NH(C_{1-20})$ أو $(\text{ألكيل})_2N(C_{1-20})$ ، حيث يمكن أن يحمل

ألكيل $-C(=O)NH(C_{1-20})$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل

على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O-$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $(\text{ألكيل})_2-N$ ، ألكيل حلقي مغلط، ألكيل-

$-NHC(=O)$ ، ألكيل $-NHSO_2$ ، ألكيل $-OC(=O)-$ ، ألكيل $-OC(=O)N$ ، أريل-

$-NHC(=O)OH$ ، ألكيل $-C(=O)O-$ ، ألكيل $-C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)NH$ أو $(\text{ألكيل})_2-N$ ،

$-C(=O)N$ ؛ وحيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل $-NHC(=O)-$ المذكور بشكل اختياري

مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، $-OH$ ، ألكيل $-O-$ ، $-NH_2$ ،

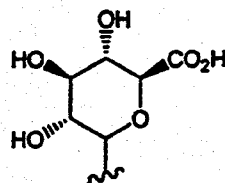
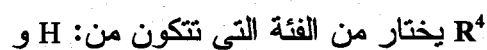
ألكيل $-NH$ ، $(\text{ألكيل})_2-N$ ، هالوجين أو نتريل؛

هالوجين، نتريل أو الكيل $\text{OC}(=\text{O})-$ ؛

NH_2 ، $(\text{ألكيل})\text{-N}$ ، هالوجين أو نتريل؛

(ث) $(\text{ألكيل})_2\text{N}-\text{SO}_2-$ ؛ و

شریطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشریطة أنه عندما يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود.



R^6 أو R^7 يمثل

L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من مثيلين، إثيلين أو

کریونیل؛

(H) يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، أريل مخلط، ألكيل حلقي

مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛

r يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ و

R⁵ يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكيل، ألكيلوكسي، -C(=O)NH₂، ألكيل -C(=O)OH، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، نثرو، -SO₂NH₂، ثيو

ألكيل، $\text{V}-\text{B}^{10}-\text{W}-\text{B}^{20}$ و $\text{V}-\text{B}^{10}$ ؛ حيث

W و V غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

-C(=O)-، -C(=O)N(ألكيل)-، -C(=O)NH-، -C(=O)O-، -NH-، -O- و -SO₂-؛

B¹⁰ غير موجود أو يمثل ألكيل؛

حيث عندما B¹⁰ يمثل ألكيل، يمكن أن يحمل الألكيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، هيدروكسي، -NHC(=O)NH₂، ألكيل -NHCO₂، ألكيل -SO₂ أو ثيو ألكيل؛

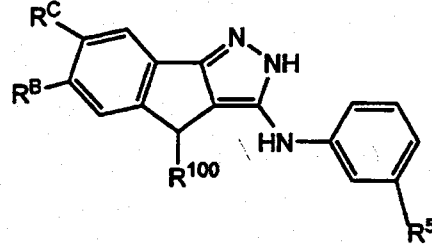
B²⁰ غير موجود أو يختار من ألكيل، ألكينيل أو H؛

حيث عندما يمثل B²⁰ ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، هيدروكسي، -NHC(=O)NH₂، ألكيل -NHCO₂، أو ثيو ألكيل؛ و

(F) يختار من الفئة التي تتكون من: فنييل، إيميدازوليل، بيريدينيل، بيريميدينيل،

مثوكسي وإثوكسي؛ و R^5 يختار من الفئة التي تتكون من: مثوكسي، إثوكسي، أيزوبروبوكسي، كلورو، برومو وفلورو.

كما يوجه الاختراع الراهن نحو مركبات بالصيغة (II-BB):



(II-BB)

حيث:

R^C يمثل $-O(CH_2)_3OH$ ؛

R^{100} يختار من الفئة التي تتكون من: H والكيل؛

R^B يختار من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي؛ و

R^5 يختار من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي وهالوجين؛

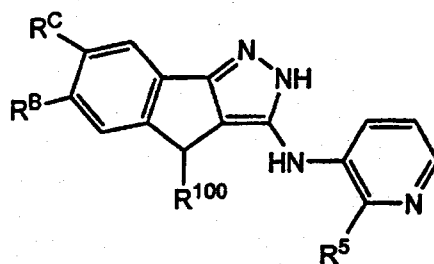
أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات، أو ملح مقبول صيدلياً منها.

ويشمل تجسيد مفضل للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II-BB) حيث R^{100} يختار من الفئة

التي تتكون من: H، مثيل، إيثيل؛ R^B يختار من الفئة التي تتكون من: مثوكسي وإثوكسي؛ و R^5 يختار

من الفئة التي تتكون من: مثوكسي، إثوكسي، أيزوبروبوكسي، كلورو، برومو وفلورو.

ويوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو مركبات بالصيغة (II-CC):



(II-CC)

حيث:

R^{100} يختار من الفئة التي تتكون من: H والكيل؛

R^C و R^B يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي؛ و

R^5 يختار من الفئة التي تتكون من: ألكيل، سيانو، هيدروكسي، ألكوكسي وهالوجين؛

أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات، أو ملح مقبول صيدلياً منها.

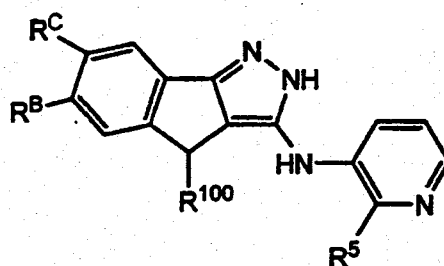
ويشمل تجسيد مفضل للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II-CC) حيث R^{100} يختار من الفئة

التي تتكون من: H، مثيل، إيثيل؛ R^C و R^B يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

مثوكسي وإثوكسي؛ و R^5 يختار من الفئة التي تتكون من: مثوكسي، إثوكسي، أيزوبروبوكسي،

كلورو، مثيل، سيانو وهيدروكسي.

ويوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو مركبات بالصيغة (II-DD):

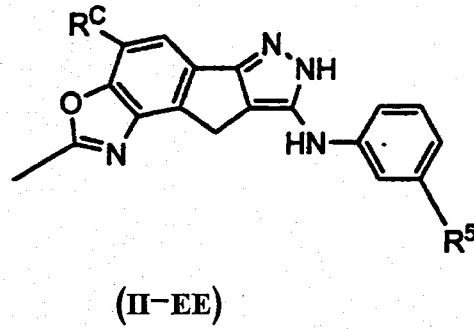


(II-DD)

حيث:

R^C يمثل $-O(CH_2)_3OH$ ؛

R^{100} يختار من الفئة التي تتكون من: H والكيل؛
 R^B يختار من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي؛ و
 R^5 يختار من الفئة التي تتكون من: ألكيل، سيانو، هيدروكسي، ألكوكسي وهالوجين؛
أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات، أو ملح مقبول صيدلياً منها.
ويشمل تجسيد مفضل للاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II-DD) حيث R^{100} يختار من الفئة التي تتكون من: H، مثيل وإثيل؛ R^B يختار من الفئة التي تتكون من: ميثوكسي وإيثوكسي، و R^5 يختار من الفئة التي تتكون من: ميثوكسي، إيثوكسي، أيزوبروبوكسي، كلورو، مثيل، سيانو وهيدروكسي.
كما يوجه الاختراع الراهن نحو مركبات بالصيغة (II-EE):



حيث:

R^5 يختار من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي وهالوجين؛ و
 R^C يختار من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي؛

حیث:

R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي، ألكيل، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل-SO₂-مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل-C(=O)-N(ألكيل)₂، -N(ألكيل)C(=O)-N(ألكيل)، ألكيل-NH-C(=O)-N(ألكيل)، ألكيل-C(=O)-O-N(ألكيل)، ألكيل-SO₂-N(ألكيل)، ألكيل-NHC(=O)-NH-ألكيل، ألكيل-NHC(=O)-NH₂، -NHC(=O)-N(ألكيل)₂، NHC(=O)-O-NHC(=O)-NH-ألكيل، -OC(=O)-N(ألكيل)₂، -OC(=O)-NH-ألكيل، -SO₂-ألكيل، ثيو وثنو ألكيل؛

L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: -
 $-(CH_2)_{1-4}$ ، $-(CH(R^{100}))$ ، $-C(=R^{100})$ ، $-C(R^{100})_2$ ، $-O$ ، $-O(CH_2)_{1-4}$ ، $-OCH(R^{100})$ ، $-OC(R^{100})_2$ ، $-S$ ،
 $-NH$ ، $-(الكيل منخفض)$ ، $-N(الكيل CO)$ ، $-N(أريل)$ ، $-(الكيل CO_2)$ ،
 $-(الكيل CONH)$ ، $-N(الكيل SO_2)$ و $-N(أريل SO_2)$ ؛ حيث R^{100} يختار من: الكيل، هيدروكسي،
 أريل، الكوكسي، أكسو، $-NH_2$ ، $-N(الكيل)$ ، $-NH(الكيل)$ ، $-N(OH)=$ أو $-NH_2OH$ ؛ شريطة أنه عندما L^2
 يمثل $-CH_2CH_2-$ ، فإنه لا يمثل أي من R^6 أو R^7 الكيل $-CH_2(C=O)NH$ ، $-CH_2(C=O)N(الكيل)_2$ أو
 الكيل $-CH_2C(=O)O$ ؛ شريطة أنه عندما L^2

يمثل $-OCH(R^{100})$ ، R^{100} يمثل الكوكسي، و (H) يمثل فنييل، فإن R^5 لا يمثل

$-C(=O)NH-NH_2$ ؛ وشريطة أنه عندما L^2 يمثل $-O$ أو $-S$ ، فإن R^6 أو R^7 لا يمثل أي منهما $-CH_3$ ؛
 R^{10} يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من (G) و X^1-A^{20} و $-Y^1-A^{21}$
 $-X^1-A^{20}$

حيث X^1 و Y^1 غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون
 من: $-(الكيل)C(=O)N(الكيل)$ ، $-(الكيل)C(=O)N(الكيل)$ ، $-C(=O)NH$ ، $-C(=O)O$ ، $-(الكيل)N$ ،
 $-(الكيل)C(=O)N(الكيل)$ ، $-N(الكيل)C(=O)O$ ، $-N(الكيل)C(=O)NH$ ، $-N(الكيل)SO_2$ ، $-NH$ ،
 $-NHC(=O)N(الكيل)$ ، $-NHC(=O)NH$ ، $-NHC(=O)O$ ، $-NHCO_2$ ، $-O$ ، $-OC(=O)$ ،
 $-(الكيل)N(الكيل)C(=O)O$ ، $-OC(=O)NH$ ، $-OC(=O)N(الكيل)$ ، $-S$ ، $-SO$ ، $-SO_2$ ، $-(الكيل)N(الكيل)SO_2$ و
 SO_2NH

A^{20} غير موجود أو يختار من الكيل أو الكينيل؛ و

A^{21} يختار من الكيل، الكينيل أو H ؛

حيث عندما يمثل A^{20} أو A^{21} الكيل أو الكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري
 مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: الكوكسي، الكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني
 الكيل أمينو، هالوجين، الكوكسي مهلجن، الكيل SO_2 مهلجن، ثيو الكيل مهلجن، هيدروكسي،

الكيل $C(=O)N(الكيل)$ ، $N(الكيل)C(=O)N(الكيل)_2$ ، $N(الكيل)C(=O)NH_2$ ، الكيل $C(=O)NH(الكيل)$ ،
 $N(الكيل)C(=O)O(الكيل)$ ، الكيل $SO_2N(الكيل)$ ، الكيل $NHC(=O)N(الكيل)_2$ ، الكيل $NHC(=O)N(الكيل)$ ،
 $NHC(=O)NH_2$ ، الكيل $NHC(=O)NH(الكيل)$ ، الكيل $NHC(=O)O(الكيل)$ ، الكيل $NHSO_2(الكيل)$ ، الكيل $(=O)$ ،
 $OC(الكيل)N(الكيل)_2$ ، الكيل $OC(=O)NH(الكيل)$ ، الكيل $OC(=O)O(الكيل)$ ، الكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو
الكيل؛

(G) يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، الكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة

جزئياً، أريل مخطط، الكيل حلقي مخطط، الكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء والكيل
حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة
الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخطط، الألكيل الحلقي المخطط، الألكيل الحلقي المدمج مع
البنزو أو الألكيل الحلقي المخطط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على
حدة من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، الكيل، الكيل مهلجن، الكوكسي، الكوكسي
مهلجن، الكيل أمينو، الكيل $NHC(=O)$ ، الكيل $C(=O)N(الكيل)$ ، أو ثاني الكيل أمينو،
 $NHC(=O)NH_2$ ، الكيل $NHC(=O)NH(الكيل)$ ، الكيل $C(=O)NH(الكيل)$ ، الكيل $OC(=O)NH(الكيل)$ ،
الكيل $NHC(=O)O(الكيل)$ ، الكيل $C(=O)O(الكيل)$ ، الكيل $N(الكيل)$ ، الكيل $NHSO_2$ ، الكيل $SO_2N(الكيل)$ ، ثيو
الكيل، ثيو الكيل مهلجن، الكيل SO_2 ، الكيل SO_2 مهلجن، $NHC(=O)N(الكيل)_2$ ،
 $N(الكيل)C(=O)N(الكيل)_2$ أو $OC(=O)N(الكيل)_2$ ؛

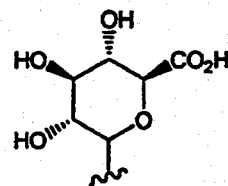
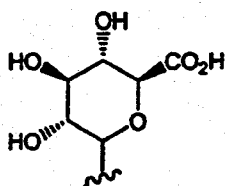
s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه يكون حاصل جمع m و s

مساوياً لعدد صحيح تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛

R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(A) H؛



شريطة أن R^4 لا يمثل

(ب)

(ج) -CH₂- يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: -H، -مethyl-، ألكيل-O-، -CH₂OH، -
CH(CH₃)OH، ألكيل-O-(C=O)-، ألكيل-C(=O)-، أريل-C(=O)O-، أريل-MgX-
-C(=O)N-، ألكيل-NH-(C=O)-، -N(C(=O)R)₂-، ألكيل-C(=O)-، -C(=O)OCH₃- فنيل- أو ألكيل-OC(=O)- فنيل-؛

(د) $\text{-C(=O)(CH}_2\text{CH}_2\text{O-)}_{1-10}$ ينتهي بـ H، مئيل، ائيل أو بنزيل؛

(هـ) $-C(=O)CH_2O(CH_2CH_2O-)_{1-10}$ ينتهي بـ H، مئیل، ائیل أو بنزیل؛

(و) الألكيل $\text{C}(=\text{O})$ - أو الألكيل حلقي $\text{C}(=\text{O})(\text{C}_3\text{--}\text{C}_6)$ ، حيث يمكن أن يحمل الألكيل $\text{C}(=\text{O})$ - المذكور والألكيل حلقي $\text{C}(=\text{O})(\text{C}_3\text{--}\text{C}_6)$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: OH -، الألكيل O -، أريل الألكيل O -، NH_2 -، ألكيل NH -، $(\text{ألكيل})_2\text{N}$ -، الألكيل حلقي مخلط، الألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ -، ألكيل NHSO_2 - أو ألكيل $\text{OC}(=\text{O})$ -؛

(ز) أرييل $(\text{CH}_2)_{1-3}(\text{C}=\text{O})$ ، أرييل $\text{C}=\text{O}$ ، أرييل مخطط $(\text{CH}_2)_{1-3}(\text{C}=\text{O})$ أو أرييل مخطط $\text{C}=\text{O}$ ، حيث يمكن أن يحمل أرييل $(\text{CH}_2)_{1-3}(\text{C}=\text{O})$ المذكور، أرييل $\text{C}=\text{O}$ المذكور، أرييل مخطط $(\text{CH}_2)_{1-3}(\text{C}=\text{O})$ المذكور وأرييل مخطط $\text{C}=\text{O}$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: OH ، ألكيل O ، NH_2 ، ألكيل NH ، $(\text{ألكيل})_2\text{N}$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل $\text{NHC}=\text{O}$ ، ألكيل NHSO_2 ، هالوجين، نتريل أو ألكيل $\text{OC}=\text{O}$ ؛

(ح) -C(=O)(CH₂)₁₆C(=O)- ينتهي بمثيل، ائيل، -OH، الكيل-O-، -NH₂، الكيل-NH-، (الكيل)₂-N- أو الكيل حلقى مختلط؛

(ح ح) -الكيل OC(=O)الكيل C(=O)- ينتهي بـ -OH، الكيل-O، -NH₂، الكيل-NH، (الكيل)₂-N أو الكيل حلقى مخلط؛

(ط) $-C(=O)O(CH_2CH_2O-)_{1-10}$ ينتهي بـ H، ميثيل، ايثيل أو بنزيل؛

9

1.

15

Y.

Yc

Yc

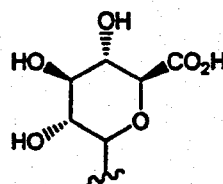
Yc

Yc

Yc

Yc

Y.



فان R^4 یمثل H ؛

 R^6 أو R^7 بمثل

L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من ألكيل دييل، كربونيل

 $\text{!-SO}_2\text{-}$ أو

(H) يختار من الفئة التي تتكون من أريل، الأليل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة

جزئياً، أراكيل، أرييل مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، أرييل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛

r يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ و

R^5 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: الأليل، الأليل أمينو، الأليلوكسي، أمينو، $-C(=O)NH_2$ ، الأليل $-C(=O)O$ ، $-C(=O)OH$ ، $-CH_2OH$ ، سيانو، ثاني الأليل أمينو، هالوجين، الأليل مهلجن، الأليلوكسي مهلجن، الأليل- SO_2 مهلجن، ثيو الأليل مهلجن، هيدروكسي، هيدروكسي الأليل، الأليل $-C(=O)N(الليل)$ ، $-N(الليل)C(=O)N(الليل)$ ، الأليل $-C(=O)NH(الليل)$ ، الأليل $-C(=O)O(الليل)$ ، الأليل $-SO_2(الليل)$ ، الأليل $-NHC(=O)$ ، $-NHC(=O)N(الليل)$ ، $-NHC(=O)NH_2$ ، $-OC(=O)N(الليل)$ ، $-NH_2$ ، $-SO_2NH_2$ ، ثيو، ثيو الأليل

الكيل، $\zeta\text{-V-B}^{10}\text{-(F)}$ و $\text{-V-B}^{10}\text{-W-B}^{20}$ ؛ حيث

V و W غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من: $C(=O)-$ ،
 $-N(الـكـيـل)C(=O)-$ ، $-C(=O)O-$ ، $-C(=O)NH-$ ، $-C(=O)N(الـكـيـل)-$ ،
 $-NH-$ ، $-N(الـكـيـل)SO_2-$ ، $-N(الـكـيـل)C(=O)O-$ ، $-N(الـكـيـل)C(=O)NH-$ ، $-N(الـكـيـل)C(=O)N(الـكـيـل)-$ ،
 $-OC(=O)-$ ، $-O-$ ، $-NHSO_2-$ ، $-NHC(=O)O-$ ، $-NHC(=O)NH-$ ، $-NHC(=O)N(الـكـيـل)-$ ، $NHC(=O)-$

-SO₂N(ألكيل)-، -SO₂-، -SO-، -S-، -OC(=O)O-، -OC(=O)NH-، -OC(=O)N(ألكيل)-، -SO₂NH₂.

B^{10} غير موجود أو يختار من الكيل أو ألكينيل؛

B^{20} غير موجود أو يختار من الكيل، ألكينيل أو H؛

حيث عندما يمثل B¹⁰ أو B²⁰ ألكيل أو ألكنيل، فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل أو الألكنيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: الكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل-SO₂-مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيلC(=O)N(ألكيل)-، -N(ألكيل)₂C(=O)N(ألكيل)، -N(ألكيل)C(=O)NH₂، ألكيلC(=O)NH(ألكيل)-، N-ألكيلC(=O)O(ألكيل)-، نـAلكيلSO₂(ألكيل)-، Aلكيل-NHC(=O)-، -NHC(=O)N(ألكيل)₂، -NHC(=O)NH₂، ألكيلNHC(=O)-، ألكيل-OH(ألكيل)-، ألكيلOH(ألكيل)-، ألكيلOC(=O)-، OC(=O)N(ألكيل)₂، ألكيلOC(=O)NH-، ألكيلOC(=O)-، ألكيلSO₂-، ثيو أو ثيو ألكيل؛ و

(F) يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقى، حلقة كربونية غير مشبعة

جزئياً، أريل مخطط، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء،

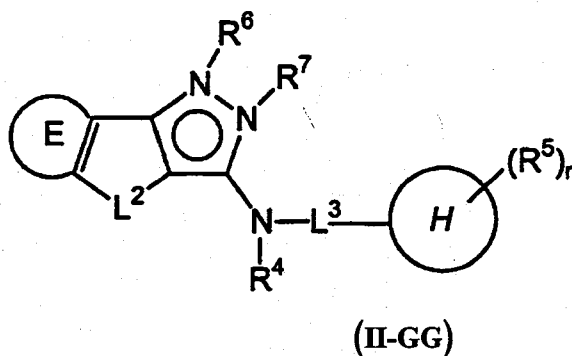
حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخلط، الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، أريل مخلط، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل $\text{C}(=\text{O})$ (ألكيل) N ، N (ألكيل) $\text{C}(=\text{O})$ N (ألكيل) $\text{C}(=\text{O})$ O ألكيل، ألكيل $\text{C}(=\text{O})$ NH (ألكيل) N ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})$ O (ألكيل) N ، ألكيل SO_2 (ألكيل) N ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ N (ألكيل) 2 ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ NH_2 ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ NH (ألكيل) N ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ O ، ألكيل NHSO_2 ، نيترو، ألكيل $\text{OC}(=\text{O})$ N (ألكيل) 2 ، ألكيل $\text{OC}(=\text{O})$ NH (ألكيل) N ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل؛

أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منها.

وتشمل تجسيدات أخرى للاختراع مركبات بالصيغة II-FF حيث L^2 ، R^4 ، R^6 ، R^7 ، L^3 ، H و

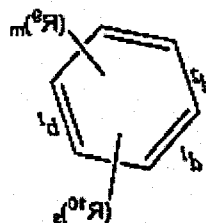
$(R^5)_r$ تتغير كما ذكر في القسم ١.أ.٢ أعلاه المتعلق بالصيغة (II) وتوليفات من تغييراتها.

وفي تجسيد مفضل يوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو مركبات بالصيغة (II-GG):



حيث:

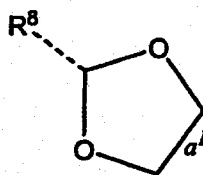
يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:



(الصيغة أ-١)،

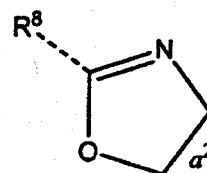
حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II-GG) وتحمل بشكل اختياري بديلاً

واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢، أ-٣ و أ-٤-ج:



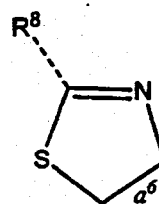
(الصيغة أ-١-أ')

حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ' من جهة a^1 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛



(الصيغة أ-١-ب)

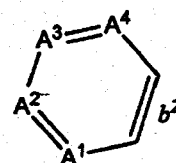
حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و



(الصيغة أ-١-ج)

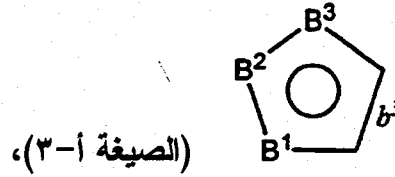
حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

حيث R^8 يمثل H أو ألكيل؛



(الصيغة أ-٢)

حيث ترتبط الصيغة أ-٢ من جهة b^2 بالحلقة L^2 في الصيغة (II-GG)؛ ويمثل A^1, A^2, A^3, A^4 (I) -N؛ أو (ii) C- يحمل بديلاً من H أو ألكوكسي، حيث يمكن أن يحمل الألكوكسي أيضاً بشكل اختياري بديلاً من ألكوكسي على ذرة كربون طرفية أو ما لا يزيد عن ٣ ذرات هالوجين على ذرة كربون طرفية؛ شريطة أن يمثل واحداً على الأقل من A^1, A^2, A^3, A^4 أو اثنين على الأكثر -N؛ و



حيث ترتبط الصيغة أ-٣ من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II-GG)؛ ويمثل كل من B^1, B^2 و B^3 على حدة (I) CH- يحمل بديلاً بشكل اختياري من ألكيل، أريل، ألكوكسي، أو هالوجين، (ii) S-، (iii) O- أو (iv) N-؛ شريطة أن واحداً على الأكثر من B^1, B^2 أو B^3 يمثل S- أو O-، و، شريطة أنه عندما B^1, B^2 أو B^3 يمثل S- أو O-، فإن أعضاء الحلقة المجاورة لا تمثل S- أو O-؛

R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكيل، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل $C(=O)N$ (ألكيل)، N ، ألكيل $C(=O)N$ (ألكيل)، ألكيل $C(=O)NH$ (ألكيل)، N ، ألكيل $C(=O)O$ (ألكيل)، ألكيل SO_2 (ألكيل)، N ، ألكيل $NHC(=O)N$ (ألكيل)، $NHC(=O)N$ ، ألكيل $NHC(=O)O$ (ألكيل)، ألكيل $NHC(=O)NH$ (ألكيل)، $NHC(=O)NH_2$ ، ألكيل $OC(=O)N$ (ألكيل)، ألكيل $OC(=O)NH$ (ألكيل)، ألكيل SO_2 ، ثيو و ثيو ألكيل؛

L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: -
 $(CH_2)_{1-4}$ ، $CH(R^{100})$ ، $C(=R^{100})$ ، $C(R^{100})_2$ ، O ، $O(CH_2)_{1-4}$ ، $OCH(R^{100})$ ، $OC(R^{100})_2$ ، S-، NH-، ألكيل منخفض، N ، ألكيل CO ، N ، ألكيل CO_2 ، N ، ألكيل $CONH$ ، N ، ألكيل SO_2 و ألكيل SO_2 ؛ حيث R^{100} يختار من: ألكيل، هيدروكسي، أريل، ألكوكسي، أكسو، NH_2 ، N ، ألكيل N ، ألكيل NH ، $N(OH)$ أو NH_2OH ؛ شريطة أنه عندما L^2 يمثل - $OCH(R^{100})$ ، R^{100} يمثل ألكوكسي،

و (H) يمثل فنيل، فإن R^5 لا يمثل $-C(=O)NH-NH_2$ ؛

R^{10} يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من (G) $-Y^1-A^{21} \xrightarrow{\frac{2}{3}} X^1-A^{20}$ $-X^1-A^{20}$.

حيث X^1 و Y^1 غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من: $-(\text{ألكيل})C(=O)N(\text{ألكيل})-$ ، $-(\text{ألكيل})C(=O)N-$ ، $-C(=O)N(\text{ألكيل})-$ ، $-C(=O)NH-$ ، $-C(=O)O-$ ، $-(\text{ألكيل})N-$ ، $-(\text{ألكيل})SO_2-$ ، $-NH-$ ، $-N(\text{ألكيل})C(=O)O-$ ، $-N(\text{ألكيل})C(=O)NH-$ ، $-N(\text{ألكيل})C(=O)N(\text{ألكيل})-$ ، $-NHC(=O)N(\text{ألكيل})-$ ، $-NHC(=O)NH$ ، $-NHC(=O)O-$ ، $-NHSO_2-$ ، $-O-$ ، $-OC(=O)$ ، $-(\text{ألكيل})N(\text{ألكيل})C(=O)O-$ ، $-(\text{ألكيل})N(\text{ألكيل})C(=O)NH-$ ، $-(\text{ألكيل})N(\text{ألكيل})C(=O)N(\text{ألكيل})-$ ، $-SO_2N(\text{ألكيل})-$ و $-SO_2NH-$ ؛

A^{20} غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛ و

A^{21} يختار من ألكيل، ألكينيل أو H؛

حيث عندما يمثل A^{20} أو A^{21} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل SO_2 -مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل $C(=O)N(\text{ألكيل})-$ ، $-N(\text{ألكيل})C(=O)N(\text{ألكيل})_2$ ، $-N(\text{ألكيل})C(=O)NH_2$ ، ألكيل $C(=O)NH(\text{ألكيل})-$ ، $-N(\text{ألكيل})C(=O)O$ ، ألكيل $C(=O)N(\text{ألكيل})-$ ، ألكيل $SO_2N(\text{ألكيل})-$ ، ألكيل $NHC(=O)N(\text{ألكيل})_2$ ، $-NHC(=O)N(\text{ألكيل})-$ ، $-NHC(=O)NH$ ، ألكيل $NHC(=O)O$ ، ألكيل $NHC(=O)NH_2$ ، $-OC(=O)N(\text{ألكيل})_2$ ، ألكيل $OC(=O)NH$ ، ألكيل $OC(=O)O$ ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل؛

(G) يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة

جزئياً، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخلط، الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل NHC(=O) ، ألكيل C(=O)N(ألكيل) ، أو ثاني ألكيل أمينو، - NHC(=O)NH_2 ، ألكيل NHC(=O)NH ، ألكيل C(=O)NH(ألكيل) ، ألكيل OC(=O)NH ، ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل C(=O)O(ألكيل) ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل $\text{SO}_2\text{N(ألكيل)}$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ، ألكيل SO_2 مهلجن، NHC(=O)N(ألكيل)_2 ، NHC(=O)N(ألكيل)_2 أو $\text{N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)}_2$ ؛

s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما لا يحمل

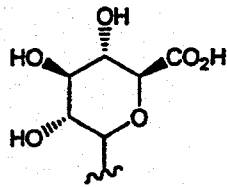
بديلاً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s

يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤، وعندما يحمل بديلاً

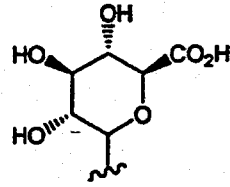
واحداً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H؛



شريطة أن R^4 لا يمثل



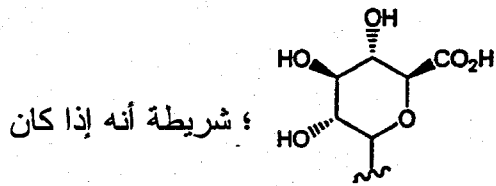
(ب)

(ج) ألكيل؛

(د) OH ألكيل C(=O) ؛ و

(هـ) ألكوكسي CH_2O C(=O) ؛

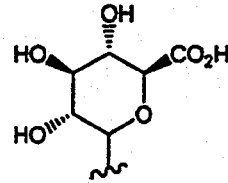
شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود؛



؛ شريطة أنه إذا كان

R^4 يختار من الفئة التي تتكون من: H و

فإن R^4 يمثل H ؛



R^6 أو R^7 يمثل

L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من ألكيل ديبيل، كربونيل

أو $-\text{SO}_2-$ ؛

يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة



جزئياً، أراكيل، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، أريل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛

r يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ و

R^5 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكيل، ألكيل أمينو، ألكيلوكسي، أمينو، C(=O)NH_2 ، ألكيل C(=O)O ، C(=O)OH ، CH_2OH ، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل C(=O)N(ألكيل) ، $\text{N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)}$ ، ألكيل

، NHC(=O) ألكيل N(الكيل)C(=O)O ألكيل $\text{SO}_2\text{N(الكيل)}$ ، ألكيل NHC(=O) ،
 NHC(=O)N(الكيل) ، NHC(=O)NH_2 ، ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل NHC(=O) ، ألكيل-
 NHSO_2 ، نترو، OC(=O)N(الكيل) ، ألكيل OC(=O)NH ، ألكيل SO_2NH_2 ،
 ثيو، ثيو

ألكيل، $\text{V-B}^{10}\text{-}\text{F}$ و $\text{V-B}^{10}\text{-W-B}^{20}$ ؛ حيث

V و W غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:
 N(الكيل)C(=O) ، N(الكيل)C(=O)O ، N(الكيل)C(=O)NH ، $\text{N(الكيل)C(=O)N(الكيل)}$ ،
 NHC(=O) ، NHC(=O)N(الكيل) ، NHC(=O)NH ، NHC(=O)O ، NHC(=O)NH_2 ،
 NHSO_2 ، $\text{SO}_2\text{N(الكيل)}$ ، OC(=O)N(الكيل) ، OC(=O)NH ، OC(=O)O ، S ، SO ، SO_2 ،
 $\text{SO}_2\text{N(الكيل)}$ و SO_2NH ؛

B^{10} غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛

B^{20} غير موجود أو يختار من ألكيل، ألكينيل أو H ؛

حيث عندما يمثل B^{10} أو B^{20} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل أو الألكينيل بشكل
 اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو،
 سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل
 مهلجن، هيدروكسي، ألكيل N(الكيل)C(=O) ، $\text{N(الكيل)C(=O)N(الكيل)}$ ،
 N(الكيل)C(=O)NH ، ألكيل N(الكيل)C(=O)O ، ألكيل $\text{SO}_2\text{N(الكيل)}$ ،
 NHC(=O) ، NHC(=O)N(الكيل) ، NHC(=O)NH_2 ، ألكيل NHC(=O)NH ،
 ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل OC(=O) ، OC(=O)N(الكيل) ، ألكيل OC(=O)NH ،
 ألكيل OC(=O)O ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل؛ و

يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة

(F)

حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخلط، الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل مهلجن، ألكيل-SO₂-مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، أريل مخلط، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل-C(=O)-ألكيل-N،
-N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)، ألكيل-NH-C(=O)-ألكيل، ألكيل-O-C(=O)-ألكيل-N،
ألكيل-SO₂-ألكيل-N، ألكيل-NHC(=O)-، ألكيل-NHC(=O)-N(ألكيل)₂، ألكيل-NHC(=O)-NH₂،
ألكيل-NHC(=O)-NH-ألكيل، ألكيل-NHC(=O)-O-ألكيل، ألكيل-NHSO₂-، نثرو، -N(ألكيل)-O-C(=O)-،
ألكيل-NH-C(=O)-O-، ألكيل-SO₂، ثيو أو ثيو ألكيل؛

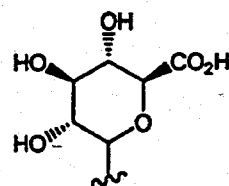
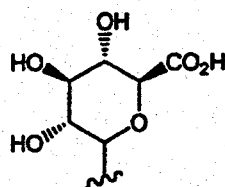
أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منها.

وتشمل تجسيدات أخرى للاختراع مركبات بالصيغة II-GG حيث E, L^2, R^4, L^3, H و $(R^5)_r$ تتغير كما ذكر في القسم ١.٠.٢ أعلاه المتعلق بالصيغة (II) ويتغير R^6 و R^7 كما سيذكر أدناه وتوليفات من التغيرات لـ $E, L^2, R^4, L^3, H, (R^5)_r, R^6$ و R^7 .

ويشمل تجسيد مفضل للاختراع مركبات بالصيغة II-GG حيث R^7 غير موجود و R^6 يختار

من الفئة التي تتكون من:

‘H (i)

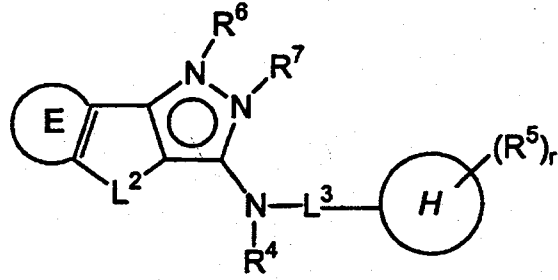


(ج) مثیل؛

(د) $-C(=O)CH_2OH$ و

(هـ) مثنوكسي $-C(=O)CH_2O$

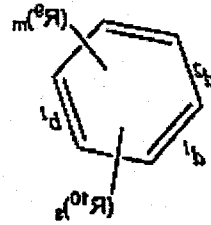
وفي تجسيد مفضل، يوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو مركبات بالصيغة (II-HH):



الصيغة (II-HH)

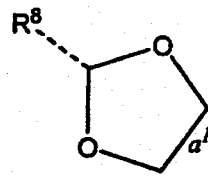
حيث:

(E) يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:



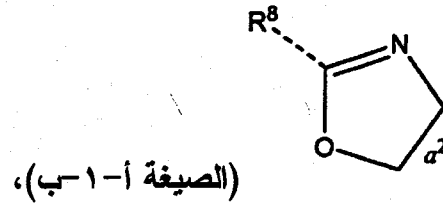
(الصيغة أ-١)،

حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II-HH) وتحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-١-أ، أ-١-ب و أ-١-ج:

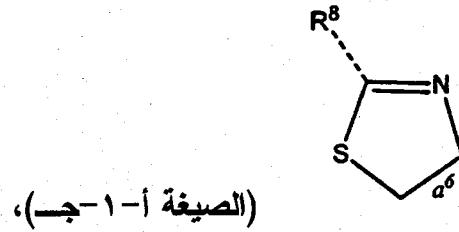


(الصيغة أ-١-أ')

حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ' من جهة a^1 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛



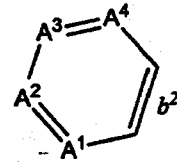
حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و



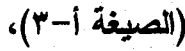
حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

حيث R^8 يمثل H أو ألكيل؛

(الصيغة أ-٢)،



0



١٠

10

۲.

٢٥

مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل-NHC(=O)، ألكيلC(=O)(ألكيل)-N، أو ثاني ألكيل أمينو، -NHC(=O)NH₂، ألكيلNHC(=O)NH₂، ألكيلNHC(=O)NH₂، ألكيلC(=O)NH(ألكيل)-N، ألكيلOC(=O)NH₂، ألكيلNHC(=O)O، ألكيلC(=O)O(ألكيل)-N، ألكيلNHSO₂، ألكيلSO₂(ألكيل)-N، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيلSO₂، ألكيلSO₂-مهلجن، (ألكيل)₂N(ألكيل)-NHC(=O)، (ألكيل)₂N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)-N أو (ألكيل)₂N(ألكيل)OC(=O)؛

s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما لا

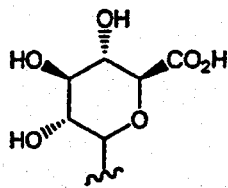
يحمل (E) بديلاً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و

s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤، وعندما يحمل (E) بديلاً

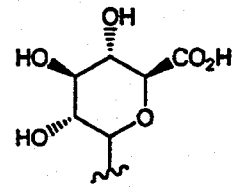
واحداً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

R⁶ و R⁷ يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H؛



شريطة أن R⁴ لا يمثل



(ب)

(ج) -CH₂- يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: -H، ميثيل، ألكيل-O، -CH₂OH، -

CH(CH₃)OH، ألكيلO(C=O)-، -OH(C=O)-، ألكيلO(C=O)-، أريلO(C=O)-، أريلO(C=O)-،

-C(=O)O، -C(=O)NH₂، ألكيلNH(C=O)-، (ألكيل)₂N(C=O)-، ألكيلC(=O)-، -

CH₃O(C=O)فثيل- أو ألكيلO(C=O)فثيل-؛

(د) -C(=O)(CH₂CH₂O)-₁₋₁₀ ينتهي بـ H، ميثيل، إيثيل أو بنزيل؛

(هـ) $-C(=O)CH_2O(CH_2CH_2O-)_{1-10}$ ينتهي بـ H، مثيل، اثيل أو بنزيل؛

(و) ألكيل $-C(=O)-$ أو ألكيل حلقي $-C(=O)(C_{3-6})-$ ، حيث يمكن أن يحمل ألكيل $-C(=O)-$ المذكور وألكيل حلقي $-C(=O)(C_{3-6})-$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: OH-، ألكيل-O-، أريل ألكيل-O-، NH_2- ، ألكيل-NH-، $(ألكيل)_2-N-$ ، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل $-NHC(=O)-$ ، ألكيل $-NHSO_2-$ أو ألكيل $-OC(=O)-$ ؛

(ز) أريل $-C(=O)(CH_2)_{1-3}-$ ، أريل $-C(=O)-$ ، أريل مخلط $-C(=O)(CH_2)_{1-3}-$ أو أريل مخلط $-C(=O)-$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $-C(=O)(CH_2)_{1-3}-$ المذكور، أريل $-C(=O)-$ المذكور، أريل مخلط $-C(=O)(CH_2)_3-$ المذكور وأريل مخلط $-C(=O)-$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: OH-، ألكيل-O-، NH_2- ، ألكيل-NH-، $(ألكيل)_2-N-$ ، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل $-NHC(=O)-$ ، ألكيل $-NHSO_2-$ ، هالوجين، نتريل أو ألكيل $-OC(=O)-$ ؛

(ح) $-C(=O)(CH_2)_{1-6}-C(=O)-$ ينتهي بمثل، اثيل، OH-، ألكيل-O-، NH_2- ، ألكيل-NH-، $(ألكيل)_2-N-$ أو ألكيل حلقي مخلط؛

(ح ح) ألكيل $-OC(=O)ألكيل-C(=O)-$ ينتهي بـ OH-، ألكيل-O-، NH_2- ، ألكيل-NH-، $(ألكيل)_2-N-$ أو ألكيل حلقي مخلط؛

(ط) $-C(=O)O(CH_2CH_2O-)_{1-10}$ ينتهي بـ H، مثيل، اثيل أو بنزيل؛

(ي) ألكيل $-C(=O)O-$ أو ألكيل حلقي $-C(=O)O(C_{3-6})-$ ، حيث يمكن أن يحمل ألكيل $-C(=O)O-$ المذكور، وألكيل حلقي $-C(=O)O(C_{3-6})-$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: OH-، ألكيل-O-، NH_2- ، ألكيل-NH-، $(ألكيل)_2-N-$ ، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل $-NHC(=O)-$ ، ألكيل $-NHSO_2-$ ، ألكيل $-OC(=O)OH-$ ، ألكيل $-OC(=O)-$ ،

$C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-NH-C(=O)-$ أو $(ألكيل)_2-N-C(=O)-$ ؛

(ك) أريل $-C(=O)O(CH_2)_{1-3}-$ ، أريل $-C(=O)O-$ ، أريل مخلط $-C(=O)O(CH_2)_{1-3}-$ أو أريل مخلط $-C(=O)O-$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $-C(=O)O(CH_2)_{1-3}-$ المذكور، أريل $-C(=O)O-$ المذكور، أريل مخلط $-C(=O)O(CH_2)_{1-3}-$ المذكور أو أريل مخلط $-C(=O)O-$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: OH-، ألكيل-O-، NH_2- ، ألكيل-NH-، $(ألكيل)_2-N-$ ، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل $-NHC(=O)-$ ، ألكيل $-NHSO_2-$ ، هالوجين، نتريل أو ألكيل $-OC(=O)-$ ؛

(ل) $C(=O)NH(CH_2CH_2O-)_{1-10}$ ينتهي بـ H ، مثيل، اثيل، بنزيل، $-CH_2CH_2NH_2$ ، ألكيل-
 CH_2CH_2NH ، $(\text{ألكيل})_2$ ، $-CH_2CH_2N(\text{ألكيل})$ ، $-CH_2CH_2$ ، $1-\text{بيروليدينيل}$ ، $1-\text{بييريدينيل}$ ،
 $4-\text{مورفولينيل}$ ، $1-\text{بييرازينيل}$ ، $1-\text{بييرازينيل}$ ، $1-(\text{ألكيل})-\text{بييرازينيل}$ ، أو
 ألكيل $C(=O)-$ ؛

(م) $C(=O)NH_2$ ، ألكيل $C(=O)NH(C_{1-20})$ ، ألكيل حلقي $C(=O)NH(C_{3-6})$ أو $(\text{ألكيل})_2$ ،
 $C(=O)N$ ، حيث يمكن أن يحمل ألكيل $C(=O)NH(C_{1-20})$ المذكور، ألكيل حلقي $C(=O)NH(C_{3-6})$ ،
 المذكور و $(\text{ألكيل})_2$ $C(=O)N$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل
 على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، NH_2 ، ألكيل $-NH$ ، $(\text{ألكيل})_2$ ، ألكيل حلقي مخطط،
 ألكيل $NHC(=O)-$ ، ألكيل $NHSO_2-$ ، ألكيل $OC(=O)-$ ، ألكيل $OC(=O)-$ ، ألكيل $OC(=O)-$ ،
 $NHC(=O)OH$ ، $C(=O)OH$ ، ألكيل $C(=O)O$ ، $C(=O)NH_2$ ، ألكيل $C(=O)NH$ ، أو $(\text{ألكيل})_2$ ،
 $C(=O)N$ ؛ وحيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل $NHC(=O)-$ المذكور بشكل اختياري
 مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، -
 NH_2 ، ألكيل $-NH$ ، $(\text{ألكيل})_2$ ، هالوجين أو نتريل؛

(ن) أريل $C(=O)NH(CH_2)_{1-3}$ ، أريل $C(=O)NH$ ، أريل مخطط $C(=O)NH(CH_2)_{1-3}$ أو أريل
 مخطط $C(=O)NH$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $C(=O)NH(CH_2)_{1-3}$ المذكور، أريل $C(=O)NH$ ،
 C المذكور، أريل مخطط $C(=O)NH(CH_2)_{1-3}$ المذكور، وأريل مخطط $C(=O)NH$ المذكور بشكل
 اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، NH_2 ، ألكيل-
 NH ، $(\text{ألكيل})_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل $NHC(=O)-$ ، ألكيل $NHSO_2-$ ، هالوجين،
 نتريل أو ألكيل $OC(=O)-$ ؛

(ع) $C(=O)NHCH_2CH_2NH(CH_2CH_2NH-)_{0-3}$ ينتهي بـ H ، مثيل، اثيل، ألكيل-
 CH_2CH_2NH ، $(\text{ألكيل})_2$ ، $-CH_2CH_2N(\text{ألكيل})$ ، $-CH_2CH_2$ ، $1-\text{بيروليدينيل}$ ، $1-\text{بييريدينيل}$ ،
 $4-\text{مورفولينيل}$ ، $1-\text{بييرازينيل}$ ، $1-\text{بييرازينيل}$ ، $1-(\text{ألكيل})-\text{بييرازينيل}$ ، أو
 $1-\text{بييرازينيل}$ ، $1-\text{بييرازينيل}$ ، $1-\text{بييرازينيل}$ ، $1-\text{بييرازينيل}$ ، $1-\text{بييرازينيل}$ ،
 $CH_2CH_2OC(=O)$ أو أريل $C(=O)-$ ؛ حيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل $C(=O)-$ المذكور

بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، -OH، ألكيل-O، -

NH_2 ، ألكيل-NH، $\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، هالوجين أو نتريل؛

(ف) $-\text{C}(=\text{S})\text{NH}_2$ ؛

(ق) ألكيل $-\text{C}(=\text{S})\text{NH}$ ؛

(ر) $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ؛

(ش) $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ ؛

(ت) ألكيل $-\text{SO}_2\text{NH}$ ؛

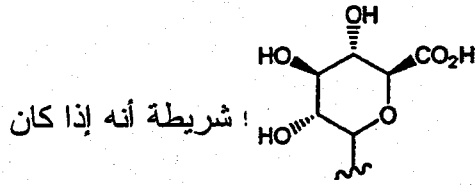
(ث) $-\text{SO}_2\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ؛

(خ) $-\text{P}(=\text{O})(\text{OCH}_3)_2$ ؛ و

(ذ) $-\text{P}(=\text{O})(\text{OCH}_2\text{CH}_3)_2$ ؛

شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما يكون R^7

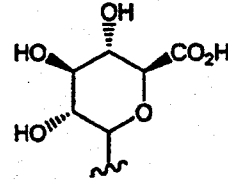
موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود؛



! شريطة أنه إذا كان

R^4 يختار من الفئة التي تتكون من: H و

فإن R^4 يمثل H؛



R^6 أو R^7 يمثل

L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من ألكيل دبيل، كربونيل

أو $-\text{SO}_2-$

يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة



1

1

1



1

1

1

1

هيدروكسي، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ،
 $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{ألكيل})$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{ألكيل})$ ، ألكيل $\text{SO}_2(\text{ألكيل})$ ،
ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ،
ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل $\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، ألكيل $\text{OC}(=\text{O})\text{NH}$ ،
ألكيل $\text{OC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل؛ و

(F) يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة

جزئياً، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء،

حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخلط، الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 -مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، أريل مخلط، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل $\text{C}(=\text{O})$ (ألكيل)-N، N_2 (ألكيل) $\text{C}(=\text{O})$ (ألكيل)-N، ألكيل $\text{NH} \text{C}(=\text{O})$ (ألكيل)-N، ألكيل $\text{O} \text{C}(=\text{O})$ (ألكيل)-N، ألكيل SO_2 (ألكيل)-N، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}_2$ (ألكيل)-N، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $\text{O} \text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل NH_2SO_2 ، نثرو، N_2 (ألكيل) $\text{N}(\text{O})=\text{O}$ ، ألكيل $\text{NH} \text{C}(=\text{O})$ ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل؛

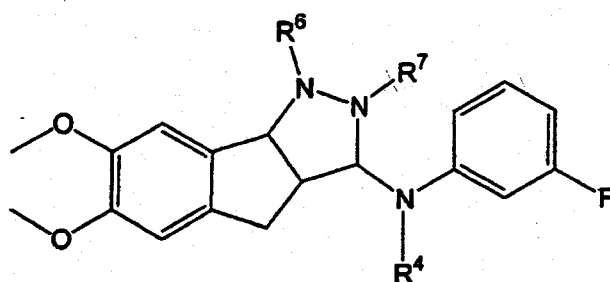
أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منها.

وتشمل تجسيدات أخرى للاختراع مركبات بالصيغة II-HH حيث E, R^4, R^6, R^7, L_3, H و $(R^5)_r$ تتغير كما هو مذكور في القسم ١.٠.٢ أعلاه فيما يتعلق بالصيغة II و L^2 يتغير كما هو مذكور أدناه، وتوليفات من التغييرات سابقة الذكر لـ $E, L^2, R^4, R^6, R^7, L_3, H, (R^5)_r$.

ويشمل تجسيد مفضل للاختراع مركبات بالصيغة II-HH حيث

L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: $-(CH_2)-$ ، $-CH(CH_3)-$ ، $-CH(CH_2CH_3)-$.

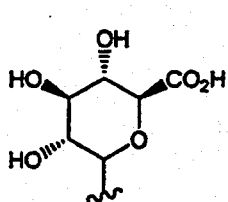
وفي تجسيد مفضل، يوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو مركبات بالصيغة (II-JJ):



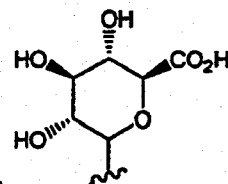
الصيغة (II-JJ)

حيث R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H؛



مريطة أن R^4 لا يمثل



(ب)

(ج) $-CH_2-$ يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: H، مثيل، ألكيل-O، $-CH_2OH$ ،

$CH(CH_3)OH$ ، ألكيل $O(C=O)-$ ، $-(C=O)OH$ ، ألكيل $O(C=O)-$ ، أريل $O(C=O)-$ ، أريل مخطط-

$C(=O)O$ ، $-(C=O)NH_2$ ، ألكيل $(C=O)NH-$ ، $-(C=O)N$ (ألكيل) $_2$ ، ألكيل $C(=O)-$ ،

CH_3OCH_2- فنيل- أو ألكيل $OC(=O)-$ فنيل-؛

(د) $\text{C}(=\text{O})(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{1-10}$ ينتهي بـ H، مثيل، اثيل أو بنزيل؛

(هـ) $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{1-10}$ ينتهي بـ H، مثيل، اثيل أو بنزيل؛

(و) ألكيل $\text{C}(=\text{O})$ أو ألكيل حلقي $\text{C}(=\text{O})(\text{C}_{3-6})$ ، حيث يمكن أن يحمل ألكيل $\text{C}(=\text{O})$ المذكور

والألكيل حلقي $\text{C}(=\text{O})(\text{C}_{3-6})$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار

كل على حدة من: -OH، ألكيل -O، أريل ألكيل -O، NH_2 ، ألكيل -NH، $(\text{ألكيل})_2\text{-N}$ ، ألكيل

حلقي مخلط، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل NHSO_2 أو ألكيل $\text{OC}(=\text{O})$ ؛

(ز) أريل $(\text{CH}_2)_{1-3}\text{C}(=\text{O})$ ، أريل $\text{C}(=\text{O})$ ، أريل مخلط $(\text{CH}_2)_{1-3}\text{C}(=\text{O})$ أو أريل مخلط-

$\text{C}(=\text{O})$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $(\text{CH}_2)_{1-3}\text{C}(=\text{O})$ المذكور، أريل $\text{C}(=\text{O})$ المذكور، أريل

مخلط $(\text{CH}_2)_{1-3}\text{C}(=\text{O})$ المذكور وأريل مخلط $\text{C}(=\text{O})$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة

واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH، ألكيل -O، NH_2 ، ألكيل -NH، $(\text{ألكيل})_2\text{-N}$ ،

ألكيل حلقي مخلط، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل NHSO_2 ، هالوجين، نتريل أو ألكيل-

$\text{OC}(=\text{O})$ ؛

(ح) $\text{C}(=\text{O})(\text{CH}_2)_{1-6}\text{C}(=\text{O})$ ينتهي بمثيل، اثيل، -OH، ألكيل -O، NH_2 ، ألكيل -NH، $(\text{ألكيل})_2\text{-N}$ أو

ألكيل حلقي مخلط؛

(ح ح) ألكيل $\text{OC}(=\text{O})$ ألكيل $\text{C}(=\text{O})$ ينتهي بـ -OH، ألكيل -O، NH_2 ، ألكيل -NH، $(\text{ألكيل})_2\text{-N}$ أو ألكيل

حلقي مخلط؛

(ط) $\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{1-10}$ ينتهي بـ H، مثيل، اثيل أو بنزيل؛

(ي) ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ أو ألكيل حلقي $\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{C}_{3-6})$ ، حيث يمكن أن يحمل ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ المذكور

والألكيل حلقي $\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{C}_{3-6})$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل

على حدة من: -OH، ألكيل -O، NH_2 ، ألكيل -NH، $(\text{ألكيل})_2\text{-N}$ ، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل-

$\text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل $\text{OC}(=\text{O})$ ، $\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ، -

$\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $\text{NH}(\text{ألكيل})$ أو $(\text{ألكيل})_2\text{N}(\text{ألكيل})$ ؛

(ك) أريل $(\text{CH}_2)_{1-3}\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ، أريل $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ، أريل مخلط $(\text{CH}_2)_{1-3}\text{C}(=\text{O})\text{O}$ أو أريل مخلط $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ،

حيث يمكن أن يحمل أريل $(\text{CH}_2)_{1-3}\text{C}(=\text{O})\text{O}$ المذكور، أريل $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ المذكور، أريل

مخلط $(\text{CH}_2)_{1-3}\text{C}(=\text{O})\text{O}$ المذكور أو أريل مخلط $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة

$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ أو أريل $\text{C}(=\text{O})$ ؛ حيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل $\text{C}(=\text{O})$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، OH ، ألكيل O ، NH_2 ، ألكيل NH ، $\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، هالوجين أو نتريل؛

(ف) $\text{C}(=\text{S})\text{NH}_2$ ؛

(ق) ألكيل $\text{C}(=\text{S})\text{NH}$ ؛

(ر) $\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ؛

(ش) SO_2NH_2 ؛

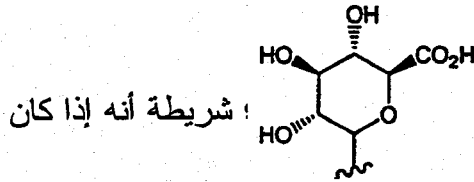
(ت) ألكيل SO_2NH ؛

(ث) $\text{SO}_2\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ؛

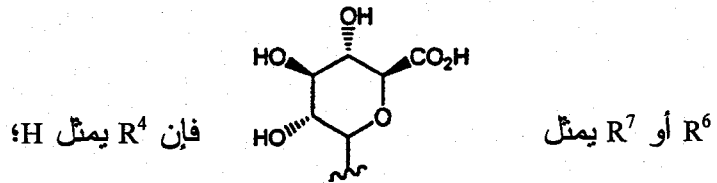
(خ) $\text{P}(=\text{O})(\text{OCH}_3)_2$ ؛ و

(ذ) $\text{P}(=\text{O})(\text{OCH}_2\text{CH}_3)_2$ ؛

شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود؛



R^4 يختار من الفئة التي تتكون من: H و



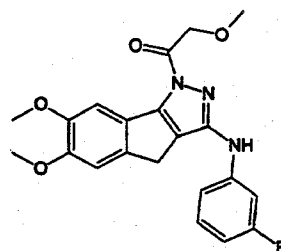
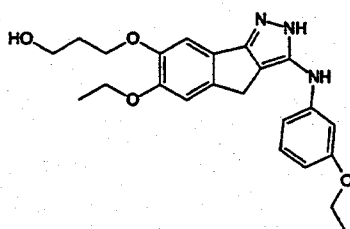
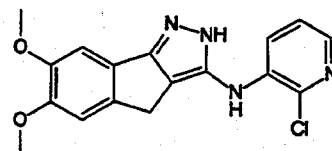
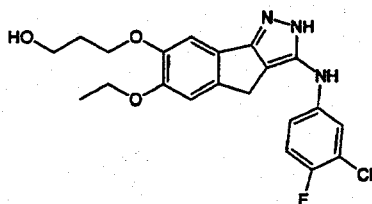
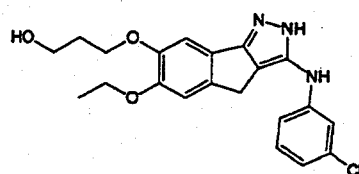
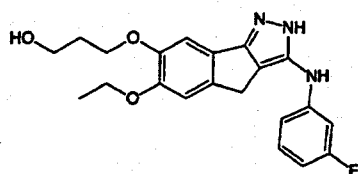
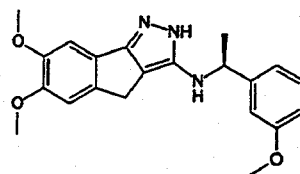
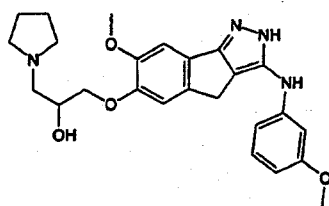
أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منها.

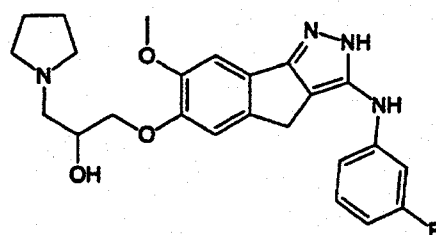
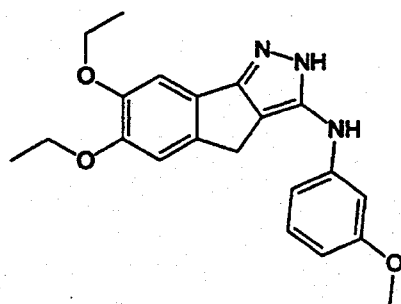
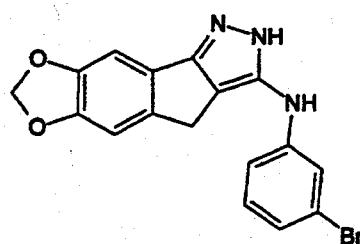
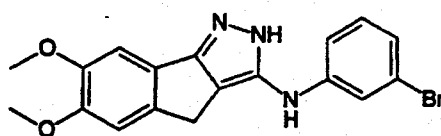
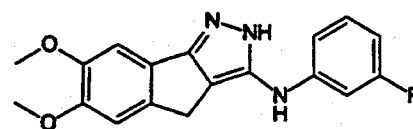
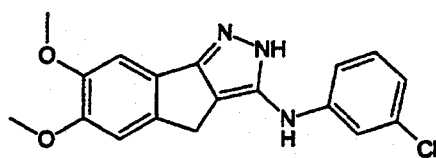
وتشمل تجسيدات أخرى للاختراع مركبات بالصيغة II-JJ حيث يتغير كل من R^6 و R^7 كما

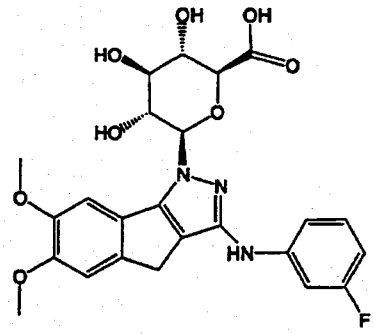
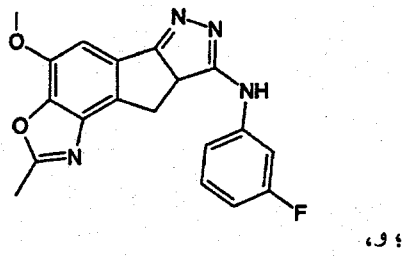
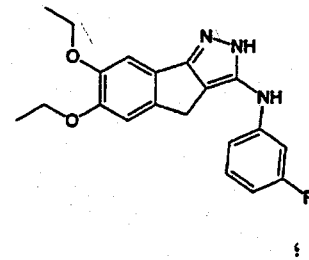
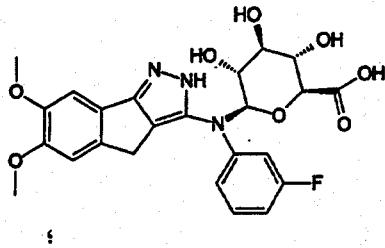
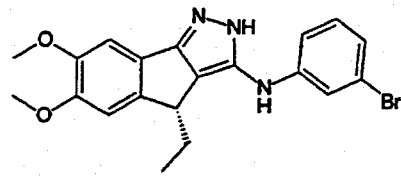
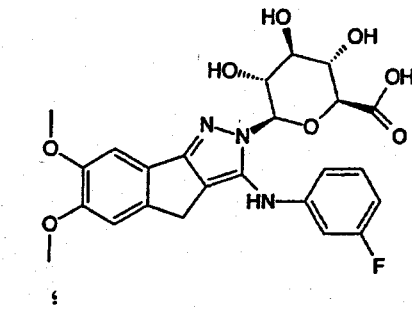
هو مذكور في القسم ١.أ.٢ أعلاه للصيغة II.

٢. جـ المركبات المفضلة

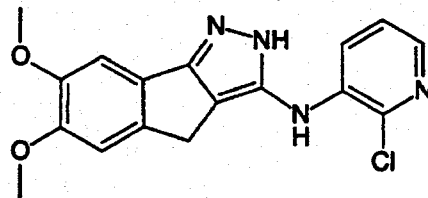
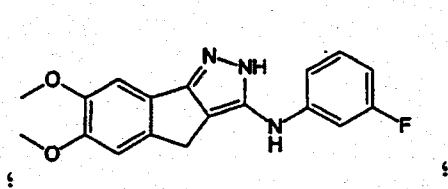
في تجسيد مفضل، يوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو مركب يختار من الفئة التي تتكون من:

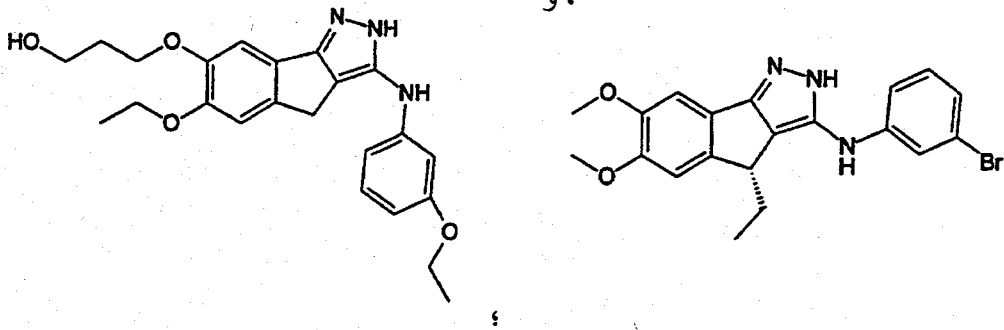




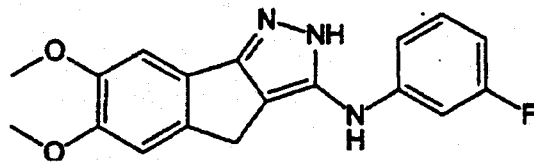


وفي تجسيد مفضل، يوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو مركب يختار من الفئة التي تتكون من:

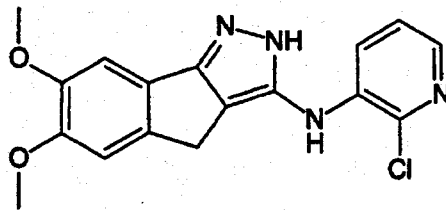




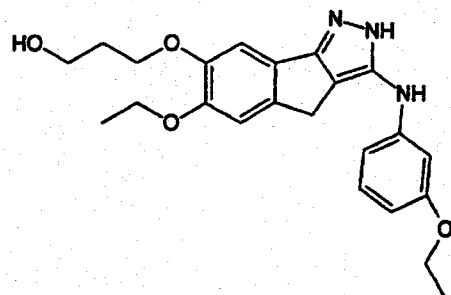
وفي تجسيد مفضل، يوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو مركب بالصيغة التالية:



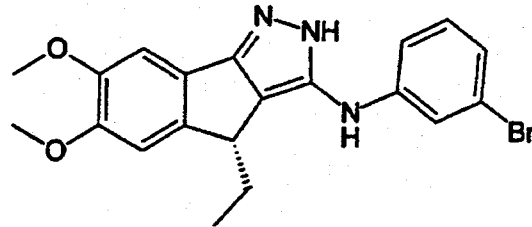
وفي تجسيد مفضل، يوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو مركب بالصيغة التالية:



وفي تجسيد مفضل، يوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو مركب بالصيغة التالية:

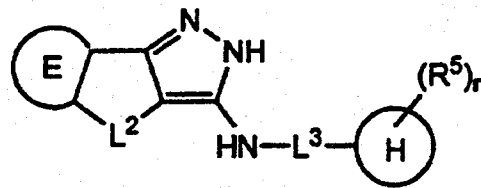


وفي تجسيد مفضل، يوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو مركب بالصيغة التالية:



٢. د. تحضير المركبات بالصيغة (IIa)

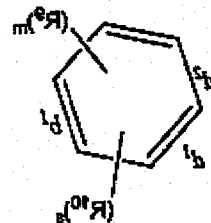
يوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو عملية لتحضير مركبات بالصيغة (IIa):



(IIa)

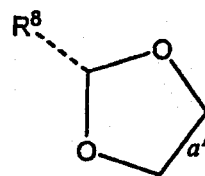
حيث:

يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:



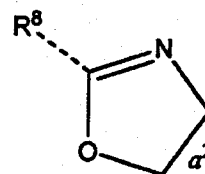
(الصيغة أ-١)،

حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II) وتحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ'-١، ب-١ و أ-١-ج:



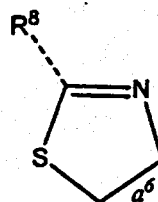
(الصيغة أ-١-أ')

حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ' من جهة a^1 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛



(الصيغة أ-١-ب)

حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و



(الصيغة أ-١-ج)

حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: -
 $-(CH_2)_{1-4}$ ، $-CH(R^{100})$ ، $-C(=R^{100})$ ، $-C(R^{100})_2$ ، $-O$ ، $-O(CH_2)_{1-4}$ ، $-OCH(R^{100})$ ، $-OC(R^{100})_2$ ، $-S$ ، -
 NH ، $-N(الكيل\ منخض)$ ، $-N(الكيل\ CO)$ ، $-N(أريل)$ ، $-N(الكيل\ CO_2)$ ،
 $-N(الكيل\ CONH)$ ، $-N(الكيل\ SO_2)$ و $-N(أريل\ SO_2)$ ؛ حيث R^{100} يختار من: ألكيل، هيدروكسي،
 أريل، ألكوكسي، أكسو، $-NH_2$ ، $-N(الكيل)$ ، $-N(الكيل\ NH)$ ، $-N(OH)=$ أو $-NH_2OH$ ؛ شريطة أنه عندما L_2
 يمثل $-OCH(R^{100})$ ، R^{100} يمثل ألكوكسي، و

(H) يمثل فنيل، فإن R^5 لا يمثل $-C(=O)NH-NH_2$ ؛

R^{10} يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من $-Y^1-A^{21}$ و $X^1-A^{20}-G$ $-X^1-A^{20}$ ؛

حيث X^1 و Y^1 غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون
 من: $-N(الكيل\ C(=O)N(الكيل))$ ، $-C(=O)N(الكيل)$ ، $-C(=O)NH$ ، $-C(=O)O$ ، $-N(الكيل)$ ،
 $-N(الكيل\ C(=O)NH)$ ، $-N(الكيل\ C(=O)O)$ ، $-N(الكيل\ SO_2)$ ، $-NH$ ،
 $-NHC(=O)$ ، $-NHC(=O)N(الكيل)$ ، $-NHC(=O)NH$ ، $-NHC(=O)O$ ، $-NH_2SO_2$ ، $-O$ ، $-OC(=O)$ ،
 $-OC(=O)N(الكيل)$ ، $-OC(=O)NH$ ، $-OC(=O)O$ ، $-S$ ، $-SO$ ، $-SO_2$ ، $-N(الكيل\ SO_2)$ و
 $-SO_2NH$ ؛

A^{20} غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛ و

A^{21} يختار من ألكيل، ألكينيل أو H؛

حيث عندما يمثل A^{20} أو A^{21} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري
 مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثنائي
 ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي،
 ألكيل $C(=O)N(الكيل)$ ، $-N(الكيل\ C(=O)N(الكيل))$ ، $-N(الكيل\ C(=O)NH_2)$ ،
 ألكيل $C(=O)NH(الكيل)$ ، $-N(الكيل\ C(=O)O(الكيل))$ ، ألكيل $SO_2(الكيل)$ ، $-N(الكيل)$ ،
 $-NHC(=O)$ ، $-NHC(=O)N(الكيل)$ ، $-NHC(=O)NH_2$ ، ألكيل $NHC(=O)NH$ ، ألكيل

NHC(=O)O ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل OC(=O) ، OC(=O)N(ألكيل)_2 ، ألكيل OC(=O)N ، ألكيل OC(=O)NH ، ألكيل OC(=O)O ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل؛

(G) يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة

جزئياً، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخلط، الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نيترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل NHC(=O) ، ألكيل C(=O)N(ألكيل) ، أو ثاني ألكيل أمينو، - NHC(=O)NH ، ألكيل NHC(=O)NH ، ألكيل C(=O)NH(ألكيل) ، ألكيل OC(=O)NH ، ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل C(=O)O(ألكيل) ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل $\text{SO}_2(ألكيل)}$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ، ألكيل SO_2 مهلجن، NHC(=O)N(ألكيل)_2 ، $\text{NHC(=O)N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)}$ أو OC(=O)N(ألكيل)_2 ؛

s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما لا يحمل

(E) بديلاً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s

يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤، وعندما يحمل (E) بديلاً

واحداً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من ألكيل ديبيل، كربونيل

أو SO_2 ؛

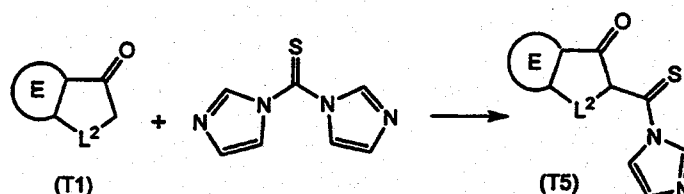
9

1.

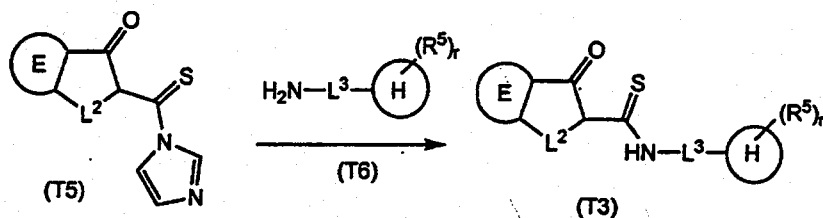
١٥

۲۰

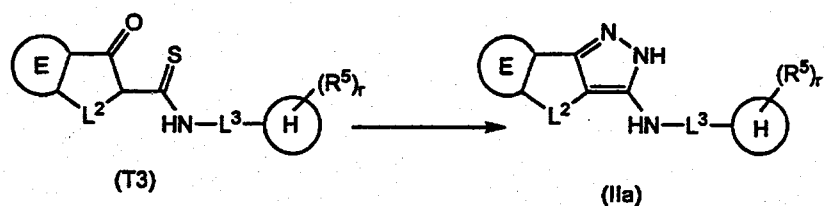
تتضمن:



مفاعلة مركب بالصيغة (T1) مع ١،١'-ثيوكربونيل ثاني إيميدازول، في وجود قاعدة، في مذيب لابروتوني، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (T5)؛

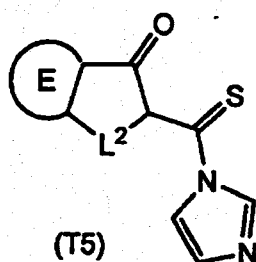


مفاعلة المركب بالصيغة (T5) مع مركب بالصيغة (T6)، في مذيب لابروتوني، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (T3)؛
مفاعلة المركب بالصيغة (T3) مع هيدرازين،



لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (IIa).

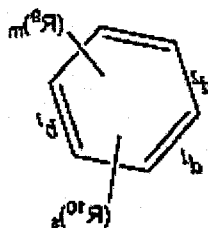
كما يوجه الاختراع الراهن نحو عملية لتحضير مركبات بالصيغة (T5)



حيث:

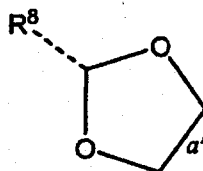
يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:

(E)



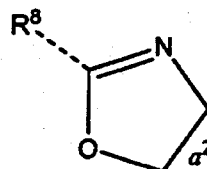
(الصيغة أ-١)،

حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II) وتحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-١-ب و أ-١-ج:



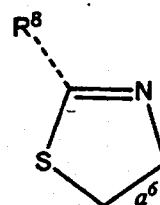
(الصيغة أ-١-أ)،

حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ من جهة a^1 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛



(الصيغة أ-١-ب)،

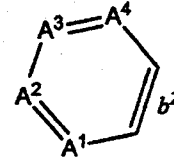
حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و



(الصيغة أ-١-ج)،

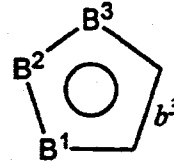
حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

حيث R^8 يمثل H أو ألكيل؛



(الصيغة أ-٢)،

حيث ترتبط الصيغة أ-٢ من جهة b^2 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، ويمثل A^1, A^2, A^3, A^4 (i)-N-؛ أو (ii) C- يحمل بديلاً من H أو ألكوكسي، حيث يمكن أن يحمل الألكوكسي أيضاً بشكل اختياري بديلاً من ألكوكسي على ذرة كربون طرفية أو ما لا يزيد عن ٣ ذرات هالوجين على ذرة كربون طرفية؛ شريطة أن يمثل واحداً على الأقل من A^1, A^2, A^3, A^4 أو اثنين على الأكثر -N-؛ و



(الصيغة أ-٣)،

حيث ترتبط الصيغة أ-٣ من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، ويمثل كل من B^1, B^2, B^3 على حدة (i) -CH- يحمل بشكل اختياري بديلاً من ألكيل، أريل، ألكوكسي أو هالوجين، (ii) -S-؛ (iii) -O-؛ أو (iv) -N-؛ شريطة أن واحداً على الأكثر من B^1, B^2, B^3 يمثل -S- أو -O-، و، شريطة أنه عندما B^1, B^2, B^3 يمثل -S- أو -O- فإن أعضاء الحلقة المجاورة لا تمثل -S- أو -O-؛

R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكيل، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل $C(=O)N$ (ألكيل)، N ، N ، N ، ألكيل $C(=O)O$ (ألكيل)، N ، ألكيل SO_2 (ألكيل)، N ، ألكيل-
٢٥

ألكيل NHSO_2 ، ألكيل OC(=O) ، OC(=O)N(ألكيل)_2 ، ألكيل OC(=O)NH ، ألكيل-
 OC(=O)O ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل؛

(G) يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة

جزئياً، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل
 حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة
 الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخلط، الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع
 البنزو أو الألكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على
 حدة من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكوكسي
 مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل NHC(=O) ، ألكيل C(=O)N(ألكيل) ، أو ثاني ألكيل أمينو، -
 NHC(=O)NH_2 ، ألكيل NHC(=O) ، ألكيل C(=O)NH(ألكيل) ، ألكيل OC(=O)NH ،
 ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل C(=O)N(ألكيل) ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل SO_2 (ألكيل) N ، ثيو
 ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ، ألكيل SO_2 مهلجن، NHC(=O)N(ألكيل)_2 ،

NHC(=O)N(ألكيل)_2 أو OC(=O)N(ألكيل)_2 ؛

s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما لا

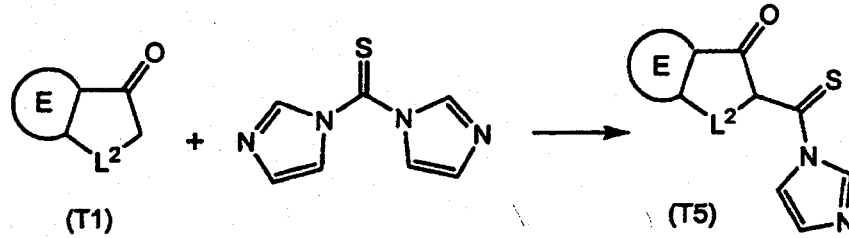
يحمل (E) بديلاً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s

يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤، وعندما يحمل (E) بديلاً واحداً

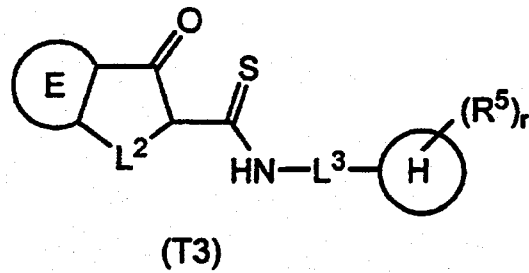
من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح

قيمته من صفر إلى ٢؛

أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منها؛
تتضمن:

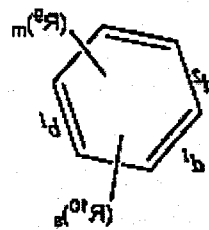


مفاعلة مركب بالصيغة (T1) مع ١،١'-ثيوكربونيل ثاني إيميدازول، في وجود قاعدة، في
مذيب لابروتوني، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (T5).
ويوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو عملية لتحضير المركبات بالصيغة (T3)



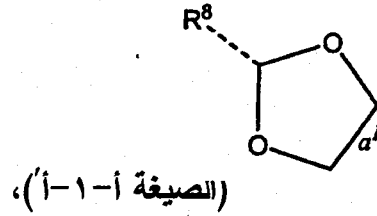
حيث:

يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:

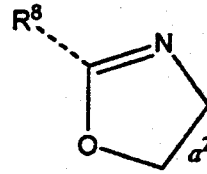


(الصيغة أ-١)،

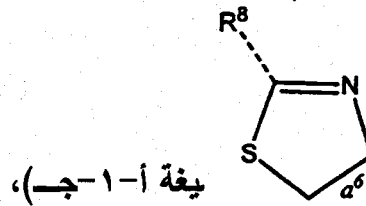
حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II) وتحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١-أ'، أ-١-ب و أ-١-ج:



حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ' من جهة a^1 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

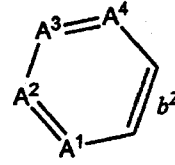


حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و



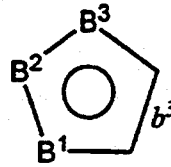
حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

حيث R^8 يمثل H أو ألكيل؛



(الصيغة أ-٢)،

حيث ترتبط الصيغة أ-٢ من جهة b^2 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، ويمثل A^1, A^2, A^3, A^4 ؛ -N-(i) أو (ii) -C- يحمل بديلاً من H أو ألكوكسي، حيث يمكن أن يحمل الألكوكسي أيضاً بشكل اختياري بديلاً من ألكوكسي على ذرة كربون طرفية أو ما لا يزيد عن ٣ ذرات هالوجين على ذرة كربون طرفية؛ شريطة أن يمثل واحداً على الأقل من A^1, A^2, A^3, A^4 أو اثنين على الأكثر -N-؛ و



(الصيغة أ-٣)،

حيث ترتبط الصيغة أ-٣ من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، ويمثل كل من B^1, B^2, B^3 على حدة (i) -CH- يحمل بشكل اختياري بديلاً من ألكيل C_{1-4} ، أريل، ألكوكسي أو هالوجين، (ii) -S-؛ (iii) -O-؛ أو (iv) -N-؛ شريطة أن واحداً على الأكثر من B^1, B^2, B^3 يمثل -S- أو -O-، و، شريطة أنه عندما B^1, B^2, B^3 يمثل -S- أو -O- فإن أعضاء الحلقة المجاورة لا تمثل -S- أو -O-؛

R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكيل، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل $C(=O)N$ (ألكيل)، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل $C(=O)N(ألكيل)$ ، ألكيل $C(=O)NH(ألكيل)$ ، ألكيل $C(=O)O(ألكيل)$ ، ألكيل $SO_2(ألكيل)$ ، $N(ألكيل)$ ، ألكيل $NHC(=O)NH(ألكيل)$ ، $NHC(=O)NH_2$ ، $NHC(=O)N(ألكيل)$ ، $NHC(=O)O(ألكيل)$ ، $NHC(=O)O(ألكيل)$ ، $NHSO_2(ألكيل)$ ، نثرو، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل $OC(=O)NH(ألكيل)$ ، ألكيل SO_2 ، ثيو و ثيو ألكيل؛

L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: -
 - $-(CH_2)_{1-4}$ ، $-(CH(R^{100}))$ ، $-C(=R^{100})$ ، $-C(R^{100})_2$ ، $-O$ ، $-O(CH_2)_{1-4}$ ، $-OCH(R^{100})$ ، $-OC(R^{100})_2$ ، $-S$ ،
 $-NH$ ، $-N$ (ألكيل منخفض)، $-N$ (ألكيل CO)، $-N$ (أريل)، $-N$ (ألكيل CO_2)،
 $-N$ (ألكيل CONH)، $-N$ (ألكيل SO_2) و $-N$ (أريل SO_2)؛ حيث R^{100} يختار من: ألكيل، هيدروكسي،
 أريل، ألكوكسي، أكسو، $-NH_2$ ، $-N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل)، $-NH$ (ألكيل)، $-N(OH)$ أو $-NH_2OH$ ؛ شريطة أنه عندما
 L^2 يمثل $-OCH(R^{100})$ ، R^{100} يمثل ألكوكسي،

و $\textcircled{H}$ يمثل فنيل، R^5 لا يمثل $-C(=O)NH-NH_2$

R^{10} يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من $\textcircled{G}$ $-A^{20}-X^1$ و $-Y^1-A^{21}$
 $-X^1-A^{20}$

حيث X^1 و Y^1 غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون
 من: $-N$ (ألكيل)، $-C(=O)N$ (ألكيل)، $-C(=O)N$ (ألكيل)، $-C(=O)NH$ ، $-C(=O)O$ ، $-N$ (ألكيل)،
 $-N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل)،
 $-NHC(=O)$ ، $-NHC(=O)N$ (ألكيل)، $-NHC(=O)NH$ ، $-NHC(=O)O$ ، $-NHSO_2$ ، $-O$ ، $-OC(=O)$ ،
 $-OC(=O)N$ (ألكيل)، $-OC(=O)NH$ ، $-OC(=O)O$ ، $-S$ ، $-SO$ ، $-SO_2$ ، $-N$ (ألكيل)، $-SO_2N$ و
 $-NH-SO_2$

A^{20} غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛ و

A^{21} يختار من ألكيل، ألكينيل أو H ؛

حيث عندما يمثل A^{20} أو A^{21} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري
 مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثنائي
 ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي،
 ألكيل $C(=O)N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل)،
 ألكيل $C(=O)NH$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل)، $-N$ (ألكيل)،
 $-NHC(=O)$ ، $-NHC(=O)N$ (ألكيل)، $-NHC(=O)NH$ ، $-NHC(=O)O$ ، $-NHSO_2$ ، $-O$ ، $-OC(=O)$ ،
 $-OC(=O)N$ (ألكيل)، $-OC(=O)NH$ ، $-OC(=O)O$ ، $-S$ ، $-SO$ ، $-SO_2$ ، $-N$ (ألكيل)، $-SO_2N$ و

NHC(=O)O ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل OC(=O) ، $(\text{ألكيل})_2\text{N(=O)OC}$ ، ألكيل- OC(=O)NH ، ألكيل OC(=O)O ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل؛

(G) يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة

جزئياً، أريل مخطط، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخطط، الألكيل الحلقي المخطط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المخطط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل NHC(=O) ، ألكيل C(=O)(ألكيل)N ، أو ثاني ألكيل أمينو، - NHC(=O)NH ، ألكيل NHC(=O)NH ، ألكيل C(=O)NH(ألكيل)N ، ألكيل OC(=O)NH ، ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل C(=O)O(ألكيل)N ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل $\text{SO}_2(ألكيل)N$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ، ألكيل SO_2 مهلجن، $(\text{ألكيل})_2\text{N(=O)NHC}$ ، $(\text{ألكيل})_2\text{N(=O)N(ألكيل)OC}$ ؛

s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما لا

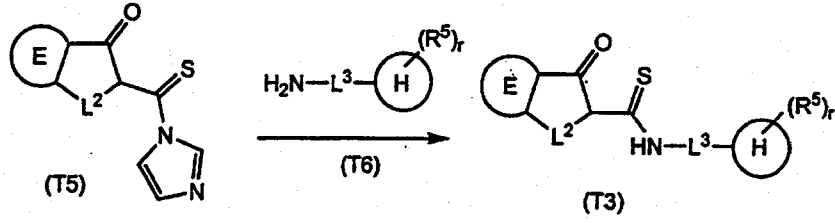
يحمل (E) بديلاً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع

m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤، وعندما يحمل (E) بديلاً

واحداً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من ألكيل ديبيل، كربونيل

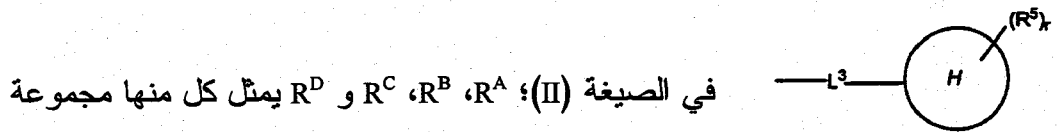
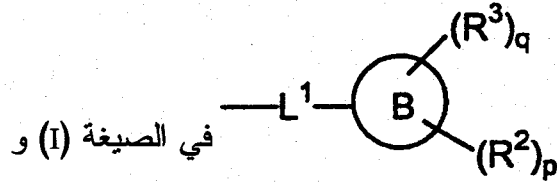
أو SO_2 ؛



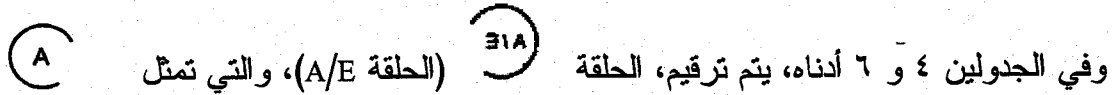
مفاعلة مركب بالصيغة (T5) مع مركب بالصيغة (T6)، في مذيب لا بروتوني، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (T3).

المركبات النموذجية

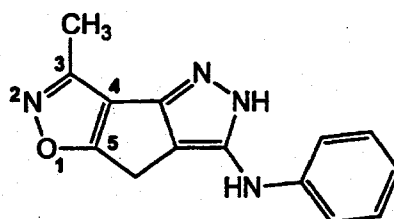
يتضمن تجسيد للاختراع الراهن مركبات كما هو مبين في الجداول من ١ إلى ١٣؛ أدناه. ويشار إلى الوزن الجزيئي بـ "MS"، ويعبر عنه بوحدات ك/ش (ص+H)⁺. وتبيّن المركبات التي تم تخليقها في الجداول من ١ إلى ٥ ومن ٧ إلى ١٣. وبالرجوع إلى المركبات بالصيغتين (I) و (II) فإن G يمثل



R^2 أو R^3 في الصيغة (I)، و/أو مجموعة R^9 أو R^{10} في الصيغة (II). وتبيّن أمثلة إضافية لمركبات نموذجية يشملها نطاق الاختراع، في الجدول ٦.

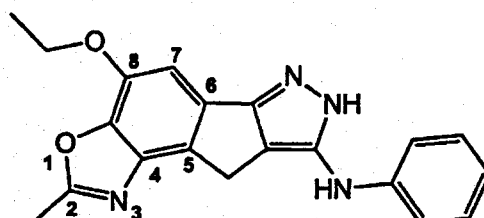


(الحلقة A) في الصيغة (I) و $\textcircled{E}$ (الحلقة E) في الصيغة (II) اصطلاحياً، باتجاه حركة عقارب الساعة، ما لم يبين الاصطلاح خلاف ذلك، بحيث تشير الأرقام المتقدمة إلى ذرات الكربون المرتبطة ببقية الجزيء الأساسي. وبناءً على ذلك، يسمى بديل الحلقة A/E، على سبيل المثال، في البنية أدناه،



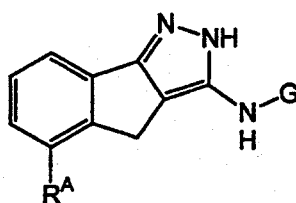
ب ٤،٥-(٣-مethyl-أيزوكسازوليل).

وبدائل الحلقة A/E المتبوعة بـ * تم ترقيمها باتجاه معاكس لحركة عقارب الساعة عند تسميتها، طبقاً للاصطلاح. على سبيل المثال، في البنية أدناه



يسمى بديل الحلقة A/E ٥،٦-(٢-مethyl-٨-إيثوكسي-بنزوكسازوليل) *.

وفيما عدا ذلك، عندما تكون الحلقة A/E عبارة عن فنيل، ترتبط حلقة الفنيل، بالتعريف، عند الموقعين ١، ٢، ويتم ترقيم بدائل حلقة الفنيل باتجاه حركة عقارب الساعة، كما هو الحال في البنية الأولى (٤،٥-أيزوكسازوليل) المبينة أعلاه.

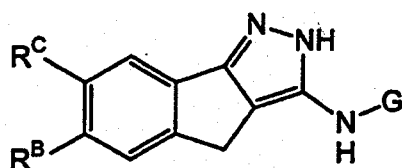
الجدول ١

MS	R ^A	G	المركب
٢٧٨	متوكسي	فنييل	٨
٢٦٢	مثيل	فنييل	٢٣
٣٤٩	٣-(N,N-ثاني مثيل-امينو)-بروبوكسي	فنييل	٧١
٣٨٣	٣-(N,N-ثاني مثيل-امينو)-بروبوكسي	٣-كلورو-فنييل	٧٢
٣٦٧	٣-(N,N-ثاني مثيل-امينو)-بروبوكسي	٤-فلورو-فنييل	٧٣
٣٧٩	٣-(N,N-ثاني مثيل-امينو)-بروبوكسي	٣-متوكسي-فنييل	٧٤
٣٥٠	٣-(N,N-ثاني مثيل-امينو)-بروبوكسي	٣-بيريدينيل	٧٥
٤٠٧	٣-(N,N-ثاني مثيل-امينو)-بروبوكسي	٣-(متوكسي-كربونيل)-فنييل	٧٧
٣٦٧	٣-(N,N-ثاني مثيل-امينو)-بروبوكسي	٣-فلورو-فنييل	٩٠
٢٨٠	مثيل	٤-فلورو-فنييل	٩٨
٢٨٠	مثيل	٣-فلورو-فنييل	٩٩
٢٦٣	مثيل	٣-بيريدينيل	١٠٠
٣٢٢	مثيل	٢,٥-ثاني متوكسي-فنييل	١٠١
٣٢٢	مثيل	٢,٤-ثاني متوكسي-فنييل	١٠٢
٢٩٨	مثيل	٢,٥-ثاني فلورو-فنييل	١٠٣
٣٤٦	مثيل	٤-ثالث فلورو متوكسي-فنييل	١٠٤
٣٣٠	مثيل	٤-ثالث فلورو مثيل-فنييل	١٠٥

۲۹۶	مٹوکسی	۴-فلورو-فنیل	۱۴۴
۳۰۸	مٹوکسی	۴-مٹوکسی-فنیل	۱۴۵
۲۷۹	مٹوکسی	۳-بیریدیل	۱۴۶
۳۳۸	مٹوکسی	۲،۵-ثانی مٹوکسی-فنیل	۱۴۷
۳۳۸	مٹوکسی	۲،۴-ثانی مٹوکسی-فنیل	۱۴۸
۳۶۲	مٹوکسی	۳-ثالث فلورو مٹوکسی-فنیل	۱۴۹
۳۴۶	مٹوکسی	۳-ثالث فلورو مٹیل-فنیل	۱۵۰
۴۲۵	۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی	۳-کلورو-فنیل	۳۹۲
۴۰۹	۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی	۳-فلورو-فنیل	۳۹۳
۴۳۵	۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی	۳-ایٹوکسی-فنیل	۳۹۴
۴۴۱	۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی	۲،۶-ثانی فلورو-بنزیل	۴۱۴
۴۷۴	۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی	۲،۶-ثانی کلورو-بنزیل	۴۱۵
۴۲۳	۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی	۲-فلورو-بنزیل	۴۱۶
۳۷۶	مٹوکسی	۳-مٹوکسی-۵-ثالث فلورو مٹیل-فنیل	۴۱۷
۳۵۷	مٹوکسی	۳-(امینو-کبریتونیل)-فنیل	۴۱۸
۲۹۶	مٹوکسی	۳-فلورو-فنیل	۴۲۲
۳۲۸	مٹوکسی	۲،۶-ثانی فلورو-بنزیل	۴۲۳
۳۵۶	۳-ہیڈروکسی-بروبوکسی	۳-کلورو-فنیل	۴۴۰
۳۶۶	۳-ہیڈروکسی-بروبوکسی	۳-ایٹوکسی-فنیل	۴۴۱
۳۴۰	۳-ہیڈروکسی-بروبوکسی	۳-فلورو-فنیل	۴۴۲
۳۷۲	۳-ہیڈروکسی-بروبوکسی	۲،۶-ثانی فلورو-بنزیل	۴۴۳
۳۵۴	۳-ہیڈروکسی-بروبوکسی	۲-فلورو-بنزیل	۴۴۴
۳۵۰	۳-ہیڈروکسی-بروبوکسی	۲-مٹیل-بنزیل	۴۴۵
۴۱۷	۲،۳-ثانی ہیڈروکسی-بروبوکسی	۳-برومو-فنیل	۴۶۸

٣٥٦	٢،٣-ثاني هيدروكسي-بروبوكسي	٣-فلورو-فنييل	٤٦٩
٤٤٠	٢-(بيروليدينيل (١))-إيثوكسي	٣-برومو-فنييل	٤٧٨
٤٢١	٢،٣-ثاني هيدروكسي-بروبوكسي	٢،٦-ثاني فلورو-بنزيل	٤٧٩

الجدول ٢



MS	R ^C	R ^B	G	المركب
٢٤٨	H	H	فنييل	١
٣٠٨	مثوكسي	مثوكسي	فنييل	٢
٢٨٢	H	H	٤-كلورو-فنييل	٣
٣٤٢	مثوكسي	مثوكسي	٣-كلورو-فنييل	٤
٣٤٢	مثوكسي	مثوكسي	٤-كلورو-فنييل	٥
٣٣٨	مثوكسي	مثوكسي	٤-مثوكسي-فنييل	٦
٢٧٨	H	مثوكسي	فنييل	٧
٣٤٢	مثوكسي	مثوكسي	٢-كلورو-فنييل	٩
٣٨٠	مثوكسي	مثوكسي	٤-(إيثوكسي-كربونيل)-فنييل	١٠
٣٦٦	مثوكسي	مثوكسي	٤-(مثوكسي-كربونيل)-فنييل	١١
٣٢٦	مثوكسي	مثوكسي	٢-فلورو-فنييل	١٢
٣٢٦	مثوكسي	مثوكسي	٤-فلورو-فنييل	١٣
٣٢٦	مثوكسي	مثوكسي	٣-فلورو-فنييل	١٤
٣٩٢	مثوكسي	مثوكسي	٢-ثالث فلورو مثوكسي-فنييل	١٥

۳۹۲	مٹوکسی	مٹوکسی	۴-ٹالٹ فلورو مٹوکسی-فنیل	۱۶
۳۷۷	مٹوکسی	مٹوکسی	۲،۴-ٹانی کلورو-فنیل	۱۷
۳۷۷	مٹوکسی	مٹوکسی	۳،۴-ٹانی کلورو-فنیل	۱۸
۳۷۷	مٹوکسی	مٹوکسی	۳،۵-ٹانی کلورو-فنیل	۱۹
۳۷۷	مٹوکسی	مٹوکسی	۲،۳-ٹانی کلورو-فنیل	۲۰
۲۸۲	H	کلورو	فنیل	۲۱
۲۶۲	مٹیل	H	فنیل	۲۲
۲۶۶	H	فلورو	فنیل	۲۴
۳۷۶	مٹوکسی	مٹوکسی	۴-ٹالٹ فلورو مٹیل-فنیل	۲۵
۳۷۶	مٹوکسی	مٹوکسی	۳-ٹالٹ فلورو مٹیل-فنیل	۲۶
۳۳۸	مٹوکسی	مٹوکسی	۲-مٹوکسی-فنیل	۲۷
۳۷۶	مٹوکسی	مٹوکسی	۲-ٹالٹ فلورو مٹیل-فنیل	۲۸
۳۳۸	مٹوکسی	مٹوکسی	۳-مٹوکسی-فنیل	۲۹
۳۰۹	مٹوکسی	مٹوکسی	۳-بیریڈیل	۳۰
۳۲۲	مٹوکسی	مٹوکسی	۲-مٹیل-فنیل	۳۱
۳۲۲	مٹوکسی	مٹوکسی	۳-مٹیل-فنیل	۳۲
۳۲۲	مٹوکسی	مٹوکسی	۴-مٹیل-فنیل	۳۳
۳۷۷	مٹوکسی	مٹوکسی	۲،۵-ٹانی کلورو-فنیل	۳۴
۳۳۸	مٹوکسی	مٹوکسی	۳-ہیدروکسی-مٹیل-فنیل	۳۶
۳۴۸	مٹوکسی	مٹوکسی	۶-اینڈازولیل	۳۷
۳۲۴	مٹوکسی	مٹوکسی	۳-ہیدروکسی-فنیل	۳۸
۲۷۸	مٹوکسی	H	فنیل	۳۹
۳۵۱	مٹوکسی	مٹوکسی	۴-(N,N-ٹانی مٹیل-امینو)-فنیل	۴۰
۳۶۸	مٹوکسی	مٹوکسی	۳،۵-ٹانی مٹوکسی-فنیل	۴۱

۴۲	۳،۴،۵-ثالث مٹوکسی-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۹۸
۴۳	۲-برومو-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۸۷
۴۴	۳-برومو-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۸۷
۴۵	۴-برومو-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۸۷
۴۶	۵-کلورو-۲-مٹیل-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۵۶
۴۷	۲،۴-ثانی مٹوکسی-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۸۶
۴۸	۲،۵-ثانی مٹوکسی-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۶۸
۴۹	۳،۴-ثانی مٹوکسی-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۶۸
۵۱	۴-(۴-مٹیل-بییرازینیل (۱))-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۴۰۶
۵۳	۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۶۰
۵۴	۳-بنزیلوکسی-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۴۱۴
۵۵	۲،۵-ثانی فلورو-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۴۴
۵۶	۵-کلورو-۲-مٹوکسی-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۷۲
۵۷	۲-ایزوپروپیل-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۵۰
۵۸	۲-ایٹیل-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۳۶
۵۹	۴-سیانو-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۳۳
۶۱	۳-سیانو-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۳۳
۶۲	۳،۴-مٹیلین دیوکسی-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۵۲
۶۴	فنیل	۴-مٹیل-بییرازینیل (۱)	H	۳۴۶
۶۵	فنیل	۱-بییریدینیل	H	۳۳۱
۶۶	فنیل	امینو	H	۲۶۳
۶۷	هکسیل حلقی	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۱۴
۷۰	۳،۵-ثانی (ثالث فلورو مٹیل)-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۴۴۴
۷۶	۲-ثالث فلورو مٹیل-۴-برومو-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۴۵۵

۷۸	۲-فوریل	مٹوکسی	مٹوکسی	۲۹۸
۷۹	۵-إندانیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۴۸
۸۱	۲-(بیریڈینیل (۱))-إیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۴۳
۸۲	۴-فلورو-فنیل	مٹوکسی	H	۲۹۶
۸۳	۳-برومو-فنیل	مٹوکسی	H	۳۵۷
۸۴	۳-بیریڈینیل	مٹوکسی	H	۲۷۹
۸۵	۲،۵-ثانی مٹوکسی-فنیل	مٹوکسی	H	۳۳۸
۸۶	۳،۴-ثانی مٹوکسی-فنیل	مٹوکسی	H	۳۳۸
۸۷	۲،۵-ثانی فلورو-فنیل	مٹوکسی	H	۳۱۴
۸۸	۴-ثالث فلورو مٹوکسی-فنیل	مٹوکسی	H	۳۶۲
۸۹	۴-ثالث فلورو مٹیل-فنیل	مٹوکسی	H	۳۴۶
۹۲	فنیل	N,N-ثانی مٹیل-آمینو	H	۲۹۱
۱۱۵	۳-کریوکسی-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۵۲
۱۱۶	۳-(آمینو-کربونیل)-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۵۱
۱۱۷	۳-برومو-فنیل	آمینو	H	۳۴۲
۱۱۸	۳-مٹوکسی-فنیل	آمینو	H	۲۹۳
۱۱۹	۳-کلورو-فنیل	آمینو	H	۲۹۷
۱۲۰	۳-(مٹوکسی-کربونیل)-فنیل	آمینو	H	۳۲۱
۱۲۱	۳-فلورو-فنیل	آمینو	H	۲۸۱
۱۲۲	۳-برومو-فنیل	۴-مٹیل-بیرازینیل (۱)	H	۴۲۵
۱۲۳	۳-مٹوکسی-فنیل	۴-مٹیل-بیرازینیل (۱)	H	۳۷۶
۱۲۴	۳-کلورو-فنیل	۴-مٹیل-بیرازینیل (۱)	H	۳۸۰
۱۲۵	۳-برومو-فنیل	هیدروکسی	هیدروکسی	۳۵۹
۱۲۹	۳-بیریڈینیل	۳-مورفولینیل (۴)-برووکسی	مٹوکسی	۴۲۲

۱۳۰	۳-برومو-فنیل	۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی	متوکسی	۵۰۰
۱۳۱	۳-متوکسی-فنیل	۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی	متوکسی	۴۵۱
۱۳۲	۳-کلورو-فنیل	۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی	متوکسی	۴۵۵
۱۳۳	۳-(متوکسی-کربونیل)-فنیل	۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی	متوکسی	۴۷۹
۱۳۴	۳-فلورو-فنیل	۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی	متوکسی	۴۳۹
۱۳۵	۳-کلورو-فنیل	۳-متوکسی-بروبوکسی	H	۳۷۰
۱۳۶	۳-فلورو-فنیل	۳-متوکسی-بروبوکسی	H	۳۵۴
۱۳۷	۳-(متوکسی-کربونیل)-فنیل	۳-متوکسی-بروبوکسی	H	۳۹۴
۱۳۸	۳-فلورو-فنیل	۳-متوکسی-بروبوکسی	H	۳۵۴
۱۳۹	۳-متوکسی-فنیل	۳-متوکسی-بروبوکسی	H	۳۶۶
۱۴۰	فنیل	۳-متوکسی-بروبوکسی	H	۳۳۶
۱۴۱	۳-برومو-فنیل	۳-متوکسی-بروبوکسی	H	۴۱۵
۱۴۲	۳-بیریدیل	۳-متوکسی-بروبوکسی	H	۳۳۷
۱۴۳	۴-متوکسی-فنیل	۳-متوکسی-بروبوکسی	H	۳۶۶
۱۵۱	۳-فلورو-فنیل	برومو	H	۳۴۵
۱۵۲	۳-بیریدیل	برومو	H	۳۲۸
۱۵۳	۲،۵-ثانی فلورو-فنیل	برومو	H	۳۶۳
۱۵۴	۳-ثالث فلورو متوکسی-فنیل	برومو	H	۴۱۱
۱۵۵	۳-ثالث فلورو متیل-فنیل	برومو	H	۳۹۵
۱۵۶	۳-متوکسی-فنیل	۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبوکسی	متوکسی	۴۳۵
۱۵۷	۳-(متوکسی-کربونیل)-فنیل	۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبوکسی	متوکسی	۴۶۳
۱۵۸	فنیل	برومو	H	۳۲۷
۱۵۹	۴-فلورو-فنیل	۳-(N,N-ثانی متیل-آمینو)-بروبوکسی	H	۳۶۷
۱۶۰	۳-فلورو-فنیل	۳-(N,N-ثانی متیل-آمینو)-بروبوکسی	H	۳۶۷
۱۶۱	۳-بیریدیل	۳-(N,N-ثانی متیل-آمینو)-بروبوکسی	H	۳۵۰
۱۶۲	۲،۵-ثانی متوکسی-فنیل	۳-(N,N-ثانی متیل-آمینو)-بروبوکسی	H	۴۰۹
۱۶۳	۲،۵-ثانی فلورو-فنیل	۳-(N,N-ثانی متیل-آمینو)-بروبوکسی	H	۳۸۵
۱۶۵	۳-ثالث فلورو متیل-فنیل	۳-(N,N-ثانی متیل-آمینو)-بروبوکسی	H	۴۱۷
۱۶۶	۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل	۳-متوکسی-بروبوکسی	متوکسی	۴۱۸

۴۱۶	ایزوبروبوکسی	ایزوبروبوکسی	۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل	۱۶۷
۳۹۴	ایزوبروبوکسی	ایزوبروبوکسی	۳-متوکسی-فنیل	۱۶۸
۳۸۲	ایزوبروبوکسی	ایزوبروبوکسی	۳-فلورو-فنیل	۱۶۹
۲۹۶	متوکسی	H	۴-فلورو-فنیل	۱۷۰
۳۰۸	متوکسی	H	۴-متوکسی-فنیل	۱۷۱
۲۹۶	متوکسی	H	۳-فلورو-فنیل	۱۷۲
۲۷۹	متوکسی	H	۳-بیریدیل	۱۷۳

١٧٤	٥،٢-ثاني مئوكسي-فنييل	H	مئوكسي	٣٣٨
١٧٥	٤،٢-ثاني مئوكسي-فنييل	H	مئوكسي	٣٣٨
١٧٦	٥،٢-ثاني فلورو-فنييل	H	مئوكسي	٣١٤
١٧٧	٤-ثالث فلورو مئوكسي-فنييل	H	مئوكسي	٣٦٢
١٧٨	٤-ثالث فلورو مئيل-فنييل	H	مئوكسي	٣٤٦
١٧٩	٣-كلورو-٤-فلورو-فنييل	٣-مورفولينيل (٤)-	مئوكسي	٤٧٣
بروبوكسي				
١٨٠	٣-فلورو-فنييل	٣-بيروليدينيل (١)-	مئوكسي	٤٢٣
بروبوكسي				
١٨١	٣-كلورو-٤-فلورو-فنييل	٣-بيروليدينيل (١)-	مئوكسي	٤٥٧
بروبوكسي				
١٨٢	٣-فلورو-فنييل	H	مئيل	٢٨٠
١٨٣	٤-مئوكسي-فنييل	H	مئيل	٢٩٢
١٨٤	٥،٢-ثاني مئوكسي-فنييل	H	مئيل	٣٢٢
١٨٥	٥،٢-ثاني فلورو-فنييل	H	مئيل	٢٩٨
١٨٦	٤-ثالث فلورو مئوكسي-فنييل	H	مئيل	٣٤٦
١٨٧	٣-ثالث فلورو مئيل-فنييل	H	مئيل	٣٣٠
١٨٨	٣-بيريدينيل	كلورو	H	٢٨٣
١٨٩	٤-مئوكسي-فنييل	كلورو	H	٣١٢
١٩٠	٣-مئوكسي-فنييل	كلورو	H	٣١٢
١٩١	٣-فلورو-فنييل	كلورو	H	٣٠٠
١٩٢	٥،٢-ثاني فلورو-فنييل	كلورو	H	٣١٨
١٩٣	٤-ثالث فلورو مئيل-فنييل	كلورو	H	٣٥٠
١٩٤	٤-ثالث فلورو مئوكسي-فنييل	كلورو	H	٣٦٦
١٩٥	٥،٣-ثاني (ثالث فلورو مئيل)-فنييل	كلورو	H	٤١٨
١٩٦	٤-ثاني مئيل أمينو-فنييل	كلورو	H	٣٢٥
١٩٧	٣-مئيل-فنييل	كلورو	H	٢٩٦

٢٩٦	H	كلورو	٤-مئيل-فنييل	١٩٨
٣٩٧	مئوكسي	٣-(N,N)-ثاني مئيل-امينو- بروبوكسي	٣-فلورو-فنييل	١٩٩
٤٣١	مئوكسي	٣-(N,N)-ثاني مئيل-امينو- بروبوكسي	٣-كلورو-٤-فلورو-فنييل	٢٠٠
٢٨٤	H	فلورو	٤-فلورو فنييل	٢٠١
٣١٨	H	فلورو	٣-كلورو-٤-فلورو-فنييل	٢٠٢
٣٢٦	H	فلورو	٥,٢-ثاني مئوكسي-فنييل	٢٠٣
٣٢٦	H	فلورو	٥,٣-ثاني مئوكسي-فنييل	٢٠٤
٣٢٦	H	فلورو	٤,٣-ثاني مئوكسي-فنييل	٢٠٥
٣٣٦	مئوكسي	مئوكسي	٥,٣-ثاني مئيل-فنييل	٢٠٦
٣٤٤	مئوكسي	مئوكسي	٥,٣-ثاني فلورو-فنييل	٢٠٧
٣٥٤	مئوكسي	مئوكسي	٣-مئيل ثيو-فنييل	٢٠٨
٣٣٦	مئوكسي	مئوكسي	٣-اثيريل-فنييل	٢٠٩
٣٨٠	مئوكسي	مئوكسي	٣-(اثيروكسي-كربونيل)-فنييل	٢١٠
٤٠٨	مئوكسي	مئوكسي	٣-(ثالث فلورو مئيل-ثيو)-فنييل	٢١١
٣٩٤	مئوكسي	مئوكسي	٤-فلورو-٣-ثالث فلورو مئيل-فنييل	٢١٢
٤٦٨	مئوكسي	٣-(٤-مئيل- بييرازينيل (١))- بروبوكسي	٣-كلورو-فنييل	٢١٣
٤٨٦	مئوكسي	٣-(٤-مئيل- بييرازينيل (١))- بروبوكسي	٣-كلورو-٤-فلورو-فنييل	٢١٤
٤٦٤	مئوكسي	٣-(٤-مئيل- بييرازينيل (١))- بروبوكسي	٣-مئوكسي-فنييل	٢١٥

۴۵۲	۳-(۴-مئیل-مئوکسی بیرازینیل (۱)) بروبوکسی	۳-فلورو-فنیل	۲۱۶
۴۳۳	۳-(N,N-ثانی مئیل-أمینو) بروبوکسی	۴-ثالث فلورو مئوکسی-فنیل	۲۱۷
۴۱۴	مئوکسی	۴-بنزیلوكسی-فنیل	۲۱۸
۴۵۵	مئوکسی	۴-(بیریدینیل (۴) کبریتونیل)-فنیل	۲۲۱
۴۲۰	۳-ایمیدازولیل (۱)- بروبوکسی	۳-فلورو-فنیل	۲۲۶
۴۵۴	۳-ایمیدازولیل (۱)- بروبوکسی	۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل	۲۲۷
۲۹۶	H	۴-مئوکسی-فنیل	۲۳۳
۲۹۶	H	۳-مئوکسی-فنیل	۲۳۴
۲۸۴	H	۳-فلورو-فنیل	۲۳۵
۳۰۲	H	۵,۲-ثانی فلورو-فنیل	۲۳۶
۳۳۴	H	۴-ثالث فلورو مئیل-فنیل	۲۳۷
۳۵۰	H	۴-ثالث فلورو مئوکسی-فنیل	۲۳۸
۴۰۲	H	۵,۳-ثانی (ثالث فلورو مئیل)-فنیل	۲۳۹
۲۸۰	H	۳-مئیل-فنیل	۲۴۰
۳۸۴	۳-مئوکسی- بروبوکسی	۳-فلورو-فنیل	۲۴۲
۳۹۶	۳-مئوکسی- بروبوکسی	۳-مئوکسی-فنیل	۲۴۴
۳۶۶	اثوکسی	۳-مئوکسی-فنیل	۲۴۵
۳۸۸	اثوکسی	۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل	۲۴۶

۲۵۹	۳-کلورو-فنیل	۳،۲-ثیانی-متوکسی هیدروکسی- بروبوکسی	۴۰۲
۲۶۰	۳-متوکسی-فنیل	۳،۲-ثیانی-متوکسی هیدروکسی- بروبوکسی	۳۹۸
۲۶۱	۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل	۳،۲-ثیانی-متوکسی هیدروکسی- بروبوکسی	۴۲۰
۲۶۲	۳-فلورو-فنیل	۳،۲-ثیانی-متوکسی هیدروکسی- بروبوکسی	۳۸۶
۲۶۳	۳-بیریدیل	۳،۲-ثیانی-متوکسی هیدروکسی- بروبوکسی	۳۶۹
۲۶۵	۳-فلورو-فنیل	۳-هیدروکسی-متوکسی بروبوکسی	۳۷۰
۲۶۶	۳-متوکسی-فنیل	۳-هیدروکسی-متوکسی بروبوکسی	۳۸۲
۲۶۷	۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل	۳-هیدروکسی-متوکسی بروبوکسی	۴۰۴
۲۶۸	۳-کلورو-فنیل	۳-هیدروکسی-متوکسی بروبوکسی	۳۸۶
۲۶۹	۳-فلورو-فنیل	۲-هیدروکسی-۳-متوکسی بیرولیدینیل (۱)- بروبوکسی	۴۳۹
۲۷۰	۳-متوکسی-فنیل	۲-هیدروکسی-۳-متوکسی بیرولیدینیل (۱)- بروبوکسی	۴۵۱

۳۷۱	متوکسي	متوکسي	۴-فلورو-۳-نترو-فنيل	۲۷۶
۳۷۲	متوکسي	متوکسي	۳-کلورو-۴-متوکسي-فنيل	۲۷۷
۳۵۲	متوکسي	متوکسي	۳-(۱-هيدروکسي-اثيل)-فنيل	۲۷۸
۴۲۰	متوکسي	متوکسي	۳،۵-ثاني (ثت-بيوتيل)-فنيل	۲۷۹
۴۷۳	متوکسي	۲-هيدروکسي-۳-بيروليدينيل (۱) بروبوکسي	۳-کلورو-۴-فلورو-فنيل	۲۸۰
۴۲۲	متوکسي	۲-هيدروکسي-۳-بيروليدينيل (۱) بروبوکسي	۳-بيريديل	۲۸۱
۴۵۵	متوکسي	۲-هيدروکسي-۳-بيروليدينيل (۱) بروبوکسي	۳-کلورو-فنيل	۲۸۲
۴۴۲	۳-متوکسي-۳-بروبوکسي	۳-متوکسي-۳-بروبوکسي	۳-فلورو-فنيل	۲۸۳
۴۵۴	۳-متوکسي-۳-بروبوکسي	۳-متوکسي-۳-بروبوکسي	۳-متوکسي-فنيل	۲۸۴
۴۵۸	۳-متوکسي-۳-بروبوکسي	۳-متوکسي-۳-بروبوکسي	۳-کلورو-فنيل	۲۸۵
۴۲۵	۳-متوکسي-۳-بروبوکسي	۳-متوکسي-۳-بروبوکسي	۳-بيريديل	۲۸۶
۴۷۶	۳-متوکسي-۳-بروبوکسي	۳-متوکسي-۳-بروبوکسي	۳-کلورو-۴-فلورو-فنيل	۲۸۷
۳۳۰	H	فلورو	۳-کلورو-۴-متوکسي-فنيل	۲۸۸
۳۱۰	H	فلورو	۳-(۱-هيدروکسي-اثيل)-فنيل	۲۸۹
۳۰۵	H	فلورو	۵-اندوليل	۲۹۰
۴۰۲	متوکسي	بنزيلوکسي	۳-فلورو-فنيل	۲۹۱
۳۹۵	متوکسي	متوکسي	۳-(۲-هيدروکسي-اثيل-امينو-کربونيل)-فنيل	۲۹۷

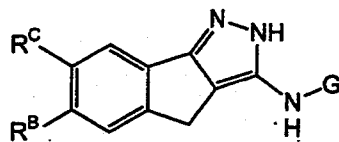
۲۹۸	۳-[N-(۳-بیروای-دینیل (۱) متوکسی	متوکسی	۴۶۲
بروبیل)-آمینو-کربونیل] فنیل			
۲۹۹	فنیل	H	فلورو ۲۶۶
۳۰۳	۵،۳-ثانی (ثت-بیوتیل)-فنیل	فلورو	H ۳۷۸
۳۰۹	۳-کلورو-۴-متوکسی-فنیل	H	مثیل ۳۲۶
۳۱۰	۳-(۱-هیدروکسی-اتیل)-فنیل	H	مثیل ۳۰۶
۳۱۱	۵-اندولیل	H	مثیل ۳۰۱
۳۱۲	۵،۳-ثانی (ثت-بیوتیل)-فنیل	H	مثیل ۳۷۴
۳۱۹	۳-(۴-مثیل-بیبرازینیل-کربونیل)-	متوکسی	متوکسی ۴۳۴
فنیل			
۳۳۴	۳-فلورو-فنیل	H	فلورو ۲۸۴
۳۳۷	۳-فلورو-فنیل	H	H ۲۶۶
۳۳۸	۵-کلورو-۲-مثیل-فنیل	H	H ۲۹۶
۳۳۹	۵،۲-ثانی فلورو-فنیل	H	H ۲۸۴
۳۴۰	۵-ثالث فلورو مثیل-۲-فلورو-فنیل	H	H ۳۳۴
۳۴۱	۵،۲-ثانی متوکسی-فنیل	H	H ۳۰۸
۳۴۲	۵-کلورو-۲-متوکسی-فنیل	H	H ۳۱۲
۳۴۳	۳-متوکسی-فنیل	H	H ۲۷۸
۳۵۷	۳-فلورو-فنیل	فلورو	متوکسی ۳۱۴
۳۵۸	۳-برومو-فنیل	فلورو	متوکسی ۳۷۵
۳۵۹	۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل	فلورو	متوکسی ۳۴۸
۳۶۰	۳-متوکسی-فنیل	فلورو	متوکسی ۳۲۶
۳۶۱	۴-فلورو-فنیل	فلورو	متوکسی ۳۱۴
۳۶۲	۳-فلورو-فنیل	هیدروکسی	هیدروکسی ۲۹۸
۳۶۳	۳-فلورو-فنیل	هیدروکسی	هیدروکسی ۳۱۲
۳۶۴	۳-بیبریدیل	فلورو	متوکسی ۲۹۷
۳۶۵	۳-فلورو-فنیل	اتوکسی	۳-هیدروکسی- ۳۸۴
بروبوکسی			

۳۶۶	۳-مٹوکسی-فنیل	اثوکسی	۳-هیدروکسی- بروبوکسی	۳۹۶
۳۶۷	۳-کلورو-فنیل	اثوکسی	۳-هیدروکسی- بروبوکسی	۴۰۰
۳۶۸	۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل	اثوکسی	۳-هیدروکسی- بروبوکسی	۴۱۸
۳۶۹	۳-فلورو-فنیل	برومو	مٹوکسی	۳۷۵
۳۷۰	۳-مٹوکسی-فنیل	برومو	مٹوکسی	۳۸۷
۳۷۱	۳-بیریدیل	اثوکسی	۳-هیدروکسی- بروبوکسی	۳۶۷
۳۷۲	۳-بیریدیل	۳-هیدروکسی- بروبوکسی	۳-هیدروکسی- بروبوکسی	۳۹۷
۳۷۳	۳-کلورو-فنیل	۳-هیدروکسی- بروبوکسی	۳-هیدروکسی- بروبوکسی	۴۳۰
۳۷۴	۳-اثوکسی-فنیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۵۲
۳۷۵	۳-اثوکسی-فنیل	اثوکسی	اثوکسی	۳۸۰
۳۷۶	۳-اثوکسی-فنیل	۳-هیدروکسی- بروبوکسی	مٹوکسی	۳۹۶
۳۷۷	۳-(۲-کلورو)-بیریدیل	مٹوکسی	مٹوکسی	۳۴۳
۳۷۹	۳-اثوکسی-فنیل	۳،۲-ثانی هیدروکسی- بروبوکسی	مٹوکسی	۴۱۲
۳۸۲	۳-فلورو-فنیل	۳-هیدروکسی- بروبوکسی	اثوکسی	۳۸۴
۳۸۳	۳-بیریدیل	۳-هیدروکسی- بروبوکسی	اثوکسی	۳۶۷
۳۸۴	۳-مٹوکسی-فنیل	۳-هیدروکسی- بروبوکسی	اثوکسی	۳۹۶

٣٨٨	٣-اثوكسي-فنييل	اثوكسي	٣-هيدروكسي- بروبوكسي	٤١٠
٣٨٩	٣-كلورو-٤-فلورو-فنييل	٣-هيدروكسي- بروبوكسي	٣-هيدروكسي- بروبوكسي	٤٤٨
٣٩٨	٣-فلورو-فنييل	٣-هيدروكسي- بروبوكسي	٣-هيدروكسي- بروبوكسي	٤١٤
٤٠٠	٣-مئوكسي-فنييل	٣-هيدروكسي- بروبوكسي	٣-هيدروكسي- بروبوكسي	٤٢٦
٤٠١	٣-اثوكسي-فنييل	٣-هيدروكسي- بروبوكسي	٣-هيدروكسي- بروبوكسي	٤٤٠
٤١٠	٢-برومو-٣-فلورو-فنييل	مئوكسي	مئوكسي	٤٠٥
٤٥٢	٤-مئيل-٣-[N]-٤-(٣-بيريديل)- بيريميدينيل (٢) أمينو-فنييل	مئوكسي	مئوكسي	٤٩٢
٤٥٣	٣-(٤-مئوكسي)-بيريديل	مئوكسي	مئوكسي	٣٣٩
٤٥٤	٣-(٤،٢-ثاني مئوكسي) بيريديل	مئوكسي	مئوكسي	٣٦٩
٤٦٠	٣-فلورو-فنييل	اثوكسي	٣-بيروليدينيل (١)-٢- هيدروكسي بروبوكسي	٤٥٣
٤٦١	٣-بيريديل	اثوكسي	٣-بيروليدينيل (١)-٢- هيدروكسي بروبوكسي	٤٣٦
٤٦٢	٣-مئوكسي-فنييل	اثوكسي	٣-بيروليدينيل (١)-٢- هيدروكسي بروبوكسي	٤٦٥

۴۶۳	۳-اثوكسي فنيل	اثوكسي	۳-بيروليدينيل (۱)-۲- هيدروكسي بروبوكسي	۴۷۹
۴۷۶	۶،۲-ثاني فلورو-فنيل	مئوكسي	مئوكسي	۳۴۴
۴۷۷	۶،۴،۲-ثالث فلورو-فنيل	مئوكسي	مئوكسي	۳۶۲
۵۴۹	۳-فلورو-فنيل	مئوكسي	بنزيلوكسي	۴۰۲
۵۶۲	۲-بيريديل	مئوكسي	مئوكسي	۳۰۹
۵۶۵	۲،۲-ثاني فـلـورو-۳،۱- بنزوديوكسوليل (۴)	مئوكسي	مئوكسي	۳۸۸
۵۶۶	۳،۲-ثاني هيدرو- H_1 -اندوليل (۱)	مئوكسي	مئوكسي	۳۳۴
۵۶۷	۵-برومو-۳،۲-ثاني هيدرو- H_1 - اندوليل (۱)	مئوكسي	مئوكسي	۴۱۳
۵۷۶	۲-(۳-مئيل-۵-برومو)-بيريديل	مئوكسي	مئوكسي	۴۰۲
۵۷۷	۳-(۴-ثالث فلورو مئيل)-بيريديل	مئوكسي	مئوكسي	۳۷۷
۵۸۲	۲-(۳-برومو)-بيريديل	مئوكسي	مئوكسي	۳۸۸
۵۸۳	۲-(۴-برومو)-بيريديل	مئوكسي	مئوكسي	۳۸۸
۵۸۴	۳-ايزوبروبوكسي-فنيل	مئوكسي	مئوكسي	۳۶۷
۵۸۷	۲-(۳-مئيل)-بيريديل	مئوكسي	مئوكسي	۳۲۴
۵۸۸	۲-(۶،۴-ثاني مئيل)-بيريديل	مئوكسي	مئوكسي	۳۳۸
۵۹۴	۳-فلورو-فنيل	اثوكسي	اثوكسي	۳۵۵
۶۰۸	۳-فلورو-فنيل	مئوكسي	هيدروكسي	۳۱۳

الجدول ٣



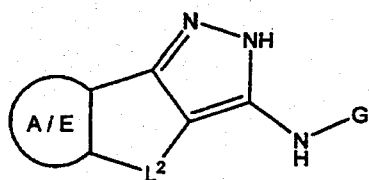
MS	R ^C	R ^B	G	المركب
٣٢٢	مئوكسي	مئوكسي	بنزيل	٦٣
٣٤٥	مئوكسي	مئوكسي	٢-مورفولينيل (٤)-اثير	٦٩
٣٩١	مئوكسي	مئوكسي	٤،٣-ثاني كلورو-بنزيل	٢١٩
٣٢٨	مئوكسي	مئوكسي	هكسيل حلقي-مئيل	٢٢٠
٣٣٦	مئوكسي	مئوكسي	٤-مئيل-بنزيل	٢٢٢
٣٣٦	مئوكسي	مئوكسي	٢-مئيل-بنزيل	٢٢٣
٣٥٢	مئوكسي	مئوكسي	٢-مئوكسي-بنزيل	٢٢٤
٣٥٢	مئوكسي	مئوكسي	٣-مئوكسي-بنزيل	٢٢٥
٣٥٦	مئوكسي	مئوكسي	٢-كلورو-بنزيل	٢٣٠
٣٥٢	مئوكسي	مئوكسي	٤-مئوكسي-بنزيل	٢٣١
٣٥٠	اثوكسي	اثوكسي	بنزيل	٢٦٤
٣٩٠	مئوكسي	مئوكسي	٥،٣-ثاني كلورو-بنزيل	٢٧١
٣٣٦	مئوكسي	مئوكسي	٣-مئيل-بنزيل	٢٧٢
٣٧٠	مئوكسي	مئوكسي	٤-كلورو-٣-مئيل-بنزيل	٢٧٣
٢٨٢	مئوكسي	مئوكسي	٥،٢-ثاني مئوكسي-بنزيل	٢٧٤
٣٥٨	مئوكسي	مئوكسي	٤،٣-ثاني فلورو-بنزيل	٢٧٥
٣٦٨	اثوكسي	اثوكسي	٢-فلورو-بنزيل	٢٩٣
٣٦٨	اثوكسي	اثوكسي	٣-فلورو-بنزيل	٢٩٤
٤١٨	اثوكسي	اثوكسي	٦،٢-ثاني كلورو-بنزيل	٢٩٥
٣٨٠	اثوكسي	اثوكسي	٢-مئوكسي-بنزيل	٢٩٦
٤٣٤	اثوكسي	اثوكسي	٢-ثالث فلورو مئوكسي-بنزيل	٣٠١
٣٨٤	اثوكسي	اثوكسي	٢-كلورو-بنزيل	٢٩٢

۳۴۹	H	فلورو	۵،۳-ثاني كلورو-بنزيل	۳۰۴
۲۹۴	H	فلورو	۳-مثيل-بنزيل	۳۰۵
۳۲۸	H	فلورو	۳-كلورو-۴-مثيل-بنزيل	۳۰۶
۳۴۰	H	فلورو	۵،۲-ثاني مئوكسي-بنزيل	۳۰۷
۳۱۶	H	فلورو	۴،۳-ثاني فلورو-بنزيل	۳۰۸
۳۴۵	مثيل	H	۵،۳-ثاني كلورو-بنزيل	۳۱۳
۲۹۰	مثيل	H	۳-مثيل-بنزيل	۳۱۴
۳۲۴	مثيل	H	۳-كلورو-۴-مثيل-بنزيل	۳۱۵
۳۳۶	مثيل	H	۵،۲-ثاني مئوكسي-بنزيل	۳۱۶
۳۱۲	مثيل	H	۴،۳-ثاني فلورو-بنزيل	۳۱۷
۳۵۰	مئوكسي	مئوكسي	۴،۳-ثاني مثيل-بنزيل	۳۲۰
۳۵۸	مئوكسي	مئوكسي	۶،۲-ثاني فلورو-بنزيل	۳۲۱
۳۸۲	مئوكسي	مئوكسي	۳،۲-ثاني مئوكسي-بنزيل	۳۲۲
۳۵۸	مئوكسي	مئوكسي	۵،۲-ثاني فلورو-بنزيل	۳۲۳
۳۶۶	مئوكسي	مئوكسي	۱-(۳-مئوكسي-فيل)-(*ع)	۳۲۴
اثير				
۳۴۰	مئوكسي	مئوكسي	۲-فلورو-بنزيل	۳۲۵
۳۹۱	مئوكسي	مئوكسي	۳،۲-ثاني كلورو-بنزيل	۳۲۶
۳۴۰	مئوكسي	مئوكسي	۳-فلورو-بنزيل	۳۲۷
۳۵۸	مئوكسي	مئوكسي	۴،۲-ثاني فلورو-بنزيل	۳۲۸
۳۹۰	مئوكسي	مئوكسي	۲-ثالث فلورو مثيل-بنزيل	۳۲۹
۳۹۱	مئوكسي	مئوكسي	۵،۲-ثاني كلورو-بنزيل	۳۳۰
۳۴۰	مئوكسي	مئوكسي	۴-فلورو-بنزيل	۳۳۱
۳۷۰	مئوكسي	مئوكسي	۳-كلورو-بنزيل	۳۳۳
۲۹۶	H	فلورو	۲-مثيل-بنزيل	۳۷۸
۴۰۰	مئوكسي	۳-هيدروكسي-	۲-كلورو-بنزيل	۳۸۵
بروبوكسي				
۳۸۴	مئوكسي	۳-هيدروكسي-	۲-فلورو-بنزيل	۳۸۶
بروبوكسي				

۴۰۰	مٹوکسی	۳،۲-ثانی هیدروکسی بروبوکسی	۲-فلورو-بنزیل	۳۸۷
۵۰۴	۳-بیرولیدینیل (۱)- ۲-هیدروکسی- بروبوکسی	مٹوکسی	۶،۲-ثانی کلورو-بنزیل	۳۹۰
۴۷۱	۳-بیرولیدینیل (۱)- ۲-هیدروکسی- بروبوکسی	مٹوکسی	۶،۲-ثانی فلورو-بنزیل	۳۹۱
۴۶۹	۳-بیرولیدینیل (۱)- ۲-هیدروکسی- بروبوکسی	مٹوکسی	۲-کلورو-بنزیل	۳۹۶
۴۵۳	۳-بیرولیدینیل (۱)- ۲-هیدروکسی- بروبوکسی	مٹوکسی	۲-فلورو-بنزیل	۳۹۷
۳۷۰	مٹوکسی	مٹوکسی	۳-کلورو-بنزیل	۴۲۴
۳۲۴	مٹوکسی	فلورو	۲-مٹیل-بنزیل	۴۲۵
۳۲۸	مٹوکسی	فلورو	۲-فلورو-بنزیل	۴۲۶
۴۳۵	مٹوکسی	۳-هیدروکسی- بروبوکسی	۶،۲-ثانی کلورو-بنزیل	۴۴۸
۴۰۲	مٹوکسی	۳-هیدروکسی- بروبوکسی	۶،۲-ثانی فلورو-بنزیل	۴۴۹
۴۵۱	مٹوکسی	۳،۲-ثانی هیدروکسی- بروبوکسی	۶،۲-ثانی کلورو-بنزیل	۴۵۰
۴۱۶	مٹوکسی	۳،۲-ثانی هیدروکسی- بروبوکسی	۲-کلورو-بنزیل	۴۵۱

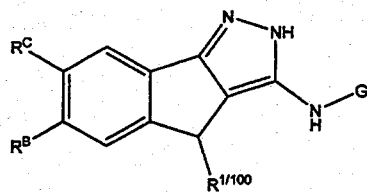
٤٥٥	٥-(فنييل)-ايزوكسازوليل	مئوكسي	مئوكسي	٣٨٩
(٣)-مئيل				
٤٥٧	٦،٢-ثاني فلورو-بنزيل	٣،٢-ثاني	مئوكسي	٤١٨
هيدروكسي- بروبوكسي				
٥٦٣	٢-بيريديل-مئيل	مئوكسي	مئوكسي	٣٢٣
٥٦٤	٣-بيريديل-مئيل	مئوكسي	مئوكسي	٣٢٣
٥٧٥	٢-برومو-بنزيل	مئوكسي	مئوكسي	٤٠١

الجدول ٤



MS	حلقة A/E	G	L ²	المركب
٢٦٨	٥،٤-ثيينيل	فنييل	-(CH ₂) ₂ -	٥٢
٢٦٢	فنييل	فنييل	-(CH ₂) ₂ -	٩٣
٢٥٤	٥،٤-ثيينيل	فنييل	-CH ₂ -	٩٤
٣٧١	٦،٥-(٣،١-بنزوديوكسوليل)	٣-برومو-فنييل	-CH ₂ -	٩٥
٣١٠	٦،٥-(٣،١-بنزوديوكسوليل)	٣-فلورو-فنييل	-CH ₂ -	٩٦
٣٢٢	٦،٥-(٣،١-بنزوديوكسوليل)	٣-مئوكسي-فنييل	-CH ₂ -	٩٧
٢٩٣	٦،٥-(٣،١-بنزوديوكسوليل)	٣-بيريديل	-CH ₂ -	١٢٦
٣٥٠	٦،٥-(٣،١-بنزوديوكسوليل)	٣-(مئوكسي-كربونيل)-فنييل	-CH ₂ -	١٢٧
٣٢٦	٦،٥-(٣،١-بنزوديوكسوليل)	٣-كلورو-فنييل	-CH ₂ -	١٢٨
٢٨٤	٥،٤-ثيينيل	٣-مئوكسي-فنييل	-CH ₂ -	٢٣٢
٢٧٢	٥،٤-ثيينيل	٣-فلورو-فنييل	-CH ₂ -	٣٣٥
٢٥٥	٥،٤-ثيينيل	٣-بيريديل	-CH ₂ -	٤٠٢
٢٨٨	٥،٤-ثيينيل	٣-كلورو-فنييل	-CH ₂ -	٤٠٣
٣٠٦	٥،٤-ثيينيل	٤-فلورو-٣-كلورو-فنييل	-CH ₂ -	٤٠٤
٢٩٨	٥،٤-ثيينيل	٣-اٲوكسي-فنييل	-CH ₂ -	٤٠٥

الجدول ٥

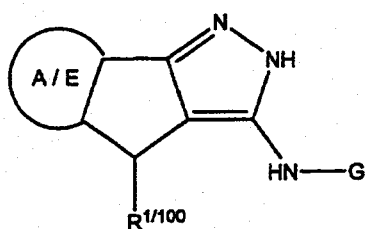


MS	R ^{1/100}	R ^C	R ^B	G	المركب
٢٦٢	أكسو	H	H	فنيل	٣٥
٢٦٤	هيدروكسي	H	H	فنيل	٥٠
٢٨٠	مثيل	H	H	٤-فلورو-فنيل	١٠٦
٢٩٢	مثيل	H	H	٤-مٹوكسي-فنيل	١٠٧
٢٨٠	مثيل	H	H	٣-فلورو-فنيل	١٠٨
٢٦٣	مثيل	H	H	٣-بيريديل	١٠٩
٣٢٢	مثيل	H	H	٥،٢-ثاني مٹوكسي-فنيل	١١٠
٣٢٢	مثيل	H	H	٤،٢-ثاني مٹوكسي-فنيل	١١١
٢٩٨	مثيل	H	H	٥،٢-ثاني فلورو-فنيل	١١٢
٣٤٦	مثيل	H	H	٤-ثالث فلورو مٹوكسي-فنيل	١١٣
٣٣٠	مثيل	H	H	٤-ثالث فلورو مٹيل-فنيل	١١٤
٣٢٢	مثيل	مٹوكسي	مٹوكسي	فنيل	٢٤٧
٣٤٠	مثيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٤-فلورو-فنيل	٢٤٨
٣٤٠	مثيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٣-فلورو-فنيل	٢٤٩
٣٧٤	مثيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٣-كلورو-٤-فلورو-فنيل	٢٥٠
٣٥٨	مثيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٥،٣-ثاني فلورو-فنيل	٢٥١
٣٥٨	مثيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٥،٢-ثاني فلورو-فنيل	٢٥٢
٣٥٢	مثيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٣-مٹوكسي-فنيل	٢٥٣
٤٢٨	مثيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٣-بنزيلوكسي-فنيل	٢٥٤
٣٦٨	مثيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٣-مثيل ثيو-فنيل	٢٥٥
٤٠٠	مثيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٣-برومو-فنيل	٢٥٦
٣٥٦	مثيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٣-كلورو-فنيل	٢٥٧
٣٨٢	مثيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٥،٢-ثاني مٹوكسي-فنيل	٢٥٨
٣٦٨	مثيل	اثوكسي	اثوكسي	٣-فلورو-فنيل	٣٤٤
٣٥١	مثيل	اثوكسي	اثوكسي	٣-بيريديل	٣٤٥
٤٢٩	مثيل	اثوكسي	اثوكسي	٣-برومو-فنيل	٣٤٦
٤٠٢	مثيل	اثوكسي	اثوكسي	٤-فلورو-٣-كلورو-فنيل	٣٤٧
٣٨٠	مثيل	اثوكسي	اثوكسي	٣-مٹوكسي-فنيل	٣٤٨

۳۶۸	مثیل	اثوکسی	اثوکسی	۴-فلورو-فنیل	۳۴۹
۳۹۶	مثیل	ایزوبروبوکسی	ایزوبروبوکسی	۳-فلورو-فنیل	۳۵۱
۳۷۹	مثیل	ایزوبروبوکسی	ایزوبروبوکسی	۳-بیریدیل	۳۵۲
۴۵۷	مثیل	ایزوبروبوکسی	ایزوبروبوکسی	۳-برومو-فنیل	۳۵۳
۴۳۰	مثیل	ایزوبروبوکسی	ایزوبروبوکسی	۴-فلورو-۳-کلورو-فنیل	۳۵۴
۴۰۸	مثیل	ایزوبروبوکسی	ایزوبروبوکسی	۳-متوکسی-فنیل	۳۵۵
۳۹۶	مثیل	ایزوبروبوکسی	ایزوبروبوکسی	۴-فلورو-فنیل	۳۵۶
۳۷۰	اثیل	متوکسی	متوکسی	۳-کلورو-فنیل	۴۱۹
۴۱۵	اثیل	متوکسی	متوکسی	۳-برومو-فنیل	۴۲۰
۳۵۴	اثیل	متوکسی	متوکسی	۴-فلورو-فنیل	۴۲۱
۴۱۵	(ق) * ایل	متوکسی	متوکسی	۳-برومو-فنیل	۴۸۲
۴۱۵	(ع) * ایل	متوکسی	متوکسی	۳-برومو-فنیل	۴۸۳
۴۱۵	۴،۴-ثانی مثیل	متوکسی	متوکسی	۳-برومو-فنیل	۴۸۵
۳۷۰	۴،۴-ثانی مثیل	متوکسی	متوکسی	۳-کلورو-فنیل	۴۸۶
۳۵۴	۴،۴-ثانی مثیل	متوکسی	متوکسی	۳-فلورو-فنیل	۴۸۷
۳۶۶	۴،۴-ثانی مثیل	متوکسی	متوکسی	۳-متوکسی-فنیل	۴۸۸
۳۸۰	۴،۴-ثانی مثیل	متوکسی	متوکسی	۳-اثوکسی-فنیل	۴۸۹
۳۹۴	مثیل	اثوکسی	اثوکسی	۳-اثوکسی-فنیل	۵۰۴
۳۸۰	اثیل	متوکسی	متوکسی	۳-اثوکسی-فنیل	۵۰۵
۳۶۶	اثیل	متوکسی	متوکسی	۳-متوکسی-فنیل	۵۱۲
۴۲۹	۲-ایزوبروبیل	متوکسی	متوکسی	۳-برومو-فنیل	۵۳۸
۳۸۴	۲-ایزوبروبیل	متوکسی	متوکسی	۳-کلورو-فنیل	۵۴۰
۳۸۰	۲-ایزوبروبیل	متوکسی	متوکسی	۳-متوکسی-فنیل	۵۴۱
۴۰۱	(ق) * مثیل	متوکسی	متوکسی	۳-برومو-فنیل	۵۵۳
۳۶۶	(ق) * مثیل	متوکسی	متوکسی	۳-متوکسی-فنیل	۵۵۴
۴۱۵	(ق) * ایل	متوکسی	متوکسی	۳-برومو-فنیل	۵۵۵
۳۸۰	(ق) * ایل	متوکسی	متوکسی	۳-متوکسی-فنیل	۵۵۶
۳۵۷	(ق) * مثیل	متوکسی	متوکسی	۳-(۲-کلورو)-بیریدیل	۵۵۹
۴۰۱	(ع) * مثیل	متوکسی	متوکسی	۳-برومو-فنیل	۵۶۸

٣٦٦	(ع*) مثيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٣-اٹوكسي-فنييل	٥٦٩
٤١٥	(ع*) ائيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٣-برومو-فنييل	٥٧٠
٣٨٠	(ع*) ائيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٣-اٹوكسي-فنييل	٥٧١
٤٢٠	(ع*) ائيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٦,٢-ثاني كلورو-بنزيل	٥٨٥
٤٠٥	(ع*) مثيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٦,٢-ثاني كلورو-بنزيل	٥٨٦
٣٧١	(ق*) ائيل	مٹوكسي	مٹوكسي	٣-(٢-كلورو)-بيريديل	٦٠٧

الجدول ٦



رقم التمييز	حلقة A/E	R ^{1/100}	G
١	٦,٥-بيريديل	H	٣-فلورو-فنييل
٢	٦,٥-بيريديل	H	٣-برومو-فنييل
٣	٦,٥-بيريديل	H	بنزيل
٤	٥,٤-بيريديل	H	٣-فلورو-فنييل
٥	٥,٤-بيريديل	H	٣-مٹوكسي-فنييل
٦	٥,٤-بيريديل	H	٣-كلورو-بنزيل
٧	٤,٣-بيريديل	H	٣-فلورو-فنييل
٨	٤,٣-بيريديل	H	٣-كلورو-فنييل
٩	٤,٣-بيريديل	H	٣-فلورو-بنزيل
١٠	٦,٥-بيريميدينيل	H	٣-هيدروكسي-مثيل-فنييل

۱۱	۶،۵-بیریمیدینیل	H	۳-برومو-فنیل
۱۲	۶،۵-بیریمیدینیل	H	۲-فلورو-بنزیل
۱۳	۵،۴-بیریمیدینیل	H	۳-هیدروکسی-متیل-فنیل
۱۴	۵،۴-بیریمیدینیل	H	۳-برومو-فنیل
۱۵	۵،۴-بیریمیدینیل	H	۲-فلورو-بنزیل
۱۶	۳،۲-(۵-کلورو-تینیل)	H	۳-فلورو-فنیل
۱۷	۳،۲-(۵-کلورو-تینیل)	H	۳-بیریدیل
۱۸	۳،۲-(۵-کلورو-تینیل)	H	۲-کلورو-بنزیل
۱۹	۵،۴-(۲-فنیل-فوریل)	H	فنیل
۲۰	۵،۴-(۲-فنیل-فوریل)	H	۳-کلورو-۴-فلورو-بنزیل
۲۱	۵،۴-تینیل	H	۳-فلورو-فنیل
۲۲	۵،۴-تینیل	H	۳-کلورو-فنیل
۲۳	۵،۴-تینیل	H	بنزیل
۲۴	۴،۳-فوریل	H	۳-هیدروکسی-متیل-فنیل
۲۵	۴،۳-فوریل	H	۳-کلورو-فنیل
۲۶	۴،۳-فوریل	H	۲-آمینو-کبریتونیل-بنزیل
۲۷	۴،۳-ایزوکسازولیل*	H	۳-ثانی-متیل-آمینو-فنیل
۲۸	۴،۳-ایزوکسازولیل*	H	۳-کلورو-فنیل
۲۹	۴،۳-ایزوکسازولیل*	H	۶،۲-ثانی-کلورو-بنزیل
۳۰	۵،۴-(۳-متیل-ایزوکسازولیل)	H	۴-متوکسی-فنیل
۳۱	۵،۴-(۳-متیل-ایزوکسازولیل)	H	۴-کلورو-فنیل
۳۲	۵،۴-(۳-متیل-ایزوکسازولیل)	H	۲-فلورو-فنیل
۳۳	۲،۱-[۵،۴-ثانی (ثالث فلورو متوکسی)-	H	۳-فلورو-فنیل

[فنیل]

۳-برومو-فنیل	H	۲،۱-۵،۴-ثانی (ثالث فلورو متوکسی)-	۳۴
[فنیل]			
۳-مثیل-بنزیل	H	۲،۱-۵،۴-ثانی (ثالث فلورو متوکسی)-	۳۵
[فنیل]			
۳-متوکسی-فنیل	H	۲،۱-۵،۳-ثانی متوکسی-فنیل)	۳۶
۳-برومو-فنیل	H	۲،۱-۵،۳-ثانی متوکسی-فنیل)	۳۷
۲-کلورو-بنزیل	H	۲،۱-۵،۳-ثانی متوکسی-فنیل)	۳۸
۳-کلورو-فنیل	H	۲،۱-۴-کلورو-۵-متوکسی-فنیل)	۳۹
۳-برومو-فنیل	H	۲،۱-۴-کلورو-۵-متوکسی-فنیل)	۴۰
۳-کلورو-بنزیل	H	۲،۱-۴-کلورو-۵-متوکسی-فنیل)	۴۱
۳-فلورو-فنیل	H	۲،۱-۴-متوکسی-اتوکسی-۵-اتوکسی-	۴۲
(فنیل)			
۳-متوکسی-فنیل	H	۲،۱-۴-متوکسی-اتوکسی-۵-اتوکسی-	۴۳
(فنیل)			
۲-مثیل-بنزیل	H	۲،۱-۴-متوکسی-اتوکسی-۵-اتوکسی-	۴۴
(فنیل)			
۳-فلورو-فنیل	H	۶،۵-۲-مثیل-۸-اتوکسی-	۴۵
بنزوکسازولیل)*			
۳-برومو-فنیل	H	۶،۵-۲-مثیل-۸-اتوکسی-	۴۶
بنزوکسازولیل)*			
۲-مثیل-بنزیل	H	۶،۵-۲-مثیل-۸-اتوکسی-	۴۷
بنزوکسازولیل)*			
۳-کلورو-فنیل	H	۶،۵-بنزوتیازولیل	۴۸
۳-متوکسی-فنیل	H	۶،۵-بنزوتیازولیل	۴۹

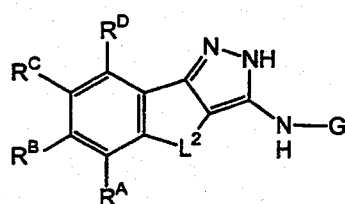
٥٠	٦،٥-بنزوئيازوليل	H	٣-كلورو-بنزيل
٥١	٢،١-(٥،٤-ثاني ائوكسي-فنييل)	H	٣،٢-ثاني كلورو-بنزيل
٥٢	٢،١-(٥،٤-ثاني ائوكسي-فنييل)	H	٣-كلورو-بنزيل
٥٣	٢،١-(٥،٤-ثاني ائوكسي-فنييل)	H	بنزيل
٥٤	٢،١-(٥،٤-ثاني(٣-مئوكسي- بروبوكسي)-فنييل)	H	٣-فلورو-فنييل
٥٥	٢،١-(٥،٤-ثاني (مئوكسي ائوكسي)-فنييل)	H	٣-مئوكسي-فنييل
٥٦	٢،١-(٥،٤-ثاني (مئوكسي ائوكسي)-فنييل)	H	٢-مئيل-بنزيل
٥٧	٢،١-(٥،٤-ثاني (ايزوبروبوكسي)-فنييل]	H	٣،٢-ثاني كلورو-بنزيل
٥٨	٢،١-(٥،٤-ثاني (ايزوبروبوكسي)-فنييل]	H	٣-كلورو-بنزيل
٥٩	٢،١-(٥،٤-ثاني (ايزوبروبوكسي)-فنييل]	H	٢-مئيل-بنزيل
٦٠	٢،١-(٥،٤-ثاني (ايزوبروبوكسي)-فنييل]	مئيل	٢،٣-ثاني كلورو-بنزيل
٦١	٢،١-(٥،٤-ثاني (ايزوبروبوكسي)-فنييل]	مئيل	٣-كلورو-بنزيل
٦٢	٢،١-(٥،٤-ثاني (ايزوبروبوكسي)-فنييل]	مئيل	٢-مئيل-بنزيل
٦٣	٢،١-(٥،٤-ثاني ائوكسي-فنييل)	مئيل	٣،٢-ثاني كلورو-بنزيل
٦٤	٢،١-(٥،٤-ثاني ائوكسي-فنييل)	مئيل	٣-كلورو-بنزيل
٦٥	٢،١-(٥،٤-ثاني ائوكسي-فنييل)	مئيل	٢-مئيل-بنزيل
٦٦	٢،١-(٥،٤-ثاني ائوكسي-فنييل)	H	٣-(ثاني مئيل امينو-اثيل امينو-كربونيل)-فنييل
٦٧	٢،١-(٥،٤-ثاني ائوكسي-فنييل)	H	٣-(٢-بيروليدينيل (١)- اثيل امينو-كربونيل)-فنييل
٦٨	٢،١-(٥،٤-ثاني ائوكسي-فنييل)	H	٣-(٢-بيروليدينيل (١)- ع-برويل امينو- كربونيل)-فنييل

٦٩	٢،١-٤-مٲوكسي اٲوكسي-٥-اٲوكسي-	H	٣-٢-ٲائي مٲيل أمينو- اٲيل أمينو-كربونيل-فٲيل
٧٠	٢،١-٤-مٲوكسي اٲوكسي-٥-اٲوكسي-	H	٣-٢-بيروليدينيل (١)- اٲيل أمينو-كربونيل-فٲيل
٧١	٢،١-٤-مٲوكسي اٲوكسي-٥-اٲوكسي-	H	٣-٣-بيروليدينيل (١) بروبيل أمينو-كربونيل- فٲيل
٧٢	٢،١-٥،٤-ٲائي اٲوكسي-فٲيل	H	٣-٢-١-مٲيل- ايميدازوليل (٥)-اٲيل أمينو-كربونيل-فٲيل]
٧٣	٢،١-٥،٤-ٲائي اٲوكسي-فٲيل	H	٣-٢-(ايميدازوليل (١) اٲيل أمينو-كربونيل-فٲيل]
٧٤	٢،١-٥،٤-ٲائي اٲوكسي-فٲيل	H	٣-N-٣-هيدروكسي مٲيل-١-بيروليدينيل (١)- بروبيل-أمينو-كربونيل]- فٲيل
٧٥	٢،١-٥،٤-ٲائي اٲوكسي-فٲيل	H	٢-أمينوكبريتونيل-فٲيل
٧٦	٢،١-٥،٤-ٲائي اٲوكسي-فٲيل	H	٣-أمينوكبريتونيل-فٲيل
٧٧	٢،١-٥،٤-ٲائي اٲوكسي-فٲيل	H	٤-أمينوكبريتونيل-فٲيل
٧٨	٢،١-٥،٤-ٲائي (ٲائي فلورو مٲوكسي)-	H	٣-فلورو-فٲيل فٲيل)
٧٩	٢،١-٥،٤-ٲائي (ٲائي فلورو مٲوكسي)-	H	٣-أمينو كبريتونيل-فٲيل فٲيل)

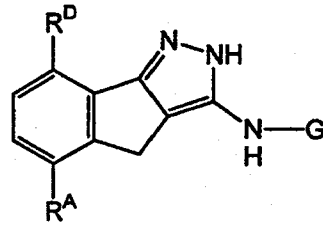
٨٠	٢،١-٥،٤-ثاني (ثاني فلورو مٹوكسي)-	H	٣-(اٹوكسي-كربونيل)-فنييل
(فنييل)			
٨١	٥،٤-(٣-اٹوكسي-ثيينيل)	H	٣-بيريديل-مٹيل
٨٢	٥،٤-(٣-اٹوكسي-ثيينيل)	H	٣-كلورو-بنزيل
٨٣	٥،٤-(٣-اٹوكسي-ثيينيل)	H	بنزيل
٨٤	٥،٤-(٣-اٹوكسي-ثيينيل)	H	هكسيل حلقي مٹيل
٨٥	٥،٤-(٣-اٹوكسي-ثيينيل)	H	هكسيل حلقي مٹيل
٨٦	٥،٤-(٣-اٹوكسي-ثيينيل)	H	فنيثيل
٨٧	٦،٥-بيريميدينيل	H	هكسيل حلقي مٹيل
٨٨	٦،٥-بيريميدينيل	H	فنيثيل
٨٩	٥،٤-(٣-مٹيل-ايزوكسازوليل)	H	هكسيل حلقي
٩٠	٤،٥-(٣-مٹيل-ايزوكسازوليل)	H	٢-فلورو-فنييل اثيل
٩١	٥،٤-بيريديل	H	٣-هيدروكسي-هكسيل حلقي
٩٢	٥،٤-بيريديل	H	٢-مٹيل بنزيل
٩٣	٥،٤-بيريديل	H	٣-مٹوكسي-فنييل اثيل
٩٤	٦،٥-بيريميدينيل	H	٤-هيدروكسي-هكسيل حلقي
٩٥	٦،٥-بيريميدينيل	H	٢-هيدروكسي مٹيل-بنزيل
٩٦	٦،٥-بيريميدينيل	H	٢-فلورو-فنييل اثيل
٩٧	٥،٤-بيريميدينيل	H	٤-هيدروكسي-هكسيل حلقي
٩٨	٥،٤-بيريميدينيل	H	٢-هيدروكسي مٹيل-بنزيل
٩٩	٥،٤-بيريميدينيل	H	٢-فلورو-فنييل اثيل

١٠٠	٢٠١-٥٠٤-ثاني اوكسي-فنييل)	H	٣-بيريديل ميثيل
١٠١	٢٠١-٥٠٤-ثاني اوكسي-فنييل)	H	١-ميثيل-٥-ايميدازوليل
ميثيل			
١٠٢	٢٠١-٥٠٤-ثاني اوكسي-فنييل)	H	٦-بيريميدينيل ميثيل
١٠٣	٢٠١-٥٠٤-ثاني اوكسي-فنييل)	H	٣-بيريديل اثيل
١٠٤	٢٠١-٥٠٤-ثاني اوكسي-فنييل)	H	١-ميثيل-٥-ايميدازوليل
ميثيل			
١٠٥	٢٠١-٥٠٤-ثاني اوكسي-فنييل)	H	٦-بيريميدينيل ميثيل

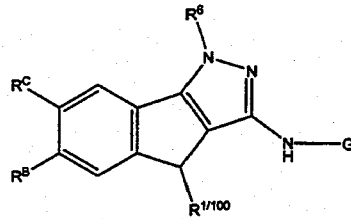
الجدول ٧



MS	G	L ²	R ^D	R ^C	R ^B	R ^A	المركب
٢٧٨	فنييل	اكسي اثيلين	H	H	H	H	٣١٨
٢٨٧	فنييل	اثيلين	H	H	سيانو	H	٣٥٠
٢٦٨	٣-فلورو-فنييل	اكسي	H	H	H	H	٣٨٠
٣٠٢	٣-كلورو-٤-فنييل	اكسي	H	H	H	H	٣٨١
فلورو-فنييل							
٢٨١	فنييل	اكسي	H	H	H	مئوكسي	٥٩٥
٤٠٣	٣-فلورو-فنييل	مئيلين	بنزيل	هيدروكسي	مئوكسي	H	٦٠٦

الجدول ٨

MS	G	R ^D	R ^A	المركب
٣٠٨	فنييل	مئوكسي	مئوكسي	٣٣٢

الجدول ٩

MS	G	R ⁶	R ^{1/100}	R ^C	R ^B	المركب
٤٠١	٣-برومو-فنييل	مئيل	H	مئوكسي	مئوكسي	٩١
٤٤٠	٣-فلورو-فنييل	٢،٢-ثاني مئيل-١- أكسو-بروبوكسي- مئيل	H	مئوكسي	مئوكسي	٤٠٩
٤٣٠	٣-فلورو-فنييل	بنزويل	H	مئوكسي	مئوكسي	٤٢٧
٤٤٠	٣-فلورو-فنييل	٤-مئوكسي-٤،١- ديوكسو-ع-بيوتيل	H	مئوكسي	مئوكسي	٤٢٨

٤٢٩	مٹوكسى	مٹوكسى	H	٤-اٹوكسى-١،٤-٣-فلورو-فنىل	٤٥٤
ڊيوكسو-ع-بيوتيل					
٤٣٠	مٹوكسى	مٹوكسى	H	١-اڪسو-بروبيل	٣٨٢
٤٣١	مٹوكسى	مٹوكسى	H	٢-مٺيل-١-اڪسو-٣-فلورو-فنىل	٣٩٦
بروبيل					
٤٣٢	مٹوكسى	مٹوكسى	H	٢-هيدروكسى-١-٣-فلورو-فنىل	٣٨٤
اڪسو-اٺيل					
٤٣٣	مٹوكسى	مٹوكسى	H	فئوكسى-كربونيل	٤٤٦
٤٣٨	مٹوكسى	مٹوكسى	H	٢-مٹوكسى-٣-فلورو-فنىل	٤٢٨
اٹوكسى-كربونيل					
٤٣٩	مٹوكسى	مٹوكسى	H	مٹوكسى-كربونيل	٣٨٤
٤٤٦	مٹوكسى	مٹوكسى	H	ٺاڻي اٹوكسى-	٤٦٢
فسفينيل					
٤٤٧	مٹوكسى	مٹوكسى	H	N,N-ٺاڻي مٺيل-٣-فلورو-فنىل	٤٣٣
امينو-كبريتونيل					
٤٥٨	مٹوكسى	مٹوكسى	H	٤-مٹوكسى-بنزويل	٤٦٠
٤٥٩	مٹوكسى	مٹوكسى	H	٣-اٹوكسى-١،٣-٣-فلورو-فنىل	٤٤٠
ڊيوكسو-بروبيل					
٤٦٤	مٹوكسى	مٹوكسى	H	٥-مٹوكسى-١،٥-٣-فلورو-فنىل	٤٥٤
ڊيوكسو-بنٺيل					
٤٦٥	مٹوكسى	مٹوكسى	H	٢-مٹوكسى-١-اڪسو-٣-فلورو-فنىل	٣٩٨
اٺيل					

٤٦٦	مٹوكسي	مٹوكسي	H	٤-هيدروكسي-٣-فلورو-فنييل ٤،١-ديوكسو-ع-	٤٢٦
بيوتيل					
٤٦٧	مٹوكسي	مٹوكسي	H	٢-(١-أكسو-و-٣-فلورو-فنييل اٹوكسي)-١-أكسو-	٤٢٦
اٹيل					
٤٧٠	مٹوكسي	مٹوكسي	H	٢-بنزيلوكسي-٣-فلورو-فنييل اٹوكسي-كربونيل	٥٠٤
٤٧١	مٹوكسي	مٹوكسي	H	٢-٢-(٢)-٣-فلورو-فنييل هيدروكسي- اٹوكسي)-اٹوكسي]- اٹوكسي-كربونيل	٥٠٢
٤٧٢	مٹوكسي	مٹوكسي	H	مٹوكسي-مٹيل ٣-فلورو-فنييل	٣٧٠
٤٧٣	مٹوكسي	مٹوكسي	H	٢-(٢-مٹوكسي-١-٣-فلورو-فنييل أكسو-اٹوكسي)-١- أكسو-اٹيل	٤٥٦
٤٧٤	مٹوكسي	مٹوكسي	H	٢-(٢-مٹيل-١-٣-فلورو-فنييل أكسو-بروبوكسي)- ١-أكسو-اٹيل	٤٥٤
٤٨٠	مٹوكسي	مٹوكسي	H	٦،٢-ثاني فلورو-٣-فلورو-فنييل بنزويل	٤٦٦
٤٨١	مٹوكسي	مٹوكسي	H	٢-فلورو-بنزويل ٣-فلورو-فنييل	٤٤٨
٤٨٤	مٹوكسي	مٹوكسي	H	٢-أكسو-بروبيل ٣-فلورو-فنييل	٣٨٢

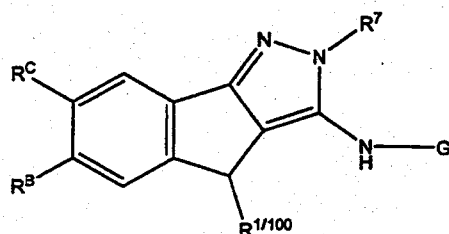
٥١٤	مٹوكسي	مٹوكسي	اٲيل	٢-مٹوكسي-١-٣-برومو-فنييل أكسو-اٲيل	٤٨٧
٥١٦	مٹوكسي	مٹوكسي	H	N-(٢-أمينو-اٲيل)-٣-فلورو-فنييل أمينو-كربونيل	٤١٢
٥١٧	مٹوكسي	مٹوكسي	H	N-[٢-(N,N-ثاني مٲيل-أمينو)-اٲيل]- أمينو-كربونيل	٤٤٠
٥١٩	مٹوكسي	مٹوكسي	اٲيل	٢-بنزيلوكسي-١-٣-فلورو-فنييل أكسو-اٲيل	٥٦٣
٥٢٠	مٹوكسي	مٹوكسي	H	N-(٢-H١)-٣-فلورو-فنييل بيروليدينيل (١)- اٲيل)-أمينو-كربونيل	٤٦٦
٥٢١	مٹوكسي	مٹوكسي	H	N-(٢-مورفولينيل-٤)-٣-فلورو-فنييل كربونيل	٤٨٢
٥٢٣	مٹوكسي	مٹوكسي	H	N-[٢-(٢)-٣-فلورو-فنييل هيدروكسي-اٲيل)- أمينو]-اٲيل)-أمينو- كربونيل	٤٥٦
٥٢٤	مٹوكسي	مٹوكسي	H	N-(٢-N-مٲيل)-٣-فلورو-فنييل أمينو)-اٲيل]-أمينو- كربونيل	٤٢٦

۴۸۲	۳-فلورو-فنیل	N-[۲-N-(۲)-] - مثیل-۱-اکسو- برویل(امینو)- اثیل]-امینو-کربونیل	H	مٹوکسی	مٹوکسی	۵۲۵
۴۵۴	۳-فلورو-فنیل	N-[۲-N-(۱)-] - اکسو-اثیل(امینو)- اثیل]-امینو-کربونیل	H	مٹوکسی	مٹوکسی	۵۲۶
۴۸۱	۳-فلورو-فنیل	N-[۲-N-(۲-مثیل)-] - ۱-اکسو- برویل(مٹوکسی)- امینو-کربونیل	H	مٹوکسی	مٹوکسی	۵۲۷
۴۸۳	۳-فلورو-فنیل	N-[۲-N-(۳-مثیل)-] - ۱-مٹوکسی-۱- اکسو(ع- بیوتیل]-امینو- کربونیل	H	مٹوکسی	مٹوکسی	۵۳۰
۴۲۴	۳-فلورو-فنیل	۴-امینو-۱-۴،۱- دیوکسو-ع-بیوتیل	H	مٹوکسی	مٹوکسی	۵۳۱
۵۱۶	۳-فلورو-فنیل	N-[۲-N-(N-بنزویل)-] - امینو(اثیل)-امینو- کربونیل	H	مٹوکسی	مٹوکسی	۵۳۲
۳۸۳	۳-فلورو-فنیل	۲-امینو-۲-اکسو- اثیل	H	مٹوکسی	مٹوکسی	۵۳۴

٥٣٦	مٹوكسي	مٹوكسي	H	٣-H-١-بيروليدينيل (١)-٣،١-ديوكسو- بروبيل	٣-فلورو-فنييل	٤٦٥
٥٣٧	مٹوكسي	مٹوكسي	H	٣-(N,N-ٲائي اٲيل-امينو)-٣،١- ديوكسو-بروبيل	٣-فلورو-فنييل	٤٦٧
٥٤٢	مٹوكسي	مٹوكسي	H	N-٢]-N-٢)-٢- هيدروكسي- بنزويل)-امينو]- اٲيل]-امينو-كربونيل	٣-فلورو-فنييل	٥٣٢
٥٤٤	مٹوكسي	مٹوكسي	H	N-٢]-٢)-٢)-٢- هيدروكسي- اٲوكسي)-اٲوكسي]- اٲيل]-امينو-كربونيل	٣-فلورو-فنييل	٥٠١
٥٤٦	مٹوكسي	مٹوكسي	اٲيل	بنزويل	٣-برومو-فنييل	٥١٩
٥٤٧	مٹوكسي	مٹوكسي	اٲيل	٢-٢]-٢)-٢- هيدروكسي- اٲوكسي)-اٲوكسي]- اٲوكسي-كربونيل	٣-برومو-فنييل	٥٩١
٥٤٨	مٹوكسي	مٹوكسي	مٲيل	٢-٢]-٢)-٢- هيدروكسي- اٲوكسي)-اٲوكسي]- اٲوكسي-كربونيل	٣-برومو-فنييل	٥٧٧
٥٧٢	مٹوكسي	مٹوكسي	H	٢-هيدروكسي-اٲيل	٣-فلورو-فنييل	٣٧٠

٣٨٣	٣-فلورو-فنييل	N-ميثيل-امينو-	H	مئوكسي	مئوكسي	٥٧٨
كربونيل						
٣٩٩	٣-فلورو-فنييل	N-ميثيل-امينو-	H	مئوكسي	مئوكسي	٥٨١
ثيوكربونيل						
٣٤٠	٣-فلورو-فنييل	ميثيل	H	مئوكسي	مئوكسي	٦٠٩
٥٠٣	٣-فلورو-فنييل	(ق)٣، (ع)٤، (ع)٥-ثالث هيدروكسي-(ع)٦- كربوكسي-رابع هيدرو-(ق)٢-بيران	H	مئوكسي	مئوكسي	٦١١

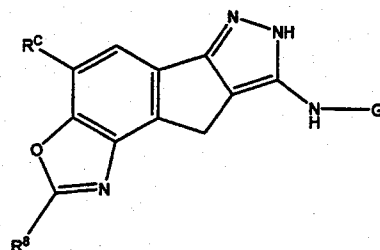
الجدول ١٠



٥٢٨	مٹوكسي	مٹوكسي	H	N-٢-(٢-مٹينيل-٣-فلورو-فنييل)-١-أكسو- بروبوكسي-اثيريل- امينو-كربونيل	٤٨١
٥٢٩	مٹوكسي	مٹوكسي	H	(ق)٣، (ع)٤، (ع)٥-ثالث هيدروكسي-(ع)٦- كربوكسي-رابع هيدرو-(ق)٢-بيران	٥٠٣
٥٣٥	مٹوكسي	مٹوكسي	H	٣-H١-بيروليدينيل (١)-٣، ١-ديوكسو- بروبيل	٤٦٥
٥٧٣	مٹوكسي	مٹوكسي	H	٢-هيدروكسي-اثيريل	٣٧٠
٥٧٩	مٹوكسي	مٹوكسي	H	N-مٹيل-امينو- كربونيل	٣٨٣
٥٨٠	مٹوكسي	مٹوكسي	H	N-مٹيل-امينو- ثيوكربونيل	٣٩٩
٥٩٨	مٹوكسي	مٹوكسي	H	N-(بنزاديسيل)- امينو-كربونيل	٥٨٠
٦٠٢	مٹوكسي	مٹوكسي	H	١-مٹوكسي-١- أكسو-اثيريل	٣٩٩

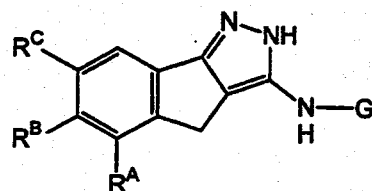
٦٠٤	مٹوكسي	مٹوكسي	H	-N[٢]-[٢]-[٢]-	٣-فلورو-فنیل	٥٠٢
هیدروكسي- اٹوكسي]-اٹوكسي]- اٹیل]-أمینو-كربونیل						
٦٠٨	مٹوكسي	مٹوكسي	H	مٹیل	٣-فلورو-فنیل	٣٤٠

الجدول ١١



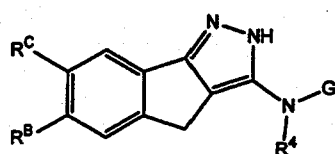
المركب	R ^C	R ^B	G	MS
٥٦٠	مٹوكسي	مٹیل	٣-مٹوكسي-فنیل	٣٦٣
٥٧٤	مٹوكسي	مٹیل	٢-فلورو-بنزیل	٣٦٥
٦٠٥	مٹوكسي	مٹیل	٣-فلورو-فنیل	٣٥٢

الجدول ١٢



المركب	R ^A	R ^B	R ^C	G	MS
٥٥٧	N-(١-أكسو-اثيل)-أمينو	مثنوكسي	مثنوكسي	٣-فلورو-فنييل	٣٨٣
٥٥٨	أمينو	مثنوكسي	مثنوكسي	٣-فلورو-فنييل	٣٤١

الجدول ١٣



المركب	R ^B	R ^C	R ^A	G	MS
٥٩١	مثنوكسي	مثنوكسي	(ق) ٣، (ع) ٤، (ع) ٥-ثالث هيدروكسي-	٣-فلورو-فنييل	٥٠٣
(ع) ٦-كربوكسي-رابع هيدرو (ق) ٢-					
بيران					

وما لم يذكر خلاف ذلك، يشمل المصطلح "ألكيل" كما استخدم في هذا البيان، سواء استخدم بمفرده أو كجزء من مجموعة بديلة، سلاسل مستقيمة ومتفرعة بها من ١ إلى ١٠ ذرات كربون، أو أي عدد ضمن هذا المدى. فعلى سبيل المثال، تشمل شقات الألكيل ميثيل، اثيل، ع-بروبيل، أيزوبروبيل، ع-بيوتيل، أيزوبيوتيل، ثن-بيوتيل، ثث-بيوتيل، ع-بنتيل، ٣-(٢-مethyl) بيوتيل، ٢-بنتيل، ٢-مethyl بيوتيل، نيوبنتيل، ع-هكسيل، ٢-هكسيل، ٢-مethyl بنتيل، وما شابه ذلك. وما لم يذكر خلاف ذلك، يشتمل ألكيل منخفض على سلاسل مستقيمة ومتفرعة بها من ١ إلى ٤ ذرات كربون، أو أي عدد ضمن هذا المدى.

وما لم يذكر خلاف ذلك، يستخدم المصطلح "ألكوكسي" أو "ألكيلوكسي" بشكل مترادف في هذا البيان، ويشير، كما استخدم في هذا البيان، سواء استخدم بمفرده أو كجزء من مجموعة بديلة، إلى شق أكسجين ايثر لمجموعات الألكيل ذات السلسلة المستقيمة أو المتفرعة الموصوفة

أعلاه. فعلى سبيل المثال، تشمل شقات الألكوكسي ميثوكسي، إيثوكسي، ع-بروبوكسي، ثن-بيوتوكسي، ثث-بيوتوكسي، ع-هكسيلوكسي وما شابه ذلك. ويحدد وضع معين لذرة الأكسجين بالنسبة لجزء الألكيل بالكيفية التالية، "ألكيل-O-" أو "O-ألكيل"، لوصف OCH_3 - و CH_2O - على التعاقب (حيث يمثل الألكيل مثيل لأغراض المثال).

وما لم يذكر خلاف ذلك، يقصد بالمصطلح "أريل" المستخدم بمفرده أو في توليفة مع مصطلحات أخرى (مثلاً، أريلوكسي، أريل ثيوكسي، أريل ألكيل)، بنية حلقية عطرية تشتمل على ذرات كربون، على سبيل المثال، فنييل، نفثيل، فلورينيل، وما شابه ذلك.

وما لم يذكر خلاف ذلك، يقصد بالمصطلح "ألكيل"، كما استخدم في هذا البيان، أي مجموعة ألكيل منخفض يحمل بدلاً من مجموعة أريل مثل فنييل، نفثيل وما شابه ذلك، على سبيل المثال، بنزيل، فنييل إثيل، فنييل بروبيل، نفثيل مثيل، وما شابه ذلك.

وما لم يذكر خلاف ذلك، يقصد بالمصطلح "ألكيل حلقي" كما استخدم في هذا البيان، سواء استخدم بمفرده أو كجزء من مجموعة بديلة، أي نظام حلقي ثابت مشبع به من ٣ إلى ١٠ أعضاء، على سبيل المثال بروبيل حلقي، بيوتيل حلقي، بنتيل حلقي، هكسيل حلقي، هبتيل حلقي وأوكتيل حلقي.

وما لم يذكر خلاف ذلك، يقصد بالمصطلح "حلقة كربونية غير مشبعة جزئياً" كما استخدم في هذا البيان، سواء استخدم بمفرده أو كجزء من مجموعة بديلة، أي نظام حلقي ثابت غير مشبع جزئياً به من ٥ إلى ١٠ أعضاء، حيث تحتوي الحلقة الكربونية على رابطة غير مشبعة واحدة على الأقل، على سبيل المثال بنتينيل حلقي، هكسينيل حلقي، هبتينيل حلقي، وما شابه ذلك.

وما لم يذكر خلاف ذلك، يشير المصطلح "مجموعة أريل مخلط" كما استخدم في هذا البيان، سواء استخدم بمفرده أو كجزء من مجموعة بديلة، إلى أي بنية عطرية أحادية أو ثنائية الحلقة بها من خمسة إلى عشرة أعضاء تحتوي على ذرات كربون وعلى ذرة مغايرة واحدة على الأقل تختار من الفئة التي تتكون من O، N و S، وتحتوي بشكل اختياري من ذرة واحدة إلى أربع ذرات مغايرة إضافية يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من O، N و S. ويمكن أن ترتبط مجموعة الأريل المخلط عند أي ذرة مغايرة أو ذرة كربون للحلقة بحيث تنتج

بنية ثابتة. وتشمل أمثلة مجموعات الأريل المخطط الملائمة، على سبيل المثال لا الحصر،
بيروليل، فوريل، ثيينيل، أكسازوليل، إيميدازوليل، بيرازوليل، أيزوكسازوليل، أيزوثيازوليل،
تريازوليل، ثياديازوليل، بيريديل، بيريدازينيل، بيريميدينيل، بيرازينيل، بيرانيل، فورازانيل،
اندوليزينيل، اندوليل، أيزواندولينيل، اندازوليل، بنزوفوريل، بنزوئينيل، بنزيميدازوليل،
بنزثيازوليل، بورينيل، كينوليزينيل، كينولينيل، أيزوكينولينيل، أيزوثيازوليل، سينولينيل،
فثالازينيل، كينازولينيل، كينوكساليينيل، نفثيريدينيل، بتيريدينيل، وما شابه ذلك.

ويشير المصطلح "الأكيل حلقي مخطط"، كما استخدم في هذا البيان، إلى أي بنية غير
مشبعة جزئياً أو مشبعة، أحادية أو ثنائية الحلقة بها من خمسة إلى عشرة أعضاء تحتوي على
ذرات كربون وعلى ذرة مغاير واحدة على الأقل تختار من الفئة التي تتكون من O، N و S،
وتحتوي بشكل اختياري من ذرة واحدة إلى أربع ذرات مغايرة إضافية تختار كل على حدة من
الفئة التي تتكون من O، N و S. ويمكن أن ترتبط مجموعة الألكيل المخطط أحادي أو ثنائي
الحلقة عند أي ذرة مغايرة أو ذرة كربون للحلقة بحيث تنتج بنية ثابتة. وتشمل أمثلة
مجموعات الألكيل المخطط أحادي أو ثنائي الحلقة ملائمة، على سبيل المثال لا الحصر،
بيرولينيل، بيروليدينيل، ديوكسولانيل، إيميدازولينيل، إيميدازولينيل، بيرازولينيل،
بيرازولينيل، بيبريدينيل، ديوكسانيل، مورفولينيل، ثاني ثيانيل، ثيومورفولينيل، بيبرازينيل،
ثالث ثيانيل، اندولينيل، كرومينيل، ٣،١-مثيلين ديوكسي فني (مكافئ لديوكسوليل مدمج مع
بنزو)، ١،٤-اثيلين ديوكسي فني (مكافئ لديوكسانيل مدمج مع بنزو) ٣،٢-ثاني هيدرو
بنزوفوريل، وما شابه ذلك.

وما لم يذكر خلاف ذلك، يقصد بالمصطلح "أريل مخطط مع بنزو"، كما استخدم في هذا
البيان، بنية ثنائية الحلقة حيث تمثل إحدى الحلقة فني (تمثل الأخرى أريل مخطط به خمسة أو
سبعة أعضاء. وتكون مجموعات الأريل المخطط المدمج مع البنزو عبارة عن مجموعة فرعية
من مجموعات الأريل المخطط. ومن الأمثلة الملائمة، على سبيل المثال لا الحصر، اندوليل،
أيزواندوليل، بنزوفوريل، بنزوئينيل، اندازوليل، بنزثيازوليل، كينولينيل، أيزوكينولينيل،
سينولينيل، فثالازينيل، كينازولينيل، بتيريدينيل، وما شابه ذلك.

وما لم يذكر خلاف ذلك، يقصد بالمصطلح "الأكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو"، كما استخدم في هذا البيان، بنية ثنائية الحلقة حيث تمثل إحدى الحلقتين فنيل وتمثل الأخرى ألكيل حلقي مخلط به خمسة أو ستة أعضاء. وتكون مجموعات الألكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو عبارة عن مجموعة فرعية من مجموعات الألكيل الحلقي المخلط. ومن الأمثلة الملائمة، على سبيل لا الحصر، ٣،١-بنزوديوكسوليل (يعرف أيضاً بـ ٣،١-مثيلين ديوكسي فنيل)، اندولينيل، ٤،١-بنزوديوكسولانيل (يعرف أيضاً بـ ٤،١-إثيلين ديوكسي فنيل)، بنزو ثاني هيدروفورانيل، بنزو رابع هيدروبيرانيل، بنزو ثاني هيدروثيوفين وما شابه ذلك.

وما لم يذكر خلاف ذلك، يقصد بالمصطلح "الأكيل حلقي مدمج مع بنزو"، كما استخدم في هذا البيان، بنية ثنائية الحلقة حيث تمثل إحدى الحلقتين فنيل وتمثل الأخرى ألكيل حلقي به من ثلاثة إلى ثمانية أعضاء. ومن الأمثلة الملائمة، على سبيل المثال لا الحصر، ٤،٣،٢،١-رابع هيدرونفتيل، ٩،٨،٧،٦-رابع هيدرو- H_5 -بنزو هبتينيل حلقي، ١٠،٩،٨،٧،٦،٥-سادس هيدروبنزو أوكتينيل حلقي، وما شابه ذلك.

ويشير المصطلح "مجموعة رابطة"، كما استخدم في هذا البيان، إلى شق ثنائي التكافؤ يشق، على سبيل المثال، بإزالة ذرة هيدروجين واحدة على الأقل من ذرتين مختلفتين، أو إزالة ذرتي هيدروجين من ذرة مفردة، بحيث يشكل مركزي الشق أحادي التكافؤ، أو مركز الشق ثنائي التكافؤ المفرد، روابط مع ذرات مختلفة.

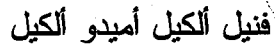
ويشمل المصطلح "الأكيل دبيل"، كما استخدم في هذا البيان، سلسلة مستقيمة ومتفرعة بها من ١ إلى ١٠ ذرات كربون، أو أي عدد ضمن هذا المدى، شقات هيدروكربونية ثنائية أو أحادية التكافؤ مشتقة بإزالة ذرة هيدروجين واحدة من ذرتي كربون مختلفتين، أو إزالة ذرتي هيدروجين من ذرة كربون مفردة. وتشمل الأمثلة على الألكيل دبيل مثيل دبيل (يشار إليه أيضاً في هذا البيان بمثيلين)، ومركبات إثيل دبيل (يشار إليها أيضاً في هذا البيان بإثيلين)، مثل إيثان-١،١-دبيل، وإيثان-٢،١-دبيل.

وبوجه عام، تستخدم قوانين التسمية وفقاً للاتحاد الدولي للكيمياء التجريبية والتطبيقية (IUPAC) في هذا الوصف بأكمله. وتشق تسمية بدائل الشقات بالإشارة أولاً إلى المجموعة

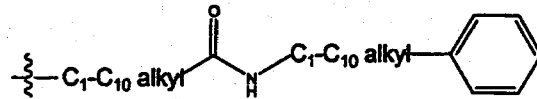
الوظيفية التي لها نقطة الارتباط مع واصله، ثم المجموعة الوظيفية المجاورة القريبة من الجزء الطرفي للسلسلة الجانبية، كما في:



أو بوصف أولاً، عند عدم استخدام واصله بداية، الجزء الطرفي للسلسلة الجانبية، ثم المجموعة الوظيفية المجاورة القريبة من نقطة الارتباط، كما في:



وتشير الأمثلة الثلاثة إلى شق بالصيغة:



حيث يوجد نقطتي ارتباط، على سبيل المثال في مجموعة رابطة، أو عضو حلقة،

ويشار إلى نقطتي الارتباط بواصله بداية وواصله نهاية. فعلى سبيل المثال، يمكن أن يشار

إلى نقاط ارتباط مجموعة رابطة تحتوي على مركزي شق أحادي التكافؤ بـ $-(CH_2)_2$ أو

$-O(CH_2)_2-$ وما شابه ذلك؛ ويمكن أن يشار إلى نقاط ارتباط مجموعة رابطة تحتوي على

مركز شق ثنائي التكافؤ مفرد بـ $-NH-$ أو $-(\text{ألكيل } C=O)-N$ ما شابه ذلك. ويمكن أن يشار

إلى نقاط ارتباط عضو حلقة عطري بـ $-N-$ ، $-S-$ أو $-CH$ وما شابه ذلك، على سبيل المثال.

وحيثما تستخدم العبارة "ينتهي بـ"، يشار إلى نقطة ارتباط البديل الطرفي بالشرطة

الثانية. فبالنسبة للعبارة $-(CH_2CH_2O)_{1-10}-C(=O)-$ ينتهي بـ $-H$ ، مثيل، اثيل، أو بنزيل"، على

سبيل المثال، تكون نقطة ارتباط البديل الطرفي المختار عبارة عن الأكسجين الطرفي، وعلى



وعندما يُذكر بأن مجموعة خاصة "تحمّل بدائل" (مثلاً، فنيل، أريل، ألكيل مخلط،

أريل مخلط)، يمكن أن تحتوي تلك المجموعة على بديل واحد أو أكثر، يفضل من بديل واحد

إلى خمسة بدائل، والأفضل من بديل واحد إلى ثلاثة بدائل، والأكثر تفضيلاً من بديل واحد إلى

بديلين، تختار كل على حدة من قائمة البدائل.

وبالرجوع إلى البدائل، يقصد بالمصطلح "كل على حدة" أنه في حالة إمكانية استخدام أكثر من بديل واحد من هذا القبيل، يمكن أن تكون هذه البدائل متماثلة أو مختلفة عن بعضها. ويراد أن لا يعتمد تعريف أي بديل أو متغير عند موقع خاص في جزيء على تعريفاته في مكان آخر في ذلك الجزيء. ومن المفهوم أنه يمكن اختيار البدائل والأنماط الاستبدالية المحمولة على مركبات هذا الاختراع من قبل شخص ملم في التقنية لتزويد مركبات ثابتة كيميائياً ويمكن تخليقها بسهولة بواسطة طرق معروفة في التقنية بالإضافة إلى تلك الطرق المبينة في هذا البيان.

وسمّيت المركبات النموذجية في الاختراع الراهن وفقاً لتسمية معروفة جيداً في التقنية، إما باستخدام نسخة أوتونوم ٢.٢ (Autom version 2.2) (صنف من برامجيات التسمية مزود بالاسم التجاري كيم درو ألترا (ChemDraw Ultra) (علامة تجارية مسجلة) ٧.٧ صفر. ١ أوفيس سوت تسوقه شركة كامبردج سوفت كومباني (Cambridge Soft.Com).

وفيما يلي إشارة إلى الاختصارات المستخدمة في هذا الوصف، وبصفة خاصة في المخططات والأمثلة:

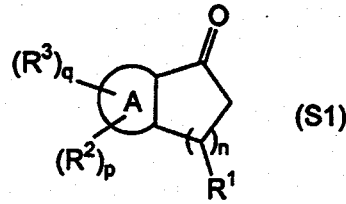
ATP	= ثالث فسفات الأدينوزين
DBU	= ٢،٢-ديازا أنديكان ثنائي حلقي
DCM	= ثاني كلوروميثان
DME	= ثاني ميثوكسي إيثيلين
DMF	= N,N-ثاني ميثيل فورماميد
DMSO	= كبريتوكسيد ثاني ميثيل
DTT	= ثاني ثيو ثريبتول
EtOAc	= أسيتات إيثيل
HPLC	= استشراب بسائل عالي الضغط
iprOH	= كحول إيزوبروبيل
MeOH	= ميثانول
PBS	= محلول ملحي منظم بالفسفات

PLC	= فسفوليبياز جـ
RAR	= حلقة أورطية لجرذ
SMGS	= إضافات لنمو عضلة ملساء
TFA	= حمض ثالث فلورو أسيتيك
THF	= رابع هيدرو فوران
TLC	= استشراب على طبقة رقيقة
٥	تريس-HCl أو تريس-CI = هيدروكلوريد ثلاثي [هيدوركسي مثيل] أمينو مثيل
UDP	= ثاني فسفات اليوريدين
عـ	= عادي
١٠ ثن	= ثانوي
ثث	= ثالثي
ق	= قويم (مركب يحرف الضوء باتجاه حركة عقارب الساعة)
ع	= عسير (مركب يحرف الضوء باتجاه معاكس لعقارب الساعة)
ي	= يسر (مركب يحرف الضوء باتجاه اليسار)
١٥ HEPES	= N-[هيدروكسي-إثيل]-بيرازيل-N'-[حمض-٢-إيثان
	كبريتونيك]
	وفي أطيايف الرنين النووي المغنطيسي (رن م) ستستعمل الرموز التالية: ف= طيف
	مفرد، ز= طيف مزدوج، ث= طيف ثلاثي، ر= طيف رباعي عـ= طيف متعدد، ص=
	الصيغة الجزيئية.
٢٠	وفي مقياس طيف الكتلة (ط ك) يستخدم الرمز ك/ش ليدل على الكتلة/شحنة
	الجزيء.
	ويمكن تحضير المركبات وفقاً للاختراع الراهن بأي عدد من العمليات كما وصفت
	بوجه عام أدناه وعلى وجه التخصيص كما وصفت في الأمثلة التالية في هذا البيان.
	وأثناء أي من عمليات تحضير المركبات وفقاً للاختراع الراهن الموصوفة في هذا
٢٥	البيان، قد يكون من الضروري و/أو المرغوب وقاية المجموعات الحساسة أو المتفاعلة

المحمولة على أي من الجزيئات المعنية (على سبيل المثال مجموعات هيدروكسي، أمينو، ثيو، أكسو أو كربوكسي). ويمكن تحقيق هذا باستخدام مجموعات واقية تقليدية، مثل تلك الموصوفة في كتاب بعنوان مجموعات واقية في الكيمياء العضوية للمحرر جيه. إف. دبليو. مكومي، بلنيوم بريس، ١٩٧٣م؛ وفيما جاء عن تي. دبليو. جرين وبي. جي. إم. ووتس في كتاب بعنوان مجموعات واقية في التخليق الكيميائي، جون وايلي آند سنز، ١٩٩١م. ويمكن إزالة المجموعات الواقية في مرحلة لاحقة ملائمة باستخدام طرق معروفة في التقنية.

طرق التخليق

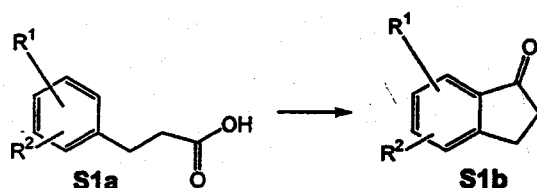
تشمل طرق تخليق المركبات وفقاً للاختراع الراهن، على سبيل المثال لا الحصر، الطرق الموصوفة أدناه. وتكون المواد الأولية المستخدمة في الطرق أ مروراً بـ هـ بوجه عام عبارة عن كيتونات أولية بالصيغة (S1)



حيث R^1 ، R^2 ، R^3 ، p ، q و n كما وصفوا في هذا البيان للمركبات بالصيغة (I)، وتكون المركبات بالصيغة (S1) إما مركبات معروفة أو متوفرة تجارياً أو مركبات يمكن تحضيرها من مركبات معروفة بواسطة تجارب كيميائية معروفة.

ويمكن تحضير كيتونات عطرية بواسطة تفاعل فريدل-كرافتس (انظر ما جاء عن فوجيل في مجلة الكيمياء العضوية التطبيقية (براكتيكال أورجانيك كيمستري)، الطبعة الثالثة، ص ٧٢٤-٧٤٩). فعلى سبيل المثال، سينتج عن إجراء أسيلة وفقاً لفريدل-كرافتس لأحماض أريل بروبانويك تحمل بدائل بالصيغة (S1a) أو مشتقاتها مركبات اندانون (١) تحمل بدائل بالصيغة (S1b)، كما وصف في النشرة العلمية. وبشكل مماثل، سينتج عن إجراء أسيلة وفقاً لفريدل-كرافتس لأحماض أريل بيوتانويك تحمل بدائل أو مشتقاتها مركبات ألفا-تترالون تحمل بدائل (انظر، على سبيل المثال، ما جاء عن إنش. تشو ومعاونيه في مجلة المركبات الحلقية

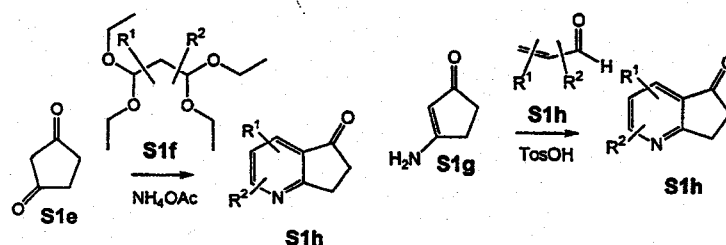
المخلطة (هتيروسايلكلز، مجلد ٤٣، العدد (١)، ص ١٢٧-١٣١، (١٩٩٦م)؛ وما جاء عن باديلي ومعاونيه في مجلة الجمعية الكيميائية (كيميكال سوسيتي)، ص ٤٦٤٧، (١٩٥٦م)؛ وما جاء عن ريف ومعاونيه في مجلة الجمعية الكيميائية الأمريكية (جورنال أف أميركان كيميكال سوسيتي)، مجلد ٧٣، ص ١٣٧١، (١٩٥١م)).



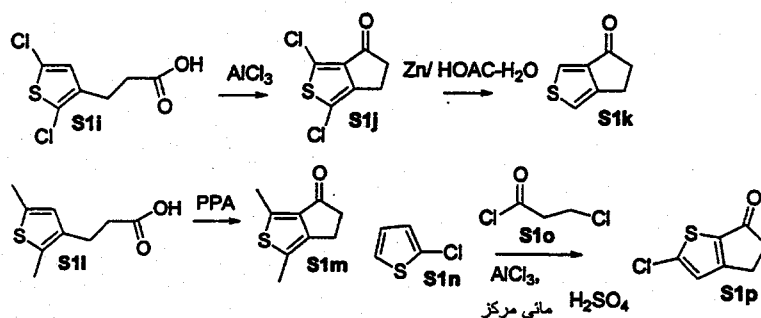
كما يمكن تحضير كيتونات أولية بالصيغة (S1b) بأكسدة الكحولات المقابلة بالصيغة (S1c) أو ألكانات بالصيغة (S1d) باستخدام عوامل أكسدة معروفة مختلفة (انظر، على سبيل المثال، ما جاء عن ماندال ومعاونيه في مجلة تتراهيدرون لترز، مجلد ٣٧، العدد (٢١)، ص ٣٧٦٩-٣٧٧٢، (١٩٩٦م)؛ وما جاء عن اشيهارا ومعاونيه في مجلة الكيمياء العضوية (أورجانك كيمستري)، مجلد ٦٢، العدد (١٧)، ص ٥٦٦٤-٥٦٦٥، (١٩٩٧م)).



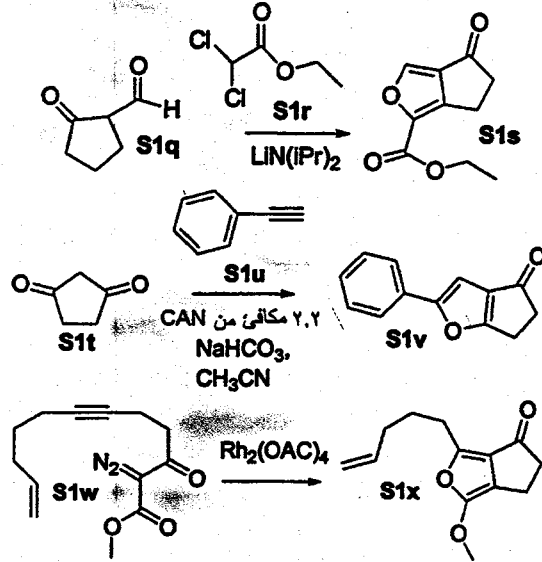
ويمكن تحضير مركبات بيريديل أريل مخلط كيتون أولية بتكثيف مركبات ديون (مركبات تحتوي على مجموعتين كيتونيتين) بالصيغة (S1e) أو مركبات إنامينون (مركبات أمينية تحتوي على رابطة مزدوجة ومجموعة كيتونية) بالصيغة (S1g) باستخدام مركبات بروبان ثاني كيتال بالصيغة (S1f) أو مركبات بروبين ألدهيد بالصيغة (S1h)، بالترتيب (انظر، على سبيل المثال، ما جاء عن هوانج ومعاونيه في مجلة مجموعة التخليق (سنثيتيك كوميونتي) مجلد ٢٨، العدد (٧)، ص ١١٩٧-١٢٠٠، (١٩٩٨م)؛ وما جاء عن ريمان ومعاونيه في مجلة علم الصيدلية (فارماتري)، مجلد ٥٠، العدد (٩)، ص ٥٨٩-٥٩٢، (١٩٩٥م)).



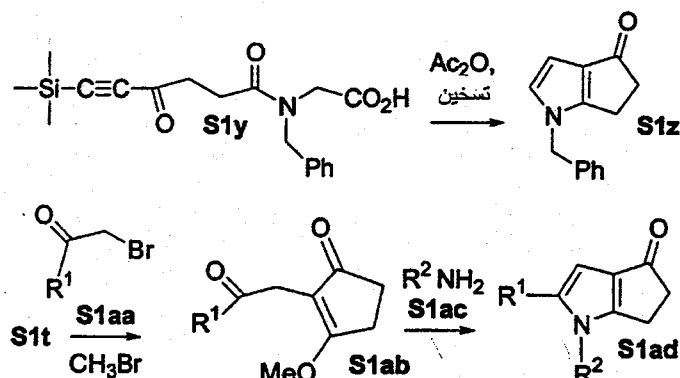
ويمكن تحضير مركبات ثيينيل أريل مخلط كيتون أولية بإجراء أسيلة وفقاً لفريدل-كرافتس لأحماض أريل مخلط بروبانويك باستخدام كلوريد ألومنيوم، حمض متعدد فسفوريك أو حمض ثالث فلورو أسيتيك.. إلخ لإنتاج الكيتونات الحلقية. (انظر، على سبيل المثال، ما جاء عن كانتريل ومعاونيه في مجلة تتراهيدرون لترز، ص ٤٤٧٧، (١٩٦٧م)؛ وما جاء عن مورارو ومعاونيه في مجلة جلسات أكاديمية العلوم الأسبوعية التشريعية (كونسيلور هيدرومادال سينسيز أكاديميك سينس) مجلد ٢٧٣، ص ١٣٦٢ (١٩٧١م)؛ وما جاء عن ماكودويل ومعاونيه في مجلة الكيمياء العضوية، مجلد ٣٢، ص ١٢٢٦، (١٩٦٧م)؛ وما جاء عن بايندر ومعاونيه في مجلة كيمياء موناتش (Monatsh) كميستري، مجلد ١٢٩، العدد (٨)، ص ٨٨٧-٨٩٦، (١٩٩٨م)).



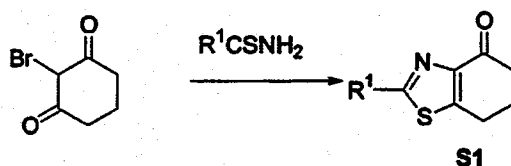
كما يمكن تحضير مركبات فورانيل أريل مخلط كيتون أولية بالصيغة (S1) وفقاً لإجراءات موصوفة فيما جاء عن كراوس ومعاونيه في مجلة رسائل في علم التخليق (سنثيسيز لترز)، مجلد ١١، ص ١٢٥٩-١٢٦٠ (١٩٧٧م)؛ وما جاء عن هوي ومعاونيه في مجلة الكيمياء العضوية، مجلد ٥٥، العدد (١٥)، ص ٤٥١٨، (١٩٩٠م)؛ وما جاء عن لي ومعاونيه في مجلة نشرة الجمعية الكيميائية الكورية (بوليتين كوريان كيميكال سوسيتي)، مجلد ١٩، العدد (١٠)، ص ١٠٨٠-١٠٨٣، (١٩٩٨م).



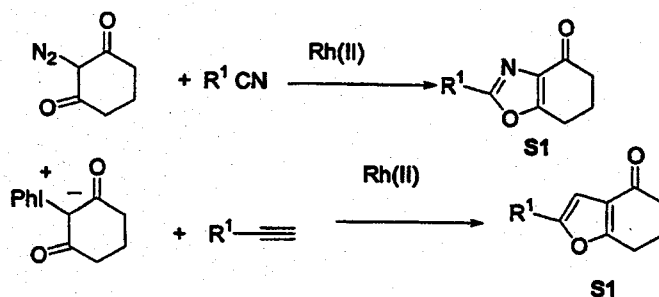
ويمكن تحضير مركبات بيروليل كيتون أولية بواسطة تفاعل إضافة حلقة داخل
 الجزيئات لمركبات أزو ميثيد يلبد باستخدام مركبات ألكاين مرتبطة كما هو مبين أدناه (انظر
 ما جاء عن نيار ومعاونيه في مجلة الكيمياء العضوية، مجلد ٦٢، العدد (٤)، ٩٨٢-٩٩١،
 (١٩٩٧م)). وبشكل بديل، يمكن تحضير مركبات بيرول كيتون الأولية من كيتونات ثنائية
 بالتفاعل مع مركبات ألفا-بروموكيتون أو مركبات ألفا-بروموبيروفات ثم بإجراء تفاعل تشكيل
 حلقة وفقاً لـ بال-كنور باستخدام أمينات تحمل بدائل بشكل ملائم (انظر، على سبيل المثال،
 ما جاء عن ستوجانوفيك ومعاونيه في مجلة الجمعية الكيميائية المصرية (جورنال أف صربيان
 كيميكال سوسيتي)، مجلد ٦٢، العدد (٩)، ص ٧٤٩-٧٥٣٠، (١٩٩٧م)).



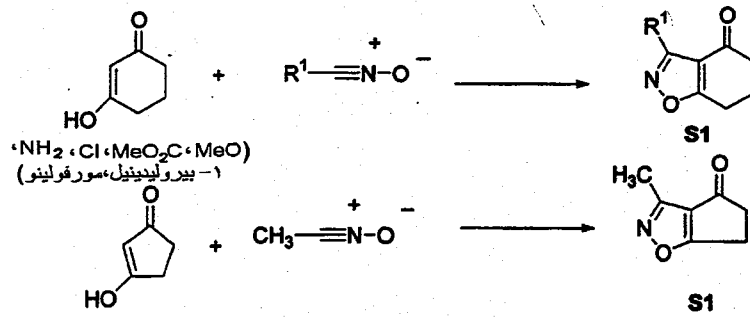
ويمكن تحضير مركبات ثيازوليل أريل مخطط كيتون بواسطة تكثيف مركبات بروموكيتون باستخدام مركبات ثيو أسيتاميد كما وصف فيما جاء عن ميلارد ومعاونيه في المجلة الأوروبية للعلاج الكيميائي والطبي (يوروبيان جورنال أف ميديكال آندي كيميكال ثيرابي)، مجلد ١٩، العدد (٥)، ص ٤٥١، (١٩٨٤م).



ويمكن تحضير مركبات أكسازول كيتون ومركبات فورانيل كيتون بواسطة تفاعلات محفزة بالروديوم لإضافة حلقات لمركبات ألفا-ديازو-ثاني كيتون باستخدام مركبات نتريل أو أسيتيلين. وبشكل مماثل، يمكن أن تخضع مركبات يليد يودونيوم لتفاعل إضافة حلقة حراري محفز بـ $Rh_2(OAc)_4$ عند الموقعين ٢ و ٣ باستخدام مركبات الأسيتيلين والنتريل لتشكيل مركبات الفوران والأكسازول المقابلة، بالترتيب. (انظر، على سبيل المثال، ما جاء عن لي ومعاونيه في مجلة المركبات الحلقية المخاطة، مجلد ٤٨، العدد (٥)، ص ٨٧٥-٨٨٣، (١٩٩٨م)؛ وما جاء عن جوجوناز ومعاونيه في مجلة تتراهدرون لترز، مجلد ٤١، العدد (٤٨)، ص ٩٢٩٩-٩٣٠٣، (٢٠٠٠م)).



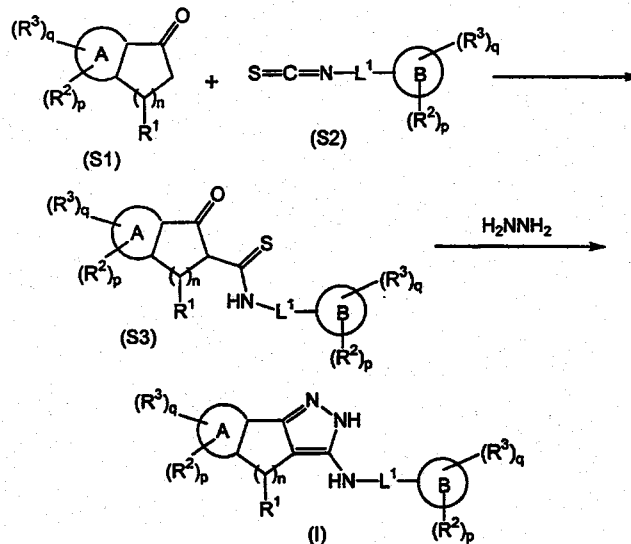
ويمكن تحضير مركبات أيزوكسازول كيتون أولية بإضافة حلقة لمركبات N-أكسيد باستخدام مركبات ثنائية الكيتون أو إينون حلقية في خطوة تفاعل واحدة كما هو مبين أدناه (انظر، على سبيل المثال، ما جاء عن أكريم ومعاونيه في مجلة كيمياء المركبات الحلقية المخلطة السويدية (Khim.Geterotsikl.Soedin)، مجلد ٧، ص ٩٠١-٩٠٤، (١٩٧٤م)؛ وما جاء عن أكريم ومعاونيه في مجلة التخليق (سنثيسيز)، مجلد ١، ص ٤٣، (١٩٧٨م)).



وسيدرك متمرس في التقنية أنه لتحضير المركبات وفقاً للاختراع الراهن، تكون المواد الأولية، أي، المركبات بالصيغة (S1)، سابقة الذكر عبارة عن مركبات معروفة أو مركبات يمكن تحضيرها وفقاً لطرق معروفة، على سبيل المثال، كما وصف أعلاه. وتكون المركبات الأولية بالصيغة (S1) حيث n يختار من عدد يتراوح من ٢ إلى ٤، عبارة عن مركبات معروفة بشكل مماثل أو يمكن تحضيرها بشكل مماثل وفقاً لطرق معروفة أو بإجراء تعديل على الطرق التمثيلية المشار إليها أعلاه.

الطريقة أ

يمكن تحضير المركبات بالصيغة (I) وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة أ.

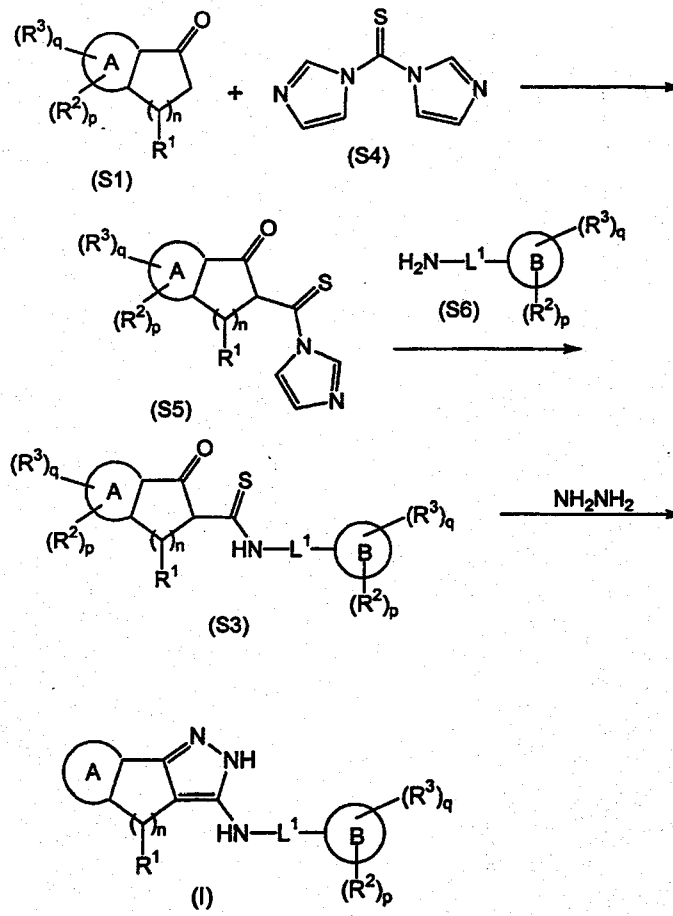


- وعليه، يُفاعل مركب بالصيغة (S1)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، مع مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (S2)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، عند درجة حرارة في المدى من حوالي -٧٨°م إلى حوالي ١٠٠°م، في مذيب عضوي لا بروتوني مثل THF، ديوكسان، DMF وما شابه ذلك، في وجود قاعدة مثل ثنائي (ثالث مثيل سيليل) أميد الليثيوم، ثنائي (ثالث مثيل سيليل) أميد الصوديوم، ثاني أيزوبروبيل أميد الليثيوم وما شابه ذلك، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (S3).
- ويُفاعل المركب بالصيغة (S3) مع الهيدرازين، ويفضل في وجود حوالي ١ مكافئ من حمض مثل حمض الأسيتيك، حمض الهيدروكلوريك وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة، ويفضل عند حوالي درجة حرارة الترجيع، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (I).
- ولقد وصفت أمثلة لتفاعل تشكيل حلقة من بيتا-كيتوثيوأميد (المركب بالصيغة S3 إلى المركب بالصيغة I) باستخدام هيدرازين يشكّل مركبات أنيلينو بيرازول مماثلة لتلك الموصوفة في الخطوة الثانية من الطريقة أعلاه، في النشرة العلمية (انظر، على سبيل المثال، ما جاء عن إم. سويس وإس. جون في مجلة الكيمياء التطبيقية (جورنال أف براكتيكال كيمستري)، مجلد ٣٢٨، العدد (٤)، ص ٦٣٥-٦٣٩، (١٩٨٦م)). كما توصف بعض مركبات كيتوثيوأميد في النشرات العلمية، وعلى سبيل المثال، انظر ما جاء عن ويزولوسكا ومعاونيه في المجلة الكيميائية البولندية (بولنديان جورنال أف كيمستري)، مجلد ٧٥، العدد (٣)، ص ٣٨٧-٤٠٠، (٢٠٠١م)؛ وما جاء عن هانسن ومعاونيه في مجلة البنيات الجزيئية (مولكيولار ستركتشرز)، مجلد ٣٧٨، العدد (١)، ص ٤٥-٥٩، (١٩٩٦م)؛ وما جاء عن أوجوستين ومعاونيه في مجلة الكيمياء التطبيقية، مجلد ٣٢١، العدد (٢)، ص ٢٠٥-٢١٤، (١٩٧٩م)؛ وما جاء عن سكوين ومعاونيه في مجلة Rocz.Chem، مجلد ٤٥، العدد (١)، ص ٦٠-٧٣، (١٩٧١م).

الطريقة ب

يمكن تحضير المركبات بالصيغة (I) بشكل بديل وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة

ب.



وعليه، يُفاعل مركب بالصيغة (S1)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، مع مركب بالصيغة (S4) (١،١'-ثيوكربونيل ثاني إيميدازول)، عند درجة حرارة منخفضة في المدى من حوالي -٧٨°م إلى حوالي درجة الصفر المئوي، في مذيب عضوي لا بروتوني مثل THF، ديوكسان، DMF وما شابه ذلك، في وجود قاعدة قوية مثل هيدريد الصوديوم، ثنائي (ثالث ميثيل سيليل) أميد الليثيوم، ثنائي (ثالث ميثيل سيليل) أميد الصوديوم، ثاني أيزوبروبيل أميد الليثيوم وما شابه ذلك، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (S5).

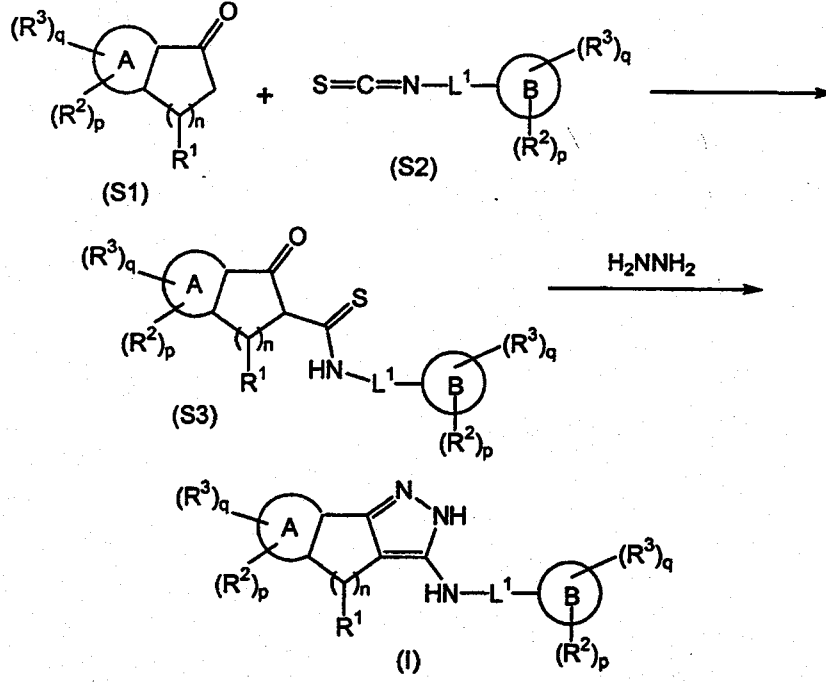
ويُفاعل المركب بالصيغة (S5) مع مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (S6)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، في مذيب عضوي لا بروتوني مثل THF، ديوكسان، كلوريد ميثيلين، كلوروفورم، DMF وما شابه ذلك، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (S3).

ويُفاعل المركب بالصيغة (S3) مع الهيدرازين، ويفضل في وجود حوالي ١ مكافئ من حمض مثل حمض الأسيتيك، حمض الهيدروكلوريك وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة، ويفضل عند حوالي درجة حرارة الترجيع، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (I). ويوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو عملية لتحضير مركب بالصيغة (I)، كما وصفت بتفصيل أوفى في الطريقة ب أعلاه. وفي أحد تجسيدات الاختراع الراهن يتعلق الاختراع بعملية لتحضير مركب بالصيغة (S5)، باستخدام الطريقة ب أعلاه. وفي تجسيد آخر يتعلق الاختراع بعملية لتحضير مركب بالصيغة (S3)، باستخدام العملية الموصوفة في الطريقة ب أعلاه.

الطريقة جـ

يمكن تحضير المركبات بالصيغة (I) بشكل بديل وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة

→



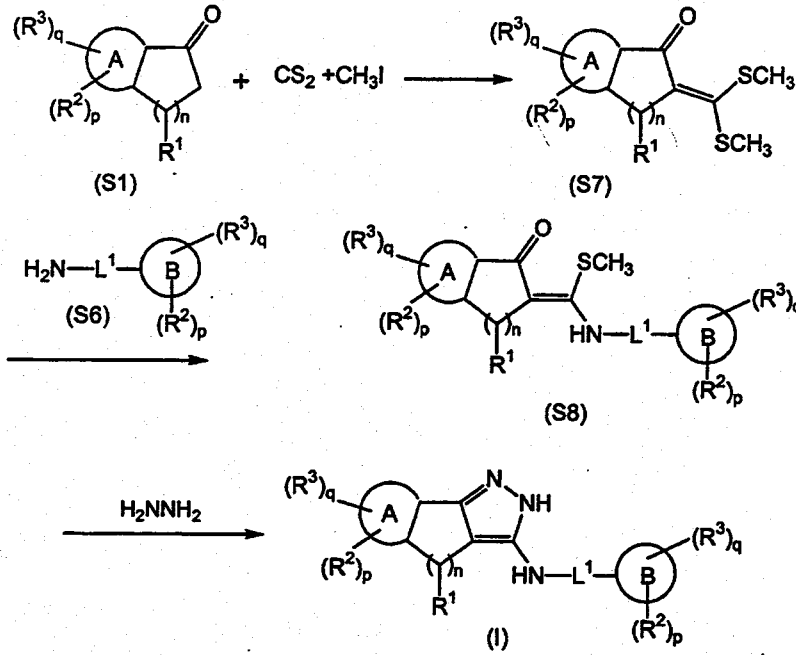
وعلى وجه التحديد، يُفاعل المركب بالصيغة (S1)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، مع مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (S2)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، عند درجة حرارة في المدى من حوالي درجة الصفر المئوي إلى حوالي ١٢٠°م، في مذيب عضوي لا بروتوني مثل THF، DMF وما شابه ذلك، في وجود هيدريد الصوديوم لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (S3).

ويُفاعل المركب بالصيغة (S3) مع الهيدرازين، ويفضل في وجود حوالي ١ مكافئ من حمض مثل حمض الأسيتيك، حمض الهيدروكلوريك وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة، ويفضل عند حوالي درجة حرارة الترجيع، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (I).

الطريقة د

يمكن تحضير المركبات بالصيغة (I) بشكل بديل وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة

د.



وعليه، يُفاعل مركب بالصيغة (S1)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، مع ثاني كبريتيد الكربون ويوديد الميثيل، في وجود قاعدة مثل هيدريد الصوديوم، ثنائي (ثالث ميثيل سيليل) أميد الليثيوم، ثنائي (ثالث ميثيل سيليل) أميد الصوديوم، ثنائي أيزوبروبيل أميد الليثيوم وما شابه ذلك، في مذيب عضوي لا بروتوني مثل THF، DMF وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة في المدى من حوالي ٢٥ م° إلى حوالي ١٠٠ م°، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (S7). وتعرف بعض المركبات بالصيغة (S7)، على سبيل المثال كما وصفت فيما جاء عن فيليمين ومعاونيه في مجلة التخليق، مجلد ٤، ص ٣٠١-٣٠٣، (١٩٩١م)؛ وما جاء عن أوجوستين في مجلة الكيمياء التطبيقية، مجلد ٣٢١، العدد (٢)، ص ٢١٥-٢٢٥، (١٩٧٩م)؛ وما جاء في نشرة براءة الاختراع الدولية رقم ٩٥/٠٧٨٩٣ وفقاً للمنظمة العالمية للملكية الفكرية (WIPO).

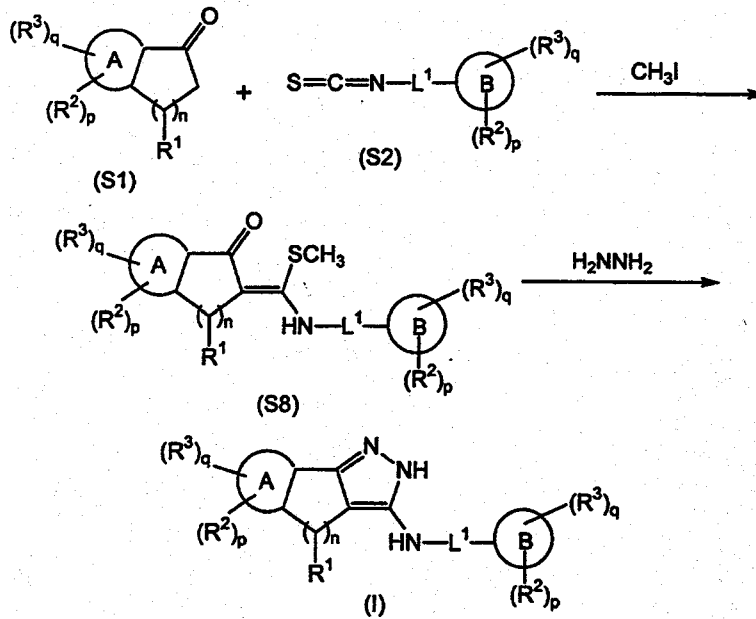
ويُفاعل المركب بالصيغة (S7) مع مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (S6)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، في مذيب عضوي لا بروتوني مثل DMF، THF وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة في المدى من حوالي ٢٥° م إلى حوالي ١٥٠° م، في وجود مقدار حفزي من حمض مثل حمض الأسيتيك، حمض الكبريتيك، حمض بارا-تولوين كبريتونيك وما شابه ذلك، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (S8).

ويُفاعل المركب بالصيغة (S8) مع الهيدرازين، ويفضل في وجود حوالي ١ مكافئ من حمض مثل حمض الأسيتيك، حمض الهيدروكلوريك وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة، ويفضل عند حوالي درجة حرارة التزجيج، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (I).

الطريقة هـ

يمكن تحضير المركبات بالصيغة (I) بشكل بديل وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة

هـ.



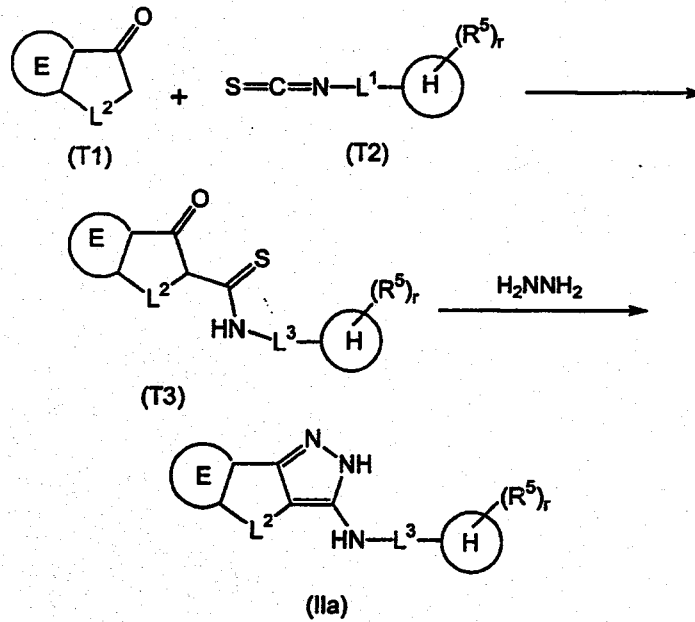
وعليه، يُفاعل مركب بالصيغة (S1)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، مع مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (S2)، وهو مركب معروف أو

مركب يحضر بطرق معروفة، في وجود يوديد الميثيل وقاعدة مثل DBU، NaH، ثنائي (ثالث ميثيل سيليل) أميد الليثيوم، ثنائي (ثالث ميثيل سيليل) أميد الصوديوم، ثاني أيزوبروبيل أميد الليثيوم وما شابه ذلك، في مذيب عضوي لا بروتوني مثل أسيتونتريل، THF، DMF وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة في المدى من حوالي درجة الصفر المئوي إلى حوالي ١٠٠° م، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (S8).

ويُفاعل المركب بالصيغة (S8) مع الهيدرازين، ويفضل في وجود حوالي ١ مكافئ من حمض مثل حمض الأسيتيك، حمض الهيدروكلوريك وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة، ويفضل عند حوالي درجة حرارة التزجيج، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (I).

الطريقة و

يمكن تحضير المركبات بالصيغة (II)، وتحديدًا المركبات بالصيغة البنوية (IIa)، وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة و.



وعليه، يُفاعل مركب بالصيغة (T1)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، مع مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (T2)، وهو مركب معروف أو

مركب يحضر بطرق معروفة، عند درجة حرارة في المدى من حوالي -٧٨° م إلى حوالي ١٠٠° م، في مذيب عضوي لا بروتوني مثل THF، ديوكسان، DMF وما شابه ذلك، في وجود قاعدة مثل ثنائي (ثالث مثيل سيليل) أميد الليثيوم، ثنائي (ثالث مثيل سيليل) أميد الصوديوم، ثنائي أيزوبروبيل أميد الليثيوم وما شابه ذلك، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (T3).

كما يمكن تحضير المركب بالصيغة (T1) حيث L2 يحتوي على ذرة أكسجين، كبريت أو نتروجين بطرق معروفة (انظر، على سبيل المثال، ما جاء عن إيه. آر. ديشباند ومعاونيه في مجلة اتصالات تخليقية (سنثيتيك كميونيكشنز)، مجلد ٢٠، العدد (٦)، ص ٨٠٩-٨١٦، (١٩٩٠م)؛ وما جاء عن دبليو-إس. لي ومعاونيه في مجلة نتراهدرون لترز، مجلد ٤٣، ص ١٩٢٣-١٩٢٥، (٢٠٠٢م)؛ وما جاء عن سي. بريان ومعاونيه في مجلة نتراهدرون، مجلد ٤٣، العدد (١)، ص ٦٩-٧٦، (١٩٨٧م)؛ وما جاء عن آتش ونفويد ومعاونيه في مجلة الكيمياء، مجلد ١٠، العدد (٩)، ص ٣٤٣، (١٩٧٠م)؛ وما جاء عن سي. موكرجي ومعاونيه في مجلة رسائل في علم التخليق، مجلد ٢، ص ٣٢٥-٣٢٧، (٢٠٠٢م)؛ وما جاء عن تي. سوجاساوا ومعاونيه في مجلة الكيمياء العضوية، مجلد ٤٤، العدد (٤)، ص ٥٧٨-٥٨٦، إس، (١٩٧٩م)؛ وما جاء عن توري ومعاونيه في مجلة الكيمياء العضوية، مجلد ٤٣، العدد (١٤)، ص ٢٨٨٢-٢٨٨٥، (١٩٧٨م)).

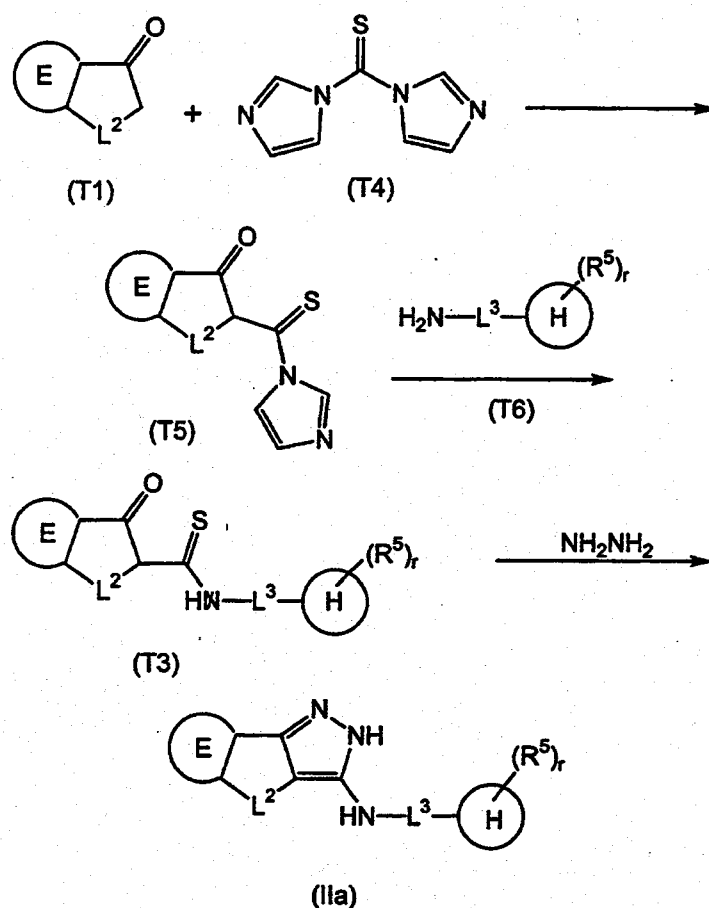
ويُفاعل المركب بالصيغة (T3) مع الهيدرازين، ويفضل في وجود حوالي ١ مكافئ من حمض مثل حمض الأسيتيك، حمض الهيدروكلوريك وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة، ويفضل عند حوالي درجة حرارة الترجيع، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (IIa).

ولقد وصفت أمثلة لتفاعل تشكيل حلقة من بيتا-كينوثيوأميد (المركب بالصيغة T3 إلى المركب بالصيغة IIa) باستخدام هيدرازين يشكّل مركبات أنيلينو بيرازول مماثلة لتلك الموصوفة في الخطوة الثانية من الطريقة و أعلاه، في النشرة العلمية (انظر، على سبيل المثال، ما جاء عن إم. سويس وإس. جون في مجلة الكيمياء التطبيقية، مجلد ٣٢٨، العدد (٤)، ص ٦٣٥-٣٦٩، (١٩٨٦م)). كما توصف بعض مركبات كينوثيوأميد في النشرات العلمية، وعلى سبيل المثال، انظر ما جاء عن ويزولوسكا ومعاونيه في المجلة الكيميائية البولندية، مجلد ٧٥، العدد (٣)، ص ٣٨٧-٤٠٠، (٢٠٠١م)؛ وما جاء عن هانسن ومعاونيه في مجلة

البنيات الجزيئية، مجلد ٣٧٨، العدد (١)، ص ٤٥-٥٩، (١٩٩٦م)؛ وما جاء عن أوجوستين ومعاونيه في مجلة الكيمياء التطبيقية، مجلد ٣٢١، العدد (٢)، ص ٢٠٥-٢١٤، (١٩٧٩م)؛ وما جاء عن سكويين ومعاونيه في مجلة Rocz.Chem.، مجلد ٤٥، العدد (١)، ص ٦٠-٧٣، (١٩٧١م).

الطريقة ز

يمكن تحضير المركبات بالصيغة (II)، وتحديداً المركبات بالصيغة البنيوية (IIa) بشكل بديل وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة ز.



وعليه، يُفاعل مركب بالصيغة (T1)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، مع مركب بالصيغة (T4) (١،١'-ثيوكربونيل ثاني إيميدازول)، عند درجة

حرارة منخفضة في المدى من حوالي -٧٨°م إلى حوالي درجة الصفر المئوي، في مذيب عضوي لا بروتوني مثل THF، ديوكسان، DMF وما شابه ذلك، في وجود قاعدة قوية مثل هيدريد الصوديوم، ثنائي (ثالث مثيل سيليل) أميد الليثيوم، ثنائي (ثالث مثيل سيليل) أميد الصوديوم، ثاني أيزوبروبيل أميد الليثيوم وما شابه ذلك، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (T5).

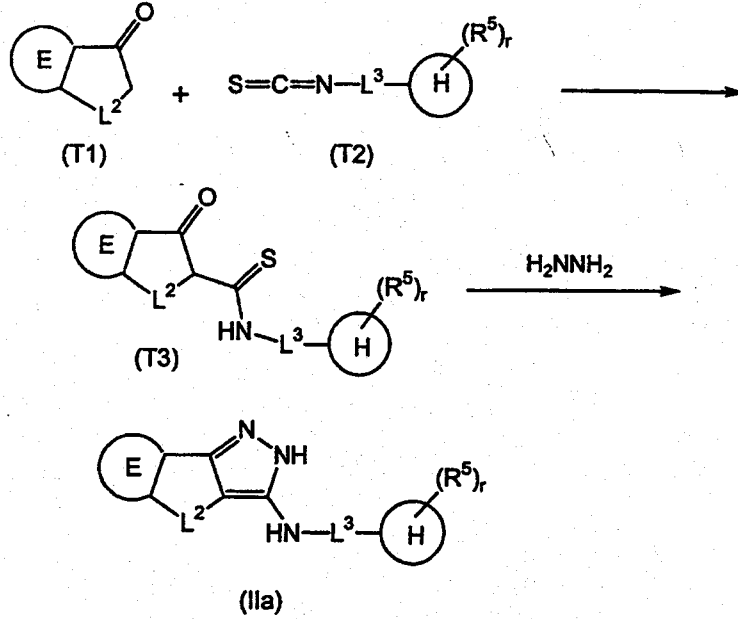
ويُفاعل المركب بالصيغة (T5) مع مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (T6)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، في مذيب عضوي لا بروتوني مثل THF، ديوكسان، كلوريد ميثيلين، كلوروفورم، DMF وما شابه ذلك، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (T3).

ويُفاعل المركب بالصيغة (T3) مع الهيدرازين، ويفضل في وجود حوالي ١ مكافئ من حمض مثل حمض الأسيتيك، حمض الهيدروكلوريك وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة، ويفضل عند حوالي درجة حرارة الترجيع، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (IIa).

ويوجه الاختراع الراهن أيضاً نحو عملية لتحضير مركب بالصيغة (IIa)، كما وصفت بتفصيل أوفى في الطريقة ز أعلاه. وفي أحد تجسيدات الاختراع الراهن يتعلق الاختراع بعملية لتحضير مركب بالصيغة (T5)، باستخدام الطريقة ز أعلاه. وفي تجسيد آخر يتعلق الاختراع بعملية لتحضير مركب بالصيغة (T3)، باستخدام العملية الموصوفة في الطريقة ز أعلاه.

الطريقة ح

يمكن تحضير المركبات بالصيغة (II)، وتحديدًا المركبات بالصيغة البنيوية (IIa)، بشكل بديل وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة ح.

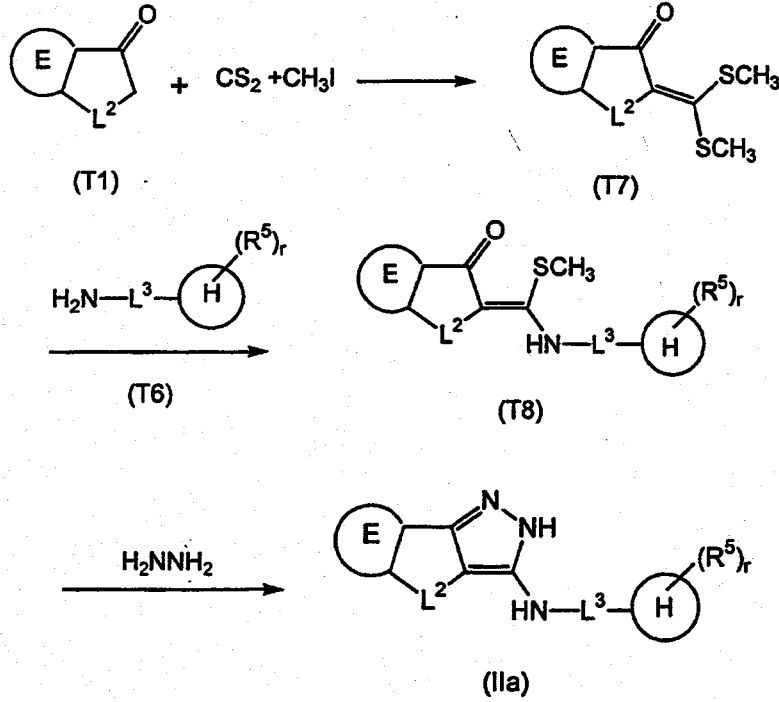


وعلى وجه التحديد، يُفاعل المركب بالصيغة (T1)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، مع مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (T2)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، عند درجة حرارة في المدى من حوالي درجة الصفر المئوي إلى حوالي ١٢٠°م، في مذيب عضوي لا بروتوني مثل THF، DMF وما شابه ذلك، في وجود هيدريد الصوديوم لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (T3).

ويُفاعل المركب بالصيغة (T3) مع الهيدرازين، ويفضل في وجود حوالي ١ مكافئ من حمض مثل حمض الأسيتيك، حمض الهيدروكلوريك وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة، ويفضل عند حوالي درجة حرارة الترجيع، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (IIa).

الطريقة ط

يمكن تحضير المركبات بالصيغة (II)، وتحديدًا المركبات بالصيغة البنائية (IIa)، بشكل بديل وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة ط.



وعليه، يُفاعل مركب بالصيغة (T1)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، مع ثاني كبريتيد الكربون ويوديد الميثيل، في وجود قاعدة مثل هيدريد الصوديوم، ثنائي (ثالث ميثيل سيليل) أميد الليثيوم، ثنائي (ثالث ميثيل سيليل) أميد الصوديوم، ثاني أيزوبروبيل أميد الليثيوم وما شابه ذلك، في مذيب عضوي لا بروتوني مثل THF، DMF، وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة في المدى من حوالي ٢٥°م إلى حوالي ١٠٠°م، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (T7).

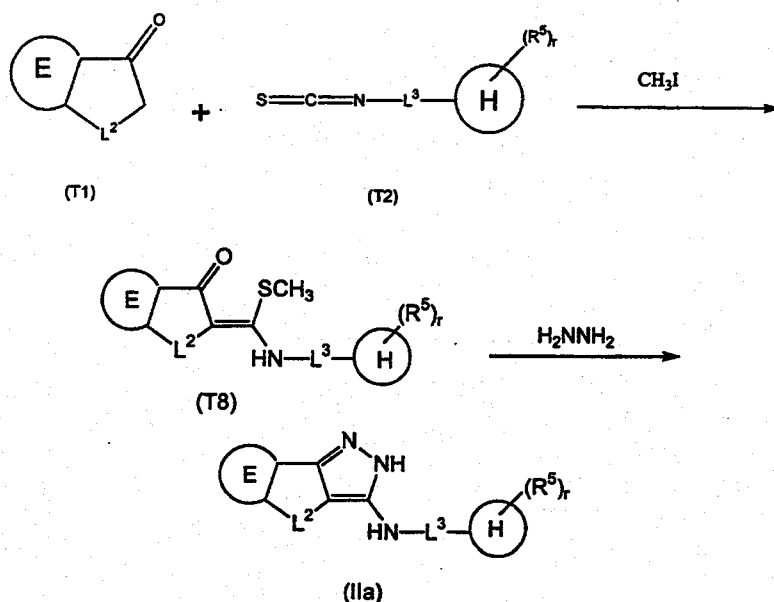
ويُفاعل المركب بالصيغة (T7) مع مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (T6)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، في مذيب عضوي لا بروتوني مثل THF، DMF، وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة في المدى من حوالي ٢٥°م إلى حوالي

١٥٠ م، في وجود مقدار حفزي من حمض مثل حمض الأسيتيك، حمض الكبريتيك، حمض بارا تولوين كبريتونيك وما شابه ذلك، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (T8).

ويُفاعل المركب بالصيغة (T8) مع الهيدرازين، ويفضل في وجود حوالي ١ مكافئ من حمض مثل حمض الأسيتيك، حمض الهيدروكلوريك وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة، ويفضل عند حوالي درجة حرارة الترجيع، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (IIa).

الطريقة ي

يمكن تحضير المركبات بالصيغة (II)، وتحديدًا المركبات بالصيغة البنيوية (IIa)، بشكل بديل وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة ي.



وعليه، يُفاعل مركب بالصيغة (T1)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، مع مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (T2)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، في وجود يوديد الميثيل وقاعدة مثل NaH، DBU، ثنائي (ثالث ميثيل سيليل) أميد الليثيوم، ثنائي (ثالث ميثيل سيليل) أميد الصوديوم، ثاني أيزوبروبيل أميد الليثيوم وما شابه ذلك، في مذيب عضوي لا بروتوني مثل أسيتونتريل، THF، DMF وما شابه

ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة في المدى من حوالي درجة الصفر المئوي إلى حوالي ١٠٠° م، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (T8).

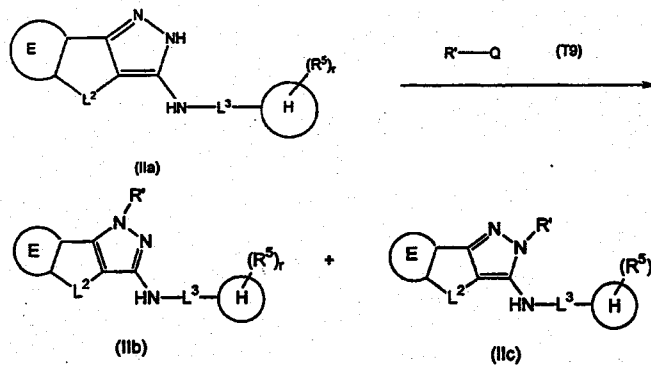
ويُفاعل المركب بالصيغة (T8) مع الهيدرازين، ويفضل في وجود حوالي ١ مكافئ من حمض مثل حمض الأسيتيك، حمض الهيدروكلوريك وما شابه ذلك، عند درجة حرارة مرتفعة، ويفضل عند حوالي درجة حرارة الترجيع، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (IIa).

ويشمل الاختراع الراهن مركبات بالصيغة (II) بحيث يكون R^6 أو R^7 موجوداً ويمثل ذرة غير ذرة الهيدروجين (أي المركبات بالصيغ (IIb)، (IIc)، (IId)، (IIe)، (IIf)، (IIg)، (IIh)، (IIi)، (IIj)، (IIk)، (IIl)، (IIm)، (IIm)، (IIn)، (IIo)، (IIp)، (IIq)، (IIr)، (IIr)، (IIs) كما عرفت بتفصيل أوفى أدناه). وتكون المركبات المذكورة عبارة عن عقاقير أولية ممكنة من مركبات بالصيغتين (I) و (II). ويشمل الاختراع الراهن أيضاً عملية لتحضير المركبات المذكورة بالصيغ (IIb)، (IIc)، (IId)، (IIe)، (IIf)، (IIg)، (IIh)، (IIi)، (IIj)، (IIk)، (IIl)، (IIm)، (IIm)، (IIn)، (IIo)، (IIp)، (IIq)، (IIr)، و (IIr).

ويعتقد بأن المركبات بالصيغة (II)، بصفتها عقاقير أولية، حيث يكون R^6 أو R^7 موجوداً ويمثل ذرة غير ذرة الهيدروجين يتم امتصاصها في الجسم الحي ثم تُؤيض أو تحلماً إلى المركبات المقابلة بالصيغة (I) أو (II). كما يمكن أن يكون للمركبات بالصيغة (II) حيث يكون R^6 أو R^7 موجوداً ويمثل ذرة غير ذرة الهيدروجين فعالية حيوية ذاتية مشابهة للمركبات الأصلية بالصيغة (I) و/أو (II).

الطريقة ل

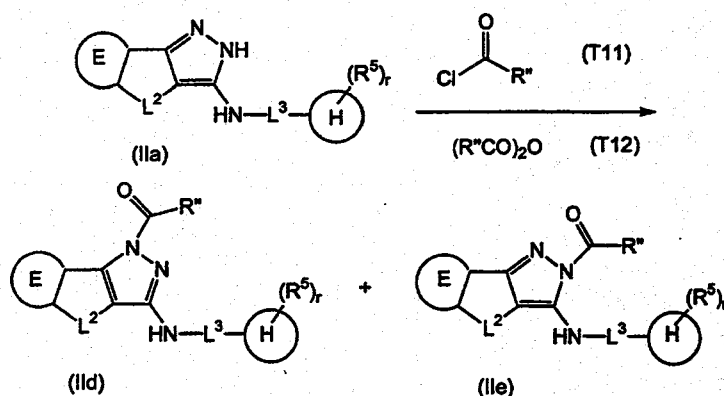
يمكن تحضير المركبات بالصيغتين (IIb) و (IIc) حيث يختار R^6 أو R^7 من الفئة التي تتكون من الفقرة (ج) المتعلقة بوصف المركبات بالصيغة (II) وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة ل.



وعليه، يُفاعل مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (IIa) مع عامل ألكلة يحمل بدائل بشكل ملائم، مركب بالصيغة (T9)، وهو مركب معروف، على سبيل المثال يوديد الميثيل، كبريتات ثاني ميثيل، بيكلات كلورو ميثيل، أكسيد الاثيلين وما شابه ذلك، أو مركب يحضر بواسطة طرق معروفة، على سبيل المثال في صورة هاليد، مسيلات، توسيلات، إيبوكسيد وتريفلات وما شابه ذلك، عند درجة حرارة في المدى من -70°C إلى 100°C ، في مذيب لا بروتوني مثل THF، DMF وما شابه ذلك؛ في وجود قاعدة مثل كربونات البوتاسيوم، كربونات السيزيوم، البيريدين، ثالث اثيل أمين، ثاني أيزوبروبيل اثيل أمين وما شابه ذلك، لإنتاج خليط من الزمرات الموضعية المقابلة، المركبات بالصيغتين (IIb) و (IIc). وتعتمد نسبة الزميرين الموضعيين على القاعدة والمذيب المستخدمين. وبشكل مفضل، يفصل الزميران الموضعيان باستشراب عمودي على هلام السليكا أو استشراب عمودي معكوس الطور لإنتاج مركبات بالصيغتين (IIb) و (IIc).

الطريقة م

يمكن تحضير المركبات بالصيغتين (IIe) و (IId)، حيث يختار R^6 أو R^7 من الفئة التي تتكون من الفقرات (د)، (هـ)، (و)، (ز)، (ح) و (ح ح) المتعلقة بوصف المركبات بالصيغة (II) وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة م.

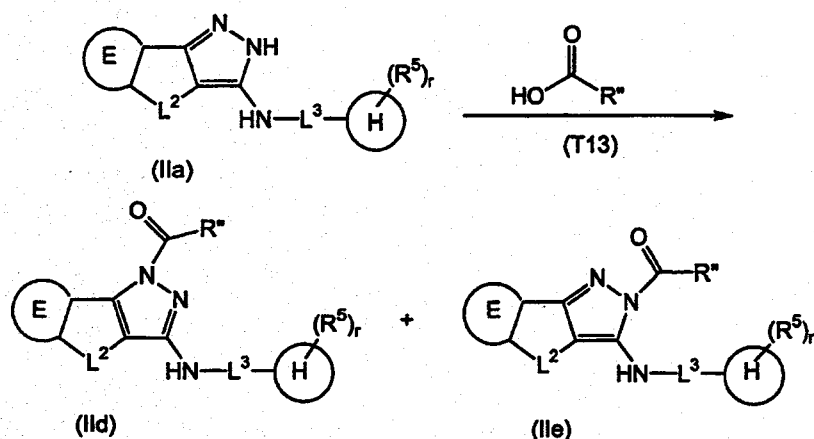


وعليه، يُفاعل مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (IIa) مع عامل أسيلة ملائم، مركب بالصيغة (T11) أو (T12)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق

معروفة، على سبيل المثال، كلوريد الأسيتيل، كلوريد أيزوالبيوتيريل، أنهيدريد السكسينيك، كلوريد مثوكسي الأسيتيل، كلوريد بنزيلوكسي الأسيتيل، كلوريد البنزويل وما شابه ذلك، عند درجة حرارة في المدى بين حوالي -70°C وحوالي 100°C ، في مذيب لا بروتوني مثل THF، DMF، بيريدين وما شابه ذلك، في وجود قاعدة مثل بيريدين، ثالث اثيل أمين، ثاني أيزوبروبيل اثيل أمين وما شابه ذلك، لإنتاج خليط من الزمراء الموضعية المقابلة، مركبات بالصيغتين (IId) و (IIe). وتعتمد نسبة الزميرين الموضعين على القاعدة والمذيب المستخدم. وبشكل مفضل، يفصل الزميران الموضعين باستشراب عمودي على هلام السليكا أو استشراب عمودي معكوس الطور لإنتاج مركبات بالصيغتين (IId) و (IIe).

الطريقة ن

يمكن تحضير المركبات بالصيغتين (IId) و (IIe)، حيث يختار R^6 أو R^7 من الفئة التي تتكون من الفقرات (د)، (هـ)، (و)، (ز)، (ح) و (ح ح) المتعلقة بوصف المركبات بالصيغة (II) بشكل بديل وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة ن.



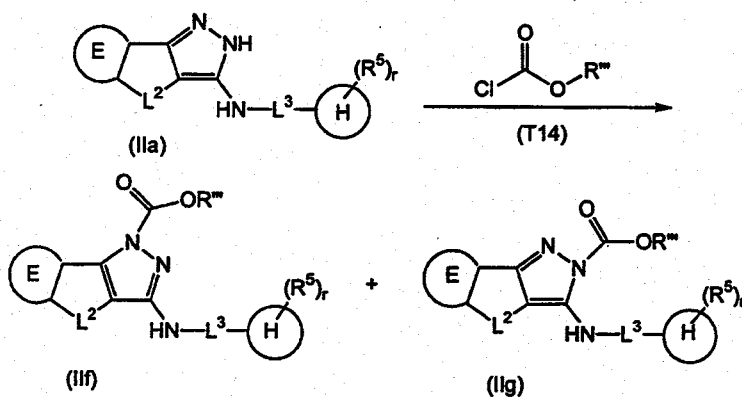
وعليه، يُفاعل مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (IIa) مع حمض كربوكسيليك يحمل بدائل بشكل ملائم، مركب بالصيغة (T13)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، على سبيل المثال، حمض ٣-أكسو-٣-بيروليدين-١-بروبيونيك وما شابه ذلك، عند درجة حرارة في المدى بين حوالي -70°C وحوالي 100°C ، في مذيب لا

بروتوني مثل THF، DMF وما شابه ذلك، في وجود قاعدة مثل ثالث ايثيل أمين، ثاني أيزوبروبيل ايثيل أمين وما شابه ذلك، لإنتاج خليط من الزمراء الموضعية المقابلة، مركبات بالصيغتين (IId) و (IIe). وتعتمد نسبة الزميرين الموضعيين على القاعدة والمذيب المستخدمين. وبشكل مفضل، يفصل الزميران الموضعيان باستشراب عمودي على هلام السليكا أو استشراب عمودي معكوس الطور لإنتاج المركبات بالصيغتين (IId) و (IIe).

وسيدرك متمرس في التقنية أنه عندما يكون الحمض الكربوكسيلي بالصيغة (T13) مثل حمض البنزويك، حمض البروبانويك وما شابه ذلك، يكتمل التفاعل في وجود عامل اقتران ببتيدي ملائم مثل ١-(٣-ثاني ميثيل أمينو بروبيل)-٣-اثيرل كربو ثاني إيميد (EDC) وهيدرات هيدروكسي بنزوتريازول (HOBT) وما شابه ذلك.

الطريقة ع

يمكن تحضير المركبات بالصيغتين (IIg) و (IIg). حيث يختار R^6 أو R^7 من الفئة التي تتكون من الفقرات (ط)، (ي)، و (ك) المتعلقة بوصف المركبات بالصيغة (II) وفقاً للعملية لموصوفة في الطريقة ع.

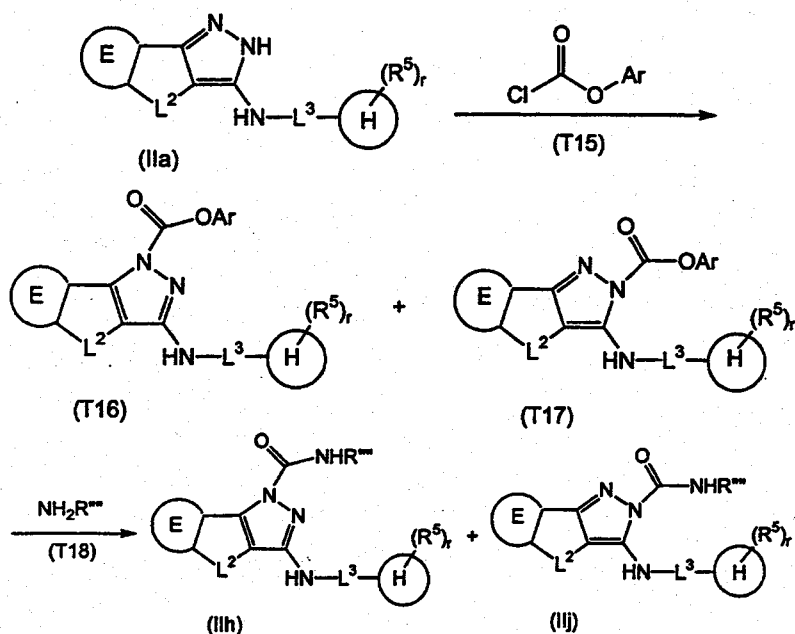


وعليه، يُفاعل مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (IIa) مع كلوروفورمات يحمل بدائل بشكل ملائم، مركب بالصيغة (T14)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، على سبيل المثال، كلوروفورمات ايثيل، كلوروفورمات ٢-مثنوكسي ايثيل، كلوروفورمات أيزوبروبيل، ثالث (جليكول ايثيلين)، ثنائي (كلوروفورمات) وما شابه ذلك، عند

درجة حرارة في المدى بين حوالي -٧٠°م وحوالي ١٠٠°م، في مذيب لا بروتوني مثل THF، DMF وما شابه ذلك، في وجود قاعدة مثل بيريدين، ثالث اثيل أمين، ثاني أيزوبروبيل اثيل أمين وما شابه ذلك، لإنتاج خليط من الزمرء الموضعية المقابلة، مركبات بالصيغتين (IIf) و (IIg). وتعتمد نسبة الزميرين الموضعين على القاعدة والمذيب المستخدمين. وبشكل مفضل، يفصل الزميران الموضعيان باستشراب عمودي على هلام السليكا أو استشراب عمودي معكوس الطور لإنتاج المركبات بالصيغتين (IIf) و (IIg).

الطريقة ف

يمكن تحضير المركبات بالصيغتين (IIj) و (IIk). حيث يختار R^6 أو R^7 من الفئة التي تتكون من الفقرات (ط)، (م)، (ن)، و (ع) المتعلقة بوصف المركبات بالصيغة (II) وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة ف.



وعليه، يُفاعل مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (IIa) مع كلوروفورمات أريل يحمل بدائل بشكل ملائم، مركب بالصيغة (T15)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بطرق معروفة، على سبيل المثال، كلوروفورمات فنييل، كلوروفورمات ٤-نتروفنييل وما شابه

ذلك، عند درجة حرارة في المدى بين حوالي -٧٠°م وحوالي ١٠٠°م، في مذيب لا بروتوني مثل DMF، THF وما شابه ذلك، في وجود قاعدة مثل بيريدين، ثالث اثيل أمين، ثاني أيزوبروبيل اثيل أمين وما شابه ذلك، لإنتاج خليط من الزمراء الموضعية المقابلة، مركبات بالصيغتين (T16) و (T17). وتفصل المركبات بالصيغتين (T16) و (T17) باستشراب عمودي على هلام السليكا أو استشراب عمودي معكوس الطور.

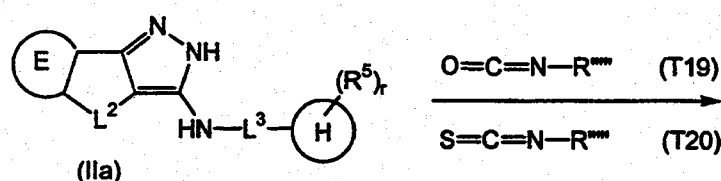
وتُفاعل المركبات بالصيغتين (T16) و (T17)، بشكل منفصل، مع أمين يحمل بدائل بشكل ملائم، مركب بالصيغة (T18)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بواسطة طرق معروفة، على سبيل المثال، ١-مثيل-١-اثيل-٢،١-ثاني أمين، بروبييل أمين، ٣- (مورفولينيل (٤))-١-بروبييل أمين وما شابه ذلك، في مذيب لا بروتوني مثل DMF، DMSO، THF وما شابه ذلك، عند درجة الحرارة في المدى بين حوالي -٧٠°م وحوالي ١٠٠°م لإنتاج المركبات المقابلة بالصيغتين (IIh) و (IIj).

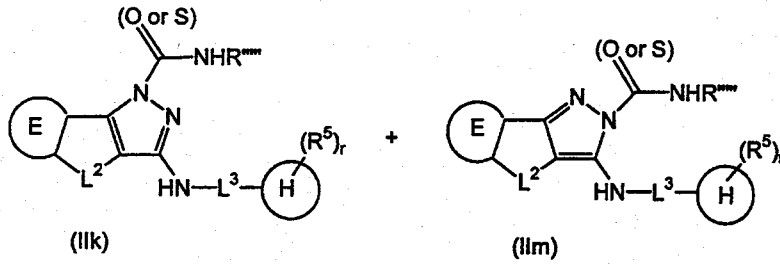
وبشكل بديل، تُفاعل المركبات بالصيغتين (T16) و (T17) في صورة خليط مع أمين يحمل بدائل بشكل ملائم، مركب بالصيغة (T18)، لإنتاج خليط من المركبات بالصيغتين (IIh) و (IIj). ثم تفصل المركبات بالصيغتين (IIh) و (IIj) بطرق معروفة، على سبيل المثال باستشراب عمودي على هلام السليكا أو استشراب عمودي معكوس الطور.

ويؤدي كل من التسلسلين إلى إنتاج المركبات المرغوبة بالصيغتين (IIh) و (IIj). ويتحقق تحضير سلسلة من المركبات بفعالية أكثر بمفاعلة المركبات بالصيغتين (T16) و (T17) بشكل منفصل بدلاً من مفاعلة خليط من المركبات بالصيغتين (T16) و (T17) ثم إجراء عملية فصل.

الطريقة ق

يمكن تحضير المركبات بالصيغتين (IIk) و (IIm)، حيث يختار R^6 أو R^7 من الفئة التي تتكون من الفقرات (ل)، (م)، (ن)، (ع)، (ف) و (ق) المتعلقة بوصف المركبات بالصيغة (II) وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة ق.



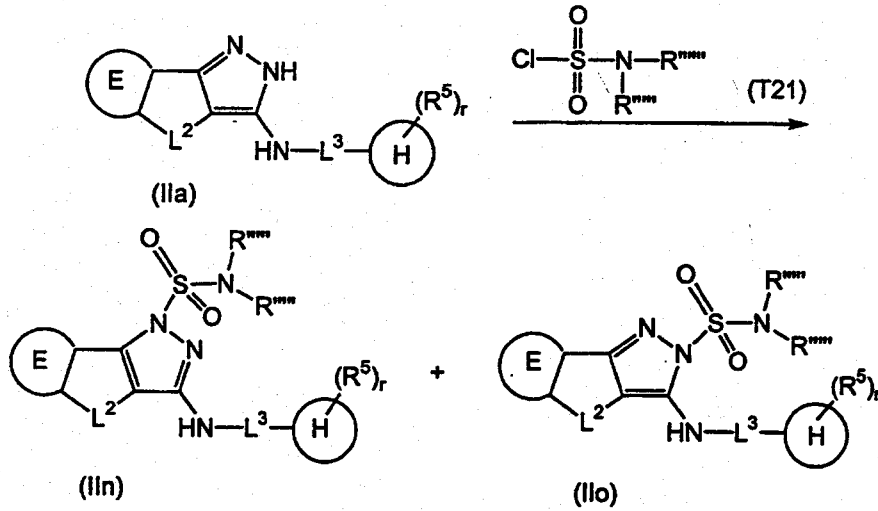


وعليه، يُفاعل مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (IIa) مع أيزوسيانات يحمل بدائل بشكل ملائم، مركب بالصيغة (T19)، أو ثيوأيزوسيانات يحمل بدائل بشكل ملائم، مركب بالصيغة (T20)، على سبيل المثال أيزوسيانات فنيـل، أيزوسيانات مـثـيل، ثـيـو أيزوسيانات مـثـيل وما شابه ذلك، عند درجة حرارة في المدى بين حوالي ٢٠°م وحوالي ١٠٠°م، في مذيب لا بروتوني مثل THF، DMF، DCM وما شابه ذلك، في وجود قاعدة مثل بيريدين، ثالث اثيل أمين، ثاني أيزوبروبيل اثيل أمين وما شابه ذلك، لإنتاج خليط من الزمراء الموضعية المقابلة، مركبات بالصيغتين (IIk) و (IIIm). وتعتمد نسبة الزميرين الموضعيين على القاعدة والمذيب المستخدم. وبشكل مفضل، يفصل الزميران الموضعيان باستشراب عمودي على هلام السليكا أو استشراب عمودي معكوس الطور لإنتاج المركبات بالصيغتين (IIk) و (IIIm).

وسيدرك مـتـمـرس في التـقـنية أنه عند تفاعل المركب بالصيغة (IIa) مع أيزوسيانات، فإنه سيكون للمركبات المقابلة بالصيغتين (IIk) و (IIIm) بدائل R⁶ أو R⁷ من -C(O)NHR^{'''} وبشكل مماثل، عند تفاعل المركب بالصيغة (IIa) مع ثيو أيزوسيانات، فإنه سيكون للمركبات المقابلة بالصيغتين (IIk) و (IIIm) بدائل R⁶ أو R⁷ من -C(S)NHR^{'''}.

الطريقة ر

يمكن تحضير المركبات بالصيغتين (IIo) و (IIn)، حيث يختار R^6 أو R^7 من الفئة التي تتكون من الفقرات (ش)، (ت) و (ث) المتعلقة بوصف المركبات بالصيغة (II) وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة ر.

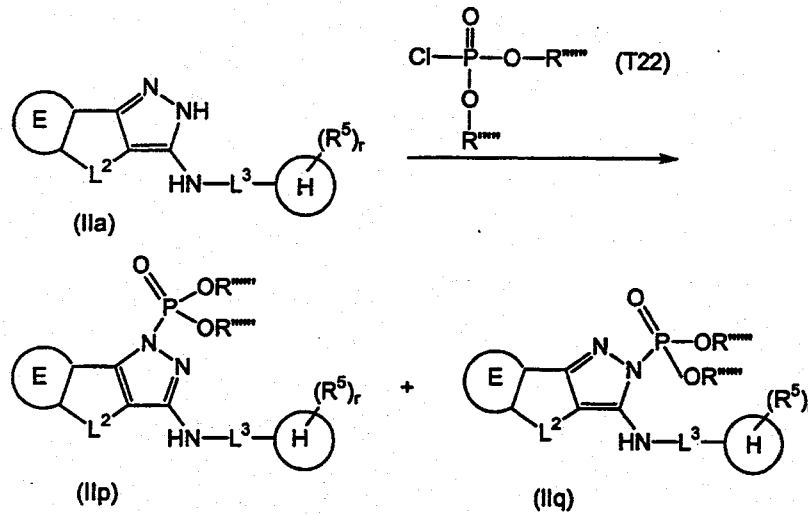


وعليه، يُفاعل مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (IIa) مع كلوريد كبريتامويل يحمل بدائل بشكل ملائم، مركب بالصيغة (T21)، وهو مركب معروف، على سبيل المثال كلوريد ثاني ميثيل كبريتامويل، كلوريد إيثيل كبريتامويل وما شابه ذلك، أو مركب يحضر بطرق معروفة عند درجة حرارة في المدى بين حوالي -٢٠°م وحوالي ١٠٠°م، في مذيب لا بروتوني مثل THF، DMF، DCM وما شابه ذلك، في وجود قاعدة مثل بيريدين، ثالث إيثيل أمين، ثاني أيزوبروبيل إيثيل أمين وما شابه ذلك، لإنتاج خليط من الزمراء الموضعية المقابلة، مركبات بالصيغتين (IIo) و (IIn). وتعتمد نسبة الزميرين الموضعين على القاعدة والمذيب المستخدم. وبشكل مفضل، يفصل الزميران الموضعيان باستشراب عمودي على هلام السليكا أو استشراب عمودي معكوس الطور لإنتاج المركبات بالصيغتين (IIo) و (IIn).

وسيدرك متمرّس في التقنية أنه عند تفاعل المركب بالصيغة (IIa) مع كبريتامويل، فإنه سيكون للمركبات المقابلة بالصيغتين (IIo) و (IIp) بدائل R^6 أو R^7 من $SO_2N(R''''')_2$ و SO_2NHR''''' .

الطريقة ش

يمكن تحضير المركبات بالصيغتين (IIp) و (IIq)، حيث يختار R^6 أو R^7 من الفئة التي تتكون من الفقرتين (خ) و (ذ) المتعلقين بوصف المركبات بالصيغة (II) وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة ش.

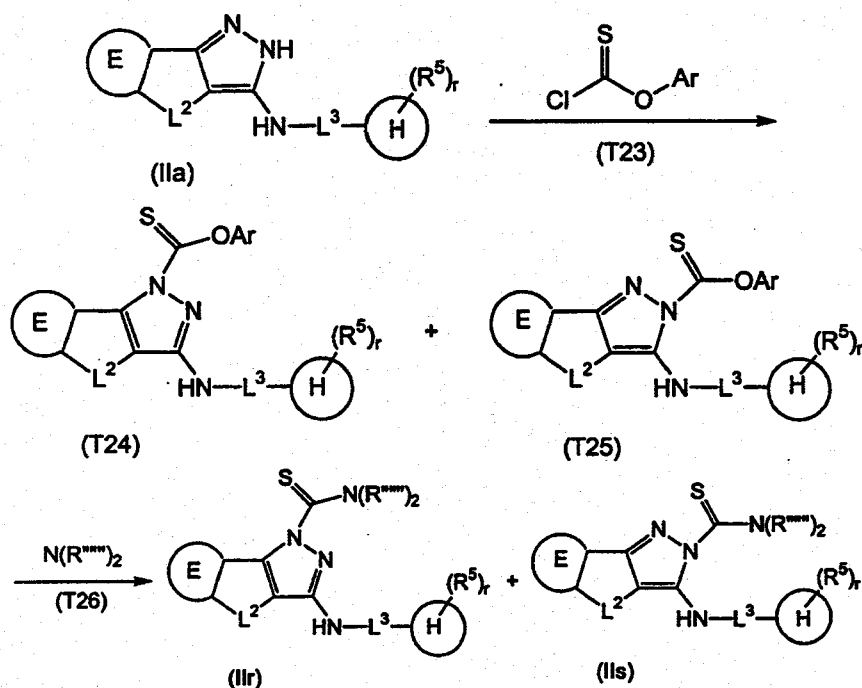


وعليه، يُفاعل مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (IIa) مع كلوروفسففات ألكيل يحمل بدائل بشكل ملائم، مركب بالصيغة (T22)، وهو مركب معروف، على سبيل المثال كلوروفسففات ثاني ميثيل، كلورو فسفات ثاني إيثيل وما شابه ذلك، أو مركب يحضر بطرق معروفة، عند درجة حرارة في المدى بين حوالي ٢٠°م وحوالي ١٠٠°م، في مذيب لا بروتوني مثل THF، DMF، DCM وما شابه ذلك، في وجود قاعدة مثل بيريدين، ثالث إيثيل أمين، ثاني أيزوبروبيل إيثيل أمين وما شابه ذلك، لإنتاج خليط من الزمرات الموضعية المقابلة، مركبات بالصيغتين (IIp) و (IIq). وتعتمد نسبة الزمرتين الموضعيتين على القاعدة والمذيب

المستخدمين. وبشكل مفضل، يفصل الزميران الموضعيان باستشراب عمودي على هلام السليكا أو استشراب عمودي معكوس الطور لإنتاج المركبات بالصيغتين (IIp) و (IIq). وسيدرك متمرّس في التقنية أنه عند تفاعل المركب بالصيغة (IIa) مع كلورو فسفات ثاني ألكيل، فإنه سيكون للمركبات المقابلة بالصيغتين (IIp) و (IIq) بدائل R^6 أو R^7 من $-P(=O)(O(C_1-C_3))_2$.

الطريقة ت

يمكن تحضير المركبات بالصيغتين (IIr) و (IIs)، حيث يختار R^6 أو R^7 من الفئة التي تتكون من الفقرة (ر) المتعلقة بوصف المركبات بالصيغة (II) وفقاً للعملية الموصوفة في الطريقة ت.



وعليه، يُفاعل مركب يحمل بدائل بشكل ملائم بالصيغة (IIa) مع ثيونو كلوروفورمات أريل يحمل بدائل بشكل ملائم، مركب بالصيغة (T23)، وهو مركب معروف أو مركب حضر بطرق معروفة، على سبيل المثال ثيونو كلوروفورمات فنيّل وما شابه ذلك، عند

درجة حرارة في المدى بين حوالي -٧٠°م وحوالي ١٠٠°م، في مذيب لا بروتوني مثل THF، DMF، DCM وما شابه ذلك، في وجود قاعدة مثل بيريدين، ثالث اثيل أمين، ثاني أيزوبروبيل اثيل أمين وما شابه ذلك، لإنتاج خليط من الزمراء الموضعية المقابلة، مركبات بالصيغتين (T24) و (T25). وتفصل المركبات بالصيغتين (T24) و (T25) باستشراب عمودي على هلام السليكا أو استشراب عمودي معكوس الطور.

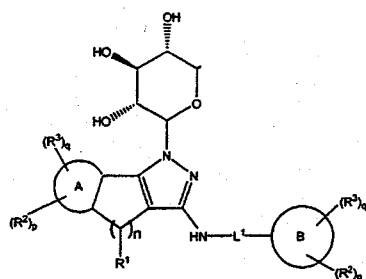
وتُفاعل المركبات بالصيغتين (T24) و (T25)، بشكل منفصل، مع أمين يحمل بدائل بشكل ملائم، مركب بالصيغة (T26)، وهو مركب معروف أو مركب يحضر بواسطة طرق معروفة، على سبيل المثال بيريدين، مورفولين، ثاني مثيل أمين، بيروليدين وما شابه ذلك، في مذيب لا بروتوني مثل DMF، DMSO، THF وما شابه ذلك، عند درجة الحرارة في المدى بين حوالي -٧٠°م وحوالي ١٠٠°م لإنتاج المركبات المقابلة بالصيغتين (IIr) و (IIs).

وبشكل بديل، تُفاعل المركبات بالصيغتين (T24) و (T25) في صورة خليط مع أمين يحمل بدائل بشكل ملائم، مركب بالصيغة (T26)، لإنتاج خليط من المركبات بالصيغتين (IIr) و (IIs). ثم تفصل المركبات بالصيغتين (IIr) و (IIs) بطرق معروفة، على سبيل المثال باستشراب عمودي على هلام السليكا أو استشراب عمودي معكوس الطور.

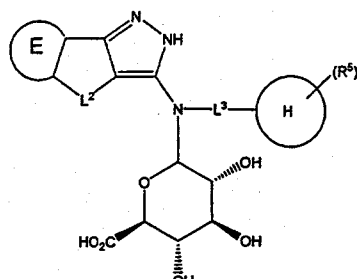
ويؤدي كل من التسلسلين إلى إنتاج المركبات المرغوبة بالصيغتين (IIr) و (IIs). ويتحقق تحضير سلسلة من المركبات بفعالية أكثر بمفاعلة المركبات بالصيغتين (T24) و (T25) بشكل منفصل بدلاً من مفاعلة خليط من المركبات بالصيغتين (T24) و (T25) ثم إجراء عملية فصل.

تخليق N-جلوكورونيد

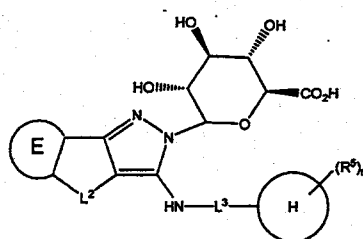
قد تخضع المركبات وفقاً لهذا الاختراع بدرجات متفاوتة لعملية إضافة N-جلوكورونيد (N-glucuronidation) في الجسم الحي بواسطة أنزيمات إسوية داخلية المنشأ متنوعة من عائلة UDP-جلوكورونوسيل ترانسفيراز (انظر ما جاء عن إس-اتش إل. تشيو؛ إس-ئي دبليو. هوسكي في ندوة الجمعية الأمريكية لعلم العقاقير والعلاجات التجريبية (ASPET) لعام ١٩٩٦م حول إضافة N-جلوكورونيد للمركبات الكيميائية غير الحيوية: اختلافات الأنواع في عملية



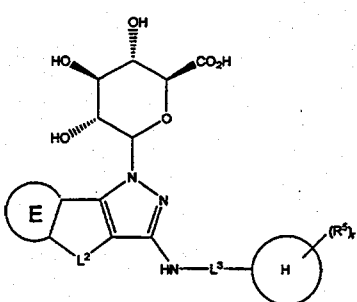
المشتقة GLU C
للمركب بالصيغة (I)



المشتقة GLU A
للمركب بالصيغة (II)



المشتقة GLU B
للمركب بالصيغة (II)



المشتقة GLU C
للمركب بالصيغة (II)

وعادة، سيكون للمركبات المضاف إليها الجلوكورونيد شكل بيتا حول ذرة الكربون الأنومرية، وخاصة عندما يتم إنتاج الجلوكورونيد بواسطة طرق أنزيمية راسخة جيداً معروفة لأشخاص متمرسين في التقنية (انظر ما جاء عن إل. لوكانين؛ أي. كلبيلانين؛ إنش. كانجاس؛ بي. أتويلا؛ ئي. إوفارا؛ جيه. تاسكينين في مقالة بعنوان تخليق مركبات جلوكورونيد نثروكاتيكل بمساعدة أنزيم وتمييزها بنيوياً، في مجلة كيمياء المركبات المقترنة حيويًا (بيوكونوجيت كميستري)، مجلد ١٠، العدد (١)، ص ١٥٠-١٥٤، (١٩٩٩م)).

كما يمكن تحضير مركبات N-جلوكورونيد بواسطة عملية تخليق مباشرة بمفاعلة المركبات بالصيغتين (I) و (II) مع هاليدات جلوكورونوسيل موقاة بشكل ملائم باتباع منهجية تخليق معروفة للأشخاص المتمرسين في التقنية (انظر ما جاء عن برامود أبدهيايا؛ إدوارد جيه. مكلنتي؛ ستيفن إس. هكت في مقالة بعنوان تحضير مركبات بيريدين-N-جلوكورونيد من مركبات نثروزأمين متخصصة بأمراض يسببها التبغ في مجلة أبحاث كيميائية في علم

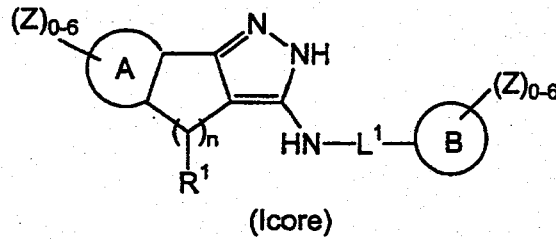
السموم (كيميكال ريسرتش إن توكسيكولوجي)، مجلد ١٤، العدد (٥)، ص ٥٥٥-٥٦١،
(٢٠٠١م)).

وسيدرك متمرس في التقنية أنه يمكن تحضير مشتقات GLU A، GLU B و GLU C للمركبات بالصيغتين (I) و (II) بواسطة طرق معروفة، بتكييف الطرق المذكورة أعلاه لتفي بالغرض.

الطرق البديلة

سيدرك متمرس في التقنية أيضاً أنه يمكن دمج المجموعتين R^2 و R^3 أو

المحمولتين على الحلقتين $\textcircled{A}$ و $\textcircled{B}$ بشكل بديل في المركب بالصيغة (I) بواسطة طرق معروفة، بعد تشكل البنية الأساسية للمركب بالصيغة (I)، وتمثل الصيغة البنائية الأساسية (core) للمركب بالصيغة I على النحو التالي ويرمز لها بالرمز (Icore)



حيث ترتبط كل Z مباشرة مع حلقة $\textcircled{A}$ أو $\textcircled{B}$ مع جزء من بديل R^2 أو R^3 (فعلى سبيل المثال عندما تمثل مجموعة R^2 المرغوبة $X-A^1-Y-A^2$ ، فإن مجموعة Z يمكن أن

ترتبط مع مجموعة $X-A^1$ المرتبطة مع حلقة $\textcircled{A}$ أو $\textcircled{B}$.

وعلى سبيل المثال، عندما تمثل مجموعة واحدة أو أكثر من مجموعات Z هيدروكسي، فإنه يمكن مفاعلة مجموعة الهيدروكسي وفقاً لطرق معروفة مع هاليد الأكيل لتشكيل البديل المقابل من الأكيل-O؛ مع الأكيل-Cl أو أريل-Cl لتشكيل البديل المقابل من الأكيل-C(O)- أو أريل-C(O)- مع الأكيل-Cl أو أريل-C(O)O- لتشكيل البديل المقابل من

ألكيل-C(O)O- أو أريل-C(O)O-؛ أو مع (ألكيل)C(O)N أو (أريل)C(O)C لتشكيل البديل المقابل من (ألكيل)N(أريل)OC(O)- أو (أريل)N(أريل)OC(O)-.

و عندما تمثل مجموعة واحدة أو أكثر من مجموعات Z أمينو، فإنه يمكن مفاعلة مجموعة الأمينو وفقاً لطرق معروفة مع ألكيل-HC(O)- أو أريل-HC(O)- لتشكيل البديل المقابل من ألكيل-NHCH₂- أو أريل-NHCH₂-؛ مع ألكيل-Cl-C(O)- أو أريل-Cl-C(O)- لتشكيل البديل المقابل من ألكيل-NHC(O)- أو أريل-NHC(O)-؛ مع ألكيل-C(O)N- أو أريل-C(O)N- لتشكيل البديل المقابل من ألكيل-NHC(O)NH- أو أريل-NHC(O)NH-؛ مع ألكيل-Cl-C(O)-O- أو أريل-Cl-C(O)-O- لتشكيل البديل المقابل من ألكيل-NHC(O)O- أو أريل-NHC(O)O-؛ أو مع ألكيل-Cl-SO₂- أو أريل-Cl-SO₂- لتشكيل البديل المقابل من ألكيل-NHSO₂- أو أريل-NHSO₂- كما سيدرك متمرّس في التقنية أنه عندما تمثل مجموعة Z مجموعة ألكيل أمينو أو أريل أمينو، يمكن إجراء نفس الطرق الكيميائية لإنتاج بدائل مقابلة حيث لا تزال تحمل مجموعة N المرتبطة مباشرة مع حلقة A أو B بديلاً من مجموعة الألكيل أو الأريل.

و عندما تمثل مجموعة واحدة أو أكثر من مجموعات Z ثيو، فإنه يمكن مفاعلة مجموعة الثيو وفقاً لطرق معروفة مع هاليد ألكيل لتشكيل البديل المقابل من ألكيل ثيو. وعندما تمثل مجموعة واحدة أو أكثر من مجموعات Z ألكيل ثيو، فإنه يمكن مفاعلة مجموعة الألكيل ثيو وفقاً لطرق معروفة لتشكيل البديل المقابل من ألكيل كبريتونيل.

و عندما تمثل مجموعة واحدة أو أكثر من مجموعات Z كربوكسي، فإنه يمكن مفاعلة مجموعة الكربوكسي وفقاً لطرق معروفة لتشكيل مجموعة C(O)Cl- المقابلة، والتي يمكن تباعاً مفاعلتها أيضاً لتشكيل البدائل المرغوبة من R² و/أو R³.

و عندما تمثل مجموعة واحدة أو أكثر من مجموعات Z المجموعة C(O)Cl-، فإنه يمكن مفاعلة مجموعة الـ C(O)Cl- وفقاً لطرق معروفة مع ألكوكسي لتشكيل البديل المقابل من ألكيل-C(O)O-؛ مع (ألكيل)NH- أو (ألكيل)₂N- لتشكيل البديل المقابل من (ألكيل)NH(ألكيل)C(O)- أو (ألكيل)₂N(ألكيل)C(O)-.

وعندما تمثل مجموعة واحدة أو أكثر من مجموعات Z هالوجيناً مثل اليود أو البروم، فإنه يمكن مفاعلة الهالوجين وفقاً لطرق معروفة مع ألكيل- $B(OH)_2$ ، أريل- $B(OH)_2$ أو أريل مخلط- $B(OH)_2$ لإحلال مجموعة الألكيل-، الأريل- أو الأريل المخلط- المقابلة محل الهالوجين.

وبشكل بديل، عندما تمثل مجموعة واحدة أو أكثر من مجموعات Z هالوجيناً مثل اليود أو البروم، فإنه يمكن مفاعلة الهالوجين وفقاً لطرق معروفة مع ألكيل أمين، ثاني ألكيل أمين، أريل أمين، أريل مخلط أمين أو ألكيل حلقي مخلط أمين لإحلال مجموعة ألكيل-NH-، $(\text{ألكيل})_2\text{-N}$ ، أريل-N-، أريل مخلط-NH- أو ألكيل حلقي مخلط-NH- المقابلة محل الهالوجين.

وبشكل بديل، عندما تمثل مجموعة واحدة أو أكثر من مجموعات Z هالوجيناً مثل اليود أو البروم، فإنه يمكن مفاعلة الهالوجين وفقاً لطرق معروفة مع ألكيل-HO، أريل-HO، أريل مخلط-HO أو ألكيل حلقي مخلط-HO لإحلال مجموعة ألكيل-O-، أريل-O-، أريل مخلط-O- أو ألكيل حلقي مخلط-O- المقابلة محل الهالوجين.

وبشكل بديل، عندما تمثل مجموعة واحدة أو أكثر من مجموعات Z هالوجيناً مثل اليود أو البروم، فإنه يمكن مفاعلة الهالوجين وفقاً لطرق معروفة مع ألكيل-HS، أريل-HS، أريل مخلط-HS أو ألكيل حلقي مخلط-HS لإحلال مجموعة ألكيل-S-، أريل-S-، أريل مخلط-S- أو ألكيل حلقي مخلط-S- المقابلة محل الهالوجين.

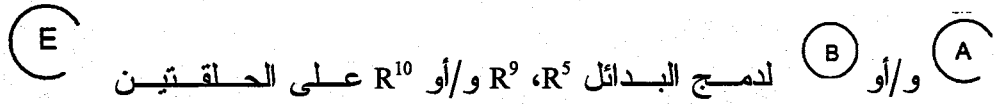
وعندما تمثل مجموعة واحدة أو أكثر من مجموعات Z مجموعة أريل- $O-SO_2$ أو ألكيل- $O-SO_2$ ، فإنه يمكن مفاعلة مجموعة الأريل- $O-SO_2$ أو الألكيل- $O-SO_2$ وفقاً لطرق معروفة مع ألكيل أمين، ثاني ألكيل أمين، أريل أمين أو أريل مخلط أمين لتشكيل مجموعة $(\text{ألكيل})_2\text{-NH}$ ، $(\text{ألكيل})_2\text{-N}$ ، (أريل-NH) أو (أريل مخلط-NH) المقابلة.

وبشكل بديل، عندما تمثل مجموعة واحدة أو أكثر من مجموعات Z أريل- $O-SO_2$ أو ألكيل- $O-SO_2$ ، فإنه يمكن مفاعلة مجموعة الأريل- $O-SO_2$ أو الألكيل- $O-SO_2$ وفقاً لطرق معروفة لإحلال هالوجين مثل Br أو I محل المجموعة $O-SO_2$ ، لتشكيل مركب وسيط فعال يمكن مفاعله أيضاً لتشكيل البديل المرغوب.

وعندما تمثل مجموعة واحدة أو أكثر من مجموعات Z ألكيل-S، أريل-S، أريل مخلط-S أو ألكيل حلقي مخلط-S، فإنه يمكن أكسدة S وفقاً لطرق معروفة لتشكيل البدائل المقابلة من ألكيل-SO₂، أريل-SO₂، أريل مخلط-SO₂ أو ألكيل حلقي مخلط-SO₂.

وعندما تحتوي مجموعة واحدة أو أكثر من مجموعات Z على رابطة غير مشبعة طرفية، فإنه يمكن مفاعلة مجموعة Z وفقاً لطرق معروفة لتشكيل الإيبوكسيد المقابل، والذي يمكن مفاعله تبعاً مع أمين يحمل بدائل مثل ألكيل أمينو، ثاني ألكيل أمين، أريل أمين، أريل مخلط أمين، ألكيل حلقي مخلط أمين، أو أمين حلقي (مثل البيريدين، المورفولين، الإيميدازول، وما شابه ذلك)، لتشكيل البديل المقابل من ألكيل-CH(OH)CH₂-NH، أريل-CH(OH)CH₂-NH، أريل مخلط-CH(OH)CH₂-NH، ألكيل حلقي₂(ألكيل)CH(OH)CH₂N، أريل-CH(OH)CH₂-NH، أريل مخلط-CH(OH)CH₂-NH، ألكيل حلقي مخلط-CH(OH)CH₂-NH- (أمين حلقي مرتبط من خلال ذرة N) -CH(OH)CH₂-NH.

كما سيدرك متمرس في التقنية أنه يمكن استخدام عمليات تحويل أو تفاعلات مشابهة لتلك الموصوفة أعلاه في (أو تطبيقها عند) تحضير المركبات بالصيغة (II). وعلى وجه التحديد، يمكن استخدام العمليات الموصوفة أعلاه لإضافة مجموعات R² و/أو R³ على الحلقة



و H الموجودتين على المركبات بالصيغة (II).

وسيدرك متمرس في التقنية أنه يمكن تحويل المركبات بالصيغة (I) حيث R¹ يمثل (=O) أكسو وفقاً لطرق معروفة لتشكيل مركبات بالصيغة (II) حيث R¹ يمثل هيدروكسي (بالاختزال) أو تحويلها إلى مركبات وسيطة حيث R¹ يمثل =NHOH (وذلك بمفاعلتها مع (NH₄OH)). ويمكن فيما بعد اختزال المركبات الوسيطة حيث R¹ يمثل =NHOH وفقاً لطرق معروفة إلى الأمين المقابل، الذي يمكن فيما بعد تعديله وظيفياً أيضاً بشكل اختياري لتحويله إلى الأمين المقابل الذي يحمل بدائل.

ويمكن تحويل المركبات بالصيغة (I) حيث R¹ يمثل هيدروكسي وفقاً لطرق معروفة لتشكيل مركبات وسيطة حيث R¹ يمثل أريل-O-SO₂ أو ألكيل-O-SO₂، بمفاعلة المركب

الوسيط مع المادة المفاعلة المقابلة من الأريل- Cl-SO_2 أو الألكيل- Cl-SO_2 . كما يمكن فيما بعد مفاعلة المجموعة R^1 المتمثلة في الأريل- O-SO_2 أو الألكيل- O-SO_2 بشكل اختياري وفقاً لطرق معروفة لتشكيل أمين (وذلك بمفاعلتها مع NaN_3 ثم الاختزال).

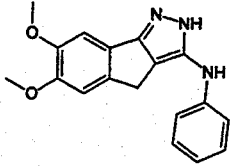
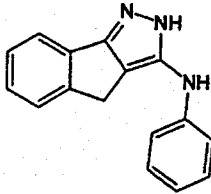
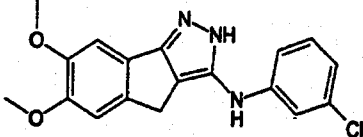
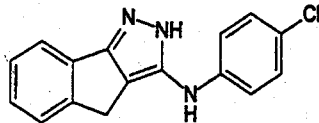
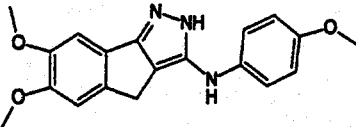
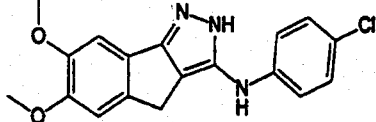
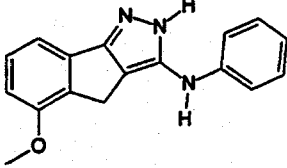
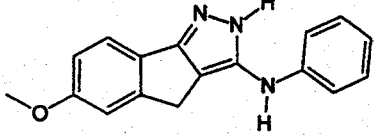
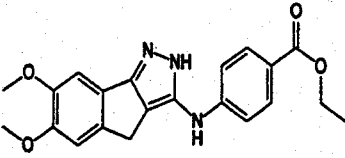
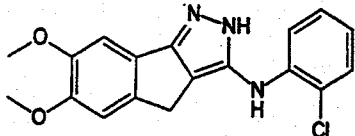
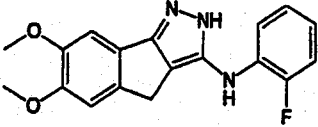
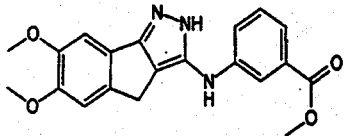
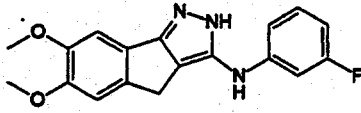
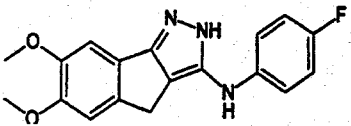
وبشكل بديل، يمكن تحويل المركبات بالصيغة (I) حيث R^1 يمثل هيدروكسي وفقاً لطرق معروفة لتشكيل مركبات بالصيغة (I) حيث R^1 يمثل ألكيل- O وذلك بمفاعلتها مع هاليد الألكيل المقابل.

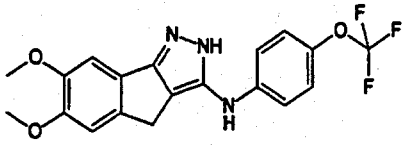
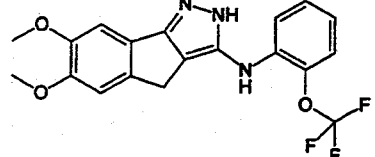
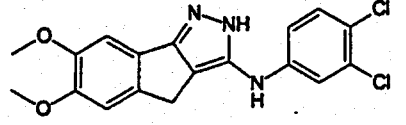
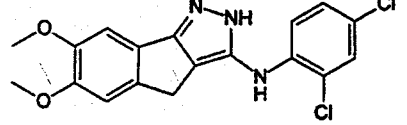
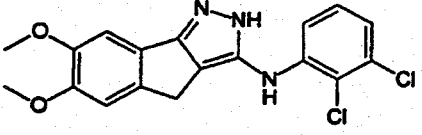
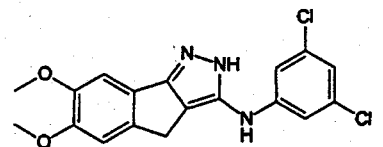
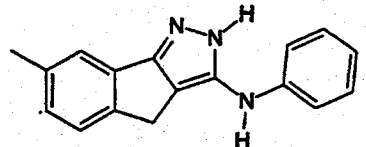
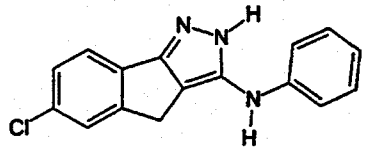
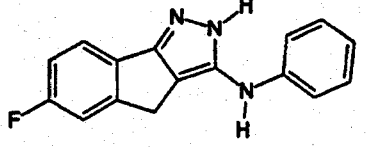
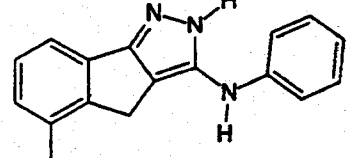
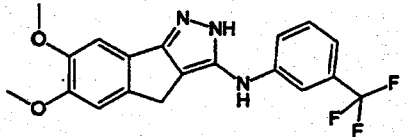
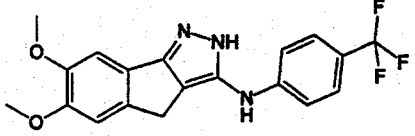
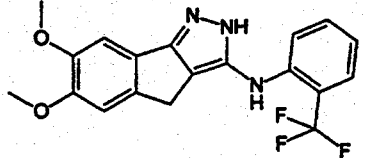
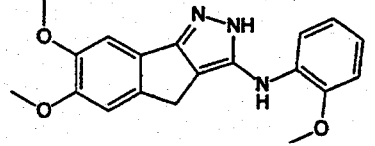
ويمكن مفاعلة المركبات بالصيغة (I) حيث R^1 يمثل أمين أو ألكيل أمين وفقاً لطرق لتشكيل مركبات بالصيغة (I) حيث R^1 يمثل ألكيل- NH-CH_2 أو $(\text{الكيل-CH}_2)\text{-NH}$ وذلك بمفاعلتها مع ألكيل- HC(O) .

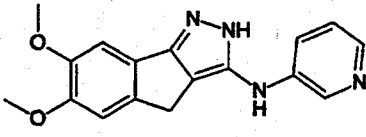
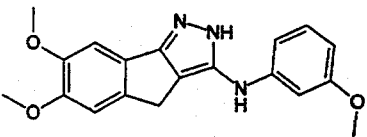
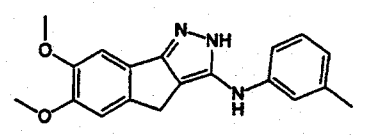
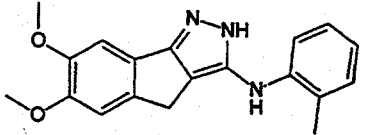
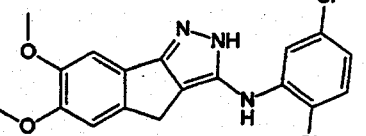
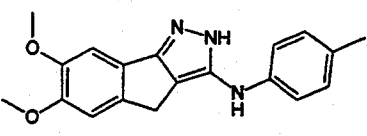
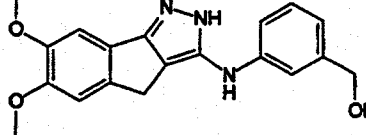
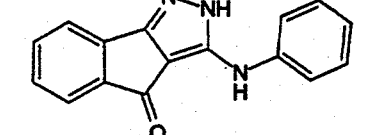
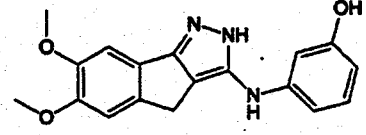
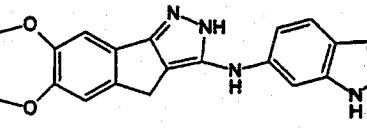
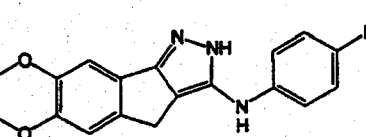
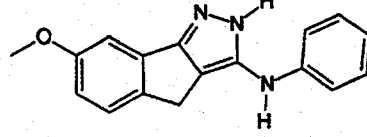
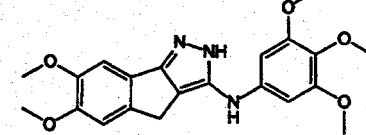
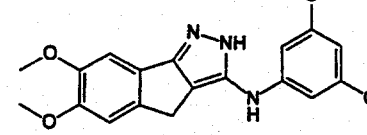
كما سيدرك متمرّس في التقنية أنه يمكن استخدام عمليات تحويل أو تفاعلات مشابهة لتلك الموصوفة أعلاه في (أو تطبيقها عند) تحضير المركبات بالصيغة (II). وعلى وجه التحديد، يمكن بالمثل تطبيق العمليات الموصوفة أعلاه لإضافة مجموعات R^1 وتحويلها اختياريًا في المركبات بالصيغة (I) لتحضير المركبات بالصيغة (II)، حيث تكون عمليات التحويل هذه مناسبة عند تحضير مجموعات L^2 المرغوبة.

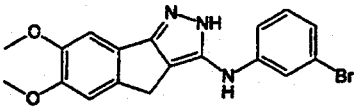
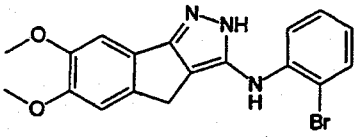
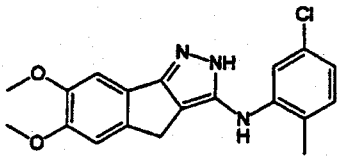
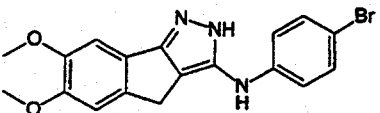
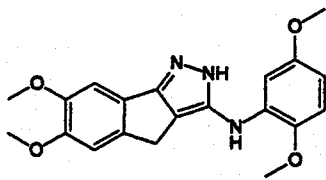
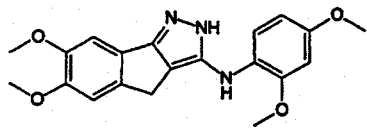
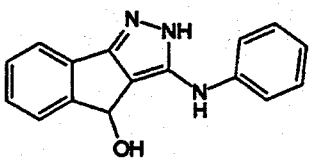
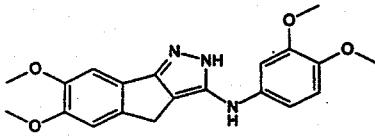
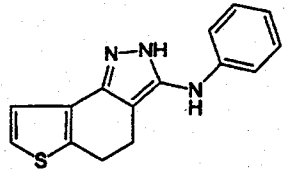
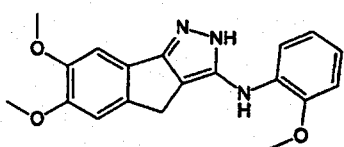
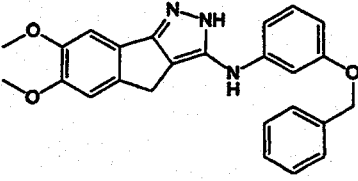
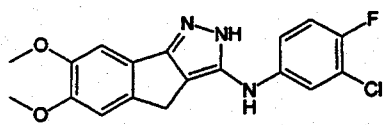
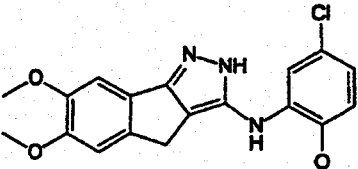
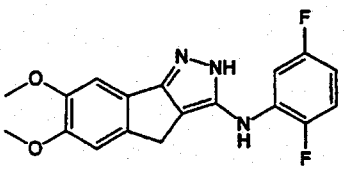
وسيدرك متمرّس في التقنية أيضاً أنه لا يراد من الأمثلة المذكورة أعلاه المتعلقة بإضافة المجموعات البديلة المرغوبة إلى المركبات بالصيغة (I) و/أو المركبات بالصيغة (II) أن تكون جميعها شاملة، ولكن يراد منها تزويد أمثلة لطرق كيميائية معروفة لدمج بدائل نموذجية. ويمكن دمج مجموعات بديلة إضافية لم توصف على وجه التخصيص في هذا البيان في المركبات بالصيغة (I) و/أو المركبات بالصيغة (II) بطرق معروفة.

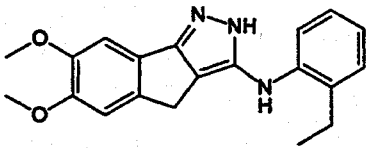
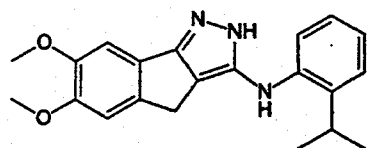
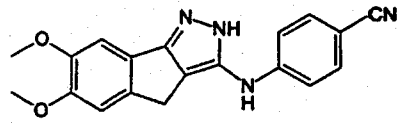
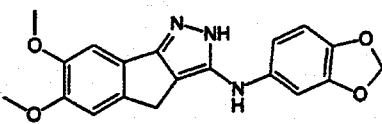
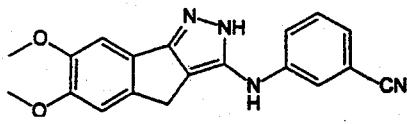
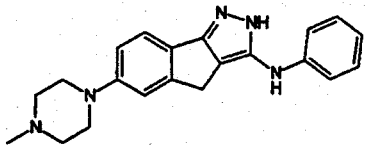
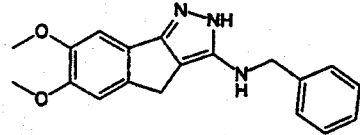
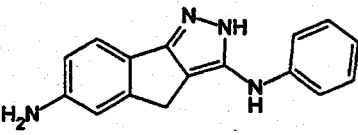
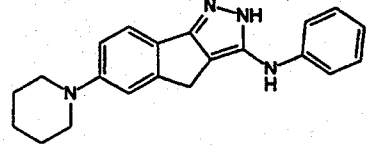
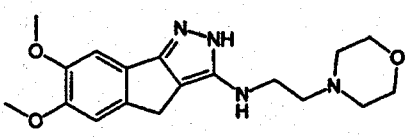
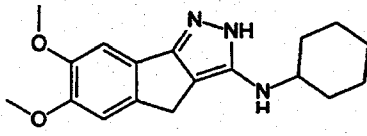
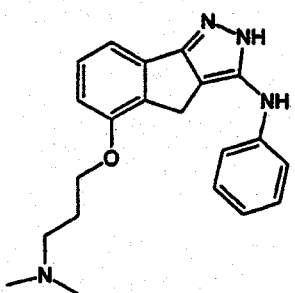
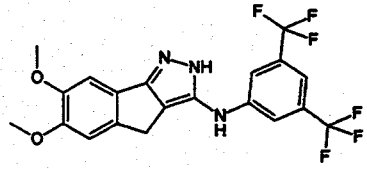
وتقدّم أنباء المركبات النموذجية وفقاً للاختراع الراهن والتي أجري تخليقها بواسطة الطرق المذكورة آنفاً. وتقدم فيما يلي أمثلة لتخليق مركبات محددة.

الصيغة البنوية	المركب	الصيغة البنوية	المركب
	١		٢
	٣		٤
	٥		٦
	٧		٨
	٩		١٠
	١١		١٢
	١٣		١٤

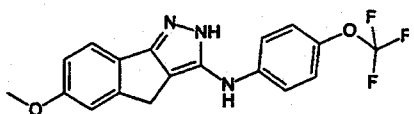
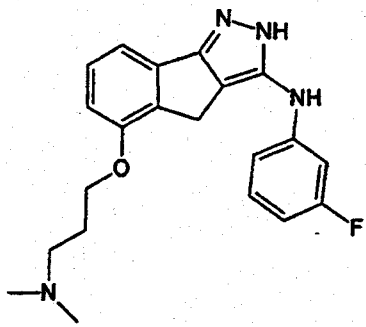
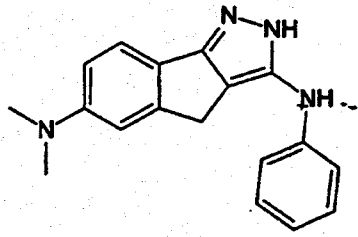
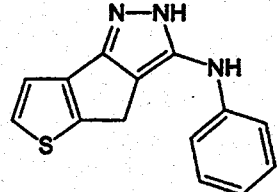
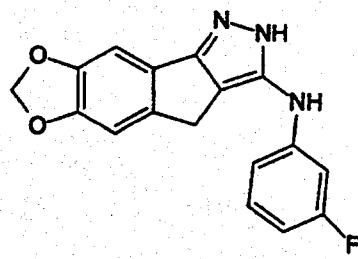
16 	10 
18 	17 
20 	19 
22 	21 
24 	23 
26 	20 
28 	27 

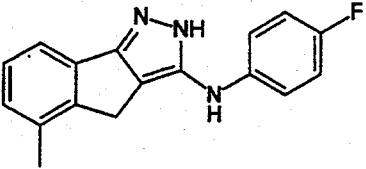
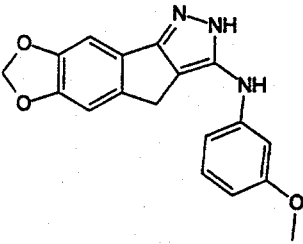
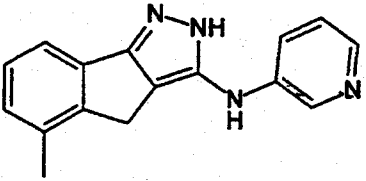
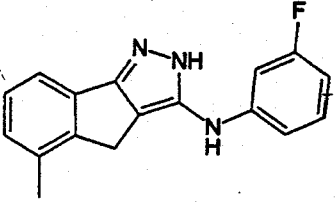
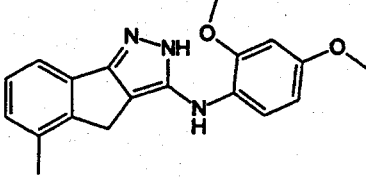
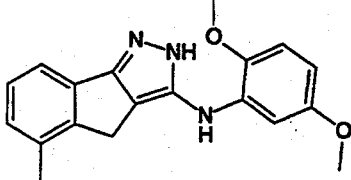
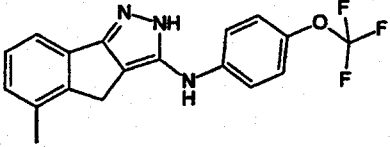
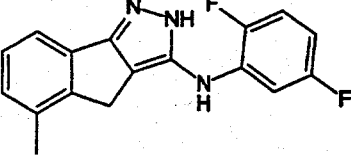
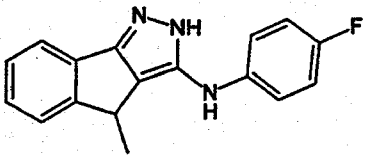
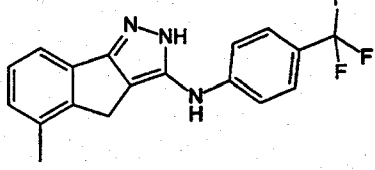
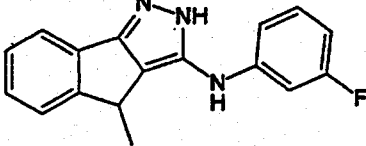
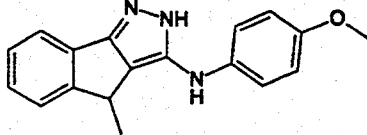
۳۰ 	۳۹ 
۳۲ 	۳۱ 
۳۴ 	۳۳ 
۳۶ 	۳۵ 
۳۸ 	۳۷ 
۴۰ 	۳۹ 
۴۲ 	۴۱ 

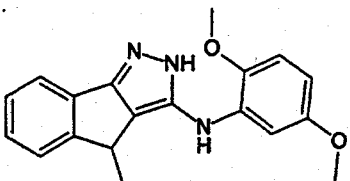
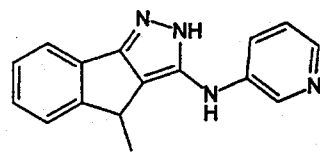
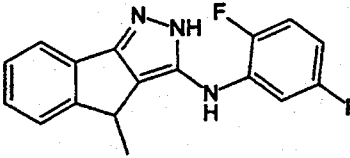
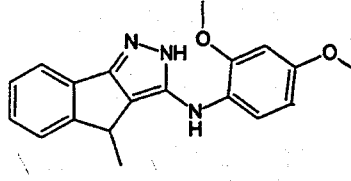
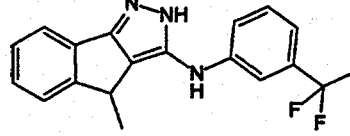
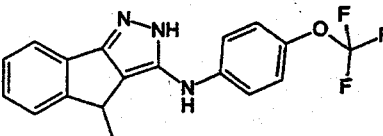
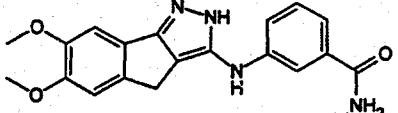
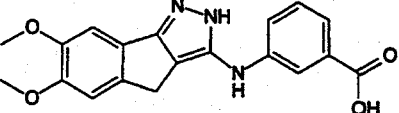
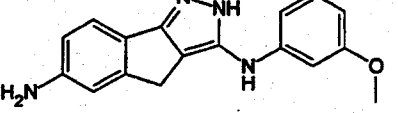
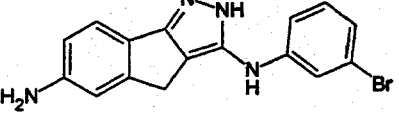
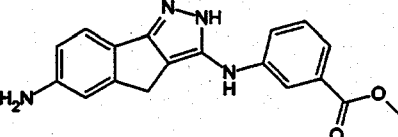
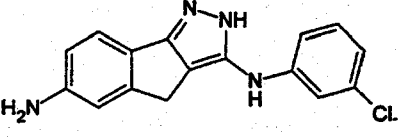
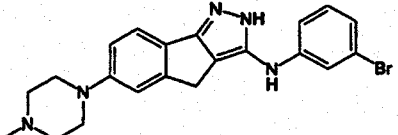
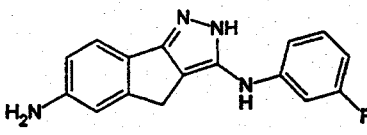
	۴۴		۴۳
	۴۵		۴۰
	۴۶		۴۷
	۴۷		۴۸
	۴۸		۴۹
	۴۹		۵۳
	۵۰		۵۰

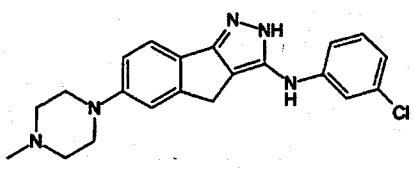
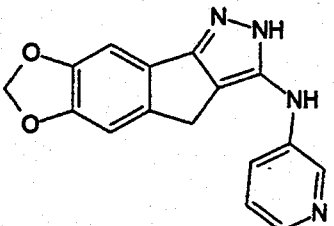
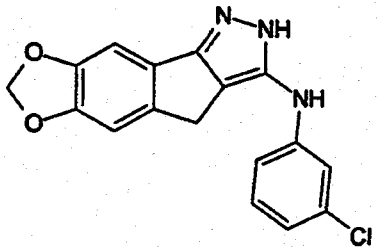
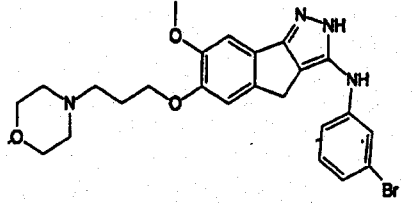
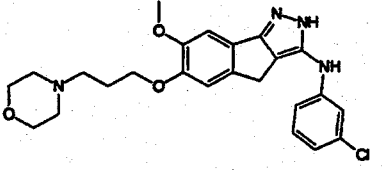
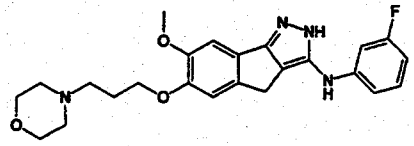
	۶۸		۶۷
			۶۹
	۶۲		۶۱
	۶۴		۶۳
	۶۶		۶۵
	۶۹		۶۷
	۷۱		۷۰

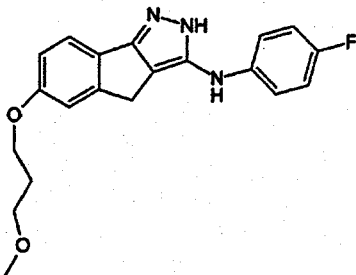
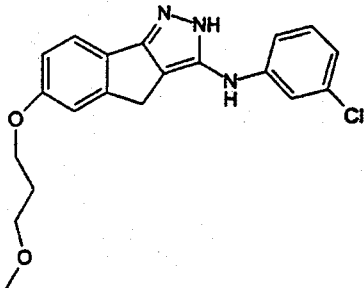
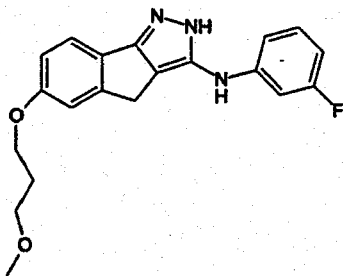
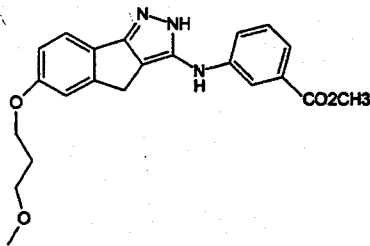
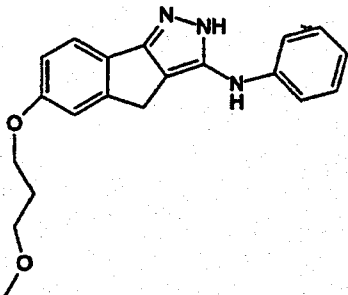
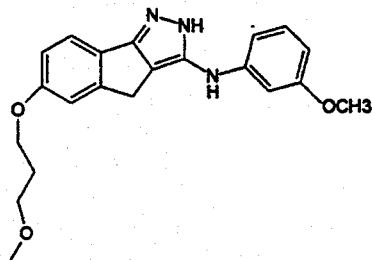
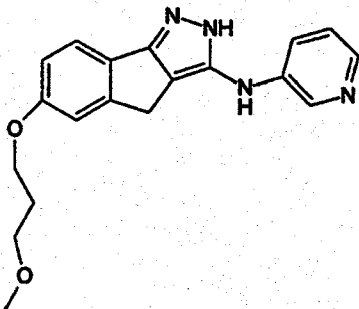
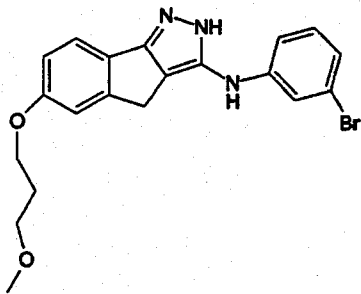
	V۳		V۲
	V۵		V۴
	V۷		V۶
	V۹		V۸
	A۲		A۱
	A۴		A۳
	A۶		A۵

	٨٨ ٨٩
	٩٠ ٨٩
	٩٢ ٩١
	٩٤ ٩٣
	٩٦ ٩٥

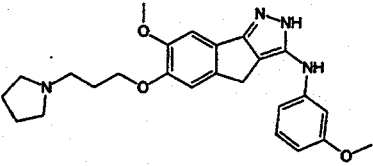
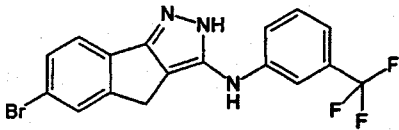
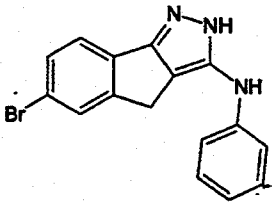
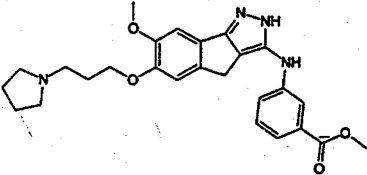
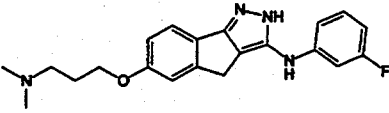
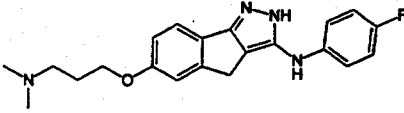
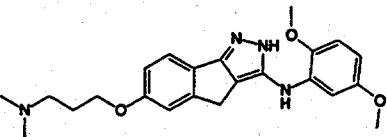
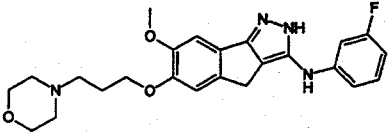
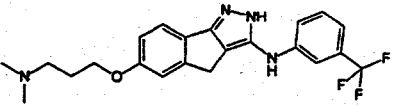
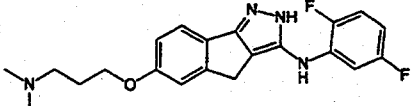
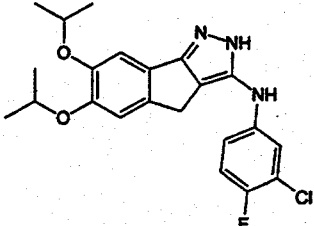
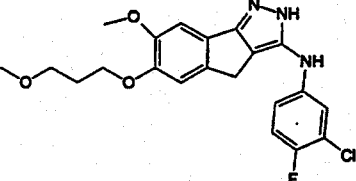
٩٨ 	٩٧ 
١٠٠ 	٩٩ 
١٠٢ 	١٠١ 
١٠٤ 	١٠٣ 
١٠٦ 	١٠٥ 
١٠٨ 	١٠٧ 

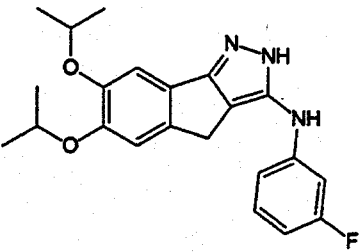
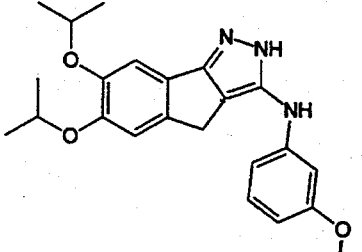
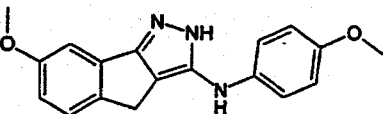
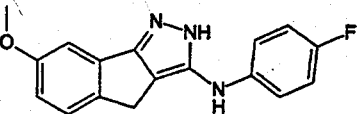
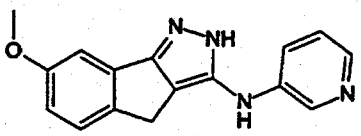
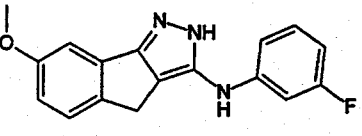
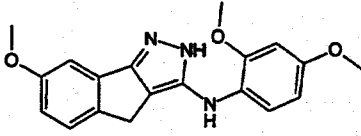
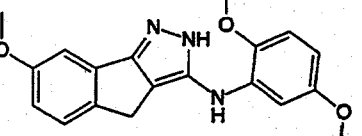
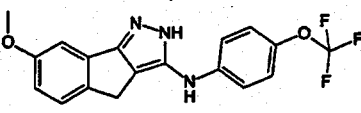
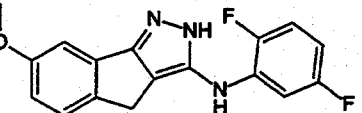
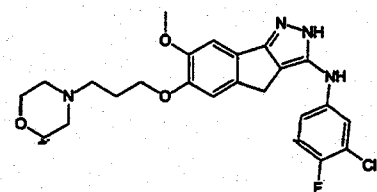
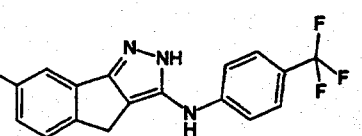
	110		109
	112		111
	114		113
	116		115
	118		117
	120		119
	122		121

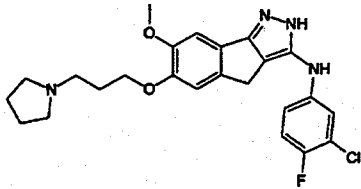
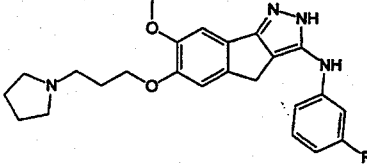
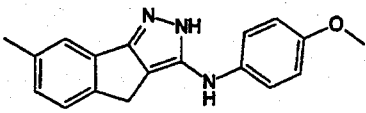
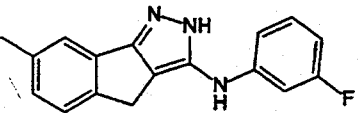
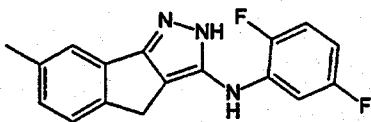
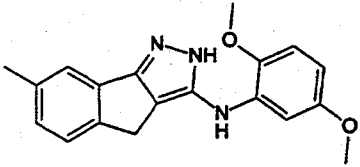
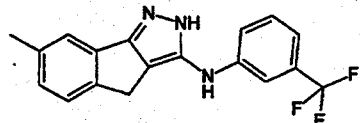
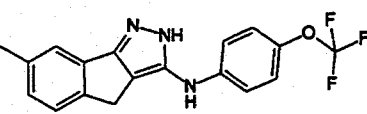
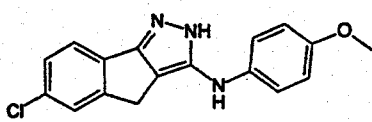
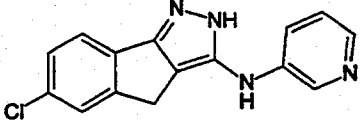
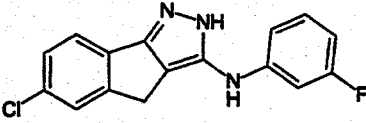
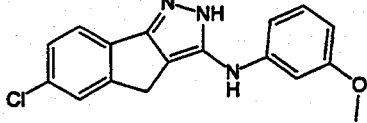
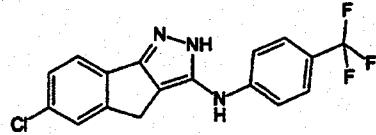
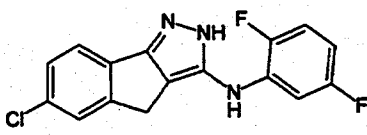
	١٢٤ ١٢٣
	١٢٦ ١٢٥
	١٢٨ ١٢٧
	١٣٠ ١٢٩
	١٣٢ ١٣١
	١٣٤ ١٣٣

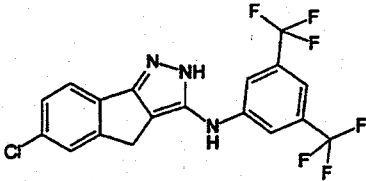
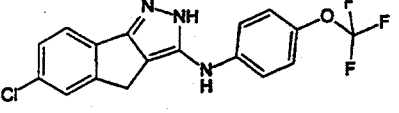
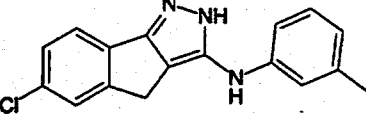
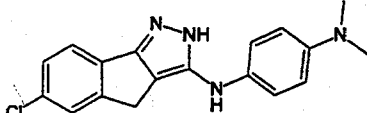
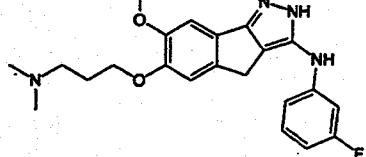
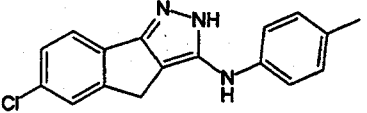
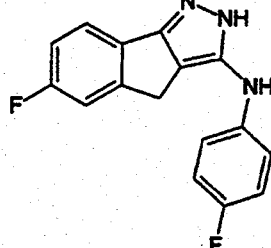
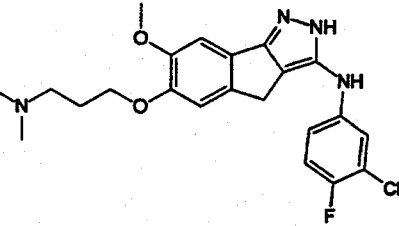
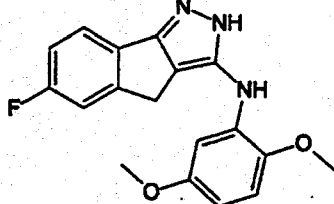
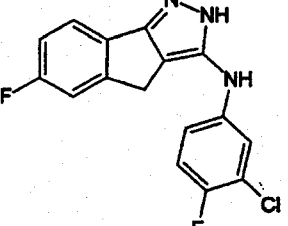
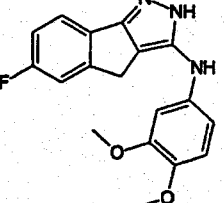
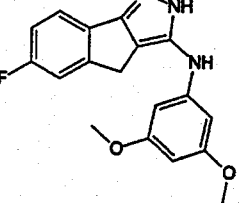
	١٣٦ ١٣٥ 
	١٣٨ ١٣٧ 
	١٤٠ ١٣٩ 
	١٤٢ ١٤١ 

	143		142
	146		140
	148		147
	100		149
	102		101
	104		103

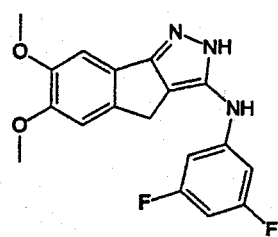
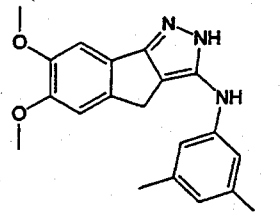
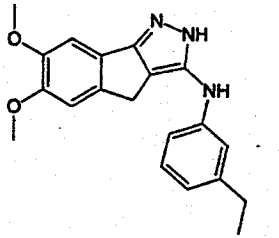
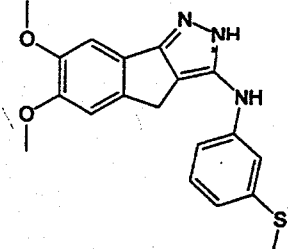
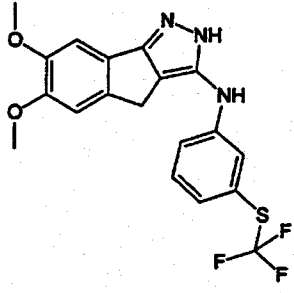
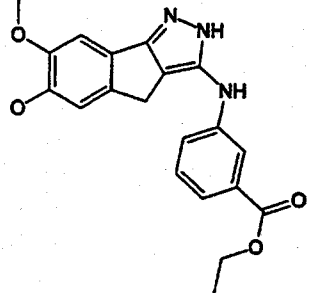
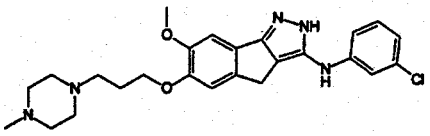
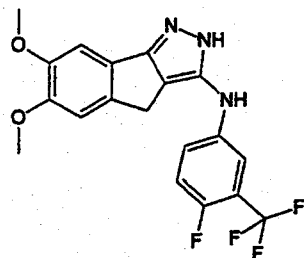
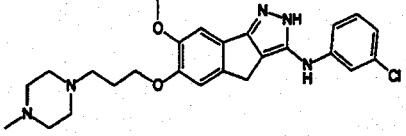
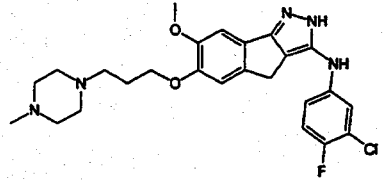
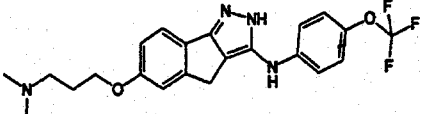
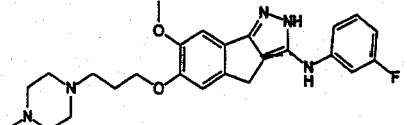
	106		100
	108		107
	169		109
	167		161
	160		163
	166		164

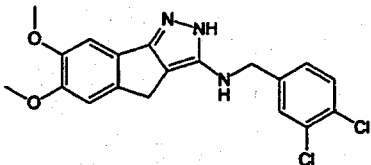
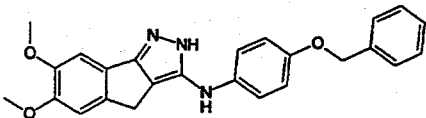
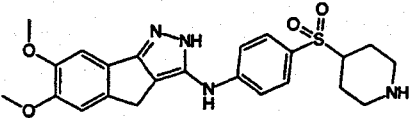
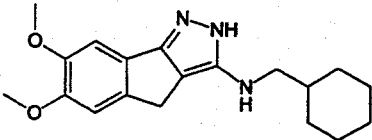
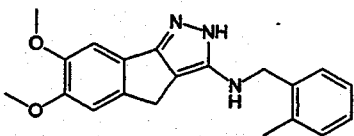
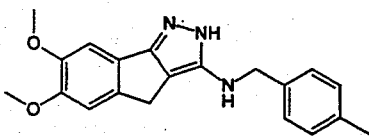
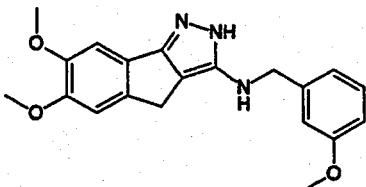
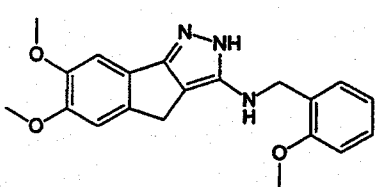
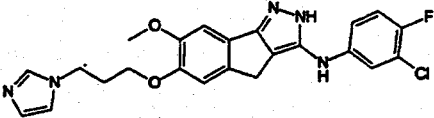
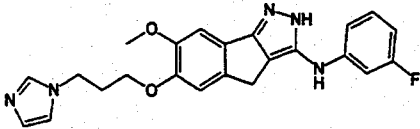
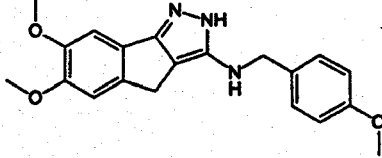
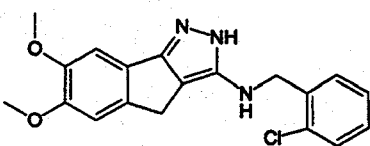
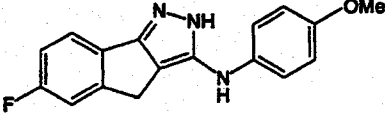
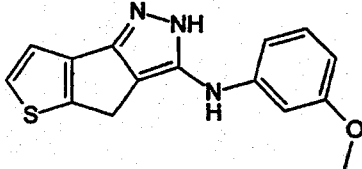
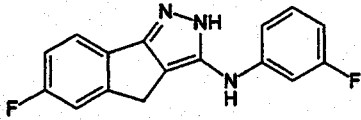
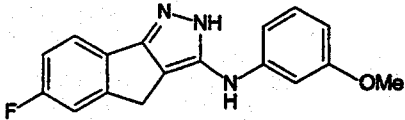
	179		178
	171		170
	173		172
	170		174
	177		176
	179		178

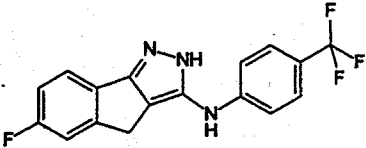
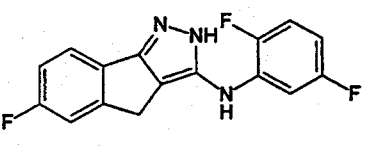
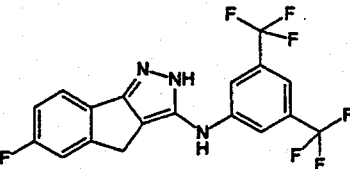
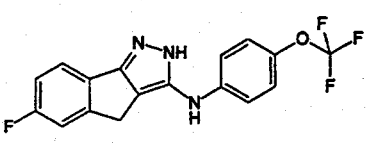
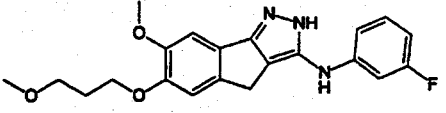
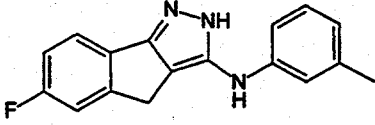
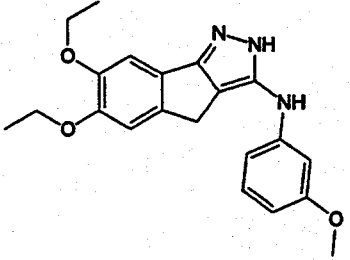
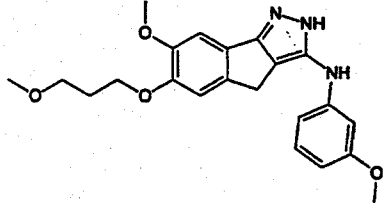
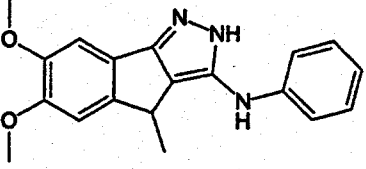
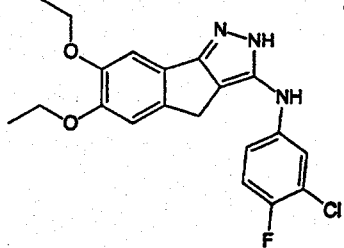
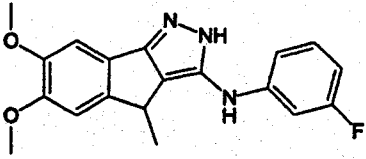
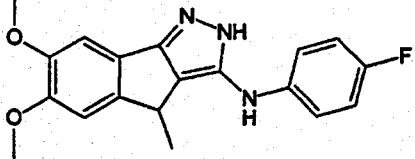
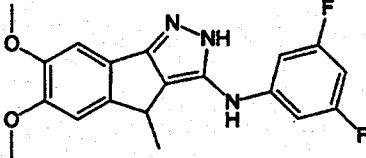
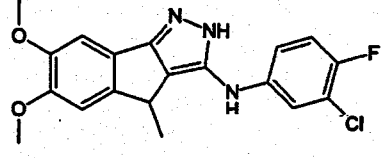
	۱۸۱		۱۸۰
	۱۸۳		۱۸۲
	۱۸۰		۱۸۴
	۱۸۷		۱۸۶
	۱۸۹		۱۸۸
	۱۹۱		۱۹۰
	۱۹۳		۱۹۲

	١٩٥  ١٩٦
١٩٧ 	 ١٩٨
١٩٩ 	
٢٠١ 	٢٠٢ 
٢٠٣ 	٢٠٤ 
٢٠٥ 	٢٠٦ 

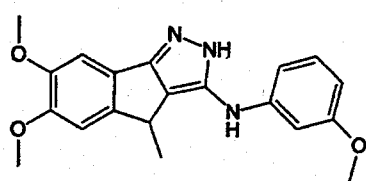
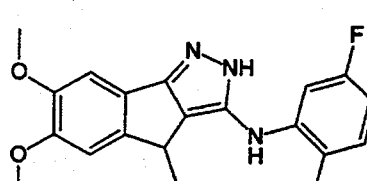
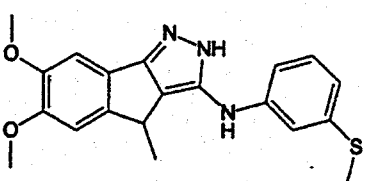
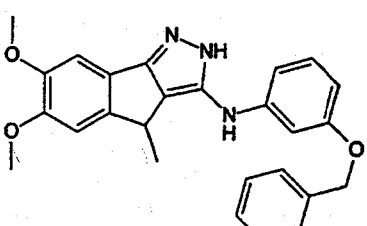
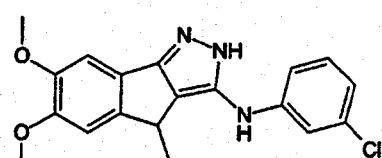
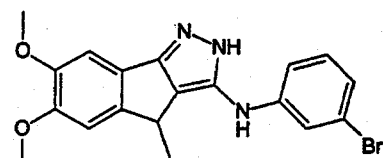
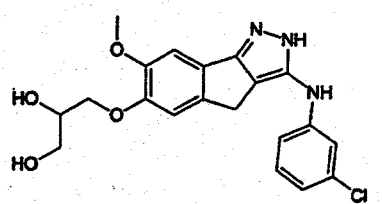
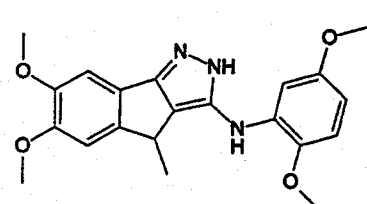
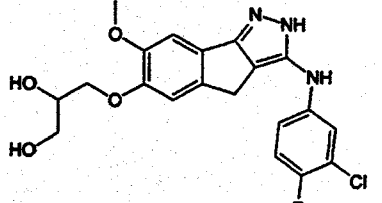
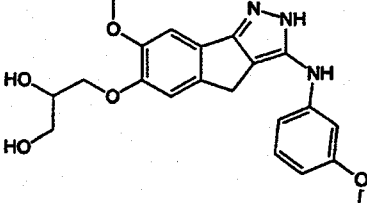
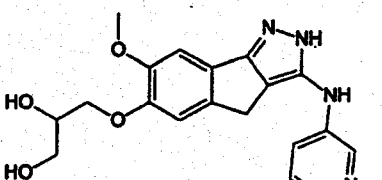
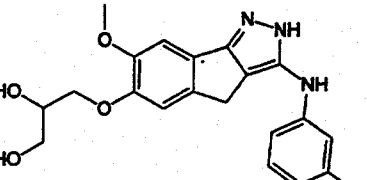
20.

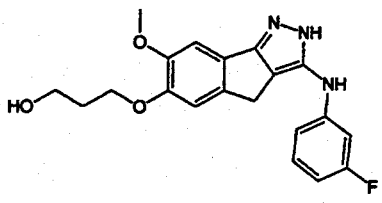
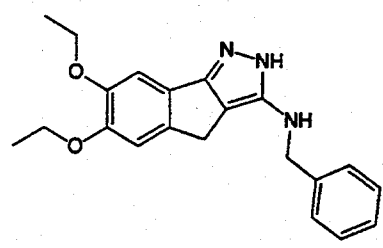
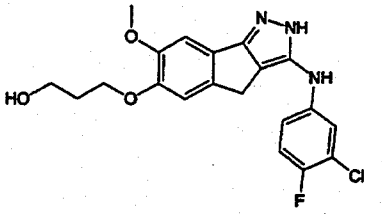
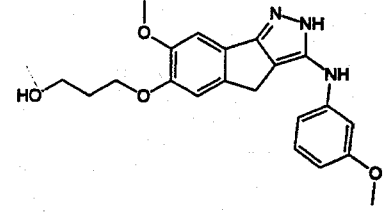
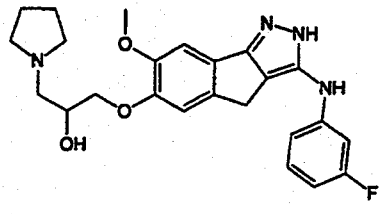
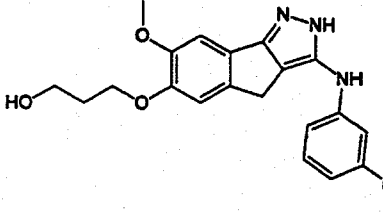
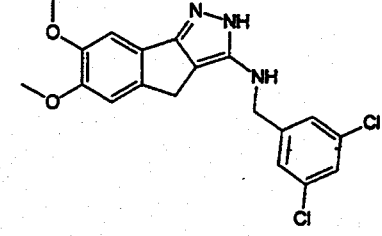
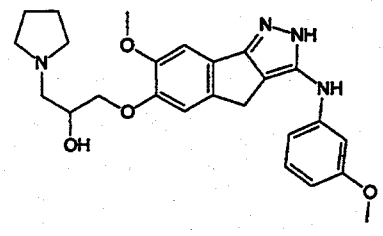
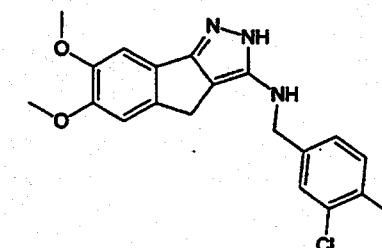
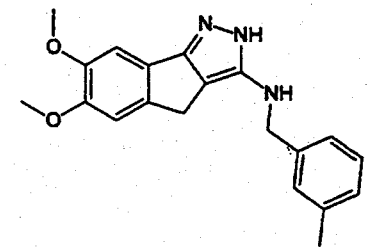
 207	 206
 209	 208
 211	 210
 213	 212
 215	 214
 217	 216

	219		218
	221		220
	223		222
	225		224
	227		226
	231		230
	233		232
	235		234

	237		236
	239		238
	242		240
	240		244
	247		246
	249		248
	251		250

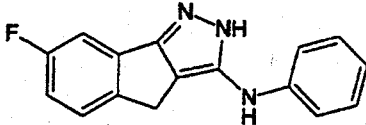
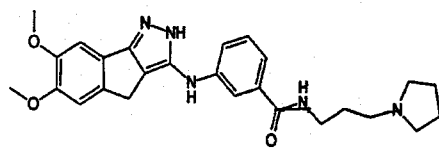
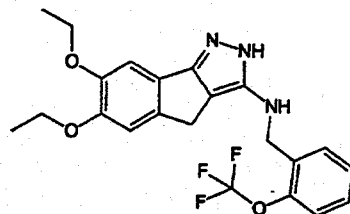
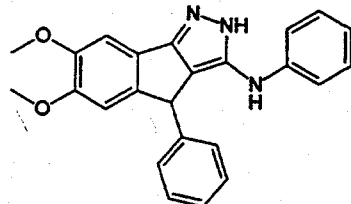
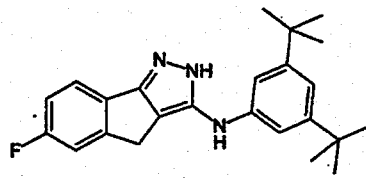
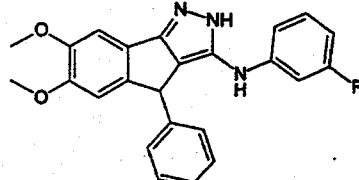
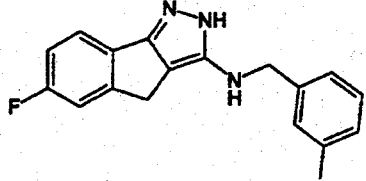
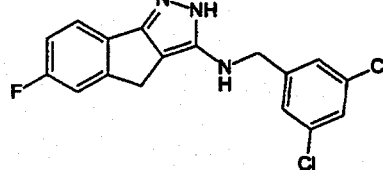
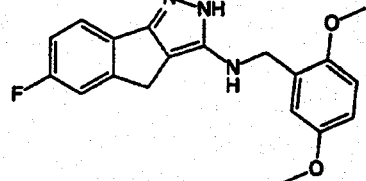
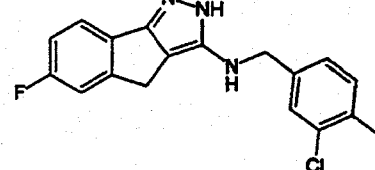
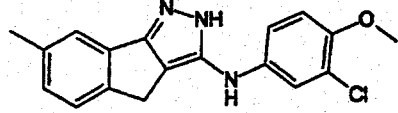
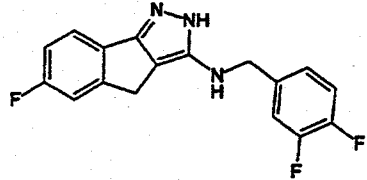
203

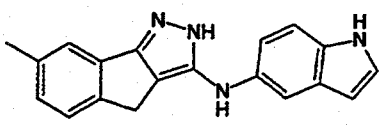
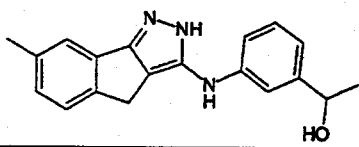
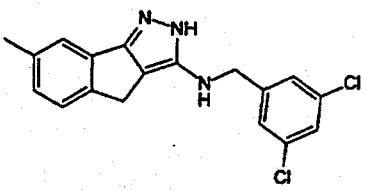
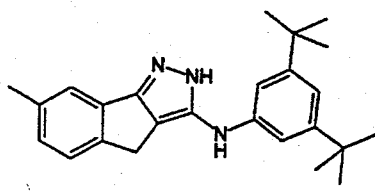
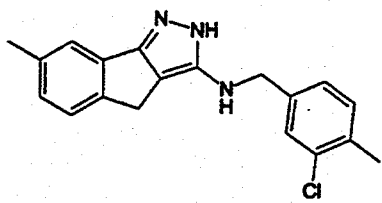
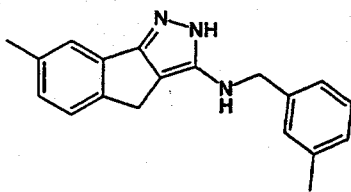
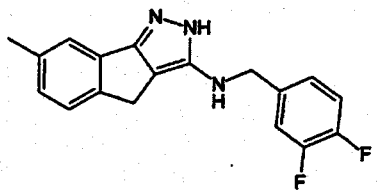
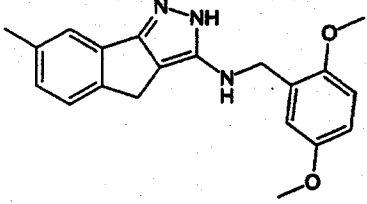
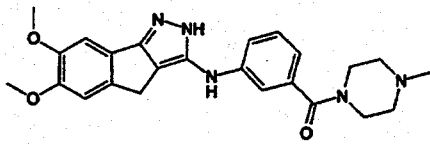
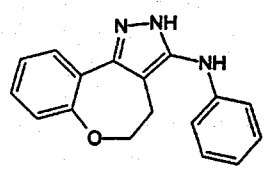
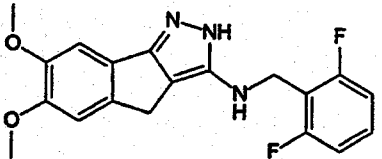
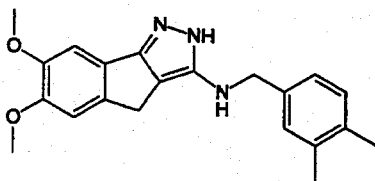
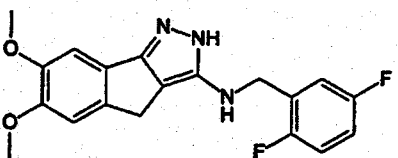
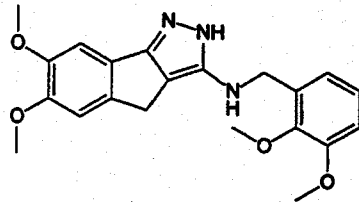
	203		204
	200		205
	207		206
	209		208
	261		260
	263		262

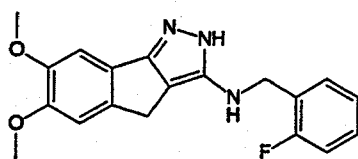
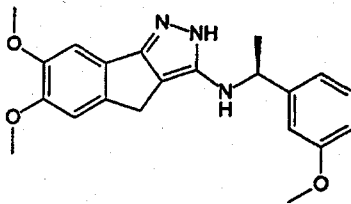
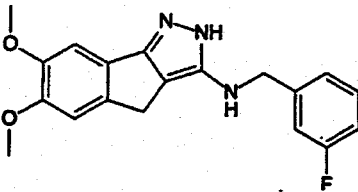
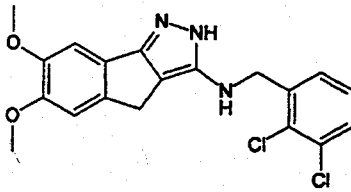
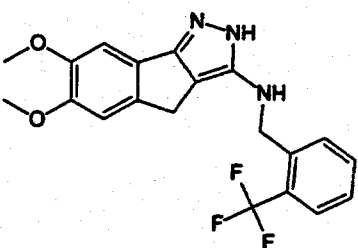
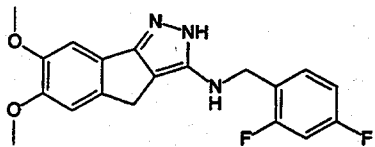
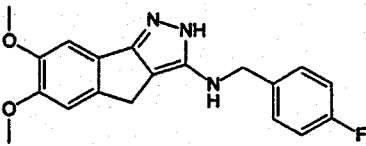
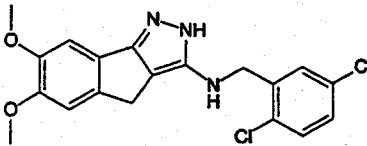
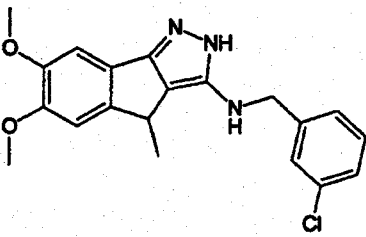
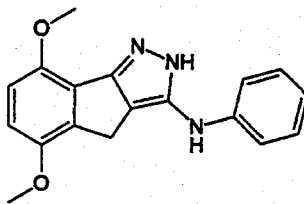
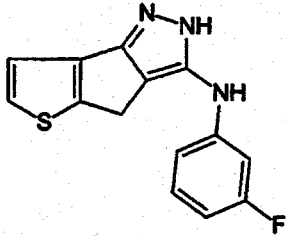
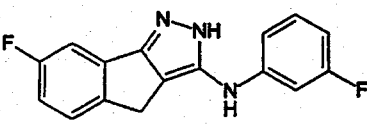
୧୧୦ 	୧୧୧ 
୧୧୨ 	୧୧୩ 
୧୧୪ 	୧୧୫ 
୧୧୬ 	୧୧୭ 
୧୧୮ 	୧୧୯ 

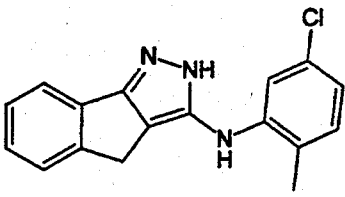
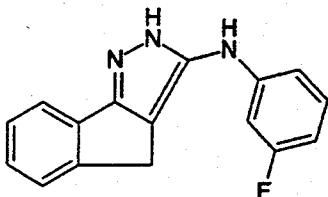
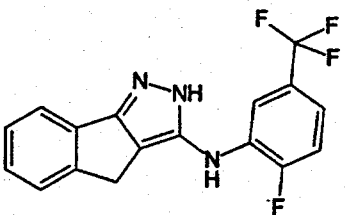
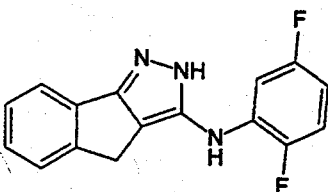
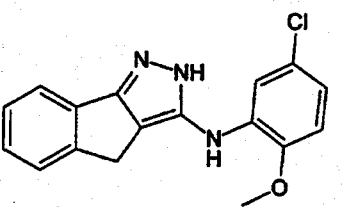
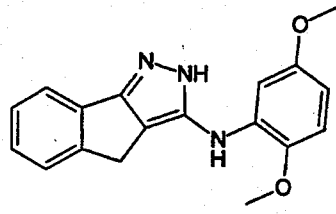
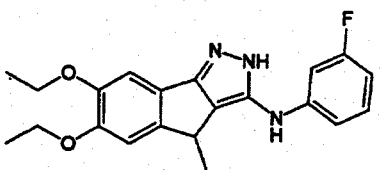
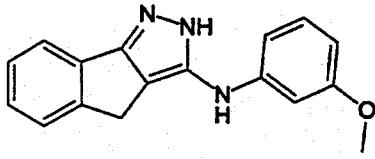
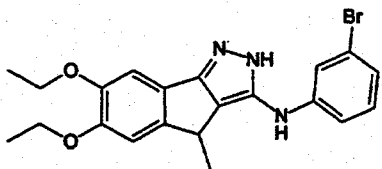
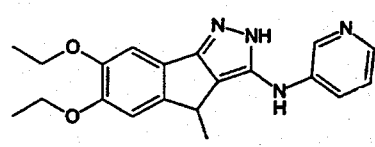
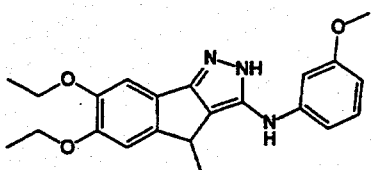
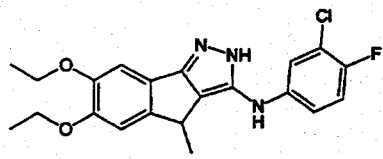
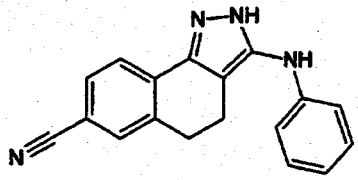
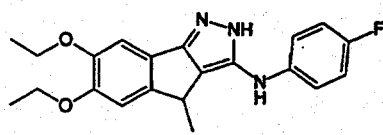
	275		276
	277		278
	279		280
	281		282
	283		284
	285		286

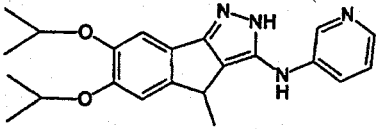
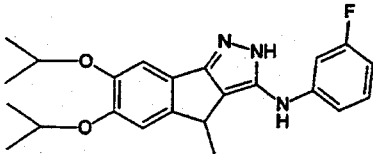
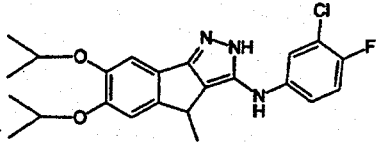
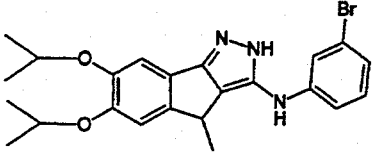
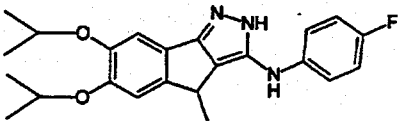
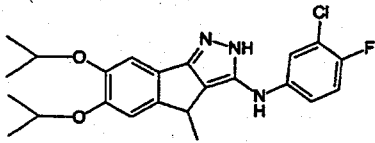
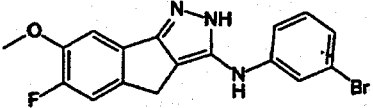
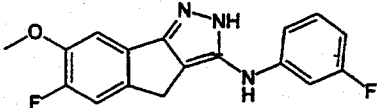
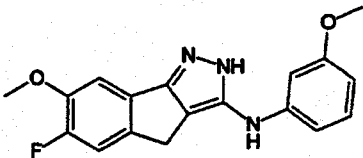
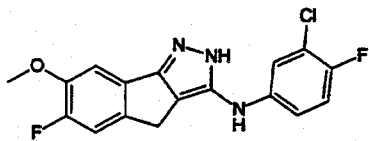
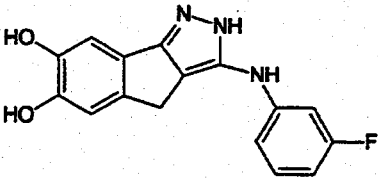
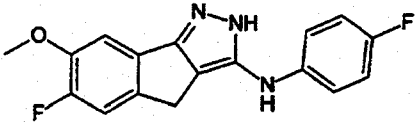
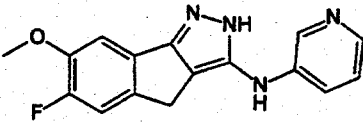
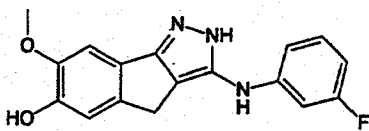
	287		286
	289		288
	291		290
	293		292
	290		294
	297		296

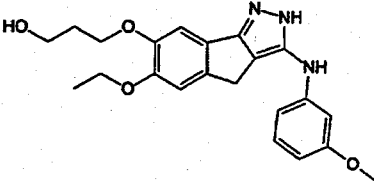
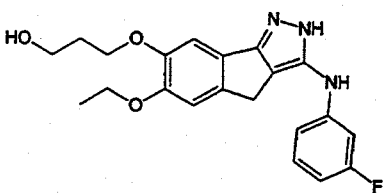
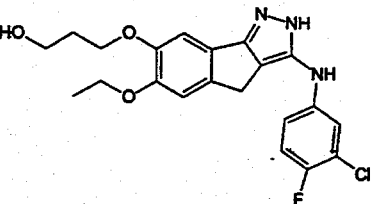
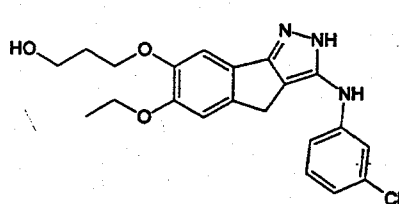
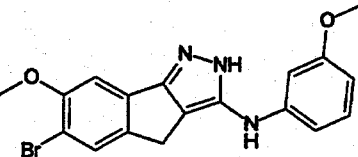
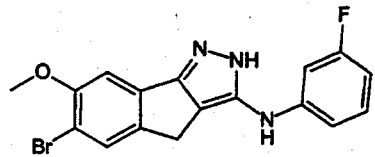
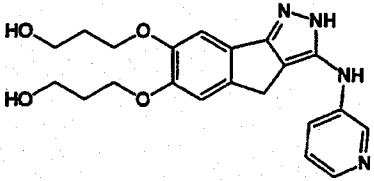
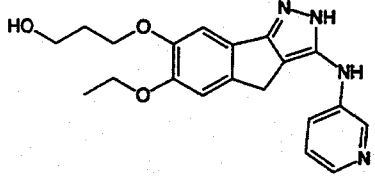
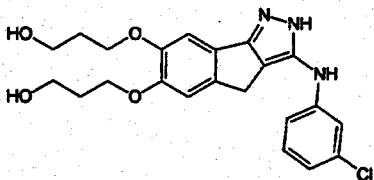
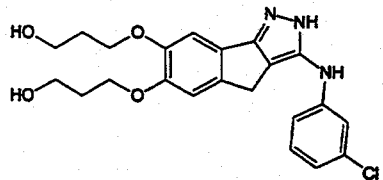
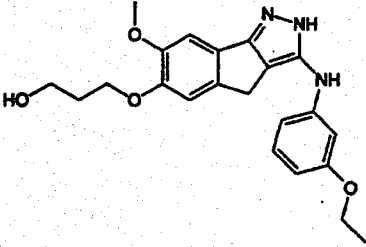
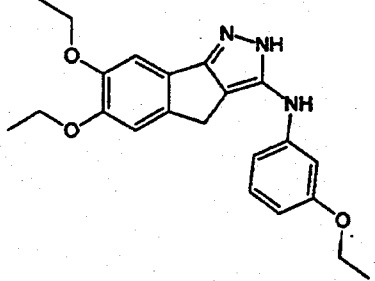
 299	 298
 291	 290
 292	 297
 290	 294
 297	 296
 299	 298

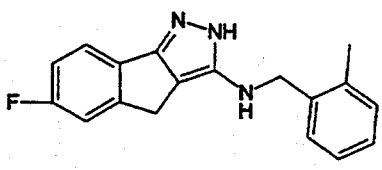
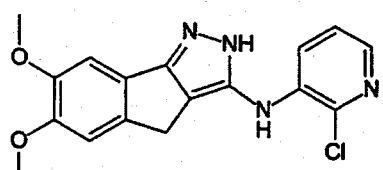
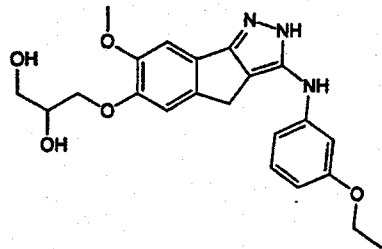
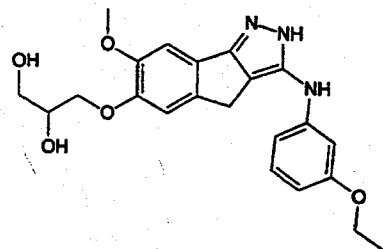
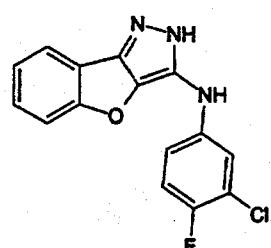
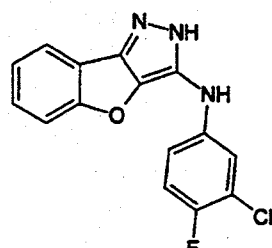
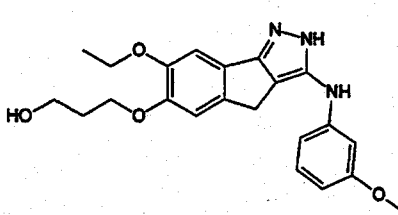
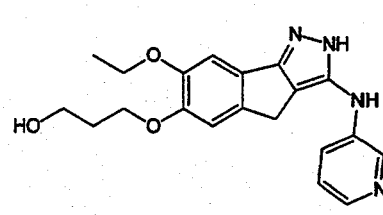
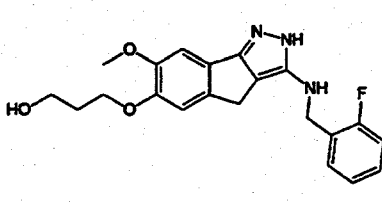
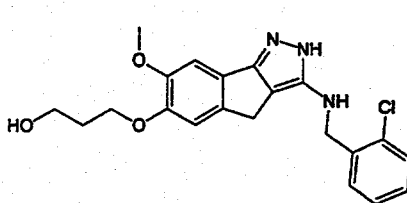
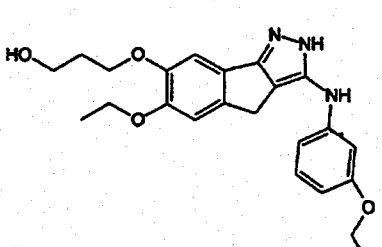
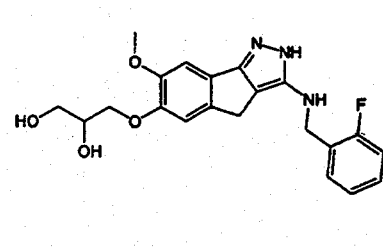
	311		310
	313		312
	310		314
	317		316
	319		318
	321		320
	323		322

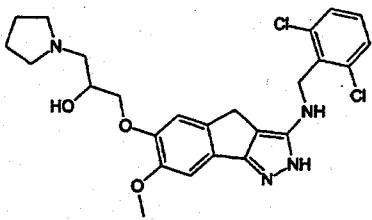
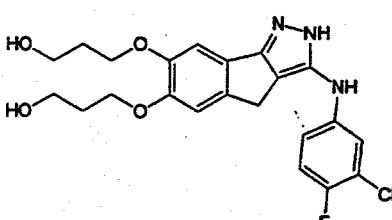
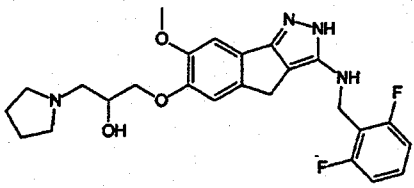
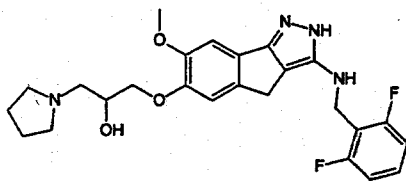
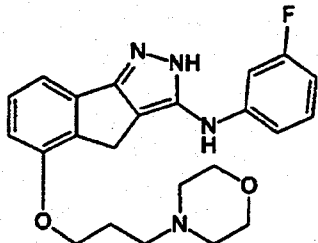
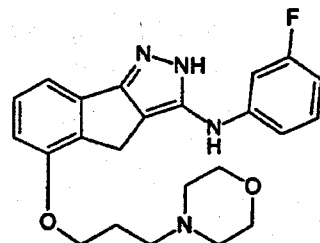
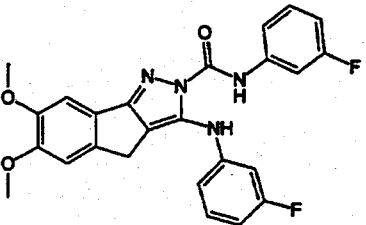
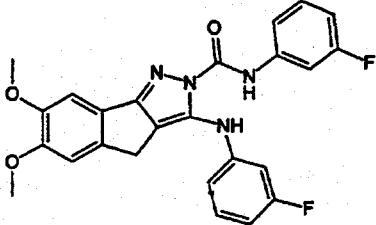
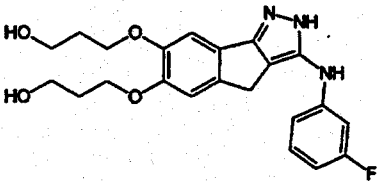
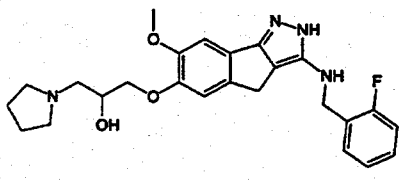
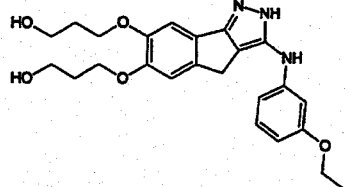
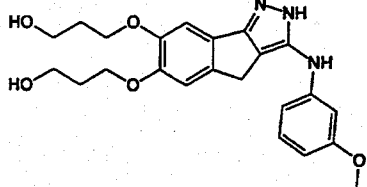
	320		324
	327		326
	329		328
	331		330
	333		332
	335		334

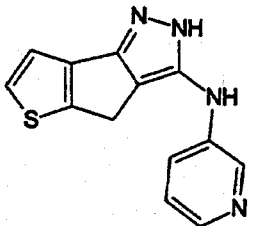
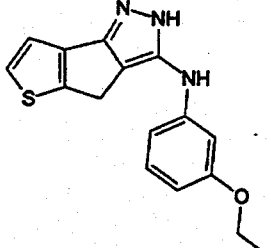
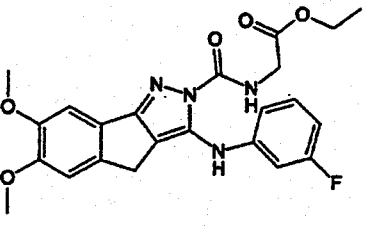
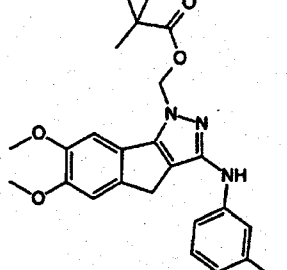
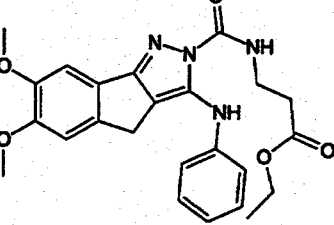
	۳۳۸		۳۳۷
	۳۴۰		۳۳۹
	۳۴۲		۳۴۱
	۳۴۴		۳۴۳
	۳۴۶		۳۴۵
	۳۴۸		۳۴۷
	۳۵۰		۳۴۹

	302		301
	304		303
	306		300
	308		307
	36.		309
	362		361
	364		363

	366		365
	368		367
	370		369
	372		371
	374		373
	376		375

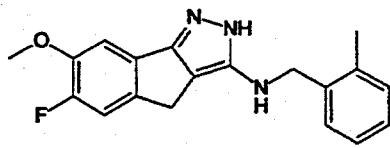
	۳۷۸		۳۷۷
	۳۸۰		۳۷۹
	۳۸۲		۳۸۱
	۳۸۴		۳۸۳
	۳۸۶		۳۸۵
	۳۸۸		۳۸۷

	390. 389 
	392 391 
	394 393 
	396 390 
	398 397 
	401 400 

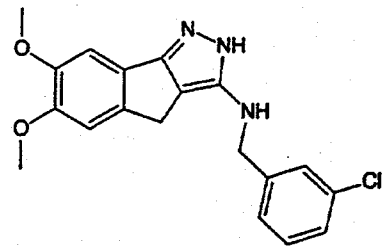
	٤.٢
	٤.٣
	٤.٤
	٤.٥
	٤.٦

	٤١٣		٤١٢
	٤١٥		٤١٤
	٤١٧		٤١٦
	٤١٩		٤١٨
	٤٢١		٤٢٠
	٤٢٣		٤٢٢

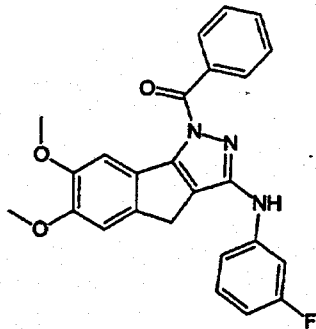
٤٢٥



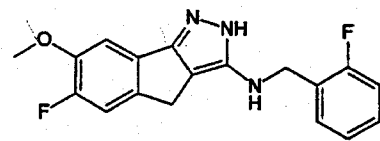
٤٢٤



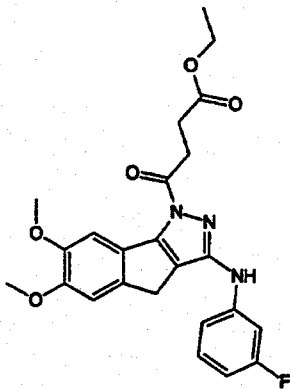
٤٢٧



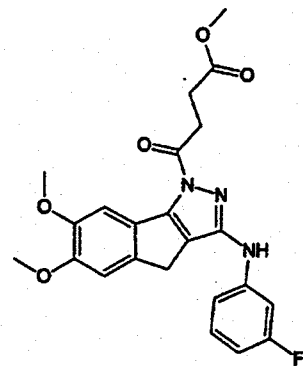
٤٢٦



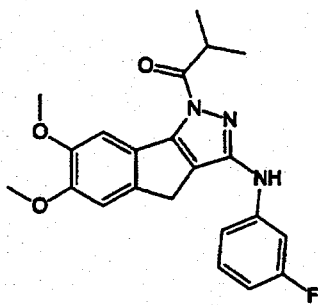
٤٢٩



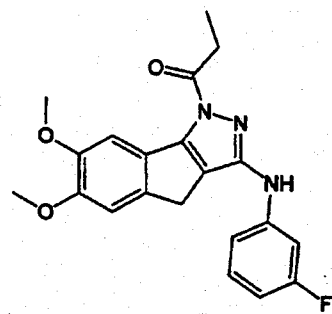
٤٢٨

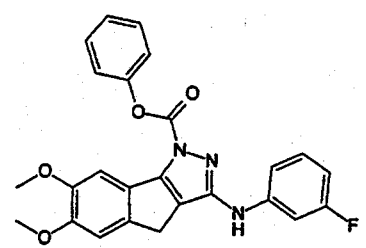
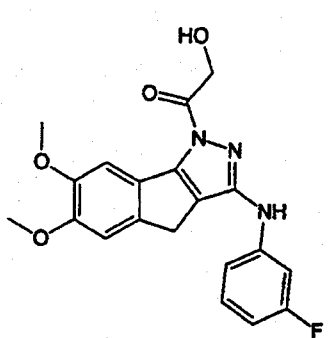
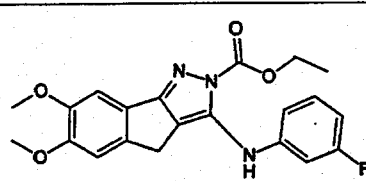
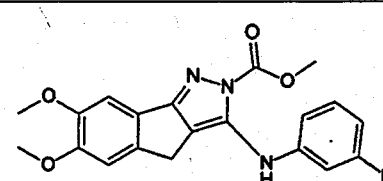
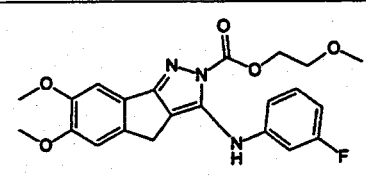
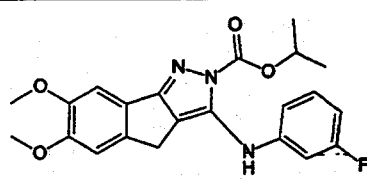
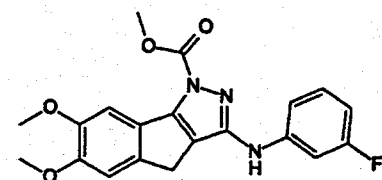
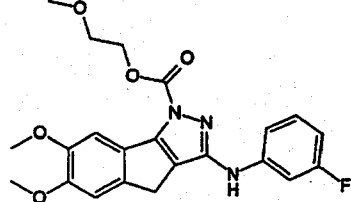
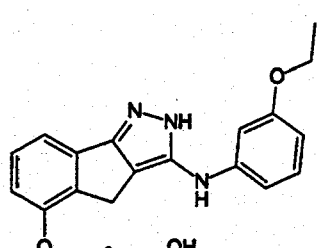
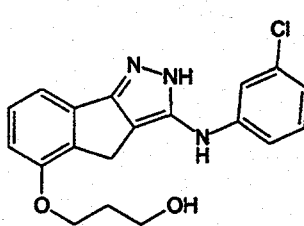
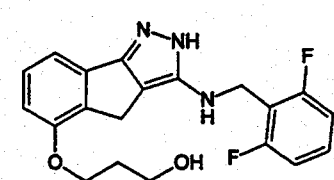
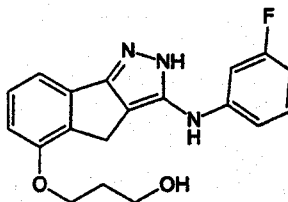


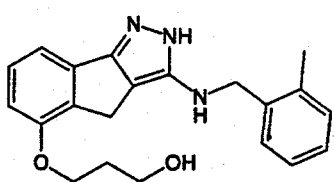
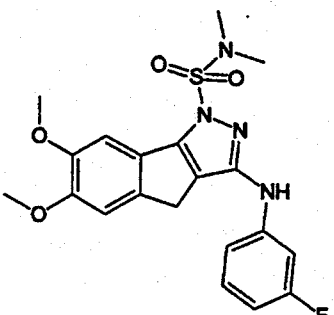
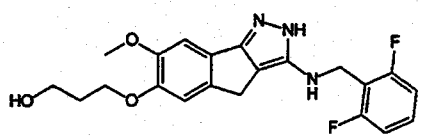
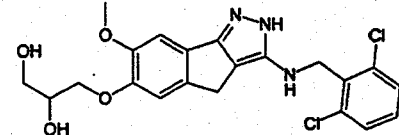
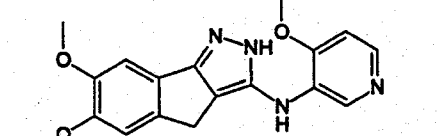
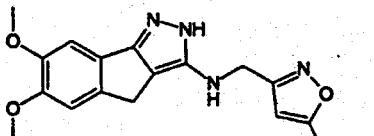
٤٣١



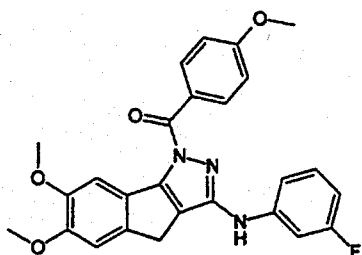
٤٣٠



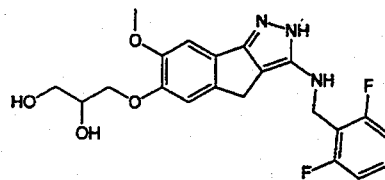
۴۳۳ 	۴۳۲ 
۴۳۵ 	۴۳۴ 
۴۳۷ 	۴۳۶ 
۴۳۹ 	۴۳۸ 
۴۴۱ 	۴۴۰ 
۴۴۳ 	۴۴۲ 

	٤٤٠ ٤٤٤
	٤٤١ ٤٤٥
	٤٤٢ ٤٤٦
	٤٤٣ ٤٤٧
	٤٤٤ ٤٤٨
	٤٤٥ ٤٤٩

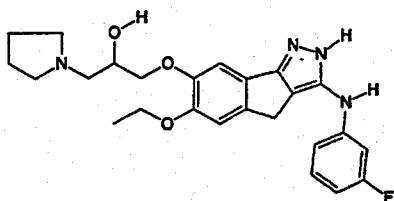
۴۵۸



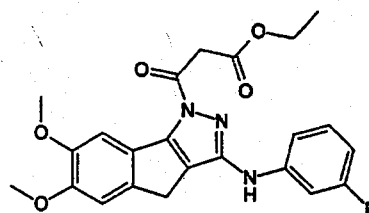
۴۵۷



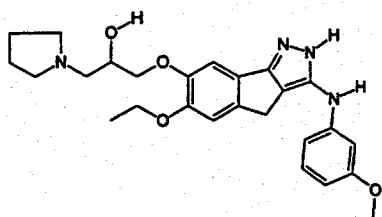
۴۶۰



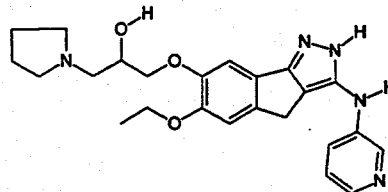
۴۵۹



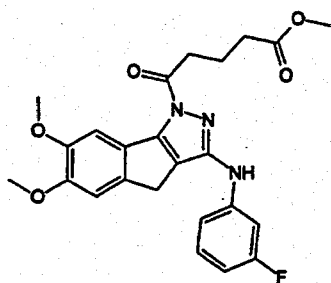
۴۶۲



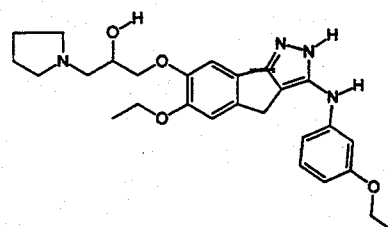
۴۶۱



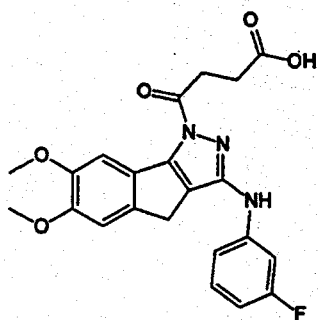
۴۶۴



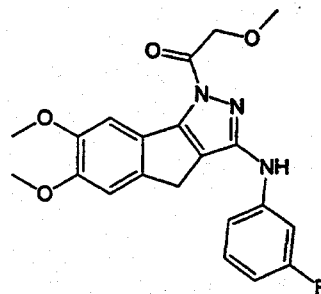
۴۶۳

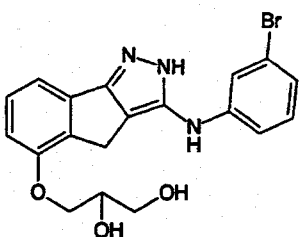
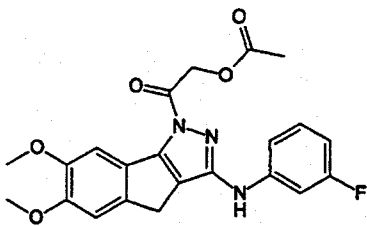
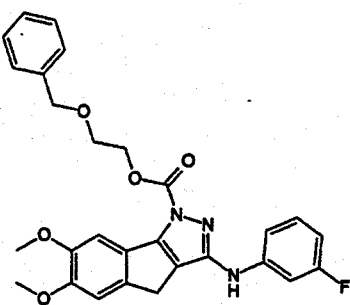
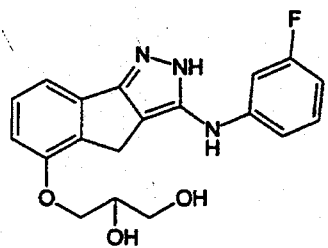
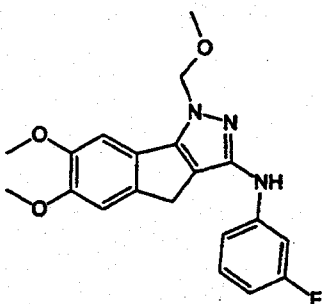
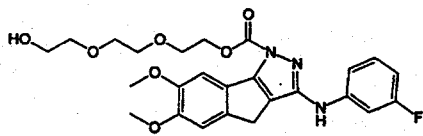
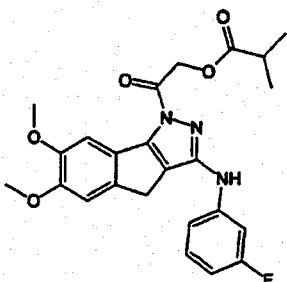
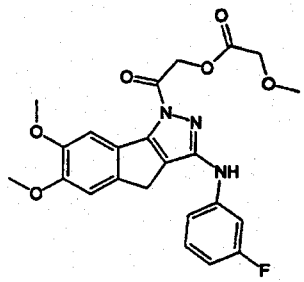


۴۶۶

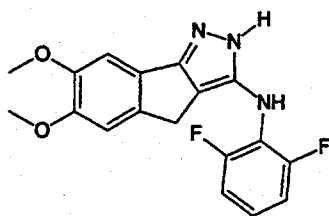


۴۶۵

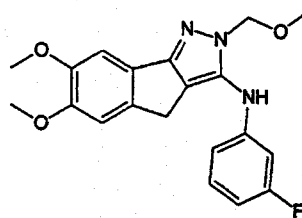


	٤٧٨ ٤٧٧ 
٤٧٠ 	٤٧٩ 
٤٧٢ 	٤٧١ 
٤٧٤ 	٤٧٣ 

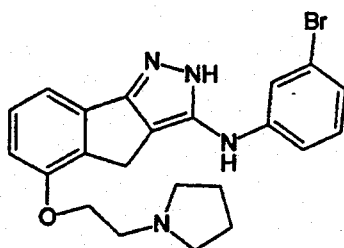
۴۷۶



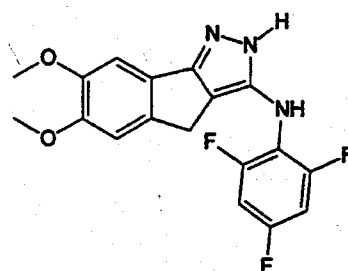
۴۷۵



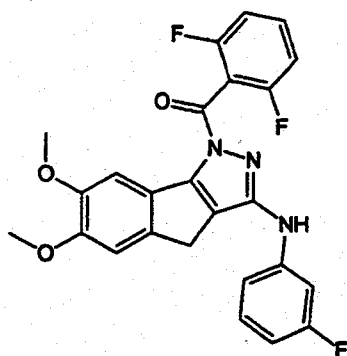
۴۷۸



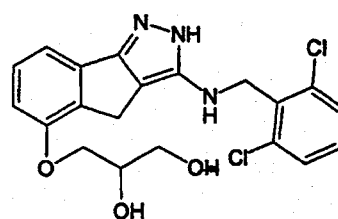
۴۷۷



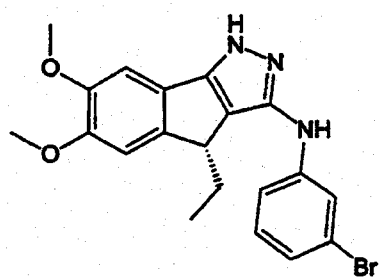
۴۸۰



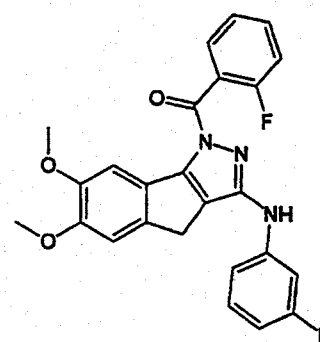
۴۷۹



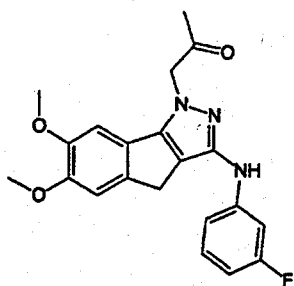
۴۸۲



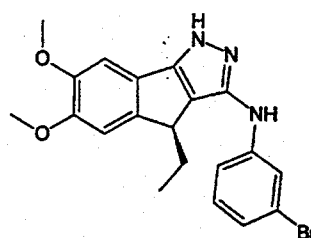
۴۸۱



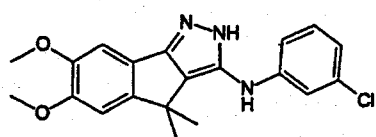
۴۸۴



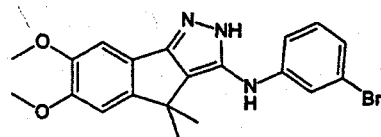
۴۸۳



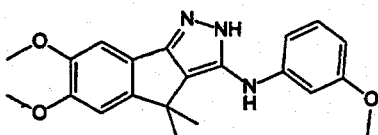
۴۸۶



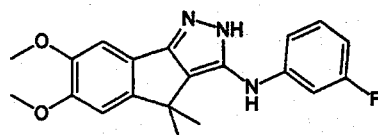
۴۸۵



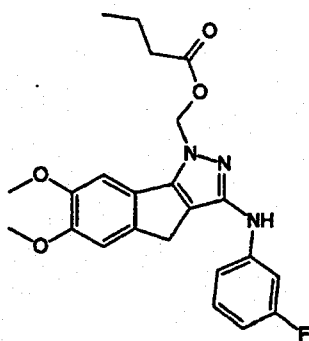
۴۸۸



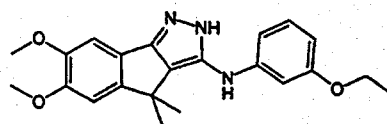
۴۸۷



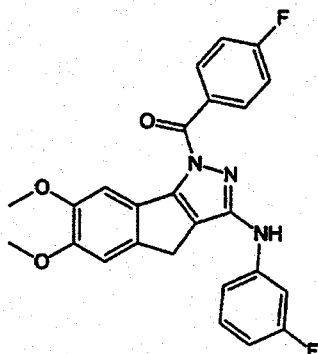
۴۹۰



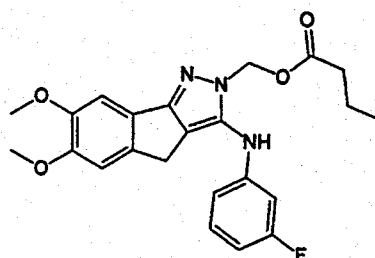
۴۸۹

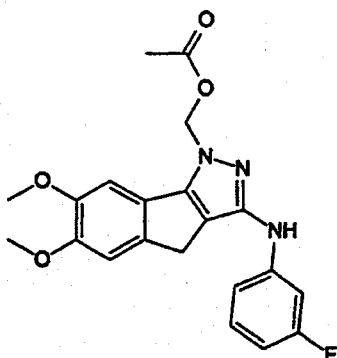


۴۹۲

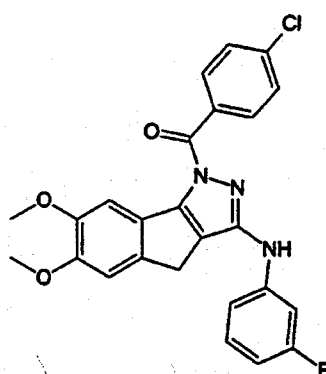


۴۹۱

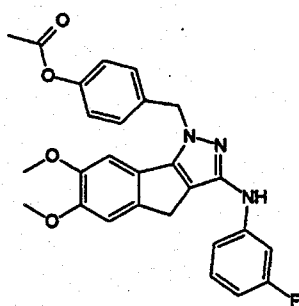




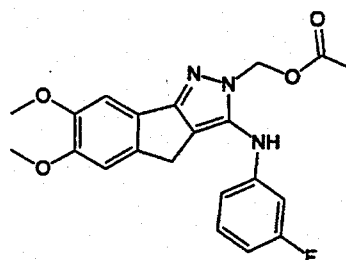
٤٩٦



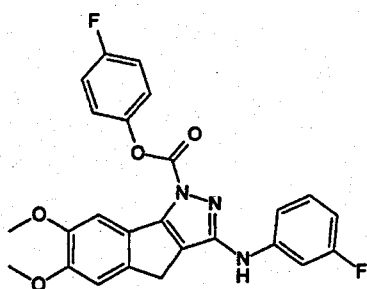
६९६



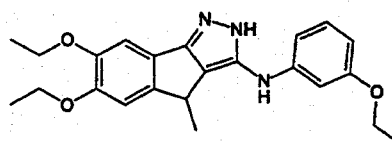
٤٩٨



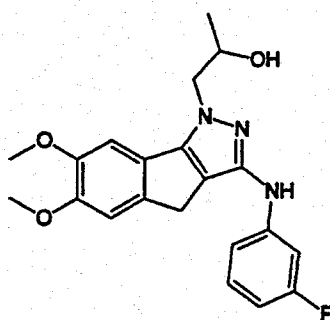
٤٩٧



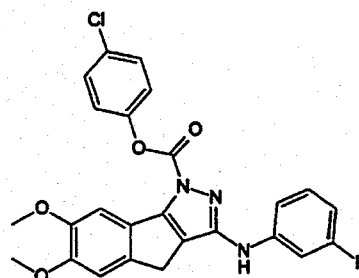
0. 0.



Σ 99

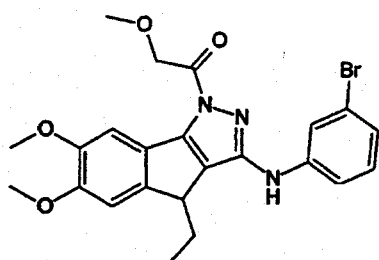


0.2

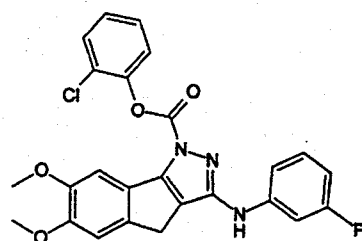


0.1

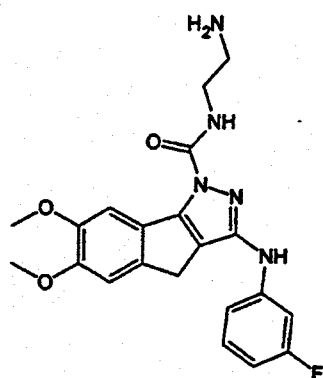
	0.4		0.3
	0.6		0.0
	0.1		0.9
	0.12		0.11



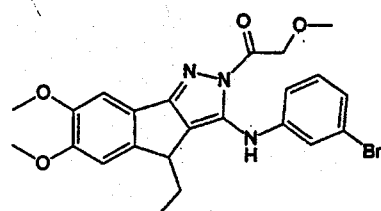
۵۱۴



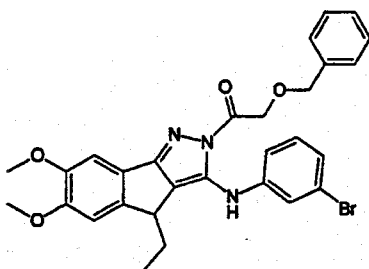
۵۱۳



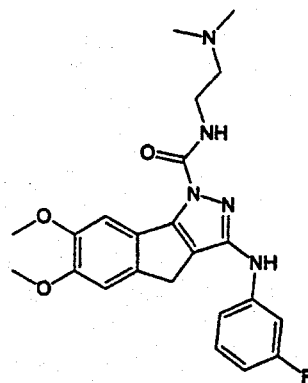
۵۱۶



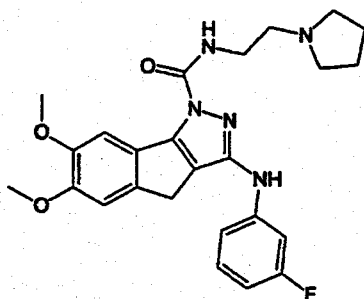
۵۱۵



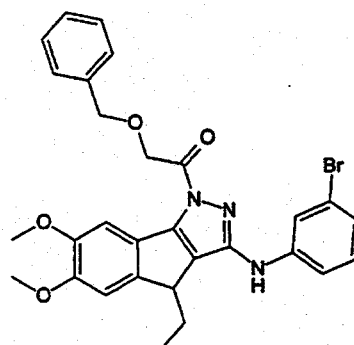
۵۱۸



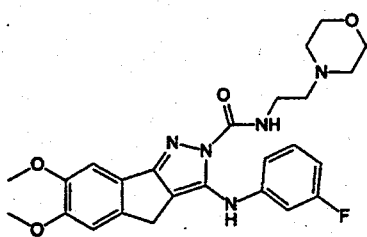
۵۱۷



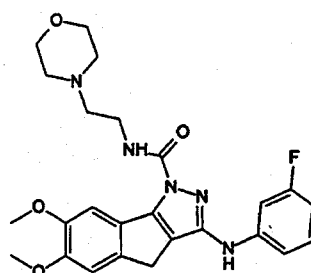
۵۲۰



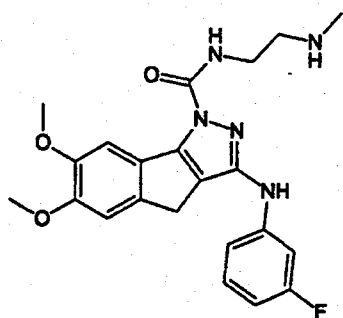
۵۱۹



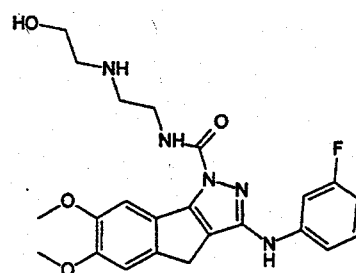
۵۲۲



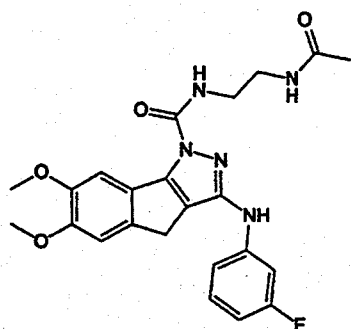
۵۲۱



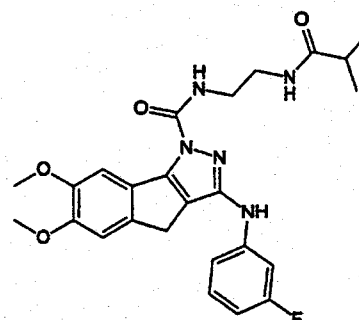
۵۲۴



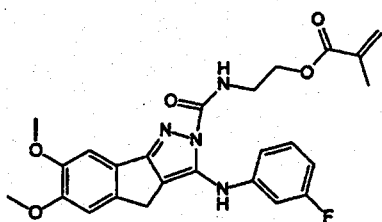
۵۲۳



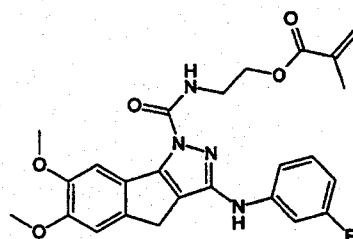
۵۲۶



۵۲۵

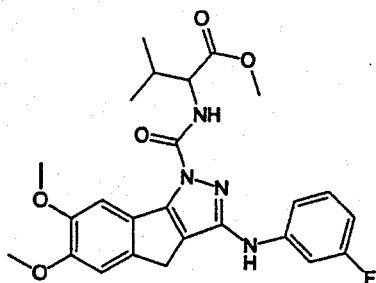


۵۲۸

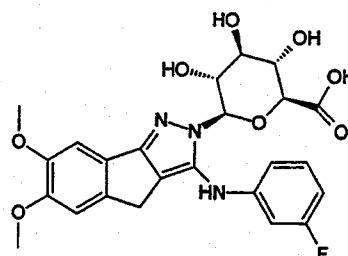


۵۲۷

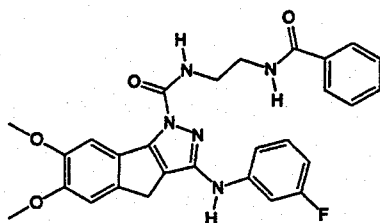
030



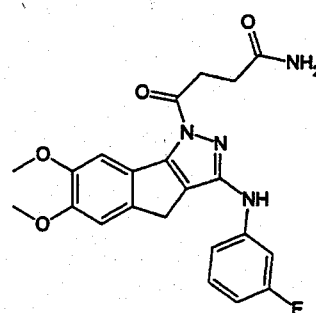
031



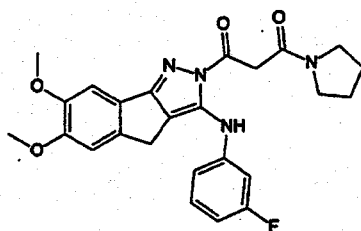
032



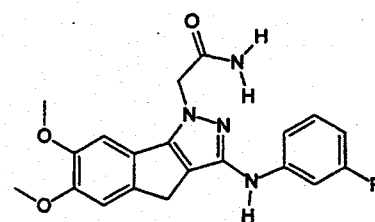
033



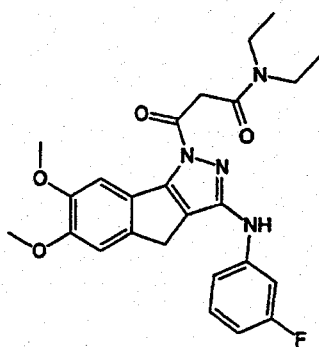
034



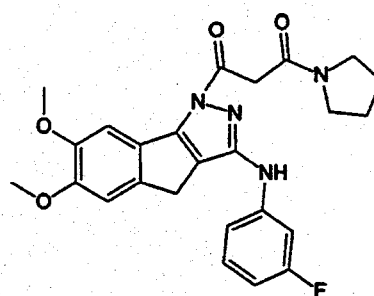
035

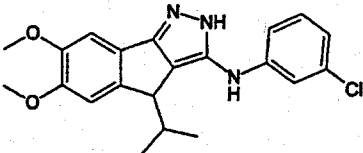
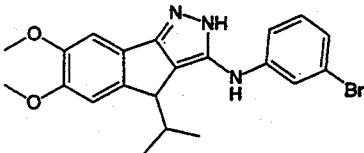
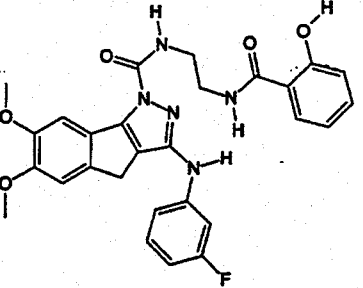
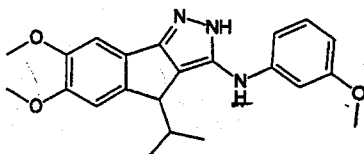
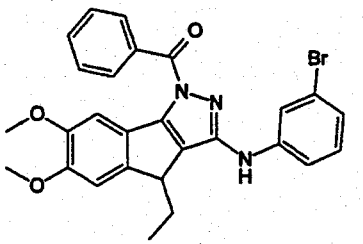
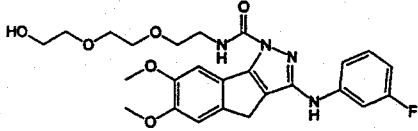
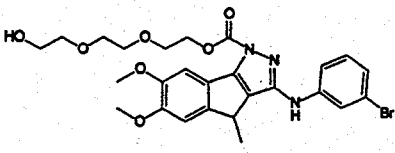
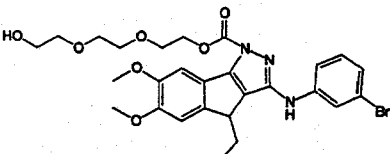
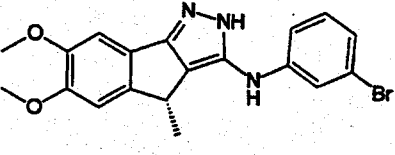
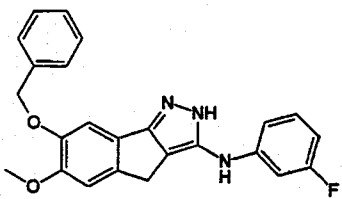
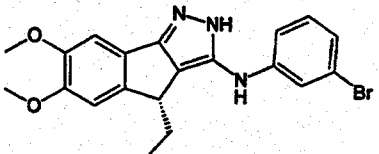
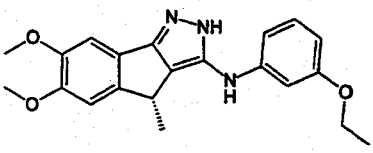


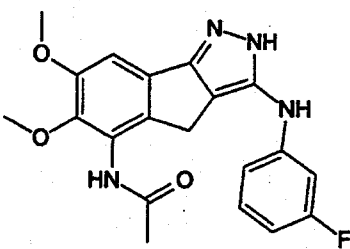
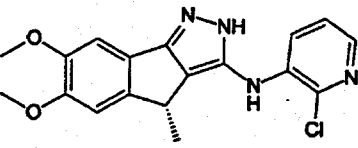
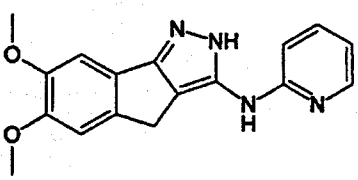
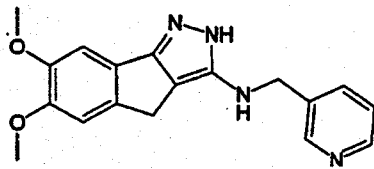
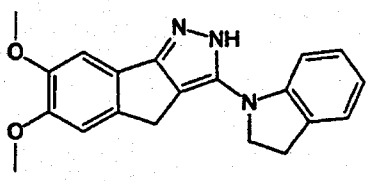
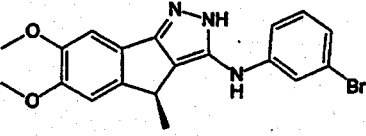
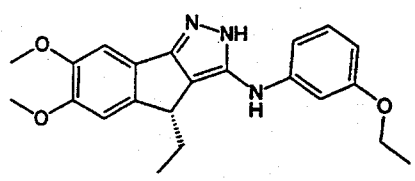
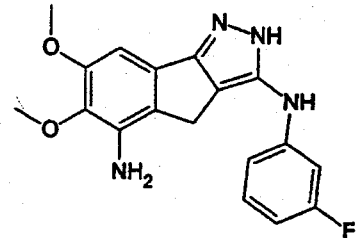
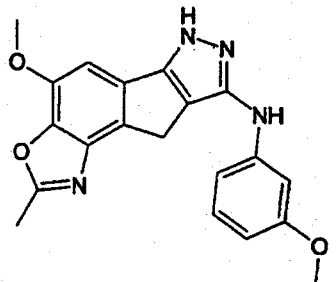
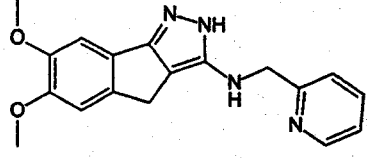
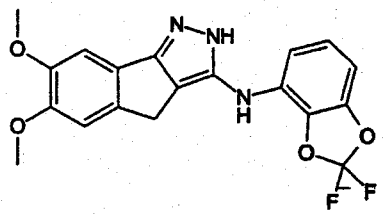
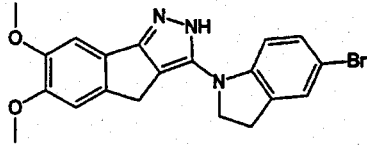
036

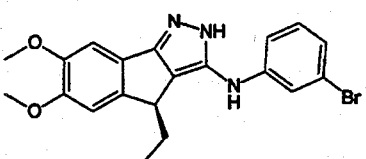
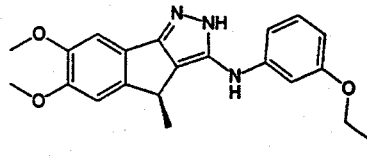
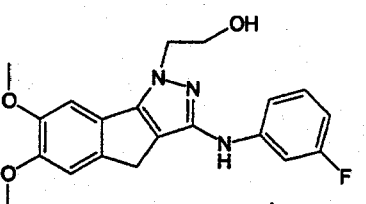
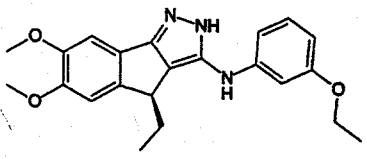
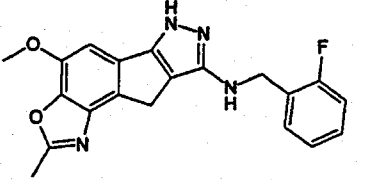
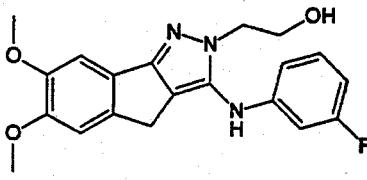
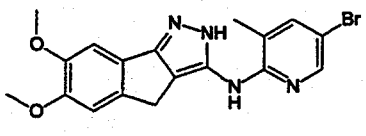
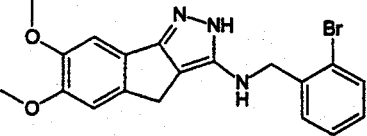
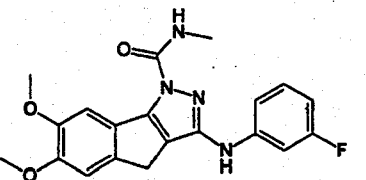
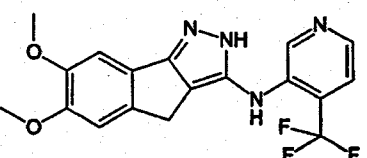
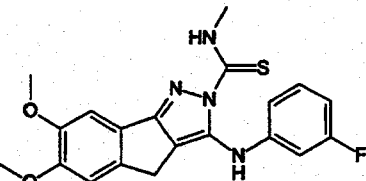
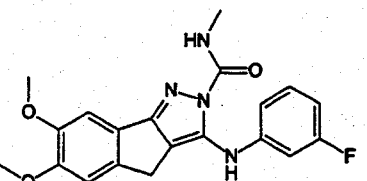


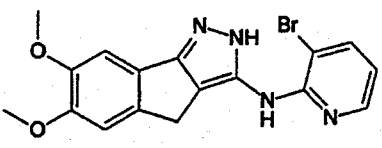
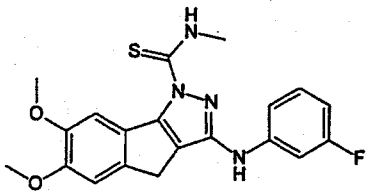
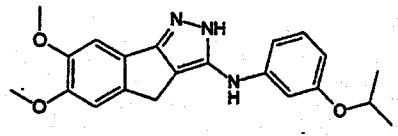
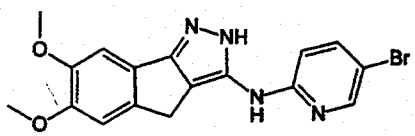
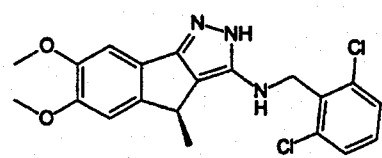
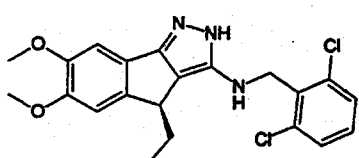
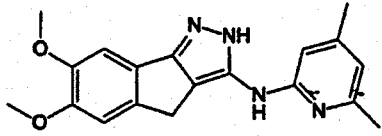
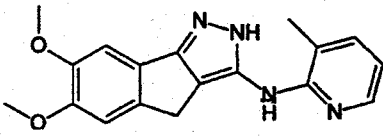
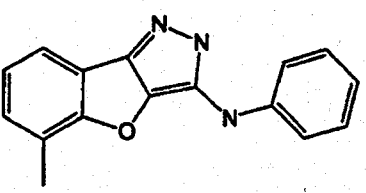
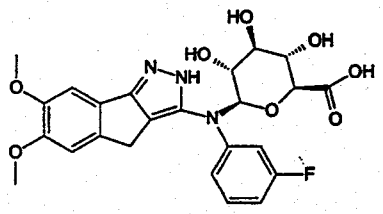
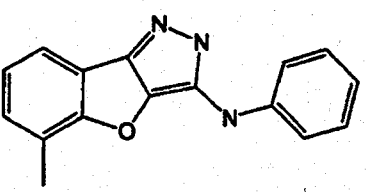
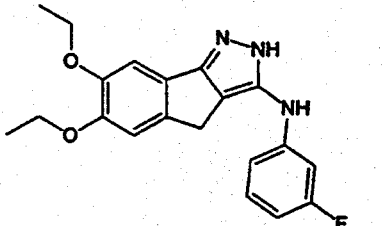
037



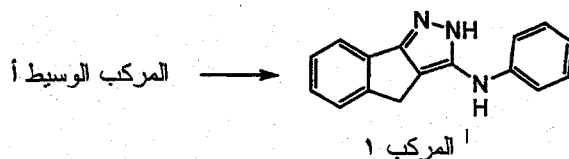
	۰۴۰ ۰۳۸ 
	۰۴۲ ۰۴۱ 
	۰۴۶ ۰۴۳ 
	۰۴۸ ۰۴۷ 
	۰۰۳ ۰۴۹ 
	۰۰۰ ۰۰۴ 

	007
	009
	062
	064
	066
	068
	006
	008
	061
	063
	065
	067

	070.		079
	072		071
	073		074
	076		075
	078		077
	080.		079

	۵۸۲ ۵۸۱ 
	۵۸۳ 
	۵۸۴ 
	۵۸۵ 
	۵۸۶ 
	۵۸۷ 

	7.2		098
	7.0		7.4
	7.7		7.6
	7.9		7.8
	7.11		7.10

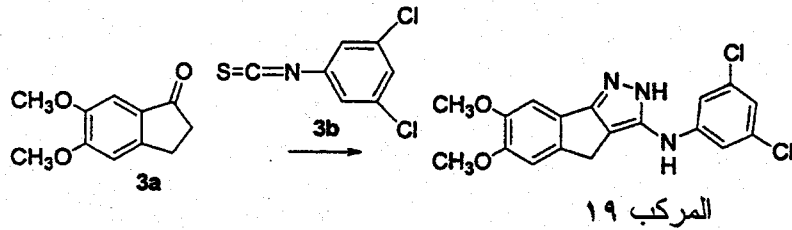


مزج ٠,٣٥ جم (١,٣١ ملي مول) من فنييل أميد لحمض ١-أكسو-اندان-٢-كربوثيريوك، (المركب الوسيط أ)، ٢ مل من الايثانول و٠,٠٤٣ مل (١,٣٨ ملي مول) من الهيدرازين في قارورة في جو من الأرجون. وسخن مزيج التفاعل بواسطة حمام بخار لمدة ساعة واحدة، ثم برد وبخر المذيب حتى حصل على زيت لونه بني. وأذيب الزيت فيما بعد في CH_2Cl_2 وغسل باستخدام HCl تركيزه ١ عياري، NaOH تركيزه ٣ عياري ومحلول ملحي. وجفف ٠,٣١ جم من المركبات العضوية الناتجة فوق Na_2SO_4 ، رشح، وأزيل المذيب في خواء. وفصل المنتج باستشراب على هلام السليكا بالتصويل باستخدام مزيج من ميثانول: كلوريد ميثيلين تركيزها ٢%. وبُلولر المركب المسمى بالعنوان (المركب ١) بعد ذلك في مزيج من مثيل هكسان حلقي: تولوين في صورة مادة صلبة لونها أبيض. درجة الانصهار: ١٤٨-١٤٩ م؛ ط ك ك/ش ٢٤٨ (ص+ H^+)؛

^1H ر ن م $((\text{CD}_3)_2\text{SO})$: ٣,٥ (ف، H_2)، ٦,٧٥ (ث، H_1)، ٧,٣-٧,٠ (عـ، H_5)، ٧,٣٥ (ث، H_1)، ٧,٥ (ز، H_2)، ٨,٤ (ف، H_1)، ١٢,٣ (ف، H_1).

المثال ٣

(٥,٣-ثاني كلورو-فنييل)-(٧,٦-ثاني ميثوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو
[٢,١-ج-] بيرازوليل (٣)-أمين، المركب ١٩ (الطريقة أ)



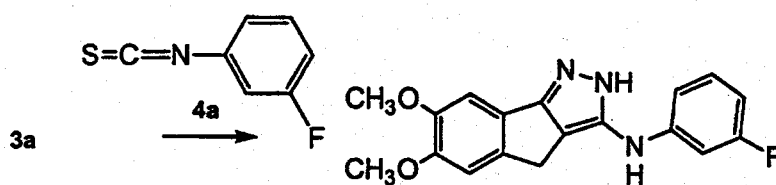
أضيف مزيج من ٤ جم (٠,٠٢١ مول) من ٦,٥-ثاني ميثوكسي اندانون (١)، المركب 3a، ٤,٤٥ جم (٠,٠٢٢ مول) من أيزوثيروسيانات ٥,٣-ثاني كلوروفنييل، المركب 3b، و ٣٠ مل من THF إلى ٢٦,٩ مل (٠,٢٦٩ مول) من سداس مثيل ثاني سيلان ليثيوم نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وأضيف ١,٠٤ (٠,٠٣٢ مول) من الهيدرازين و ١,٦٥ مل من حمض الأسيتيك إلى مزيج التفاعل، الذي قلب فيما بعد عند درجة حرارة الغرفة لمدة ١٢

ساعة. واستمر التفاعل عند ٧٥°م طوال الليل. وخففت المركبات العضوية الناتجة أولاً باستخدام ١٠٠ مل من أسيتات الاثيل، ثم غسلت باستخدام الماء والمحول الملحي، جففت فوق Na_2SO_4 ، وأزيل المذيب في خواء. وأعيدت بلورة الركازات الكيميائية في الإيثانول. ومزج الناتج الأول والثاني من المادة الصلبة وأذيب في CH_3CN ساخن، حيث أضيف حجم مكافئ من محلول HCl -اينثر لترسيب المركب المسمى بالعنوان (المركب ١٩)، الذي جمع وجفف في خواء عند ٦٠°م، درجة الانصهار $< ٢٧٠^\circ\text{م}$ ؛ ط ك ك/ش ٣٧٦ و ٣٧٨ (ص+H)⁺؛
 ^1H ر ن م $(\text{CD}_3)_2\text{SO}$: ٣,٤٤ (ف، H٢)، ٣,٨٣ (ف، H٣)، ٣,٨٢ (ف، H٣)، ٦,٩٣ (ف، H١)، ٧,١٩ (ف، H١)، ٧,٢١ (ف، H١)، ٧,٣٥ (ف، H٢).

المثال ٤

(٣-فلورو-فنييل)-(٧,٦-ثاني مثنوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [١,٢-ج-])

بيرازوليل (٣)-أمين، المركب ١٤ (الطريقة أ)



المركب ١٤

أضيف مزيج من ٣,٠ جم (٠,٠١٥٤ مول) من ٦,٥-ثاني مثنوكسي اندانون (١)، المركب 3a، ٢,٤ جم (٠,٠١٥٧ مول) من أيزوثيوسيانات ٣-فلورو-فنييل، المركب 4a، و ٣,٠ مل من THF إلى ١٥,٤ مل (٠,٠١٥٤ مول) من سادس مثيل ثاني سيلان ليثيوم نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وقلب مزيج التفاعل لمدة ١٢ ساعة. وأضيف ٠,٧٥ مل (٠,٠١٥٤ مول) من الهيدرازين و ٠,٩٦ مل من حمض الأسيتيك إلى مزيج التفاعل، الذي سخن فيما بعد عند درجة حرارة الترجيع لمدة ٢٤ ساعة. وأضيف المزيج الناتج أولاً إلى ٣٠ مل من الماء ثم استخلص باستخدام CH_2Cl_2 . ومزجت الطبقات العضوية وغسلت باستخدام محلول NaHCO_3 مائي، ثم غسلت بالماء والمحول الملحي، جففت فوق Na_2SO_4 ، وأزيل

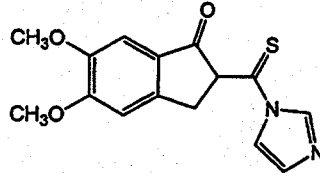
المذيب في خواء. وأذيب الركاز في CH_3CN ساخن. وأضيف إلى المزيج بعد ذلك مكافئ واحد من محلول HCl - إيثر فنتج راسب من المركب المسمى بالعنوان. وأذيب الراسب في CH_3CN وأزيل منه اللون باستخدام فحم نباتي وأعيدت بلورته فنتج المركب ١٤ في صورة مادة صلبة لونها أبيض ضارب إلى الصفرة. ط ك كـ/ش ٣٢٦ (ص+H)⁺؛

¹H ر ن م $((\text{CD}_3)_2\text{SO})$: ٣,٤٤ (ف، H٢)، ٣,٨٠ (ف، H٣)، ٣,٨١ (ف، H٣)، ٦,٥٨ (ث، H١)، ٦,٨٥ (ز، H١)، ٧,١ (ز، H١)، ٧,٢١ (ف، H١)، ٧,٢٣ (ف، H١)، ٧,٣ (ع، H١)، ٩,٢ (ف عريض، H١).

المثال ٥

٢- (إيميدازول-١-كربوثيريل)-٦,٥-ثاني مثنوكسي-اندانون (١)،

المركب الوسيط ب، (الطريقة ب)



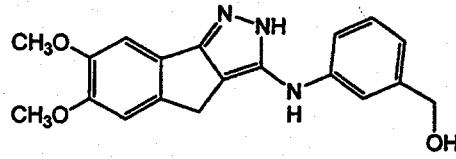
مزج ١١ مل (١١ ملي مول) من ثنائي (ثالث ميثيل سيليل) أميد ليثيوم في THF و ٢٠ مل من THF مع التقليل في قارورة جافة في جو من النيتروجين. وأضيف ١,٩٢ جم (١٠ ملي مول) من ٦,٥-ثاني مثنوكسي اندانون (١) في ١٥ مل من THF إلى القارورة. ثم برد مزيج التفاعل في حمام أسيتون مبرد بثلج جاف. وقلب محلول التفاعل عند -٧٨°م وأضيف ٢,١٨ جم (١١ ملي مول) من ثيو ثاني إيميدازول في ١٥ مل من THF. وقلب مزيج التفاعل عند -٧٨°م لمدة ٥ ساعات ثم سقي باستخدام ٤٠ مل من محلول NH_4Cl مشبع، ودفئ إلى درجة حرارة الغرفة. واستخلص المحلول المائي للمزيج باستخدام أسيتات الاثيل مرتين فنتج المركب المسمى بالعنوان في صورة المحلول العضوي. وغسل المزيج بالماء ومحلول NaCl مشبع، جفف فوق Na_2SO_4 ، وأزيل المذيب في خواء. ونتج ٢- (إيميدازول-١-كربوثيريل)-٦,٥-ثاني مثنوكسي-اندانون (١) في صورة مادة صلبة لونها أصفر. وأظهر تحليل HPLC أن المنتج كان نقياً. ط ك كـ/ش ٣٠٣ (ص+H)⁺؛

^1H ر ن م $((\text{CD}_3)_2\text{SO})$: ٣,٦٠ (ف، H_2)، ٣,٧٠ (ف، H_3)، ٣,٨٥ (ف، H_3)، ٦,٩٠ (ف، H_1)، ٧,١ (ف، H_1)، ٧,٥١ (ف، H_1)، ٧,٦٠ (ف، H_1)، ٩,١ (ف، H_1).

المثال ٦

[٣]-(٧,٦-ثاني مثنوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [١,٢-ج-])

بيرازوليل (٣) أمينو-فنيل-ميثانول، المركب ٣٦، (الطريقة ب)



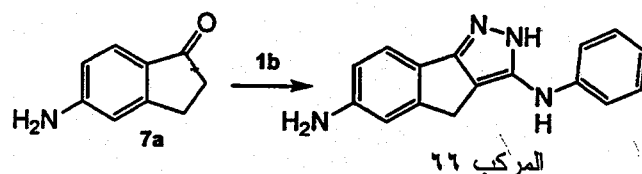
مزج ١,٠ جم (٣,٣ ملي مول) من ٢-(ايميدازول-١-كربوثيريل)-٦,٥-ثاني مثنوكسي-اندينو (١)، المركب الوسيط ب، مع ٠,٤٠ جم (٣,٣ ملي مول) من كحول ٣-أمينو بنزيل و ٣٠ مل من THF في قارورة. ونتج (٣-هيدروكسي ميثيل-فنيل)-أميد لحمض ٦,٥-ثاني مثنوكسي-١-أكسو-اندين-٢-كربوثيريل بعد تقليب مزيج التفاعل لمدة ٤ ساعات عند درجة حرارة الغرفة. وأظهر تحليل طيف الكتلة بواسطة HPLC (ط ك/HPLC) أن ك/ش = ٣٥٨ (ص H^+). ولم يفصل المركب الوسيط، ومزج المزيج مع ٠,١٣ مل (٤ ملي مول) من الهيدرازين، و ٣-٢ نقاط من حمض الأسيتيك. وسخن مزيج التفاعل عند ٧٨ م لمدة ١٢ ساعة. ثم خفف محلول التفاعل باستخدام أسيتات الاثيل، غسل بالماء، وجفف فوق Na_2SO_4 . وأزيل المذيب ونقي المركب المسمى بالعنوان بواسطة HPLC على عمود من نوع سي-١٨ (C-18) معكوس الطور باستخدام $\text{TFA-H}_2\text{O-CH}_3\text{CN}$ بصفتها مذيبات متدرجة التركيز. ونتج المركب المسمى بالعنوان، [٣]-(٧,٦-ثاني مثنوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو اندينو [١,٢-ج-]) بيرازوليل (٣) أمينو-فنيل-ميثانول، المركب ٣٦ في صورة ملح TFA صلب. ط ك ك/ش ٣٣٨ (ص H^+)، ونقي المنتج بواسطة HPLC بنسبة ١٠٠% (الطول الموجي ٢١٤ ميكرومتر بالأشعة فوق البنفسجية)؛

^1H ر ن م $((\text{CD}_3)_2\text{SO})$: ٣,٤٠ (ف، H_2)، ٤,٥٤ (ف، H_2)، ٦,٨١ (ز، H_1)، ٧,٠٢ (ز، H_1)، ٧,١٤ (ف، H_1)، ٧,٢٢ (ز، H_2).

المثال ٧

N3-فنيـل-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [١، ٢-جـ] بيرازول-٦،٣-ثاني أمين،

المركب ٦٦، (الطريقة جـ)



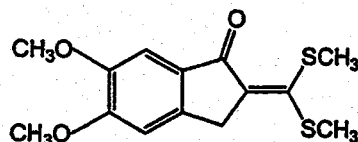
مزج ٠،٢٥ جم (٦ ملي مول) من NaH (مشتت في زيت معدني بنسبة ٦٠%) و ٢٥ مل من THF جاف في قارورة في جو من الأرجون. ثم أضيف ٠،٢٢ جم (١٥ ملي مول) من ٥-أمينو اندانون (١)، المركب 7a، و ٠،١٨ مل (١٥ ملي مول) من أيزوثيوسيانات فنيـل، المركب 1b، إلى مزيج التفاعل مع التقليب. وبعد تقليب مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة لمدة ساعة واحدة، أضيف ٠،٤٥ (٧٥ ملي مول) من الهيدرازين ثم ٠،٠٧٠ مل (٢،٢٥ ملي مول) من حمض الأسيتيك. واستمر التفاعل عند ٧٠°م مع التقليب طوال الليل. وخفف مزيج التفاعل باستخدام محلول NaHCO_3 مائي مشبع، استخلص باستخدام أسيتات الاثيل، غسل بمحلول ملحي، جفف فوق كبريتات الصوديوم وأزيل المذيب في خواء. ونقيت المادة الخام بواسطة HPLC فنتج المركب المسمى بالعنوان (المركب ٦٦) في صورة ملح TFA. ط كـ/ش ٢٦٣ (ص + H)⁺؛

¹H ر ن م $((\text{CD}_3)_2\text{SO})$: ٣،٥٠ (ف، H٢)، ٦،٨٠ (عـ، H١)، ٦،٩٨ (عـ، H١)، ٧،١٤ (عـ، H٣)، ٧،٢٤ (عـ، H٢)، ٧،٣٢ (ث، H١)، ٧،٤٩ (ز، H١)، ٧،٥٦ (ز، H١)، ٨،٨٠ (ف عريض، H١)؛ ونقي المنتج بواسطة HPLC بنسبة ١٠٠% (الطول الموجي ٢١٤ ميكرومتر بالأشعة فوق البنفسجية).

المثال ٨

٢-(ثنائي-مثيل كبريتانيل-مثيلين)-٦،٥-ثاني ثوكسي-اندانون (١)،

المركب الوسيط د، (الطريقة د)



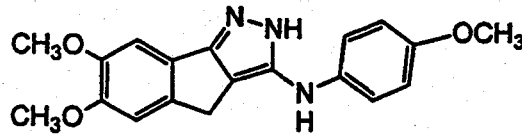
أضيف ٣,٣٧ جم (٤٤,٣ ملي مول) من NaH (مشتت في زيت معدني بنسبة ٦٠%)، ٣,٣٧ جم (٤٤,٣ ملي مول) من ثاني كبريتيد الكربون و ٥٠ مل من THF إلى قارورة جافة في جو من النيتروجين. وبردت قارورة التفاعل باستخدام حمام مائي مبرد بالتلج ثم أضيف ٧,١ جم (٣٧ ملي مول) من ٦,٥-ثاني مثنوكسي-اندانون (١)، المركب 3a في ٥٠ مل من THF. وقلب مزيج التفاعل لمدة ساعة واحدة. ثم، أضيف ٥,٢ مل (٤٤,٣ ملي مول) من يوريد ميثيل. وترك محلول التفاعل الناتج يقلب عند درجة حرارة الغرفة طوال الليل، وبعد ذلك أضيف ١٥٠ مل من محلول NH₄Cl مائي ثم ١٥٠ مل من أسيتات الاثيل. وفصلت الطبقة المائية واستخلصت مرتين باستخدام أسيتات الاثيل في كل مرة. وغسل المحلول العضوي بالماء وأضيف محلول NaCl مشبع. وجفف المحلول فوق Na₂SO₄، رشح وركز. وسحنت المادة الصلبة الناتجة باستخدام الايثانول فنتج ٢-(ثنائي-مethyl كبريتانيل-مثيلين)-٦,٥-ثاني مثنوكسي-اندانون (١)، المركب الوسيط د، في صورة مادة صلبة لونها أصفر. ط ك ك/ش ٢٩٧ (ص + H)⁺؛

¹H ر ن م (CDCl₃): ٢,٥٠ (ف، H³)، ٢,٥٨ (ف، H³)، ٣,٨٠ (ف، H²)، ٣,٩٠ (ف، H³)، ٤,٠ (ف، H³)، ٧,٢٠ (ف، H¹)، ٧,٢٢ (ف، H¹).

المثال ٩

٧,٦-ثاني مثنوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج]-بيرازوليل (٣)-

(٤-مثنوكسي-فنييل)-أمين، المركب ٦، (الطريقة د)



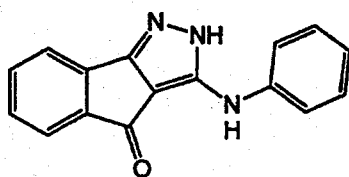
وضع ٥٠ مجم (٠,١٧ ملي مول) من المركب الوسيط د (حضر كما وصف في المثال ٨ أعلاه)، ٢٥ مجم (٠,٢ ملي مول) من ٤-مثنوكسي أنيلين و ١ مل من حمض الأسيتيك في قارورة تفاعل. وسخن المزيج عند ٧٠ م طوال الليل. ثم صب المزيج في الماء واستخلص باستخدام أسيتات الاثيل. وغسل المحلول العضوي، جفف، وركز فنتج ركاز لونه بني غامق.

وعلق الركاز في إيثانول ومزج مع ٠,٠٥ مل من الهيدرازين. ثم سخن مزيج التفاعل عند ٧٠°م طوال الليل، وخفف المزيج باستخدام أسيتات الاثيل وبعد ذلك غسل بالماء، جفف وركز. ونقي المنتج الخام على عمود من هلام السليكا باستخدام مزيج من كلوريد الميثيلين والميثانول بصفتهما مواد التصويل. وجمعت الأجزاء النقية وركزت فنتج المركب المسمى بالعنوان (المركب ٦)، (٧,٦-ثاني مئوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل (٣))-(٤-مئوكسي-فنييل)-أمين، في صورة مادة صلبة لونها بني. ط ك ك/ش ٣٣٨ (ص + H)⁺؛ ونقي المنتج بواسطة HPLC بنسبة ٩٩% (بالأشعة فوق البنفسجية)؛

¹H ر ن م (CDCl₃): ٣,٢٩ (ف، H٢)، ٣,٧٣ (ف، H٣)، ٣,٨٠ (ف، H٣)، ٣,٨٩ (ف، H٣)، ٦,٨٠ (ز، H٢)، ٦,٩٥ (ع، H٣)، ٧,٣ (ف، H١).

المثال ١٠

٣-فنييل أمينو-H٢-اندينو [٢,١-ج] بيرازولون (٤)، المركب ٣٥ (الطريقة هـ)



أضيف ٥ جم (٠,٠٣٤٢ مول) من ٣,١-انديون و ٤,١ مل (٠,٠٣٤٢ مول) من أيزوثيوسيانات الفنييل (المركب 1b) إلى ٥٠ مل من الأسيتونتريل وبرد المزيج إلى درجة الصفر المئوي. ثم أضيف ١٠,٢ مل (٠,٠٦٨٤ مول) من DBU نقطة نقطة وقلب مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة لمدة ساعتين. وبرد مزيج التفاعل إلى درجة الصفر المئوي، ثم أضيف ٣,٢ مل (٠,٠٥١ مول) من يوريد الميثيل ببطء. وقلب مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة لمدة ٤ ساعات، ثم سقي باستخدام ٣٠٠ مل من محلول حمض أسيتيك/ماء بنسبة ٥٠/٥٠ ورشح الراسب وغسل بالماء.

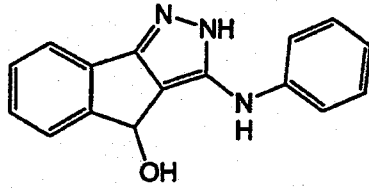
وأضيف ٠,٥٠ جم (٠,٠٠١٧ مول) من الراسب، ٠,٠٨ مل (٠,٠٠٢٦ مول) من الهيدرازين، و ٠,٥ مل (٠,٠٠٦ مول) من حمض الأسيتيك معاً إلى ١٠ مل من الأسيتونتريل ثم قلب المزيج عند ٧٥°م لمدة ٤ ساعات. وسقي مزيج التفاعل بمحلول NaHCO₃ مائي مشبع،

استخلص باستخدام أسيتات الاثيل، غسل بمحلول ملحي، وجفف فوق كبريتات الصوديوم. وأزيل المذيب في خواء. وسحنت المادة الخام الناتجة باستخدام ثاني كلوروميثان وميثانول فنتج المركب المسمى بالعنوان (المركب ٣٥)، ٣-فنييل أمينو-٢-هيدرو-اندينو [١، ٢-ج] بيرازولون (٤). ط ك ك-ش ٢٦٢ (ص + ه)؛

^1H ر ن م $((\text{CD}_3)_2\text{SO})$: ٦,٩٢ (ع، ه١)، ٧,١١ (ع، ه٢)، ٧,٢٧ (ع، ه٣)، ٧,٤٨ (ع، ه٣)، ٩,٦٠ (ف، ه١)، ١٢,٣ (ف، ه١).

المثال ١١

٣-فنييل أمينو-٢-هيدرو-اندينو [١، ٢-ج] بيرازولون (٤)،
المركب ٥٠، (الطريقة هـ)

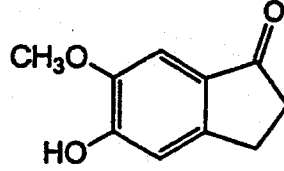


علق ٠,١٥ جم (٠,٠٠٠٥٧ مول) من المركب ٣٥، حضر كما في المثال ١٠، في ٥٠ مل من مزيج من MeOH/DCM بنسبة ٥٠/٥٠، حيث أضيف ٨٠٠ مجم من بورون هيدريد الصوديوم. وقلب مزيج التفاعل لمدة ساعتين. ثم سقي مزيج التفاعل بمحلول NaHCO_3 مائي مشبع، استخلص باستخدام أسيتات الاثيل، غسل بمحلول ملحي، وجفف فوق كبريتات الصوديوم. وأزيل المذيب في خواء. وسحنت المادة الخام باستخدام ثاني كلوروميثان وميثانول فنتج المركب المسمى بالعنوان، ٣-فنييل أمينو-٢-هيدرو-اندينو [١، ٢-ج] بيرازولون (٤). ط ك ك-ش ٢٦٤ (ص + ه)؛

^1H ر ن م $((\text{CD}_3)_2\text{SO})$: ٥,٢٨ (ع، ه٢)، ٦,٧٠ (ع، ه١)، ٧,١٩ (ع، ه٦)، ٧,٣٤ (ع، ه١)، ٧,٤٨ (ع، ه١)، ٨,٣٢ (ف، ه١)، ١٢,١٥ (ف، ه١).

المثال ١٢

٥-هيدروكسي-٦-مثنوكسي-اندانون (١)، المركب الوسيط ح

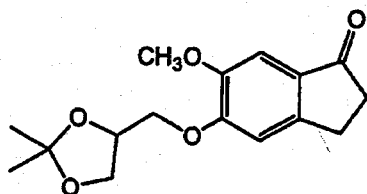


- قلب مزيج من ٢٥,٠ جم (٠,١٣ مول) من ٦,٥-ثاني مثنوكسي اندانون (١)، ٢٠,٠ جم (٠,٤٧ مول) من كلوريد الليثيوم و ٢٠٠,٠ مل من DMF عند ١٦٠ °م لمدة ٦٠ ساعة. ٥
- وأضيف ٤٠٠,٠ مل من الماء وغسل المزيج باستخدام أسيتات الاثيل. وحُمضت الطبقة المائية باستخدام HCl تركيزه ٢ عياري واستخلصت مرتين باستخدام ٣٠٠,٠ مل من أسيتات الاثيل في كل مرة. وغسلت الطبقة العضوية باستخدام محلول ملحي وأزيل المذيب في خواء. ونقيت المادة الخام على عمود من هلام السليكا باستخدام مزيج من MeOH/DCM بنسبة ٣/٩٧ بصفته مزيج التصويل. وأزيل المذيب في خواء فنتج ٥-هيدروكسي-٦-مثنوكسي-اندانون (١) ١٠
- (المركب الوسيط ح) في صورة مادة صلبة لونها أصفر فاتح. ط ك ك/ش ١٧٩ (ص+H)⁺ ويعتبر المركب المسمى بالعنوان (المركب الوسيط ح) مركباً معروفاً ويمكن كذلك تحضيره بنزع المثل من ٥,٦-ثاني مثل أكسي اندانون (١) باستخدام مزيج من DMSO/KNC عند ١٠٠ °م (انظر ما جاء عن جيه. إم. سا ومعاونيه في مجلة الكيمياء العضوية (جورنال أف أورجانيك كيمستري)، المجلد ٥٧، ص ٥٨٩، ١٩٩٢م). ١٥

المثال ١٣

٥- (٢،٢)-ثاني ميثيل-٣،١-ديوكسولانيل (٤) مثنوكسي

٦- مثنوكسي-اندانون (١)، المركب الوسيط ط

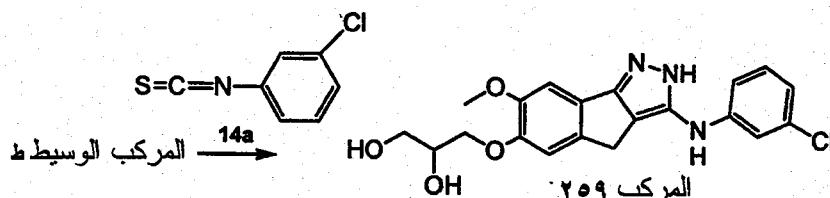


قلب مزيج من ٠,٥٠ جم (٠,٠٠٢٨ مول) من ٥-هيدروكسي-٦-اندانون (١)،
المركب الوسيط ح، ٠,٧٦٦ مول (٠,٠٠٥٦ مول) من ٤-كلورو ميثيل-٢،٢-ثاني ميثيل-
٣،١-ديوكسولان، ١,٥٤ جم (٠,٠١١ مول) من كربونات البوتاسيوم و ٢٠,٠ مل من DMF
عند ٩٥° م لمدة ٣ أيام. وأضيف ١٥٠ مل من الماء واستخلص المزيج مرتين باستخدام ١٥٠
مل من أسيتات الاثيل في كل مرة. وغسلت الطبقة العضوية باستخدام NaHCO_3 مشبع، محلول
ملحي وجففت فوق Na_2SO_4 . ثم أزيل المذيب في خواء فنتج ٥- (٢،٢)-ثاني ميثيل- [٣،١]
ديوكسولانيل (٤) مثنوكسي-٦-مثنوكسي-اندانون (١) (المركب الوسيط ط) في صورة مادة
صلبة لونها بني فاتح. ط ك ك/ش ٢٩٣ (ص + H) $^+$.

المثال ١٤

٣- [٣]- (٣-كلورو- فنييل أمينو)-٧-مثنوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١]-ج-

بيرازوليلوكسي (٦)-[٦]-بروبان-٢،١-ديول، المركب ٢٥٩، (الطريقة أ)



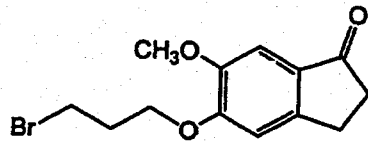
أضيف مزيج من ٠,٣٠ جم (٠,٠٠١ مول) من ٥- (٢،٢)-ثاني ميثيل- [٣،١]
ديوكسولانيل (٤) مثنوكسي-٦-مثنوكسي-اندانون (١) (المركب الوسيط ط)، ٠,١٤ مل

(٠,٠٠١١ مول) من أيزوثيو سيانات ٣-كلورو-فنييل (المركب الوسيط 14a) و ١,٥ مل من THF إلى ١,٢ مل (٠,٠٠١٢ مول) من سادس مثيل ثاني سيلان ليثيوم نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وقلب مزيج التفاعل لمدة ٤ ساعات. وأضيف ٠,٠٧٠ مل (٠,٠٠٢٢ مول) من الهيدرازين و ٠,١٣٢ مل (٠,٠٠٢٢ مول) من حمض الأسيتيك إلى مزيج التفاعل، حيث سخن فيما بعد عند درجة حرارة الترجيع لمدة ١٨ ساعة. وأضيف المزيج الناتج أولاً إلى ١٠ مل من الماء ثم استخلص باستخدام CH_2Cl_2 . ومزجت الطبقات العضوية وغسلت بمحلول NaHCO_3 مائي، ثم غسلت بالماء والمحلول الملحي، وجففت فوق Na_2SO_4 ، وأزيل المذيب في خواء. ونقيت المادة الخام بواسطة HPLC معكوس الطور وحولت إلى المنتج المرغوب عندما تركت تستقر في محلول TFA تركيزه ٠,١%. ونتج عن التجفيد المركب المسمى بالعنوان، ٣-[[٣-((٣-كلورو-فنييل أمينو)-٧-مثنوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليلوكسي (٦)]-بروبان-٢,١-ديول في صورة مسحوق لونه أبيض. ط ك ك/ش ٤٠٢ (ص + H)؛

^1H ر ن م $((\text{CD}_3)_2\text{SO})$: ٣,٤١ (ف، H_2)، ٣,٤٦ (ز، H_2)، ٣,٧٨ (ف، H_4)، ٣,٨٨ (ع، H_1)، ٤,٠٠ (ع، H_1)، ٦,٧٥ (ز، H_1)، ٧,١٥ (ع، H_4)، ٧,٤٠ (ف، H_1)، ٨,٨٠ (ف عريض، H_1). ١٥

المثال ١٥

٥-(٣-برومو-بروبوكسي)-٦-مثنوكسي-اندانون (١)، المركب الوسيط ي

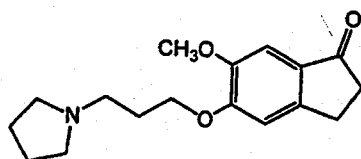


قلب مزيج من ٥,٠ جم (٠,٠٢٨ مول) من ٥-هيدروكسي-٦-مثنوكسي-اندانون (١) (المركب الوسيط ح)، ٥,٧ مل (٠,٠٥٦ مول) من ٣,١-ثاني برومو بروبان و ١,٢ جم (٠,٠٢٨ مول) من هيدريد الصوديوم في ٥٠ مل من DMF عند درجة حرارة الغرفة طوال الليل في جو من الأرجون. وسقي مزيج التفاعل باستخدام ١٥٠ مل من الماء، استخلص

بأسيئات الاثيل، ثم غسل باستخدام HCl تركيزه ١ عياري ومحلول ملحي. وجففت الخلاصة فوق كبريتات الصوديوم وأزيل المذيب في خواء فنتج المركب المسمى بالعنوان، ٥-(٣)-بروموبروبوكسي-٦-مثنوكسي-اندانون (١). ط ك ك/ش ٢٩٧ (ص + H) ⁺.

المثال ١٦

٥-٦-مثنوكسي-٣-بيروليدينيل (١)-بروبوكسي-اندانون (١)، المركب الوسيط ك

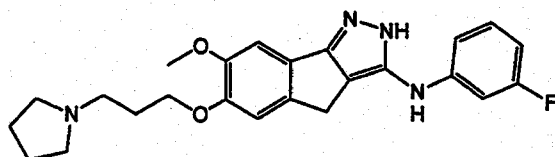


قلب مزيج من ٢,٠ جم (٠,٠٠٦٦ مول) من ٥-(٣-بروموبروبوكسي)-٦-مثنوكسي-اندانون (١) (المركب الوسيط ي) و ١,٧ مل (٠,٠٢ مول) من بيروليدين في ٥٠ مل من DME (٢,١-ثاني مثنوكسي ايثان) عند درجة حرارة الغرفة طوال الليل في جو من الأرجون. وسقي مزيج التفاعل بـ ١٥٠ مل من الماء وجعل حمضياً باستخدام ٥٠ مل من HCl تركيزه ١ عياري. وغسل المحلول المائي بأسيئات الاثيل، وجعل قاعدياً باستخدام ٢٥ مل من NaOH تركيزه ٣ عياري واستخلص بأسيئات الاثيل. وبعد الغسل بالمحلول الملحي والتجفيف فوق كبريتات الصوديوم، أزيل المذيب في خواء فنتج المركب المسمى بالعنوان. ط ك ك/ش ٢٩٠ (ص + H) ⁺.

المثال ١٧

٣-(فلورو-فنييل)-٧-مثنوكسي-٦-(٣-بيروليدينيل (١)-بروبوكسي)-٤,٢-ثاني هيدرو-

اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل (٣)-أمين، المركب ١٨٠، (الطريقة أ)



أضيف مزيج من ٠,٤٥ جم (٠,٠٠١٥٥ مول) من ٥-٦-مثنوكسي-٣-بيروليدينيل (١)-بروبوكسي-اندانون (١) (المركب الوسيط ك)، ٠,١٩ مل (٠,٠٠١٧ مول) من

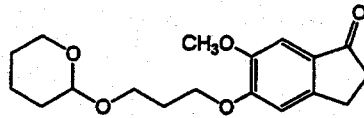
أيزوثيوسيانات ٣-فلورو-فنييل (المركب 4a) و ١,٥ مل من THF إلى ١,٨ مل (٠,٠٠١٨ مول) من سادس مثيل ثاني سيلان الليثيوم نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وقلب مزيج التفاعل لمدة ٤ ساعات. وأضيف ٠,٠٩٥ مل (٠,٠٠٣ مول) من الهيدرازين و ٠,١٨٠ مل (٠,٠٠٣ مول) من حمض الأسيتيك إلى مزيج التفاعل. ثم سخن مزيج التفاعل عند درجة حرارة الترجيع لمدة ١٨ ساعة. وأضيف المزيج الناتج أولاً إلى ١٠ مل من الماء ثم استخلص باستخدام CH_2Cl_2 . ومزجت الطبقات العضوية وغسلت بمحلول NaHCO_3 مائي، ثم غسلت باستخدام الماء والمحلول الملحي، وجففت فوق Na_2SO_4 ، وأزيل المذيب في خواء. ونقيت المادة الخام باستخدام HPLC معكوس الطور. ونتج عن التجفيد المركب المسمى بالعنوان، (٣-فلورو-فنييل)-(٧-مثنوكسي-٦-(٣-بيروليدينيل (١)-بروبوكسي)-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج]-بيرازوليل (٣))-أمين في صورة مسحوق لونه أبيض. ط ك ك/ش ١٠

٤٢٣ (ص + H)؛

^1H ر ن م $((\text{CD}_3)_2\text{SO})$: ١,٨٨ (ع، H_2)، ٢,٠٠ (ع، H_2)، ٢,١٥ (ع، H_2)، ٣,٠٢ (ع، H_2)، ٣,٢٩ (ز، H_2)، ٣,٣٧ (ف، H_2)، ٣,٦١ (ع، H_2)، ٣,٧٤ (ف، H_3)، ٤,٠٤ (ث، H_2)، ٦,٥٢ (ث، H_1)، ٦,٩٣ (ز، H_1)، ٧,١٨ (ع، H_4)، ٨,٨ (ف عريض، H_1)، ٩,٧ (ف عريض، H_1). ١٥

المثال ١٨

٦-مثنوكسي-٥-(٣-رابع هيدرو-بيروبيروكسي (٢))-بروبوكسي-اندانون (١)، المركب الوسيط ل



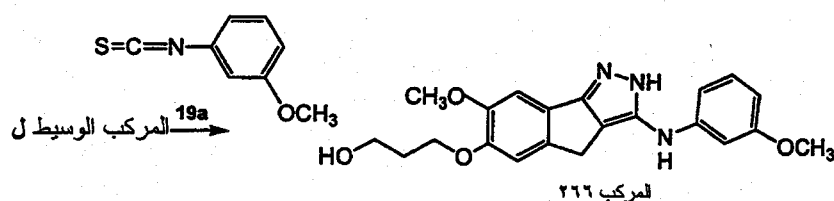
قلب مزيج من ٢,٩٨ جم (٠,٠١٧ مول) من ٥-هيدروكسي-٦-مثنوكسي-اندانون (١) (المركب الوسيط ح)، ٦,٠ جم (٠,٠٣٤ مول) من ٢-(٣-كلورو-بروبوكسي)-رابع هيدرو-بيران (المركب 18a)، و ١٠,٠ جم (٠,٠٧٢٥ مول) من كربونات البوتاسيوم في ٥٠ مل من DMF عند ٨٠ م طوال الليل في جو من الأرجون. ثم خفف مزيج التفاعل باستخدام ٢٠٠ مل ٢٠

من أسيتات الاثيل وغسل ثلاث مرات بالماء. وبعد التجفيف فوق كبريتات الصوديوم، أزيل المذيب في خواء. وتجمدت المادة الخام عند الاستقرار فنتج المركب المسمى بالعنوان، ٦-
 مثنوكسي-٥-٣- (رابع هيدرو-بيرانييلوكسي (٢)) -بروبوكسي- [اندانون (١). ط ك ك/ش
 ٣٠٩ (ص+H) ⁺.

المثال ١٩

٣- [٧- مثنوكسي-٣- (٣- مثنوكسي-فنييل أمينو)-٢،٤- ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-ج-]

بيرازوليوكسي (٦) [٦- بروبانول (١)، المركب ٢٦٦ (الطريقة أ)]



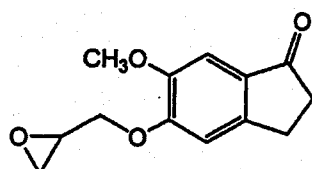
أضيف مزيج من ٠,١٦ جم (٠,٠٠٠٥ مول) من ٦- مثنوكسي-٥-٣- (رابع هيدرو-
 بيرانييلوكسي (٢)) -بروبوكسي- [اندانون (١) (المركب الوسيط ل)، ٠,٠٨ مول (٠,٠٠٠٦
 مول) من أيزوثيوسيانات ٣- مثنوكسي-فنييل (المركب 19a) و ١,٥ مل من THF إلى ٠,٧ مل
 (٠,٠٠٠٧ مول) من سادس مثيل ثاني سيلان الليثيوم نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة مع
 التقليب. وقلب مزيج التفاعل لمدة ٤ ساعات. وأضيف ٠,٠٣٥ مل (٠,٠٠١١ مول) من
 الهيدرازين و ٠,٦٦ مل (٠,٠٠١١ مول) من حمض الأسيتيك إلى مزيج التفاعل، الذي سخن
 فيما بعد عند درجة حرارة الترجيع لمدة ١٨ ساعة. وأضيف إلى المزيج الناتج أولاً ١٠ مل
 من الماء ثم استخلص مزيج التفاعل باستخدام CH_2Cl_2 . ومزجت الطبقات العضوية وغسلت
 بمحلول NaHCO_3 مائي، ثم غسلت باستخدام الماء والمحلول الملحي، وجففت فوق Na_2SO_4 ،
 وأزيل المذيب في خواء. ونقيت المادة الخام بواسطة HPLC معكوس الطور وحولت إلى
 المنتج المرغوب عندما تركت تستقر في TFA تركيزه ١% في محلول من CH_3CN : ماء.
 ونتج عن التجفيد المركب المسمى بالعنوان، ٣- [٧- مثنوكسي-٣- (٣- مثنوكسي-فنييل أمينو)-

٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-ج-] بيرازوليلوكسي (٦)-[بروبانول (١) في صورة مسحوق لونه أبيض. ط ك كـ/ش ٣٨٢ (ص+H)⁺؛

¹H ر ن م ((CD₃)₂SO): ١,٨٨ (عـ، H٢)، ٣,٤٠ (ف، H٢)، ٣,٥٧ (ث، H٢)، ٣,٧٢ (ف، H٣)، ٣,٧٨ (ف، H٣)، ٤,٠٥ (ث، H٢)، ٦,٣٨ (ز، H١)، ٦,٦٨ (ز، H١)، ٦,٧٧ (ف، H١)، ٧,١٠ (عـ، H٢)، ٧,٢٥ (ف، H١)، ٨,٧٥ (ف عريض، H١).

المثال ٢٠

٦-مئوكسي-٥-أكسيرانيل مئوكسي-اندانون (١)، المركب الوسيط م

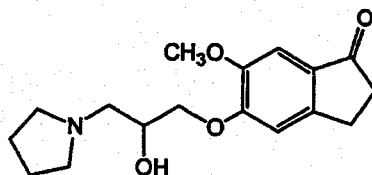


قلب مزيج من ٥,٠ جم (٠,٠٢٨ مول) من ٥-هيدروكسي-٦-مئوكسي-اندانون (١) (المركب الوسيط ح)، ٤,٤ مل (٠,٠٥٦ مول) من ٢-كلورو مئيل-أكسيران، و ١١,٦ جم (٠,٠٨٤ مول) من كربونات البوتاسيوم في ٥٠ مل من DMF عند ٧٠ م طوال الليل في جو من الأرجون. ثم خفف مزيج التفاعل باستخدام ٢٠٠ مل من أسيتات الاثيل وغسل ٣ مرات باستخدام الماء في كل مرة. وجفف محلول أسيتات الاثيل فوق كبريتات الصوديوم وأزيل المذيب في خواء فنتج المركب المسمى بالعنوان (المركب الوسيط م). ط ك كـ/ش ٢٣٦ (ص+H)⁺.

المثال ٢١

٥-(٢-هيدروكسي-٣-بيروليدينيل (١)-بروبوكسي)

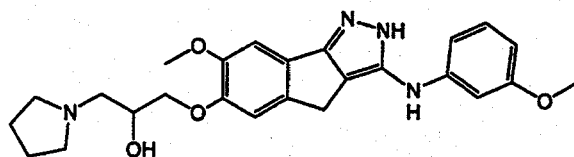
٦-مئوكسي-اندانون (١)، المركب الوسيط ن



قلب مزيج من ٢,٥ جم (٠,٠١٠٦ مول) من ٦-مثنوكسي-٥-أكسيرانيل مثنوكسي-اندانون (١) (المركب الوسيط م) و ٠,٩ مل (٠,٠١١ مول) من البيروليدين في ٥٠ مل من DME عند ٥٠°م لمدة ٥ ساعات في جو من الأرجون. ثم، أضيف ١٥٠ مل من أسيتات الاثيل وغسل المحلول مرتين باستخدام الماء في كل مرة. وبعد الاستخلاص باستخدام HCl تركيزه ٢ عياري، جعلت الطبقة الحمضية المائية قاعدية باستخدام NaOH تركيزه ٣ عياري واستخلصت بأسيتات الاثيل. وغسلت خلاصات أسيتات الاثيل بمحلول ملحي، وجففت فوق كبريتات الصوديوم وأزيل المذيب في خواء. وسحن الركاز الناتج بثاني اثيل اثير فنتج المركب المسمى بالعنوان. ط ك ك-ش ٣٠٦ (ص+H)⁺.

المثال ٢٢

١- [٧-مثنوكسي-٣- (٣-مثنوكسي-فنييل أمينو)-٢,٤-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج]-بيرازوليلوكسي (٦)]-٣-بيروليدينيل (١)-بروبانول (٢)، المركب ٢٧٠ (الطريقة أ)

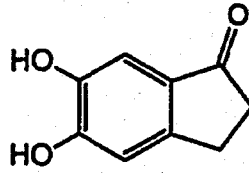


أضيف ٠,٧ مل (٠,٠٠٠٧ مول) من سادس مثيل ثاني سيلان الليثيوم إلى مزيج من ٠,١٦ جم (٠,٠٠٠٥ مول) من ٥- (٢-هيدروكسي-٣-بيروليدينيل (١)-بروبوكسي)-٦-مثنوكسي-اندانون (١) (المركب الوسيط ن)، و ٠,٠٨ مل (٠,٠٠٠٦ مول) من أيزوثيوسيانات ٣-مثنوكسي-فنييل (المركب 19a) و ١,٥ مل من THF نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وقلب مزيج التفاعل لمدة ٤ ساعات. وأضيف ٠,٣٥ مل (٠,٠٠١١ مول) من الهيدرازين و ٠,٦٦ مل (٠,٠٠١١ مول) من حمض الأسيتيك إلى مزيج التفاعل. وبعد ذلك، سخن مزيج التفاعل عند درجة حرارة الترجيع لمدة ١٨ ساعة. ثم أولاً أضيف إلى المزيج الناتج ١٠ مل من الماء وبعد ذلك استخلص مزيج التفاعل باستخدام CH_2Cl_2 . ومزجت الطبقات العضوية وغسلت بمحلول NaHCO_3 مائي، ثم غسلت باستخدام الماء والمحلول الملحي، وجففت فوق Na_2SO_4 ، وأزيل المذيب في خواء. ونقيت المادة الخام بواسطة HPLC معكوس الطور.

وننتج عن التجفيد المركب المسمى بالعنوان، ١-[٧-مثنوكسي-٣-(٣-مثنوكسي-فنيـل أمينو)-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [١، ٢-ج] بيرازوليلوكسي (٦)]-٣-بيروليدينيل (١)-بروبانول (٢) في صورة مسحوق لونه أبيض. ط ك ك/ش ٤٥١ (ص+H)⁺؛
¹H ر ن م ((CD₃)₂SO): ١،٨٩ (ع، هـ)، ٢،٠٢ (ع، هـ)، ٣،١٢ (ع، هـ)، ٣،٣٤ (ع، هـ)، ٣،٤٥ (ع، هـ)، ٣،٦٢ (ع، هـ)، ٣،٧٠ (ع، هـ)، ٣،٨٥ (ع، هـ)، ٤،٠٠ (ع، هـ)، ٤،٢٠ (ع، هـ)، ٤،٣٧ (ع، هـ)، ٦،٧١ (ع، هـ)، ٦،٧٨ (ع، هـ)، ٧،١٠ (ع، هـ)، ٧،٢٥ (ع، هـ)، ٧،٣ (ع، هـ)، ٨،٦٨ (ع، هـ)، ٩،٦٠ (ع، هـ).
 عريض، (H١).

المثال ٢٣

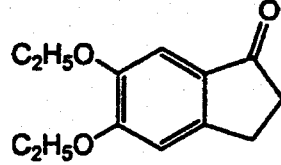
٦،٥-ثاني هيدروكسي-اندانون (١)، المركب الوسيط ع



برد محلول من ١٩ جم (٠،٠٩٤ مول) من ٦،٥-ثاني مثنوكسي اندانون (١) (المركب 3a) في ٢٠٠ مل من كلوريد الميثيلين عند -٧٨° م باستخدام حمام iPrOH مبرد بالتلج الجاف. ثم أضيف إلى هذا المحلول ٢٠٠ مل (٠،٢ مول) من محلول من BBr₃ تركيزه ١ جزيئي في CH₂Cl₂ نقطة نقطة. وقلب المحلول الناتج عند -٧٨° م لمدة ساعة واحدة ثم عند درجة الصفر المئوي لمدة ساعة واحدة. وفيما بعد، برد المحلول مرة أخرى إلى -٧٨° م باستخدام حمام iPrOH المبرد بالتلج الجاف وسقي باستخدام ٥٠ مل من MeOH. وبخر المحلول باستخدام مبخر دوّار حتى الجفاف، وأعيدت إذابة المادة الصلبة في MeOH وركزت ثانية مرتين إضافيتين. واستخدمت المادة الصلبة حمراء اللون، المركب المسمى بالعنوان، في تفاعلات لاحقة دون تنقية إضافية. ط ك ك/ش ١٦٥ (ص+H)⁺.

المثال ٢٤

٦،٥-ثاني اثوكسي-اندانون (١)، المركب الوسيط ف

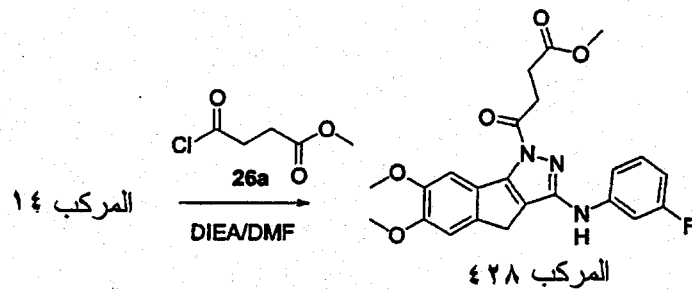


- قلب مزيج من ٢٤ جم (٠،١٤٦ مول) من ٦،٥-ثاني هيدروكسي اندانون (١)
 (المركب الوسيط ع)، ٦٠ جم (٠،٤٣ مول) من كربونات البوتاسيوم و ٥٦ مل (٠،٧٥ مول)
 من بروميد ثاني ايثيل في ٢٠٠ مل DMF عند ٦٠°م لمدة ١٤ ساعة. وأضيف ١٥٠ مل من
 الماء إلى مزيج التفاعل ثم استخلص مزيج التفاعل مرتين باستخدام ١٥٠ مل من أسيتات
 الايثيل في كل مرة. وغسلت خلاصات أسيتات الايثيل باستخدام NaHCO_3 مشبع ومحلول ملحي
 وجففت فوق Na_2SO_4 . ثم أزيل المذيب في خواء فنتج المركب المسمى بالعنوان في صورة
 مادة صلبة لونها بني. ط ك ك/ش ٢٢١ (ص + H) ⁺.

المثال ٢٦

استر مثيل لحمض ٤-[[٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧،٦-ثاني مثوكسي-٤-اندينو

٢،١-ج-] بيرازوليل (١)-٤-أكسو-بيوتيريك، المركب ٤٢٨ (الطريقة م)



- أضيف ٠،٥٢ مل (٣،٠ ملي مول) من ثاني أيزوبروبيل ايثيل أمين (DIEA) إلى مزيج
 من ٠،٥٠ جم (١،٥ ملي مول) من (٧،٦-ثاني مثوكسي-٤،١-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-ج-]
 بيرازوليل ((٣))-٣-(٣-فلورو-فنييل)-أمين (المركب ١٤)، ٠،٢٧٧ جم (١،٨ ملي مول) من

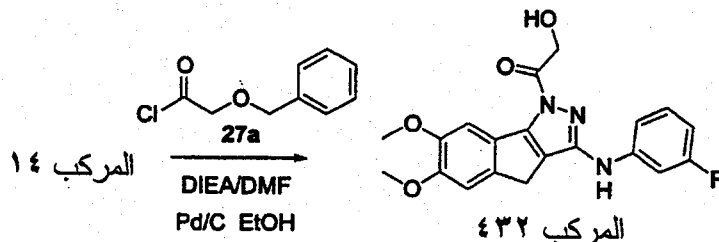
استر مثيل لحمض ٣-كلورو كربونيل-بروبيونيك (المركب 26a) و ١,٥ مل من DMF عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وقلب مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة طوال الليل. وسقي مزيج التفاعل بالماء واستخلص باستخدام EtOAc. وأزيل المذيب بواسطة التبخير بالمبخر الدوار وأعدت المادة الخام بواسطة HPLC معكوس الطور. ونتج عند التجفيد المركب المسمى بالعنوان في صورة مسحوق لونه أبيض. ك/ش ٤٣٩,٩ (ص + H)⁺؛

¹H ر ن م ((CD₃)₂SO): ٢,٧٨ (ث، H٢)، ٣,٣٢ (ث، H٢)، ٣,٤٥ (ف، H٢)، ٣,٦٢ (ف، H٣)، ٣,٧٩ (ف، H٦)، ٦,٦٤ (ع، H١)، ٧,١٥ (ف، H١)، ٧,٣٠ (ع، H٢)، ٧,٦٢ (ز، H١)، ٧,٧٠ (ف، H١)، ٩,٤٥ (ف، H١).

المثال ٢٧

١-[(٣)-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني ميثوكسي-٤-اندينو [٢,١-ج-]

بيرازوليل (١)-[٢-هيدروكسي-ايتانول، المركب ٤٣٢ (الطريقة م)]

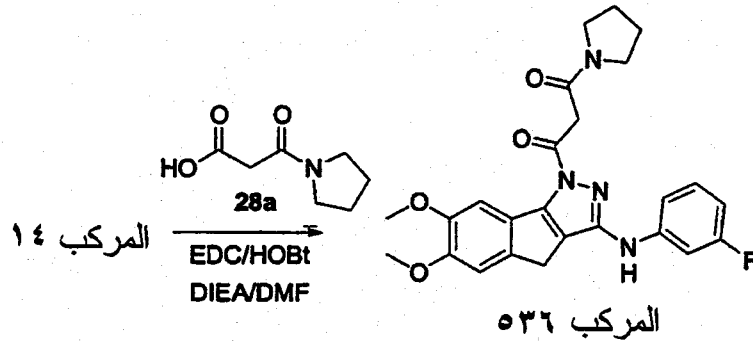


أضيف ٥,٢ مل (٣٠ ملي مول) من ثاني أيزوبروبيل اثيل أمين إلى مزيج من ٣,٦ جم (١٠,٠ ملي مول) من (٧,٦-ثاني ميثوكسي-٤,١-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣)-((٣)-(٣-فلورو-فنييل)-أمين (المركب ١٤)، ٢,٢ جم (١٢,٠ ملي مول) من كلوريد بنزيلوكسي-أسيتيل (المركب 27a) و ٥٠ مل من DMF عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وقلب مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة طوال الليل. وسقي مزيج التفاعل بالماء واستخلص باستخدام EtOAc. وجفف فوق كبريتات الصوديوم وأزيل المذيب في خواء. وأذيت المادة الخام في ايثانول وأضيف ٠,٥ جم من Pd محمول على كربون. ورج مزيج التفاعل باستخدام جهاز هدرجة طوال الليل. ورشح مزيج التفاعل خلال سيليت (Celite) وأزيل المذيب

في خواء. وسحن في مقدار صغير من EtOAc. ونتج ٣,٢ جم من مادة نقية بنسبة ٩٠% تقريباً. وأعدّ ٣٠٠ مجم من المادة الخام بواسطة عمود من نوع جلزون (Gilson) ونتج عن التجفيد المركب ٤٣٢ في صورة مسحوق لونه أبيض. ط ك كـ/ش ٣٨٤ (ص+H)⁺؛
¹H ر ن م ((CD₃)₂SO): ٣,٥٥ (ف، H٢)، ٣,٨٢ (ف، H٦)، ٤,٨٧ (ف، H٢)، ٥,٤٠ (ف، عريض، H١)، ٦,٦٥ (ع، H١)، ٧,٢٤ (عـ، H٣)، ٧,٥٨ (ز، H١)، ٧,٩٢ (ف، H١)، ٩,٥٠ (ف، H١).

المثال ٢٨

١-[٣]-(٣-فلورو-فنيـل أمينو)-٧,٦-ثاني مـثوكسي-٤-H-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل (١)-
 ٣-بيروليدينيل (١)-بروبان-٣,١-ديون، المركب ٥٣٦ (الطريقة ن)



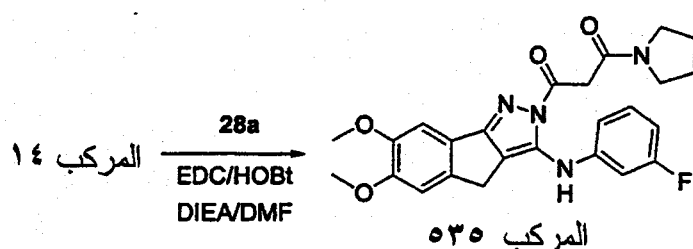
قلب مزيج من ٠,٣٦ جم (١,٠ ملي مول) من (٧,٦-ثاني مـثوكسي-٤,١-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل (٣))-((٣)-٣-فلورو فنيـل)-أمين (المركب ١٤)، ٠,١٥٧ جم (١,٠ ملي مول) من حمض ٣-أكسو-٣-بيروليدينيل (١)-بروبيونيك (المركب 28a)، ٢٤,٠ جم (١,٢٥ ملي مول) من ١-(٣-ثاني مـثيل أمينو بروبيـل)-٣-اثيريل كربو ثاني ايميد (EDC)، ٠,١٧ جم (١,٢٥ ملي مول) من هيدرات هيدروكسي بنزو-تريازول (HOBt) و ٠,٢٢٠ مل (١,٢٥ ملي مول) من DIEA في ١٠ مل من DMF طوال الليل عند درجة حرارة الغرفة. وسقي مزيج التفاعل باستخدام NaHCO₃ مشبع واستخلص باستخدام EtOAc. وأزيل المذيب في خواء وأعدت المادة الخام باستخدام عمود جلزون. ونتج عن التجفيد مسحوق لونه أبيض. ط ك كـ/ش ٤٦٥,١ (ص + H)⁺؛

^1H ر ن م $((\text{CD}_3)_2\text{SO})$: ١,٨٢ (ع, ه٢), ١,٩٨ (ع, ه٢), ٣,٣٤ (ف, ه٢), ٣,٥٩ (ع, ه٤), ٣,٧٩ (ف, ه٣), ٣,٨٠ (ف, ه٣), ٤,٠٩ (ف, ه٢), ٦,٦٧ (ث, ه١), ٧,٢٧ (ع, ه٣), ٧,٦٥ (ز, ه١), ٨,٨٩ (ف, ه١), ٩,٥٠ (ف, ه١).

المثال ٢٩

١-[٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني مثنوكسي-٤-اندينو [٢,١-ج]-بيرازوليل (٢)]-

٣-بيروليدينيل (١)-بروبان-٣,١-ديون, المركب ٥٣٥ (الطريقة ن)

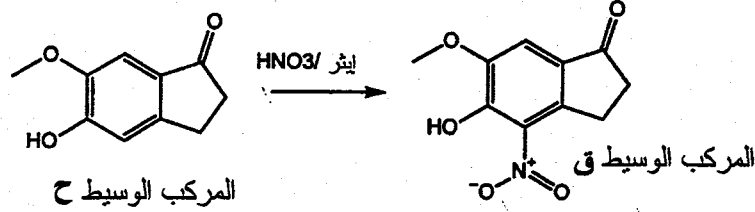


قلب مزيج من ٠,٣٦ جم (١,٠ ملي مول) من (٧,٦-ثاني مثنوكسي-٤,١-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج]-بيرازوليل (٣))-٣-(٣-فلورو فنييل)-أمين (المركب ١٤), ٠,١٥٧ جم (١,٠ ملي مول) من حمض ٣-أكسو-٣-بيروليدينيل (١)-بروبيونيك (المركب 28a), ٢٤,٠ جم (١,٢٥ ملي مول) من EDC, ٠,١٧ جم (١,٢٥ ملي مول) من HOBt و ٠,٢٢٠ مل (١,٢٥ ملي مول) من DIEA في ١٠ مل من DMF طوال الليل عند درجة حرارة الغرفة. وسقي مزيج التفاعل باستخدام NaHCO_3 مشبع واستخلص باستخدام EtOAc. وأزيل المذيب في خواء وأعدت المادة الخام باستخدام عمود جلسون. ونتج عن التجفيد المركب ٥٣٥ في صورة مسحوق لونه أبيض. ط ك-ش ٤٦٥,١ (ص+ H^+)؛

^1H ر ن م $((\text{CD}_3)_2\text{SO})$: ١,٨٢ (ع, ه٢), ١,٩٨ (ع, ه٢), ٣,٣٤ (ف, ه٢), ٣,٥٩ (ع, ه٤), ٣,٧٩ (ف, ه٣), ٣,٨٠ (ف, ه٣), ٤,٠٩ (ف, ه٢), ٦,٦٧ (ث, ه١), ٧,٢٧ (ع, ه٣), ٧,٦٥ (ز, ه١), ٨,٨٩ (ف, ه١), ٩,٥٠ (ف, ه١).

المثال ٣٠

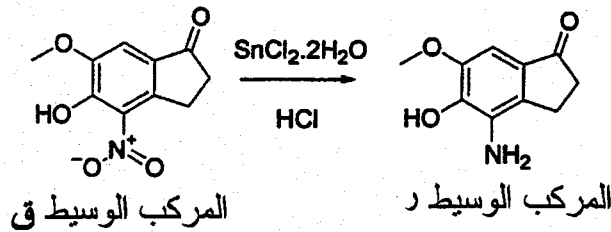
٥-هيدروكسي-٦-مثنوكسي-٤-نترو-اندانون (١)، المركب الوسيط ق



كان المركب الوسيط ح مركباً معروفاً وحضر وفقاً لطريقة النشر العلمية الموصوفة
 ٥ فيما جاء عن جوز إم. سا ومعاونيه في مجلة الكيمياء العضوية، مجلد ٥٧، العدد (٥)، ص
 ٥٨٩، ١٩٩٢م. أذيب ٣,٠ جم (٠,٠١٧ مول) من ٥-هيدروكسي-٦-مثنوكسي-اندانون (١)
 (المركب الوسيط ح) في ١٠٠ مل من ثاني إيثيل إيثر وأضيف ٧,٥ مل من حمض النتريك
 نقطة نقطة. وقلب مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة لمدة ساعتين. واكتمل التفاعل
 بواسطة HPLC. وأزيل الراسب بالترشيح وغسل بالإيثر. ونتاج ٣,٢ جم من مادة صلبة لونها
 ١٠ أصفر (المركب الوسيط ق). ط ك ك-ش/٢٢٤ (ص + H)⁺؛
¹H ر ن م ((CD₃)₂SO): ٢,٦٤ (عـ، H٢)، ٣,١٥ (عـ، H٢)، ٣,٩٢ (ف، H٣)، ٧,٣٢
 (ف، H١)، ١١,٧٥ (ف، H١).

المثال ٣١

٤-أمينو-٥-هيدروكسي-٦-مثنوكسي-اندانون (١)، المركب الوسيط ر



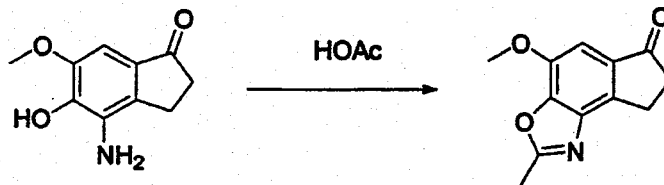
كان المركب الوسيط ق مركباً معروفاً وحضر وفقاً لطريقة النشر العلمية الموصوفة
 فيما جاء عن جوز إم. سا ومعاونيه في مجلة الكيمياء العضوية، مجلد ٥٧، العدد (٢)، ص

٥٨٩، ١٩٩٢م. وأضيف ٢,٠ جم (٩,٠ ملي مول) من ٥-هيدروكسي-٦-مثوكسي-٤-نترو-اندانون (١) (المركب الوسيط ق) إلى ١٠,٠ جم (٤٤ ملي مول) من ثاني هيدرات كلوريد القصدير في ٣٠ مل من HCl مركز فوق حمام مبرد بالتلج. وقلب مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة طوال الليل. واكتمل التفاعل بواسطة HPLC. وسقي مزيج التفاعل بالماء وجعل متعادلاً باستخدام كريات NaOH صلبة. وأزيل الراسب الصلب المتشكل بالترشيح خلال سياليت. واستخلصت الطبقة المائية باستخدام EtOAc، غسلت بمحلول ملحي، وجففت فوق كبريتات الصوديوم. وأزيل المذيب بالتبخير بواسطة مبخر دوّار فنتج ١,٥ جم من المركب الوسيط ر في صورة مادة صلبة لونها أصفر. ط ك ك/ش ١٩٤ (ص + H)⁺؛
¹H ر ن م ((CD₃)₂SO): ٢,٤٢ (—، H₂)، ٢,٧٦ (—، H₂)، ٣,٧١ (ف، H₃)، ٦,٥٠ (ف، H₁) ١٠.

المثال ٣٢

٤-مثوكسي-٢-مثيل-٨,٧-ثاني هيدرو-اندينو [٥,٤-د]

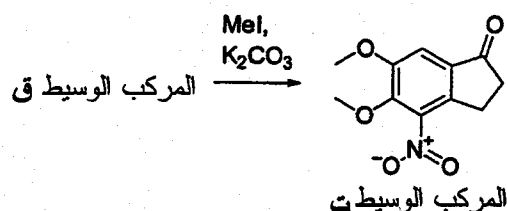
اكسازولون (٦)، المركب الوسيط ش



١٥ كان المركب الوسيط ر مركباً معروفاً وحضر وفقاً لطريقة النشرة العلمية الموصوفة فيما جاء عن جوز إم. سا ومعاونيه في مجلة الكيمياء العضوية، مجلد ٥٧، العدد (٢)، ص ٥٨٩، ١٩٩٢م. وأذيب ١,٥ جم (٧,٨ ملي مول) من ٤-أمينو-٥-هيدروكسي-٦-مثوكسي-اندانون (١) (المركب الوسيط ر) في ٤٠ مل من حمض أسيتيك جليدي وسخن مع الترجيع بشكل معتدل طوال الليل. ولم يكتمل التفاعل بواسطة HPLC ولذلك استمر التفاعل ليوم آخر. وسقي مزيج التفاعل بالماء، جعل قاعدياً باستخدام NaOH تركيزه ٣ عياري واستخلص باستخدام EtOAc. وغسل بمحلول ملحي، وجفف فوق Na₂SO₄ وأزيل المذيب في خواء. ونتج ١,٢ جم من مادة صلبة داكنة اللون (المركب الوسيط ق)؛ ط ك ك/ش ٢١٨ (ص + H)⁺. ٢٠

المثال ٣٤

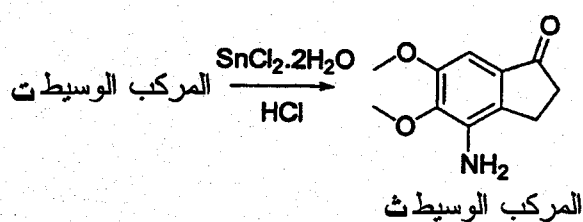
٦،٥-ثاني ميثوكسي-٤-نترو-اندانون (١)، المركب الوسيط ق



أضيف ٤،٤ جم (٠،٠٢ مول) من ٥-هيدروكسي-٦-ميثوكسي-٤-نترو-اندانون (١) (المركب الوسيط ق) و ٢،٧ جم (٠،٠٢ مول) من كربونات البوتاسيوم في DMF. وأضيف ٥،٠ مل (٠،٠٨ مول) من يوديد الميثيل وقلب مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة طوال الليل. وكانت نسبة التحول ١٥% فقط بواسطة HPLC ولذلك استمر التفاعل لأربعة أيام أخرى عند ٥٠°م. وسقي مزيج التفاعل بالماء واستخلص باستخدام EtOAc. وغسل بمحلول ملحي، وجفف فوق Na_2SO_4 وأزيل المذيب في خواء. ونتج ٣،٤ جم من المادة الخام (المركب الوسيط ت). ط ك ك/ش ٢٣٨ (ص+H)⁺.

المثال ٣٥

٤-أمينو-٦،٥-ثاني ميثوكسي-اندانون (١)، المركب الوسيط ث



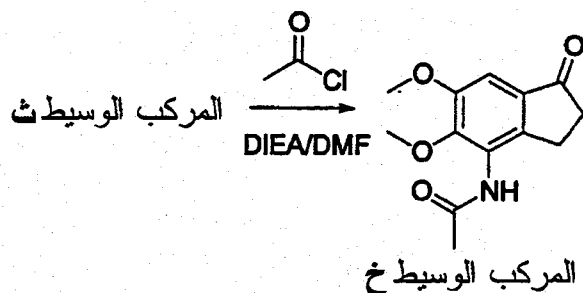
أضيف ٢،٠ جم (٨،٤ ملي مول) من ٦،٥-ثاني ميثوكسي-٤-نترو-اندانون (١) (المركب الوسيط ت) إلى ١٠،٠ جم (٤٤ ملي مول) من ثاني هيدرات كلوريد القصدير في ٣٠ مل من HCl مركز في حمام مبرد بالتج. وقلب مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة طوال الليل. واكتمل التفاعل بواسطة HPLC. وسقي مزيج التفاعل بالماء وجعل متعادلا

باستخدام كريات NaOH صلبة. وأزيل الراسب الصلب المتشكل بالترشيح خلال سيليبت. واستخلصت الطبقة المائية باستخدام EtOAc، غسلت بمحلول ملحي، وجففت فوق كبريتات الصوديوم. وأزيل المذيب بالتبخير بواسطة مبخّر دوّار فنتج ١,٢ جم من مادة صلبة لونها أصفر المركب الوسيط ث. ط ك كـ/ش ٢٠٨ (ص+H)؛

¹H ر ن م (CDCl₃): ٢,٦٩ (عـ، H٢)، ٢,٨٠ (عـ، H٢)، ٣,٨٤ (ف، H٣)، ٣,٨٧ (ف، H٣)، ٤,٠٢ (ف، H٢)، ٦,٧٢ (ف، H١).

المثال ٣٦

N-(٦,٥-ثاني مثنوكسي-١-أكسو-اندانيل ((٤)-أسيتاميد، المركب الوسيط خ

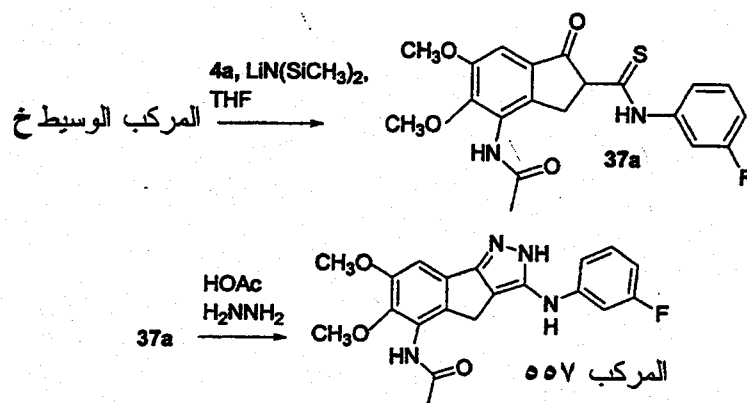


أذيب ٠,٢١٤ جم (١,٠ ملي مول) من ٤-أمينو-٦,٥-ثاني مثنوكسي-اندانون (١) (المركب الوسيط ث) في ٥ مل من DMF و ٠,٠٧١ مل (١,٠ ملي مول) من كلوريد الأسيتيل و ٠,١٨ مل (١,٠ ملي مول) من DIEA. وقلب مزيج التفاعل طوال الليل عند درجة حرارة الغرفة. وسقي مزيج التفاعل باستخدام بيكربونات صوديوم مشبعة واستخلص باستخدام EtOAc. وغسلت الطبقة العضوية بمحلول ملحي، جففت فوق Na₂SO₄ وأزيلت في خواء. ونتج ٠,٢٥ جم من المادة الخام (المركب الوسيط خ)؛ ط ك كـ/ش ٢٥٠,١ (ص + H) +.

المثال ٣٧

N-[3-(3-فلورو-فنييل أمينو)-٦،٧-ثاني ميثوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو

(١، ٢-جـ) بيرازوليل (٥)]-أسيتاميد، المركب ٥٥٧ (الطريقة أ)



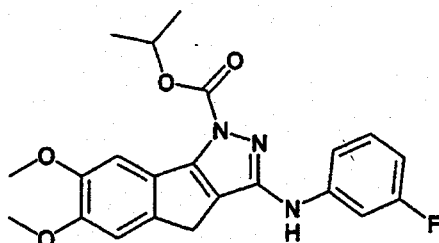
أضيف مزيج من ٠,٢٥ جم (٠,٠٠١ مول) من N-(٦,٥-ثاني ميثوكسي-١-أكسو-اندينيل (٤))-أسيتاميد (المركب الوسيط خ)، ٠,١٤ مل (٠,٠٠١١ مول) من أيزوثيوسيانات ٣-فلورو-فنييل (المركب 4a) و ١,٥ مل من THF إلى ١,٢ مل (٠,٠٠١٢ مول) من سداس ميثيل ثاني سيلان الليثيوم نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وقلب مزيج التفاعل لمدة ٤ ساعات فنتج منتج المركب الوسيط (المركب 37a) الذي لم يفصل. وأضيف ٠,٠٧ مل (٠,٠٠٢٢ مول) من الهيدرازين و ٠,١٣٢ مل (٠,٠٠٢٢ مول) من حمض الأسيتيك إلى مزيج التفاعل ثم سخن عند درجة حرارة الترجيع لمدة ١٨ ساعة. ثم أولاً أضيف المزيج الناتج إلى ١٠ مل من الماء وبعد ذلك استخلص باستخدام EtOAc. ومزجت الطبقات العضوية وغسلت بمحلول NaHCO₃ مائي، ثم غسلت بالماء والمحلول الملحي، وجففت فوق Na₂SO₄، وأزيل المذيب في خواء. وأعدت المادة الخام بواسطة HPLC معكوس الطور. ونتج عن التجفيد مسحوق لونه أبيض (المركب ٥٥٧). ط ك ك/ش ٣٨٣,١ (ص H⁺)؛

¹H ر ن م ((CD₃)₂SO): ٢,٠٧ (ف، H١)، ٣,٣٢ (ف، H١)، ٣,٤٠ (ف، H١)، ٣,٧٢ (ف، H٣)، ٣,٨٩ (ف، H٣)، ٦,٥١ (ث، H١)، ٦,٩٢ (ث، H١)، ٧,١٨ (ع، H٣)، ٨,٨٧ (عريض، H١)، ٩,٦٢ (ف، H١).

المثال ٣٨

استر أيزوبروبيل لحمض ٣-(٣-فلورو-فنيـل أمينو)-٧،٦-ثاني مـثوكسي-٤-اندينو

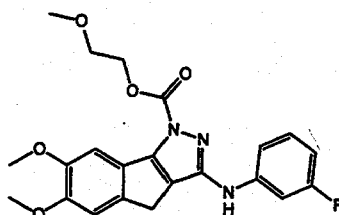
[١، ٢-ج] بيرازول-١-كربوكسيليك، المركب ٤٣٦ (الطريقة ع)



- ٥ قلب محلول من ٠,٥ جم (٠,٠٠١٤ مول) من (٧,٦-ثاني مـثوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [١، ٢-ج] بيرازوليل (٣))-٣-(فلورو-فنيـل)-أمين HCl (المركب ١٤)، ١٠ مل من THF و ٠,٥١٢ مل (٠,٠٠٢٩٥ مول) من ثاني أيزوبروبيل أمين حتى ذابت المادة الصلبة بشكل كامل. وأضيف ١,٥ مل (٠,٠٠١٥ مول) من كلورو فورمات أيزوبروبيل ببطء عند درجة حرارة الغرفة. وقلب مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة طوال الليل. وأزيل المذيب في خواء من المركبات العضوية الناتجة. وكانت محاولة فصل الزمراء الناتجة باستشراب معكوس الطور غير ناجحة. ووضع الزمير الذي يحتوي على أجزاء في ثلاثة. وتبلور معظم الزمير الرئيسي. ورشحت بلورات المركب المسمى بالعنوان ببيضاء اللون من المحلول (المركب ٤٣٦). ط ك كـ/ش ٤١٢ (ص + H)⁺؛
- ١٠ ¹H ر ن م ((CD₃)₂SO): ١,٤ (ز، H٦)، ٣,٥٥ (ف، H٢)، ٣,٨٥ (ف، H٦)، ٥,٢٥ (سباعي، H١)، ٦,٦٥ (ث، H١)، ٧,٢٥ (عـ، H٣)، ٧,٦٥ (ز، H١)، ٧,٨ (ف، H١)، ٩,٤ (ف، H١).

المثال ٣٩

استر ٢-مئوكسي-اثلل لحمض ٣-(٣-فلورو-فنيل أمينو)-٧،٦-ثاني مئوكسي
H٤-اندينو [١، ٢-ج] بيرازول-١-كربوكسيليك، المركب ٤٣٨ (الطريقة ع)

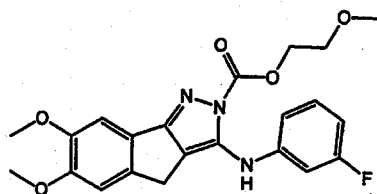


قلب محلول من ٠,٥ جم (٠,٠٠١٤ مول) من ٧،٦-ثاني مئوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [١، ٢-ج] بيرازوليل (٣)-((٣-فلورو-فنيل)-أمين HCl (المركب ١٤)، ١٠ مل من THF و ٠,٥١٢ مل (٠,٠٠٢٩٥ مول) من ثاني أيزوبروبيل أمين حتى ذابت المادة الصلبة بشكل كامل. وأضيف ٠,١٧٨ مل (٠,٠٠١٥٤ مول) من كلورو فورمات ٢-مئوكسي اثلل نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة. وبعد ساعتين من التقليب، اكتمل التفاعل. وأزيل المذيب في خواء ووضع زيت عضوي على نظام استشراب معكوس الطور لفصل الزمراء. وكان الفصل ناجحاً. وجمعت الأجزاء وجفدت فنتجت مادة صلبة لونها أصفر باهت (المركب ٤٣٨). وأظهر ر ن م أن الزمير الرئيسي هو المركب المسمى بالعنوان. ط ك ك/ش ٤٢٨ (ص+H)⁺؛

¹H ر ن م ((CD₃)₂SO): ٣,٣٥ (ف، H³)، ٣,٦ (ف، H²)، ٣,٧٥ (ث، H²)، ٣,٨٥ (ز، H¹)، ٤,٦ (ث، H²)، ٦,٧ (ع، H¹)، ٧,٣ (ع، H³)، ٧,٧ (ز، H¹)، ٧,٨ (ف، H¹)، ٩,٤ (ف، H¹). ١٥

المثال ٤٠

استر ٢-مئوكسي-اثلل لحمض ٣-(٣-فلورو-فنيل أمينو)-٧،٦-ثاني مئوكسي
H٤-اندينو [١، ٢-ج] بيرازول-٢-كربوكسيليك، المركب ٤٣٧ (الطريقة ع)



قلب محلول من ٠,٥ جم (٠,٠٠١٤ مول) من (٧,٦-ثاني ميثوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [١, ٢-ج-] بيرازوليل (٣))-(٣-فلورو-فنييل)-أمين HCl (المركب ١٤)، ١٠ مل من THF و ٠,٥١٢ مل (٠,٠٠٢٩٥ مول) من ثاني أيزوبروبيل أمين حتى ذابت المادة الصلبة بشكل كامل. وأضيف ٠,١٧٨ مل (٠,٠٠١٥٤ مول) من كلورو فورمات ٢-ميثوكسي اثيل نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة. وبعد ساعتين من التقليل، اكتمل التفاعل. وأزيل المذيب في خواء ووضع زيت عضوي على نظام استشراب معكوس الطور لفصل الزمراء. وكان الفصل ناجحاً. وجمعت الأجزاء وجفدت فنتجت مادة صلبة لونها أصفر باهت (المركب ٤٣٧). وأظهر ر ن م أن الزمير الرئيسي هو المركب المسمى بالعنوان. ط ك ك/ش ٤٢٨ (ص+H)⁺؛

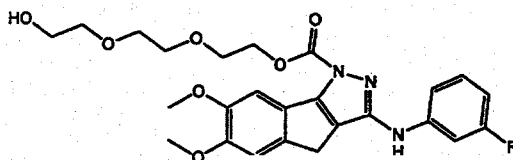
^1H ر ن م $(\text{CD}_3)_2\text{SO}$: ٣,٣٥ (ف, H^3), ٣,٤ (ف, H^2), ٣,٧ (ث, H^2), ٣,٨ (ف, H^3), ٣,٩ (ف, H^3), ٤,٥ (ث, H^2), ٦,٨٥ (ث, H^1), ٧,٠ (ع, H^2), ٧,٢ (ف, H^1), ٧,٣٥ (ف, H^1), ٨,٩ (ع, H^2), ٨,٩ (ف, H^1).

المثال ٤١

استر ۲- [۲- (۲-هیدروکسی-اثوکسی)-اثوکسی]-اثیل لحمض ۳-(۳-فلورو-فیل-امینو)-

٦، ٧-ثاني مئوكسي-H-اندينو [١، ٢-ج] بيرازول-١-كربوكسيليك، المركب ٤٧١

(الطريقة ٤)



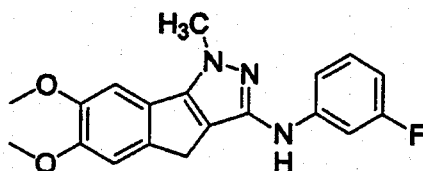
جهزت قارورتان بحيث احتوت كل منهما على ٥٠ مل من THF. وأضيف ٠,٥٠ جم (٠,٠٠١٤ مول) من (٧,٦-ثاني ميثوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [١, ٢-ج] بيرازوليل ((٣)-(٣-فلورو-فنييل)-أمين HCl (المركب ١٤) و ٠,٥١٢ مل (٠,٠٠٢٩٥ مول) من ثاني أيزوبروبيل أمين إلى القارورة الأولى التي قلبت محتوياتها في جو من الأرجون حتى ذابت المادة الصلبة بشكل كامل. وأضيف ١,١٣٤ مل (٠,٠٠٥٥ مول) من ثنائي (كلوروفورمات) ثالث (جليكول اثيلين) إلى القارورة الثانية التي وضعت في حمام كحول أيزوبروبيل مبرد بالتلج الجاف في جو من الأرجون. ثم أضيف كل محتويات القارورة الأولى دفعة واحدة إلى القارورة الثانية. واكتمل التفاعل خلال ١٠ دقائق. وترك مزيج التفاعل ليصل إلى درجة حرارة الغرفة. وأزيل المذيب في خواء. وأذيب الزيت الناتج بني اللون في أسيتات اثيل وثنائي كلوروميثان وغسل باستخدام بيكرينات الصوديوم. وجففت المركبات العضوية الناتجة فوق كبريتات الصوديوم، ورشحت، وأزيل المذيب في خواء. وفصل الزمير الرئيسي (المركب ٤٧١) من الزمير الثانوي باستشراب معكوس الطور. وحلّ الكلورفورمات الطق، بواسطة H^1 ر ن م، إلى الكحول في DMSO المستخدم لتحميل العمود معكوس الطور. وجمعت أجزاء كل زمير وجفدت. ط ك كـ/ش ٥٠٢ (ص+H)⁺؛

H^1 ر ن م $((CD_3)_2SO)$: ٣,٧-٣,٣ (عـ، H^{12})، ٣,٨٥ (ز، H^6)، ٤,٦ (عـ، H^2)، ٦,٧ (عـ، H^1)، ٧,٣ (عـ، H^3)، ٧,٧ (ز، H^1)، ٧,٨ (ف، H^1)، ٩,٤ (ف، H^1).

المثال ٤٢

(٧,٦-ثاني ميثوكسي-١-مethyl-٤,١-ثاني هيدرو-اندينو [١, ٢-ج] بيرازوليل ((٣)-

(٣-فلورو-فنييل)-أمين، المركب ٦٠٩ (الطريقة ل)



أضيف ٠,١٤١ جم (٠,٠٠١ مول) من يودوميثان إلى مزيج من ٣٢١ مجم (٠,٠٠١ مول) من (٣-فلورو-فنييل)-٧,٦-ثاني ميثوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [١, ٢-ج]-١-

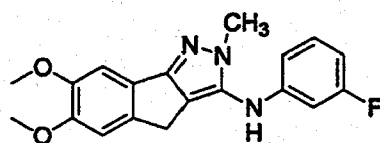
(N-مثيل-بيرازوليل (٣))-أمين (المركب ١٤)، ٠,١٢٩ جم (٠,٠٠١ مول) من ثاني أيزوبروبيل اثيل أمين، و ٥ مل من DCM. وقلب مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة لمدة ١٨ ساعة. وأولاً أضيف المزيج الناتج إلى ٥ مل من الماء ثم استخلص باستخدام CH_2Cl_2 . ومزجت الطبقات العضوية وغسلت بمحلول NaHCO_3 مائي، ثم غسّلت بالماء، وجففت فوق Na_2SO_4 ، وأزيل المذيب في خواء. واحتوى المزيج على زميرين على أساس تحليل ط ك/HPLC. وفصل المزيج بواسطة HPLC باستخدام عمود من نوع سي-١٨ معكوس الطور و $\text{TFA-H}_2\text{O-CH}_3\text{CN}$ بصفتها مذيبات متدرجة التركيز. ونتج المركب المسمى بالعنوان (المركب ٦٠٩)؛ الزمير الرئيسي) في صورة ملح TFA صلب ونقي المنتج بواسطة HPLC بنسبة ١٠٠% (الطول الموجي = ٢١٤ ميكرومتر بالأشعة فوق البنفسجية)؛ ط ك/ك/ش ٣٤٠ (ص+H)؛

^1H ر ن م (CDCl_3): ۳,۳۳ (ف، ه $_2$)، ۳,۸۴ (ف، ه $_3$)، ۳,۹۰ (ف، ه $_3$)، ۳,۹۵ (ف، ه $_3$)، ۶,۴۸ (ث، ه $_1$)، ۶,۶۶ (ز، ه $_1$)، ۶,۵۷ (ز، ه $_1$)، ۷,۰ (ف، ه $_1$)، ۷,۱ (ث، ه $_2$).

المثال ٤٣

٦، ٧-ثاني مٹوكسى-٢-مٹيل-١، ٤-ثاني هيڊرو-انڊينو [١، ٢-ج-] بيرازوليل (٣)-

(٣-فلورو-فنييل)-أمين، المركب ٦١٠ (الطريقة ل)



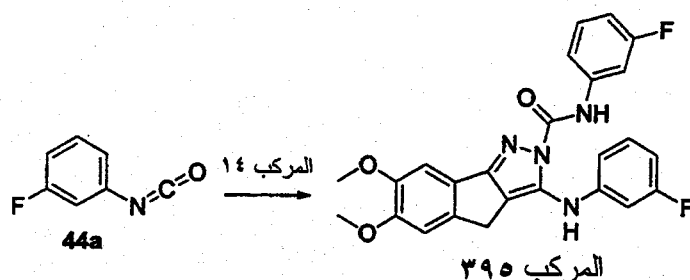
أضيف ٠,١٤١ جم (٠,٠٠١ مول) من يودوميثان إلى مزيج من ٣٢١ مجم (٠,٠٠١ مول) من (٣-فلورو-فنيـل)-٧,٦-ثاني مـثوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [١, ٢-ج]-١-N-مـثـيل-بيـرازولـيل ((٣)-أـمـين (المركب ١٤)، ٠,١٢٩ جم (٠,٠٠١ مول) من ثاني

أيزوبروبيل اثيل أمين، و ٥ مل من DCM. وقلب مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة لمدة ١٨ ساعة. وأولاً أضيف المزيج الناتج إلى ٥ مل من الماء ثم استخلص باستخدام CH_2Cl_2 . ومزجت الطبقات العضوية وغسلت بمحلول NaHCO_3 مائي، ثم غسلت بالماء، وجففت فوق

Na_2SO_4 ، وأزيل المذيب في خواء. واحتوى المزيج على زميرين على أساس تحليل ط ك/HPLC. وفصل المزيج بواسطة HPLC باستخدام عمود من نوع سي-١٨ معكوس الطور و $\text{TFA-H}_2\text{O-CH}_3\text{CN}$ بصفتها مذيبات متدرجة التركيز. ونتج المركب المسمى بالعنوان (المركب ٦١٠)؛ (الزمير الثانوي) في صورة ملح TFA صلب. ط ك ك-ش ٣٤٠ (ص+H)⁺؛ ¹H ر ن م (CDCl_3): ٣,٣٣ (ف، H٢)، ٣,٧٤ (ف، H٣)، ٣,٨٤ (ف، H٣)، ٣,٨٨ (ف، H٣)، ٦,٣٧ (ز، H١)، ٦,٤٦ (ز، H١)، ٦,٥٣ (ث، H١)، ٧,٠ (ف، H١)، ٧,١ (ث، H١)، ٧,٢ (ف، H١).

المثال ٤٤

(٣-فلورو-فنيـل)-أميد لحمض ٣-(٣-فلورو-فنيـل أمينو)-٦,٧-ثاني مثنوكسي
H٤-اندينو [٢,١-ج-] بيرازول-٢-كربوكسيليك، المركب ٣٩٥ (الطريقة ق)



أضيف ٠,١٣٧ جم (٠,٠٠١ مول) من أيزوسيانات ٣-فلورو فنيـل (المركب 44a) إلى مزيج من ٣٢١ مجم (٠,٠٠١ مول) من (٣-فلورو-فنيـل)-٦,٧-ثاني مثنوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] ١-(N-مئيل-بيرازوليل (٣))-أمين (المركب ١٤)، ٠,١٢٩ جم (٠,٠٠١ مول) من ثاني أيزوبروبيل ائيل أمين، و ٥ مل من DCM. وقلب مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة لمدة ١٨ ساعة. وأولاً أضيف المزيج الناتج إلى ٥ مل من الماء ثم استخلص باستخدام CH_2Cl_2 . ومزجت الطبقات العضوية وغسلت بمحلول NaHCO_3 مائي، ثم غسلت بالماء، وجففت فوق Na_2SO_4 ، وأزيل المذيب في خواء. ونقي المركب المسمى بالعنوان بواسطة HPLC باستخدام عمود من نوع سي-١٨ معكوس الطور و $\text{TFA-H}_2\text{O-CH}_3\text{CN}$

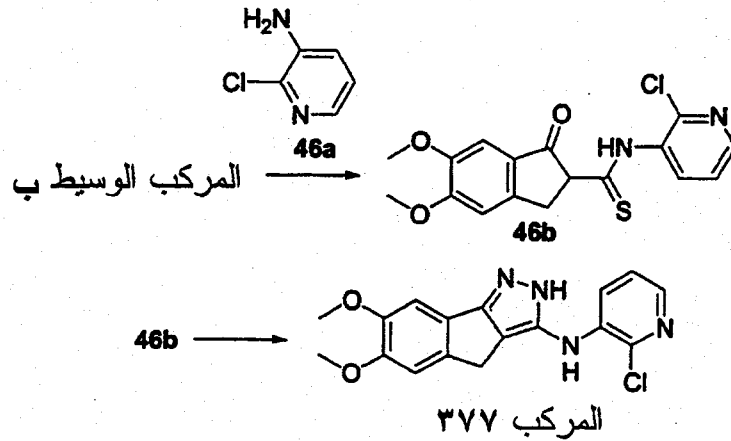
بصفتها مذيبات متدرجة التركيز. ونتج المركب المسمى بالعنوان في صورة ملح TFA صلب.
ط كـ/ش ٤٦٣ (ص+H)⁺؛

¹H ر ن م (CDCl₃): ٣,٣٣ (ف، H٢)، ٣,٧٤ (ف، H٣)، ٣,٨٤ (ف، H٣)، ٣,٨٨ (ف، H٣)، ٦,٣٧٧ (ع، H١)، ٧,٢١ (ف، H١)، ٧,٣٣ (ع، H٣)، ٧,٤ (ع، H٢)، ٧,٦ (ز، H٣)، ٧,٨٥ (ف، H١)، ٧,٩ (ع، H١)، ٩,٣١ (ف، H١)، ٩,٥٤ (ف، H١).

المثال ٤٦

(٢-كلورو-بيريديل (٣))-(٧,٦-ثاني مثنوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو

(٢,١-جـ) بيرازوليل (٣))-أمين، المركب ٣٧٧ (الطريقة ب)



مزج محلول من ٠,٣٠٢ جم (٠,٠٠١ مول) من ٢-(إيميدازول-١-كربوثيريل)-
٦,٥-ثاني مثنوكسي-اندينون (١) (المركب الوسيط ب) (حضر كما في المثال ٥)، مع ٠,١٢٨ جم (٠,٠٠١ مول) من ٣-أمينو-٢-كلوروبيريدين (المركب 46a) و ١٠ مل من THF في قارورة. ونتج (٤-كلور-N-مethyl-فنييل)-أميد لحمض ٦,٥-ثاني مثنوكسي-١-أكسو-اندين-٢-كربوثيريل (المركب 46b) بعد تقليب مزيج التفاعل لمدة ٤ ساعات عند درجة حرارة الغرفة كما تبين من تحليل ط ك/HPLC، حيث كـ/ش = ٣٦٢ (ص+H)⁺.

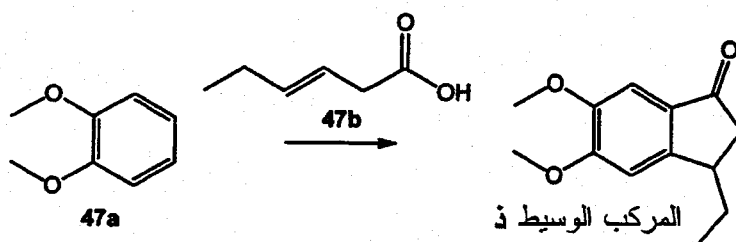
ولم يفصل المركب الوسيط (المركب 46b) عولج المزيج بعد ذلك باستخدام ٠,٠٤ مل (١,٣ ملي مول) من الهيدرازين، ونقطتين من حمض الأسيتيك. وسخن مزيج التفاعل عند

٧٥ م لمدة ١٨ ساعة. ثم خفف محلول التفاعل باستخدام CH_2Cl_2 ، وغسل بمحلول NaHCO_3 مائي، ثم غسل بالماء، وجفف فوق Na_2SO_4 ، وأزيل المذيب في خواء. ونقي المركب المسمى بالعنوان بواسطة HPLC باستخدام عمود من نوع سي-١٨ معكوس الطور و $\text{TFA-H}_2\text{O-CH}_3\text{CN}$ بصفته مذيبات متدرجة التركيز. ونتج المركب المسمى بالعنوان (المركب ٥٢٩) في صورة ملح TFA صلب. ط ك ك-ش ٣٤٣ (ص+H)؛

^1H ر ن م (CDCl_3): ٣,٣٣ (ف، H٢)، ٣,٨٤ (ف، H٣)، ٣,٨٨ (ف، H٣)، ٦,٧٧ (ث، H١)، ٦,٨٦ (ز، H١)، ٧,٦ (ز، H١)، ٧,٩ (ز، H١)، ٨,٢٣ (ف، H١).

المثال ٤٧

٦,٥-ثاني مثنوكسي-٣-إثيل-اندانون (١)، المركب الوسيط ذ



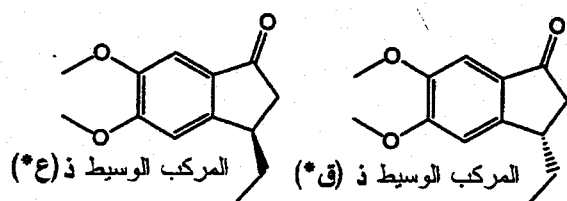
قلب مزيج من ٢١,٩ مل (٠,١٧٠ مول) من ٢,١-ثاني مثنوكسي-بنزين (المركب 47a) و ٢٥,٥ جم (٠,٢٥٥ مول) من حمض بنتينويك (٣) (المركب 47b) في جو من الأرجون في حمام مبرد بالتج. وأضيف ٢٣٠ جم (١,٠٥ مول) من حمض متعدد فسفوريك ببطء. وبعد اكتمال الإضافة، أزيل الحمام المبرد بالتج وسخن مزيج التفاعل لمدة ١٦ ساعة عند ٦٠ م. وأضيف مزيج التفاعل إلى ماء مبرد بالتج واستخلص باستخدام ثاني كلورميثان. وغسلت الخلاصات العضوية باستخدام NaOH تركيزه ٣ عياري، ماء، محلول ملحي وجففت فوق Na_2SO_4 . ثم أزيل المذيب في خواء فنتج زيت لونه أحمر يحتوي على المركب المسمى بالعنوان الخام. ونقيت المادة الخام على عمود من هلام السليكا باستخدام ثاني كلوروميثان بصفته مادة التصويل. ومزجت الأجزاء النقية وركزت فنتج المزيج الراسيمي للمركب المسمى بالعنوان في صورة مادة صلبة لونها أبيض ضارب إلى الصفرة. ط ك ك-ش ٢٢١ (ص+H)؛ ونقي المنتج بواسطة HPLC بنسبة ٩٩% (بالأشعة فوق البنفسجية)؛

^1H ر ن م: ٠,٩ (ث, H^3), ١,٤ (ع, H^1), ٢,٠ (ع, H^1), ٢,٢ (ز, H^1), ٢,٧ (ز, H^1), ٣,٢ (ع, H^1), ٣,٨ (ف, H^1), ٣,٩ (ف, H^1), ٧,٠ (ف, H^1), ٧,٢ (ف, H^1).

المثال ٤٨

ق* ٦,٥-ثاني مثنوكسي-٣-اثيل-اندانون (١)، المركب الوسيط ذ (ق*)؛

ع* ٦,٥-ثاني مثنوكسي-٣-اثيل-اندانون (١)، المركب الوسيط ذ (ع*)



استخدم المزيج الراسيمي، المحضر في المثال ٤٧، لفصل لانطباقي. وأجري الفصل باستخدام عمود من نوع كايرال باك إيه دي (Chiralpack AD) (وزن حشوته ٥٠٠ جم، قطره الداخلي ٥ سم وطوله ٤١ سم) باستخدام مزيج من هكسان/إيثانول بنسبة ١٢/٨٨ بتوزيع متساوي بصفته مزيج التوصيل. وجمعت الأبداد النقية وأزيل المذيب في خواء فتجت بلورات لونها أبيض ضارب إلى الصفرة من المركب المسمى بالعنوان. ط ك كـ/ش ٢٢١

(ص+ H^+)؛ ونقي المنتج بواسطة HPLC بنسبة ٩٩% (بالأشعة فوق البنفسجية)؛

^1H ر ن م: ٠,٩ (ث, H^3), ١,٤ (ع, H^1), ٢,٠ (ع, H^1), ٢,٢ (ز, H^1), ٢,٧ (ز, H^1), ٣,٢ (ع, H^1), ٣,٨ (ف, H^1), ٣,٩ (ف, H^1), ٧,٠ (ف, H^1), ٧,٢ (ف, H^1).

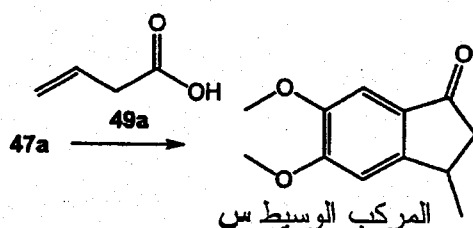
ويكون الشكلان ق* و ع* كما بينا في الرسم. ولم يحدد الشكلان المطلقان.

يكون للزمير ق* دوران: $\alpha (\text{MeOH}) = -20,50$

يكون للزمير ع* دوران: $\alpha (\text{MeOH}) = +18,60$

المثال ٤٩

٦,٥-ثاني مثنوكسي-٣-مثيل-اندانون (١)، المركب الوسيط س



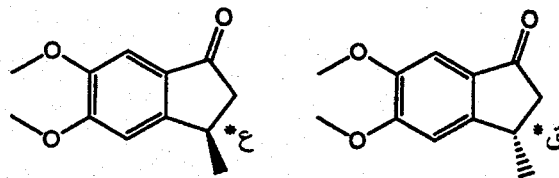
قلب مزيج من ١٩,١ مل (٠,١٥٠ مول) من ٢,١-ثاني ميثوكسي-بنزين (المركب 47a) و ١٩,٢ مل (٠,٢٢٥ مول) من حمض البيوتينيك (٣) (المركب 49a) في جو من الأرجون في حمام ثلجي. وأضيف ٢٣٠ جم (١,٠٥ مول) من حمض متعدد الفسفوريك ببطء. وبعد اكتمال الإضافة، أزيل الحمام المبرد بالثلج وسخن مزيج التفاعل لمدة ١٦ ساعة عند ٦٠°م. وأضيف مزيج التفاعل إلى ماء مبرد بالثلج واستخلص باستخدام إيثر. وغسلت الخلاصات العضوية باستخدام NaOH تركيزه ٣ عياري، ماء، محلول ملحي وجففت فوق Na_2SO_4 . ثم أزيل المذيب في خواء فنتجت مادة صلبة لونها أصفر تحتوي على مزيج راسيمي من المركب المسمى بالعنوان. ونقيت المادة الخام على عمود من هلام السليكا باستخدام مزيج من EtOAc: هكسان بنسبة ٢:١ بصفته مزيج التصويل. ومزجت الأجزاء النقية وركزت فنتج المزيج الراسيمي للمركب المسمى بالعنوان (المركب الوسيط س) في صورة مادة صلبة لونها أبيض ضارب إلى الصفرة. ط ك ك-ش ٢٠٧ (ص+H)⁺؛

^1H ر ن م: ١,٣ (ز، H^3)، ٢,١ (زز، H^1)، ٢,٨ (زز، H^1)، ٣,٣ (ع—، H^1)، ٣,٨ (ف، H^3)، ٣,٩ (ف، H^3)، ٧,٠ (ف، H^1)، ٧,٢ (ف، H^1).

المثال ٥٠

(٣ق)-(٦,٥-ثاني ميثوكسي-٣-مثيل)-اندانون (١)، المركب الوسيط س (ق*)؛

(٣ع)-(٦,٥-ثاني ميثوكسي-٣-مثيل)-اندانون (١)، المركب الوسيط س (ع*)



استخدم المزيج الراسيمي (المركب الوسيط س)، المحضر في المثال ٤٩، لفصل لانطباقي. وأجري الفصل على عمود من نوع كايرال باك إيه دي (وزن حشوته ٥٠٠ جم، قطره الداخلي ٥ سم وطوله ٤١ سم) باستخدام مزيج من هكسان/إيثانول بنسبة ١٢/٨٨ بتوزيع متساوي بصفته مزيج التصويل. وجمعت الأبداد النقية وأزيل المذيب في خواء فنتجت بلورات

لونها أبيض ضارب إلى الصفرة من المركب المسمى بالعنوان. ط ك كـ/ش ٢٠٧

(ص+H)⁺؛ ونقي المنتج بواسطة HPLC بنسبة ٩٧% (بالأشعة فوق البنفسجية)؛

¹H ر ن م: ١,٣ (ز, H^٣), ٢,١ (زز, H^١), ٢,٨ (زز, H^١), ٣,٣ (عـ, H^١), ٣,٨ (ف, H^٣), ٣,٩ (ف, H^٣), ٧,٠ (ف, H^١), ٧,٢ (ف, H^١).

ويكون الشكلان ق* و ع* كما بينا في الرسم. ولم يحدد الشكلان المطلقان.

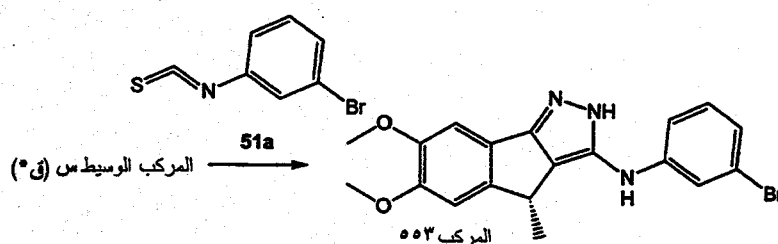
يكون للزمير ق* دوران: α (MeOH) = -٨,٥

يكون للزمير ع* دوران: α (MeOH) = +٦,٠

المثال ٥١

(٤ق)-N-(٣-برومو-فنيـل)-٧,٦-ثاني مـثوكسي-٤-مـثيل-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو

(٢,١-جـ- [بيرازوليل (٣)]-أمين، المركب ٥٥٣ (الطريقة أ)



أضيف ٠,٢٥٠ جم (٠,٠٠١٢ مول) من ق* -٦,٥-ثاني مـثوكسي-٣-مـثيل-اندينون

(١) (المركب الوسيط س ق*) إلى قارورة في جو من الأرجون وقلب في THF حتى

النوبان. وأضيف ١,٢٢ مل (٠,٠٠١٢٢ مول) من سادس مـثيل ثاني سيلان الليثيوم نقطة

نقطة. وقلب المحلول لمدة ٣٠ دقيقة حتى تحول لونه إلى أحمر غامق. وأضيف ٠,٢٦١ جم

(٠,٠٠١٢٢ مول) من ٣-Br-أيزوثيوسيانات (المركب 51a) وأصبح لون مزيج التفاعل أحمر

غامق بدرجة أكبر. وأضيف ٠,٠٧٦ مل (٠,٠٠١٣٢ مول) من حمض الأسيتيك و٠,٠٥٩ مل

(٠,٠٠١٢٢ مول) من هيدرات الهيدرازين. وسخن مزيج التفاعل مع الترجيع عند ٨٠ م لمدة

١٨ ساعة. وعند اكتمال العملية، أضيف ١ مل من الماء إلى مزيج التفاعل. وصب المحلول

على عمود تجفيف واستخلص من العمود باستخدام ثاني كلوروميثان. وصرف المذيب

باستخدام غاز النتروجين وأذيبت المادة الخام في DMSO للتقنية بواسطة HPLC معكوس

الطور. وجمعت الأجزاء النقية وجفدت فنتج المركب المسمى بالعنوان (المركب ٥٥٣) في صورة مادة صلبة لونها أصفر باهت. ط ك كـ/ش ٤٠١ (ص+H)⁺؛ ونقي المنتج بواسطة HPLC بنسبة ١٠٠% (بالأشعة فوق البنفسجية)؛

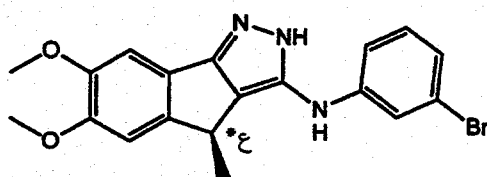
¹H ر ن م: ١,٢ (ز، H³)، ٣,٧ (ر، H¹)، ٣,٨ (ز، H⁶)، ٧,٠ (ع—، H¹)، ٧,١ (ف، H¹)، ٧,٢ (ز، H²)، ٧,٢٥ (ف، H¹)، ٧,٥٥ (ف، H¹)، ٨,٨ (ف، H¹)، ٦٢,٨٥ + = (MeOH) α دوران: *

يكون للزمرق * دوران: α (MeOH) = ٦٢,٨٥ + ولم يحدد الشكل المطلق.

المثال ٥٢

(ع*)-(٣-برومو-فنيـل)-٧,٦-ثاني مـثوكسي-٤-مـثيل-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو

[٢,١-ج-] بيرازوليل (٣)-((٣)-أمين، المركب ٥٦٨ (الطريقة أ)



أضيف ٠,٢٥٠ جم (٠,٠٠١٢ مول) من ع* ٥,٦-ثاني مـثوكسي-٣-مـثيل-اندينون (١) (المركب الوسيط س (ع*)) إلى قارورة في جو من الأرجون وقلب في THF حتى الذوبان. وأضيف ١,٢٢ مل (٠,٠٠١٢٢ مول) من سادس مـثيل ثاني سيلان الليثيوم نقطة نقطة. وقلب المحلول لمدة ٣٠ دقيقة حتى تحول لونه إلى أحمر غامق. وأضيف ٠,٢٦١ جم (٠,٠٠١٢٢ مول) من ٣-Br-أيزوثيوسيانات (المركب 51a) وأصبح لون مزيج التفاعل أحمر غامق بدرجة أكبر. وأضيف ٠,٠٧٦ مل (٠,٠٠١٣٢ مول) من حمض الأسيتيك و٠,٠٥٩ مل (٠,٠٠١٢٢ مول) من هيدرات الهيدرازين. وسخن مزيج التفاعل مع الترجيع عند ٨٠°م لمدة ١٨ ساعة. وعند اكتمال العملية، أضيف ١ مل من الماء إلى مزيج التفاعل. وصب المحلول على عمود تجفيف واستخلص من العمود باستخدام ثاني كلوروميثان. وصرف المذيب باستخدام غاز النتروجين وأذيبت المادة الخام في DMSO للتنقية بواسطة HPLC معكوس الـطور. وجمعت الأجزاء النقية وجفدت فنتج المركب المسمى بالعنوان (المركب ٥٦٨) في

صورة مادة صلبة لونها أصفر باهت. ط ك كـ/ش ٤٠١ (ص⁺H)؛ ونقي المنتج بواسطة HPLC بنسبة ١٠٠% (بالأشعة فوق البنفسجية)؛

¹H ر ن م: ١,٢ (ز, H^٣), ٣,٧ (ر, H^١), ٣,٨ (ز, H^٦), ٧,٠ (ع, —), ٧,١ (ف, H^١), ٧,٢ (ز, H^٢), ٧,٢٥ (ف, H^١), ٧,٥٥ (ف, H^١), ٨,٨ (ف, H^١).

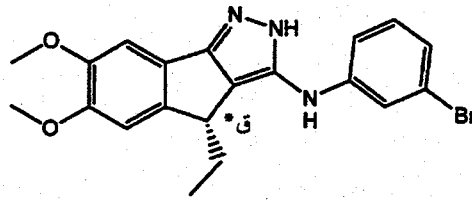
يكون للزمير ع* دوران: α (MeOH) = -٦٢,٦٠

ولم يحدد الشكل المطلق.

المثال ٥٣

ق*-(٣-برومو-فنييل)-(٧,٦-ثاني ميثوكسي-٤-إثيل-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو

[٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣))-أمين، المركب ٥٥٥ (الطريقة أ)



أضيف ٠,٢٥٠ جم (٠,٠٠١١ مول) من ق* -٦,٥-ثاني ميثوكسي-٣-إثيل-اندينون

(١) (المركب الوسيط ذ (ق*)) إلى قارورة في جو من الأرجون وقلب في THF حتى

النوبان. وأضيف ١,٢ مل (٠,٠٠١٢ مول) من سادس ميثيل ثاني سيلان الليثيوم نقطة نقطة.

وقلب المحلول لمدة ٣٠ دقيقة حتى تحول لونه إلى أحمر غامق. وأضيف ٠,٢٥٧ جم

(٠,٠٠١٢ مول) من ٣-Br-أيزوثيوسيانات (المركب 51a) وأصبح لون مزيج التفاعل أحمر

غامق بدرجة أكبر. وأضيف ٠,٠٦٩ مل (٠,٠٠١٢١ مول) من حمض الأسيتيك و٠,٠٥٨ مل

(٠,٠٠١٢ مول) من هيدرات الهيدرازين. وسخن مزيج التفاعل مع الترجيع عند ٨٠°م لمدة

١٨ ساعة. وعند اكتمال العملية، أضيف ١ مل من الماء إلى مزيج التفاعل. وصب المحلول

على عمود تجفيف واستخلص من العمود باستخدام ثاني كلوروميثان. وصرف المذيب

باستخدام غاز النتروجين وأذيبت المادة الخام في DMSO للتقية بواسطة HPLC معكوس

الطور. وجمعت الأجزاء النقية وجفنت فنتج المركب المسمى بالعنوان (المركب ٥٥٥) في

صورة مادة صلبة لونها أصفر باهت. ط ك كـ/ش ٤١٥ (ص+H)⁺؛ ونقي المنتج بواسطة

HPLC بنسبة ١٠٠% (بالأشعة فوق البنفسجية)؛

¹H ر ن م: ٠,٥ (ث، H³)، ١,٧ (ع، H¹)، ١,٨ (ع، H¹)، ٣,٧ (ث، H¹)، ٣,٨ (ز، H⁶)، ٦,٩٥ (ز، H¹)، ٧,١ (ز، H¹)، ٧,٢ (ع، H³)، ٧,٣ (ف، H¹)، ٨,٧ (ف، H¹).

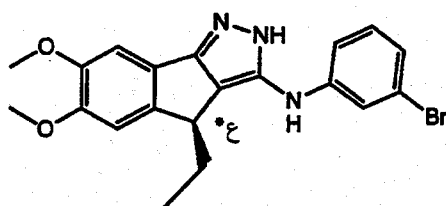
يكون للزميرق* دوران: α (MeOH) = +٧٤,٦٤

ولم يحدد الشكل المطلق.

المثال ٥٤

ع*-(٣-برومو-فنييل)-(٧,٦-ثاني ميثوكسي-٤-إثيل-٦,٥-ثاني هيدرو-اندينو

٢,١-ج-] بيرازوليل (٣)-أمين، المركب ٥٧٠ (الطريقة أ)



أضيف ٠,٢٥٠ جم (٠,٠٠١١ مول) من ع*-(٦,٥-ثاني ميثوكسي-٣-إثيل-اندينون

(١) (المركب الوسيط ذ ع*) إلى قارورة في جو من الأرجون وقلب في THF حتى الذوبان.

وأضيف ١,٢ مل (٠,٠٠١٢ مول) من سادس ميثيل ثاني سيلان الليثيوم نقطة نقطة. وقلب

المحلول لمدة ٣٠ دقيقة حتى تحول لونه إلى أحمر غامق. وأضيف ٠,٢٥٧ جم (٠,٠٠١٢

مول) من ٣-Br-أيزوثيوسيانات (المركب 51a) وأصبح لون مزيج التفاعل أحمر غامق بدرجة

أكبر. وأضيف ٠,٠٦٩ مل (٠,٠٠١٢١ مول) من حمض الأسيتيك و٠,٠٥٨ مل (٠,٠٠١٢

مول) من هيدرات الهيدرازين. وسخن مزيج التفاعل مع الترجيع عند ٨٠ م لمدة ١٨ ساعة.

وعند اكتمال العملية، أضيف ١ مل من الماء إلى مزيج التفاعل. وصب المحلول على عمود

تجفيف واستخلص من العمود باستخدام ثاني كلوروميثان. وصرف المذيب باستخدام غاز

النيتروجين وأذيبت المادة الخام في DMSO للتقنية بواسطة HPLC معكوس الطور. وجمعت

الأجزاء النقية وجفت فنتج المركب المسمى بالعنوان (المركب ٥٧٠) في صورة مادة صلبة

لونها أصفر باهت. ط ك ك/ش ٤١٥ (ص+H)⁺؛ ونقي المنتج بواسطة HPLC بنسبة ١٠٠%
(بالأشعة فوق البنفسجية)؛

¹H ر ن م: ٠,٥ (ث، H³)، ١,٨ (—، H²)، ٣,٧ (ث، H¹)، ٣,٨ (ز، H⁶)، ٦,٩٥ (ز، H¹)، ٧,١ (ز، H¹)، ٧,٢ (ع، H³)، ٧,٣ (ف، H¹)، ٨,٧ (ف، H¹).

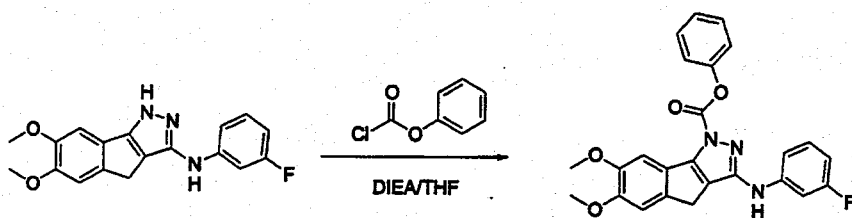
يكون للزمير ع* دوران: α (MeOH) = -٥٣,٨٥

ولم يحدد الشكل المطلق.

المثال ٥٥

استر فنييل لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني مثنوكسي-٤-اندينو

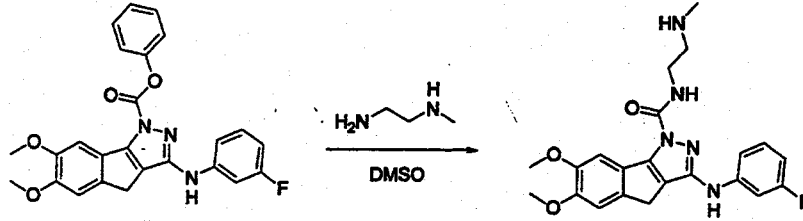
[٢,١-ج] بيرازول-١-كربوكسيليك (الطريقة ع)، المركب ٤٣٣



أضيف ١,٤ مل (٨,٤ ملي مول) من ثاني أيزوبروبيل اثيل أمين (DIPEA) إلى مزيج من ١,٥ جم (٤,٢ ملي مول) من (٧,٦-ثاني مثنوكسي-٤,١-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل (٣))-٣-(فلورو فنييل)-أمين (المركب ١٤)، ٠,٧٦ مل (٦,٣ ملي مول) من كلوروفورمات الفنييل (المركب 55a) و ١٠ مل من THF عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وقلب مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة طوال الليل. وسقي مزيج التفاعل باستخدام بيكربونات صوديوم مشبعة واستخلص بأسيتات الاثيل. وجفف المذيب فوق كبريتات الصوديوم وأزيل بالتبخير بواسطة مبخّر دوّار فنتجت مادة خام (المركب ٤٣٣). ط ك ك/ش ٤٤٦,١ (ص+H)⁺.

المثال ٥٦

(٢-مethyl أمينو-اثير)-أميد حمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني ميثوكسي
-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول-١-كربوكسيليك، المركب ٥٢٤ (الطريقة ف)



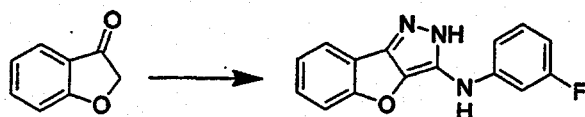
أذيب ٠,٥٠ جم (١,١٢ ملي مول) من استر فنييل لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-
 ٧,٦-ثاني ميثوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول-١-كربوكسيليك و ٠,١٢ مل (١,٣ ملي
 مول) من ١-N-مethyl-اثيران-٢,١-ثاني أمين (المركب 56a) في ٥ مل من DMSO. وقلب
 مزيج التفاعل عند درجة حرارة الغرفة طوال الليل. وسقي مزيج التفاعل باستخدام بيكرونات
 صوديوم مشبعة واستخلص باستخدام أسيتات الاثير. وجفف المذيب فوق كبريتات الصوديوم
 وأزيل بالتبخير بواسطة مبخر دوار. وأعدت المادة الخام باستخدام عمود HPLC من نوع
 جلسون ونتج عن التجفيد المركب المسمى بالعنوان في صورة ملح TFA. ط ك ك/ش
 ٤٢٦,٣ (ص+H)⁺؛

¹H ر ن م ((CD₃)₂SO): ٢,٦ (ف، H^٣)، ٣,١٢ (عـ، H^٢)، ٣,٢٤ (ف، H^٢)، ٣,٥٨ (ر،
 H^٢)، ٣,٧٨ (ف، H^٣)، ٣,٨١ (ف، H^٣)، ٦,٥٥ (ث، H^١)، ٧,٢١ (عـ، H^٢)، ٧,٣٢ (ز،
 H^١)، ٧,٤٩ (ز، H^١)، ٧,٩٠ (ف، H^١)، ٨,١٥ (ث، H^١)، ٨,٦٠ (ف، H^١)، ٩,٢٢ (ف،
 H^١).
 ١٥

المثال ٥٧

(٣-فلورو-فنييل)-(٨-٢-أكسا-٣،٢-ديازا-١-حلقي بنتا [أ] اندينيل (١))

-أمين، المركب ٣٨٠ (الطريقة أ)

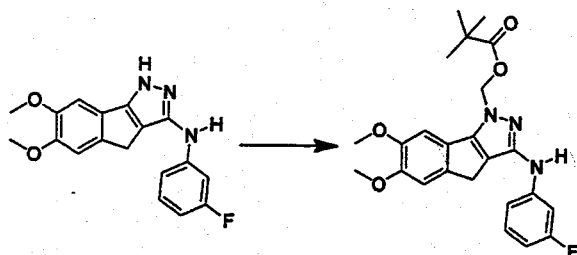


أضيف ١,٣٤ مل (٠,٠٠١٣٤ مول) من سداس مثيل ثاني سيلان الليثيوم إلى مزيج من ٠,١٥٠ جم (٠,٠٠١١٢ مول) من بنزوفورانون (٣) (المركب 57a)، ٠,٢٥٩ جم (٠,٠٠١٣٤ ملي مول) من أيزوثيوسيانات ٣-فلورو-فنييل (المركب 4a) و ٢,٠٠ مل من THF نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وقلب مزيج التفاعل لمدة ١٢ ساعة. وأضيف ٠,٠٨٤ مل (٠,٠٠٢٦٨ مول) من الهيدرازين و ٠,١٥٤ مل (٠,٠٠٢٦٨ مول) من حمض الأسيتيك إلى مزيج التفاعل، الذي سخن عند درجة حرارة الترجيع لمدة ٤٨ ساعة. ثم خفف محلول التفاعل بأسيتات الاثيل، غسل بالماء وجفف فوق $MgSO_4$. وأزيل المذيب في خواء ونقي المركب المسمى بالعنوان بواسطة HPLC باستخدام عمود من نوع سي-١٨ معكوس الطور و $TFA-H_2O-CH_3CN$ بصفتها مذيبات متدرجة التركيز. ونسج المركب المسمى بالعنوان في صورة ملح TFA. ط ك ك-ش ٢٦٨ (ص H^+)؛

^1H ر ن م $((CD_3)_2SO)$: ٦,٥٥ (زث، H^1)، ٦,٩٥ (ز، H^1)، ٧,٠٥ (ز، H^1)، ٧,٢٠ (زز، H^1)، ٧,٤٠ (ع، H^2)، ٧,٦٥ (ز، H^1)، ٧,٧٥ (ز، H^1)، ٩,٠٠ (ف عريض، H^1).

المثال ٥٨

٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧،٦-ثاني مثنوكسي-H٤-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل (١) مثيل
استر لحمض ٢،٢-ثاني مثيل-بروبيونيك المركب ٤٠٩، (الطريقة ل)

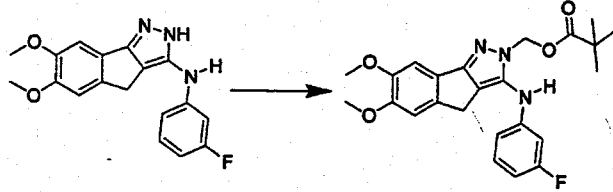


٥ سخن مزيج من ١,٢٥ جم (٠,٠٠٣٨٥ مول) من (٣-فلورو-فنييل)-٧،٦-ثاني مثنوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل ((٣)-أمين (المركب ١٤)، ١,٠٠ مل (٠,٠٠٥٧٨ مول) من ثاني أيزوبروبيل اثيل أمين، ٠,٨٣٣ مل (٠,٠٠٥٧٨ مول) من بيڤالات كلورومثيل و ٠,٩٦٠ جم (٠,٠٠٥٧٨ مول) من يوديد البوتاسيوم في ١٩ مل من THF إلى ٧٥ م لمدة ١٢ ساعة. وخفف مزيج التفاعل بأسيتات الاثيل وغسل بمحلول ملحي وجفف فوق $MgSO_4$. وفصل المركب المسمى بالعنوان الناتج أولاً بواسطة HPLC باستخدام عمود من نوع سي-١٨ معكوس الطور و $TFA-H_2O-CH_3CN$ بصفتها مذيبات متدرجة التركيز. غير أنه، تلوث هذا الزمير بالمادة الأولية (٣-فلورو-فنييل)-٧،٦-ثاني مثنوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل ((٣)-أمين (المركب ١٤)). ونقي المركب المسمى بالعنوان فيما بعد باستشراب عمودي على هلام السليكا (غسل مسبقاً بـ Et_3N تركيزه ١% في هكسانات) بالتصويل باستخدام مزيج من هكسانات: أسيتات اثيل بنسبة ١:٢ بصفته مزيج التصويل. ط ك-ش ٤٤٠,٠١ (ص+H)؛

^1H ر ن م $((CD_3)_2SO)$: ١,٢٠ (ف، H٩)، ٣,٤٠ (ف، H٢)، ٣,٩٠ (ف، H٣)، ٣,٩٦ (ف، H٣)، ٦,٢٠ (ف، H٢)، ٦,٥٧ (ع، H١)، ٦,٨٢ (ز، H١)، ٦,٩٥ (ع، H١)، ٧,٠٣ (ف، H١)، ٧,١٥ (ع، H١)، ٧,٢٧ (ف، H١).

المثال ٥٩

٣-(٣-فلورو-فنيـل أمينو)-٧،٦-ثاني مـثوكسي-٤-اندينو [١، ٢-جـ] بيرازوليل (١) مـثيل
استر لحمض ٢،٢-ثاني مـثيل-بروبيونيك المركب ٤٠٨، (الطريقة ل)



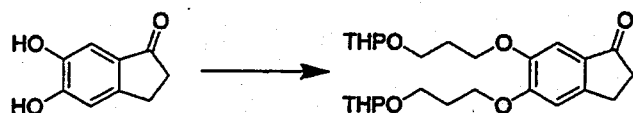
سخن مزيج من ١،٢٥ جم (٠،٠٠٣٨٥ مول) من (٣-فلورو-فنيـل)-٧،٦-ثاني
مثوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [١، ٢-جـ] بيرازوليل ((٣))-أمين (المركب ١٤)، ١،٠٠
مل (٠،٠٠٥٧٨ مول) من ثاني أيزوبروبيل اثيل أمين، ٠،٨٣٣ مل (٠،٠٠٥٧٨ مول) من
بيفالات كلورومثيل و ٠،٩٦٠ جم (٠،٠٠٥٧٨ مول) من يوديد البوتاسيوم في ١٩ مل من THF
إلى ٧٥ م° لمدة ١٢ ساعة. وخفف مزيج التفاعل بأسيتات الاثيل وغسل بمحلول ملحي وجفف
فوق $MgSO_4$. وفصل المركب المسمى بالعنوان الناتج ثانياً بواسطة HPLC باستخدام عمود من
نوع سي-١٨ معكوس الطور و $TFA-H_2O-CH_3CN$ بصفتها مذيبات متدرجة التركيز. غير
أنه، تلوث هذا الزمير بالمادة الأولية (٣-فلورو-فنيـل)-٧،٦-ثاني مـثوكسي-٤،٢-ثاني
هيدرو-اندينو [١، ٢-جـ] بيرازوليل ((٣))-أمين (المركب ١٤). ونقي المركب المسمى
بالعنوان فيما بعد باستشراب عمودي على هلام السليكا (غسل مسبقاً بـ Et_3N تركيزه ١% في
هكسانات) بالتصويل باستخدام مزيج من هكسانات: أسيتات اثيل بنسبة ١:٢ بصفته مزيج
التصويل. ط ك كـ/ش ٤٤٠،١ (ص+) H^+ ؛

^1H ر ن م $((CD_3)_2SO)$: ١،٢٢ (ف، H^9)، ٣،٤٠ (ف، H^2)، ٣،٩٠ (ف، H^3)، ٣،٩٣ (ف،
 H^3)، ٥،٩٤ (ف، H^2)، ٦،٦٢ (ع، H^2)، ٦،٧٢ (ز، H^1)، ٦،٩٧ (ف، H^1)، ٧،٢١ (ع،
 H^1)، ٧،٣٣ (ف، H^1)، ٧،٥٦ (ف عريض، H^1).

المثال ٦٠

٦،٥-ثنائي [٣-(رابع هيدروبييرانيلوكسي (٢)-بروبوكسي]

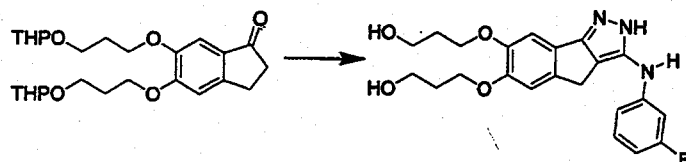
-اندانون (١)، المركب الوسيط ص



قلب مزيج من ٢،٠٠ جم (٠،٠١٢٢ مول) من ٦،٥-ثنائي هيدروكسي-اندانون (١)
 (المركب الوسيط ع)، ٤،٢٢ جم (٠،٠٣٠٥ مول) من كربونات البوتاسيوم، ٤،٣٦ جم
 (٠،٠٢٤٤ مول) من ٢-(٣-كلورو-بروبوكسي)-رابع هيدروبييران (المركب 18a) و ٤،٠٠
 جم (٠،٠٢٤٤ مول) من يوريد البوتاسيوم في ٢٠ مل من DMF عند ٦٠ م لمدة ٣٦ ساعة. ثم
 خفف مزيج التفاعل بأسيئات الاثيل، غسل بالماء وجفف فوق $MgSO_4$. وأزيل المذيب في خواء
 ونقي المركب المسمى بالعنوان باستشراب عمودي على هلام السليكا بالتصويل باستخدام مزيج
 من هكسانات: أسيئات اثيل بنسبة ١:٣ بصفته مزيج التصويل. ط ك ك/ش ٤٤٩ (ص+H)⁺؛
¹H ر ن م ($CDCl_3$): ١،٦٠ (ع، H١٢)، ٢،١٣ (ع، H٤)، ٢،٧٠ (ث، H٢)، ٣،١٢ (ث،
 H٣)، ٣،٥٢ (ع، H٤)، ٣،٩٠ (ع، H٢)، ٤،٢٠ (ع، H٤)، ٤،٦٠ (ف، H٢)، ٦،٩٠
 (ف، H١)، ٧،١٨ (ف، H١).

المثال ٦١

٣-٣-٣-فلورو-فنييل أمينو)-٦-(٣-هيدروكسي-بروبوكسي)-٢،٤-ثاني هيدرو-اندينو
٢،١-ج-[بيرازوليلوكسي (٧)-بروبانول (١)، المركب ٣٩٨ (الطريقة أ)]



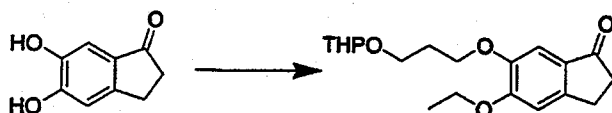
أضيف ٠،٢٦ مل (٠،٠٠٠٢٦ مول) من سادس ميثيل ثاني سيلان الليثيوم إلى مزيج من ٠،١٠٠ جم (٠،٠٠٠٢٢ مول) من ٦،٥-ثنائي [٣-٢-٣-هيدرو-بيرانيلوكسي (٢)]-بروبوكسي-انداون (١) (المركب الوسيط ص)، ٠،٣١ مل (٠،٠٠٠٢٦ مول) من أيزوثيوسيانات ٣-فلورو فنييل (المركب 4a) و ٤ مل من THF نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وقلب مزيج التفاعل لمدة ١٢ ساعة. وأضيف ٠،٠٠٨ مل (٠،٠٠٠٢٦ مول) من الهيدرازين و ٠،١٥ مل (٠،٠٠٠٢٦ مول) من حمض الأسيتيك إلى مزيج التفاعل، الذي سخن بعد ذلك عند درجة حرارة الترجيع لمدة ٢٤ ساعة. ثم خفف محلول التفاعل بأسيتات الاثيل، غسل بالماء وجفف فوق $MgSO_4$. وأزيل المذيب في خواء ونقي المركب المسمى بالعنوان بواسطة HPLC باستخدام عمود من نوع سي-١٨ معكوس الطور و TFA- H_2O - CH_3CN بصفتها مذيبات متدرجة التركيز. ونتج المركب المسمى بالعنوان في صورة ملح TFA. ط ك ك-ش ٤١٤،٣ (ص+)⁺؛

¹H ر ن م (CD_3OD): ٢،٠٥ (ع، ه٤)، ٣،٥٠ (ف، ه٢)، ٣،٨٣ (ع، ه٤)، ٤،٢٠ (ث، ه٤)، ٦،٧٦ (ع، ه١)، ٦،٩٥ (ع، ه٢)، ٧،٢٦ (ف، ه١)، ٧،٢٨ (ف، ه١)، ٧،٣٦ (ع، ه١).

المثال ٦٢

٥-إثوكسي-٦-٣- (رابع هيدرو-بيرانييلوكسي ((٢))

-بروبوكسي-اندانون (١)، المركب الوسيط غ



قلب مزيج من ٢,٠٠ جم (٠,٠١٢٢ مول) من ٦,٥-ثاني-هيدروكسي-اندانون (١) (المركب الوسيط ع)، ٤,٢٢ جم (٠,٠٣٠٥ مول) من كربونات البوتاسيوم و ٠,٩١١ مل (٠,٠١٢٢ مول) من بروميد اثيل في ٢٠ مل من DMF عند درجة حرارة الغرفة لمدة ١٢ ساعة. ثم خفف مزيج التفاعل باستخدام أسيتات الاثيل، غسل بالماء وجفف فوق $MgSO_4$. وأزيل المذيب في خواء. ونقي ٥-إثوكسي-٦-هيدروكسي-اندانون (١) الناتج (المركب 62a) باستشراب عمودي على هلام السليكا بالتصويل باستخدام مزيج من هكسانات: أسيتات اثيل بنسبة ١:٣ بصفته مزيج التصويل.

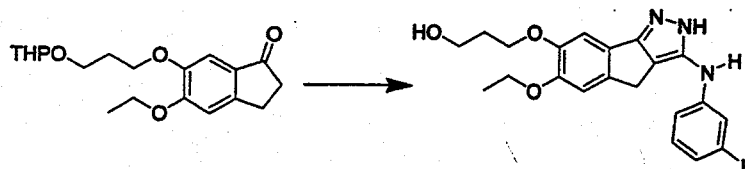
وقلب مزيج من ٠,٥٢ جم (٠,٠٠٢٧١ مول) من ٥-إثوكسي-٦-هيدروكسي-اندانون (١) (المركب 62a) ٠,٩٣٨ جم (٠,٠٠٥٤٢ مول) من ٢-(٣-كلورو-بروبوكسي)-رابع هيدرو-بيران (المركب 18a)، ٠,٩٣٦ جم (٠,٠٠٦٧٨ مول) من كربونات البوتاسيوم و ٠,٩٠٠ جم (٠,٠٠٥٤٢ مول) من يوديد البوتاسيوم في ٥,٥ مل من DMF عند ٦٠°م لمدة ١٢ ساعة. ثم خفف مزيج التفاعل بأسيتات الاثيل، غسل بالماء وجفف فوق $MgSO_4$. وأزيل المذيب في خواء ونقي المركب المسمى بالعنوان باستشراب عمودي على هلام السليكا بالتصويل باستخدام مزيج من هكسانات: أسيتات اثيل بنسبة ١:٣ بصفته مزيج التصويل. ط ك ك/ش ٣٣٤,٢ (ص+H)⁺؛

¹H ر ن م (CDCl₃): ١,٦٠ (ع، H٩)، ٢,١٨ (ع، H٢)، ٢,٦٥ (ث، H٢)، ٣,٠٦ (ث، H٢)، ٣,٤٨ (ع، H٢)، ٣,٨٥ (ع، H٢)، ٤,١٨ (ع، H٤)، ٤,٦٢ (ث، H١)، ٦,٨٤ (ف، H١)، ٧,٢٢ (ف، H١).

المثال ٦٣

٣- [٦-اثوكسي-٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [١، ٢-ج-]

بيرازوليلوكسي (٧)-[بروبانول (١)، المركب ٣٦٥ (الطريقة أ)]



أضيف ٠,٣٦٠ مل (٠,٠٠٠٣٦ مول) من سادس مثيل ثاني سيلان الليثيوم إلى مزيج من ٠,١٠٠ جم (٠,٠٠٠٣ مول) من ٥-اثوكسي-٦- [٣- (رابع هيدرو-بيرانيلوكسي (٢)) - بروبووكسي]-انداون (١) (المركب الوسيط غ)، ٠,٠٤٣ مل (٠,٠٠٠٣٦ مول) من أيزوثيوسيانات ٣-فلورو فنييل (المركب الوسيط 4a) و ٣ مل من THF نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وقلب مزيج التفاعل لمدة ٥ ساعات. وأضيف ٠,٠١١ مل (٠,٠٠٠٣٦ مول) من الهيدرازين و ٠,٠٢١ مل (٠,٠٠٠٣٦ مول) من حمض الأسيتيك إلى مزيج التفاعل، الذي سخن بعد ذلك عند درجة حرارة الترجيع لمدة ١٢ ساعة. ثم خفف محلول التفاعل باستخدام أسيتات الاثيل، غسل بالماء وجفف فوق $MgSO_4$. وأزيل المذيب في خواء ونقيت المادة الخام بواسطة HPLC معكوس الطور وحولت إلى المنتج المرغوب عندما تركت تستقر في محلول TFA تركيزه ٠,١%. ونتج عن التجفيد المركب المسمى بالعنوان في صورة مسحوق لونه أبيض. ط ك كـ/ش ٣٨٤,٤ (ص+H)؛

^1H ر ن م ($CDCl_3$): ١,٤٧ (ث، H^3)، ٢,١٢ (عـ، H^2)، ٣,٤٣ (ف، H^2)، ٣,٩٠ (ث، H^2)، ٤,٠٨ (ر، H^2)، ٤,٢٢ (ث، H^2)، ٤,٨٥ (ف عريض، H^1) ٦,٨٩ (عـ، H^2)، ٦,٩٧ (ف، H^1)، ٧,١٨ (ف، H^1)، ٧,٣٢ (عـ، H^2)، ٩,٤٢ (ف عريض، H^1).

المثال ٦٤

٦-اوكسي-٥-[-٣-(رابع هيدرو-بيرانييلوكسي (٢))-بروبوكسي]-اندانون

(١)، المركب الوسيط أ

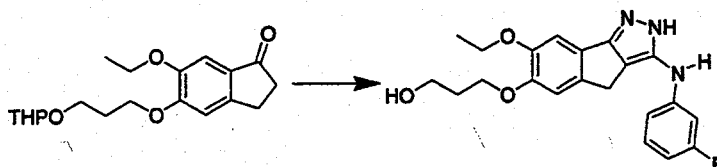


قلب مزيج من ١,٨٠ جم (٠,٠١٠٩٨ مول) من ٦,٥-ثاني هيدروكسي-اندانون (١)
(المركب الوسيط ع)، ٣,٨٠ جم (٠,٠٢٧٤٤ مول) من كربونات البوتاسيوم، ١,٣٧ جم
(٠,٠٠٧٦٩ مول) من ٢-[-٣-(كلورو-بروبوكسي)-رابع هيدرو-بيران (المركب 18a)] و ١,٢٨
جم (٠,٠٠٧٦٩ مول) من يوديد البوتاسيوم في ٢٠ مل من DMF عند ٦٠°م لمدة ٤ ساعات.
ثم أضيف إلى هذا المزيج ١,٦٤ مل (٠,٠٢١٩٦ مول) من بروميد الاثيل واستمر التسخين
لمدة ٤ ساعات إضافية. ثم خفف مزيج التفاعل بأستيات الاثيل، غسل بالماء وجفف فوق
MgSO₄. وأزيل المذيب في خواء ونقي المركب المسمى بالعنوان باستشراب عمودي على
هلام السليكا بالتصويل باستخدام مزيج من هكسانات: أستيات اثيل بنسبة ١:٣ بصفته مزيج
التصويل. ط ك-ش ٣٣٤,٢ (ص+H)⁺؛

¹H ر ن م (CDCl₃): ١,٦٥ (ع، H٩)، ٢,٢٠ (ع، H٢)، ٢,٦٨ (ث، H٢)، ٣,١٥ (ث،
H٢)، ٢,٥٥ (ع، H٢)، ٤,١٠ (ع، H٦)، ٤,٦٠ (ع، H١)، ٦,٩٢ (ف، H١)، ٧,١٦
(ف، H١).

المثال ٦٥

٣- [٧-اوكسي-٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو
[٢،١-ج-] بيرازوليلوكسي (٦)]-بروبانول (١)، المركب ٣٨٢ (الطريقة أ)

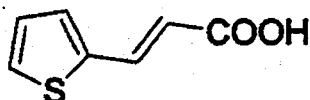


أضيف ٠,٣٦٠ مل (٠,٠٠٠٣٦ مول) من سداس مثيل ثاني سيلان الليثيوم إلى مزيج من ٠,١٠٠ جم (٠,٠٠٠٣ مول) من ٦-اوكسي-٥-[٣-(رابع هيدرو-بيرانييلوكسي (٢))-بروبوكسي]-انديان (١) (المركب الوسيط أ)، ٠,٠٤٣ مل (٠,٠٠٠٣٦ مول) من أيزوثيوسيانات ٣-فلورو فنييل (المركب الوسيط 4a) و ٣ مل من THF نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وقلب مزيج التفاعل لمدة ٤٨ ساعة. وأضيف ٠,٠١١ مل (٠,٠٠٠٣٦ مول) من الهيدرازين و ٠,٠٢١ مل (٠,٠٠٠٣٦ مول) من حمض الأسيتيك إلى مزيج التفاعل، الذي سخن بعد ذلك عند درجة حرارة الترجيع لمدة ١٢ ساعة. ثم خفف محلول التفاعل باستخدام أسيتات الاثيل، غسل بالماء وجفف فوق $MgSO_4$. وأزيل المذيب في خواء ونقيت المادة الخام بواسطة HPLC معكوس الطور وحولت إلى المنتج المرغوب عندما تركت تستقر في محلول TFA تركيزه ٠,١%. ونجح عن التجفيد المركب المسمى بالعنوان في صورة مسحوق لونه أبيض. ط ك ك-ش ٣٨٤,٢ (ص+H)⁺؛

¹H ر ن م ((CD₃)₂SO): ١,٢٨ (ث، H³)، ٢,٩٠ (ع، H²)، ٣,٤٢ (ف، H²)، ٣,٦٠ (ث، H²)، ٤,١٢ (ع، H⁴)، ٦,٥٤ (ع، H¹)، ٦,٨٨ (ز، H¹)، ٧,٢٠ (ع، H⁴)، ٨,٨٠ (ف عريض، H¹).

المثال ٦٦

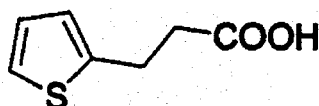
حمض ٣-ثيوفينيل (٢)-أكريليك، المركب الوسيط أب



- سخن مزيج من ١,٢٠ جم (٠,٠١٠٧ مول) من ثيوفين-٢-كربالدهيد (المركب 66a)،
 ١,١١ جم (٠,٠١٠٧ مول) من حمض المالونيك و ٠,٨٢٥ جم (٠,٠١٠٧ مول) من أسيتات
 الأمونيوم في ٨,٥ مل من DMF إلى ١٠٠ م لمدة ٣ ساعات. وخفف النظام باستخدام أسيتات
 الاثيل وغسل بالماء وجفف فوق $MgSO_4$. وأزيل المذيب في خواء ونقي المركب المسمى
 بالعنوان باستشراب عمودي على هلام السليكا بالتصويل باستخدام مزيج من هكسانات: أسيتات
 اثيل بنسبة ١:٣ بصفته مزيج التصويل.
 ١. ^1H ر ن م $(CDCl_3)$: ٦,٢٥ (ز، H_1)، ٧,٠٨ (ع، H_1)، ٧,٣٠ (ز، H_1)، ٧,٤٢ (ز، H_1)،
 ٧,٨٨ (ز، H_1).

المثال ٦٧

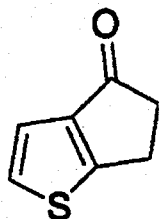
حمض ٣-ثيوفينيل (٢)-بروبيونيك، المركب الوسيط أج



- قلب مزيج من ٢,٠٠ جم (٠,٠١٢٩٩ مول) من حمض ٣-ثيوفينيل (٢)-أكريليك
 (المركب الوسيط أب)، ٢,٠٠ جم من Pd محلول على كربون بنسبة ١٠% في ٢٠٠ مل من
 الميثانول في جو من H_2 (ضغطه ٥٠ رطل/بوصة^٢ (٣٤٤,٧ كيلوباسكال)) لمدة ١٨ ساعة.
 ونظف النظام الناتج بالنتروجين ثم رشح من خلال حشوة سيليت. وجففت المركبات العضوية
 فوق $MgSO_4$ وأزيل المذيب في خواء فنتج حمض ٣-ثيوفينيل (٢)-بروبيونيك.
 ٢. ^1H ر ن م $(CDCl_3)$: ٢,٧٦ (ث، H_2)، ٣,٢٠ (ث، H_2)، ٦,٨٢ (ز، H_1)، ٦,٩٥ (ع،
 H_1)، ٧,١٥ (ز، H_1).

المثال ٦٨

٦،٥-ثاني هيدرو-حلقي بنتا [ب] ثيوفينون (٤)، المركب الوسيط أد

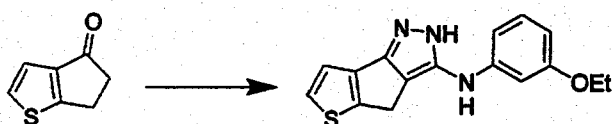


أضيف ١,٦٧ مل (٠,٠٢٢٤٤ مول) من SOCl_2 إلى محلول من ١,٧٥ جم (٠,٠١١٢٢ مول) من حمض ٣-ثيوفينيل (٢)-بروبيونيك (المركب الوسيط أ-ج) في ٥٠ مل من ثاني كلوروميثان وقلب المزيج عند درجة حرارة الغرفة لمدة ٦ ساعات. وأضيف هذا المحلول نقطة نقطة إلى معلق من ٢,٩٨ جم (٠,٠٢٢٤٤ مول) من AlCl_3 في ٥٠ مل من ثاني كلوروميثان خلال ٤٥ دقيقة. وقلب المزيج الناتج عند درجة حرارة الغرفة لمدة ١٢ ساعة. وسقي النظام بإضافة ١٠ مل من الماء نقطة نقطة واستخلص بثاني كلوروميثان. وجففت المركبات العضوية فوق MgSO_4 وأزيل المذيب في خواء. ونقي المركب المسمى بالعنوان باستشراب عمودي على هلام السليكا بالتصويل باستخدام مزيج من هكسانات: أسيتات اثيل بنسبة ١:٤ بصفته مزيج التصويل. ط ك كـ/ش ١٣٩,١ (ص+H)⁺؛
 ^1H ر ن م (CDCl_3): ٣,٠١ (ث، H_2)، ٣,١٨ (ث، H_2)، ٧,١٥ (ز، H_1)، ٧,٣٢ (ز، H_1).

المثال ٦٩

٧,٥-ثاني هيدرو-١-ثيا-٥,٤-ديازا-حلقي بنتا [أ] بنتالينيل ((٦))-

(٣-اثوكسي-فنييل)-أمين، المركب ٤٠٥ (الطريقة أ)



أضيف ٠,٥٦٠ مل (٠,٠٠٠٥٦ مول) من سداس مثيل ثاني سيلان الليثيوم إلى مزيج من ٠,٠٦٥ جم (٠,٠٠٠٤٧ مول) من ٦,٥-ثاني هيدرو-حلقي بنتا [ب] ثيوفينون (٤)

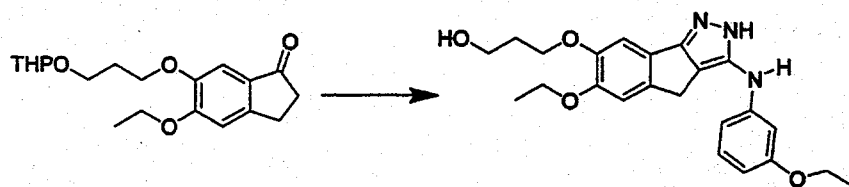
(المركب الوسيط أد)، ٠,١٠٨ جم (٠,٠٠٠٥٦ مول) من أيزوثيوسيانات ٣-اثوكسي-فنييل (المركب 69a) ٢,٥ مل من THF نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وقلب مزيج التفاعل لمدة ٣ ساعات. وأضيف ٠,٠٣٦ مل (٠,٠٠١١٢ مول) من الهيدرازين و ٠,٠٠٣٢ مل (٠,٠٠٠٥٦ مول) من حمض الأسيتيك إلى مزيج التفاعل، الذي سخن بعد ذلك إلى ٥٠ °م لمدة ٨ ساعات. ثم خفف محلول التفاعل بأسيتات الاثيل، غسل بالماء وجفف فوق $MgSO_4$. وأزيل المذيب في خواء ونقي المركب المسمى بالعنوان بواسطة HPLC على عمود من نوع سي-١٨ معكوس الطور و $TFA-H_2O-CH_3CN$ بصفتها مذيبات متدرجة التركيز. ونتج المركب المسمى بالعنوان في صورة ملح TFA. ط ك ك/ش ٢٩٨,٢ (ص+H)⁺؛

^1H ر ن م $((\text{CD}_3)_2\text{SO})$: ١,٢٥ (ث, ه١), ٣,٥٢ (ف, ه٢), ٣,٨٨ (ز, ه٢), ٥,٨٠ (ف, عريض, ه١), ٦,٢٨ (ع, ه١), ٦,٦٥ (ع, ه٢), ٧,٠٥ (ث, ه١), ٧,١٨ (ز, ه١), ٧,٥٨ (ز, ه١), ٨,٦٠ (ف عريض, ه١).

٧٠. المثال

۳- {۶- اٹوکسی-۳- (۳- اٹوکسی-فنیل آمینو)-۲،۴- ثانی ہیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]}

بیرازولیلوکسی (۷) - بروبانول (۱)، المركب ۳۸۸ (الطريقة أ)



أضيف ٠,٣٦٠ مل (٠,٠٠٠٣٦ مول) من سداس مثيل ثاني سيلان الليثيوم إلى مزيج من ٠,١٠٠ جم (٠,٠٠٠٣ مول) من ٥-اثوكسي-٦-[-٣- (رابع هيدرو-بيرانيلوكسي (٢))-بروبوكسي]-اندانون (١) (المركب الوسيط غ)، ٠,٠٤٣ مل (٠,٠٠٠٣٦ مول) من أيزوثيوسيانات ٣-اثوكسي فني (المركب 69a) و ٣ مل من THF نقطة نقطة عند درجة حرارة الغرفة مع التقليب. وقلب مزيج التفاعل لمدة ٥ ساعات. وأضيف ٠,٠١١ مل (٠,٠٠٠٣٦ مول) من الهيدرازين و ٠,٠٢١ مل (٠,٠٠٠٣٦ مول) من حمض الأسيتيك إلى مزيج التفاعل،

الذي سخن بعد ذلك عند درجة حرارة الترجيع لمدة ١٢ ساعة. ثم خفف محلول التفاعل باستخدام أسيتات الاثيل، غسل بالماء وجفف فوق $MgSO_4$. وأزيل المذيب في خواء ونقيت المادة الخام بواسطة HPLC معكوس الطور وحولت إلى المنتج المرغوب عندما تركت تستقر في محلول TFA تركيزه ١,٠%. ونتج عن التجفيد المركب المسمى بالعنوان في صورة مسحوق لونه أبيض. ط ك كـ/ش ١٠,٢ (ص+H)⁺؛

¹H ر ن م $((CD_3)_2SO)$: ٨,٦٥ (ف عريض، H١)، ٧,١٤ (عـ، H٣)، ٦,٧٩ (ف، H١)، ٦,٧١ (ز، H١)، ٦,٣٧ (ز، H١)، ٤,٠٣ (عـ، H٦)، ٣,٦٠ (ث، H٢)، ٣,٤٠ (ف، H١)، ١,٨٨ (عـ، H٢)، ١,٣٠ (عـ، H٦).

الفعالية الحيوية

١٠. فعاليات حيوية للمركبات وفقاً للاختراع

خضعت المركبات التي تقع ضمن نطاق هذا الاختراع لاختبارات حيوية مختلفة. وأظهرت نتائج هذه الاختبارات أن المركبات التي تقع ضمن نطاق هذا الاختراع عملت على تثبيط فعالية كيناز PDGF-R. وأظهرت المركبات التي تقع ضمن نطاق هذا الاختراع أيضاً فعالية مثبّطة ضد كيناز c-Abl. وبالإضافة إلى ذلك، عملت المركبات التي تقع ضمن نطاق هذا الاختراع على تثبيط تكاثر الخلايا (بما في ذلك خلايا الأنسجة السوية، الخلايا الورمية وخلايا اللوكيميا) في وجود تنبيه لـ PDGF أو عدم وجوده. وأظهرت دراسات أخرى أن المركبات التي تقع ضمن نطاق هذا الاختراع عملت على تثبيط تولد الأوعية وأظهرت المركبات امتلاكها فعالية مضادة للورم. وعلاوة على ذلك، تسببت المركبات التي تقع ضمن نطاق هذا الاختراع في جعل الخلايا الورمية تتأثر بالمعالجة بالأشعة. وتبين أن العقاقير الأولية للمركبات التي تقع ضمن نطاق هذا الاختراع تتحول مرة أخرى إلى المركبات الأصلية في الجسم الحي.

وأجريت المعايير النمذجية التالية لتحديد الفعاليات الحيوية للمركبات التي تقع ضمن نطاق الاختراع. ولقد زودت لتوضيح الاختراع بكيفية غير محدّدة.

١. تثبيط فعالية كيناز مستقبلية-PDGF

تمت معايرة فعالية كيناز PDGF-R بتحديد قدرته على إجراء أسترة فسفورية لأحد بروتيناته المستهدفة، PLC γ ، في نظام يخلو من الخلايا، وبصفة خاصة، استخدام ببتييد PLC1 يشتمل على شق التيروسين حيث تحدث الأسترة الفسفورية للمعايرة.

المواد

حضرت المواد المفاعلة التالية للمعايرة:

- ١٠ محلول منظم للكيناز تركيزه ١٠ أضعاف (احتوى على تريس-HCl تركيزه ٥٠٠ ملي جزيئي ودرجة حموضته ٨، MgCl₂ تركيزه ١٠٠ ملي جزيئي، Na₃VO₄ تركيزه ١ ملي جزيئي)؛
- ١٠ DTT تركيزه ١٠ ملي جزيئي (التركيز النهائي بلغ ١ ملي جزيئي في المعايرة)؛ ATP تركيزه ١٠ ملي جزيئي (التركيز النهائي بلغ ٥ ميكرو جزيئي في المعايرة)؛ ³³P- γ -ATP (كتالوج رقم: NEG/602H بـ ٢٠٠٠-٣٠٠٠ كوري/ملي مول) اشترى من شركة نيوانجلاند نيوكليار (NEN)؛ انزيم بيتا لمستقبلية-PDGF مأشوب، قابل للذوبان، منقى يشتمل على حقل كيناز التيروسين (من الحمض الأميني ٥٤٥ إلى ١١٠٦ من بنك الجينات برقم حيازة: AAA36427) بتركيز ٠,٤ مجم/مل؛ محلول منظم لتخفيف الأنزيم (احتوى على تريس-HCl تركيزه ٥٠ ملي جزيئي ودرجة حموضته ٨,٠، زلال مصل بقرى (BSA) تركيزه ٠,١%)؛
- ١٥ محلول الغسل/الايقاف المنظم (احتوى على EDTA+PBS تركيزه ١٠٠ ملي جزيئي)؛ ألواح ومضية من ستربتايفدين من شركة NEN (كتالوج رقم: SMP-103) ترتبط مع ببتييد PLC1 البيوتينيلي ولكن ليس بأنزيم PDGF-R؛ ببتييد PLC1 (أميد-KHKLAEGSAYEEV-بيوتين) بتركيز بلغ ١ ملي جزيئي في تريس-HCl تركيزه ٥٠ ملي جزيئي ودرجة حموضته ٨.

الطريقة

مزجت المواد المفاعلة أولاً وفقاً للنظام التالي:

لوح واحد (ميكرو لتر)	لكل عين (ميكرو لتر)	
١١٠٠	١٠	محلول منظم للكيناز تركيزه ١٠ أضعاف
١١٠٠	١٠	DTT تركيزه ١٠ ملي جزيئي

٠,٠٥	٥,٥	ATP بارد تركيزه ١٠ ملي جزيئي
٠,٠٢٥	٢,٧٥	ببتيد PLC1 تركيزه ١ ملي جزيئي
٠,٠٨	٨,٨	$^{33}\text{P}-\gamma\text{-ATP}$ (بمقدار ١٠ ميكروكوري/ميكرولتري)
٤٩,٧٧	٥٤٧٥	H_2O

ووزع مزيج التفاعل الموصوف أعلاه في كل عين من عيون لوح ومضي بمقدار ٧٠ ميكرولتري/عين. ولاختبار تأثير مركب على فعالية كيناز PDGF-R، أضيف مركب الاختبار بتركيز ثابت أو بتركيز مخففة بشكل متسلسل في DMSO تركيزه ١٠٠% إلى عيون مناسبة بمقدار ١ ميكرولتري/عين.

وخفف أنزيم PDGF-R في محلول منظم لتخفيف الأنزيم كما يلي:

محلول منظم لتخفيف الأنزيم ٣٢٨٩ ميكرولتري
 أنزيم PDGF-R ١٠٠ ميكرولتري

وبدأ تفاعل الكيناز بإضافة ٣٠ ميكرولتري من محلول أنزيم PDGF-R مخفف إلى كل عين من عيون اللوح الومضي الذي يحتوي على ATP ساخن و PLC1، باستثناء عيون العمود ١٢، الصفوف (هـ) إلى (ح)، حيث استخدمت لحساب خلفية اللوح. ودُوم اللوح الومضي للمزج وحضن عند ٣٠°م لمدة ٦٠ دقيقة. ثم، طرح مزيج التفاعل وغسل اللوح الومضي ثلاث مرات باستخدام ٢٠٠ ميكرولتري من محلول الغسل/الإيقاف المنظم. وبالتالي، ملئت كل عين من عيون اللوح الومضي بـ ٢٠٠ ميكرولتري من محلول الغسل/الإيقاف المنظم وقيس مقدار ^{33}P المحتجز في كل عين باستخدام باكارد توب كاونت (Packard TopCount) بعد إحكام سد اللوح بمادة إحكام سد شفاقة للوح.

وعندما عمل مركب اختبار على تثبيط فعالية كيناز PDGF-R، احتوت العين التي تحتوي على مركب من هذا القبيل على ^{33}P بنسبة أقل بالمقارنة مع العين التي تخلو من المركب. وتعرف النسبة المئوية لتثبيط مركب الاختبار لفعالية كيناز PDGF-R بمقدار ^{33}P المحتجز في العين التي تحتوي على المركب مقسوماً على مقدار ^{33}P في العين التي تخلو من المركب. وبإجراء اختبارات في ظروف المعايرة الموصوفة، أظهر أكثر من ٦٠٠ مركب من

المركبات التي تقع ضمن نطاق الاختراع عند تركيز نهائي بلغ ١٠ ميكروجزيئي تأثير مثبّط لفعالية كيناز PDGF-R.

ولاختبار فعالية تثبيط مركبات الاختراع الراهن، قيس IC_{50} (التركيز المثبط للنصف) لمركب منفرد باستخدام الطريقة الموصوفة أعلاه. وكما استخدم في هذا البيان، يشير IC_{50} لفعالية كيناز PDGF-R إلى تركيز مثبّط تقل عنده فعالية كيناز PDGF-R إلى النصف بالمقارنة مع تفاعلات لا تحتوي على مثبّط.

ويشير تثبيط فعالية كيناز PDGF-R بشكل مفضل إلى IC_{50} يقل عن أو يساوي حوالي ٧٥ ميكروجزيئي باستخدام المعايير الموصوفة أعلاه. وبشكل مفضل، يمكن أن يثبط المركب فعالية كيناز PDGF-R بـ IC_{50} يقل عن أو يساوي حوالي ١٠ ميكروجزيئي، والأفضل يقل عن أو يساوي حوالي ١ ميكروجزيئي، والأكثر تفضيلاً يقل عن أو يساوي حوالي ٠,١ ميكروجزيئي. وتفضل قيم IC_{50} منخفضة لأن قيم IC_{50} تدل على فعالية المركب. وينبغي أيضاً أخذ عوامل أخرى معروفة في التقنية بعين الاعتبار، مثل العمر النصفى للمركب، التوزيع الحيوي، والسمية للاستخدامات العلاجية. وقد تمكّن عوامل من هذا القبيل مركب له IC_{50} أعلى من أن يكون له فعالية أكبر داخل الجسم الحي من مركب له IC_{50} أقل.

وتم اختبار مركبات نموذجية وفقاً للاختراع الراهن بالنسبة لفعالية كيناز PDGF-R فحصل على النتائج المتمثلة في النسب المئوية للتثبيط و/أو قيم IC_{50} ، كما أدرجت في الجدول أ.

الجدول أ. قيم IC_{50} والنسب المئوية لتثبيط المركبات لفعالية كيناز PDGF-R

المركب	اسم المركب	النسبة المئوية للتثبيط عند ١٠ ميكروجزيئي	قيم IC_{50} (ميكروجزيئي)
١	(٤،٢)-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل (٣)-فنيل-أمين	٩١	٠,٣١٧
٢	(٧،٦)-ثاني ميثوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل (٣)-فنيل-أمين	٩١	٠,٠٠٦

٠,١٥٧	٩٠	٣ (٤-كلورو-فنييل)-(٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل ((٣)-امين
٠,٠٠٣	٩٠	٤ (٣-كلورو-فنييل)-(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل ((٣)-امين
٠,٦٥٩	٩١	٥ (٤-كلورو-فنييل)-(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل ((٣)-امين
٠,١٣١	٧٥	٦ (٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل ((٣)-امين
٠,٢١٧	٩٢	٧ (٦-مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل ((٣)-فنييل-امين
٠,٠٥٤	٩٨	٨ (٥-مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل ((٣)-فنييل-امين
٠,١١	٨٩	٩ (٢-كلورو-فنييل)-(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل ((٣)-امين
٢,٠٧	٦٨	١٠ استر اٲيل لحمض ٤-(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل (٣) امينو بنزويك
٠,٠١٥٧	٩٧	١١ استر مٲيل لحمض ٣-(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل (٣) امينو بنزويك
٠,٠٥٦	٧٦	١٢ (٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل ((٣)-امين
٠,٠٠٦٥	٩١	١٣ (٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل ((٣)-امين

۰,۰۰۱۷	۱۰۸	۱۴ (۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۱], ۲-جـ] بيرازوليل ((۳))-(۳-فلورو-فنيل)-امين
۱,۹۲	۷۹	۱۵ (۶,۷-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱]- جـ] بيرازوليل ((۳))-(۲-ثالث فلورو مٹوكسي- فنيل)-امين
۴	۷۹	۱۶ (۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱]- جـ] بيرازوليل ((۳))-(۴-ثالث فلورو مٹوكسي- فنيل)-امين
۳,۵۴	۷۹	۱۷ (۴,۲-ثاني كلورو-فنيل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲- ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱]-جـ] بيرازوليل ((۳))-امين
۰,۲۳	۶۵	۱۸ (۴,۳-ثاني كلورو-فنيل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲- ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱]-جـ] بيرازوليل ((۳))-امين
۰,۱۷۴	۹۱	۱۹ (۵,۳-ثاني كلورو-فنيل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲- ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱]-جـ] بيرازوليل ((۳))-امين
۱,۰۹۵	۷۷	۲۰ (۳,۲-ثاني كلورو-فنيل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲- ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱]-جـ] بيرازوليل ((۳))-امين
۰,۱۲۱	۱۰۳	۲۱ (۶-كلورو-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱]-جـ] بيرازوليل ((۳))-فنيل-امين
۰,۰۴۵	۹۶	۲۲ (۷-مٹيل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱]-جـ] بيرازوليل ((۳))-فنيل-امين
۱,۹۴	۸۷	۲۳ (۵-مٹيل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱]-جـ] بيرازوليل ((۳))-فنيل-امين
۰,۰۸۴	۷۱	۲۴ (۶-فلورو-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱]-جـ] بيرازوليل ((۳))-فنيل-امين

۴,۷۶۶	۶۲	۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- جـ] بيرازوليل ((۳))-(۴-ثالث فلورو مٹوكسي- فنيل)-امين	۲۵
۰,۰۳۷	۹۲	۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- جـ] بيرازوليل ((۳))-(۳-ثالث فلورو مٹوكسي- فنيل)-امين	۲۶
۰,۶۵۵	۷۱	۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- جـ] بيرازوليل ((۳))-(۲-مٹوكسي-فنيل)-امين	۲۷
۱۹,۱۴	۹۶	۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- جـ] بيرازوليل ((۳))-(۲-ثالث فلورو مٹيل-فنيل)- امين	۲۸
۰,۰۱	۹۹	۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- جـ] بيرازوليل ((۳))-(۳-مٹوكسي-فنيل)-امين	۲۹
۰,۰۱۶	۱۰۷	۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- جـ] بيرازوليل ((۳))-بيريدينيل (۳)-امين	۳۰
۰,۱۱۵	۵۹	۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- جـ] بيرازوليل ((۳))-اورثو-توليل-امين	۳۱
۰,۰۱۲	۷۹	۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- جـ] بيرازوليل ((۳))-ميتا-توليل-امين	۳۲
۱,۴۱۵	۵۹	۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- جـ] بيرازوليل ((۳))-بارا-توليل-امين	۳۳
۶,۹۸۷	۵۷	۵,۲-ثاني كلورو-فنيل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲- ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-جـ] بيرازوليل ((۳))-امين	۳۴
۲,۰۶۳	۸۸	۳-فنيل امينو-H۲-اندينو [۲,۱-جـ] بيرازولون (۴)	۳۵

۰,۰۳۳	۸۵	۳۶] ۳-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج- بيرازوليل (۳) آمينو)-فنيل]-ميٿانول	۳۶
۱,۹۷۸	۸۰	۳۷] ۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- ج- بيرازوليل (۳)-H۱-اندازوليل (۶))-آمين	۳۷
۰,۰۳۱	۷۴	۳۸] ۳-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج- بيرازوليل (۳) آمينو)-فنول	۳۸
۰,۰۱۸	۹۲	۳۹] ۷-مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج- بيرازوليل (۳)-فنيل-آمين	۳۹
۵,۹۵	۶۳	۴۰] N-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج- بيرازوليل (۳)-N'',N'-ثاني مٿيل- بنزين-۲,۱-ثاني آمين	۴۰
۰,۰۳۳۶	۸۳	۴۱] ۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- ج- بيرازوليل (۳)-۵,۳-ثاني مٹوكسي-فنيل)- آمين	۴۱
۰,۶۹۲	۸۵	۴۲] ۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- ج- بيرازوليل (۳)-۵,۴,۳-ثالث مٹوكسي-فنيل)- آمين	۴۲
۰,۱۹۵	۶۰	۴۳] ۲-برومو-فنيل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج- بيرازوليل (۳)-آمين	۴۳
۰,۰۰۰۵۴	۹۴	۴۴] ۳-برومو-فنيل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج- بيرازوليل (۳)-آمين	۴۴
۲,۱۶۴	۸۶	۴۵] ۴-برومو-فنيل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج- بيرازوليل (۳)-آمين	۴۵

١٤,١٥	٥١	(٥-كلورو-٢-مئيل-فئيل)-(٧,٦-ثاني مئوكسي- ٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)- أمين	٤٦
لم يحدد	٤٧	(٧,٦-ثاني مئوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- ج-] بيرازوليل ((٣)- (٤,٢-ثاني مئوكسي-فئيل)- أمين	٤٧
لم يحدد	٣٩	(٧,٦-ثاني مئوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- ج-] بيرازوليل ((٣)- (٥,٢-ثاني مئوكسي-فئيل)- أمين	٤٨
٣,٠٦٦	٧٢	(٧,٦-ثاني مئوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- ج-] بيرازوليل ((٣)- (٤,٣-ثاني مئوكسي-فئيل)- أمين	٤٩
١١,٣٧	٣٨	٣-فئيل أمينو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازولول (٤)	٥٠
٢٦,٧٥	٣٠	(٧,٦-ثاني مئوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- ج-] بيرازوليل ((٣)- (٤-٤-مئيل-بيرازينيل ((١)-فئيل]-أمين	٥١
٢,٤	٧١	(٥,٤-ثاني هيدرو-H٢-٦-ثيا-٢,١-ديازا-as- انداسينيل ((٣)-فئيل-أمين	٥٢
٠,٠٥٨٥٩	٩٤	(٣-كلورو-٤-فلورو-فئيل)-(٧,٦-ثاني مئوكسي- ٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)- أمين	٥٣
٠,٠٣٤٨	٧٦	(٣-بنزيلوكسي-فئيل)-(٧,٦-ثاني مئوكسي-٤,٢- ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-أمين	٥٤

۰,۶۳۶	۷۶	۵۵ (۵,۲-ثاني فلورو-فنیل)-(۷,۶-ثاني مٹوکسي-۴,۲- ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل ((۳)-امين
۸,۴۰۲	۳۶	۵۶ (۵-کلورو-۲-مٹوکسي-فنیل)-(۷,۶-ثاني مٹوکسي- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل ((۳)- امين
۲,۱۵۱	۷۱	۵۷ (۷,۶-ثاني مٹوکسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- ج-] بيرازولیل ((۳)-((۲-ايروبرويل-فنیل)-امين
۸,۵۲۴	۴۰	۵۸ (۷,۶-ثاني مٹوکسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- ج-] بيرازولیل ((۳)-((۲-ايل-فنیل)-امين
۱,۸۱۸	۷۱	۵۹ ۴-(۷,۶-ثاني مٹوکسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل (۳) امينو)-بنزونتریل
۰,۱۳۷	۷۱	۶۱ ۳-(۷,۶-ثاني مٹوکسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل (۳) امينو)-بنزونتریل
۰,۳۱۳	۸۵	۶۲ بنزو [۳,۱] ديوكسولیل (۵)-(۷,۶-ثاني مٹوکسي- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل ((۳)- امين
۰,۱۹۰۹	۹۴	۶۳ بنزيل-(۷,۶-ثاني مٹوکسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل ((۳)-امين
۰,۴۴۹	۱۱۸	۶۴ [۶-(۴-مٹیل-بييرازينيل (۱))-۴,۲-ثاني هيدرو- اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل ((۳)-فنیل-امين
۱,۵۳۵	۷۶	۶۵ فنیل-(۶-بييريدينيل (۱))-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل ((۳)-امين
۰,۰۹۲	۱۰۸	۶۶ N3-فنیل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازول-۶,۳-ثاني امينو

۰,۶۱۷	۷۷	هكسيل حلقى-(۷,۶-ثانى مٲوكسى-۴,۲-ثانى هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازوليل (۳))-امين	۶۷
	۱۸	(۷,۶-ثانى مٲوكسى-۴,۲-ثانى هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازوليل (۳))-((۲-مورفولينيل (۴)-اٲيل)-امين	۶۹
۱۶,۸۵	۴۱,۵	(۵,۳-ثنائى-ثالث فلورو مٲيل-فنيل)-(۷,۶-ثانى مٲوكسى-۴,۲-ثانى هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازوليل (۳))-امين	۷۰
۰,۱۸۵	۱۱۰	[۵-(۳-ثانى مٲيل امينو-بروبوكسى)-(۴,۲-ثانى هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازوليل (۳))-فنيل-امين	۷۱
۰,۲۸۳	۹۶	(۳-كلورو-فنيل)-[۵-(۳-ثانى مٲيل امينو-بروبوكسى)-(۴,۲-ثانى هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازوليل (۳))-امين	۷۲
۵۰<<	۳۰~	[۵-(۳-ثانى مٲيل امينو-بروبوكسى)-(۴,۲-ثانى هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازوليل (۳))-فنيل-امين	۷۳
۰,۴۲۴	۱۰۲	[۵-(۳-ثانى مٲيل امينو-بروبوكسى)-(۴,۲-ثانى هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازوليل (۳))-فنيل-امين	۷۴
۰,۵۷۵	۱۱۵	[۵-(۳-ثانى مٲيل امينو-بروبوكسى)-(۴,۲-ثانى هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازوليل (۳))-بيريدينيل (۳))-امين	۷۵

۵۰ <<	۱۶	(۴-برومو-۲-ثالث فلورو مئیل-فنیل)-(۷،۶-ثانی مئوکسی-۴،۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲،۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-امین	۷۶
۰،۲۱۷	۱۰۸	استر مئیل لحمض ۳-[۵-(۳-ثانی مئیل أمینو- بروبوکسی)-(۴،۲-ثانی هیدرو اندينو [۲،۱-ج-] بیرازولیل (۳) أمینو]-بنزويك	۷۷
۱،۲۹۱	۸۵	(۷،۶-ثانی مئوکسی-۴،۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲،۱- ج-] بیرازولیل ((۳)-فورانیل (۲)-امین	۷۸
۳،۷۰۵	۵۶	(۷،۶-ثانی مئوکسی-۴،۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲،۱- ج-] بیرازولیل ((۳)-اندانیل (۵)-امین	۷۹
۸۵،۹۵	۲۹	(۷،۶-ثانی مئوکسی-۴،۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲،۱- ج-] بیرازولیل ((۳)-(۲-بیریدینیل (۱)-اثیل)-امین	۸۱
۰،۲۷۳	۷۹	(۴-فلورو-فنیل)-(۶-مئوکسی-۴،۲-ثانی هیدرو- اندينو [۲،۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-امین	۸۲
۰،۰۷۱۹	۹۳	(۳-برومو-فنیل)-(۶-مئوکسی-۴،۲-ثانی هیدرو- اندينو [۲،۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-امین	۸۳
۰،۷۱	۸۶	(۶-مئوکسی-۴،۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲،۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-بیریدینیل (۳)-امین	۸۴
۵،۸۲۳	۶۱	(۵،۲-ثانی مئوکسی-فنیل)-(۶-مئوکسی-۴،۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲،۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-امین	۸۵
۲،۵۳۲	۵۷	(۴،۳-ثانی مئوکسی-فنیل)-(۶-مئوکسی-۴،۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲،۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-امین	۸۶
۰،۰۶۹	۹۱	(۵،۲-ثانی فلورو-فنیل)-(۶-مئوکسی-۴،۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲،۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-امین	۸۷

۲۰,۸	۴۲	۶-مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳))- (۴-ثالث فلورو مٹوکسی-فنیل)-آمین	۸۸
۰,۸۸۶	۸۸	۶-مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳))- (۴-ثالث فلورو مٹیل-فنیل)-آمین	۸۹
۰,۰۰۸۷	۹۷	۵- (۳-ثانی مٹیل آمینو-بروبوکسی)-۴,۲-ثانی هیدرو-انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳))- (۳)- فلورو-فنیل)-آمین	۹۰
۲,۹۶۹	۷۶	۳-برومو-فنیل)- (۷,۶-ثانی مٹوکسی-۱-مٹیل- ۴,۱-ثانی هیدرو-انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳))- آمین	۹۱
۰,۳۸۳	۷۵	N6,N6-ثانی مٹیل-N3-فنیل-۴,۲-ثانی هیدرو- انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازول-۴,۳-ثانی آمین	۹۲
۱,۰۲۷	۸۸	۵,۴-ثانی هیدرو-H۲-بنزو [ز] اندازولیل ((۳))- فنیل-آمین	۹۳
۰,۴۱۵	۹۵	۷,۵-ثانی هیدرو-۱-ثیا-۵,۴-دیازا-حلقی بنتا [ا] بنتالینیل ((۶))-فنیل-آمین	۹۴
۰,۰۶۳	۹۱,۰	۳-برومو-فنیل)- (۹,۲-ثانی هیدرو-۷,۵-دیوکسا- ۳,۲-دیازا-حلقی بنتا [ا]-s-انداسینیل ((۱))-آمین	۹۵
۰,۰۷۶	۹۳,۰	۹,۲-ثانی هیدرو-۷,۵-دیوکسا-۳,۲-دیازا-حلقی بنتا [ا]-s-انداسینیل ((۱))- (۳-فلورو-فنیل)-آمین	۹۶
۰,۰۵۴	۹۱,۰	۹,۲-ثانی هیدرو-۷,۵-دیوکسا-۳,۲-دیازا-حلقی بنتا [ا]-s-انداسینیل ((۱))- (۳-مٹوکسی-فنیل)-آمین	۹۷
۳۰,۶۹	۲۶	۴-فلورو-فنیل)- (۵-مٹیل-۴,۲-ثانی هیدرو-انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳))-آمین	۹۸

۱,۴۶۸	۸۷,۵	(۳-فلورو-فنیل)-(۵-مثیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۱,۲-ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین	۹۹
۱,۷۲۳	۸۱	(۵-مثیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-بیریدینیل (۳)-آمین	۱۰۰
۱,۰۹۲	۵۲	(۵,۲-ثانی متوکسی-فنیل)-(۵-مثیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین	۱۰۱
۳,۴۰۴	۵۰	(۴,۲-ثانی متوکسی-فنیل)-(۵-مثیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین	۱۰۲
۴,۰۹۹	۴۳	(۵,۲-ثانی فلورو-فنیل)-(۵-مثیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین	۱۰۳
۰,۶۶۶	۳۶	(۵-مثیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-(۴-ثالث فلورو متوکسی-فنیل)-آمین	۱۰۴
۱,۸۸۴	۶۹	(۵-مثیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-(۴-ثالث فلورو مثیل-فنیل)-آمین	۱۰۵
۱,۰۴۸	۳۸	(۴-فلورو-فنیل)-(۴-مثیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین	۱۰۶
۱,۲۷۵	۵۶	(۴-متوکسی-فنیل)-(۴-مثیل-۴,۲-ثانی هیدرو- اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین	۱۰۷
۰,۳	۸۲	(۳-فلورو-فنیل)-(۴-مثیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین	۱۰۸
۰,۵۳۷	۸۳	(۴-مثیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-بیریدینیل (۳)-آمین	۱۰۹
۰,۱۸۹	۸۰	(۵,۲-ثانی متوکسی-فنیل)-(۴-مثیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین	۱۱۰

٠,١١	٩٥	١١١ (٤,٢-ثاني مٲوكسي-فٲيل)-(٤-مٲيل-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣))-أمين
٠,٠٨٣	٧٢	١١٢ (٥,٢-ثاني فلورو-فٲيل)-(٤-مٲيل-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣))-أمين
٢,٤٥	٦٠	١١٣ (٤-مٲيل-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣))- (٤-ثالث فلورو مٲوكسي-فٲيل)-أمين
١,٣٧	٨٠	١١٤ (٤-مٲيل-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣))- (٣-ثالث فلورو مٲيل-فٲيل)-أمين
٣,٠٥٦	٨٢	١١٥ حمض ٣-(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو- اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣) أمينو)-بنزويك
٠,٠٠٥٣	٩٦	١١٦ ٣-(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣) أمينو)-بنزاميد
٠,١٣	٩٨	١١٧ N3-(٣-برومو-فٲيل)-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازول-٦,٣-ثاني أمين
٠,٠٢١٣	٧٤	١١٨ N3-(٣-مٲوكسي-فٲيل)-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازول-٦,٣-ثاني أمين
٠,٠١٩٨	٩٠	١١٩ N3-(٣-كلورو-فٲيل)-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازول-٦,٣-ثاني أمين
٠,٣٠٨	٨٧	١٢٠ استر مٲيل لحمض ٣-(٦-أمينو-٤,٢-ثاني هيدرو- اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣) أمينو)-بنزويك
٠,١٤٣	٩٢	١٢١ N3-(٣-فلورو-فٲيل)-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازول-٦,٣-ثاني أمين

۰,۰۱۶۲	۷۰	(۳-برومو-فنیل)-(۶-۴-مثیل-بیرازینیل ((۱)- ۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)- أمین	۱۲۲
۰,۲۲۸	۸۷	(۳-متوکسی-فنیل)-(۶-۴-مثیل-بیرازینیل ((۱)- ۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)- أمین	۱۲۳
۰,۰۱۶۳	۹۴	(۳-کلورو-فنیل)-(۶-۴-مثیل-بیرازینیل ((۱)- ۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)- أمین	۱۲۴
۳,۴۴	۷۱	۳-(۳-برومو-فنیل أمينو)-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازول-۷,۶-دیول	۱۲۵
۰,۱۷۵۸	۶۵	(۹,۲-ثانی هیدرو-۷,۵-دیوکسا-۳,۲-دیازا-حلقی بنتا [أ]-s-انداسینیل ((۱)-بیریدینیل (۳)-أمین	۱۲۶
۰,۴۲۱	۸۹	استر مثیل لحمض ۳-(۹,۲-ثانی هیدرو-۷,۵- دیوکسا-۳,۲-دیازا-حلقی بنتا [أ]-s-انداسینیل (۱) أمینو)-بنزویک	۱۲۷
۰,۰۵۹۵۸	۸۸	(۳-کلورو-فنیل)-(۹,۲-ثانی هیدرو-۷,۵-دیوکسا- ۳,۲-دیازا-حلقی بنتا [أ]-s-انداسینیل ((۱)-أمین	۱۲۸
۰,۰۳۶۷	۵۳,۵	[۷-متوکسی-۶-(۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی)- ۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)- بیریدینیل (۳)-أمین	۱۲۹
۰,۰۰۲۱۴۸	۹۴,۵	(۳-برومو-فنیل)-(۷-متوکسی-۶-(۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی)-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱- ج-] بیرازولیل (۳)-أمین	۱۳۰

٠,٠١٢٩٧	٩٧	١٣١ [٧-مٲوكسي-٦-٣-مورفولينيل (٤)-بروبوكسي]- ٤,٢-ٲائي هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازولينيل (٣)- (٣-مٲوكسي-فنييل)-أمين
٠,٠٠٥٣٧	٧٩	١٣٢ (٣-كلورو-فنييل)-[٧-مٲوكسي-٦-٣-مورفولينيل (٤)-بروبوكسي]-٤,٢-ٲائي هيدرو-اندينو [٢,١]- ج-] بيرازولينيل (٣)-[أمين
٠,٠٣٧٨٩	٥٣	١٣٣ استر مٲيل لحمض ٣-[٧-مٲوكسي-٦-٣-مورفولينيل (٤)-بروبوكسي]-٤,٢-ٲائي هيدرو-اندينو [٢,١]- ج-] بيرازولينيل (٣) أمينو] بنزويك
٠,٠١٠٠٦	٩٦	١٣٤ (٣-فلورو-فنييل)-[٧-مٲوكسي-٦-٣-مورفولينيل (٤)-بروبوكسي]-٤,٢-ٲائي هيدرو-اندينو [٢,١]- ج-] بيرازولينيل (٣)-[أمين
٠,٢٠٢	٨٧	١٣٥ (٣-كلورو-فنييل)-[٦-٣-مٲوكسي-بروبوكسي]- ٤,٢-ٲائي هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازولينيل (٣)- أمين
١,٣٣١	٦٤,٥	١٣٦ (٤-فلورو-فنييل)-[٦-٣-مٲوكسي-بروبوكسي]- ٤,٢-ٲائي هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازولينيل (٣)- أمين
٢,١١	٧١	١٣٧ استر مٲيل لحمض ٣-[٦-٣-مٲوكسي-بروبوكسي]- ٤,٢-ٲائي هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازولينيل (٣) أمينو]-بنزويك
٠,٣٠١١	٧٩,٥	١٣٨ (٣-فلورو-فنييل)-[٦-٣-مٲوكسي-بروبوكسي]- ٤,٢-ٲائي هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازولينيل (٣)- أمين

۰,۰۹۸۲۲	۸۰	(۳-مٹوکسی-فنیل)-(۶-۳-مٹوکسی-بروبوکسی)- ۴,۲-ثانی هیدرو-انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)- امین	۱۳۹
۰,۰۱۳۶۶	۵۶,۵	[۶-۳-مٹوکسی-بروبوکسی)-(۴,۲-ثانی هیدرو- انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)-فنیل-امین	۱۴۰
۰,۳۱۹۲	۸۳,۵	(۳-برومو-فنیل)-(۶-۳-مٹوکسی-بروبوکسی)- ۴,۲-ثانی هیدرو-انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)- امین	۱۴۱
۰,۴۵۳۴	۸۲,۵	[۶-۳-مٹوکسی-بروبوکسی)-(۴,۲-ثانی هیدرو- انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)-بیریدینیل (۳)- امین	۱۴۲
۸,۱۲۴	۶۷	(۴-مٹوکسی-فنیل)-(۶-۳-مٹوکسی-بروبوکسی)- ۴,۲-ثانی هیدرو-انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)- امین	۱۴۳
۰,۸۳۵۹	۹۶,۵	(۴-فلورو-فنیل)-(۵-مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو- انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳))-امین	۱۴۴
۱۳,۹۳	۴۸,۵	(۵-مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳))-(۴-مٹوکسی-فنیل)-امین	۱۴۵
۰,۱۶۰۳	۷۸,۵	(۵-مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳))-بیریدینیل (۳)-امین	۱۴۶
۲,۹۸۴	۳۲	(۵,۲-ثانی مٹوکسی-فنیل)-(۵-مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳))-امین	۱۴۷
۸,۶۰۱	۵۷	(۴,۲-ثانی مٹوکسی-فنیل)-(۵-مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-انڈینو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳))-امین	۱۴۸

۸,۳۷	۲۷,۵	۱۴۹ (۵-مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-۳-ثالث فلورو مٹوکسی-فنیل)-آمین
۰,۸۲۲۶	۸۵	۱۵۰ (۵-مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-۳-ثالث فلورو مٹیل-فنیل)-آمین
۰,۰۹۱۸۴	۷۹	۱۵۱ (۶-برومو-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-۳-فلورو-فنیل)-آمین
۰,۱۷۳۹	۸۰	۱۵۲ (۶-برومو-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-بیریدینیل (۳)-آمین
۱,۰۳۳	۷۹	۱۵۳ (۶-برومو-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-۵,۲-ثانی فلورو-فنیل)-آمین
۴۱,۶۲	۲۹	۱۵۴ (۶-برومو-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-۳-ثالث فلورو مٹوکسی-فنیل)-آمین
۸,۱۱	۵۳	۱۵۵ (۶-برومو-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-۳-ثالث فلورو مٹیل-فنیل)-آمین
۰,۰۰۱	۸۷,۵	۱۵۶ (۳-مٹوکسی-فنیل)-[۷-مٹوکسی-۶-(۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبوکسی)-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین
۰,۰۰۷	۸۵	۱۵۷ استر مٹیل لحمض ۳-[۷-مٹوکسی-۶-(۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبوکسی)-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳) آمینو] بنزویک
۰,۱۸۵۹	۸۷,۵	۱۵۸ (۶-برومو-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-فنیل)-آمین

۰,۰۹۸۸۷	۹۲,۵	۱۵۹ [۶-(۳-ثاني مئيل أمينو-بروبوكسي)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳)-[۴- فلورو-فنييل]-امين
۰,۰۵۸۵۵	۹۴,۵	۱۶۰ [۶-(۳-ثاني مئيل أمينو-بروبوكسي)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳)-[۳- فلورو-فنييل]-امين
۰,۳۸۲۵	۸۴	۱۶۱ [۶-(۳-ثاني مئيل أمينو-بروبوكسي)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳)-بيريدينيل (۳)-امين
۵۴,۸۷	۲۱,۵	۱۶۲ (۲,۵-ثاني مئيل مئوكسي-فنييل)-[۶-(۳-ثاني مئيل أمينو- بروبوكسي)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳)-امين
۲۲,۶۵	۳۲	۱۶۳ (۲,۵-ثاني فلورو-فنييل)-[۶-(۳-ثاني مئيل أمينو- بروبوكسي)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳)-امين
۰,۱۰۰۹	۹۲,۵	۱۶۵ [۶-(۳-ثاني مئيل أمينو-بروبوكسي)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳)-[۳-ثالث فلورو مئيل-فنييل]-امين
۰,۰۸۵	۸۸	۱۶۶ (۳-كلورو-۴-فلورو-فنييل)-[۷-مئوكسي-۶-(۳- مئوكسي-بروبوكسي)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳)-امين
۰,۵۱۱۱	۹۲	۱۶۷ (۳-كلورو-۴-فلورو-فنييل)-[۷,۶-ثاني ايزوبروبوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳)-امين

۰,۰۶۸۸	۹۱	۱۶۸ (۷،۶-ثاني أيزوبروبوكسي-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲،۱] بيرازوليل ((۳))-(۳-مٹوكسي-فنييل)-امين
۰,۰۳۶	۸۹	۱۶۹ (۷،۶-ثاني أيزوبروبوكسي-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲،۱] بيرازوليل ((۳))-(۳-فلورو-فنييل)-امين
۰,۰۲۶۷۶	۹۵,۵	۱۷۰ (۴-فلورو-فنييل)-(۷-مٹوكسي-۴،۲-ثاني هيدرو- اندينو [ج-۲،۱] بيرازوليل ((۳)))-امين
۰,۱۲۳۲	۹۲,۵	۱۷۱ (۷-مٹوكسي-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲،۱] بيرازوليل ((۳))-(۴-مٹوكسي-فنييل)-امين
۰,۰۱۳۳	۵۵	۱۷۲ (۳-فلورو-فنييل)-(۷-مٹوكسي-۴،۲-ثاني هيدرو- اندينو [ج-۲،۱] بيرازوليل ((۳)))-امين
۰,۲۱۴۶	۸۷	۱۷۳ (۷-مٹوكسي-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲،۱] بيرازوليل ((۳))-بيريدينييل (۳)-امين
۰,۳۴۵۹	۸۳	۱۷۴ (۵،۲-ثاني مٹوكسي-فنييل)-(۷-مٹوكسي-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲،۱] بيرازوليل ((۳)))-امين
۳,۹۲۹	۷۱	۱۷۵ (۴،۲-ثاني مٹوكسي-فنييل)-(۷-مٹوكسي-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲،۱] بيرازوليل ((۳)))-امين
۰,۳۱۸۳	۴۶,۵	۱۷۶ (۵،۲-ثاني فلورو-فنييل)-(۷-مٹوكسي-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲،۱] بيرازوليل ((۳)))-امين
۰,۵۲۲۶	۶۵,۵	۱۷۷ (۷-مٹوكسي-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲،۱] بيرازوليل ((۳))-(۴-ثالث فلورو مٹوكسي-فنييل)-امين
۰,۱۳۲۴	۹۸,۵	۱۷۸ (۷-مٹوكسي-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲،۱] بيرازوليل ((۳))-(۴-ثالث فلورو مٹيل-فنييل)-امين

۰,۰۷۱۲۴	۹۲	(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل) [۷-متوکسی-۶-۳- مورفولینیل (۴)-بروبوکسی]-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)-آمین	۱۷۹
۰,۰۱۳۳	۹۸,۵	(۳-کلورو-فنیل)-[۷-متوکسی-۶-۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبوکسی]-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱- ج-] بیرازولیل (۳)-آمین	۱۸۰
۰,۰۱۵۳۶	۷۴,۵	(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)-[۷-متوکسی-۶-۳- بیرولیدینیل (۱)-بروبوکسی]-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)-آمین	۱۸۱
۰,۰۰۰۵	۱۰۷	(۳-کلورو-فنیل)-[۷-متیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)-آمین	۱۸۲
۰,۰۴۵۵	۵۳	(۴-متوکسی-فنیل)-[۷-متیل-۴,۲-ثانی هیدرو- اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)-آمین	۱۸۳
۱,۱	۹۴	(۵,۲-ثانی متوکسی-فنیل)-[۷-متیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)-آمین	۱۸۴
۰,۰۰۵	۸۴	(۵,۲-ثانی فلورو-فنیل)-[۷-متیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)-آمین	۱۸۵
۰,۴۱۴۱	۷۸	(۷-متیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)-[۴-تالٹ فلورو متوکسی-فنیل]-آمین	۱۸۶
	۳۵	(۷-متیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)-[۳-تالٹ فلورو متیل-فنیل]-آمین	۱۸۷
۰,۰۴۳۷	۷۴	(۶-کلورو-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳)-بیریدینیل (۳)-آمین	۱۸۸

٠,١٩٨٩	٩٢	(٦-كلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٤-مٹوكسي-فنييل)-امين	١٨٩
٠,٠٤	٨٠	(٦-كلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٣-مٹوكسي-فنييل)-امين	١٩٠
٠,٠٦٨٦	٨٨	(٦-كلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٣-فلورو-فنييل)-امين	١٩١
٠,١٠٣	٦٧	(٦-كلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٥,٢-ثاني فلورو-فنييل)-امين	١٩٢
	٤٩	(٦-كلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٤-ثالث فلورو مٹيل-فنييل)-امين	١٩٣
٢,٦٠٨	٨٧	(٦-كلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٤-ثالث فلورو مٹوكسي-فنييل)-امين	١٩٤
٢,٢٨	٧٦	(٥,٣-ثنائي-ثالث فلورو مٹيل-فنييل)-(٦-كلورو- ٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)- امين	١٩٥
١,٢٩٣	٧٠	N-(٦-كلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-N',N'-ثاني مٹيل-بنزين-٤,١-ثاني امين	١٩٦
	٨	(٦-كلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-ميٹا-توليل-امين	١٩٧
٠,١٣٨٤	٧٢	(٦-كلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-بارا-توليل-امين	١٩٨

٠,٠٠٥٩	٨٣	١٩٩ ٦- (٣-ثاني مئيل أمينو-بروبوكسي)-٧-مئوكسي- ٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣)- (٣-فلورو-فنييل)-أمين
٠,٠٠٢	٨٧	٢٠٠ (٣-كلورو-٤-فلورو-فنييل)-٦- (٣-ثاني مئيل أمينو- بروبوكسي)-٧-مئوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣)-أمين
٠,٠٠٩	٩٦	٢٠١ (٦-فلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣))- (٤-فلورو-فنييل)-أمين
٠,٠١٢٣٨	٧٧	٢٠٢ (٣-كلورو-٤-فلورو-فنييل)- (٦-فلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣))-أمين
٠,٠١٥٩٥	٨٦	٢٠٣ (٥,٢-ثاني مئوكسي-فنييل)- (٦-فلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣))-أمين
٠,٠٣٨	٩٠	٢٠٤ (٥,٣-ثاني مئوكسي-فنييل)- (٦-فلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣))-أمين
٠,٠٤٧	٨٦	٢٠٥ (٤,٣-ثاني مئوكسي-فنييل)- (٦-فلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣))-أمين
٠,٦٤٠١	٦٣	٢٠٦ (٧,٦-ثاني مئوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- ج-] بيرازوليل (٣))- (٥,٣-ثاني مئيل-فنييل)-أمين
٠,٠١	٨٩	٢٠٧ (٥,٣-ثاني فلورو-فنييل)- (٧,٦-ثاني مئوكسي-٤,٢- ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣))-أمين
٠,٠٠٣	٨٢	٢٠٨ (٧,٦-ثاني مئوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- ج-] بيرازوليل (٣))- (٣-مئيل كبريتانيل-فنييل)-أمين
٠,٠٣٢٨١	٩٩	٢٠٩ (٧,٦-ثاني مئوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- ج-] بيرازوليل (٣))- (٣-اثيل-فنييل)-أمين

۰,۰۶۷۲۳	۹۰	استر ائیل لحمض ۳-(۷,۶-ثانی مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیل (۳) آمینو)- بنزویک	۲۱۰
۰,۰۰۵	۸۷	(۷,۶-ثانی مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیل ((۳)-۳-تالٹ فلورو مٹیل کبریتانیل-فنیل)-آمین	۲۱۱
۰,۷۷۵	۸۴	(۷,۶-ثانی مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیل ((۳)-۴-فلورو-۳-تالٹ فلورو مٹیل-فنیل)-آمین	۲۱۲
۰,۰۰۲۷	۸۲	(۳-کلورو-فنیل)-۷-مٹوکسی-۶-۳-(۴-مٹیل-بیرازینیل (۱))-بروبوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیل (۳)-آمین	۲۱۳
	۴۶	(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)-۷-مٹوکسی-۶-۳-(۴-مٹیل-بیرازینیل (۱))-بروبوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیل (۳)-آمین	۲۱۴
۰,۰۰۵۷	۹۹	{۷-مٹوکسی-۶-۳-(۴-مٹیل-بیرازینیل (۱))-بروبوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیل (۳)-{۳-مٹوکسی-فنیل)-آمین	۲۱۵
۰,۰۰۵۸	۱۰۰	(۳-فلورو-فنیل)-۷-مٹوکسی-۶-۳-(۴-مٹیل-بیرازینیل (۱))-بروبوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیل (۳)-آمین	۲۱۶
۳,۴۷۹	۵۱	۶-(۳-ثانی مٹیل آمینو-بروبوکسی)-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیل (۳)-۴-تالٹ فلورو مٹوکسی-فنیل)-آمین	۲۱۷

۲,۰۱	۸۱	(۴-بنزیلوکسی-فنیل)-(۷,۶-ثانی مٹوکسی-۴,۲- ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازولیل ((۳)-آمین	۲۱۸
	۳۹	(۴,۳-ثانی کلورو-بنزیل)-(۷,۶-ثانی مٹوکسی- ۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازولیل ((۳)- آمین	۲۱۹
۳,۲۹	۷۳	هکسیل حلقی مٹیل-(۷,۶-ثانی مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازولیل ((۳)-آمین	۲۲۰
۱,۵۹۸	۷۱	(۷,۶-ثانی مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱- ج] بيرازولیل ((۳)-[۴-(بيبريدین-۴-کبريتونیل)- فنیل]-آمین	۲۲۱
۰,۸۰۶	۷۰	(۷,۶-ثانی مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱- ج] بيرازولیل ((۳)-[۴-مٹیل-بنزیل]-آمین	۲۲۲
۰,۰۴۵۹۳	۹۷	(۷,۶-ثانی مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱- ج] بيرازولیل ((۳)-[۲-مٹیل-بنزیل]-آمین	۲۲۳
	۲۴	(۷,۶-ثانی مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱- ج] بيرازولیل ((۳)-[۲-مٹوکسی-بنزیل]-آمین	۲۲۴
۰,۰۷۴۴۳	۹۰	(۷,۶-ثانی مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱- ج] بيرازولیل ((۳)-[۳-مٹوکسی-بنزیل]-آمین	۲۲۵
۰,۰۰۳	۱۰۲	(۳-فلورو-فنیل)-[۶-(۳-ایمیدازولیل (۱)- بروبوکسی)-(۷-مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازولیل ((۳)-آمین	۲۲۶
۰,۰۳۴۸۷	۸۳,۵	(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)-[۶-(۳-ایمیدازولیل (۱)-بروبوکسی)-(۷-مٹوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو- اندينو [۲,۱-ج] بيرازولیل ((۳)-آمین	۲۲۷

٠,٠٠١٩	٩٠	(٢-كلورو-بنزيل)-(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-امين	٢٣٠
	٣٧	(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٤-مٲوكسي-بنزيل)-امين	٢٣١
٠,٠٣٩٦	١٠٢	(٧,٥-ثاني هيدرو-١-ثيا-٥,٤-ديازا-حقيقي بنتا [أ] بنتالينيل ((٦)-٣-مٲوكسي-فنييل)-امين	٢٣٢
٠,٠٢٧٥٩	٥٠	(٦-فلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٤-مٲوكسي-فنييل)-امين	٢٣٣
٠,٣٥٨١	١٠١	(٦-فلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٣-مٲوكسي-فنييل)-امين	٢٣٤
٠,٢١١٤	٨٦	(٦-فلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٣-فلورو-فنييل)-امين	٢٣٥
٠,٠٠٥	٨٢	(٥,٢-ثاني فلورو-فنييل)-(٦-فلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-امين	٢٣٦
٠,٠٥	٨٨	(٦-فلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٤-ثالث فلورو مٲيل-فنييل)-امين	٢٣٧
٠,٤١٨٧	٨٧	(٦-فلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٤-ثالث فلورو مٲوكسي-فنييل)-امين	٢٣٨
٠,١٣٨	٩١	(٥,٣-ثنائي-ثالث فلورو مٲيل-فنييل)-(٦-فلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-امين	٢٣٩
٠,٠٠٢	٩٢	(٦-فلورو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-ميٲا-ٲوليل-امين	٢٤٠

٠,٠١٣	١٠٤	(٣-فلورو-فنيل)-(٧-مٲوكسي-٦-(٣-مٲوكسي- بروبوكسي)-(٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-امين	٢٤٢
٠,٠٠٠٢	١٠١	[٧-مٲوكسي-٦-(٣-مٲوكسي-بروبوكسي)-(٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)- مٲوكسي-فنيل)-امين	٢٤٤
٠,٠٠١	٨٧	(٧,٦-ثاني اٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- ج-] بيرازوليل ((٣)-(٣-مٲوكسي-فنيل)-امين	٢٤٥
٠,٠١٢١	٧٧	(٣-كلورو-٤-فلورو-فنيل)-(٧,٦-ثاني اٲوكسي- ٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)- امين	٢٤٦
٠,٠٠٧	٩٦	(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤-مٲيل-٤,٢-ثاني هيدرو- اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-فنيل-امين	٢٤٧
٠,٤٠٩٩	٦٨	(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤-مٲيل-٤,٢-ثاني هيدرو- اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-(٤-فلورو-فنيل)- امين	٢٤٨
٠,٠٠٦	٩٦	(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤-مٲيل-٤,٢-ثاني هيدرو- اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-(٣-فلورو-فنيل)- امين	٢٤٩
٠,٢٢٣٤	٨٨	(٣-كلورو-٤-فلورو-فنيل)-(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤- مٲيل-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-امين	٢٥٠

۰,۳۲۲۲	۸۴	(۵,۳-ثاني فلورو-فنیل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴- مٹیل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل ((۳)-أمين	۲۵۱
	۱۶	(۵,۲-ثاني فلورو-فنیل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴- مٹیل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل ((۳)-أمين	۲۵۲
۰,۰۱۶۵	۹۴	(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴-مٹیل-۴,۲-ثاني هيدرو- اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل ((۳)-(۳-مٹوكسي- فنیل)-أمين	۲۵۳
۰,۱۸۰۸	۸۹	(۳-بنزيلوكسي-فنیل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴-مٹیل- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل ((۳)- أمين	۲۵۴
۰,۱۶۱۵	۹۰	(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴-مٹیل-۴,۲-ثاني هيدرو- اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل ((۳)-(۳-مٹیل كبريتانيل-فنیل)-أمين	۲۵۵
۰,۰۰۸	۸۹	(۳-برومو-فنیل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴-مٹیل- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل ((۳)- أمين	۲۵۶
	۳۵	(۳-كلورو-فنیل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴-مٹیل- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل ((۳)- أمين	۲۵۷
	۳۹	(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴-مٹیل-۴,۲-ثاني هيدرو- اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولیل ((۳)-(۵,۲-ثاني مٹوكسي-فنیل)-أمين	۲۵۸

۰,۰۰۲۰۴۵	۹۳	۳-۳- (۳-کلورو-فنیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۴,۲- ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليلوکسي (۶)- بروبان-۲,۱-ديول	۲۵۹
۰,۰۰۱۵	۹۱	۳-۳- (۳-مٹوکسي-فنيل آمينو)-۴,۲- ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليلوکسي (۶)- بروبان ۲,۱-ديول	۲۶۰
۰,۰۰۱	۷۱	۳-۳- (۳-کلورو-۴-فلورو-فنيل آمينو)-۷- مٹوکسي-۴,۲- ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليلوکسي (۶)-بروبان ۲,۱-ديول	۲۶۱
۰,۰۰۱	۹۰	۳-۳- (۳-فلورو-فنيل آمينو)-۷-مٹوکسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليلوکسي (۶)- بروبان ۲,۱-ديول	۲۶۲
۰,۰۰۴۶	۱۰۳	۳-۷-مٹوکسي-۳- (بيريدينيل (۳) آمينو)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليلوکسي (۶)- بروبان ۲,۱-ديول	۲۶۳
۰,۰۸۵۱۹	۸۶	بنزيل-(۷,۶-ثاني اٹوکسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليل ((۳)-امين	۲۶۴
۰,۰۰۵۵۳۵	۶۳	۳-۳- (۳-فلورو-فنيل آمينو)-۷-مٹوکسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليلوکسي (۶)- بروبانول (۱)	۲۶۵
۰,۰۰۱۵۳۴	۱۱۰	۳-۷-مٹوکسي-۳- (۳-مٹوکسي-فنيل آمينو)-۴,۲- ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليلوکسي (۶)- بروبانول (۱)	۲۶۶

٠,٠١٠٥٩	٩٣,٥	٣-٣-(٣-كلورو-٤-فلورو-فنييل أمينو)-٧- مثوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليلوكسي (٦)-[بروبانول (١)]	٢٦٧
٠,٠٠١١٣٤	٨٤	٣-٣-(٣-كلورو-فنييل أمينو)-٧-مثوكسي-٤,٢- ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليلوكسي (٦)-[بروبانول (١)]	٢٦٨
٠,٠٠٠٥٩١٤	٤٩	١-٣-(٣-كلورو-فنييل أمينو)-٧-مثوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليلوكسي (٦)-٣- بيروليدينيل (١) بروبانول (٢)	٢٦٩
٠,٠٠٠٤٢٨٧	١٠٧	١-٧-مثوكسي-٣-(٣-مثوكسي-فنييل أمينو)-٤,٢- ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليلوكسي (٦)-[٣-بيروليدينيل (١) بروبانول (٢)]	٢٧٠
٦,٩٨٧	٥٤,٥	(٣,٥-ثاني كلورو-بنزيل)-(٦,٧-ثاني مثوكسي- ٢,٤-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣))- أمين	٢٧١
٠,٣٨٨٨	٦١	(٦,٧-ثاني مثوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- ج-] بيرازوليل ((٣))-(٣-مethyl-بنزيل)-أمين	٢٧٢
١,٥٨٤	٧٧	(٣-كلورو-٤-methyl-بنزيل)-(٦,٧-ثاني مثوكسي- ٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣))- أمين	٢٧٣
٢,٦١	٥٧,٥	(٢,٥-ثاني مثوكسي-بنزيل)-(٦,٧-ثاني مثوكسي- ٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣))- أمين	٢٧٤

۰,۵۰۰.۶	۸۰,۵	۲۷۵ (۴,۳-ثاني فلورو-بنزىل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسى- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱]-بيرازولىل (۳))- امين
۰,۲۸۷.۴	۱۱	۲۷۶ (۷,۶-ثاني مٹوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱]- بيرازولىل (۳))- (۴-فلورو-۳-نترو-فنىل)-امين
۱,۳۶۱	۸۸	۲۷۷ (۳-كلورو-۴-مٹوكسى-فنىل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسى- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱]-بيرازولىل (۳))- امين
۰,۰۲۹.۴۹	۹۷	۲۷۸ ۱-[۳-(۷,۶-ثاني مٹوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱]-بيرازولىل (۳) امينو)-فنىل]-ايثانول
۲۰۳,۱	۱۹,۵	۲۷۹ (۵,۳-ثاني نٹ-بيوتيل-فنىل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسى- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱]-بيرازولىل (۳))- امين
۰,۰۰۱.۷۲	۱۰.۲	۲۸۰ ۱-[۳-(۳-كلورو-۴-فلورو-فنىل امينو)-۷- مٹوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱]- بيرازولىلوکسي (۶)]-۳-بيروليدينيل (۱)-بروبانول (۲)
۰,۰۰۲.۵۹۹	۶۷	۲۸۱ ۱-[۷-مٹوكسى-۳-(بيريدينيل (۳) امينو)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱]-بيرازولىلوکسي (۶)]-۳- بيروليدينيل (۱)-بروبانول (۲)
۰,۰۰۰.۰۸۹	۹۹	۲۸۲ ۱-[۳-(۳-كلورو-فنىل امينو)-۷-مٹوكسى-۴,۲- ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱]-بيرازولىلوکسي (۶)]- ۳-بيروليدينيل (۱)-بروبانول (۲)

۰,۰۰۴۳۵۶	۸۶,۵	[۷,۶-ثنائي-(۳-مٹوکسي-بروبوکسي)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳)-۳-فلورو-فنيل]-امين	۲۸۳
۰,۰۰۵۰۹	۸۴,۶	[۷,۶-ثنائي-(۳-مٹوکسي-بروبوکسي)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳)-۳-مٹوکسي-فنيل]-امين	۲۸۴
۰,۰۰۲۷۷۹	۱۸,۵	[۷,۶-ثنائي-(۳-مٹوکسي-بروبوکسي)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳)-۳-کلورو-فنيل]-امين	۲۸۵
۰,۰۱۶۲۴	۹۵,۵	[۷,۶-ثنائي-(۳-مٹوکسي-بروبوکسي)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳)-بيريدينيل (۳)-امين	۲۸۶
۰,۰۲۶۱۶	۹۲,۵	[۷,۶-ثنائي-(۳-مٹوکسي-بروبوکسي)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳)-۳-کلورو-۴-فلورو-فنيل]-امين	۲۸۷
۰,۲۱۹۴	۸۸,۵	(۳-کلورو-۴-مٹوکسي-فنيل)-(۶-فلورو-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳))-امين	۲۸۸
۰,۰۱۸۵۳	۹۳,۵	۱-[۳-(۶-فلورو-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳) امينو)-فنيل]-ايتانول	۲۸۹
۰,۰۶۱۴۲	۸۷,۵	(۶-فلورو-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳))-((۵)-ايتانول	۲۹۰
۰,۲۰۵۲	۹۵	(۶-بنزيلوکسي-۷-مٹوکسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۳))-((۳)-۳-فلورو-فنيل)-امين	۲۹۱

۰,۰۱۸۲۲	۸۶,۵	(۲-کلورو-بنزیل)-(۷,۶-ثانی ائوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین	۲۹۲
۰,۰۶۹۱۶	۹۶,۵	(۷,۶-ثانی ائوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین	۲۹۳
۰,۲۶۳۷	۸۱	(۷,۶-ثانی ائوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین	۲۹۴
۰,۰۰۱۶۴۵	۸۱,۵	(۶,۲-ثانی کلورو-بنزیل)-(۷,۶-ثانی ائوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین	۲۹۵
۱,۸۲۱	۷۲,۵	(۷,۶-ثانی ائوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین	۲۹۶
۰,۲۷۴۹	۹۰,۵	۳-(۷,۶-ثانی مئوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳) آمینو)-N-(۲)-هیدروکسی-اethyl-بنزامید	۲۹۷
۰,۴۰۸۲	۹۲	۳-(۷,۶-ثانی مئوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳) آمینو)-N-(۳) بیرویلیدینیل (۱) برویل-بنزامید	۲۹۸
۰,۰۱۹۲۸	۸۰	(۷-فلورو-۲,۴-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-فنیل-آمین	۲۹۹
	۴۰	(۷,۶-ثانی مئوکسی-۴-فنیل-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-فنیل-آمین	۳۰۰
	۷۲	(۷,۶-ثانی ائوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳)-۲-ثالث فلورو مئوکسی-بنزیل)-آمین	۳۰۱

۳۰۲	(۷،۶-ثاني مٹوكسي-۴-فنيل-۴،۲-ثاني هيدرو- اندينو [۲،۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-۳-فلورو-فنيل)- امين	۴۷	
۳۰۳	(۵،۳-ثاني-ثت-بيوتيل-فنيل)-۶-فلورو-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲،۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين	۵۰	۹،۳۳۸
۳۰۴	(۵،۳-ثاني كلورو-بنزيل)-۶-فلورو-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲،۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين	۳۸	۳،۴۵۶
۳۰۵	(۶-فلورو-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲،۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-۳-مئيل-بنزيل)-امين	۸۷	۰،۴۵۷۷
۳۰۶	(۳-كلورو-۴-مئيل-بنزيل)-۶-فلورو-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲،۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين	۴۷،۵	۸،۵۸۹
۳۰۷	(۵،۲-ثاني مٹوكسي-بنزيل)-۶-فلورو-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲،۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين	۵۹	۳،۴۰۱
۳۰۸	(۴،۳-ثاني فلورو-بنزيل)-۶-فلورو-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲،۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين	۱۴	۰،۵۱۰۸
۳۰۹	(۳-كلورو-۴-مٹوكسي-فنيل)-۷-مئيل-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲،۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين	۹۲،۵	۰،۰۳۰۲۲
۳۱۰	۱-۳-۷-مئيل-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲،۱-ج-] بيرازوليل (۳) امينو-فنيل-ايتانول	۹۵،۵	۰،۰۲۰۲
۳۱۱	(H۱-اندوليل (۵))-۷-مئيل-۴،۲-ثاني هيدرو- اندينو [۲،۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين	۶۸،۵	۰،۰۷۴۷۸
۳۱۲	(۵،۳-ثاني-ثت-بيوتيل-فنيل)-۷-مئيل-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲،۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين	۵۶،۵	۵،۶۷۲

۳,۵۰۳	۶۲,۵	(۵,۳-ثاني كلورو-بنزىل)-(۷-مئىل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازولىل ((۳)-امين	۳۱۳
۰,۸۹۴۴	۷۶	(۳-مئىل-بنزىل)-(۷-مئىل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازولىل ((۳)-امين	۳۱۴
۱,۹۲۴	۱۷,۵	(۳-كلورو-۴-مئىل-بنزىل)-(۷-مئىل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازولىل ((۳)-امين	۳۱۵
۴,۹۰۶	۶۶	(۵,۲-ثاني مئوكسى-بنزىل)-(۷-مئىل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازولىل ((۳)-امين	۳۱۶
۱,۲۴۷	۷۹	(۴,۳-ثاني فلورو-بنزىل)-(۷-مئىل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازولىل ((۳)-امين	۳۱۷
۳۴,۳۸	۲۳	(۵,۴-ثاني هيدرو-H۲-۶-اكسا-۲,۱-ديازا-بنزو [ه-] ازولينىل ((۳)-فنيل-امين	۳۱۸
۲,۲۰۱	۸۰,۵	[۳-(۷,۶-ثاني مئوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازولىل (۳) امينو)-فنيل]-۴-مئىل-بيرازينىل ((۱)-ميتانون	۳۱۹
۱,۹۵۸	۷۰,۵	(۷,۶-ثاني مئوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازولىل ((۳)-امين	۳۲۰
۰,۰۰۷۴۵۴	۷۷	(۶,۲-ثاني فلورو-بنزىل)-(۷,۶-ثاني مئوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازولىل ((۳)-امين	۳۲۱
۰,۰۵۴۶۶	۲۲	(۳,۲-ثاني مئوكسى-بنزىل)-(۷,۶-ثاني مئوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱] بيرازولىل ((۳)-امين	۳۲۲

۸,۷۱۱	۶۰,۵	(۵,۲-ثاني فلورو-بنزىل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسى- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولىل ((۳)- امين	۳۲۳
۱,۳۲۵	۷۴,۵	(۷,۶-ثاني مٹوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- ج-] بيرازولىل ((۳)-[۱-(۳-مٹوكسى-فنيل)-ايل]- امين	۳۲۴
۰,۰۹۶۶۹	۶۱	(۷,۶-ثاني مٹوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- ج-] بيرازولىل ((۳)-[۲-فلورو-بنزىل]-امين	۳۲۵
۰,۲۶۷۱	۸۲	(۳,۲-ثاني كلورو-بنزىل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسى- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولىل ((۳)- امين	۳۲۶
۱۰,۶۲	۵۲	(۷,۶-ثاني مٹوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- ج-] بيرازولىل ((۳)-[۳-فلورو-بنزىل]-امين	۳۲۷
۰,۶۹۷۱	۷۸,۵	(۴,۲-ثاني فلورو-بنزىل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسى- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولىل ((۳)- امين	۳۲۸
۰,۰۷۶۲	۵۸	(۷,۶-ثاني مٹوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- ج-] بيرازولىل ((۳)-[۲-ثالث فلورو مٹيل-بنزىل]- امين	۳۲۹
۰,۰۱۶۲	۱۰۰	(۵,۲-ثاني كلورو-بنزىل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسى- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولىل ((۳)- امين	۳۳۰
۰,۱۸۸۶	۹۳	(۷,۶-ثاني مٹوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱- ج-] بيرازولىل ((۳)-[۴-فلورو-بنزىل]-امين	۳۳۱

۰,۳۷۱۶	۹۰	(۸,۵-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-جـ] بيرازوليل ((۳-فنيل-امين	۳۳۲
۲,۵۵	۷۳,۵	(۳-كلورو-بنزيل)-(۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴-مٹيل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-جـ] بيرازوليل ((۳)-امين	۳۳۳
۰,۰۰۸۶۹۳	۹۹,۵	(۷-فلورو-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-جـ] بيرازوليل ((۳)-(۳-فلورو-فنيل)-امين	۳۳۴
۰,۱۲۹۲	۱۰۰	(۷,۵-ثاني هيدرو-۱-ثيا-۵,۴-ديازا-حقيقي بنتا [۱] بنتالينيل ((۶)-(۳-فلورو-فنيل)-امين	۳۳۵
۰,۰۰۸۸۰۴	۱۰۰	(۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-جـ] بيرازوليل ((۳)-(۳-فلورو-فنيل)-امين	۳۳۷
۰,۴۵۱۲	۷۸,۵	(۵-كلورو-۲-مٹيل-فنيل)-(۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-جـ] بيرازوليل ((۳)-امين	۳۳۸
۰,۱۱۷۴	۱۰۰	(۵,۲-ثاني فلورو-فنيل)-(۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-جـ] بيرازوليل ((۳)-امين	۳۳۹
۰,۱۰۴۶	۹۲,۵	(۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-جـ] بيرازوليل ((۳)-(۲-فلورو-۵-ثالث فلورو مٹيل-فنيل)-امين	۳۴۰
۰,۰۴۱۱۸	۹۲,۵	(۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-جـ] بيرازوليل ((۳)-(۲,۵-ثاني مٹوكسي-فنيل)-امين	۳۴۱
۰,۰۲۶۶۸	۵۶,۵	(۵-كلورو-۲-مٹوكسي-فنيل)-(۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-جـ] بيرازوليل ((۳)-امين	۳۴۲
۰,۰۰۸۰۷۵	۹۹,۵	(۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-جـ] بيرازوليل ((۳)-(۳-مٹوكسي-فنيل)-امين	۳۴۳

۰,۰۶۴۶۵	۱۰۰	(۷,۶-ثاني ائوكسي-۴-مئيل-۴,۲-ثاني هيدرو- اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليل ((۳)-۳-فلورو-فنييل)- أمين	۳۴۴
۰,۰۸۹۳	۸۸	(۷,۶-ثاني ائوكسي-۴-مئيل-۴,۲-ثاني هيدرو- اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليل ((۳)-بيريدينيل (۳)- أمين	۳۴۵
۰,۰۷۳۹۲	۹۸	(۳-برومو-فنييل)-(۷,۶-ثاني ائوكسي-۴-مئيل- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليل ((۳)- أمين	۳۴۶
۰,۰۴۵۳	۹۰,۵	(۳-كلورو-۴-فلورو-فنييل)-(۷,۶-ثاني ائوكسي-۴- مئيل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليل ((۳)-امين	۳۴۷
۰,۰۲۵۲۹	۹۷,۵	(۷,۶-ثاني ائوكسي-۴-مئيل-۴,۲-ثاني هيدرو- اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليل ((۳)-۳-مئوكسي- فنييل)-امين	۳۴۸
۰,۰۸۰۸۹	۷۸	(۷,۶-ثاني ائوكسي-۴-مئيل-۴,۲-ثاني هيدرو- اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليل ((۳)-۴-فلورو-فنييل)- امين	۳۴۹
۰,۰۶۵۱۲	۹۱	۳-فنييل امينو-۵,۴-ثاني هيدرو-H۲-بنزو [از] اندازول-۷-كربونتريل	۳۵۰
۰,۰۳۹۹۸	۹۳	(۷,۶-ثاني ايزوبروبوكسي-۴-مئيل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليل ((۳)-۳- فلورو-فنييل)-امين	۳۵۱

۰,۷۵۵۴	۸۶,۵	۳۵۲ (۷,۶-ثاني أيزوبروبوكسي-۴-مثيل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-بيريدينيل (۳)-أمين
۰,۳۵۹۴	۸۸	۳۵۳ (۳-برومو-فنيل)-(۷,۶-ثاني أيزوبروبوكسي-۴-مثيل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين
۲,۴۵	۶۲	۳۵۴ (۳-كلورو-۴-فلورو-فنيل)-(۷,۶-ثاني أيزوبروبوكسي-۴-مثيل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين
۱,۰۲۶	۸۵	۳۵۵ (۷,۶-ثاني أيزوبروبوكسي-۴-مثيل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-۳-مثوكسي-فنيل)-امين
۱,۹۵۳	۷۰	۳۵۶ (۷,۶-ثاني أيزوبروبوكسي-۴-مثيل-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-۴-فلورو-فنيل)-امين
۰,۰۰۹۴۱۷	۹۸,۵	۳۵۷ (۶-فلورو-۷-مثوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-۳-فلورو-فنيل)-امين
۰,۰۰۸۷۷	۹۲	۳۵۸ (۳-برومو-فنيل)-(۶-فلورو-۷-مثوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين
۰,۰۴۱۵۱	۹۸,۵	۳۵۹ (۳-كلورو-۴-فلورو-فنيل)-(۶-فلورو-۷-مثوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين
۰,۰۰۷۵۰۱	۹۸	۳۶۰ (۶-فلورو-۷-مثوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-۳-مثوكسي-فنيل)-امين

۰,۰۱۱۵۶	۱۰۰	۳۶۱ (۶-فلورو-۷-متوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳))-(۴-فلورو-فنیل)-آمین
۰,۷۸۴۴	۸۰,۵	۳۶۲ ۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازول-۷,۶-دیول
۰,۰۰۵۴۶۶	۷۶,۵	۳۶۳ ۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷-متوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولول (۶)
۰,۰۱۵۰۶	۱۰۰	۳۶۴ (۶-فلورو-۷-متوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳))-بیریدینیل (۳)-آمین
۰,۰۱۱۳۱	۹۹,۵	۳۶۵ ۳-[۶-اتوکسی-۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیلوکسی (۷)]- بروبانول (۱)
۰,۰۱۲۰۹	۱۰۰	۳۶۶ ۳-[۶-اتوکسی-۳-(۳-متوکسی-فنیل آمینو)-۴,۲- ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیلوکسی (۷)]- بروبانول (۱)
۰,۰۰۸۱۴	۹۷	۳۶۷ ۳-[۳-(۳-کلورو-فنیل آمینو)-۶-اتوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیلوکسی (۷)]- بروبانول (۱)
۰,۰۶۲۹۳	۸۹,۵	۳۶۸ ۳-[۳-(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل آمینو)-۶- اتوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیلوکسی (۷)]-بروبانول (۱)
۰,۰۱۸۷	۱۰۰	۳۶۹ (۶-برومو-۷-متوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳))-(۳-فلورو-فنیل)-آمین
۰,۰۱۲۱۸	۹۴	۳۷۰ (۶-برومو-۷-متوکسی-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۳))-(۳-متوکسی-فنیل)-آمین

۰,۰۴۷۶	۱۰۰	۳-۶-اثوکسي-۳-(بیریدینیل (۳) آمینو)-۴,۲-ثاني هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیلوکسي (۷)-[بروبانول (۱)	۳۷۱
۰,۰۱۵۵۳	۱۰۰	۳-۷-۳-هیدروکسي-بروبوکسي-۳-(بیریدینیل (۳) آمینو)-۴,۲-ثاني هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیلوکسي (۶)-[بروبانول (۱)	۳۷۲
۰,۰۰۳۷۷۲	۱۰۰	۳-۳-۳-کلورو-فنیل آمینو)-۷-۳-هیدروکسي-بروبوکسي-۴,۲-ثاني هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیلوکسي (۶)-[بروبانول (۱)	۳۷۳
۰,۰۱۴۱۲	۱۰۰	۷,۶-ثاني مٹوکسي-۴,۲-ثاني هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیل ((۳))-۳-اثوکسي-فنیل)-آمین	۳۷۴
۰,۰۱۰۲۸	۹۶,۵	۷,۶-ثاني اثوکسي-۴,۲-ثاني هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیل ((۳))-۳-اثوکسي-فنیل)-آمین	۳۷۵
۰,۰۰۹۰۹۶	۱۰۰	۳-۳-۳-اثوکسي-فنیل آمینو)-۷-مٹوکسي-۴,۲-ثاني هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیلوکسي (۶)-[بروبانول (۱)	۳۷۶
۰,۰۰۸۵۷۲	۹۹	۲-۲-کلورو-بیریدینیل ((۳))-۷,۶-ثاني مٹوکسي-۴,۲-ثاني هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیل ((۳))-آمین	۳۷۷
۰,۰۴۶۷	۹۴,۵	۶-فلورو-۴,۲-ثاني هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیل ((۳))-۲-مٹیل-بنزیل)-آمین	۳۷۸
۰,۰۰۸۱۱۹	۱۰۰	۳-۳-۳-اثوکسي-فنیل آمینو)-۷-مٹوکسي-۴,۲-ثاني هیدرو-اندينو [۲,۱-ج] بیرازولیلوکسي (۶)-[بروبان-۲,۱-دیول	۳۷۹

۰,۰۱۵۳۳	۹۹,۵	(۳-فلورو-فنیل)-(H۲-۸-اکسا-۳,۲-دياز-۱-حلقی بنتا [۱] اندینیل (۱))-آمین	۳۸۰
۰,۰۵۴۹۲	۱۰۰	(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)-(H۲-۸-اکسا-۳,۲- دياز-۱-حلقی بنتا [۱] اندینیل (۱))-آمین	۳۸۱
۰,۰۱۱۸۵	۱۰۰	۳-[۷-اثوکسی-۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)]- بروبانول (۱)	۳۸۲
۰,۰۲۵۳۳	۹۳	۳-[۷-اثوکسی-۳-(بیریدینیل (۳) آمینو)-۴,۲-ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)]- بروبانول (۱)	۳۸۳
۰,۰۰۵۶۰۷	۱۰۰	۳-[۷-اثوکسی-۳-(۳-متوکسی-فنیل آمینو)-۴,۲- ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)]- بروبانول (۱)	۳۸۴
۰,۰۰۴۰۷۲	۹۸,۵	۳-[۳-(۲-کلورو-بنزیل آمینو)-۷-متوکسی-۴,۲- ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)]- بروبانول (۱)	۳۸۵
۰,۰۱۱۰۱	۹۵,۵	۳-[۳-(۲-فلورو-بنزیل آمینو)-۷-متوکسی-۴,۲- ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)]- بروبانول (۱)	۳۸۶
۰,۰۱۱۶۲	۱۰۰	۳-[۳-(۲-فلورو-بنزیل آمینو)-۷-متوکسی-۴,۲- ثانی هیدرو-اندینو [۲,۱-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)]- بروبان-۲,۱-دیول	۳۸۷

۰,۰۳۶۶۷	۹۶	۳-۶-اثوكسى-۳-۳-اثوكسى-فنيل آمينو)-۴,۲- ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليلوكسى (۷)- بروبانول (۱)	۳۸۸
۰,۰۱۵۱۱	۹۸	۳-۳-۳-كلورو-۴-فلورو-فنيل آمينو)-۷-۳- هيدروكسى-بروبوكسى)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليلوكسى (۶)-بروبانول (۱)	۳۸۹
۰,۰۰۲۰۲۹	۹۹	۱-۳-۶,۲-ثاني كلورو-بنزىل آمينو)-۷-مئوكسى- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليلوكسى [۶)-۳-بيروليدينيل (۱)-بروبانول (۲)	۳۹۰
۰,۰۰۶۷۹۶	۹۹	۱-۳-۶,۲-ثاني فلورو-بنزىل آمينو)-۷-مئوكسى- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليلوكسى [۶)-۳-بيروليدينيل (۱)-بروبانول (۲)	۳۹۱
۰,۱۵۲۸	۸۰	۳-۳-كلورو-فنيل)-۵-۳-مورفولينيل (۴)- بروبوكسى)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليل (۳)-امين	۳۹۲
۰,۱۷۳۷	۹۴,۵	۳-۳-فلورو-فنيل)-۵-۳-مورفولينيل (۴)- بروبوكسى)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليل (۳)-امين	۳۹۳
۰,۳۲۸۹	۹۱	۳-۳-اثوكسى-فنيل)-۵-۳-مورفولينيل (۴)- بروبوكسى)-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج] بيرازوليل (۳)-امين	۳۹۴
۰,۶۸۶۱	۸۸	۳-۳-فلورو-فنيل)-اميد لحمض ۳-۳-فلورو-فنيل امينو)-۷,۶-ثاني مئوكسى-H۴-اندينو [۲,۱-ج] بيرازول-۲-كربوكسيليك	۳۹۵

٠,٠٠٥١٢٩	٩٩,٥	١-٣-(٢-كلورو-بنزيل أمينو)-٧-٣-٤,٢- ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليلوكسي (٦)- ٣-بيروليدينيل (١)-بروبانول (٢)	٣٩٦
٠,٠٠٧٧٠١	٩٢	١-٣-(٢-فلورو-بنزيل أمينو)-٧-٣-٤,٢- ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليلوكسي (٦)- ٣-بيروليدينيل (١)-بروبانول (٢)	٣٩٧
٠,٠٠٦٨٢	٩٦	٣-٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧-(٣-هيدروكسي- بروبوكسي)-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليلوكسي (٦)-بروبانول (١)	٣٩٨
٠,٠٠٢٩١٨	٩٨,٥	٣-٧-(٣-هيدروكسي-بروبوكسي)-٣-٣- ٣-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليلوكسي (٦)-بروبانول (١)	٤٠٠
٠,٠٢٢٠٣	٩٨,٥	٣-٣-(٣-اثوكسي-فنييل أمينو)-٧-(٣-هيدروكسي- بروبوكسي)-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليلوكسي (٦)-بروبانول (١)	٤٠١
٠,١٩٥٧	٩٠	(٥,٧-ثاني هيدرو-١-٣-٥,٤-ديازا-حلقي بنتا [أ] بنتالينيل (٦))-بيروليدينيل (٣)-أمين	٤٠٢
٠,٠٨٥٨٨	٩٦	(٣-كلورو-فنييل)-٧,٥-ثاني هيدرو-١-٣-٥,٤- ديازا-حلقي بنتا [أ] بنتالينيل (٦)-أمين	٤٠٣
١,١١٥	٧٤,٥	(٣-كلورو-٤-فلورو-فنييل)-٧,٥-ثاني هيدرو-١- ٣-٥,٤-ديازا-حلقي بنتا [أ] بنتالينيل (٦)-أمين	٤٠٤
٠,٠٦٣٥٤	٩٤,٥	(٧,٥-ثاني هيدرو-١-٣-٥,٤-ديازا-حلقي بنتا [أ] بنتالينيل (٦))-٣-اثوكسي-فنييل)-أمين	٤٠٥

۰,۰۷۵۰۲	۹۶	۱-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو-۷,۶-ثانی مٹوکسی- H۴-انڈینو [۲,۱-ج] بیرازولیل (۲)-ایٹانوں	۴۰۶
۹,۸۸۳	۳۹	اسٹر اٹیل لحمض {۳-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو-۷,۶- ثانی مٹوکسی-H۴-انڈینو [۲,۱-ج] بیرازول-۲- کربونیل]-آمینو}-آسیتیک	۴۰۷
۰,۶۸۶۶	۸۳	اسٹر ۳-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو-۷,۶-ثانی مٹوکسی- H۴-انڈینو [۲,۱-ج] بیرازولیل (۲) مٹیل لحمض ۲,۲-ثانی مٹیل-بروبیونیک	۴۰۸
۰,۱۰۷۶	۸۵,۵	اسٹر ۳-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو-۷,۶-ثانی مٹوکسی- H۴-انڈینو [۲,۱-ج] بیرازولیل (۱) مٹیل لحمض ۲,۲-ثانی مٹیل-بروبیونیک	۴۰۹
۱,۰۷۶	۸۳,۵	(۲-برومو-۳-فلورو-فنیل)-۷,۶-ثانی مٹوکسی- ۴,۲-ثانی ہیڈرو-انڈینو [۲,۱-ج] بیرازولیل (۳)- آمین	۴۱۰
۰,۰۸۲۳۳	۱۴,۵	اسٹر اٹیل لحمض ۳-۳-۳-فنیل مٹوکسی-۷,۶- آمینو-H۴-انڈینو [۲,۱-ج] بیرازول-۲-کربونیل]- آمینو]-بروبیونیک	۴۱۱
۱۲,۷۲	۴۴	اسٹر مٹیل لحمض ۲-۳-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو- ۷,۶-ثانی مٹوکسی-H۴-انڈینو [۲,۱-ج] بیرازول- ۲-کربونیل]-آمینو}-۴-مٹیل-بنتانویک	۴۱۲
۱,۱۴	۷۱	اسٹر مٹیل لحمض ۲-۳-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو- ۷,۶-ثانی مٹوکسی-H۴-انڈینو [۲,۱-ج] بیرازول- ۲-کربونیل]-آمینو}-۳-مٹیل-بیوتیریک	۴۱۳

۰,۰۶۳۹	۸۰,۵	(۶,۲-ثاني فلورو-بنزىل)-(۵-۳-مورفولينيل (۴)- بروبوكسي)-(۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولينيل (۳)-امين	۴۱۴
۰,۰۲۵۸۱	۹۸	(۶,۲-ثاني كلورو-بنزىل)-(۵-۳-مورفولينيل (۴)- بروبوكسي)-(۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولينيل (۳)-امين	۴۱۵
۱,۱۸۵	۷۲,۵	(۲-فلورو-بنزىل)-(۵-۳-مورفولينيل (۴)- بروبوكسي)-(۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولينيل (۳)-امين	۴۱۶
۱۲,۲	۲۷,۵	(۵-مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولينيل (۳)-((۳-مٹوكسي-۵-ثالث فلورو مٹيل- فنيل)-امين	۴۱۷
۰,۸۹۱۶	۸۲,۵	۳-(۵-مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولينيل (۳) امينو)-بنزين كبريتوناميد	۴۱۸
۰,۰۶۲۱۴	۱۰۰	(۳-كلورو-فنيل)-(۴-اٹيل-۷,۶-ثاني مٹوكسي- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولينيل (۳)- امين	۴۱۹
۰,۰۵۲۳۶	۱۰۰	(۳-برومو-فنيل)-(۴-اٹيل-۷,۶-ثاني مٹوكسي- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولينيل (۳)- امين	۴۲۰
۰,۰۸۲۱۹	۱۰۰	(۴-اٹيل-۷,۶-ثاني مٹوكسي-۴,۲-ثاني هيدرو- اندينو [۲,۱-ج-] بيرازولينيل (۳)-((۳-فلورو-فنيل)- امين	۴۲۱

۰,۰۲۹۶۶	۸۳	(۳-فلورو-فنیل)-(۵-متوکسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين	۴۲۲
۰,۱۸۱۵	۹۰	(۶,۲-ثاني فلورو-بنزيل)-(۵-متوکسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين	۴۲۳
۰,۰۷۹۱۲	۱۰۰	(۳-کلورو-بنزيل)-(۷,۶-ثاني متوکسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين	۴۲۴
۰,۰۰۲۲۹۶	۹۶	(۶-فلورو-۷-متوکسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين	۴۲۵
۰,۲۴۱۵	۹۷	(۲-فلورو-بنزيل)-(۶-فلورو-۷-متوکسي-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين	۴۲۶
۱,۱۵	۸۰	[۳]-(۳-فلورو-فنيل أمينو)-(۷,۶-ثاني متوکسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۱)-فنيل-ميثانون	۴۲۷
۰,۴۳۲	۸۵,۵	استر مثيل لحمض ۴-[۳]-(۳-فلورو-فنيل أمينو)-(۷,۶-ثاني متوکسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۱)-۴-اکسو-بيوتيريك	۴۲۸
۰,۶۷۰۶	۷۲	استر اثيل لحمض ۴-[۳]-(۳-فلورو-فنيل أمينو)-(۷,۶-ثاني متوکسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۱)-۴-اکسو-بيوتيريك	۴۲۹
۰,۵۷۱	۶۱,۵	۱-[۳]-(۳-فلورو-فنيل أمينو)-(۷,۶-ثاني متوکسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۱)-بروبانون	۴۳۰
۰,۴۴۳۷	۸۴,۵	۱-[۳]-(۳-فلورو-فنيل أمينو)-(۷,۶-ثاني متوکسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل ((۱)-۲-مثيل-بروبانون (۱)	۴۳۱

٠,٠٣٨٠٤	٩٥,٥	١-٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني مٲوكسي- H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل (١)-٢- هيدروكسي-ايتانول	٤٣٢
٠,٥٨٤٩	٧١	استر فنييل لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦- ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول-١- كربوكسيليك	٤٣٣
٠,٥٠٣	٨٦	استر مٲيل لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦- ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول-٢- كربوكسيليك	٤٣٤
١,٥٨٨	٦٧	استر اٲيل لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦- ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول-٢- كربوكسيليك	٤٣٥
٠,٩٦١٩	٩,٥	استر أيزوبروبيل لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)- ٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول- ٢-كربوكسيليك	٤٣٦
٠,٢٩١٤	٨٣,٥	استر ٢-مٲوكسي-اٲيل لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول-٢-كربوكسيليك	٤٣٧
٠,٩٩٢٣	٧٧,٥	استر ٢-مٲوكسي-اٲيل لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول-١-كربوكسيليك	٤٣٨
٠,٦٢٠٢	٦٩,٥	استر مٲيل لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦- ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول-١- كربوكسيليك	٤٣٩

۰,۰۴۵۷۴	۸۹,۵	۳-۳-۳-کلورو-فنیل آمینو-۴,۲-ثانی هیدرو- اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليلوكسي (۵)-بروبانول (۱)	۴۴۰
۰,۲۰۵۸	۹۶	۳-۳-۳-اثوكسي-فنیل آمینو-۴,۲-ثانی هیدرو- اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليلوكسي (۵)-بروبانول (۱)	۴۴۱
۰,۲۰۴۸	۹۴,۵	۳-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو-۴,۲-ثانی هیدرو- اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليلوكسي (۵)-بروبانول (۱)	۴۴۲
۰,۰۹۷۹۵	۸۹,۵	۳-۳-۶,۲-ثانی فلورو-بنزیل آمینو-۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليلوكسي (۵)- بروبانول (۱)	۴۴۳
۰,۵۱۸۵	۷۹,۵	۳-۳-۲-فلورو-بنزیل آمینو-۴,۲-ثانی هیدرو- اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليلوكسي (۵)-بروبانول (۱)	۴۴۴
۰,۰۲۵۲۶	۹۵	۳-۳-۲-مثیل-بنزیل آمینو-۴,۲-ثانی هیدرو- اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليلوكسي (۵)-بروبانول (۱)	۴۴۵
۰,۲۶۵۶	۹۳,۵	استر ثانی ائیل لحمض ۳-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو- ۷,۶-ثانی مئوكسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليل (۱)-فسفونيك	۴۴۶
	۷	ثانی مئیل امید لحمض ۳-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو- ۷,۶-ثانی مئوكسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازول (۱)-كبريتونيك	۴۴۷
۰,۰۰۱۷۶۷	۱۰۰	۳-۳-۶,۲-ثانی كلورو-بنزیل آمینو-۷-مئوكسي- ۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بيرازوليلوكسي (۶)-بروبانول (۱)	۴۴۸

۰,۰۰۴۰۹۸	۹۸,۵	۳-۳-۶,۲-ثاني فلورو-بنزىل أمينو-۷-مٹوكسى- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱-ج] بيرازوليلوكسى (۶)-بروبانول (۱)	۴۴۹
۰,۰۰۰۹۳۸۲	۱۰۰	۳-۳-۶,۲-ثاني كلورو-بنزىل أمينو-۷-مٹوكسى- ۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱-ج] بيرازوليلوكسى (۶)-بروبان-۲,۱-ديول	۴۵۰
۰,۰۰۲۰۰۴	۹۹,۵	۳-۳-۲-كلورو-بنزىل أمينو-۷-مٹوكسى-۴,۲- ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱-ج] بيرازوليلوكسى (۶)- بروبان-۲,۱-ديول	۴۵۱
۱,۰۹۶	۷۲	N1-۷,۶-ثاني مٹوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱-ج] بيرازوليل (۳)-۴-مٹيل-N3-۴- بيريدينيل (۳)-بيريميدينيل (۲)-بنزين-۳,۱-ثاني امين	۴۵۲
۰,۸۲۹۴	۸۸	۷,۶-ثاني مٹوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱- ج] بيرازوليل (۳)-۴-مٹوكسى-بيريدينيل (۳)- امين	۴۵۳
۰,۲۵۷۹	۹۹	۷,۶-ثاني مٹوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱- ج] بيرازوليل (۳)-۴,۲-ثاني مٹوكسى-بيريدينيل (۳)-امين	۴۵۴
۰,۱۵۳۲	۹۵	۷,۶-ثاني مٹوكسى-۴,۲-ثاني هيدرو-اندينو [ج-۲,۱- ج] بيرازوليل (۳)-۵-فيل-ايزوكسازوليل (۳) مٹيل-امين	۴۵۵

٠,٠٠٣٤١٤	١٠٠	٣-٣-٦,٢-ثاني فلورو-بنزيل أمينو-٧-مئوكسي- ٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [١,٢-ج-] بيرازوليلوكسي ٦-[[١-] بروبان-٢,١-ديول	٤٥٧
٦,٩٩٨	٧٠,٥	٣-٣-٣-فلورو-فنيل أمينو-٧,٦-ثاني مئوكسي-H٤- اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (١)-[[١-] مئوكسي فنيل-ميثانون	٤٥٨
٠,٠٣٦٥٤	١٠٠	استر اثيل لحمض ٣-٣-٣-فلورو-فنيل أمينو- ٧,٦-ثاني مئوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ١-[[١-] أكسو-بروبيونيك	٤٥٩
٠,٠٠٤٢٧	٩٧,٥	١-٦-اثوكسي-٣-٣-٣-فلورو-فنيل أمينو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليلوكسي (٧)-[[٧-] ٣- بيروليدينيل (١)-بروبانول (٢)	٤٦٠
٠,٠٠٧٥٥٢	٩٧,٥	١-٦-اثوكسي-٣-٣-٣-بيروليدينيل (٣) أمينو-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليلوكسي (٧)-[[٧-] ٣- بيروليدينيل (١)-بروبانول (٢)	٤٦١
٠,٠٠٢١٥	٩٩	١-٦-اثوكسي-٣-٣-٣-مئوكسي-فنيل أمينو-٤,٢- ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليلوكسي (٧)-[[٧-] ٣- بيروليدينيل (١)-بروبانول (٢)	٤٦٢
٠,٠١٠٩٥	٩٨,٥	١-٦-اثوكسي-٣-٣-٣-اثوكسي-فنيل أمينو-٤,٢- ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليلوكسي (٧)-[[٧-] ٣- بيروليدينيل (١)-بروبانول (٢)	٤٦٣
٠,٢٤٤٦	٩٢	استر مئيل لحمض ٥-٣-٣-٣-فلورو-فنيل أمينو- ٧,٦-ثاني مئوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ١-[[١-] أكسو-بنتانويك	٤٦٤

٠,٠٠٦٧٢٨	٩٦	١-٣-٣-فلورو-فنىل أمينو-٧,٦-ثانى مٲوكسى- H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازولىل (١)-٢-مٲوكسى- اينٲانون	٤٦٥
٠,٠٣١١٣	٩٦	حمض ٤-٣-٣-فلورو-فنىل أمينو-٧,٦-ثانى مٲوكسى-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازولىل (١)-٤- أكسو-بيوتيريك	٤٦٦
٠,٠١٧٦٣	٩٦,٥	استر ٢-٣-٣-فلورو-فنىل أمينو-٧,٦-ثانى مٲوكسى-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازولىل (١)-٢- أكسو-اٲىل لحمض أسيتيك	٤٦٧
٠,٠٤٧٨٤	٩٥,٥	٣-٣-٣-برومو-فنىل أمينو-٤,٢-ثانى هيدرو- اندينو [٢,١-ج] بيرازولىلوكسى (٥)-بروبان- ٢,١-ديول	٤٦٨
٠,١٥٩٨	٩٦	٣-٣-٣-فلورو-فنىل أمينو-٤,٢-ثانى هيدرو- اندينو [٢,١-ج] بيرازولىلوكسى (٥)-بروبان- ٢,١-ديول	٤٦٩
٠,١٩٧	٩٦	استر ٢-بنزيلوكسى-اٲىل لحمض ٣-٣-فلورو-فنىل أمينو-٧,٦-ثانى مٲوكسى-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول-١-كربوكسيليك	٤٧٠
٠,١٣٤٧	٩٠,٥	استر ٢-٢-٢-هيدروكسى-اٲوكسى)-اٲوكسى]-اٲىل لحمض ٣-٣-فلورو-فنىل أمينو-٧,٦-ثانى مٲوكسى-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول-١- كربوكسيليك	٤٧١

٤٧٢	(٦،٧-ثاني مٹوكسي-١-مٹوكسي مئيل-٤،١-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-جـ] بيرازوليل ((٣)-٣)-فلورو-فنيل)-امين	٣٥	
٤٧٣	استر ٢-[٣]-٣-(فلورو-فنيل امينو)-٧،٦-ثاني مٹوكسي-H٤-اندينو [٢،١-جـ] بيرازوليل ((١)-٢-اكسو-اثير لحمض مٹوكسي اسيتيك	٩٨،٥	٠،٠٠٨٩٦٢
٤٧٤	استر ٢-[٣]-٣-(فلورو-فنيل امينو)-٧،٦-ثاني مٹوكسي-H٤-اندينو [٢،١-جـ] بيرازوليل ((١)-٢-اكسو-اثير لحمض ايزوبيوتيريك	٩١،٥	٠،٠٦٣٤٢
٤٧٥	(٦،٧-ثاني مٹوكسي-٢-مٹوكسي مئيل-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-جـ] بيرازوليل ((٣)-٣)-فلورو-فنيل)-امين	٦٥،٥	٥،٠٣٥
٤٧٦	(٢،٦-ثاني فلورو-فنيل)-(٦،٧-ثاني مٹوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-جـ] بيرازوليل ((٣)-امين	٨٨،٥	٠،٢٤٩٥
٤٧٧	(٦،٧-ثاني مٹوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-جـ] بيرازوليل ((٣)-٦،٤،٢-٣)-تالوث فلورو-فنيل)-امين	٩٥	٠،٢٢٩٣
٤٧٨	(٣-برومو-فنيل)-[٥]-٢-بيروليدينيل (١)-اثوكسي)-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-جـ] بيرازوليل ((٣)-امين	٩٣،٥	٠،١٦١٧
٤٧٩	٣-[٣]-٦،٢-ثاني كلورو-بنزيل امينو)-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-جـ] بيرازوليلوكسي ((٥)-بروبان-٢،١-بيول	٩٤،٥	٠،٦٢٣٨

٤٨٠	(٦،٢-ثاني فلورو-فنيل)-(٣-٣)-(٣-فلورو-فنيل أمينو)- ٧،٦-ثاني مٹوكسي-H٤-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل [(١)-ميٹانون]	٨	
٤٨١	(٢-فلورو-فنيل)-(٣-٣)-(٣-فلورو-فنيل أمينو)-٧،٦- ثاني مٹوكسي-H٤-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل [(١)-ميٹانون]	٥٩	٣,٧٦٤
٤٨٢	(٣-برومو-فنيل)-(٤-اثيل-٧،٦-ثاني مٹوكسي)- ٤،١-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل ((٣))- امين	١٠٠	٠,٣٨٦٣
٤٨٣	(٣-برومو-فنيل)-(٤-اثيل-٧،٦-ثاني مٹوكسي)- ٤،١-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل ((٣))- امين	٧٨,٥	٤,٩٧
٤٨٤	١-(٣-٣)-(٣-فلورو-فنيل أمينو)-٧،٦-ثاني مٹوكسي- H٤-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل [(١)]-برويانون (٢)	٨٧	٠,٢١٨
٤٨٥	(٣-برومو-فنيل)-(٧،٦-ثاني مٹوكسي-٤،٤-ثاني مٹيل-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل ((٣))-امين	٣٢	٥٩,٠٣
٤٨٦	(٣-كلورو-فنيل)-(٧،٦-ثاني مٹوكسي-٤،٤-ثاني مٹيل-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل ((٣))-امين	٣٤,٥	١٥,٧٦
٤٨٧	(٧،٦-ثاني مٹوكسي-٤،٤-ثاني مٹيل-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل ((٣))-(٣)- فلورو-فنيل)-امين	٤٣	٣٧,٤٧

٣٩,٢٩	٣٣,٥	(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٤-ثاني مٲيل-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٣)- مٲوكسي-فنييل)-أمين	٤٨٨
	٢٥,٥	(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٤-ثاني مٲيل-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٣)- اٲوكسي-فنييل)-أمين	٤٨٩
٠,٠٢٨٥	٩٦	استر ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٦,٧-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (١) مٲيل لحمض بيوتيريك	٤٩٠
٠,٣١٤٢	٩٢	استر ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٢) مٲيل لحمض بيوتيريك	٤٩١
٠,٤٧١٦	٧٨	(٤-فلورو-فنييل)-[٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (١)-ميٲانول	٤٩٢
١,٥٤١	٨٣	(٤-كلورو-فنييل)-[٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (١)-ميٲانول	٤٩٤
٠,٠١٣٦	٨٨,٥	استر ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (١) مٲيل لحمض أسيتيك	٤٩٦
٠,٠٧٧٧٤	٩٧	استر ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٢) مٲيل لحمض أسيتيك	٤٩٧

۸,۳۲۶	۵۱,۵	استر ۴- [۳- (۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷,۶-ثانی متوکسی- H_4 -اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۱) مثیل-فنیل لحمض أسيتيك	۴۹۸
۱,۷۴۳	۸۷	استر ۴- [۳- (۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷,۶-ثانی متوکسی- H_4 -اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۲) مثیل-فنیل لحمض أسيتيك	۴۹۹
۰,۴۹۲۳	۸۰,۵	استر ۴-فلورو فنیل لحمض ۳- (۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷,۶-ثانی متوکسی- H_4 -اندينو [۲,۱-ج-] بیرازول-۱-کربوکسیلیک	۵۰۰
۰,۰۹۵۹۸	۹۰	استر ۴-کلورو-فنیل لحمض ۳- (۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷,۶-ثانی متوکسی- H_4 -اندينو [۲,۱-ج-] بیرازول-۱-کربوکسیلیک	۵۰۱
۵۴,۰۲	۶۰,۵	۱- [۳- (۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷,۶-ثانی متوکسی- H_4 -اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۱)]-بروبانول (۲)	۵۰۲
۰,۰۴۵۰۹	۱۰۳	استر ۴-فلورو فنیل لحمض ۳- (۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷,۶-ثانی متوکسی- H_4 -اندينو [۲,۱-ج-] بیرازول-۲-کربوکسیلیک	۵۰۳
۰,۱۴۱۹	۱۰۱	(۷,۶-ثانی اتوکسی-۴-مثیل-۴,۲-ثانی هیدرو- اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳))- (۳-اتوکسی- فنیل)-آمین	۵۰۴
۰,۱۳۴	۹۷	(۳-اتوکسی-فنیل)- (۴-اتیل-۷,۶-ثانی متوکسی- ۴,۲-ثانی هیدرو-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل (۳))- آمین	۵۰۵

٥٠٦	٩٧	٠,٠٢٩٤	مثيل أميد لحمض ٥-٣-٣-فلورو-فنييل أمينو- ٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل ١-[[١)]-أكسو-بنتانويك
٥٠٩	٣٠,٥		استر مثيل لحمض ٣-٣-٣-فلورو-فنييل أمينو-٧,٦- ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل ١-[[١)]-أسيتيك
٥١٠	٥٧	٢٦,٦٢	استر ائيل لحمض ٣-٣-٣-فلورو-فنييل أمينو-٧,٦- ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل ٢-[[٢)]-أسيتيك
٥١١	٥١	١٢,٥٢	استر ائيل لحمض ٣-٣-٣-فلورو-فنييل أمينو-٧,٦- ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل ١-[[١)]-أسيتيك
٥١٢	٩٢	٠,١٨٣٤	٤-ائيل-٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو- اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل (٣)-٣-مٲوكسي- فنييل)-أمين
٥١٣	٨٦	٠,٧٧٢٦	٢-كلورو-فنييل استر لحمض ٣-٣-٣-فلورو-فنييل أمينو-٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول-١-كربوكسيليك
٥١٤	٨٥	٠,٢٤	١-٣-٣-٣-برومو-فنييل أمينو-٤-ائيل-٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل (١)-٢- مٲوكسي-ايتانول
٥١٥	٩٠	٠,١٣٥٧	١-٣-٣-٣-برومو-فنييل أمينو-٤-ائيل-٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل (٢)-٢- مٲوكسي-ايتانول

۱۰,۰۴	۶۸,۵	(۲-آمینو-اتیل)-آمید لحمض ۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷,۶-ثاني مٹوکسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازول-۱-کربوکسیلیک	۵۱۶
۱,۷۹۳	۷۵,۵	(۲-ثاني مٹیل آمینو-اتیل)-آمید لحمض ۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷,۶-ثاني مٹوکسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازول-۱-کربوکسیلیک	۵۱۷
۰,۱۸۳۸	۹۲,۵	۲-بنزیلوکسي-۱-(۳-۳-برومو-فنیل آمینو)-۴-اتیل-۷,۶-ثاني مٹوکسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۲)-ایٹانون	۵۱۸
۰,۱۳۹	۹۷,۵	۲-بنزیلوکسي-۱-(۳-۳-برومو-فنیل آمینو)-۴-اتیل-۷,۶-ثاني مٹوکسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازولیل ((۱)-ایٹانون	۵۱۹
۰,۰۶۵۲۵	۱۰۰	(۲-بیرولیدینیل (۱)-اتیل)-آمید لحمض ۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷,۶-ثاني مٹوکسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازول-۱-کربوکسیلیک	۵۲۰
۰,۰۵۵۸۷	۹۷	(۲-مورفولینیل (۴)-اتیل)-آمید لحمض ۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷,۶-ثاني مٹوکسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازول-۱-کربوکسیلیک	۵۲۱
۰,۷۹۰۹	۹۴	(۲-مورفولینیل (۴)-اتیل)-آمید لحمض ۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷,۶-ثاني مٹوکسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازول-۲-کربوکسیلیک	۵۲۲
۰,۱۹۲۷	۹۸,۵	[۲-(۲-هیدروکسي-اتیل آمینو)-اتیل]-آمید لحمض ۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷,۶-ثاني مٹوکسي-H۴-اندينو [۲,۱-ج-] بیرازول-۱-کربوکسیلیک	۵۲۳

٥٢٤	(٢-مئيل أمينو-اثيرل)-أميد لحمض ٣-(٣-فلورو-فنيل أمينو)-٧،٦-ثاني مئوكسي-H٤-اندينو [٢،١-ج-] بيرازول-١-كربوكسيليك	٧٨	٢,٤٨٢
٥٢٥	(٢-أيزوبيوتيريل أمينو-اثيرل)-أميد لحمض ٣-(٣-فلورو-فنيل أمينو)-٧،٦-ثاني مئوكسي-H٤-اندينو [٢،١-ج-] بيرازول-١-كربوكسيليك	٣٣	٤٣,١٦
٥٢٦	(٢-أسيتيل أمينو-اثيرل)-أميد لحمض ٣-(٣-فلورو-فنيل أمينو)-٧،٦-ثاني مئوكسي-H٤-اندينو [٢،١-ج-] بيرازول-١-كربوكسيليك	٧٣	٨,٠٩١
٥٢٧	استر ٢-[[٣-(٣-فلورو-فنيل أمينو)-٧،٦-ثاني مئوكسي-H٤-اندينو [٢،١-ج-] بيرازول-١-كربونيل]-أمينو]-اثيرل لحمض ٢-مئيل-أكربليك	٤٦,٥	١٧,٤٧
٥٢٨	استر ٢-[[٣-(٣-فلورو-فنيل أمينو)-٧،٦-ثاني مئوكسي-H٤-اندينو [٢،١-ج-] بيرازول-٢-كربونيل]-أمينو]-اثيرل لحمض ٢-مئيل-أكربليك	٩٣,٥	٠,١٩٦
٥٢٩	حمض ٦-[[٣-(٣-فلورو-فنيل أمينو)-٧،٦-ثاني مئوكسي-H٤-اندينو [٢،١-ج-] بيرازوليل (٢)-٥،٤،٣-ثالث هيدروكسي-رابع هيدرو-بيران-٢-كربوكسيليك	٤٤	١٠,٦٤
٥٣٠	استر مئيل لحمض ٢-[[٣-(٣-فلورو-فنيل أمينو)-٧،٦-ثاني مئوكسي-H٤-اندينو [٢،١-ج-] بيرازول-١-كربونيل]-أمينو]-٣-مئيل بيوتيريك	٧١,٥	٤,١٥١

٥٣١	٤-٣-٣-فلورو-فنييل آمينو-٧،٦-ثاني مټوكسي- H٤-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل (١)-٤-أكسو- بيوتيراميد	٩٠	٠,٠٢٤٠٤
٥٣٢	٢-بنزويل آمينو-اټيل-أميد لحمض ٣-٣-فلورو- فنييل آمينو-٧،٦-ثاني مټوكسي-H٤-اندينو [٢،١- ج] بيرازول-١-كربوكسيليك	٤٢	
٥٣٤	٢-٣-٣-فلورو-فنييل آمينو-٧،٦-ثاني مټوكسي- H٤-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل (١)-أسيتاميد	٩٤	٠,٩٣٣٢
٥٣٥	١-٣-٣-فلورو-فنييل آمينو-٧،٦-ثاني مټوكسي- H٤-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل (٢)-٣- بيروليدينيل (١)-بروبان-٣،١-ديون	١٠٥	٠,٠٣٢٢٤
٥٣٦	١-٣-٣-فلورو-فنييل آمينو-٧،٦-ثاني مټوكسي- H٤-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل (١)-٣- بيروليدينيل (١)-بروبان-٣،١-ديون	٨٨	٠,٤٣٦٢
٥٣٧	N,N-ثاني اټيل-٣-٣-٣-فلورو-فنييل آمينو- ٧،٦-ثاني مټوكسي-H٤-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل (١)-٣-أكسو-بروبيوناميد	١٠٤	٠,٣٣٠٣
٥٣٨	٣-برومو-فنييل-٤-أيزوبروبيل-٧،٦-ثاني مټوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل (٣)-أمين	٦٥	
٥٤٠	٣-كلورو-فنييل-٤-أيزوبروبيل-٧،٦-ثاني مټوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢،١-ج] بيرازوليل (٣)-أمين	٤٧	١٤,٦٨

٤٤,٢٢	٥٠	(٤-أيزوبروبيل-٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (٣)-٣- مٲوكسي-فنييل)-أمين	٥٤١
	٢١	[٢-٢-هيدروكسي-بنزويل أمينو)-اٲيل]-أميد لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج-] بيرازول-١-كربوكسيليك	٥٤٢
	٦٠	{٢-٢-٢-هيدروكسي-اٲوكسي)-اٲوكسي]-اٲيل}-أميد ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٦,٧-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج-] بيرازول-١-كربوكسيليك	٥٤٤
	٧٢,٥	[٣-٣-برومو-فنييل أمينو)-٤-اٲيل-٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل (١)-فنييل-ميٲانول	٥٤٦
	٦٨,٥	استر ٢-٢-٢-هيدروكسي-اٲوكسي)-اٲوكسي]-اٲيل لحمض ٣-(٣-برومو-فنييل أمينو)-٤-اٲيل-٧,٦-ثاني مٲوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج-] بيرازول-١-كربوكسيليك	٥٤٧
٠,٢١٤٤	٨٢,٥	استر ٢-٢-٢-هيدروكسي-اٲوكسي)-اٲوكسي]-اٲيل لحمض ٣-(٣-برومو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤-مٲيل-H٤-اندينو [٢,١-ج-] بيرازول-١-كربوكسيليك	٥٤٨
٠,٠٩١١٤	١٠٦	(٧-بنزيلوكسي-٦-مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [١,٢-ج-] بيرازوليل (٣)-٣-فلورو-فنييل)-أمين	٥٤٩

٠,٠٠٦٥٠١	٩٩,٥	(٣-برومو-فنيل)-(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤-مٲيل-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-امين	٥٥٣
٠,٠٢٠٨	١٠٢	(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤-مٲيل-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-٣-اٲوكسي-فنيل)-(امين	٥٥٤
٠,٠٢٠٩٤	٩٧,٥	(٣-برومو-فنيل)-(٤-اٲيل-٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-امين	٥٥٥
٠,٠١٠٤	٩٨	(٣-اٲوكسي-فنيل)-(٤-اٲيل-٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-امين	٥٥٦
٠,٠٣٢٤٨	١٠١,٥	N-(٣-٣-فلورو-فنيل امينو)-(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٥)-اسيتاميد	٥٥٧
٠,٠١٢١٤	١٠٢	N3-(٣-٣-فلورو-فنيل)-(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازول-٥,٣-ثاني امين	٥٥٨
٠,٠٣٧٠٦	١٠٢	(٢-كلورو-بيريدينيل ((٣)-٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤-مٲيل-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج-] بيرازوليل ((٣)-امين	٥٥٩
٠,٠٢٤٧١	١٠٢	(٤-مٲوكسي-٢-مٲيل-٩,٦-ثاني هيدرو-٣-اكسا-٧,٦,١-تريازا-حلقى بنتا [ب]-as-انداسينيل ((٨)-٣-مٲوكسي-فنيل)-(امين	٥٦٠

٠,٠٨٣٩٩	٩٣,٥	(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- جـ] بيرازوليل ((٣)-بيريدينيل (٢)-أمين	٥٦٢
١,٤٤٩	٨٩	(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- جـ] بيرازوليل ((٣)-بيريدينيل (٢) مٲيل-أمين	٥٦٣
٠,٨٨٦٤	٩٩,٥	(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- جـ] بيرازوليل ((٣)-بيريدينيل (٣) مٲيل-أمين	٥٦٤
	٤١,٥	(٢,٢-ثاني فلورو-بنزو [٣,١] ديوكسوليل ((٤)- (٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- جـ] بيرازوليل ((٣)-أمين	٥٦٥
	٥٤	٣-(٣,٢-ثاني هيدرو-اندوليل ((١)-٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازول	٥٦٦
	٣٩,٥	٣-(٥-برومو-٣,٢-ثاني هيدرو-اندوليل ((١)-٧,٦- ثاني مٲوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازول	٥٦٧
٠,٧٩٠٤	٧٨	(٣-برومو-فنيل)-(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤-مٲيل- ٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل ((٣)- أمين	٥٦٨
٥,٠٩٨	٦٤	(٧,٦-ثاني مٲوكسي-٤-مٲيل-٤,٢-ثاني هيدرو- اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل ((٣)-(٣-اثوكسي- فنيل)-أمين	٥٦٩
٢,٠٤٨	٧٧,٥	(٣-برومو-فنيل)-(٤-اثيل-٧,٦-ثاني مٲوكسي- ٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-جـ] بيرازوليل ((٣)- أمين	٥٧٠

٣,٨٨٦	٦٦	(٣-اٲوكسي-فٲيل)-(٤-اٲيل-٧,٦-ٲائي مٲوكسي- ٤,٢-ٲائي هيدرو-اندينو [ج-٢,١] بيرازوليل ((٣)- أمين	٥٧١
٧,٣٣٢	٦٧	٢-٣-٣-فلورو-فٲيل أمينو)-(٧,٦-ٲائي مٲوكسي- H٤-اندينو [ج-٢,١] بيرازوليل ((١)-ايتانول	٥٧٢
	٥٢	٢-٣-٣-فلورو-فٲيل أمينو)-(٧,٦-ٲائي مٲوكسي- H٤-اندينو [ج-٢,١] بيرازوليل ((٢)-ايتانول	٥٧٣
٠,١٦٣	٩٩	(٢-فلورو-بنزيل)-(٤-مٲوكسي-٢-مٲيل-٩,٦-ٲائي هيدرو-٣-أكسا-٧,٦,١-ٲريازا-حلقلي بنتا [ب]-as- انداسينيل ((٨)-أمين	٥٧٤
٠,٠٠٢١٢٩	٩٩,٥	(٢-برومو-بنزيل)-(٧,٦-ٲائي مٲوكسي-٤,٢-ٲائي هيدرو-اندينو [ج-٢,١] بيرازوليل ((٣)-أمين	٥٧٥
٣٣,٣٣	١٨	(٥-برومو-٣-مٲيل-بيريدينيل ((٢)-٧,٦-ٲائي مٲوكسي-٤,٢-ٲائي هيدرو-اندينو [ج-٢,١] بيرازوليل ((٣)-أمين	٥٧٦
٣٦١,٥	١٩	(٧,٦-ٲائي مٲوكسي-٤,٢-ٲائي هيدرو-اندينو [ج-٢,١] [ج-بيرازوليل ((٣)-٤-ٲالث فلورو مٲيل-بيريدينيل ((٣)-أمين	٥٧٧
٤,٠٢٣	٨٠	مٲيل أميد لحمض ٣-٣-فلورو-فٲيل أمينو)-(٧,٦- ٲائي مٲوكسي-H٤-اندينو [ج-٢,١] بيرازول-١- كربوكسيليك	٥٧٨
	٢٨	مٲيل أميد لحمض ٣-٣-فلورو-فٲيل أمينو)-(٧,٦- ٲائي مٲوكسي-H٤-اندينو [ج-١,٢] بيرازول-٢- كربوكسيليك	٥٧٩

٥٨٠	٩٣	٠,١٢٥٥	مثيل أميد لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦- ثاني مئوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول-٢- كربوئيونيڪ
٥٨١	٩٠,٥	١,١٣٩	مثيل أميد لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦- ثاني مئوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول-١- كربوئيونيڪ
٥٨٢	٨٢,٥	١,٢٤٧	(٣-برومو-بيريدينييل (٢))-٧,٦-ثاني مئوكسي- ٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج] بيرازولييل (٣)- أمين
٥٨٣	٨٢	١,١٠١	(٥-برومو-بيريدينييل (٢))-٧,٦-ثاني مئوكسي- ٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج] بيرازولييل (٣)- أمين
٥٨٤	١٠٩	٠,٠١١١٣	(٧,٦-ثاني مئوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- ج] بيرازولييل (٣))-٣-ايزوبروبوكسي-فنييل)-أمين
٥٨٥	١٠١,٥	٠,٤٢٨٧	(٦,٢-ثاني كلورو-بنزيل)-(٤-اثيل-٧,٦-ثاني مئوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج] بيرازولييل (٣))-أمين
٥٨٦	١٠٠,٥	٠,٠٢٧٧٦	(٦,٢-ثاني كلورو-بنزيل)-(٧,٦-ثاني مئوكسي-٤- مثيل-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج] بيرازولييل (٣))-أمين
٥٨٧	٨٦	١,٧٠٤	(٧,٦-ثاني مئوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١- ج] بيرازولييل (٣))-٣-مثيل-بيريدينييل (٢))-أمين

٥٨٨	٧،٦-ثاني مٹوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢٠١]- جـ] بيرازوليل ((٣))-٦،٤-ثاني مثيل بيريدينيل ((٢)) أمين	١٠٣	٠،٥٥٦٤
٥٩١	حمض ٦-[٧،٦-ثاني مٹوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو- اندينو [٢٠١]-جـ] بيرازوليل ((٣))-٣-فلورو-فنييل)- أمينو]-٥،٤،٣-ثالث هيدروكسي-رابع هيدرو-بيران- ٢-كربوكسيليك	٩٦	٠،٦٦٢٣
٥٩٤	٧،٦-ثاني اٹوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢٠١]- جـ] بيرازوليل ((٣))-٣-فلورو-فنييل)-امين	٦٤	٠،٠١٥٦
٥٩٥	(٧-مٹوكسي-H٢-٨-اكسا-٣،٢-ديازا-حلقي بنتا [I]) اندينيل ((١))-فنييل-امين	٧١	٠،٠٢٤٨٨
٥٩٨	بنتاديسيل اميد لحمض ٣-(٣-فلورو فنييل امينو)- ٧،٦-ثاني مٹوكسي-H٤-اندينو [٢٠١]-جـ] بيرازول- ٢-كربوكسيليك	صفر	٩٨،٤٣
٦٠١	٣-(٧،٦-ثاني مٹوكسي-٤،٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢٠١]-جـ] بيرازوليل (٣) امينو)-N-٢]-٢)-(٢)- ٢]-٥)-(٢-أكسو-سادس هيدرو-ثيينو [٤،٣-د] ايميدازوليل ((٦))-بنتانويل امينو]-اٹوكسي{-اٹوكسي)- اٹوكسي]-اثيل{-بنز اميد	٨٩	٢،٢٩
٦٠٢	استر مثيل لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل امينو)-٧،٦- ثاني مٹوكسي-H٤-اندينو [٢٠١]-جـ] بيرازوليل ((٢))-اسيتيك	٤٠	

٢,١٢٧	٧٩,٥	{٢-٢-٢}-(٢-هيدروكسي-اثوكسي)-[اثيل]- أميد لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني مئوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازول-٢- كربوكسيليك	٦٠٤
٠,٠٠٥١	٩٧,٥	(٣-فلورو-فنييل)-(٤-مئوكسي-٢-مئيل-٩,٨-ثاني هيدرو-٣-أكسا-٧,٦,١-تريازا-حلقي بنتا [ب]-as- انداسينيل ((٨)-أمين	٦٠٥
	٥٣,٥	٨-بنزيل-٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٦-مئوكسي- ٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج] بيرازولول (٧)	٦٠٦
٠,٥٤٧٥	٧٨	(٢-كلورو-بيريدينيل ((٣)-٤-اثيل-٧,٦-ثاني مئوكسي-٤,٢-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل ((٣)-أمين	٦٠٧
٠,٠٢٥٩٦	١٠٦	٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٦-مئوكسي-٢,٤-ثاني هيدرو-اندينو [٢,١-ج] بيرازولول (٧)	٦٠٨
٤,٦٨٣	٨٤	(٧,٦-ثاني مئوكسي-١-مئيل-٤,١-ثاني هيدرو- اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل ((٣)-٣-فلورو-فنييل)- أمين	٦٠٩
٩,٣٧٧	٥١,٥	(٧,٦-ثاني مئوكسي-٢-مئيل-٤,١-ثاني هيدرو- اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل ((٣)-٣-فلورو-فنييل)- أمين	٦١٠
		حمض ٦-[٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٧,٦-ثاني مئوكسي-H٤-اندينو [٢,١-ج] بيرازوليل (١)- ٥,٤,٣-ثالث هيدروكسي-رابع هيدرو-بيران-٢- كربوكسيليك	٦١١

٢. تثبيط فعالية كيناز c-Abl

لقد أظهرت الدراسات السابقة أن مثبِّط انتقائي لكيناز PDGF-R وهو ST1-571 (المبين أعلاه) كان أيضاً عبارة عن مثبط انتقائي لفعالية كيناز c-Abl ولذلك كان مثبطاً انتقائياً لمنتج الجين الورمي Bcr-Abl (وللحصول على نظرة عامة عن التداخلات العلاجية في Bcr-Abl انظر ما جاء عن كندلر ومعاونيه في مجلة آراء الخبراء حول الخلايا المستهدفة العلاجية (أكسبيرت أوبنيون أف ثيرابيوتيك تارجيتس)، مجلد ٦، العدد (١): ص ٨٥-١٠١، ٢٠٠٢م). وقد يرافق أشكال مغايرة لـ Bcr-Abl أنواع متميزة من اللوكيميا البشرية، مثل لوكيميا مزمنة نخاعية المنشأ (CML)؛ لوكيميا حادة متعلقة بالخلايا الليمفية (ALL)؛ لوكيميا مزمنة ألفية الأصباغ المتعادلة (CNL)؛ لوكيميا حادة عديمة التمايز (AUL)؛ ولوكيميا حادة نخاعية المنشأ (AML) (انظر ما جاء عن أنجالي ومعاونيه في مجلة أبحاث اللوكيميا (لوكيميا ريسرتش)، مجلد ٢٦، العدد (٨): ص ٧١٣-٧٢٠، ٢٠٠٢م). ولقد تم اختبار فعالية تثبيط المركبات التي تقع ضمن نطاق الاختراع لفعالية كيناز c-Abl وفقاً للطريقة التالية.

المواد

١. محلول منظم للكيناز تركيزه ١٠ أضعاف [احتوى على تريس-HCl تركيزه ٥٠٠ ملي جزيئي ودرجة حموضته ٨، $MgCl_2$ تركيزه ١٠٠ ملي جزيئي، Na_3VO_4 تركيزه ١ ملي جزيئي].

٢. DTT تركيزه ١٠ ملي جزيئي [التركيز النهائي بلغ ١ ملي جزيئي].

٣. ATP تركيزه ١٠ ملي جزيئي [التركيز النهائي بلغ ٥ ميكرو جزيئي] (حصل عليه من شركة جيبكو (Gibco)، كتالوج رقم: 18330-019، مدينة كارلسباد، ولاية كاليفورنيا).

٤. ^{33}P - γ -ATP [كتالوج رقم: NEG-602H؛ بـ ٢٠٠٠-٣٠٠٠ كوري/ملي مول]، بمقدار ٢ ميكروكوري لكل عين باستخدام ١٠ ميكروكوري/ميكرو لتر (٠,٢ ميكرو لتر/عين).

٥. أنزيم Abl (حصل عليه من شركة نيو انجلاند بيولابس (New England Biolabs)، كتالوج رقم: P6050L، مدينة بفرلي، ولاية ماساشوستس) بمقدار ١٠٠ وحدة/ميكرو لتر باستخدام ١٠ وحدات/عين (٠,١ ميكرو لتر/عين).

٦. محلول منظم لتخفيف الأنزيم [احتوى على تريس-HCl تركيزه ٥٠ ملي جزيئي ودرجة حموضته ٨، BSA تركيزه ٠,١%].

٧. محلول الغسل/الإيقاف المنظم [احتوى على EDTA + PBS تركيزه ١٠٠ ملي جزيئي].

٨. ألواح ومضية من ستريتايفدين من شركة NEN (حصل عليها من نيو انجلاند نيوكليار (NEN)، كتالوج رقم: SMP-103، مدينة بوسطن، ولاية ماساشوستس).

٩. ركيزة ببتيد Abl (أميد-EAIYAAPFAKKK-بيوتين) بتركيز ١ ملي جزيئي في تريس-HCl تركيزه ٥٠ ملي جزيئي ودرجة حموضته ٨ (استخدام ١,٠ ميكرو جزيئي).

الطريقة

مزجت المواد المفاعلة أولاً وفقاً للنظام التالي:

لوح واحد (ميكرو لتر)	لكل عين (ميكرو لتر)	
١١٠٠	١٠	محلول منظم للكيناز تركيزه ١٠ أضعاف
١١٠٠	١٠	DTT تركيزه ١٠ ملي جزيئي
٥,٥	٠,٠٥	ATP بارد تركيزه ١٠ ملي جزيئي
١١	٠,١	ببتيد Abl تركيزه ١ ملي جزيئي
٢٢	٠,٢	$^{33}\text{P}-\gamma\text{-ATP}$ بمقدار ١٠ ميكروكوري/ميكرو لتر
٥٤٦٢	٤٩,٦٥	H_2O

١٠. ووزع مزيج التفاعل الموصوف أعلاه في كل عين من عيون لوح ومضي بمقدار ٧٠ ميكرو لتر/عين. ولاختبار تأثير مركب على فعالية كيناز Abl، أضيف مركب الاختبار بتركيز ثابت أو بتركيز مخفف بشكل متسلسل في DMSO تركيزه ١٠٠% إلى عيون مناسبة بمقدار ١ ميكرو لتر/عين.

وخفف أنزيم Abl في محلول منظم لتخفيف الأنزيم كما يلي:

٣٢٨٩ ميكرو لتر

محلول منظم لتخفيف الأنزيم

١١ ميكرو لتر

أنزيم Abl (١٠٠ وحدة/ميكرو لتر)

وبدا تفاعل الكيناز بإضافة ٣٠ ميكرو لتر من محلول أنزيم Abl مخفف إلى كل عين من عيون اللوح الومضي الذي يحتوي على ATP ساخن (بمقدار ٢ ميكروكوري/عين) وركيزة ببتيد Abl (بتركيز نهائي بلغ ١ ميكروجزيئي)، باستثناء عيون العمود ١٢، الصفيين (هـ) و (و)، حيث استخدمنا لحساب خلفية اللوح. ودُوم اللوح الومضي للمزج وحضن عند ٣٠° م لمدة ٦٠ دقيقة. ثم، طرح مزيج التفاعل وغسل اللوح الومضي ثلاث مرات باستخدام ٢٠٠ ميكرو لتر من محلول الغسل/الإيقاف المنظم. وبالتالي، ملئت كل عين من عيون اللوح الومضي بـ ٢٠٠ ميكرو لتر من محلول الغسل/الإيقاف المنظم. وقيس مقدار ^{33}P المحتجز في كل عين باستخدام باكارد توب كاونت بعد إحكام سد اللوح بمادة إحكام سد شفافة للوح.

وعندما عمل مركب اختبار على تثبيط فعالية كيناز Abl، احتوت العين التي تحتوي على مركب من هذا القبيل على ^{33}P بنسبة أقل بالمقارنة مع العين التي تخلو من المركب. وبإجراء اختبارات في ظروف المعايرة الموصوفة، أظهرت المركبات التي تقع ضمن نطاق الاختراع تأثيراً مثبطاً لفعالية كيناز c-Abl.

ولاختبار فعالية تثبيط مركبات الاختراع الراهن، قيس IC_{50} لمركب منفرد باستخدام الطريقة الموصوفة أعلاه. وكما استخدم في هذا البيان، يشير IC_{50} لفعالية كيناز c-Abl إلى تركيز مثبّط تقل عنده فعالية كيناز c-Abl إلى النصف بالمقارنة مع تفاعلات لا تحتوي على مثبّط. وتدرج قيم IC_{50} لفعالية كيناز c-Abl لمركبات نموذجية منفردة وفقاً للاختراع الراهن في الجدول ب.

الجدول ب. قيم تركيز المركبات المثبّط لفعالية كيناز c-Abl إلى النصف (قيم IC_{50})

رقم المركب	قيم IC_{50} (ميكروجزيئي)
٢	٠,٠١١
٨	٠,٦٩٤
١١	٠,١١٨

٠,٠٢٠	١٢
٠,١٧٣	١٣
٠,٠٣٨	١٤
٠,٠١٩	٢٢
٠,١٣٤	٢٦
٠,٠٠٥	٢٩
٠,٤٩١	٣٠
٠,٠٠٢	٣٢
٠,٠٦٤	٣٦
٠,٠٠٢	٣٨
٠,٠١٣	٣٩
٠,٠٧٨	٤١
٠,٠٠٧	٤٤
٠,٩٧١	٥٤
٠,٤١٩	٦٣
١,٠٢٩٠	٩٠
٠,٢٢٧	٩٧
٠,٣٨٦	١١٦
٠,٤٢٧	١١٨
٠,٥٢٤	١١٩
١,٢٦٠	١٢٢
١,٨٥٠	١٢٤
٠,٣١٣	١٢٨
١,٠٧٨٠	١٢٩

٢,٣٦٠	١٢٩
٠,٢٣٦	١٣٠
٠,٦٦٥	١٣٢
٠,٤٩٨	١٣٣
١,١٦٠	١٣٤
١,٤١٠	١٤٠
٠,٠٨٩	١٥٦
٠,٣٧١	١٥٧
١,٠٢٠	١٦٠
٠,٠٧٥	١٧٠
٠,٠٨٤	١٧٢
٠,٨٧٠	١٧٩
٠,٠٨٢	١٨٠
٠,٠٥٦	١٨١
٠,٠٩٣	١٨٢
٠,٦٦٦	١٨٥
١,٤٠٠	١٨٨
٠,٠٦٩	١٩٠
٠,٠٢٧	١٩٩
٠,٠٢٠	٢٠٠
٠,٢١٧	٢٠١
٢,٦٥٠	٢٠٢
٠,١٦٠	٢٠٣
٠,١٦٥	٢٠٤

٠,٣٢٨	٢٠٥
٠,٠٦٢	٢٠٧
٠,٠٠٩	٢٠٨
٠,٠٠٧	٢٠٩
٠,٤٣٩	٢١٨
٠,٢٤٥	٢٢٦
٠,٦٤١	٢٢٧
٠,٠٣٣	٢٤٧
٠,٠٣٥	٢٤٩
٠,٠٣٧٩٥	٢٥٣
٠,٠٥٥	٢٥٦
٠,٠١٣	٢٦٠
٠,٠٦٤	٢٦١
٠,٠٢٧	٢٦٢
٠,٥١٢	٢٦٣
٠,٠٨٥	٢٦٥
٠,٠١٥	٢٦٦
٠,٣٢٦	٢٦٧
٠,٠٢٠	٢٦٨
٠,١٠١	٢٦٩
٠,٠٣٦	٢٧٠
٠,٣٦٣	٢٨٠
١,٥٨٠	٢٨١
٠,٠٤٣	٢٨٢

٠,٣٤٠	٢٨٣
٠,٠٦٩	٢٨٤
٢,٩٥٠	٢٨٦
٣,٤٥٠	٢٨٧
٢,٤٠٠	٢٨٩
٠,٠٠١	٢٩٢
٠,١٩٨	٢٩٩
٠,٨٢٢	٣٠٩
١,٤٧١	٣١٠
٠,٠٩١	٣٣٠
٣,٣٠٠	٣٣٤
٢,٧٤٢	٣٣٧
٢,١٨٠	٣٣٩
٠,٣٥٠	٣٤١
٠,٠١١	٣٤٨
٠,٣٣٨	٣٥٨
٠,١٤٣	٣٥٩
٠,٠٧٧	٣٦٠
٠,٠٤٣	٣٦١
٠,٠٠١	٣٦٣
٠,٠٤٧	٣٦٩
٠,٠٠٦	٣٧٠
٠,٩٠٥	٣٧١
٠,٠١٠	٣٧٣

٠,٠٥١	٣٧٤
٠,٠٦٠	٣٧٦
٠,٠١٤	٣٧٩
٠,٣٢٧	٣٨٠
١,٤٩٦	٣٨١
٠,٠١٩	٣٨٢
٠,١٨٣	٣٨٣
٠,٠٠٤	٣٨٤
٠,٠١٢	٣٨٥
٠,٠٢٠	٣٨٦
٠,٠٤٦	٣٨٨
٠,٠١٧	٣٨٩
صفر	٣٩٠
٠,٠١٤	٣٩١
٠,٠٠٢	٣٩٦
٠,٠١٠	٣٩٨
٠,٠٠٥	٤٠٠
٠,٠١٤	٤٠١
٠,٢١٩	٤١٥
٠,٢٩٢	٤١٩
٠,٣٣٥	٤٢٠
٣,٠٧٨	٤٢٢
٠,٠٩٦	٤٣٢
٠,٠٠٣	٤٤٨

٠,٠٢٣	٤٤٩
٠,٠٠٤	٤٥٧
٠,٠٧٠	٤٥٩
٠,٠٠٤	٤٦٠
٠,٣٣٧	٤٦١
صفر	٤٦٢
٠,٠٠٨	٤٦٣
٠,٠٥١	٤٦٥
٠,١٩١	٤٦٦
٠,٢٤٤	٤٦٧
٠,٦٠٣	٤٦٨
٠,٠٢٧	٤٦٩
٠,٠٣٨	٤٩٠
٠,٤٦٠	٥٩٥

٣. معايير مضادة لتكاثر الخلايا

بالإضافة إلى المعايير التي تخلو من الخلايا المذكورة أعلاه، قيسست الفعاليات الحيوية للمركبات وفقاً للاختراع أيضاً في معايير أساسها خلايا. وتتمثل معايرة من هذا القبيل في قياس تأثير المركب على تكاثر الخلايا في وجود أو عدم وجود تنبيه لـ PDGF في أنواع مختلفة من الخلايا. ٥

٣.١. تأثير مضاد لتكاثر الخلايا في خلايا سوية في وجود تنبيه لـ PDGF

تم اختبار تأثير المركبات وفقاً للاختراع على تكاثر الخلايا في خلايا أولية بشرية سوية، وبصفة خاصة، خلايا عضلة ملساء لشريان تاجي بشري محفوظ في ظروف قريّة (HCASMC)، في وجود تنبيه لـ PDGF على أساس دمج ثيميدين- ^{14}C في دنا (الحمض النووي الريبوزي منقوص الأكسجين) الخلايا. ١٠

المواد

تم شراء المواد التالية من مصادرها المعنية:

ديمر متجانس بيتا PDGF بشري مأشوب، rhPDGF-BB (يشار إليه فيما يلي في هذا البيان بـ "PDGF-BB" يشتري من شركة آر أند دي سيسستم (R & D System) (في مدينة مينيابوليس، ولاية مينيسوتا، كتالوج رقم: 220-BB)؛ خلايا عضلة ملساء لشريان تاجي بشري محفوظ في ظروف قرية (HCASMC)، وسط زراعة أنسجة لـ HCASMC، وإضافات لنمو عضلة ملساء (SMGS) تشتري من شركة كسكيد بيولوجكس (Cascade Biologics) (مدينة بورتلند، ولاية أوريجون، كتالوج رقم: C-017-5C لـ HCASMC؛ الوسط ٢٣١، كتالوج رقم: M-231-500 و SMGS كتالوج رقم: S-007-25)؛ ألواح دقيقة وماضة معالجة بمزرعة نسيجية سيتوستار (SytoStar) بها ٩٦ عيناً تشتري من شركة أميرشام (Amersham) (مدينة بسكاتاواي، ولاية نيويورك، كتالوج رقم: RPNQ0160؛ ثيميدين-¹⁴C مثل بتركيز ٥٦ ملي كوري/ملي مول (٢٥٠ ميكروكوري/٢,٥ مل) يشتري من شركة NEN (كتالوج رقم: NEC568)؛ DMSO من شركة سيجما (Sigma) (مدينة سانت لويس، ولاية ميسوري، كتالوج رقم: D-5879)؛ خزانات معقمة للمواد المفاعلة من شركة كوستار (Costar) (من شركة في دبليو آر انترناشيونال، انك. (VWR International, Inc.) مدينة وست شستر، ولاية بنسلفانيا، كتالوج رقم: 4870)؛ محلول PBS لدليكو من شركة جيبكو (كتالوج رقم: 14190-136)؛ غطاء من لوح أبيض لشريط دعم للجزء السفلي للوح سيتوستار من باكارد (كتالوج رقم: 6005199).

الطريقة

بنرت HCASMC بمقدار ٤٠٠٠ خلية/عين تقريباً في حجم بلغ ١٠٠ ميكرو لتر من الوسط ٢٣١ الكامل باستخدام SMGS. وزرعت الخلايا لمدة ٤٨ ساعة حتى بلغت نسبة الالتقاء ٨٠%. ثم جعلت ساكنة في الوسط ٢٣١ الذي يخلو من SMGS لمدة ٢٤ ساعة. وزودت أوساط الخلية مجدداً بالوسط ٢٣١ الخالي من SMGS والمحتوي على PDGF-BB بتركيز يبلغ ٥٠ نانوجم/مل في حجم كلي بلغ ١٠٠ ميكرو لتر/عين؛ وأضيف ١ ميكرو لتر من مركبات الاختبار بتراكيز مخففة بشكل متسلسل في DMSO تركيزه ١٠٠% إلى كل عين. وبالنسبة للعيون الضابطة حيث حدث أقصى نمو، أضيف فقط ١ ميكرو لتر من DMSO تركيزه

١٠٠%، وبالنسبة للعيون (الغفل) حيث حدث أدنى نمو، أضيف ١ ميكرو لتر من هكسيميد حلقي تركيزه ١٠ ملي جزيئي إلى كل عين. وبعد ٢٤ ساعة من الحضانة، أضيف ٢٠ ميكرو لتر من مزيج ثيميدين- ^{14}C إلى كل عين وحضر مزيج ثيميدين- ^{14}C وفقاً للنظام التالي:

المادة المفاعلة:	لوح واحد (ميكرو لتر)	عين واحدة (ميكرو لتر)
ثيميدين- ^{14}C	٢٢٠	٢
وسط ٢٣١ يخلو من SMGS	١٩٨٠	١٨
المزيج الكلي	٢٢٠٠	٢٠

حضنت الخلايا لمدة ٢٤ ساعة إضافية في أوساط تحتوي على مركبات الاختبار، PDGF-BB و ثيميدين- ^{14}C . ثم طرح مزيج التفاعل وغسل اللوح ثلاث مرات باستخدام ٢٠٠ ميكرو لتر من PBS في كل مرة. وبعد ذلك، ملئت كل عين على اللوح بـ ٢٠٠ ميكرو لتر من PBS. وأحكم سد الجزء العلوي من اللوح بمادة إحكام سد شفاقة للوح ووضعت مواد إحكام سد بيضاء لدعم اللوح على الجزء السفلي من الألواح. وقيس ^{14}C المحتجز داخل كل عين باستخدام باكارد توب كاونت.

ويرتبط مقدار ^{14}C المحتجز في عين بتكاثر الخلايا داخل العين. فعندما ثبت مركب اختبار تكاثر HCASMC مستحث بـ PDGF-BB، احتجزت العين التي تحتوي على مركب من هذا القبيل مقدار أقل من ^{14}C أقل بالمقارنة مع العيون الضابطة حيث حدث أقصى نمو. ولاختبار فعالية مركب الاختراع الراهن في تثبيط، قيس تركيز مركب منفرد مثبّط لتكاثر HCASMC المستحث بـ PDGF-BB إلى النصف (IC_{50}) باستخدام الطريقة المذكورة أعلاه. وكما استخدم في هذا البيان، يشير IC_{50} المذكور إلى تركيز مركب الاختبار حيث يقل مقدار تكاثر HCASMC المستحث بـ PDGF-BB إلى النصف بالمقارنة مع العيون الضابطة التي حدث فيها أقصى نمو والتي لا تحتوي على المركب. ويبين الجدول جـ أمثلة على قيم IC_{50} لمركبات نموذجية وفقاً للاختراع.

٣. تأثير مضاد لتكاثر الخلايا في خلايا سوية في عدم وجود لـ PDGF

تم اختبار تأثير المركبات وفقاً للاختراع على تكاثر الخلايا في خلايا أولية بشرية سوية، وبصفة خاصة، خلايا بطانية لوريد سري بشري (HUVEC)، في عدم وجود تنبيه لـ PDGF على أساس دمج BrdU في دنا الخلايا.

المواد

تم شراء المواد التالية من مصادرها المعنية:

خلايا HUVEC من شركة كسكيد بيولوجكس، كتالوج رقم: C-015-10C؛ وسط ٢٠٠ من شركة كسكيد بيولوجكس، كتالوج رقم: M-200-500؛ إضافات لزراعة مصل تركيزه منخفض (LSGS) من شركة كسكيد بيولوجكس، كتالوج رقم: S-003-10؛ وسط F12-K من شركة جيبكو/بي آر إل (Gibco/BRL)، كتالوج رقم: 21127-022؛ طقم BrdU من شركة روتش (Roche)، كتالوج رقم: 1 647 229؛ ومحلول من تريسين/EDTA من شركة كسكيد بيولوجكس، كتالوج رقم: R-001-100.

الطريقة

ومن أجل التكاثر، زرعت خلايا HUVEC في وسط M-200 مضاف إليه LSGS. ولإجراء الدراسات، فصلت الخلايا مع محلول تريسين/EDTA وغسلت ثلاث مرات باستخدام ١٠ مل من وسط F12K (منخفض تركيز المصل (LS)) ثم فرز بالطرد المركزي بسرعة ٤٠٠ × تسارع الجاذبية الأرضية لمدة ٥ دقائق. ويكون وسط F-12K (منخفض تركيز المصل (LS)) عبارة عن وسط F-12K يحتوي على مصل بقري جنيني معالج بالحرارة تركيزه ٠,٢%.

وضبط تركيز الخلية إلى حوالي ٥ × ١٠^٤ خلية/مل في وسط (LS) F-12K، وأضيف ٢٠٠ ميكرو لتر (تقريباً ١ × ١٠^٤ خلية) إلى كل عين من عيون لوح يحتوي على ٩٦ عينا. ثم حضنت الخلايا لمدة تتراوح من ١٦ إلى ٢٠ ساعة عند ٣٧°م في جو يحتوي على هواء بنسبة ٩٥% و CO₂ بنسبة ٥% لترك الخلايا ترتبط وتصبح ساكنة.

ونُبه تكاثر الخلايا بإضافة ٥٠ ميكرو لتر من محلول مخفف من LSGS في F-12K(LS) بنسبة ١:١٠. وحضرت عيون ضابطة منبهة بدرجة قصوى بإضافة ٥٠

ميكرو لتر من المحلول المخفف من LSGS بنسبة ١:١٠٠. واحتوت العيون الضابطة الصفيرية على ٥٠ ميكرو لتر من وسط (LS) F-12K فقط. وأضيفت مركبات الاختبار في DMSO تركيزه ١٠٠% بحجم بلغ ٢,٥ ميكرو لتر للحصول على تركيز العقار النهائي المرغوب. واختبرت حالات التضاعف للعيون الثمانية لكل حالة. وحضنت الخلايا عند ٣٧° م طوال الليل. وفي اليوم التالي أضيف ٢٥ ميكرو لتر من BrdU (المحلول المخفف الأم بنسبة ١:١٠٠ في وسط (LS) F-12K) إلى كل عين.

وحضنت الخلايا لمدة إضافية تراوحت من ٢٠ إلى ٢٤ ساعة. وأزيل الوسط وتثبتت الخلايا بإضافة ٢٠٠ ميكرو لتر من محلول فكس دنت (FixDent) (موجود في طقم BrdU) إلى كل عين ثم حضنت عند درجة حرارة الغرفة لمدة ٣٠ دقيقة إضافية. وأزيل محلول فكس دنت بالألوة وتتشيف الألواح، وأضيف ١٠٠ ميكرو لتر من مضاد BrdU-POD (موجود في طقم BrdU) مخفف بنسبة تخفيف بلغت ١:١٠٠ في محلول الجسم المضاد (الموجود في طقم BrdU) إلى كل عين. وحضر محلول BrdU-POD المضاد المخفف قبل الاستخدام بفترة قصيرة. وحضنت الألواح عند درجة حرارة الغرفة لمدة ٩٠ دقيقة.

وأزيل الجسم المضاد غير المرتبط بغسله ثلاث مرات بمحلول غسل (باستخدام حجم بلغ ٢٠٠ ميكرو لتر لكل غسلة). وحضر محلول الغسل بتحضير محلول مخفف بنسبة ١:١٠٠ من المحلول الأم المنظم للغسل (موجود في طقم BrdU) بماء مقطر. وأضيف ١٠٠ ميكرو لتر من محلول ركيزة (موجود في طقم BrdU) إلى كل عين وحضنت لمدة إضافية تراوحت من ٣٠ إلى ٤٠ دقيقة. ثم أخذت قراءات الألواح عند طول موجي بلغ ٤٠٥ نانومتر باستخدام قارئ لوح يحتوي على ٩٦ عيناً.

ولاختبار فعالية تثبيط مركب الاختراع الراهن، قيس تركيز مركب منفرد مثبط لتكاثر HUVEC غير المعتمد على PDGF-BB إلى النصف (IC_{50}) باستخدام الطريقة الموصوفة أعلاه. وكما استخدم في هذا البيان، يشير IC_{50} المذكور إلى تركيز مركب الاختبار الذي عنده يقل مقدار تكاثر HUVEC إلى النصف بالمقارنة مع العيون الضابطة التي حدث فيها أقصى نمو والتي لا تحتوي على المركب. وبين الجدول جـ أمثلة على قيم IC_{50} لمركبات نموذجية وفقاً للاختراع.

٣جـ. تأثير مضاد لتكاثر الخلايا في الخلايا الورمية

تم اختبار تأثير المركبات وفقاً للاختراع على تكاثر الخلايا في خلايا ورمية مختلفة على أساس دمج ثيميدين- ^{14}C في دنا الخلايا.

المواد

استخدمت مواد مشابهة لتلك الموصوفة أعلاه في الفقرة ٣أ، باستثناء استخدام خلايا مختلفة، وسط زراعة خلايا، وإضافات للنمو. وحصل على خطوط خلايا ورمية بشرية مشتقة من مصادر أنسجة بشرية مختلفة (LoVo من القولون، H460 من الرئة، T47D من الثدي، PC3 من البروستات، A375 من الميلانوما، AsPC1 من البنكرياس) من مجموعة المزارع النمطية الأمريكية (ATCC) وزرعت في ظروف محددة ضرورية لكل نوع من الخلايا، كما زود بواسطة ATCC. وحصل على وسط كامل من سلجرو (Cellgro): وسط اسكوفي يحتوي على مصل بقري جنيني (FBS) بنسبة ١٠% (من شركة ميدياتش، انك، (Mediatech, Inc.) هيرندون، بالاسم التجاري VA20171، كتالوج رقم / 10-016-CV).

الطريقة

بنرت خلايا ورمية بمقدار تراوح من ٣٠٠٠-٨٠٠٠ خلية لكل عين تقريباً في حجم بلغ ١٠٠ ميكرو لتر من الوسط الكامل. وزرعت الخلايا لمدة ٢٤ ساعة في وسط كامل، وخفف ١ ميكرو لتر من مركب الاختراع بشكل متسلسل في DMSO تركيزه ١٠٠% وأضيف إلى كل عين. وبالنسبة للعيون الضابطة حيث التي حدث فيها أقصى نمو، أضيف فقط ١ ميكرو لتر من DMSO تركيزه ١٠٠%. وبعد ٢٤ ساعة من الحضانة، أضيف ٢٠ ميكرو لتر من مزيج ثيميدين- ^{14}C الرئيسي إلى كل عين وحضر مزيج ثيميدين- ^{14}C الرئيسي وفقاً للنظام

التالي:

المادة المفاعلة:	لوح واحد (ميكرو لتر)	عين واحدة (ميكرو لتر)
ثيميدين- ^{14}C	٢٢٠	٢
وسط كامل	١٩٨٠	١٨
المزيج الكلي	٢٢٠٠	٢٠

وحضنت الخلايا لمدة ٢٤ ساعة إضافية عند ٣٧° م في وسط يحتوي على مركب الاختبار، وثيميدين- ^{14}C . ثم طرح مزيج التفاعل وغسل اللوح مرتين باستخدام ٢٠٠ ميكرو لتر من PBS في كل مرة. وبعد ذلك، ملئت كل عين على اللوح بـ ٢٠٠ ميكرو لتر من PBS. وأحكم سد الجزء العلوي من اللوح بمادة إحكام سد شفافة للوح ووضعت مواد إحكام سد بيضاء لدعم اللوح على الجزء السفلي من الألواح. وقيس ^{14}C المحتجز داخل كل عين باستخدام باكارد توب كاونت.

ولاختبار فعالية مركب الاختراع الراهن في التثبيط، قيس تركيز مركب منفرد مثبِّط لتكاثر خط خلية ورمية إلى النصف (IC_{50}) باستخدام الطريقة الموصوفة أعلاه. وكما استخدم في هذا البيان، يشير IC_{50} المذكور إلى تركيز مركب الاختبار الذي عنده يقل مقدار تكاثر الخلية الورمية إلى النصف بالمقارنة مع العيون الضابطة التي حدث فيها أقصى نمو والتي لا تحتوي على المركب. ويبين الجدول جـ أمثلة على قيم IC_{50} لمركبات نموذجية وفقاً للاختراع.

الجدول جـ. قيم تركيز مركبات نموذجية مثبِّط لتكاثر الخلايا إلى النصف (قيم IC_{50})

رقم المركب	HCASMC (PDGF-BB) (ميكرو جزيئي)	HUVEC (LSGS) (ميكرو جزيئي)	H460 (ميكرو جزيئي)	LoVo (ميكرو جزيئي)	PC3 (ميكرو جزيئي)	T47D (ميكرو جزيئي)	A375 (ميكرو جزيئي)	AsPC1 (ميكرو جزيئي)
٤	٠,٢٦٨	١,٧٣٠	٠,٠٣٠	٠,٠١٢	٠,٠٤٨	٠,٠٣٠	١,٥٨٠	٠,٤٢٧
١١	٠,٠١٤	٠,٠٠٢	٠,٠٣٣	٠,٠٠٢		٠,٠٠٧		
١٢	٠,١٠٦	٠,٠٣١	٠,٠٠٣	٠,٠١١	٠,٠١٣	٠,٠٣١	٠,٠١١	٠,٠٧٧
١٤	٠,٠٠٣	٤,٨٧٠	٠,٠١٠	٠,٠١١		٠,٠٣٢		
٢٢	٠,٢٧٨	٢,١٥٠	٩,٢٧٠	١٣,٤٥٠	٤٩,٥٠٠	٠,٣٨١	١١,٥٥٠	١٠ <
٣٠	٠,٠٠٢	١,٠ <	٠,٢٩٠	٠,٤٢٣	٠,١٧٥	٨,٢٠٠	٠,٥٠٧	١٠ <
٣٩	٠,٠٠٩	٠,٠١٥	٩,٩٥٠	١٠,٥٣٠	١٠ <	١٠ <	٥٠ <	١٠ <

		٢,٦		٢,٤	٣,٦٧	٢,٤٦٠	٠,٠١٤	٦٣
	٠,٠٠٤			٠,٠٧١				٩١
		٠,٦٢٢		٠,٢٢٥	٠,٤٢٤	١,٩١٠	٠,٠١٩	٩٧
١٠ <	١٤,٤٠٠	١٠,٥٠٠	٦,٣٤٠	٣,٨٤٠	١٤,٣٠٠	٠,٢٢٣	٠,١٢٥	١٢٢
١٠ <	١,٢٣٠	١,٩٠٠	٣,١٣٠	٢,١٤٠	٣,٥٩٠	٠,٢١٨	٠,٠٠٨	١٥٧
١,٥٥٠	٢,١٧٦	٠,٣٥٥	٠,٣٠٣	٣,٧٠٠	١,٢٠٠	٠,٠٤٩		٣٣٠
٠,١٥٥	٠,٠٠٢	٠,٠٠٣	٠,٠٠٤	٠,٠١٨	٠,٠٠٦			٣٨٨
٠,٠٤٠	٠,٠٠٢	٠,٠٠٦	٠,٠١٢	٠,٠٣٥				٤٣٢
٤,٣٠٠	٠,٢١٤	٠,٨٢٢	٠,٢٧٦	٣,٨٠٠	٤,١٠٠			٤٢٠

د. تأثير مضاد لتكاثر الخلايا في خلايا اللوكيميا

تم اختبار تأثير المركبات وفقاً للاختراع على تكاثر الخلايا في خلايا اللوكيميا، وبصفة خاصة، الخط الخلوي K562 للوكيميا المزمنة نخاعية المنشأ البشرية (CML) باستخدام معايير عد الخلايا بالتدفق ومعايير عد الخلايا باستثناء أزرق تريبان. ولقد وجد أن الخط الخلوي K562 — CML يعبر عن الجين الورمي bcr/abl، الطابع المميز الوراثي لـ CML بشري (انظر ما جاء عن وو ومعاونيه في مجلة اللوكيميا، مجلد ٩، العدد (٥)، ص ٨٥٨-٨٦٢، ١٩٩٥م).

المواد والطريقة

حصل على الخط الخلوي K562 للوكيميا المزمنة نخاعية المنشأ البشرية (CML) من مجموعة المزارع النمطية الأمريكية (ATCC) وزرعت تحت ظروف محددة، كما زود من قبل ATCC. واستخدم جهاز بكتون ديكنسون اف ايه سي اس سي أليور (Becton Dickinson FACSCalibur) لعمليات تحليل تعداد الخلايا بالتدفق. واستخدم طقم مادة مفاعلة لدنا من نوع سايكل تست بلس (Cycle TEST Plus) (كتالوج رقم: 340242، بكتون ديكنسون) في دراسة صبغ الخلايا. ثم اتبعت طريقة التشغيل القياسية وبروتوكول لطقم مادة مفاعلة لدنا من نوع سايكل تست بلس من بكتون ديكنسون لإجراء الدراسة. بشكل مختصر، استخدم تحليل تعداد

الخلايا بالتدفق لخط خلية K562 لـ CML المصبوغ بشكل متفاوت لتقييم محتوى الدنا وتوزيع طور دورة الخلية للخلايا المعالجة بتركيز مختلفة من المركب لمدة ٢٤ ساعة. ولقد صبغت خلايا K562 لـ CML المعالجة بالمركب رقم ١٤ أولاً بيوريد البروبيديوم ثم تحليل الفلورة لتحديد كمية جانبية دورة الخلية. وأجري تحليل للبيانات باستخدام برنامج تحليل بيانات دورة خلية ModFit LT (من شركة فيرتن سوفت وير هاوس (Verity Software House)، توبشام مدينة، ولاية مين ٠٤٠٨٦ (www.vsh.com) وأجري اختبار لتحديد حيوية الخلية باستخدام معايير باستثناء أزرق تريبيان (يحصل على أزرق تريبيان من شركة سيجما، كتالوج رقم: T 0776) باتباع طرق معروفة لأولئك المتمرسين في التقنية.

وقد أظهرت أطياف تعداد الخلايا بالتدفق أنه بعد ٢٤ ساعة من المعالجة، تسبب المركب في تجمع الخلايا في الطور G2/M للدورة وإيقاف نمو خلايا K562 لـ CML البشرية بطريقة تعتمد على التركيز (الجدول د).

الجدول د. النسبة المئوية للخلايا عند أطوار نمو مختلفة بعد المعالجة بالمركب

تركيز المركب (نانو جزيئي)	G0-G2 (%)	الطور S (%)	الطور G2/M (%)
صفر	٣٧	٤٥	١٨
١	٣٥	٥٣	١١
١٠	٣١	٤١	٢٨
١٠٠	٢	صفر	٩٨
١٠٠٠	٣	٤	٩٣
١٠٠٠٠	٥	٥	٩٠

ولقد أظهرت دراسات تحديد حيوية الخلية باستخدام معايير باستثناء أزرق تريبيان أن معالجة خلايا K562 بالمركب رقم ١٤ لمدة ٢٤ ساعة تسببت في انخفاض معتمد على التركيز لتكاثر الخلايا في خلايا K562. وبلغ (IC_{50}) تركيز المركب رقم ١٤ المثبط لتكاثر

K562 إلى النصف (IC_{50}) (أي، تركيز المركب الذي عنده يقل مقدار تكاثر خلايا K562 إلى النصف بالمقارنة مع الخلايا الضابطة التي حدث فيها أقصى نمو والتي لا تحتوي على المركب) حوالي ١٠ نانو جزيئي كما قيس من المعايير باستثناء أزرق تريبيان.

وباستخدام بروتوكولات مشابهة في معايير تعداد الخلايا بالتدفق ومعايير عدد الخلايا باستثناء أزرق تريبيان، وجد أيضاً أن المركب رقم ١٤ أعاق أيضاً نمو أنواع أخرى من الخلايا مثل H460 وLoVo في الطور G2/M لدورة الخلية.

ويمكن اختبار أي مركب ضمن نطاق الاختراع لتحديد قدرتها على تثبيط تكاثر الخلايا باستخدام بروتوكولات مختلفة موصوفة في هذا البيان.

٤. معايير لتحديد التأثير المضاد لتولد الأوعية

يمكن قياس فعالية مركب هذا الاختراع في تثبيط تولد الأوعية في الجسم الحي باستخدام نموذج فأري محقون بمترجيل (معايرة MM) لتولد الأوعية (انظر ما جاء عن باسانيتي ومعاونيه في مجلة البحوث المخبرية (لابوراتوري انفستجياشن)، مجلد ٦٧، ص ٥١٩-٥٢٨، ١٩٩٢م). وتعتبر معايرة فأر محقون بمترجيل طريقة مثبتة جيداً لتحديد مقدار تولد الأوعية (انظر على سبيل المثال ما جاء عن كبوجروسي ومعاونيه في كتاب بعنوان

طرق في الطب الجزيئي، الأمراض الوعائية: علم الأحياء الجزيئية وبروتوكولات العلاج الجيني، المحرر من قبل: إيه. إتش. باكر، شركة هوماننا بريس (Humana Press)، مدينة توتووا، ولاية نيوجرزي، ١٩٩٩م). ولقد تميز النموذج بكونه مناسب بشكل واسع كنموذج محاكي لعملية تولد الأوعية ولقد استخدم بشكل واسع في تقييم كل من فعالية تولد الأوعية المحتملة والفعالية المضادة لتولد الأوعية المحتملة في الجسم الحي لمركبات/عوامل عديدة. ولقد تبين

بأن المركبات ذات فعالية موضحة مضادة لتولد الأوعية في نماذج أخرى مضادة لتولد الأوعية أخرى (مثلاً معايرة RAR) عبارة عن مثبطات فعالة لتولد الأوعية في معايرة MM وتحديث انخفاضاً في نمو الأورام في نماذج طعم مغاير ورمية بشرية. ولقد أجريت كل الطرق التي استخدمت حيوانات في مرفق حيواني معتمد بشكل كامل من قبل الجمعية الأمريكية لتقييم واعتماد العناية بالحيوانات المخبرية (AAALAC) ووفقاً لدليل العناية بالحيوانات المخبرية

واستخدامها (الصادر عن المؤسسة الوطنية للصحة (NIH)). ولقد أقرت البروتوكولات من قبل لجنة العناية بالحيوانات الداخلية RWJ-PRI واستخدامها (IACUC).

الطريقة

- حقنت فئران ذكور سوية (C57BL/6J) تحت الجلد (بطنياً تحت ضلع القفص عند خط الوسط البطني) بـ ١,٠ مل من مترجيل مبرد تبريداً مفاجئاً مضاف إليه عامل نمو منقى مفرد قبل تولد الأوعية (بمقدار تراوح من ١٠٠-٥٠٠ نانوجم/مل) من rhPDGF-BB (المذكور أعلاه)، عامل نمو خلية ورمية ليفية قاعدية بشرية مأشوبة، rhFGF-قاعدي (من شركة آر أند دي سيستم، كتالوج رقم: 233-FB) أو عامل نمو بطاني وعائي بشري مأشوب، rhVEGF (من شركة بانفيريا (PanVera)، كتالوج رقم: R2951 وهيبارين (٣٥ بتركيز وحدة/مل). وتشكل المركبات في صورة معلمات تركيزها ١% (التركيز النهائي ١ مجم/مل) في مثيل سليلوز تركيزه ٠,٥%. وتم إعطاء سواغ أو مركبات الاختبار لمجموعات معالجة بها من ٨-١٠ فئران لكل مجموعة معالجة عن طريق الفم بالتغذية بطريق ناسور معدي والتي تبدأ بعد ساعتين من عمليات حقن المترجيل. واستمر إعطاء الجرعات لمدة ٣ أيام متعاقبة (أي، جرعة مرة واحدة يومياً من اليوم الأول، جرعة مرتين يومياً من اليوم الثاني، وجرعة مرتين يومياً من اليوم الثالث). وبعد ١٨ ساعة تقريباً من إعطاء الجرعة الأخيرة من السواغ أو العقار، أميتت الفئران موتاً هادئاً وأزيلت أغشية المترجيل بالجراحة بشكل سليم (أزيل الجلد الفوقي وقطع الغطاء مع الحفاظ على بعض البطانة البريتونية للدعم). ووضع الغطاء في أنابيب موسومة مسبقاً تحتوي على ١,٠ مل من الماء المقطر، قطع إلى قطع صغيرة واستخلص منه الهيموجلوبين (Hb) طوال الليل في حمام مائي درجة حرارته ٣٧°م مع رج يسير. وفرزت الأنابيب في اليوم التالي بالطرد المركزي بسرعة ٣٠٠٠ دورة في الدقيقة لمدة ٢٠ دقيقة. وأزيلت المواد الطافية وقيس تركيز الهيموجلوبين في خلاصة الغطاء بواسطة المطيافية الضوئية باستخدام طريقة المعايرة لدرايكن (طقم المادة المفاعلة لدرايكن 525-A؛ من شركة سيجما) وأخذت القراءات من المطياف الضوئي من نوع بكمان دي يو ٧٤٠٠ (Beckman DU 7400). واستخدم محتوى الهيموجلوبين للغطاء على أنه مؤشر غير مباشر لاستجابة مولدة للأوعية وكان الانخفاض في محتوى هيموجلوبين الغطاء إشارة على فعالية مضادة لتولد

الأوعية في الجسم الحي. وقورنت قدرة المركبات على تثبيط تولد الأوعية المنبه بـ PDGF-BB في الجسم الحي مباشرة مع فئران ضابطة معالجة بسواغ. وتم تحليل اختلافات المجموعة إحصائياً باستخدام اختبار مان-ويتني، حيث اعتبرت قيمة-معامل احتمال (قيمة-p) مساوية لـ ٠,٠٥ أو أقل مهمة إحصائياً.

ويمكن اختبار أي مركب يقع ضمن نطاق الاختراع باستخدام بروتوكول معايرة MM في الجسم الحي الموصوف في هذا البيان. وتبين نتائج مركبات نموذجية وفقاً للاختراع من معايرة MM في الجسم الحي مضاف إليها PDGF في الجدول هـ.

الجدول هـ. مركبات نموذجية تثبّط تولد الأوعية في الجسم الحي في معايرة MM

مضاف إليها PDGF-BB

رقم المركب	النسبة المئوية للتثبيط عند إعطاء ٣٠ مجم/كجم عن طريق الفم
١٤	٤٠
١٢	٤٥
٢٦	٤٢

٥- معايرة لتحديد تأثير مضاد للورم

تم تقييم فعالية مركبات تجريبية مضادة للورم في الجسم الحي باستخدام نموذج طعم مغاير لفأر عار ورمي بشري. وأجريت جميع الطرق التي استخدمت الحيوانات في مرفق حيواني معتمد بشكل كامل من قبل الجمعية الأمريكية لتقييم واعتماد العناية بالحيوانات المخبرية (AAALAC) ووفقاً لدليل العناية بالحيوانات المخبرية واستخدامها (وفقاً لـ NIH). ولقد أقرت البروتوكولات من قبل لجنة العناية بالحيوانات الداخلية RWJ-PRI واستخدامها (IACUC).

وحصل على خطوط خلوية ورمية بشرية (MDA-MB-231، LoVo، H460.. إلخ) من مجموعة المزارع النمطية الأمريكية وزرعت في ظروف محددة ضرورية لكل نوع خلوية. وحققت فئران عارية صغرية إناث (من شركة شارلز ريفر (Charles River) nu/nu) تحت

الجلد في منطقة إربية للفخذ بـ ١-٢×١٠ من الخلايا الورمية في ٠,١ مل من الحجم في اليوم صفر. وبالنسبة لدراسات تأخير النمو، أعطيت الفئران جرعات من سواغ عن طريق الفم (مجموعة ضابطة) أو عقاقير تجريبية بعد ثلاثة أيام من تلقيح الخلايا الورمية. وحضرت المركبات في مثل سليلوز تركيزه ٠,٥% وأعطيت العلاجات مرتين يومياً لمدة تراوحت من ٣٠ إلى ٣٥ يوماً متعاقباً. وقيس نمو الورم مرتين في الأسبوع باستخدام برجل لتحديد أمد معالجة. وقيست مساحات الورم (ملم^٢) كحاصل ضرب الطول×العرض. وقيست أوزان الأجسام مرتين في الأسبوع واستخدم فقد في وزن الجسم كقياس للسمية الإجمالية. وعند نهاية الدراسة، أميتت الفئران موتاً هادئاً واستأصلت الأورام الصلبة بالجراحة بشكل سليم ووزنت. وتمت الاستفادة من الوزن النهائي للورم للدلالة على نقطة نهاية الفعالية الأولية. وحللت الاختلافات بين الفئران المعالجة والضابطة إحصائياً بواسطة أنوفا (ANOVA) واختبار دونيت تي (Dunnett's t.test).

ويمكن اختبار أي مركب ضمن نطاق الاختراع في الجسم الحي باستخدام نموذج طعم مغاير لفأر عار ورمي بشري موصوف في هذا البيان. ولقد ثبت مركب نموذجي، المركب رقم ١٤، نمو الورم بنسبة ٧٢% باستخدام ٥٠ مجم/كجم من العقار كما تبين من دراسة نموذج طعم مغاير لفأر عار ورمي بشري في الجسم الحي.

٦. معالجة مؤتلفة مع العلاج بالأشعة

يعتبر العلاج بالأشعة طريقة علاجية رئيسية في معالجة أنواع عديدة من السرطانات بما في ذلك سرطانات البروستات والمبيض البشرية. ولقد اختبرت فعالية المركبات التي تقع ضمن نطاق الاختراع في مقاومة التكاثر في توليفة مع المعالجة بالأشعة. ولقد أجريت معايرة تكوين المستعمرات على خطين خلويين لسرطان بشري مختلفين، DU145 (سرطان البروستات) وMDAH2774 (سرطان المبيض) بعد المعالجة المؤتلفة من العلاج بالأشعة ومركب نموذجي وفقاً للاختراع، المركب رقم ١٤.

المواد:

حصل على خلايا DU145 (سرطان البروستات) وMDAH2774 (سرطان المبيض) من ATCC؛ وأضيف إلى وسط MEM لأوساط النمو (من شركة ميديانتش، مدينة هرندون، ولاية

فرجينيا) FBS تركيزه ٨%، بنسيلين تركيزها ٥٠ وحدة/مل وستربتوميسين تركيزه ٥٠ ميكروجم/مل (هايكلون، مدينة لوجان، ولاية يوتا)، و L-جلوتامين تركيزه ٢ ملي جزيئي (هايكلون، مدينة لوجان، ولاية يوتا)، HEPES تركيزه ٢٥ ملي جزيئي (هايكلون، مدينة لوجان، ولاية يوتا)؛ وأضيف إلى وسط مكوي ٥ إيه (McCoy 5A) (من شركة ميدياتش، مدينة هرندون، ولاية فرجينيا) FBS تركيزه ٨%، بنسيلين تركيزه ٥٠ وحدة/مل وستربتوميسين تركيزه ٥٠ ميكروجم/مل (هايكلون، مدينة لوجان، ولاية يوتا) وي - جلوتامين تركيزه ٢ ملي جزيئي (هايكلون، مدينة لوجان، ولاية يوتا)، وكان مصدر ^{137}Cs عبارة عن مادة إشعاعية من نوع جاماسيل ١٠٠٠ إلبت (Gammacell 1000Elite) (شركة إم دي اس نورديون (MDS Nordion)، كاناتا، ولاية أونتاريو، كندا)؛ DMSO؛ PBS تركيزه الضعف؛ ميثانول؛ بنفسج بلوري بنسبة ٢٥،٠%، وأطباق لزراعة الأنسجة قطرها ٦٠ ملم.

الطريقة:

طلبت خلايا DU145 أو MDAH2774 عند العدد الخلوي المرغوب في الطور اللوغاريتمي المبكر على أطباق قطرها ٦٠ ملم في وسط MEM مضاف إليه FBS تركيزه ٨%، بنسلين، ستربتوميسين، ي-جلوتامين، أو وسط مكوي مضاف إليها FBS تركيزه ٨%، بنسلين، ستربتوميسين وجلوتامين، بالترتيب. وطلبت الخلايا في ثلاث مرات. وأضيف المركب رقم ١٤ بتركيز مختلفة إلى الخلايا بعد ١٤ ساعة من الطلي. وتراوحت التراكيز النهائية للمركب في الأوساط الخلوية من ١ إلى ١٠٠ نانو جزيئي. وبعد ٢٤ ساعة من الحضانة بواسطة مركب الاختبار، عولجت الأطباق ذات الأرقام الزوجية بالأشعة باستخدام $\text{Gy } ٧,٣$ (أطباق تحتوي على خلايا DU145) أو $\text{Gy } ٥,٤$ (أطباق تحتوي على خلايا MDAH2774) باستخدام مصدر ^{137}Cs (معدل الجرعة ٣,٣٢ Gy/دقيقة)، ولم تعالج الأطباق ذات الأرقام الفردية بالأشعة. وحضنت الخلايا لمدة ٢٤ ساعة إضافية في وسط احتوي على مركب الاختبار. ثم، زودت الخلايا ثانية بوسط مماثل جديد يخلو من المركب وتركت تنمو لمدة ١١ يوماً إضافياً. ثم ثبتت الخلايا بالميثانول، صبغت بنفسج بلوري تركيزه ٢٥،٠% وعُدت النسائل التي احتوت على أكثر من ٥٠ خلية.

ولقد تبين من نتائج هذه الدراسات أنه عند البدء بتركيز ٣٠ نانو جزيئي، أظهر المركب رقم ١٤ فعاليات تثبيط واضحة ضد تشكيل مستعمرات في كل من خلايا DU145 وMDAH2774 عند وجود الإشعاع أو عدم وجوده، ولكن كان تأثير التثبيط أكبر بشكل واضح في العلاج بالأشعة (الجدول و). ولقد ظهر بأن الفعالية تعتمد على التركيز حيث تحققت تأثيرات مثيرة باستخدام مركب تركيزه ١٠٠ نانو جزيئي باستخدام العلاج بالأشعة في أي من الخطوط الخلوية، والنتائج منسجمة مع الملاحظة المتمثلة في أن المركب رقم ١٤ تسبب في توقف نمو الطور G2/M في الخلايا السرطانية المتكاثرة، لأنه يُتوقع للخلايا عند حدوث توقف لنمو الطور G2/M أن تكون أكثر حساسية وتأثراً لإصابة إضافية، مثل الأشعة.

ويمكن اختبار أي مركب يقع ضمن نطاق الاختراع من حيث قدرته على جعل الخلايا تتأثر بالمعالجة بالأشعة باستخدام البروتوكولات الموصوفة في هذا البيان.

الجدول و. معايير تكون المستعمرات باستخدام المعالجة المؤتلفة من المعالجة بالأشعة

والمركب رقم ١٤

عدد مستعمرات MDAH2774 (متوسط ثلاث معايير)		عدد مستعمرات DU145 (متوسط ثلاث معايير)		تركيز المركب (نانو جزيئي)
علاج بأشعة W/o (طلي ١٠٠٠ خلية أولاً)	علاج بأشعة W/o (طلي ٢٠٠ خلية أولاً)	علاج بأشعة W/ (طلي ١٢٠٠ خلية أولاً)	علاج بأشعة W/o (طلي ٢٠٠ خلية أولاً)	
١٢١	١٠١	١٣٤	١٣٣	صفر
١٢١	٩٨	١١٧	١١٨	١
١٢٥	٩٦	١٠٠	١٠٨	٣
١٢١	١١٠	١٢٦	١١١	١٠
٨	٣٥	٥٧	١٠٠	٣٠
٣	٨	٥	٢٢	١٠٠

وأشارت هذه الدراسة إلى أن الخلايا السرطانية التي عولجت مسبقاً بتركيز منخفضة من المركب وفقاً للاختراع أظهرت انخفاضاً أكبر بالنسبة لتشكيل المستعمرات في توليفة مع العلاج بالأشعة، بالمقارنة مع العلاج بالمركب وحده أو العلاج بالأشعة وحده. وتدعم هذه الدراسات الأولية مبدأ استخدام مركب وفقاً للاختراع في توليفة مع العلاج بالأشعة في حالات السرطان حيث يعتبر العلاج بالأشعة طريقة علاجية قياسية.

٧. تحول العقاقير الأولية إلى المركبات الأصلية

لقد توضّح بأن التعديل الكيميائي لعامل فعال يمكن أن يغيّر بشكل ملحوظ الخواص الكيميائية-الفيزيائية مثل الذوبانية، الثبات، الامتصاص، النقل والوفرة الحيوية باعتبار حيز حيوي خاص (انظر ما جاء عن ادوارد بي. روتش في كتاب بعنوان مادة حاملة قابلة للانعكاس حيويًا في تصميم العقار، برجامون بريس، ١٩٨٧م). وتعتبر العقاقير الأولية جزيئات يمكن حلّماتها بشكل عكوس مرة أخرى إلى العامل الفعال بواسطة أنزيمات مثل أنزيمات الاستراز. وتم تقييم العقاقير الأولية للمركبات ضمن نطاق الاختراع في أنظمة معايرة في أنبوب الاختبار وفي الجسم الحي من حيث إمكانية تحولها في الجسم الحي إلى المركبات الأصلية.

وتم حضن عقاقير أولية مختلفة لمركب نموذجي وفقاً للاختراع، المركب رقم ١٤، في بلازما جرد محضرة حديثاً لمدة ساعتين. وتمت معايرة فعاليات هذه العقاقير الأولية في تثبيط كيناز PDGF-R قبل وبعد الحضن في البلازما. ولقد أجريت معايرة تثبيط كيناز PDGF-R كما وصف أعلاه. ولقد تبين أن الحضن في البلازما لمدة ساعتين زاد من فعالية العقاقير الأولية في تثبيط كيناز PDGF-R بشكل ملحوظ. وهذا يوحي بأن مقدار كبير من العقار الأولي قد تحول إلى العقار الأصلي في بلازما الجرد. وفي الواقع، تم الكشف عن مقدار كبير من المركب الأصلي بواسطة عمليات التحليل بـ HPLC بعد ساعتين من الحضن في بلازما الجرد (الجدول ز).

وعلاوة على ذلك، أعطيت العقاقير الأولية عن طريق الفم إلى الجرذان (بمقدار ١٠ مجم/كجم) في دراسات الحركات الدوائية، وتمت مراقبة تحول العقاقير الأولية إلى المركب الأصلي بواسطة عمليات التحليل المتمثلة في HPLC/MS/MS. وتم الكشف عن المركب

الأصلي أو المركبات الاقترانية من الجلوكورونيد للمركب الأصلي في بلازما الجرذ من دراسات الحركات الدوائية (الجدول ز).

الجدول ز. نسب تحول عقاقير أولية نموذجية إلى المركب الأصلي رقم ١٤ المقاسة بواسطة

HPLC

رقم المركب	الحضن في بلازما جرذ (لمدة ساعتين)		PK سريع (لمدة نصف ساعة) (التركيز بوحدة ميكرو جزيئي)	
	النسبة المئوية للمركب الأصلي	العقار الأولي	المركب الأصلي	المركبات الاقترانية من الجلوكورونيد
٥٧٨	صفر%	٧,٨	صفر	٠,٠٠٧
٤٣٢	٢%	٠,٠٨	٠,٠٥	٠,٩
٤٦٥	٦%	٠,٢٢٣	صفر	٦,٦٦٤
٤٣٣	٤٧%	٠,٠٦	٠,١	٣,٩
٤٧١	٥٦%	صفر	١,٨٥٦	٣٤,٧٩
٤٣٦	١,٥%	٠,٠٣٨	صفر	٣,٣٤٧

ويمكن اختبار تحول العقاقير الأولية إلى أي مركب أصلي ضمن نطاق الاختراع باستخدام البروتوكولات الموصوفة في هذا البيان.

طرق استخدام المركبات وفقاً للاختراع

يمكن استخدام المركبات وفقاً للاختراع في طرق لمعالجة/الوقاية من اضطرابات تكاثر خلوي أو اضطرابات مرتبط بـ PDGF-R. كما يمكن استخدامها في طرق تمييز مثبطات PDGF-R جديدة، على سبيل المثال عن طريق تصميم منطقي.

١. طرق تمييز مثبطات كيناز PDGF-R أساسها تصميم منطقي

في أحد أوجه هذا الاختراع، يمكن استخدام المركبات وفقاً للاختراع لتمييز مثبطات كيناز PDGF-R جديدة على أساس تصميم منطقي.

وكما استخدم في هذا البيان، يشير المصطلح "تصميم منطقي" إلى العملية المستخدمة لتصميم مثبط كيناز PDGF-R على أساس البنية ثلاثية الأبعاد لمثبط كيناز PDGF-R، ويفضل الطريقة التي تشتمل على البنية ثلاثية الأبعاد لمثبط كيناز PDGF-R مترابط مع بروتين PDGF-R، ويفضل بروتين PDGF-R بشري، والأفضل حقل حفازي لكيناز لبروتين PDGF-R بشري. وكما استخدم في هذا البيان، يشير المصطلح "حقل حفازي لكيناز PDGF-R" إلى متعدد ببتيد يتكون من أصغر سياق حمضي أميني ضروري لفعالية كيناز PDGF-R، حيث يمكن تحديد سياق الحمض الأميني الأصغر الضروري لفعالية كيناز PDGF-R بسهولة من قبل أولئك المتمرسين في التقنية. ويمكن أن يكون الحقل الحفازي عبارة عن ذلك لـ PDGF-R من إنسان أو حيوان. فعلى سبيل المثال، يمكن أن يشتمل "الحقل الحفازي لكيناز PDGF-R" على الحمض الأميني ٥٤٥ إلى ١١٠٦ من بنك الجينات برقم حيازة AAA36427.

ولقد استخدم تصميم منطقي يعتمد على البنية بنجاح لتمييز مثبطات جزيئية صغيرة جديدة لتشكيلة من الأنزيمات، مثل انزيمات البروتياز وأنزيمات الفسفاتاز لتيروسين بروتيني. وتشتمل طريقة تستخدم مثبطات كيناز PDGF-R جديدة على أساس تصميم منطقي على الخطوات التالية: (أ) تحديد بنية ثلاثية الأبعاد للمركب بالصيغة (I) أو (II) في عدم وجود أو وجود متعدد ببتيد يشتمل على الحقل الحفازي لكيناز PDGF-R؛ (ب) تحليل البنية ثلاثية الأبعاد للمركب وحده أو للتفاعل التبادلي بين الجزيئي بين المركب المذكور و PDGF-R، (ج) اختيار مركب يحاكي بنية المركب وحده أو يتضمن التفاعل التبادلي المتوقع؛ (د) تخليق المركب المصمم المذكور؛ و(هـ) تحديد قدرة الجزيء على الارتباط مع كيناز PDGF-R وتثبيط فعاليته. ويمكن تكرار هذه الخطوات للحصول على المركبات المثلى بواسطة الضبط الدقيق لسمات التفاعل التبادلي.

ويمكن الحصول على بنية ثلاثية الأبعاد بواسطة، على سبيل المثال، دراسة البلوريات بالأشعة السينية، الرنين المغناطيسي النووي والتشكيل التماثلي، وتعتبر هذه الطرق طرقاً معروفة جيداً.

وتتضمن طريقة خاصة وفقاً للاختراع تحليل البنية ثلاثية الأبعاد للتفاعل التبادلي بين الجزيئي بين المركب المذكور و PDGF-R، ويفضل حقل كيناز الفعال لـ PDGF-R. ويشمل

الاختراع الراهن استخدام المعلومات عن البنية ثلاثية الأبعاد للمركب بالصيغة (I) أو (II) المتراكب مع PDGF-R في أنظمة برامجيات تشكيل جزيئية لتساعد في تحليل التفاعلات بين الجزيئية. وسيميّز ويحلّل موقع الربط المحتمل على PDGF-R بالإضافة إلى الشقات الأساسية على المركب بالصيغة (I) أو (II)، حيث تعتبر مهمة للتفاعلات التبادلية بين الجزيئية.

وتتضمن طريقة خاصة أخرى وفقاً للاختراع تصميم مركب يتضمن التفاعل التبادلي المتوقع المعرف أعلاه. وقد يستخدم تشكيل بمساعدة الكمبيوتر من هذا القبيل وتصميم العقار معلومات مثل تحليل امتثالي كيميائي، جهد كهركوني للجزيئات، طي البروتين،... إلخ. ولذلك، ستصمم مثبطات كيناز PDGF-R جديدة بالاعتماد على التفاعل التبادلي بين الجزيئي بين المركب بالصيغة (I) أو (II) و PDGF-R، تسمح بالربط النوعي للمركب المصمم مع PDGF-R. وقد يعمل المركب بالصيغة (I) أو (II) كمادة معيرة للتصميم الابتدائي.

وتشمل طريقة خاصة أخرى وفقاً للاختراع تخليق المركبات المصممة التي تتضمن التفاعل التبادلي المتوقع المعرف أعلاه. ويمكن تخليق مثل هذا الصنف من المركبات باستخدام تشكيلة من الطرق المعروفة في التقنية. فعلى سبيل المثال، يمكن أن تُثبت طرق التخليق الموصوفة في هذا البيان أو التعديلات على هذه الطرق أنها مفيدة في تخليق المركبات المصممة.

وتتضمن طريقة خاصة أخرى أيضاً وفقاً للاختراع معايرة المركبات الجديدة من حيث قدرتها على الارتباط مع PDGF-R وتنشيط فعاليته. ويمكن قياس قدرة مركب على تنشيط فعالية كيناز PDGF-R باستخدام أي من المعايير الحيوية الموصوفة أعلاه، بما في ذلك معايرة كيناز PDGF-R الخالية من الخلايا؛ معايرة تكاثر الخلايا الورمية البشرية وتكاثر خلايا HCASMC منبه بـ PDGF-BB؛ معايرة MM مضادة لتولد الأوعية في الجسم الحي؛ ومعايرة طعم مغاير لفأر ورمي بشري.

ولأن المركبات التي تقع ضمن نطاق الاختراع أظهرت أيضاً فعالية مثبّطة لكيناز c-Abl، فإنه يمكن تمييز مثبطات كيناز c-Abl جديدة بواسطة تصميم منطقي باستخدام طريقة مشابهة لتلك الموصوفة في هذا البيان. وتشتمل طريقة من هذا القبيل على الخطوات التالية:

- (أ) تحديد بنية ثلاثية الأبعاد للمركب بالصيغة (I) أو (II) في عدم وجود أو وجود متعدد بيتيد يشتمل على حقل حفازي لكيناز c-Abl؛
- (ب) تحليل البنية ثلاثية الأبعاد للمركب وحدة أو للتفاعل التبادلي بين الجزيئي بين المركب المذكور و c-Abl؛
- (ج) اختيار مركب يحاكي بنية المركب وحده أو يتضمن التفاعل التبادلي المتوقع؛
- (د) تخليق المركب المصمم المذكور؛ و
- (هـ) تحديد قدرة المركب على الارتباط مع كيناز c-Abl وتنشيط فعاليته.

٢. طرق المعالجة/الوقاية

- في وجه آخر لهذا الاختراع، يمكن استخدام المركبات وفقاً للاختراع لتنشيط أو خفض فعالية فعكيز PDGF-R أو فعالية كيناز c-Abl في خلية أو في كائن خاضع للمعالجة، أو ١٠
- لمعالجة الاضطرابات المرتبطة بـ PDGF-R أو التكاثر الخلوي في كائن الخاضع للمعالجة. وفي أحد تجسيدات هذا الوجه، يزود الاختراع الراهن طريقة لخفض أو تنشيط فعالية كيناز PDGF-R أو c-Abl في خلية تشتمل على خطوة ملاسة الخلية مع مركب بالصيغة (I) أو (II). ١٥
- ويزود الاختراع الراهن أيضاً طريقة لتنشيط فعالية كيناز PDGF-R أو c-Abl في كائن خاضع للمعالجة تشتمل على خطوة إعطاء مركب بالصيغة (I) أو (II) إلى الكائن الخاضع للمعالجة. ويزود الاختراع الراهن أيضاً طريقة لتنشيط التكاثر الخلوي في خلية تشتمل على ملاسة الخلية مع مركب بالصيغة (I) أو (II).
- ويمكن تحديد فعالية كيناز PDGF-R أو c-Abl في خلية أو كائن خاضع للمعالجة بواسطة طرق معروفة جيداً في التقنية، مثل معايرة كيناز PDGF-R أو معايرة كيناز c-Abl ٢٠
- الموصوفة أعلاه.
- ويشير المصطلح "كائن خاضع للمعالجة" كما استخدم في هذا البيان، إلى حيوان، ويفضل ثديي، والأكثر تفضيلاً إنسان، بصفته هدف المعالجة، الملاحظة أو التجربة.
- وفي تجسيدات أخرى لهذا الوجه، يزود الاختراع الراهن طريقتين وقائية وعلاجية لمعالجة كائن خاضع للمعالجة ومعرض لخطر تطور اضطراب تكاثر خلوي أو اضطراب مرتبط بـ PDGF-R. ٢٥

وفي أحد الأمثلة، يزود الاختراع طريقة لوقاية كائن خاضع للمعالجة من اضطراب تكاثر خلوي أو اضطراب مرتبط بـ PDGF-R، بإعطاء الكائن الذي الخاضع للمعالجة مقداراً فعالاً وقائياً من تركيب صيدلي يشتمل على المركب بالصيغة (I) أو (II) ومادة حاملة مقبولة صيدلياً. ويمكن أن يحدث إعطاء العامل الوقائي المذكور قبل ظهور الأعراض المميزة لاضراب التكاثر الخلوي أو اضطراب مرتبط بـ PDGF-R، بحيث تتم الوقاية من مرض أو اضطراب، أو بشكل بديل، يتم تأخير تقدمه.

وفي مثال آخر، يتعلق الاختراع بطرق لمعالجة اضطراب التكاثر الخلوي في كائن خاضع للمعالجة أو اضطراب مرتبط بـ PDGF-R بإعطاء الكائن الخاضع للمعالجة مقداراً فعالاً علاجياً من تركيب صيدلي يشتمل على المركب بالصيغة (I) أو (II) ومادة حاملة مقبولة صيدلياً. ويمكن أن يكون إعطاء العامل العلاجي المذكور متزامناً مع ظهور الأعراض المميزة للاضطراب، بحيث يعمل العامل العلاجي المذكور كعلاج ليعوض عن اضطراب التكاثر الخلوي أو الاضطرابات المرتبطة بـ PDGF-R.

ويشير المصطلح "مقدار فعال وقائياً" إلى مقدار من مركب فعال أو عامل صيدلي يثبّط أو يؤخّر بداية اضطراب في كائن خاضع للمعالجة ينشده باحث، طبيب بيطري، طبيب بشري أو طبيب مجرب آخر.

ويشير المصطلح "مقدار فعال علاجياً" كما استخدم في هذا البيان، إلى مقدار من مركب فعال أو عامل صيدلي يظهر الاستجابة الحيوية أو الطبية في كائن خاضع للمعالجة ينشده باحث، طبيب بيطري، طبيب بشري أو طبيب مجرب آخر، تشمل تخفيف أعراض المرض أو الاضطراب المعالج.

وتعرف طرق في التقنية لتحديد الجرعات العلاجية والوقائية الفعالة من التركيب الصيدلي وفقاً للاختراع الراهن .

وكما استخدم في هذا البيان، يراد أن يشمل المصطلح "تركيب" منتجاً يشتمل على المقومات المحددة بالمقادير المحددة، بالإضافة إلى أي منتج ينتج، بشكل مباشر أو غير مباشر، من توليفات من المقومات المحددة بالمقادير المحددة.

وكما استخدم في هذا البيان، يشمل المصطلح "اضطرابات مرتبطة بـ PDGF-R"، أو "اضطرابات مرتبطة بـ PDGF"، أو "اضطرابات مرتبطة بكيناز تيروزين مستقبلية PDGF" الأمراض المقترنة مع أو المتضمنة فعالية PDGF-R، فعلى سبيل المثال، الفعالية المفرطة لـ PDGF-R، والحالات المرافقة لهذه الأمراض. ويشير المصطلح "فعالية مفرطة لـ PDGF-R" إلى (١) تعبير عن PDGF-R في خلايا لا تعبر عادةً عن PDGF-R؛ (٢) تعبير عن PDGF بواسطة خلايا لا تعبر عادةً عن PDGF؛ (٣) تعبير زائد عن PDGF-R يؤدي إلى تكاثر خلوي غير مرغوب؛ (٤) تعبير زائد عن PDGF يؤدي إلى تكاثر خلوي غير مرغوب، أو (٥) طفرات تؤدي إلى تنشيط بنوي لـ PDGF-R. ومن أمثلة "الاضطرابات المرتبطة بـ PDGF-R" اضطرابات ناتجة عن التنبه المفرط لـ PDGF-R بسبب المقدار الكبير غير الطبيعي لـ PDGF أو الطفرات في PDGF، أو اضطرابات ناتجة عن المقدار الكبير غير الطبيعي لفعالية PDGF-R بسبب المقدار الكبير غير الطبيعي لـ PDGF-R أو الطفرات في PDGF-R. ومن المعروف أن الفعالية المفرطة لـ PDGF تكون متضمنة في منشأ عدد من الأمراض الخطيرة، بما في ذلك السرطانات (مثل الورم الدبقي، سرطان الرئة، سرطان الثدي، سرطان القولون والمستقيم، سرطان البروستات، سرطان المعدة و سرطان المريء، سرطانات الدم (اللوكيميا) والأورام الليمفية)، واضطرابات تكاثر خلوي أخرى، مثل تصلب العصيدي، أمراض الأوعية المستحثة بزرع الأعضاء، تكوين بطانة جديدة، تليف الرئة، معاودة التصيق، التليف الرئوي، التهاب كبيبات الكلى، تصلب كبيبات الكلى، سوء النمو الخلقي للكلية متعددة الأكياس، تليف الكلية، والتهاب المفاصل شبه الروماتزمي (انظر ما جاء عن إيه. أوستمان وسي إتش. هيلدين في مجلة أبحاث السرطان المتقدمة، المجلد ٨٠، ص ١-٣٨، ٢٠٠١م، والمراجع المذكورة فيها).

ويشير المصطلح "اضطرابات التكاثر الخلوي" إلى التكاثر الخلوي غير المرغوب فيه لمجموعة فرعية واحدة أو أكثر من الخلايا في كائن حي متعدد الخلايا مما يضر (أي، شعور بعدم الارتياح أو متوسط عمر متوقع أقل) بالكائنات الحية متعددة الخلايا. ويمكن أن تحدث اضطرابات التكاثر الخلوي في أنواع مختلفة من الحيوانات والبشر. فعلى سبيل المثال، كما استخدم في هذا البيان تشمل "اضطرابات التكاثر الخلوي" اضطرابات ورمية واضطرابات

تكاثر خلوي أخرى. وكما استخدم في هذا البيان، يشير المصطلح "اضطراب ورمي" إلى ورم ناتج عن نمو مفرط خلوي غير مضبوط. ومن أمثلة الاضطرابات الورمية، على سبيل المثال لا الحصر، سرطانات مثل سرطانات الورم الدبقي، سرطانات الرئة، سرطانات الثدي، سرطانات القولون والمستقيم، سرطانات البروستات، سرطانات المعدة، سرطانات المريء، سرطانات القولون، سرطانات البنكرياس، سرطانات المبيض، سوء النمو النخاعي، الورم النخاعي المتعدد، اللوكيميا والأورام الليمفية. ومن أمثلة اللوكيميا، على سبيل المثال لا الحصر لوكيميا مزمنة نخاعية المنشأ (CML)؛ لوكيميا حادة متعلقة بالخلايا الليمفية (ALL)؛ لوكيميا مزمنة أليفة الأصباغ المتعادلة (CNL)؛ لوكيميا حادة عديمة التمايز (AUL)؛ ولوكيميا حادة نخاعية المنشأ (AML). وتشمل أمثلة اضطرابات تكاثر خلوي أخرى، على سبيل المثال لا الحصر، التصلب العصيدي، أمراض الأوعية المستحثة بزرع الأعضاء، تكوين بطانة جديدة، تليف الرئة، الانتكاس البقي، معاودة التضيق، التليف الرئوي، التهاب كبيبات الكلى، تصلب كبيبات الكلى، سوء النمو الخلقي للكلية متعددة الأكياس، تليف الكلية، اعتلال الشبكة الدياتيبي والتهاب المفاصل شبه الروماتزمي.

وفي تجسيد آخر لهذا الوجه، يتضمن الاختراع علاج مؤتلف لمعالجة أو تثبيط بداية اضطراب تكاثر خلوي أو اضطراب مرتبط بـ PDGF-R في كائن خاضع للمعالجة ويشمل العلاج المؤتلف إعطاء الكائن الخاضع للمعالجة مقداراً فعالاً وقائياً أو علاجياً من المركب بالصيغة (I) أو (II)، وعلاج واحد أو أكثر من العلاجات المضادة لتكاثر الخلايا بما في ذلك العلاج الكيميائي، العلاج بالأشعة، العلاج بالجينات والعلاج المناعي.

وفي تجسيد للاختراع الراهن، يمكن إعطاء المركب وفقاً للاختراع الراهن مؤتلفاً مع العلاج الكيميائي، وكما استخدم في هذا البيان، يشير مصطلح العلاج الكيميائي إلى علاج يشتمل على عامل علاجي كيميائي. ويمكن استخدام مجموعة من العوامل العلاجية الكيميائية في طرق المعالجة المؤتلفة الموصوفة في هذا البيان. وتشمل العوامل العلاجية الكيميائية المتوقعة، على سبيل المثال لا الحصر، أدرياميسين، دكتينومييسين، ميتومييسين، كرمينومييسين، دونومييسين، دوكسوروبيسين، تموكسيفين، تاكسول، تاكسوتير، فنكريستين، فنبلاستين، فينوريلبين، اتوبوزيد (VP-16)؛ ٥-فلورويوراسيل (5FU)، سيتوزين أرابينوزيد، فوسفاميد

حلقي، ثيوثيبا، ميثوتريكسات، كمبتوثيسين، هرسيبيتين، أوكتينوميسين-D، ميتوميسين-C، سيسبلاتين (CDDP)، أمينو بترين، كومبريتاستاتين (مركبات كومبريتاستاتين) ومشتقات وعقاقير أولية منها.

وفي تجسيد آخر للاختراع الراهن، يمكن إعطاء المركب وفقاً للاختراع الراهن مؤتلفاً مع العلاج بالأشعة. وكما استخدم في هذا البيان، يشير مصطلح "العلاج بالأشعة" إلى علاج يتضمن تعريض الكائن الذي يكون بحاجة إلى المعالجة بالأشعة. ويعرف هذا العلاج لأولئك المتمرسين في التقنية. وستكون المخططات المناسبة للعلاج بالأشعة مماثلة لتلك المستخدمة سابقاً في العلاجات السريرية حيث يستخدم العلاج بالأشعة وحده أو في توليفة مع علاجات كيميائية أخرى.

وفي تجسيد آخر للاختراع الراهن. يمكن إعطاء المركب وفقاً للاختراع الراهن مؤتلفاً مع العلاج بالجينات. وكما استخدم في هذا البيان، يشير مصطلح "العلاج بالجينات" إلى علاج يستهدف جينات خاصة تسهم في تطور الورم. وتشمل الاستراتيجيات الممكنة للعلاج بالجينات علاج جينات قاصرة مثبّطة للسرطان، الانتقال العارض أو الخمج التحويلي للخلايا باستخدام دنا لا معين يناظر جينيات تحمل شيفرة عوامل نمو ومستقبلاتها، أو الجينات المعروفة بـ "الجينات الانتحارية".

وفي تجسيديات أخرى لهذا الاختراع، يمكن إعطاء المركب وفقاً للاختراع الراهن مؤتلفاً مع العلاج المناعي. وكما استخدم في هذا البيان، يشير مصطلح "العلاج المناعي" إلى علاج يستهدف بروتينات محددة تسهم في تطور الورم عن طريق أجسام مضادة مختصة بهذه البروتينات. فعلى سبيل المثال، لقد استخدمت أجسام مضادة وحيدة النسيلة ضد عامل نمو بطاني وعائي في معالجة السرطانات.

وعند استخدام تركيب صيدلي ثانٍ بالإضافة إلى المركب وفقاً للاختراع، يمكن إعطاء التركيبين الصيدليين معاً في تركيب مفرد، بشكل منفصل، بشكل متعاقب، في نفس الوقت تقريباً، أو في مواعيد إعطاء جرعات منفصلة.

وكما سيفهم من قبل أولئك الملمين في التقنية، ستكون الجرعات المناسبة من العوامل العلاجية الكيميائية مشابهة بشكل عام لتلك المستخدمة سابقاً في العلاجات السريرية أو أقل.

- منها حيث تعطى العلاجات الكيميائية بمفردها أو مؤتلفة مع علاجات كيميائية أخرى. وعلى سبيل المثال فحسب، تستخدم عوامل مثل السسبلاتين، وعوامل ألكلة دنا أخرى بشكل واسع لمعالجة السرطان. وتبلغ الجرعات الفعالة من السسبلاتين المستخدمة في التطبيقات السريرية ٢٠ مجم/م^٢ لمدة ٥ أيام كل ثلاثة أسابيع وذلك لثلاث مجموعات علاجية كلية معطاة بشكل منتظم. ولا يُمتص السسبلاتين عن طريق الفم وبالتالي ينبغي تصريفه عن طريق الحقن في الوريد، تحت الجلد، داخل الورم أو داخل البريتون. ومن العوامل المفيدة الأخرى مركبات تتداخل مع تكرار الدنا، الانقسام الفتيلي والعزل الصبغي. وتستخدم مركبات علاجية كيميائية من هذا القبيل بما في ذلك، أدرياميسين، يعرف كذلك بدوكسوروبيسين، إتبوزيد، فيراباميل، بودوفيلوتوكسين، وما شابه ذلك، بشكل واسع في أوضاع سريرية لمعالجة الأورام. وتعطى هذه المركبات من خلال عمليات حقن على شكل لقمة في الوريد بجرعات تتراوح من ٢٥- ١٠ ٧٥ مجم/م^٢ فترة تبلغ ٢١ يوماً عند إعطاء الأديرياميسين، إلى ٣٥-٥٠ مجم/م^٢ للإتبوزيد في الوريد أو عن طريق الفم بجرعة تبلغ ضعف الجرعة المعطاة في الوريد. ويفضل استخدام عوامل تعطل تخليق ودقة المصادر متعددة النوكليوتيد مثل ٥-فلورويوراسيل (5-FU) خلايا ورمية مستهدفة. وبالرغم من سمية 5-FU إلى حد بعيد، فإنه عادة ما يعطى في الوريد بجرعات تتراوح من ٣ إلى ١٥ مجم/كجم/يوم.
- ويمكن إعطاء المركب وفقاً للاختراع إلى كائن خاضع للمعالجة جهازياً، على سبيل المثال، في الوريد، عن طريق الفم، تحت الجلد، في العضل، في الجلد أو عن طريق غير معوي. كما يمكن إعطاء المركب وفقاً للاختراع إلى كائن خاضع للمعالجة موضعياً. ومن أمثلة أنظمة التصريف الموضعي غير المحددة استخدام أجهزة طبية داخل تجويف الأنبوبة تشمل أجهزة قسطرة لتصريف العقار داخل الأوعية، أسلاك، واقيات طعم عقاقيرية وأدوات إرتصاف داخل تجويف الأنبوبة. ويمكن إعطاء المركب وفقاً للاختراع أيضاً إلى كائن خاضع للمعالجة مؤتلفاً مع عامل استهداف لتحقيق تركيز موضعي عالٍ للمركب عن الموقع المستهدف. وبالإضافة إلى ذلك، يمكن تشكيل المركب لإطلاق سريع أو إطلاق بطيء مع هدف المحافظة على العقاقير أو العوامل متلامسة مع الأنسجة المستهدفة لفترة تتراوح من ساعات إلى أسابيع.

- ويزود الاختراع الراهن أيضاً تركيباً صيدلياً يشتمل على المركب بالصيغة (I) أو (II)، أو زمير بصري، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه، مقترناً مع مادة حاملة مقبولة صيدلياً. ويمكن أن يحتوي التركيب الصيدلي على مقدار من المركب بين حوالي ٠,١ مجم و ١٠٠٠ مجم، ويفضل مقدار يتراوح من حوالي ١٠٠ إلى ٥٠٠ مجم، ويمكن أن يشكل بأي شكل ملائم لطريقة الإعطاء المختارة. وتشير العبارة "مقبول صيدلياً" إلى الوحدات المنفصلة الجزيئية والتراكيب الجزيئية التي لا تنتج تفاعل غير ملائم، تحسّاسي أو تفاعل معاكس آخر عند إعطائها إلى حيوان، أو إنسان، حسب الاقتضاء. وتُدرج الاستخدامات البيطرية على السواء ضمن الاختراع وتشمل التاكيبات "المقبولة صيدلياً" تركيبات لكلّي الاستخدامين السريري و/أو البيطري. وتشمل المواد الحاملة سواغات صيدلية ضرورية وخاملة، بما في ذلك، على سبيل المثال لا الحصر، مواد رابطة، عوامل تعليق، مواد مزلفة، عوامل إضفاء نكهة، مواد محليّة، مواد حافظة، صبغات وطلايات. وتشمل التراكيب الملائمة للإعطاء عن طريق الفم أشكال صلبة، مثل حبوب، أقراص، أقراص كبسولية (كابليت)، كبسولات (يشتمل كل منها على تركيبات ذات إطلاق مباشر، موقوت ومعزز)، حبيبات ومساحيق، وأشكال سائلة، مثل محاليل، أشربة، إكسيرات، مستحلبات، ومعلقات. وتشمل أشكال مفيدة للإعطاء غير المعوي محاليل، مستحلبات ومعلقات معقمة.
- كما يشتمل التركيب الصيدلي وفقاً للاختراع الراهن على تركيب صيدلي يمتاز بإطلاق بطيء لمركب الاختراع. ويشتمل التركيب على مادة حاملة ذات إطلاق بطيء (ونموذجياً، مادة حاملة بوليمرية) ومركب وفقاً للاختراع. وتعرف المواد الحاملة القابلة للانحلال حيوياً وذات الإطلاق البطيء جيداً في التقنية. وتعتبر هذه المواد الحاملة مواد يمكنها تشكيل جسيمات تعمل على احتجاز مركب فعال (مركبات فعالة) فيها وإحلاله/إذابته ببطء في وسط ملائم (مثلاً، وسط مائي، حمضي، قاعدي، .. إلخ) وبذلك إحلاله/إذابته في موانع الجسم وإطلاق المركب الفعال (المركبات الفعالة) فيها. ويفضل أن تكون الجسيمات عبارة عن جسيمات دقيقة (أي، بقطر في المدى من حوالي ١ إلى ٥٠٠ نانومتر، ويفضل من حوالي ٥٠-٢٠٠ نانومتر، والأكثر تفضيلاً قطر يبلغ حوالي ١٠٠ نانومتر).

ويزود الاختراع الراهن أيضاً طرق لتحضير التراكيب الصيدلانية وفقاً لهذا الاختراع.

يخلط مركب بالصيغة (II) أو (II) أو زمير بصري، بد، استر، صنو فراغي، راسيمات أو مخلوط راسيمي منه، وملح منه، بصفته المقوم الفعال، خلطاً متآلفاً مع مادة حاملة صيدلانية وفقاً لتقنيات تركيب صيدلانية تقليدية، حيث يمكن أن تتخذ المادة الحاملة تشكيلة واسعة من الأشكال بالاعتماد على شكل المستحضر المرغوب للإعطاء، مثلاً، عن طريق الفم، أو عن طريق غير معوي مثلاً الإعطاء في العضل. وعند تحضير التراكيب على شكل جرعة تعطى عن طريق الفم، فإنه يمكن استخدام أي وسط من الأوساط الصيدلانية المألوفة. وعليه، فإنه بالنسبة لمستحضرات فموية سائلة، مثل، على سبيل المثال، المعلقات، الإكسيرات والمحاليل، تشمل المواد الحاملة والإضافات الملائمة الماء، الجليكولات، الزيوت، الكحولات، عوامل إضفاء النكهة، المواد الحافظة، العوامل الملونة وما شابه ذلك؛ وبالنسبة للمستحضرات الفموية الصلبة مثل، على سبيل المثال، المساحيق، الكبسولات، الأقراص الكبسولية (كابليت)، الكبسولات الهلامية والأقراص، تشمل المواد الحاملة والإضافات الملائمة النشويات، السكريات، المخففات، عوامل التحبيب، المواد المزلقة، المواد الرابطة، عوامل التفتيت وما شابه ذلك.

وبسبب سهولة إعطائها، تمثل الأقراص والكبسولات شكل وحدة الجرعة الأكثر فائدة، حيث تستخدم في هذه الحالة مواد حاملة صيدلانية صلبة بشكل واضح. وحسب الرغبة، يمكن أن تغلف الأقراص بمادة سكرية أو تغلف معويّاً بواسطة تقنيات قياسية. وبالنسبة للمستحضرات التي تعطى بطريقة غير معوية، تشمل المادة الحاملة عادة ماء معقم، رغم أنه يمكن وجود مقومات أخرى تستخدم، على سبيل المثال، لأغراض مثل المساعدة على الذوبان أو للحفظ كما يمكن تحضير معلقات قابلة للحقن، حيث يمكن في هذه الحالة استخدام مواد حاملة سائلة مناسبة، عوامل تعليق مناسبة وما شابه ذلك. وعند التحضير لغرض الإطلاق البطيء، تتم أولاً إذابة أو تشتيت مادة حاملة ذات إطلاق بطيء، ونموذجياً مادة حاملة بوليمرية، ومركب وفقاً للاختراع في مذيب عضوي. وبعد ذلك يضاف المحلول العضوي الناتج إلى محلول مائي للحصول على مستحلب من نوع زيت في ماء. ويفضل أن يشتمل المحلول المائي على عامل (عوامل) فعال سطحي. ويخير المذيب العضوي لاحقاً من المستحلب من نوع الزيت في الماء

للحصول على معلق غرواني من جسيمات تحتوي على المادة الحاملة ذات الإطلاق البطيء والمركب وفقاً للاختراع.

وستحتوي التراكيب الصيدلانية المذكورة في هذا البيان، لكل وحدة جرعة، مثلاً قرص، كبسولة، مسحوق، حقنة، تركيب ملء ملعقة شاي وما شابه ذلك، على مقدار من المقوم الفعال ضروري لتصريف جرعة فعالة كما وصف أعلاه. وستحتوي التراكيب الصيدلانية المذكورة في هذا البيان، لكل وحدة جرعة، مثلاً قرص، كبسولة، مسحوق، حقنة، تحميلية، ملعقة شاي مليئة وما شابه ذلك، على مقدار يتراوح من حوالي ٠,٠١ مجم إلى ٢٠٠ مجم/كجم من وزن الجسم لكل يوم. ويفضل أن يتراوح المقدار من حوالي ٠,٠٣ إلى ١٠٠ مجم/كجم من وزن الجسم لكل يوم، والأكثر تفضيلاً، مقدار يتراوح من حوالي ٠,٠٥ إلى ١٠ مجم/كجم من وزن الجسم لكل يوم. ويمكن إعطاء المركبات بنظام إعطاء مرة واحدة إلى ٥ مرات في اليوم. غير أنه، يمكن أن تختلف الجرعات على أساس احتياجات المرضى، حدة الحالة المرضية المعالجة والمركب المستخدم. ويمكن إعطاء الجرعات يومياً أو بشكل متكرر في فترات نظامية تالية.

ويفضل أن تكون هذه التراكيب على شكل وحدات من الجرعات مثل الأقراص، الحبوب، الكبسولات، المساحيق، الحبيبات، المحاليل أو المعلقات غير المعوية المعقمة، الحلاية الهوائية أو المرشحات السائلة المعاييرة، القطرات، الأمبولات، الأجهزة ذاتية الحقن أو التحاميل؛ وذلك لغرض الإعطاء الفموي، غير المعوي، داخل الأنف، تحت اللسان أو عن طريق المستقيم، أو لغرض الإعطاء عن طريق الاستنشاق أو الإنزاع. وبشكل بديل، يمكن أن يوجد التركيب على شكل ملائم للإعطاء مرة في الأسبوع أو مرة في الشهر؛ فعلى سبيل المثال، يمكن تكيف ملح عديم الذوبان من المركب الفعال، مثل ملح ديكانوات، لتزويد مستحضر مختزن للحقن في العضل. ولتحضير تراكيب صلبة مثل الأقراص، يخلط المقوم الفعال الأساسي مع مادة حاملة صيدلانية، مثلاً مقومات إعداد أقراص تقليدية مثل نشا الذرة، اللاكتوز، السكروز، السوربيتول، الطلق، حمض الستياريك، ستيرات المغنيسيوم، الفسفات ثنائي الكالسيوم أو المواد الصمغية، ومواد مخففة صيدلانية أخرى، مثل الماء، لتشكيل تركيب أولي صلب يحتوي على خليط متجانس من مركب وفقاً للاختراع الراهن، أو ملح مقبول صيدلياً

منه. وعند الإشارة إلى هذه التراكيب الأولية بأنها متجانسة، فإنه يقصد بأن المقوم الفعال يشتت بانتظام في كل التركيب بحيث يمكن تقسيم التركيب بسهولة إلى أشكال جرعات فعالة متكافئة مثل الأقراص، الحبوب والكبسولات. ثم يقسم هذا التركيب الأولي الصلب إلى أشكال جرعات وحيدة من النوع الموصوف أعلاه تحتوي على المقوم الفعال بمقدار يتراوح من ٠,١ إلى حوالي ٥٠٠ مجم وفقاً للاختراع الراهن. ويمكن تغليف الأقراص أو الحبوب للتركيب الجديد أو تركيبه بطريقة أخرى لتزويد شكل جرعة تزود الميزة المتمثلة بالمفعول طويل الأجل. وعلى سبيل المثال، يمكن أن يشتمل القرص أو الحبة على مكون جرعة داخلي ومكون جرعة خارجي، حيث يوجد الأخير على شكل غلاف فوق المكون المذكور أولاً. ويمكن فصل المكونين بواسطة طبقة معوية تعمل على مقاومة التفتت في المعدة وتسمح بمرور المكون الداخلي بشكل سليم في الاثني عشرى أو تأخير إطلاقه. ويمكن استخدام تشكيلة من المواد لهذه الطبقات المعوية أو الأغلفة، وتشمل مواد من هذا القبيل عدداً من الأحماض البوليمرية، ومن أمثلة هذه المواد صمغ اللك، كحول الأسيتيل وأسيتات السليلوز.

وتشمل الأشكال السائلة حيث يمكن دمج المركب بالصيغة (I) أو (II) لغرض الإعطاء عن طريق الفم أو عن طريق الحقن، محاليل مائية، أشربة مضاف إليها نكهات بشكل ملائم، معلقات مائية أو زيتية، ومستحلبات مضاف إليها نكهات مع زيوت صالحة للأكل مثل زيت بذور القطن، زيت السمسم، زيت جوز الهند أو زيت الفول السوداني، بالإضافة إلى الأكسيرات وسواغات صيدلية مشابهة. وتشمل عوامل تشتيت أو تعليق ملائمة للمعلقات المائية مواد صمغية اصطناعية وطبيعية مثل الكثيراء، الأفاقيا، الالجينات، الديكستران، كربوكسي مثيل سليلوز الصوديوم، مثيل السليلوز، البيروليدون متعدد الفينيل أو الجيلاتين. كما يمكن أن تشمل الأشكال السائلة في عوامل تشتيت أو تعليق مضاف إليها نكهات بشكل ملائم المواد الصمغية الاصطناعية والطبيعية، على سبيل المثال، الكثيراء الأفاقيا، مثيل-السليلوز وما شابه ذلك. وبالنسبة للإعطاء غير المعوي، تكون المعلقات والمحاليل المعقمة مرغوبة. وتستخدم مستحضرات متساوية التوتر تحتوي بوجه عام على مواد حافظة ملائمة عندما يكون الإعطاء في الوريد مرغوباً.

وبشكل مستحسن، يمكن إعطاء المركبات بالصيغة (I) أو (II) في جرعة يومية مفردة، أو يمكن إعطاء الجرعة اليومية الكلية في جرعات مجزأة تعطى مرتين، ثلاث أو أربع مرات يوميا. وعلاوة على ذلك، يمكن إعطاء المركبات وفقاً للاختراع الراهن على شكل جرعة داخل الأنف عن طريق استخدام موضعي لسواغات ملائمة تعطى داخل الأنف، أو عن طريق لطخات جلدية تعطى عبر الأدمة معروفة جيداً لأولئك الملمين في التقنية. وليتم الإعطاء على شكل نظام تصريف عبر الأدمة، سيكون إعطاء الجرعة، طبعاً، متواصلًا بدلاً من أن يكون منقطعاً طوال نظام إعطاء الجرعات.

فعلى سبيل المثال، بالنسبة للإعطاء الفموي على شكل قرص أو كبسولة، يمكن دمج مكون العقار الفعال مع مادة حاملة خاملة مقبولة صيدلياً غير سامة تعطى عن طريق الفم مثل الايثانول، الجليسرول، الماء وما شابه ذلك. وعلاوة على ذلك، يمكن، حسب الرغبة أو الإقتضاء، إضافة مواد رابطة؛ مواد مزلفة؛ عوامل تفتيت وعوامل ملوئة ملائمة إلى المخلوط. وتشمل المواد الرابطة الملائمة، على سبيل المثال لا الحصر، النشاء، الجيلاتين، السكريات الطبيعية مثل الجلوكوز أو بيتا-لاكتوز، المواد المحلّية من الذرة، المواد الصمغية الطبيعية والاصطناعية مثل الأفاقيا، الكثيراء أو أوليات الصوديوم، ستيارات الصوديوم، ستيارات المغنيسيوم، بنزوات الصوديوم، أسيتات الصوديوم، كلوريد الصوديوم وما شابه ذلك. وتشمل عوامل التفتيت، على سبيل المثال لا الحصر، النشاء، مثيل السليلوز، الأجار، البننتونيت، صمغ الزنثان وما شابه ذلك.

ويمكن أن يتفاوت مقدار الجرعة اليومية من المنتجات خلال مدى واسع من ١ إلى ٥٠٠٠ مجم لكل إنسان بالغ لكل يوم. وبالنسبة للإعطاء الفموي، يفضل أن تزود التراكيب على شكل أقراص تحتوي على ٠,٠١، ٠,٠٥، ٠,١، ٠,٥، ١,٠، ٢,٥، ٥,٠، ١٠,٠، ١٥,٠، ٢٥,٠، ٥٠,٠، ١٠٠، ١٥٠، ٢٠٠، ٢٥٠ و ٥٠٠ ملي جرام من المكون الفعال لغرض الضبط العرضي للجرعات المعطاة إلى المريض المراد معالجته. وعادة ما يزود مقدار فعال من العقار بمستوى جرعة يتراوح من حوالي ٠,٠١ مجم/كجم إلى حوالي ٢٠٠ مجم/كجم من وزن الجسم لكل يوم. وبصفة خاصة، مستوى جرعة يتراوح من حوالي ٠,٠٣ إلى حوالي ١٥ مجم/كجم من وزن الجسم لكل يوم، وعلى الأخص، مستوى جرعة يتراوح من حوالي ٠,٠٥

إلى حوالي ١٠ مجم/كجم من وزن الجسم لكل يوم. ويمكن إعطاء المركبات بنظام يصل إلى أربع مرات أو أكثر في اليوم، ويفضل مرة أو مرتين في اليوم.

ويمكن تحديد الجرعات المثلى المراد إعطاؤها بسهولة من قبل أولئك المتمرسين في التقنية، وستختلف تبعاً للمركب المعين المستخدم، طريقة الإعطاء، مفعول المستحضر، طريقة الإعطاء وتقدم الحالة المرضية. وبالإضافة إلى ذلك، ستتشأ الحاجة إلى ضبط الجرعات من العوامل المقترنة مع المريض المعين المعالج، بما في ذلك عمر المريض، وزنه، غذاؤه، وزمن الإعطاء.

كما يمكن إعطاء المركب وفقاً للاختراع الراهن على شكل أنظمة تصريف جسيمات دهنية، مثل حويصلات صغيرة أحادية الصفائح، حويصلات كبيرة أحادية الصفائح، وحويصلات متعددة الصفائح. ويمكن تشكيل الجسيمات الدهنية من تشكيلة من الدهون، بما في ذلك على سبيل المثال لا الحصر دهون أميفاتية مثل مركبات فسفاتيديل كولين، مركبات سفنجوميولين، مركبات فسفاتيديل إيثانول أمين، مركبات كرديوليبيين، مركبات فسفاتيديل سيرين، مركبات فسفاتيديل جليسيرول، أحماض فسفاتيديك، مركبات فسفاتيديل نوزيتول، مركبات ثاني أسيل ثالث مثيل أمونيوم بروبان، مركبات ثاني أسيل ثاني مثيل أمونيوم بروبان، وستياريل أمين، دهون متعادلة مثل مركبات ثلاثية الجليسيريد، وتوليفات منها. ويمكن أن تحتوي على كولسترول أو قد تخلو من الكولسترول.

ويمكن إعطاء المركب وفقاً للاختراع الراهن موضعياً أيضاً. ويمكن استخدام أي أداة تصريف، مثل أجهزة قسطرة لتصريف العقار داخل الأوعية، أسلاك، واقية طعم عقاقيرية وأدوات إرتصاف داخل تجويف الأنبوبة. ويفضل أن تحتوي أداة التصريف على واقية طعم تشتمل على طبقة خارجية أو غلاف يعمل على تصويل وإطلاق المركبات. ويمكن أن يشتمل نظام التصريف لأداة من هذا القبيل على قسطر تسريب موضعي يعمل على تصريف المركب بمعدل مضبوط من قبل الذي يعطي الدواء.

ويزود الاختراع الراهن أداة لتصريف عقار تشتمل على أداة طبية داخل تجويف الأنبوبة، يفضل واقية طعم، وجرعة علاجية من مركب وفقاً للاختراع.

- ويشير المصطلح "واقية طعم" إلى أي أداة يمكن أن تصرف بواسطة قسطرة. وتستخدم واقية طعم بشكل روتيني لمنع انسداد الأوعية الناتج عن حالات الشنوذ الفيزيائي مثل النمو الداخلي غير المرغوب للنسيج الوعائي الناتج عن الكلم الجراحي. وغالباً ما يكون لها بنية شبكية اتساعية، أنبوبية مناسبة لتُترك داخل تجويف قناة للتخلص من حدوث انسداد ما. ٥
- ويكون لواقية الطعم سطح ملامس لجدار تجويف و سطح معرض لتجويف. ويكون السطح الملامس لجدار التجويف عبارة عن السطح الخارجي للأنبوب ويكون السطح المعرض للتجويف عبارة عن السطح الداخلي للأنبوب. ويمكن أن تكون واقية الطعم عبارة عن بوليمر، معدن أو بوليمر ومعدن، ويمكن بشكل اختياري أن تتحل حيويًا.
- وعادة ما تولج واقيات الطعم وفي التجويف في صورة غير توسعية ثم تتسع تلقائياً، أو بمساعدة أداة ثانية في الموضع الملائم. وتحدث طريقة نموذجية للتوسع من خلال استخدام بالون تقويم أوعية مركب على قسطر حيث يُنفخ داخل ممر الجسم أو الوعاء المتضيق أو لأجل التخلص من وإعاقة تقدم الانسدادات المقترنة بمكونات الجدار للوعاء ولغرض الحصول على تجويف موسَّع. كما يمكن استخدام واقيات الطعم ذاتية التوسع الموصوفة في براءة الاختراع الأمريكية قيد النظر رقم A1 ٢٥١٦٦٢٥/٢٠٠٢ باسم فالونتيكو ومعاونيه. ويمكن أن تزود التوليفة من واقية طعم مع عقاقير، عوامل أو مركبات تقوي من الالتهاب والتكاثر ١٥
- المعالجة الأكثر فعالية لمعاودة التضيق عقب تقويم الأوعية.
- ويمكن دمج المركبات وفقاً للاختراع أو تثبيتها بواقية الطعم بواسطة عدة طرق وباستخدام أي عدد من المواد المتوافقة حيويًا. وفي تجسيد تمثيلي، يدمج المركب مباشرة في مادة أساس بوليمرية، مثل بوليمر متعدد البيروول، ويغلف فيما بعد السطح الخارجي لواقية الطعم. وبصفة أساسية، يتم تصويل المركب من مادة الأساس بالانتشار خلال جزيئات البوليمر. وتوصف واقيات الطعم وطرق لتغليف العقاقير على واقيات الطعم بالتفصيل في ٢٠
- نشرة براءة الاختراع الدولية رقم ٩٦٣٢٩٠٧ وفقاً للمنظمة العالمية للملكية الفكرية. وفي تجسيد تمثيلي آخر، تغلف واقية الطعم أولاً بطبقة أساس تشتمل على محلول من المركب، إيثيلين-مع-أسيئات فينيل، و ميثاكريلات متعدد بيوتيل. ثم، تغلف واقية الطعم بشكل إضافي بطبقة خارجية لا تشتمل إلا على ميثاكريلات متعدد بيوتيل. وتعمل الطبقة الخارجية كحاجز ٢٥

انتشار لمنع المركب من التصويل بسرعة كبيرة والدخول إلى الأنسجة المحيطة. وتحدد سماكة الطبقة الخارجية أو الكسوة الفوقية المعدل الذي يتم عنده تصويل المركب من مادة الأساس. وتوصف واقيات الطعم وطرق التغليف بالتفصيل في نشرة براءة الاختراع الأمريكية رقم ٢٠٠٢/٠٠١٦٦٢٥ والمراجع المذكورة فيها.

٥ ويمكن إضافة محلول من المركب وفقاً للاختراع والمواد/البوليمرات المتوافقة حيويًا إلى أو على واقية طعم بواسطة عدة طرق. فعلى سبيل المثال، يمكن رش المحلول على واقية الطعم أو يمكن غمس واقية الطعم في المحلول. وفي تجسيد مفضل، يُرش المحلول على واقية الطعم ثم تترك لتجف. وفي تجسيد تمثيلي آخر، يمكن شحن المحلول كهربائياً بأحد القطبيتين وتشحن واقية الطعم كهربائياً بالقطبية المعاكسة. وبهذه الكيفية، سينجذب المحلول وواقية الطعم نحو بعضهما البعض. وباستخدام هذا النوع من عمليات الرش، يمكن تقليل الفضالة ويمكن تحقيق ضبط أكثر لسماكة الطبقة الخارجية. ويفضل أن يثبت المركب بالسطح الخارجي لواقية الطعم فقط مما يؤدي إلى حدوث تلامس مع أحد النسجة. غير أنه بالنسبة لبعض المركبات، يمكن تغليف كل واقية الطعم. وتكون التوليفة من جرعة المركب الموضوعة على واقية الطعم وطبقة البوليمر الخارجية التي تتحكم بإطلاق العقار مهمة في فعالية العقار. ويفضل أن يبقى المركب على واقية الطعم لمدة لا تقل عن ثلاثة أيام إلى ستة أشهر أو أكثر تقريباً، ويفضل لمدة بين سبعة أيام وثلاثين يوماً.

١٠ ويمكن استخدام أي عدد من البوليمرات المتوافقة حيويًا غير القابلة للحت بالاقتران مع المركب وفقاً للاختراع. ومن المهم ملاحظة إمكانية استخدام بوليمرات مختلفة لواقيات طعم مختلفة. على سبيل المثال، تعمل مادة الأساس من اثيلين-مع-أسيئات فينيل و ميثاكريلات متعدد بيوتيل الموصوفة أعلاه جيداً مع واقيات طعم من الفولاذ الذي لا يصدأ. ويمكن استخدام بوليمرات أخرى بشكل أكثر فعالية مع واقيات طعم شكلت من مواد أخرى، بما في ذلك مواد تظهر خواص فائقة المرونة مثل سبائك من النيكل والتيتانيوم.

٢٠ ويزود الاختراع الراهن أيضاً طريقة لمعالجة اضطرابات متعلقة بـ PDGF-R، بصفة خاصة معاودة التضيق، التكثر النسيجي لجوانية الأوعية أو الالتهاب، في جدران الأوعية

الدموية، حيث تتضمن التصريف المضبوط، بواسطة إطلاق من أداة طبية داخل تجويف الأنبوبة، مثل واقية طعم، مركب وفقاً للاختراع بمقادير فعالة علاجياً.

وتعرف طرق لإدخال واقية طعم إلى تجويف جسم جيداً ويفضل إدخال واقيات الطعم المغلفة بالمركب وفقاً لهذا الاختراع باستخدام قسطن. وكما سيدرك من قبل أولئك الملمين في التقنية، ستختلف الطرق بدرجة طفيفة على أساس موقع غرز واقية الطعم. وبالنسبة لغيرز واقية طعم تاجية، يولج القسطن البالوني الذي يحتوي على واقية الطعم في الشريان التاجي وتوضع واقية الطعم في الموقع المرغوب. وينفخ البالون، موسعاً واقية الطعم. وعند اتساع واقية الطعم، تتلامس واقية الطعم مع جدار التجويف. وبمجرد وضع واقية الطعم، يفرغ البالون من الهواء ويزال. وتبقى واقية الطعم في مكانها مع السطح المتلامس للتجويف الذي يحتوي على المركب المتلامس مباشرة مع سطح جدار التجويف. ويمكن أن يرافق غرز واقية الطعم معالجة مضادة للتجلط حسب الحاجة.

ويمكن أن تختلف الظروف المثلى لتصريف المركبات لتستخدم في واقية الطعم وفقاً للاختراع تبعاً لاختلاف أنظمة التصريف الموضعي المختلفة المستخدمة، بالإضافة إلى خواص وتركيز المركبات المستخدمة. وتشمل الظروف التي يمكن استمثالها، على سبيل المثال، تراكيز المركبات، حجم التصريف، معدل التصريف، عمق اختراق جدار الأوعية، ضغط النفخ الأقرب، مقدار وحجم الاختراقات وملاءمة بالون القسطن لتصريف العقار. ويمكن استمثال الظروف لتثبيط تكاثر الخلايا العضلية الملساء عند موقع الإصابة بحيث لا يحدث انسداد شرياني كبير بسبب معاودة التضيق، كما قيس، على سبيل المثال، بواسطة قدرة الخلايا العضلية الملساء على التكاثر، أو بواسطة التغيرات في المقاومة الوعائية أو قطر التجويف. ويمكن تحديد الظروف المثلى على أساس البيانات التي حصل عليها من دراسات نماذج حيوانية باستخدام طرق حسابية روتينية.

وتتمثل طريقة بديلة أخرى لإعطاء مركبات هذا الاختراع في قرن المركب بعامل استهداف يوجّه المركب الاقتراضي إلى موقع التأثير المقصود الخاص به، أي، إلى خلايا بطانية وعائية، أو إلى خلايا ورمية. ويمكن استخدام كل من عوامل استهداف الجسم المضاد أو غير الجسم المضاد. وبسبب التفاعل التبادلي النوعي بين عامل الاستهداف وشريك الربط

المقابل الخاص به، يمكن إعطاء مركب وفقاً لهذا الاختراع بتركيز موضعية عالية عند موقع مستهدف قريب وبالتالي تتم معالجة الاضطراب عند الموقع المستهدف بشكل أكثر فعالية.

وتشتمل عوامل استهداف الجسم المضاد على أجسام مضادة أو شدفات ربط مع مستضد منها، ترتبط مع مكون يمكن استهدافه أو الوصول إليه لخلية ورمية، جهاز وعائي ورمي، أو سدى ورمي. ويفضل أن يكون "المكون الذي يمكن استهدافه أو الوصول إليه" للخلية الورمية، الجهاز الوعائي الورمي أو السدى الورمي عبارة عن مكون يعبر عنه عند السطح، يمكن الوصول إليه عند السطح أو متركز سطحياً. كما تشمل عوامل استهداف الجسم المضاد أجسام مضادة أو شدفات ربط مع مستضد منها، ترتبط مع مكون داخل الخلية يتم إطلاقه من خلية ورمية متخثرة. ويفضل أن تكون أجسام مضادة من هذا القبيل عبارة عن أجسام مضادة وحيدة النسيلة، أو شدفات ربط مع مستضد منها، ترتبط مع مستضد (مستضدات) عديم الذوبان داخل الخلايا موجود في خلايا قد تستحث لتكون منفذة، أو في أشباح خلوية لكل الخلايا الورمية والسوية بصفة جوهرية، ولكن لا توجد أو لا يمكن الوصل إليها عند السطح الخارجي لخلايا حية سوية لثديي.

وكما استخدم في هذا البيان، يشير المصطلح "جسم مضاد" بمعنى واسع إلى أي عامل ربط مناعي مثل IgG ، IgM ، IgA ، IgE ، $F(ab')_2$ ، شذفة أحادية التكافؤ مثل Fab' ، Fab ، Dab ، بالإضافة إلى أجسام مضادة مصممة مثل أجسام مضادة مأشوبة، أجسام مضادة معدلة بشرياً، أجسام مضادة ثنائية النوع، وما شابه ذلك. ويمكن أن يكون الجسم المضاد عديد النسيلة أو وحيد النسيلة، بالرغم من أن الجسم المضاد وحيد النسيلة هو المفضل. وتعرف مجموعة واسعة جداً من الأجسام المضادة في التقنية التي لها نوعية مناعية للسطح الخلوي لأي نوع ورمي صلب فعلياً (انظر ما جاء في الجدول الملخص حول الأجسام المضادة وحيدة النسيلة للأورام الصلبة في براءة الاختراع الأمريكية رقم ٥٨٥٥٨٦٦ باسم ثورب ومعاونيه). وتعرف طرق لأولئك المتمرسين في التقنية لإنتاج وفصل أجسام مضادة للورم (انظر مثلاً براءة الاختراع الأمريكية رقم ٥٨٥٥٨٦٦ باسم ثورب ومعاونيه، وبراءة الاختراع الأمريكية رقم ٦٣٤٢٢١٩ باسم ثورب ومعاونيه).

وتشمل عوامل استهداف غير الجسم المضاد عوامل نمو، مثل PDGF، VEGF و FGF؛
 ببتيدات تحتوي على ثالث ببتيد R-G-D يرتبط على وجه التخصيص بالجهاز الوعائي الورمي؛
 ومكونات استهداف أخرى مثل انيكسينات وربيطات ذات صلة. وبالإضافة إلى ذلك، يمكن
 كذلك استخدام تشكيلة من جزئيات عضوية أخرى كعوامل استهداف للأورام، ومن أمثلتها
 ٥ سكريدات قصيرة السلسلة من هياالورونان تميز على وجه التخصيص بروتين الارتباط مع
 الهياالورونان، بروتين سطحي خلوي يعبر عنه أثناء انتقال الخلية الورمية والخلية البطانية
 وأثناء تشكل أنبوب صغير يشبه الأنبوب الشعري (انظر براءة الاختراع الأمريكية رقم
 ٥٩٠٢٧٩٥ باسم تول ومعاونيه)، ومركبات متعددة الأنبيون، وبصفة خاصة مركبات متعددة
 الكبريتات أو متعددة الكبريتونات مثل متعددات سكريد متعددة الأنبيون مضاف إليها كبريتات
 ١٠ عند N- و O-، كبريتونات متعدد الستيرين ومركبات متعددة الأنبيون أخرى موصوفة في براءة
 الاختراع الأمريكية رقم ٥٧٦٢٩١٨ (باسم ثورب)، حيث ترتبط بشكل انتقائي مع الخلايا
 البطانية الوعائية.

وتعرف تقنيات لقرن شقات علاجية بأجسام مضادة جيداً، انظر، مثلاً، ما جاء عن
 أمون ومعاونيه في مقالة بعنوان "أجسام مضاد وحيدة النسيلة للاستهداف المناعي للعقاقير في
 ١٥ معالجة السرطان" في كتاب بعنوان الأجسام المضادة وحيدة النسيلة ومعالجة السرطان، عن
 ريزفيلد ومعاونيه، ص ٢٤٣-٢٥٦ (إصدار شركة آلان آر. ليس، إنك.، (Alan R. Liss)
 ١٩٨٥م)؛ وما جاء عن هليستروم ومعاونيه في مقالة بعنوان "أجسام مضادة لتصريف العقار"
 في كتاب بعنوان تصريف العقار المضبوط (الطبعة الثانية) للمحرر وبنسون ومعاونيه، ص
 ٦٢٣-٦٥٣ (إصدار شركة مارسيل ديكر، إنك. (Marcel Dekker, Inc.))؛ وما جاء عن ثورب
 ٢٠ في مقالة بعنوان "مواد حاملة لأجسام مضادة لعوامل التسمم الخلوي في معالجة السرطان:
 نظرة عامة حول الأجسام المضادة وحيدة النسيلة ٨٤ في مجلة التطبيقات الحيوية والسريرية
 للمحرر بنشيرا ومعاونيه، ص ٤٧٥-٥٠٦، (١٩٨٥م). ويمكن كذلك تطبيق تقنيات مشابهة
 لربط المركبات وفقاً لاختراع مع عوامل استهداف غير الجسم المضاد. وسيدرك أولئك
 المتمرسين في التقنية، أو قد يتمكنوا من تحديد، طرق لتشكيل مركبات اقترانية مع عوامل

استهداف غير الجسم المضاد، مثل جزئيات صغيرة، بتيدات قصيرة السلسلة، متعددة سكرية، أو مركبات متعددة الأنبيون أخرى.

وبالرغم من إمكانية استخدام أي شق رابط ثابت بشكل معقول في الدم لربط المركب وفقاً للاختراع بعامل الاستهداف، تفضل روابط قابلة للإطلاق حيويًا و/أو فواصل أو واصلات قابلة للانشقاق انتقائيًا. ولا تزال "الروابط القابلة للإطلاق حيويًا" و "الفواصل أو الوصلات القابلة للانشقاق انتقائيًا" تمتلك ثباتًا معقولاً عند الدوران، ولكنها تكون قابلة للإطلاق، الانشقاق أو الحلمأة في ظروف محددة فقط أو بشكل مفضل، أي في وسط معين، أو عند التلامس مع عامل خاص. وتشمل روابط من هذا القبيل، على سبيل المثال، روابط ثنائية وثلاثية الكبريتيد وروابط حمضية غير ثابتة، مثل تلك الموصوفة في براءتي الاختراع الأمريكيتين أرقام ٥,٤٧٤,٧٦٥ و ٥,٧٦٢,٩١٨ وروابط تتأثر بالأنزيم، بما في ذلك روابط ببتيدية، استرات، أميدات، مركبات فسفو ثاني استر وجليكوزيدات مثل تلك الموصوفة في براءتي الاختراع الأمريكيتين أرقام ٥,٤٧٤,٧٦٥ و ٥,٧٦٢,٩١٨. وتسهل سمات تصميم إطلاق انتقائي من هذا القبيل الإطلاق المعزز للمركبات من المركبات الاقترانية عند الموقع المستهدف المقصود.

ويزود الاختراع الراهن تركيباً صيدلياً يشتمل على مقدار فعال من المركب وفقاً للاختراع مقترناً مع عامل استهداف ومادة حاملة مقبولة صيدلياً موصوفة في المرجع سابق الذكر.

ويزود الاختراع الراهن أيضاً طريقة لمعالجة اضطراب مرتبط بـ PDGF-R، وبصفة خاصة ورم، تتضمن إعطاء الكائن الخاضع للمعالجة مقداراً فعالاً علاجياً من مركب بالصيغة (I) أو (II) مقترناً مع عامل استهداف. وعند استخدام بروتينات مثل أجسام مضادة أو عوامل نمو، أو متعددة سكرية كمعامل استهداف، فإنه يفضل إعطاؤها في صورة تراكيب قابلة للحقن. ويعطى محلول الجسم المضاد القابل للحقن في وريد، شريان أو في المائع الشوكي خلال مدة تتراوح من دقيقتين إلى حوالي ٤٥ دقيقة، ويفضل من ١٠ إلى ٢٠ دقيقة. وفي حالات معينة، يكون الإعطاء في الجلد وفي التجويف مفيداً للأورام المحصورة في مناطق قريبة من مناطق خاصة من الجلد و/أو تجاويف خاصة من الجسم. وبالإضافة إلى ذلك، يمكن استخدام عمليات إعطاء داخل الغمد للأورام التي تقع في الدماغ.

وتعتمد الجرعات الفعالة علاجياً من المركب وفقاً للاختراع المقترنة مع عامل استهداف على الفرد، نوع المرض، حالة المرض، طريقة الإعطاء ومتغيرات إكلينيكية أخرى. ويمكن تحديد الجرعات الفعالة بسهولة باستخدام بيانات يحصل عليها من نموذج حيواني. وتستخدم حيوانات خاضعة للاختبار تحمل أوراماً صلبة بشكل متكرر لاستمثال جرعات علاجية مناسبة قبل نقلها إلى وسط إكلينيكي. وتعرف نماذج من هذا القبيل بأنها موثوقة جداً ٥ في توقع استيرياتيجيات فعالة مضادة للسرطان. فعلى سبيل المثال، تستخدم فئران تحمل أوراماً صلبة بشكل واسع في اختبارات إكلينيكية أولية لتحديد أمداء مفعول عوامل علاجية تولد تأثيرات مضادة للورم مفيدة بأدنى درجة سمية.

وسيدرك متمرس في التقنية أنه قد تحتوي المركبات بالصيغة (I) أو (II) على ذرة كربون لا تماثلية واحدة أو أكثر في بنيتها. ويراد أن يشتمل الاختراع الراهن ضمن نطاقه على الأشكال الزميرية النقية من ناحية فراغية كيميائية للمركبات بالإضافة إلى مخاليطها الراسيمية ويمكن الحصول على الأشكال الزميرية النقية من الناحية فراغية كيميائية بتطبيق مبادئ معروفة في التقنية. ويمكن فصل الأصناء الفراغية بواسطة طرق فصل فيزيائية مثل تقنيات التبلور التجزيئي والتقنية الاستشرابية، ويمكن فصل الأبداد عن بعضها بواسطة التبلور الانتقائي للأملاح الصنو فراغية بواسطة أحماض أو قواعد فعالة بصرياً أو بواسطة استشراب لا تماثلي. ويمكن كذلك تحضير زمراء فراغية بشكل تخليقي من مواد أولية مناسبة نقية من ناحية فراغية كيميائية، أو باستخدام تفاعلات ذات انتقائية فراغية. ١٥

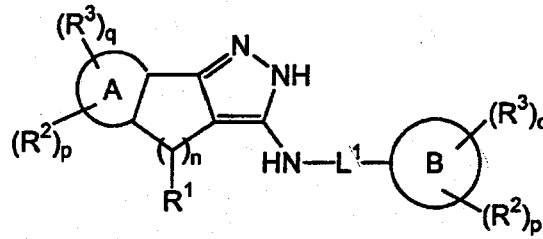
وقد يكون لبعض المركبات وفقاً للاختراع الراهن زمراء مقابل ومجاور. وبالإضافة إلى ذلك، عندما تنتج عمليات تستخدم لتحضير المركبات وفقاً للاختراع خليط من الزمراء الفراغية، يمكن فصل هذه الزمراء بواسطة تقنيات تقليدية مثل الاستشراب التحضيري. ويمكن تحضير المركبات في صورة زمير فراغي مفرد أو في صورة راسيمية كخليط من بعض الزمراء الفراغية الممكنة. ويمكن الحصول على الأشكال غير الراسيمية بالتخليق أو التحليل. ويمكن، على سبيل المثال، تحليل المركبات إلى مكوناتها البدية بواسطة تقنيات قياسية، مثل تشكيل الأزواج الصنو فراغية بتشكيل الملح. ويمكن كذلك تحليل المركبات بواسطة رابطة إسهامية مع مادة مساعدة لانطباقية، ثم فصل استشرابي و/أو فصل تبلري، وإزالة المادة ٢٥

المساعدة اللانطباقية. وبشكل بديل، يمكن تحليل المركبات باستخدام استشراب لانطباقية. ويراد أن يغطي نطاق الاختراع الراهن كل هذه الزمراء أو الزمراء الفراغية بحد ذاتها، بالإضافة إلى مخاليط من الزمراء مقابل ومجاور، مخاليط من الأصناء الفراغية وأيضاً المخاليط الراسيمية للأبداد (زمراء بصرية).

وفي حين تذكر المواصفة السابقة مبادئ الاختراع الراهن، بواسطة الأمثلة المزودة لغرض التوضيح، سيفهم بأن تطبيق الاختراع يشمل كل الاختلافات، التكيفات و/أو التعديلات المألوفة التي تقع ضمن نطاق عناصر الحماية التالية ومكافئاتها.

عناصر الحماية

١- مركب بالصيغة (I):



(١)

حيث:

n يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من ١ إلى ٤؛

R¹ يختار من الفئة التي تتكون من هيدروجين، ألكيل منخفض (الوزن

الجزئي)، -OH، ألكوكسي، أكسو، -NH₂، (ألكيل)-NH، و (ألكيل)-N؛

أختار من الفئة التي تتكون من مجموعة أريل، أريل مخلط أحادي

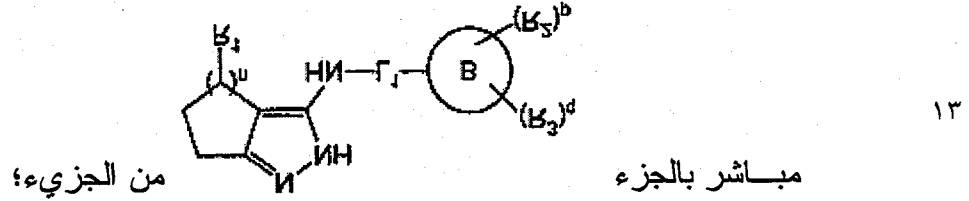
الحلقة به خمسة أو ستة أعضاء، أريل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة

أعضاء، ألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مدمج

مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث ترتبط مجموعة الأريل المخلط المدمج مع

البنزو، الألكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المدمج مع

١٢ البنزو بالجزيء على نحو يكفل ارتباط حلقة الفينيل بشكل



١٤ P يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

١٥ R^2 يختار من الفئة التي تتكون من $\text{X}-\text{A}^1-\text{Y}-\text{A}^2$ و $\text{X}-\text{A}^1-\text{D}$ حيث،

١٧ X و Y غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من

١٨ $-\text{NHC}(=\text{O})-$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})-$ ، $-\text{SO}_2-$ ، $-\text{SO}-$ ، $-\text{S}-$ ، $-\text{N}(\text{الكيل})-$ ، $-\text{NH}-$ ، $-\text{O}-$

١٩ $-\text{NHC}(=\text{O})\text{O}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})\text{O}-$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})-$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ ، $-\text{N}(\text{الكيل})\text{C}(=\text{O})-$ ،

٢٠ $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})-$ ، $-\text{N}(\text{الكيل})\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ ، $\text{OC}(=\text{O})\text{NH}-$

٢١ $-\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})-$ ، $-\text{N}(\text{الكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})-$ ، $-\text{N}(\text{الكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})-$

٢٢ $-\text{SO}_2\text{NH}-$ ، $-\text{SO}_2\text{N}(\text{الكيل})-$ و $-\text{SO}_2\text{N}(\text{الكيل})-$ ؛

٢٣ A^1 غير موجود أو يختار من ألكيل أو الكينيل؛

٢٤ A^2 يختار من ألكيل، الكينيل أو H؛ حيث، عندما يمثل A^1 أو A^2 ألكيل أو الكينيل، فإنه

٢٥ يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو

٢٦ أكثر تختار كل على حدة من هالوجين، سيانو، هيدروكسي، ألكوكسي، ثيو،

٢٧ ألكوكسي مهلجن، ألكيل $-\text{OC}(=\text{O})-$ ، ألكيل $-\text{OC}(=\text{O})\text{O}-$ ، أمينو، ألكيل أمينو،

٢٨ ألكيل $-\text{NHC}(=\text{O})-$ ، ألكيل $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})-$ ، ثاني ألكيل أمينو، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ،

٢٩ ألكيل $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}-$ ، ألكيل $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ ، $-\text{N}(\text{الكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، $-\text{N}(\text{الكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ،

٣٠ ألكيل $-\text{OC}(=\text{O})\text{NH}-$ ، ألكيل $-\text{NHC}(=\text{O})\text{O}-$ ، ألكيل $-\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{الكيل})-$ ، ألكيل $-\text{NHSO}_2-$ ،

٣١ ألكيل $-\text{SO}_2\text{N}(\text{الكيل})-$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل $-\text{SO}_2-$ ، ألكيل $-\text{SO}_2\text{O}-$ ، ألكيل $-\text{SO}_2\text{NH}-$ ،

٣٢ $(\text{الكيل})_2\text{N}(\text{الكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})_2$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})_2$ أو $(\text{الكيل})_2\text{N}(\text{الكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})_2$ ؛

٣٣ **(D)** يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير

٣٤ مشبعة جزئياً، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو

٣٥ عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث

٣٦ يمكن أن يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل

٣٧ المخلط، الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي

٣٨ المخلط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من

٣٩ هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي،

٤٠ ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})$ ، أو ثاني ألكيل

٤١ أمينو، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{الكيل})$ ،

٤٢ $(\text{الكيل})\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{الكيل})$ ، ألكيل NHSO_2 ،

٤٣ ألكيل $\text{SO}_2(\text{الكيل})$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ،

٤٤ ألكيل SO_2 مهلجن، $(\text{الكيل})_2\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})_2$ ، $(\text{الكيل})_2\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})$ أو

٤٥ $(\text{الكيل})_2\text{N}(\text{الكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})_2$ ؛

٤٦ q يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛

٤٧ R^3 يختار من الفئة التي تتكون من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو،

٤٨ ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ،

٤٩ ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})$ ، أو ثاني ألكيل أمينو، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ،

٥٠ ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{الكيل})$ ، ألكيل $\text{OC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ،

٥١ ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{الكيل})$ ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل $\text{SO}_2(\text{الكيل})$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل

٥٢ مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، $(\text{الكيل})_2\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})_2$ ،

٥٣ $(\text{الكيل})_2\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})$ و $(\text{الكيل})_2\text{N}(\text{الكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})_2$ ؛

٥٤ شريطة أن يكون حاصل جمع p و q مساوياً لعدد صحيح تتراوح قيمته من صفر إلى

٤؛

٥٥

L^1 غير موجود أو يختار من الفئة التي تتكون من ألكيل؛

٥٦

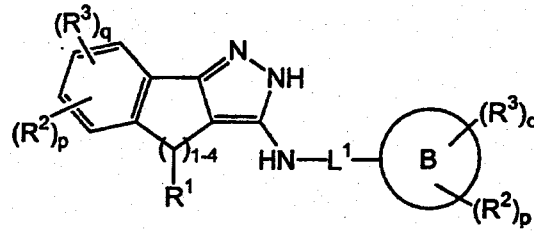
٥٧ (B) يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة

٥٨ جزئياً، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة

٥٩ أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛

٦٠ أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه.

١ ٢- مركب وفقاً لعنصر الحماية ١ بالصيغة (Ia):



(Ia)

١ ٣- مركب وفقاً لعنصر الحماية ١، حيث:

٢ n يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من ١ إلى ٢؛

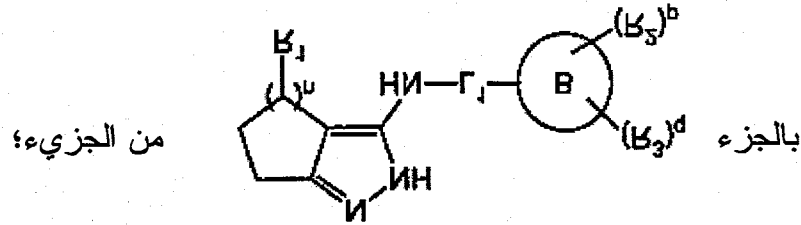
٣ R^1 يمثل هيدروجين؛

٤ (A) يختار من الفئة التي تتكون من مجموعة فنيل، أريل مخلط به خمسة أو

٥ ستة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث ترتبط

٦ مجموعة الألكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو والذي به تسعة أو عشرة

٧ أعضاء بالجزيء بشكل يكفل ارتباط حلقة الفينيل مباشرة



٩ P يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

١٠ R^2 يختار من الفئة التي تتكون من ثاني (ألكيل منخفض) أمينو-ألكوكسي، ألكيل

١١ منخفض-ألكوكسي، ألكوكسي يحمل بديلاً من هيدروكسي و $\text{O}-A^1-\text{D}$ ؛

١٢ حيث A^1 يختار من الفئة التي تتكون من ألكيل منخفض؛ حيث يحمل الألكيل المنخفض

١٣ بشكل اختياري بديلاً واحداً أو بديلين يختار كل منهما على حدة من هيدروكسي، أمينو،

١٤ ألكيل أمينو أو ثاني ألكيل أمينو؛

١٥ وحيث D يختار من الفئة التي تتكون من أربل مخلط به خمسة أو ستة

١٦ أعضاء وألكيل حلقي مخلط به خمسة أو ستة أعضاء؛ حيث يحمل الأربل المخلط أو

١٧ الألكيل الحلقي المخلط بشكل اختياري بديلاً واحداً أو بديلين يختار كل منهما على حدة

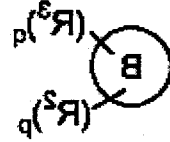
١٨ من هالوجين، ألكيل منخفض، ألكوكسي منخفض، أمينو، ألكيل منخفض أمينو أو ثاني

١٩ (ألكيل منخفض) أمينو؛

٢٠ q يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

٢١ R^3 يختار من الفئة التي تتكون من ألكيل منخفض وألكوكسي منخفض، وهالوجين؛

- ٢٢ L^1 غير موجود أو يمثل ألكيل منخفض؛
- ٢٣ يختار من الفئة التي تتكون من مجموعة فنيل وأريل مخلط به خمسة أو ستة أعضاء؛ حيث تحمل مجموعة الفينيل أو الأريل المخلط بشكل اختياري بديلاً واحداً أو بديلين يختار كل منهما على حدة من هالوجين، ألكيل منخفض، ألكوكسي منخفض أو بنزيلوكسي؛
- ٢٤
- ٢٥
- ٢٦
- ٢٧ أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه.
- ١ -٤- مركب وفقاً لعنصر الحماية ١، حيث:
- ٢ n يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من ١ إلى ٢؛
- ٣ R^1 يمثل هيدروجين؛
- ٤ يختار من الفئة التي تتكون من فنيل، ثينيل، و ١،٣-بنزوديوكسوليل؛
- ٥ P يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛
- ٦ R^2 يختار من الفئة التي تتكون من ٣-ثاني ميثيل أمينو-بروبوكسي، ٣-مثنوكسي-بروبوكسي، ٢،٣-ثاني هيدروكسي-بروبوكسي، ٣-هيدروكسي-بروبوكسي، ٢-هيدروكسي-٣-بيروليدينيل (١)-بروبوكسي و ٣-٤-مثنيل-بييرازينيل (١)-بروبوكسي؛
- ٧
- ٨
- ٩
- ١٠ q يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛
- ١١ R^3 يختار من الفئة التي تتكون من ميثيل، مثنوكسي، إيثوكسي؛
- ١٢ L^1 غير موجود أو يمثل CH_2 ؛

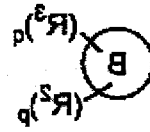


- ١٣ يختار من الفئة التي تتكون من فنيل وبيريديل؛ حيث يحمل الفنيل بشكل
- ١٤ اختياري بديلاً واحداً أو بديلين يختار كل منهما على حدة من فلورو، كلورو، مثيل،
- ١٥ مثوكسي أو بنزيلوكسي؛
- ١٦ أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه.
- ١ -٥- مركب وفقاً لعنصر الحماية (١)، حيث:
- ٢ يختار من الفئة التي تتكون من فنيل، أريل مخطط به خمسة أعضاء، أريل
- ٣ مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أعضاء والكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة
- ٤ أعضاء؛
- ٥ R^1 يختار من الفئة التي تتكون من هيدروجين، هيدروكسي، ألكسو والكيل منخفض؛
- ٦ P يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛
- ٧ R^2 يختار من الفئة التي تتكون من الكيل حلقي مخطط، بنزيلوكسي، ثاني (الكيل
- ٨ منخفض) أمينو-ألكوكسي منخفض، ألكوكسي منخفض-ألكوكسي منخفض، أريل مخطط-
- ٩ ألكوكسي منخفض، ألكيل حلقي مخطط-ألكوكسي منخفض وألكوكسي منخفض؛ حيث
- ١٠ يحمل الألكيل الحلقي المخطط، لوحده أو كجزء من مجموعة بديلة بشكل اختياري بديلاً
- ١١ يختار من ألكيل منخفض أو هيدروكسي؛ حيث يحمل الألكوكسي المنخفض، لوحده أو
- ١٢ كجزء من مجموعة بديلة بشكل اختياري بديلاً واحداً أو بديلين من هيدروكسي؛
- ١٣ q يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛
- ١٤ R^3 يختار من الفئة التي تتكون من هيدروكسي، ألكوكسي منخفض، ألكيل منخفض،
- ١٥ هالوجين، أمينو، (الكيل منخفض) أمينو وثاني (الكيل منخفض) أمينو؛

- ١٦ L^1 غير موجود أو يختار من الفئة التي تتكون من ألكيل منخفض؛
- ١٧ يختار من الفئة التي تتكون من فنيل، ألكيل حلقي، ألكيل حلقي مدمج
- ١٨ مع بنزو، أريل مخلط وألكيل حلقي مخلط؛ حيث يحمل الفينيل بشكل اختياري بديلاً
- ١٩ واحداً إلى ثلاثة بدائل تختار كل على حدة من هيدروكسي، كربوكسي، هالوجين،
- ٢٠ ألكيل منخفض، ألكيل منخفض يحمل بديلاً من هيدروكسي، ألكوكسي منخفض، ألكوكسي
- ٢١ منخفض كربونيل، ثالث فلورو مثيل، ثالث فلورو ميثوكسي، ألكيل منخفض أمينو، ثاني
- ٢٢ (ألكيل منخفض) أمينو، سيانو، نثرو، أمينو كربونيل، ألكيل منخفض أمينو كربونيل،
- ٢٣ ثاني (ألكيل منخفض) أمينو كربونيل، (ألكيل منخفض يحمل بديلاً من هيدروكسي)-
- ٢٤ أمينو كربونيل، (أريل مخلط-ألكيل منخفض)-أمينو كربونيل، ألكيل منخفض-ثيو، ثالث
- ٢٥ فلورو مثيل ثيو، ألكيلوكسي، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مخلط يحمل بديلاً من
- ٢٦ ألكيل منخفض أو ألكيل حلقي مخلط-كبريتونيل؛
- أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه.

- ١ ٦- مركب وفقاً لعنصر الحماية ٥، حيث:
- ٢ يختار من الفئة التي تتكون من فنيل، ثيينيل و ١،٣-بنزوديوكسوليل؛
- ٣ R^1 يختار من الفئة التي تتكون من هيدروجين، هيدروكسي، ألكسو ومثيل؛
- ٤ P يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛
- ٥ R^2 يختار من الفئة التي تتكون من بيبيريدينيل، ٤-مثيل-بيبيريزينيل (١)، ٣-٤-
- ٦ مثيل-بيبيرازينيل (١)-بروبوكسي، ٣-ثاني مثيل أمينو-بروبوكسي، ٣-مئوكسي-
- ٧ بروبووكسي، ٣-مورفولينيل (١)-بروبوكسي، ٣-بيروليدينيل (١)-بروبوكسي، ٣-
- ٨ إيميدازوليل (١)-بروبوكسي، ٣، ٢-ثاني هيدروكسي-بروبوكسي، ٣-هيدروكسي-

- ٩ بروبيوكسي، ٢-هيدروكسي-٣-بيروليدينيل (١)-بروبوكسي وبنزيلوكسي؛
- ١٠ q يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛
- ١١ R^3 يختار من الفئة التي تتكون من هيدروكسي، ميثوكسي، إيثوكسي، أيزوبروبوكسي،
- ١٢ ميثيل، برومو، فلورو، كلورو، أمينو وثاني ميثيل أمينو؛
- ١٣ L^1 غير موجود أو يختار من الفئة التي تتكون من ميثيل وإيثيل؛

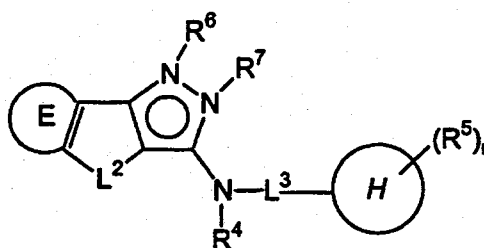


- ١٤ يختار من الفئة التي تتكون من فنييل، ٤-كلورو فنييل، ٣-كلورو فنييل،

- ١٥ ٢-كلورو فنييل، ٢-فلورو فنييل، ٣-فلورو فنييل، ٤-فلورو فنييل، ٢-برومو فنييل، ٣-
- ١٦ برومو فنييل، ٤-برومو فنييل، ٢-ميثيل فنييل، ٣-ميثيل فنييل، ٤-ميثيل فنييل، ٢-إيثيل فنييل،
- ١٧ ٣-إيثيل فنييل، ٢-أيزوبروبيل فنييل، ٢-ميثوكسي فنييل، ٣-ميثوكسي فنييل، ٤-ميثوكسي فنييل،
- ١٨ فنييل، ٣-ميثوكسي كربونيل فنييل، ٣-إيثوكسي كربونيل فنييل، ٤-إيثوكسي كربونيل فنييل،
- ١٩ ٣-هيدروكسي فنييل، ٣-سيانو فنييل، ٤-سيانو فنييل، ٣-كربوكسي فنييل، ٢-ثالث فلورو
- ٢٠ ميثيل فنييل، ٣-ثالث فلورو ميثيل فنييل، ٤-ثالث فلورو ميثيل فنييل، ٢-ثالث فلورو
- ٢١ ميثوكسي فنييل، ٣-ثالث فلورو ميثوكسي فنييل، ٤-ثالث فلورو ميثوكسي فنييل، ٣-
- ٢٢ هيدروكسي ميثيل-فنييل، ٣-(١-هيدروكسي إيثيل) فنييل، ٣-ميثيل ثيو فنييل، ٣-ثالث
- ٢٣ فلورو ميثيل ثيو فنييل، ٣-بنزيلوكسي-فنييل، ٤-بنزيلوكسي فنييل، ٤-ميثيل أمينو فنييل،
- ٢٤ ٤-ثاني ميثيل أمينو فنييل، ٣-أمينو كربونيل فنييل، ٥، ٢-ثاني فلورو فنييل، ٤، ٣-ثاني
- ٢٥ فلورو فنييل، ٥، ٣-ثاني فلورو فنييل، ٤، ٢-ثاني كلورو فنييل، ٥، ٢-ثاني كلورو فنييل،
- ٢٦ ٦، ٢-ثاني كلورو فنييل، ٤، ٣-ثاني كلورو فنييل، ٥، ٣-ثاني كلورو فنييل، ٥، ٣-ثاني
- ٢٧ ميثيل فنييل، ٤، ٢-ثاني ميثوكسي فنييل، ٥، ٢-ثاني ميثوكسي فنييل، ٤، ٣-ثاني ميثوكسي
- ٢٨ فنييل، ٥، ٣-ثاني ميثوكسي فنييل، ٥، ٣-ثاني (ثالث فلورو ميثيل)-فنييل، ٥، ٣-ثاني (ثث-
- ٢٩ بيوتيل)-فنييل، ٣-كلورو-٤-فلورو-فنييل، ٣-كلورو-٤-ميثوكسي-فنييل، ٤-كلورو-٣-
- ٣٠ ميثيل-فنييل، ٥-كلورو-٢-ميثيل-فنييل، ٥-كلورو-٢-ميثوكسي-فنييل، ٤-برومو-٢-
- ٣١ ثالث فلورو ميثيل-فنييل، ٤-فلورو-٣-ثالث فلورو ميثيل-فنييل، ٤-فلورو-٣-نترو-فنييل،

- ٣٢ ٥، ٤، ٣-ثالث مثنوكسي فنييل، ٤- (٤-مثيل-بييريدينيل (١))-فنييل، ٤- (بييريدين-٤-
 ٣٣ كبريتونيل)-فنييل، ٣- (٢-هيدروكسي-إثيل أمينو كربونيل)-فنييل، ٣- (٣-بيروليدينيل
 ٣٤ (١)-بروبيل أمينو كربونيل)-فنييل، هكسيل حلقي، ٢-فوريل، ٣-بييريديل، ٤-
 ٣٥ مورفولينيل، ٥-إندوليل، ٦-إندازوليل، ٥-إندانيل، بييريدينيل و ٤، ٣-مثيلين ديوكسي
 ٣٦ فنييل؛
 ٣٧ أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه.

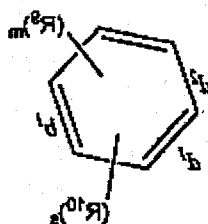
١ ٧- مركب بالصيغة (II):



(II)

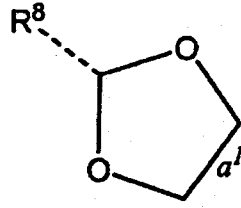
حيث:

٤ يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:



(الصيغة أ-١)،

- ٦ حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b¹ بالحلقة L² في الصيغة (II) وتحمل بشكل اختياري
 ٧ بديلاً واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-١'، أ-١-ب و أ-١-ج:



٨

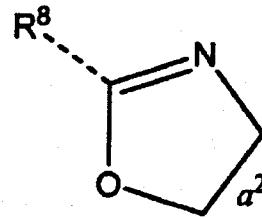
(الصيغة أ-١-أ')

حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ' من جهة a^1 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على

٩

الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

١٠



١١

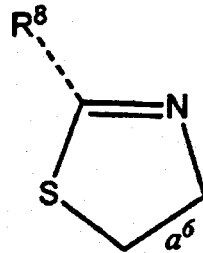
(الصيغة أ-١-ب)

حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على

١٣

الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و

١٤



١٥

(الصيغة أ-١-ج)

حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على

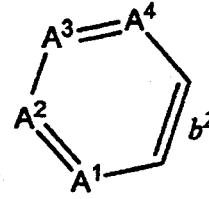
١٦

الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

١٧

حيث R^8 يمثل H أو ألكيل؛

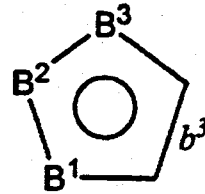
١٨



١٩

(الصيغة أ-٢)،

- ٢٠ حيث ترتبط الصيغة أ-٢ من جهة b^2 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، ويمثل A^1 ، A^2 ،
 ٢١ A^3 ، A^4 -N-(i)؛ أو (ii) -C- يحمل بديلاً من H أو الكوكسي، حيث يمكن أن يحمل
 ٢٢ الألكوكسي أيضاً بشكل اختياري بديلاً من الكوكسي على ذرة كربون طرفية أو ما لا
 ٢٣ يزيد عن ٣ ذرات هالوجين على ذرة كربون طرفية؛ شريطة أن يمثل واحداً على الأقل
 ٢٤ من A^1 ، A^2 ، A^3 ، A^4 أو اثنين على الأكثر -N؛ و



٢٥

(الصيغة أ-٣)،

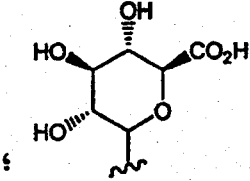
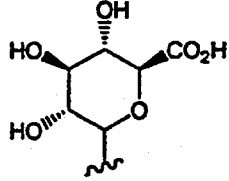
- ٢٦ حيث ترتبط الصيغة أ-٣ من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، ويمثل كل من B^1 ، B^2 ،
 ٢٧ و B^3 على حدة (i) -CH- يحمل بشكل اختياري بديلاً من الأكيل، أريل، الكوكسي أو
 ٢٨ هالوجين، (ii) -S-؛ (iii) -O-؛ أو (iv) -N-؛ شريطة أن واحداً على الأكثر من B^1 ، B^2 ،
 ٢٩ أو B^3 يمثل -S- أو -O-، و، شريطة أنه عندما B^1 ، B^2 أو B^3 يمثل -S- أو -O- فإن
 ٣٠ أعضاء الحلقة المجاورة لا تمثل -S- أو -O-؛
 ٣١ R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: الكوكسي، الأكيل، الأكيل أمينو،
 ٣٢ أمينو، سيانو، ثاني الأكيل أمينو، هالوجين، الأكيل مهلجن، الأيلوكسي مهلجن،
 ٣٣ الأكيل SO_2 مهلجن، ثيو الأكيل مهلجن، هيدروكسي، الأكيل $C(=O)$ (الأكيل)-N،
 ٣٤ N (الأكيل)- $C(=O)$ (الأكيل)-N، الأكيل $C(=O)NH$ (الأكيل)-N،
 ٣٥ الأكيل $C(=O)O$ (الأكيل)-N، الأكيل SO_2 (الأكيل)-N، الأكيل $NHC(=O)$

- ٥٧ A^{20} غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛ و
- ٥٨ A^{21} يختار من ألكيل، ألكينيل أو H؛
- ٥٩ حيث عندما يمثل A^{20} أو A^{21} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل أو الألكينيل
- ٦٠ بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل
- ٦١ أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن، ألكيل-SO₂-مهلجن،
- ٦٢ ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيلC(=O)N(ألكيل)-، N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)-،
- ٦٣ N(ألكيل)C(=O)NH ألكيل، ألكيلC(=O)NH(ألكيل)-، ألكيلC(=O)O(ألكيل)-، N(ألكيل)-
- ٦٤ ألكيل-SO₂(ألكيل)-، ألكيلNHC(=O)-، NHC(=O)N(ألكيل)-، -NHC(=O)-،
- ٦٥ NHC(=O)NH ألكيل، ألكيلNHC(=O)-، ألكيلNHC(=O)O-، ألكيل-
- ٦٦ NH-SO₂ ألكيل، ألكيلOC(=O)-، N(ألكيل)OC(=O)-، ألكيلNHOC(=O)-،
- ألكيلOC(=O)N(ألكيل)-، ثيو أو ثيو ألكيل؛



يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير

- ٦٨
- ٦٩ مشبعة جزئياً، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو
- ٧٠ عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث
- ٧١ يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخلط،
- ٧٢ الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المخلط
- ٧٣ المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من هالوجين،
- ٧٤ هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكوكسي مهلجن،
- ٧٥ ألكيل أمينو، ألكيلNHC(=O)-، ألكيلC(=O)N(ألكيل)-، أو ثاني ألكيل
- ٧٦ أمينو، -NHC(=O)NH₂، ألكيلNHC(=O)-، ألكيلC(=O)NH(ألكيل)-، N(ألكيل)-
- ٧٧ ألكيلNHOC(=O)-، ألكيلNHC(=O)O-، ألكيلC(=O)O(ألكيل)-، N(ألكيل)-
- ٧٨ ألكيلNH-SO₂، ألكيلSO₂(ألكيل)-، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل-SO₂،
- ٧٩ ألكيل-SO₂-مهلجن، NHC(=O)N(ألكيل)-، N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)- أو

- ٨٠ $(\text{الكيل})_2\text{N}(\text{C}=\text{O})\text{O}-$
- ٨١ s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛
- ٨٢ m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما لا يحمل
- ٨٣ E بديلاً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s
- ٨٤ يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤، وعندما يحمل
- ٨٥ E بديلاً
- ٨٦ واحداً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً
- ٨٧ صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛
- ٨٨ R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:
- ٨٩ $\text{H} (\text{ أ })$
- ٩٠  شريطة أن R^4 لا يمثل
- ٩١  (ب)
- ٩٢ (ج) CH_2- يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: $\text{H}-$ ، ميثيل-، ألكيل-، -
- ٩٣ CH_2OH ، $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OH}$ ، ألكيل- $\text{O}(\text{C}=\text{O})-$ ، $\text{OH}(\text{C}=\text{O})-$ ، ألكيل- $\text{O}(\text{C}=\text{O})-$ ،
- ٩٤ أريل- $\text{O}(\text{C}=\text{O})-$ ، أريل مخلوط- $\text{O}(\text{C}=\text{O})-$ ، $\text{NH}_2(\text{C}=\text{O})-$ ، ألكيل- $\text{NH}(\text{C}=\text{O})-$ ،
- ٩٥ $(\text{الكيل})_2\text{N}(\text{C}=\text{O})-$ ، ألكيل- $\text{C}(\text{O})-$ ، OCH_3 -فنيل- أو ألكيل- $\text{OC}(\text{O})$ -فنيل-؛
- ٩٦ (د) $(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{1-10}(\text{C}=\text{O})-$ ينتهي بـ H ، ميثيل، إيثيل أو بنزيل؛
- ٩٧ (هـ) $(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{1-10}(\text{C}=\text{O})\text{CH}_2-$ ينتهي بـ H ، ميثيل، إيثيل أو بنزيل؛
- ٩٨ (و) ألكيل- $\text{C}(\text{O})-$ أو ألكيل حلقي- $(\text{C}_3-6)(\text{C}=\text{O})-$ ، حيث يمكن أن يحمل
- ٩٩ ألكيل- $\text{C}(\text{O})-$ المذكور وألكيل حلقي- $(\text{C}_3-6)(\text{C}=\text{O})-$ المذكور بشكل

- ٩٨ اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O$ ،
- ٩٩ أريل ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $-N$ (ألكيل) $_2$ ، ألكيل حلقي مخطط،
- ١٠٠ ألكيل $-NHC(=O)$ ، ألكيل $-NHSO_2$ أو ألكيل $-OC(=O)$ ؛
- ١٠١ (ز) أريل $(CH_2)_{1-3}C(=O)$ ، أريل $-C(=O)$ ، أريل مخطط $(CH_2)_{1-3}C(=O)$ أو أريل مخطط $-C(=O)$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $(CH_2)_{1-3}C(=O)$ المذكور،
- ١٠٢ أريل $-C(=O)$ المذكور، أريل مخطط $(CH_2)_{1-3}C(=O)$ المذكور وأريل مخطط $-C(=O)$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل
- ١٠٥٤ على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $-N$ (ألكيل) $_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل $-NHC(=O)$ ، ألكيل $-NHSO_2$ ، هالوجين، نتريل أو
- ١٠٧ ألكيل $-OC(=O)$ ؛
- ١٠٨ (ح) $-C(=O)(CH_2)_{1-6}C(=O)-$ ينتهي بمثيل، اثيل، $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ،
- ١٠٩ $-N$ (ألكيل) $_2$ أو ألكيل حلقي مخطط؛
- ١١٠ (ح ح) ألكيل $-OC(=O)$ ألكيل $-C(=O)$ ينتهي بـ $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ،
- ١١١ $-N$ (ألكيل) $_2$ أو ألكيل حلقي مخطط؛
- ١١٢ (ط) $-C(=O)O(CH_2CH_2O-)_{1-10}$ ينتهي بـ H ، مثيل، اثيل أو بنزيل؛
- ١١٣ (ي) ألكيل $-C(=O)O$ أو ألكيل حلقي $-C(=O)O(C_{3-6})$ ، حيث يمكن أن يحمل ألكيل $-C(=O)O$ المذكور، وألكيل حلقي $-C(=O)O(C_{3-6})$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة
- ١١٤ واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ،
- ١١٥ $-N$ (ألكيل) $_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل $-NHC(=O)$ ، ألكيل $-NHSO_2$ ،
- ١١٦ ألكيل $-OC(=O)$ ، ألكيل $-C(=O)OH$ ، ألكيل $-C(=O)O$ ، ألكيل $-C(=O)NH_2$ ،
- ١١٧ ألكيل $-C(=O)NH$ أو $-C(=O)N$ (ألكيل) $_2$ ؛
- ١١٨ (ك) أريل $(CH_2)_{1-3}C(=O)O$ ، أريل $-C(=O)O$ ، أريل مخطط $(CH_2)_{1-3}C(=O)O$ أو أريل مخطط $-C(=O)O$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $(CH_2)_{1-3}C(=O)O$ المذكور،
- ١٢٠ أريل $-C(=O)O$ المذكور، أريل مخطط $(CH_2)_{1-3}C(=O)O$ المذكور أو أريل مخطط $-C(=O)O$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل
- ١٢٢

- (ع) $-C(=O)NHCH_2CH_2NH(CH_2CH_2NH-)_{0-3}$ ينتهي بـ H-، ميثيل، اثيل،
 ١٤٨
 الكيل $-CH_2CH_2NH-$ ، $(\text{الكيل})_2-CH_2CH_2N-$ ، $-CH_2CH_2-$ ، ١-بيروليدينيل، $-CH_2CH_2-$
 ١٤٩
 ١-بيبريدينيل، $-CH_2CH_2-$ ، ٤-مورفولينيل، $-CH_2CH_2-$ ، ١-بيبرازينيل،
 ١٥٠
 $-CH_2CH_2-$ ، ١-٤-بيبرازينيل، $-CH_2CH_2OH$ ، $-CH_2CH_2OCH_3$ ،
 ١٥١
 $CH_2CH_2OCH_2CH_3$ ، الكيل $-CH_2CH_2OC(=O)-$ أو أريل $-C(=O)-$ ؛ حيث يمكن أن
 ١٥٢
 يحمل جزء الأريل في أريل $-C(=O)-$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة
 ١٥٣
 أو أكثر تختار كل على حدة من: الكيل، -OH، الكيل-O، -NH₂، الكيل-NH،
 ١٥٤
 $(\text{الكيل})_2-N-$ ، هالوجين أو نتريل؛
 ١٥٥

(ف) $-C(=S)NH_2$ ؛ ١٥٦

(ق) الكيل $-C(=S)NH-$ ؛ ١٥٧

(ر) $(\text{الكيل})_2N-C(=S)-$ ؛ ١٥٨

(ش) $-SO_2NH_2$ ؛ ١٥٩

(ت) الكيل $-SO_2NH-$ ؛ ١٦٠

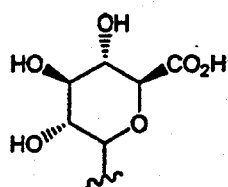
(ث) $(\text{الكيل})_2N-SO_2-$ ؛ ١٦١

(خ) $-P(=O)(OCH_3)_2$ ؛ و ١٦٢

(ذ) $-P(=O)(OCH_2CH_3)_2$ ؛ ١٦٣

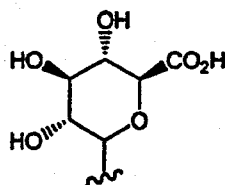
شريطة أنه عندما يكون R⁶ موجوداً، فإن R⁷ يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما
 ١٦٤

يكون R⁷ موجوداً، فإن R⁶ يكون غير موجود؛



؛ شريطة أنه إذا

R⁴ يختار من الفئة التي تتكون من: H و



فإن R⁴ يمثل H؛

كان R⁶ أو R⁷ يمثل

L³ غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من الكيل دييل،
 ١٦٨

كربونيل أو $-\text{SO}_2$ ؛

١٦٩

يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة

١٧٠

جزئياً، أرالكيل، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو

١٧١

عشرة أعضاء، أريل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، وألكيل حلقي

١٧٢

مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛

١٧٣

 r يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ و

١٧٤

 R^5 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكيل، ألكيل أمينو، ألكيلوكسي،

١٧٥

أمينو، $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ ، سيانو، ثاني ألكيل أمينو،

١٧٦

هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن،

١٧٧

هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ،

١٧٨

 $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{ألكيل})$ ، ألكيل $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{ألكيل})$ ،

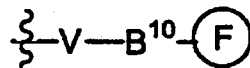
١٧٩

ألكيل $-\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{ألكيل})$ ، ألكيل $\text{SO}_2(\text{ألكيل})$ ، ألكيل $-\text{NHC}(=\text{O})$ ،

١٨٠

 $-\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $-\text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل $-\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ،

١٨١

ألكيل $-\text{NHSO}_2$ ، نثرو، $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، ألكيل $-\text{OC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $-\text{SO}_2$ ،

١٨٢

 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ ، ثيو، ثيو ألكيل، و $-\text{V}-\text{B}^{10}-\text{W}-\text{B}^{20}$ ؛ حيث

١٨٣

 V و W غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من

١٨٤

الفئة التي تتكون من: $-\text{C}(=\text{O})$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ ،

١٨٥

 $-\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(\text{ألكيل})$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})$ ،

١٨٦

 $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ ،

١٨٧

 $-\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{ألكيل})$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{SO}_2$ ، $-\text{NH}$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})$ ،

١٨٨

 $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $-\text{NHSO}_2$ ، $-\text{O}$ ، $-\text{OC}(=\text{O})$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})$ ،

١٨٩

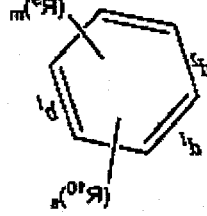
- ١٩٠ OC، -OC(=O)NH-، -OC(=O)O-، -S-، -SO-، -SO₂-، -(الكيل)SO₂N- و -SO₂NH-؛
- ١٩١ B¹⁰ غير موجود أو يختار من الكيل أو ألكينيل؛
- ١٩٢ B²⁰ غير موجود أو يختار من الكيل، ألكينيل أو H؛
- ١٩٣ حيث عندما يمثل B¹⁰ أو B²⁰ الكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل أو
- ١٩٤ الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:
- ١٩٥ ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن،
- ١٩٦ ألكيل-SO₂ مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي،
- ١٩٧ ألكيل C(=O)N(الكيل)، -N(الكيل)₂ C(=O)N(الكيل)، -N(الكيل)
- ١٩٨ NH₂ C(=O)N(الكيل)، ألكيل NH C(=O)N(الكيل)، ألكيل C(=O)O(الكيل)، -N(الكيل)
- ١٩٩ ألكيل SO₂ N(الكيل)، ألكيل NHC(=O)، -NHC(=O)N(الكيل)₂، -NHC(=O)NH₂،
- ٢٠٠ ألكيل NH C(=O)NHC(=O)، ألكيل O(الكيل)NHC(=O)، ألكيل NHSO₂، ألكيل C(=O)OC(=O)N(الكيل)،
- ٢٠١ -(الكيل)N(الكيل)OC(=O)NH، ألكيل NH C(=O)OC(=O)N(الكيل)، ألكيل SO₂، ثيو أو ثيو
- ألكيل؛ و
- ٢٠٢ (F)
- يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير
- ٢٠٣ مشبعة جزئياً، أريل مخطط، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو
- ٢٠٤ عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء،
- ٢٠٥ حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل
- ٢٠٦ المخطط، الألكيل الحلقي المخطط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي
- ٢٠٧ المخطط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من:
- ٢٠٨ ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن،
- ٢٠٩ ألكيل مهلجن، ألكيل-SO₂ مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، أريل مخطط،
- ٢١٠ هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل C(=O)N(الكيل)، -N(الكيل)
- ٢١١ -(الكيل)N(الكيل)C(=O)N(الكيل)، ألكيل NH C(=O)N(الكيل)، -N(الكيل)

- ٢١٣ ألكيل $O=C(ألكيل)N-$ ، ألكيل $SO_2(ألكيل)N-$ ، ألكيل $NHC(=O)-$ ، $(ألكيل)N(=O)-$
- ٢١٤ NHC ، $NHC(=O)NH_2$ ، ألكيل $NHC(=O)NH-$ ، ألكيل $O(=O)NHC-$ ، ألكيل $NHSO_2-$
- ٢١٥ نيترو، $(ألكيل)N(=O)OC-$ ، ألكيل $OC(=O)NH-$ ، ألكيل SO_2- ، ثيو أو ثيو ألكيل؛
أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه.

٨- ما كب ه وفقاً لعنصر الحماية ٧، حيث:

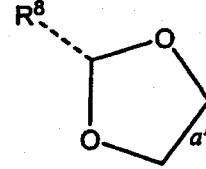
(E)

يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:



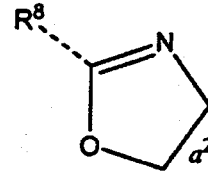
(الصيغة أ-١)،

حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II) وتحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-١-ب و أ-١-ج:



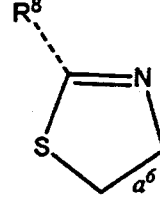
(الصيغة أ-١-أ)، حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ' من جهة a^1

بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛



(الصيغة أ-١-ب)، حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2

بذرت الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و



١٠

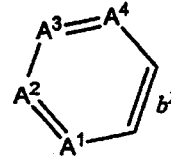
(الصيغة أ-١-ج)، حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي

١١

الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

١٢

حيث R^8 يمثل H أو ألكيل منخفض؛



١٣

(الصيغة أ-٢)، حيث تختار الصيغة أ-٢ من الفئة التي تتكون من

١٤

بيريديل وبيريميدينيل؛ ترتبط من جهة b^2 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)؛ وتحمل بشكل

١٥

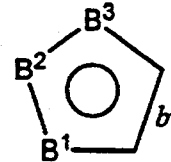
اختياري بديلاً من H أو ألكوكسي على عضو حلقة كربونية، حيث يمكن أن يحمل

١٦

الألكوكسي أيضاً بشكل اختياري بديلاً من ألكوكسي على ذرة كربون طرفية أو ما لا

١٧

يزيد عن ٣ ذرات هالوجين على ذرة كربون طرفية؛ و



١٨

(الصيغة أ-٣)، حيث تختار الصيغة أ-٣ من الفئة التي تتكون من

١٩

ثيينيل، أيزوكسازوليل وفوريل؛ ترتبط من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، وتحمل

٢٠

بشكل اختياري على عضو حلقة كربونية بديلاً من ألكيل C_{1-4} ، أريل، ألكوكسي، أو

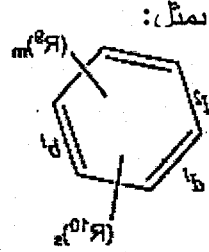
٢١

هالوجين.

١

٩- مركب وفقاً لعنصر الحماية ٧ حيث:

(E)



(الصيغة أ-٤)،

حيث ترتبط الصيغة أ-٤ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II) وحيث

عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما

يمثل الصيغة أ-٤، فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح

قيمته من صفر إلى ٤.

١٠- مركب وفقاً لعنصر الحماية ٧، حيث: L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي

تتكون من: $-(CH_2)-$ ، $-(CH_2)_{3-4}-$ ، $-(CH(R^{100})-)$ ، $-C(=R^{100})-$ ، $-C(R^{100})_2-$ ، $-O(CH_2)_{1-4}-$ ،

$-OCH(R^{200})-$ ، $-NH-$ ، $-(ألكيل منخفض)-N-$ ، $-(ألكيل CO)-N-$ ،

$-(أريل)-N-$ ، $-(ألكيل CO_2)-N-$ ، $-(ألكيل CONH)-N-$ ، $-(ألكيل SO_2)-N-$ و $-(أريل SO_2)-N-$ ؛

حيث R^{200} يختار من: ألكيل، هيدروكسي، أريل، أكسو، NH_2 ، $-(ألكيل)-NH$ ،

$-(ألكيل)_2-N$ ، $-N(OH)=$ أو $-NH_2OH$.

١١- مركب وفقاً لعنصر الحماية ٧، حيث: R^9 و R^{10} يختار كل منهما على حدة من الفئة

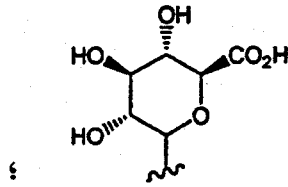
التي تتكون من: ١-بيبريدينيل، ٢-(بيروليدينيل (١))، إيثوكسي، ٣، ٢-ثاني

هيدروكسي-بروبوكسي، ٢-هيدروكسي-٣-بيروليدينيل (١)-بروبوكسي، ٣-٤-

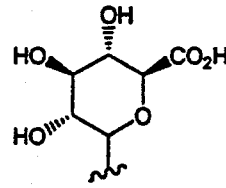
- ٥ ميثيل-بييرازينيل (١)-بروبوكسي، ٣-(N,N-ثاني ميثيل-أمينو)-بروبوكسي، ٣-
 ٦ هيدروكسي-بروبوكسي، ٣-إيميدازوليل (١)-بروبوكسي، ٣-مئوكسي-بروبوكسي،
 ٧ ٣-مورفولينيل (٤)-بروبوكسي، ٣-بيروليدينيل (١)-٢-هيدروكسي-بروبوكسي، ٣-
 ٨ بيروليدينيل (١)-بروبوكسي، ٤-ميثيل-بييرازينيل (١)، أمينو، بنزيل، بنزيلوكسي،
 ٩ برومو، كلورو، سيانو، ائوكسي، فلورو، H، هيدروكسي، أيزوبروبوكسي، مئوكسي،
 ميثيل، N-(١-أكسو-اثيل)-أمينو، و N,N-ثاني ميثيل-أمينو.

٢ ١٢- مركب وفقاً لعنصر الحماية ٧، حيث: R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي
 ٣ تتكون من:

(أ) H؛



شريطة أن R^4 لا يمثل



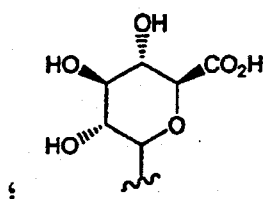
(ب)

- ٥
 ٦ (ج) - CH_2 - يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: H-، ميثيل-، ألكيل-O-،
 ٧ CH_2OH ، $CH(CH_3)OH$ ، ألكيل-O(C=O)-، ألكيل-O(C=O)-، $-(C=O)NH_2$ ،
 ٨ ألكيل-C(=O)-، أو ألكيل-OC(=O)-فنييل-؛
 ٩ (و) ألكيل-C(=O)- يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على
 ١٠ حدة من: OH-، ألكيل-O-، فنييل-ألكيل-O- أو ألكيل-OC(=O)-؛
 ١١ (ز) فنييل-C(=O)- يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على
 ١٢ حدة من: ألكيل-O-، كلورو أو فلورو؛
 ١٣ (ح) - $C(=O)(CH_2)_{1-6}C(=O)-$ ينتهي بـ OH-، ألكيل-O-، NH_2 ، ألكيل-NH-، $N(ألكيل)_2$ -
 ١٤ أو بيروليدينيل؛
 ١٥ (ح ح) -ألكيل-OC(=O)-ألكيل-C(=O)- ينتهي بـ ألكيل-O-؛

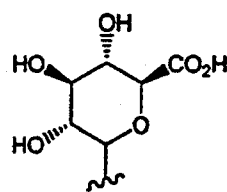
- (ط) $\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{1-10}$ ينتهي بـ H أو بنزير؛ ١٦
- (ي) ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر من ألكيل-O، ١٧
- (ك) فنييل $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر من كلورو أو ١٨
فلورو؛ ١٩
- (ل) $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{1-10}$ ينتهي بـ H-؛ ٢٠
- (م) ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{C}_{1-20})$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر ٢١
- تختار كل على حدة من: NH_2 ، ألكيل-NH، $(\text{ألكيل})_2\text{-N}$ ، بيروليدينيل، ٢٢
- مورفولينيل، ألكيل-NHC(=O)-، ألكينيل-OC(=O)-، فنييل-NHC(=O)- أو ٢٣
- ألكيل-O $\text{C}(=\text{O})$ ، وحيث يمكن أن يحمل جزء الفنييل في فنييل-NHC(=O)- ٢٤
- المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ٢٥
- ألكيل، -OH، ألكيل-O، NH_2 ، ألكيل-NH، $(\text{ألكيل})_2\text{-N}$ ، هالوجين ٢٦
ونتريل؛ ٢٧
- (ن) فنييل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ - يحمل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر من ٢٨
فلورو؛ ٢٩
- (ع) $\text{C}(=\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH})_{0-3}$ ينتهي بـ $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ ٣٠
- وفنييل $\text{C}(=\text{O})$ ؛ حيث يمكن أن يحمل جزء الفنييل في فنييل $\text{C}(=\text{O})$ - المذكور ٣١
- بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار من -OH؛ ٣٢
- (ف) $\text{C}(=\text{S})\text{NH}_2$ ؛ ٣٣
- (ث) $(\text{ألكيل})_2\text{-SO}_2\text{N}$ ؛ و ٣٤
- (ذ) $\text{P}(=\text{O})(\text{OCH}_2\text{CH}_3)_2$ ؛ ٣٥
- شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما ٣٦
يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود.

١

٢ ١٣- مركب وفقاً لعنصر الحماية ٧ حيث: R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من: H،



شريطة أن R^4 لا يمثل



- ١-مئوكسي-١-أكسو-إثيل، ١-مئيل-إثوكسي-كربونيل، ١-أكسو-بيوتوكسي-مئيل،
 ١-أكسو-إثوكسي-مئيل، ١-أكسو-إثيل، ١-أكسو-بروبيل،
 ٢-(١-أكسو-إثوكسي)-١-أكسو-إثيل، ٢-(٢-مئوكسي-١-أكسو-إثوكسي)-١-أكسو-إثيل،
 ٢-مئوكسي-٢-أكسو-إثيل، ٢، ٢-ثاني مئيل-١-أكسو-بروبوكسي-مئيل، ٢-إثوكسي-٢-أكسو-إثيل،
 ٢-مئوكسي-٢-أكسو-إثيل، ٢، ٢-ثاني فلورو-بنزويل،
 ٢-٢-(٢-هيدروكسي-إثوكسي)-إثوكسي-كربونيل،
 ٢-بنزيلوكسي-١-أكسو-إثيل، ٢-بنزيلوكسي-إثوكسي-كربونيل،
 ٢-كلورو-فنوكسي-كربونيل، ٢-فلورو-بنزويل، ٢-هيدروكسي-١-أكسو-إثيل،
 ٢-هيدروكسي-إثيل، ٢-هيدروكسي-بروبيل، ٢-مئوكسي-١-أكسو-إثيل،
 ٢-مئوكسي-إثوكسي-كربونيل، ٢-مئيل-١-أكسو-بروبيل، ٢-أكسو-بروبيل،
 ٣-(N,N-ثاني إثيل أمينو)-١،٣-ديوكسو-بروبيل،
 ٣-H-١-بيروليدينيل (١)-١،٣-ديوكسو-بروبيل، ٣-إثوكسي-١،٣-ديوكسو-بروبيل،
 ٣-H-١-بيروليدينيل (١)-١،٣-ديوكسو-بروبيل، ٤-(١-أكسو-إثوكسي)-بنزيل،
 ٤-أمينو-١،٤-ديوكسو-٤-بيوتيل، ٤-إثوكسي-١،٤-ديوكسو-٤-بيوتيل،
 ٤-هيدروكسي-١،٤-ديوكسو-٤-بيوتيل، ٤-مئوكسي-١،٤-ديوكسو-٤-بيوتيل،
 ٤-كلورو-بنزويل، ٤-كلورو-فنوكسي-كربونيل، ٤-فلورو-بنزويل،
 ٤-فلورو-فنوكسي-كربونيل، ٤-مئوكسي-بنزويل،

- ٢٤ ٥-(N-مثيل-أمينو)-١,٥-ديوكسو-بنتيل، ٥-مثوكسي-١,٥-ديوكسو-بنتيل،
 ٢٥ بنزويل، ثاني إيثوكسي-فسفينيل، إيثوكسي-كربونيل، مثوكسي-كربونيل،
 ٢٦ مثوكسي-مثيل، مثيل، N-(٢-إيثوكسي-٢-أكسو-إثيل)-أمينو-كربونيل،
 ٢٧ N-(٢-H١-بيروليدينيل (١)-إثيل)-أمينو-كربونيل،
 ٢٨ N-(٢-أمينو-إثيل)-أمينو-كربونيل،
 ٢٩ N-(٢-مورفولينيل (٤)-إثيل)-أمينو-كربونيل،
 ٣٠ N-(٣-إيثوكسي-٣-أكسو-بروبيل)-أمينو-كربونيل،
 ٣١ N-(٣-فلورو-فيل)-أمينو-كربونيل، N-(بنتاديسيل)-أمينو-كربونيل،
 ٣٢ N،N-ثاني مثيل-أمينو-كبريتونيل،
 ٣٣ N-[٢-(٢-مثينيل-١-أكسو-بروبوكسي)-إثيل]-أمينو-كربونيل،
 ٣٤ N-[٢-(٣-مثيل-١-مثوكسي-١-أكسو)-ع-بيوتيل]-أمينو-كربونيل،
 ٣٥ N-[٢-(٤-مثيل-١-مثوكسي-١-أكسو)-بنتيل]-أمينو-كربونيل،
 ٣٦ N-[٢-(N،N-ثاني مثيل-أمينو)-إثيل]-أمينو-كربونيل،
 ٣٧ N-[٢-(N-بنزويل-أمينو)-إثيل]-أمينو-كربونيل،
 ٣٨ N-[٢-(N-مثيل-أمينو)-إثيل]-أمينو-كربونيل،
 ٣٩ N-[٢-(٢-هيدروكسي-إيثوكسي)-إيثوكسي]-إثيل]-أمينو-كربونيل،
 ٤٠ N-[٢-(١-أكسو-إثيل)-أمينو]-إثيل]-أمينو-كربونيل،
 ٤١ N-[٢-(٢-هيدروكسي-بنزويل)-أمينو]-إثيل]-أمينو-كربونيل،
 ٤٢ N-[٢-(٢-هيدروكسي-إثيل)-أمينو]-إثيل]-أمينو-كربونيل،
 ٤٣ N-[٢-(٢-مثيل-١-أكسو-بروبيل)-أمينو]-إثيل]-أمينو-كربونيل،
 ٤٤ N-مثيل-أمينو-كربونيل، N-مثيل-أمينو-ثيو-كربونيل، و
 ٤٥ فنوكسي-كربونيل، شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛
 وشريطة أنه عندما يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود.

١

٢ ١٤- مركب وفقاً لعنصر الحماية ٧ حيث: L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار

١ من الفئة التي تتكون من مثيلين، إيثيلين أو كربونيل.

١٥- مركباً لعنصر الحماية ٧ حيث:

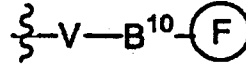


٢ يختار من الفئة التي تتكون من فنييل، هكسيل حلقي، فوريل، إيميدازوليل،

٣ أيزوكسازوليل، بيريديل، بيريميدينيل، إندوليل، إندازوليل، بيريدينيل، مورفولينيل،
٤ إندانيل، ٢،٣-ثاني هيدرو-١H-إندوليل وبنزوديوكسوليل.

١٦- مركب وفقاً لعنصر الحماية ٧ حيث: R^5 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من:

٢ مثيل، إيثيل، أيزوبروبيل، ثث-بيوتيل، ميثوكسي، إيثوكسي، $-C(=O)NH_2$ ،
٣ ميثيل $-C(=O)O$ ، إيثيل $-C(=O)O$ ، $-C(=O)OH$ ، سيانو، ثاني ميثيل-أمينو، برومو، كلورو،
٤ فلورو، ثالث فلورو ميثيل، ثالث فلورو ميثوكسي، ثيو-ثالث فلورو ميثيل،
٥ هيدروكسي، هيدروكسي ميثيل، هيدروكسي إيثيل، نيترو، $-SO_2NH_2$ ، ثيو ميثيل،



و، $-V-B^{10}-W-B^{20}$.

١٧- مركب وفقاً لعنصر الحماية ١٦ حيث: V و W غير موجودين أو يختار كل

٢ منهما على حدة من الفئة التي تتكون من: $-C(=O)-$ ، (ألكيل-).

٣ $C(=O)N$ ، $-C(=O)NH-$ ، $-C(=O)O-$ ، $-NH-$ ، $-O-$ و $-SO_2-$ ؛ B^{10} غير موجود أو يختار

٤ من ميثيل أو إيثيل؛ حيث يحمل الميثيل أو الإيثيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو

٥ أكثر تختار كل على حدة من ثاني ميثيل-أمينو أو هيدروكسي؛ و B^{20} غير موجود أو

٦ يختار من ألكيل، ألكينيل أو H ؛ حيث عندما يمثل B^{20} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن

٧ تحمل مجموعة الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار

٨ كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين،

٩ ألكوكسي مهلجن، هيدروكسي، $-NHC(=O)NH_2$ ، ألكيل $-NHSO_2$ أو ثيو

١٠

ألكيل.

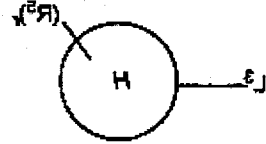
١٨-٥- وفقاً لعنصر الحماية ١٧ حيث:



يختار من الفئة التي تتكون من: فنيـل، إيميدازوليـل، بيريدينيل،

بيريميدينيل، بيروليدينيل، مورفولينيل، بيبيرازينيل وبيبيريدينيل يحمل بشكل اختياري
بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من مئوكسي، إئوكسي، مئيل، إئيل، برومو،
كلورو، فلورو، ثالث فلورو مئيل، بيريدينيل، هيدروكسي أو هيدروكسي مئيل.

١٩- مركب وفقاً لعنصر الحماية ٩ حيث:



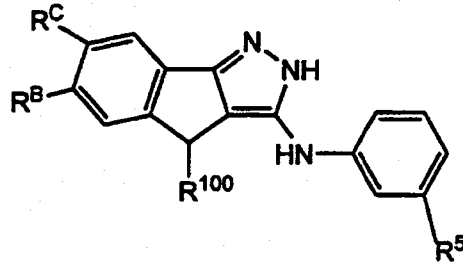
يختار من الفئة التي تتكون من: ١- (٣-مئوكسي-فنيـل)-ع*

- ١- إئيل؛ ٢- (٣-برومو)-بيريديل؛ ٢- (٣-مئيل)-بيريديل؛ ٢- (٣-مئيل-٥-برومو)-
بيريديل؛ ٢- (٤،٦-ثاني مئيل)-بيريديل؛ ٢- (٤-برومو)-بيريديل؛ ٢- (بيبيريدينيل
(١)-إئيل؛ ٢،٢-ثاني فلورو-١،٣-بنزوديوكسوليل (٤)؛ ٢،٣-ثاني كلورو-بنزيل؛
٢،٣-ثاني كلورو-فنيـل؛ ٢،٣-ثاني هيدرو-١-إندوليل (١)؛ ٢،٣-ثاني مئوكسي-
بنزيل؛ ٢،٤،٦-ثالث فلورو-فنيـل؛ ٢،٤-ثاني كلورو-فنيـل؛ ٢،٤-ثاني فلورو-بنزيل؛
٢،٤-ثاني مئوكسي-فنيـل؛ ٢،٤-ثاني مئوكسي-فنيـل؛ ٢،٥-ثاني كلورو-بنزيل؛ ٢،٥-
ثاني كلورو-فنيـل؛ ٢،٥-ثاني فلورو-بنزيل؛ ٢،٥-ثاني فلورو-فنيـل؛ ٢،٥-ثاني
مئوكسي-بنزيل؛ ٢،٥-ثاني مئوكسي-فنيـل؛ ٢،٦-ثاني كلورو-بنزيل؛ ٢،٦-ثاني
فلورو-بنزيل؛ ٢،٦-ثاني فلورو-فنيـل؛ ٢-برومو-٣-فلورو-فنيـل؛ ٢-برومو-بنزيل؛
٢-برومو-فنيـل؛ ٢-كلورو-بنزيل؛ ٢-كلورو-فنيـل؛ ٢-إئيل-فنيـل؛ ٢-فلورو-بنزيل؛
٢-فلورو-فنيـل؛ ٢-فوريل؛ ٢-أيزوبروبيل-فنيـل؛ ٢-مئوكسي-بنزيل؛ ٢-مئوكسي-

١٥	فنیل؛ ٢-مثیل-بنزیل؛ ٢-مثیل-فنیل؛ ٢-مورفولینیل (٤)-ایٹیل؛ ٢-بیریڈیل؛ ٢-
١٦	بیریڈیل-مثیل؛ ٢-ثالث فلورو مٹوکسی-بنزیل؛ ٢-ثالث فلورو مٹوکسی-فنیل؛ ٢-
١٧	ثالث فلورو مٹیل-٤-برومو-فنیل؛ ٢-ثالث فلورو مٹیل-بنزیل؛ ٢-ثالث فلورو مٹیل-
١٨	فنیل؛ ٣-(١-هیدروکسی-ایٹیل)-فنیل؛ ٣-(٢،٤-ثانی مٹوکسی)-بیریڈیل؛ ٣-(٢)-
١٩	کلورو)-بیریڈیل؛ ٣-(٢-هیدروکسی-ایٹیل-آمینو-کربونیل)-فنیل؛ ٣-(٤-مٹوکسی)-
٢٠	بیریڈیل؛ ٣-(٤-مثیل-بیرازینیل-کربونیل)-فنیل؛ ٣-(٤-ثالث فلورو مٹیل)-
٢١	بیریڈیل؛ ٣-(آمینو-کربونیل)-فنیل؛ ٣-(آمینو-کبریتونیل)-فنیل؛ ٣-(ایٹوکسی)-
٢٢	کربونیل)-فنیل؛ ٣-(مٹوکسی-کربونیل)-فنیل؛ ٣-(ثالث فلورو مٹیل-ٹیو)-فنیل؛
٢٣	٣،٤،٥-ثالث مٹوکسی-فنیل؛ ٣،٤-ثانی کلورو-بنزیل؛ ٣،٤-ثانی کلورو-فنیل؛
٢٤	٣،٤-ثانی فلورو-بنزیل؛ ٣،٤-ثانی مٹوکسی-فنیل؛ ٣،٤-ثانی مٹیل-بنزیل؛ ٣،٤-
٢٥	مثیلین دیوکسی-فنیل؛ ٣،٥-ثانی (نٹ-بیونیل)-فنیل؛ ٣،٥-ثانی (ثالث فلورو مٹیل)-
٢٦	فنیل؛ ٣،٥-ثانی کلورو-بنزیل؛ ٣،٥-ثانی کلورو-فنیل؛ ٣،٥-ثانی فلورو-فنیل؛
٢٧	٣،٥-ثانی مٹوکسی-فنیل؛ ٣،٥-ثانی مٹیل-فنیل؛ ٣-[N-(٣-بیروایڈینیل (١)-
٢٨	بروبیل)-آمینو-کربونیل]-فنیل؛ ٣-بنزیلوکسی-فنیل؛ ٣-برومو-فنیل؛ ٣-کربوکسی-
٢٩	فنیل؛ ٣-کلورو-٤-فلورو-فنیل؛ ٣-کلورو-٤-مٹوکسی-فنیل؛ ٣-کلورو-٤-مثیل-
٣٠	بنزیل؛ ٣-کلورو-بنزیل؛ ٣-کلورو-فنیل؛ ٣-سیانو-فنیل؛ ٣-ایٹوکسی-فنیل؛ ٣-
٣١	ایٹیل-فنیل؛ ٣-فلورو-بنزیل؛ ٣-فلورو-فنیل؛ ٣-هیدروکسی مٹیل-فنیل؛ ٣-
٣٢	هیدروکسی-فنیل؛ ٣-ایزوبروبوکسی-فنیل؛ ٣-مٹوکسی-٥-ثالث فلورو مٹیل-فنیل؛
٣٣	٣-مٹوکسی-بنزیل؛ ٣-مثیل-بنزیل؛ ٣-مثیل-فنیل؛ ٣-مثیل ٹیو-فنیل؛ ٣-بیریڈیل؛
٣٤	٣-بیریڈیل-مثیل؛ ٣-ثالث فلورو مٹوکسی-فنیل؛ ٣-ثالث فلورو مٹیل-فنیل؛ ٤-(٤)-
٣٥	مثیل-بیرازینیل (١))-فنیل؛ ٤-(ایٹوکسی-کربونیل)-فنیل؛ ٤-(N,N-ثانی مٹیل-
٣٦	آمینو)-فنیل؛ ٤-(بیریڈینیل (٤)-کبریتونیل)-فنیل؛ ٤-بنزیلوکسی-فنیل؛ ٤-برومو-
٣٧	فنیل؛ ٤-کلورو-٣-مثیل-بنزیل؛ ٤-کلورو-فنیل؛ ٤-سیانو-فنیل؛ ٤-ثانی مٹیل
٣٨	آمینو-فنیل؛ ٤-فلورو-٣-کلورو-فنیل؛ ٤-فلورو-٣-نترو-فنیل؛ ٤-فلورو-٣-ثالث
٣٩	فلورو مٹیل-فنیل؛ ٤-فلورو-بنزیل؛ ٤-فلورو-فنیل؛ ٤-مٹوکسی-بنزیل؛

- ٤٠ ٤-مئيل-٣-[N]-٤-(٣-بيريديل)-بيريميدينيل (٢) أمينو-فنييل؛ ٤-مئيل-بنزيل؛
 ٤١ ٤-مئيل-فنييل؛ ٤-ثالث فلورو مئوكسي-فنييل؛ ٤-ثالث فلورو مئيل-فنييل؛ ٥-فنييل-
 ٤٢ أيزوكسازوليل (٣)-مئيل؛ ٥-برومو-٢،٣-ثاني هيدرو-١H-إندوليل (١)؛ ٥-
 ٤٣ كلورو-٢-مئوكسي-فنييل؛ ٥-كلورو-٢-مئيل-فنييل؛ ٥-إندانييل؛ ٥-إندوليل؛ ٥-ثالث
 ٤٤ فلورو مئيل-٢-فلورو-فنييل؛ ٦-إندازوليل؛ بنزيل؛ هكسيل حلقي؛ هكسيل حلقي-مئيل؛
 وفنييل.

٢٠- مركب بالصيغة (II-AA):



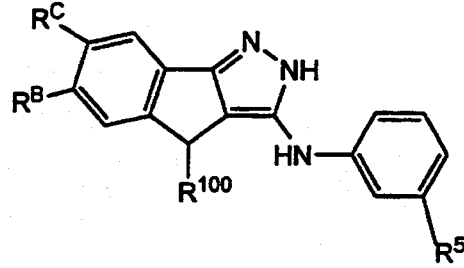
(II-AA)

حيث:

- ٥ R^{100} يختار من الفئة التي تتكون من: H وألكيل؛
 ٦ R^C و R^B يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي؛ و
 ٧ R^5 يختار من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي وهالوجين؛
 أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات، أو ملح مقبول صيدلياً منه.

- ٢١- مركب وفقاً لعنصر الحماية ٢٠، حيث R^{100} يختار من الفئة التي تتكون من: H، مئيل،
 إيثيل؛ R^C و R^B يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من: مئوكسي
 وإثوكسي؛ و R^5 يختار من الفئة التي تتكون من: مئوكسي، إثوكسي، أيزوبروبوكسي،
 كلورو، برومو وفلورو.

٢٢- مركب بالصيغة (II-BB):



(II-BB)

حيث:

R^C يمثل $-O(CH_2)_3OH$ ؛

R^{100} يختار من الفئة التي تتكون من: H وألكيل؛

R^B يختار من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي؛ و

R^5 يختار من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي وهالوجين؛

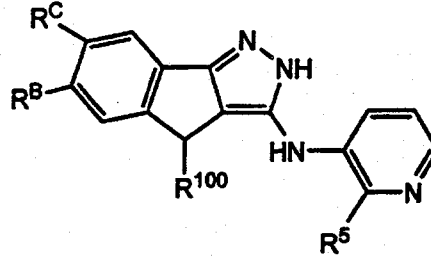
أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات، أو ملح مقبول صيدلياً منه.

٢٣- مركب وفقاً لعنصر الحماية ٢٢، حيث R^{100} يختار من الفئة التي تتكون من: H، مثيل،

إثيل؛ R^B يختار من الفئة التي تتكون من: ميثوكسي وإيثوكسي؛ و R^5 يختار من الفئة

التي تتكون من: ميثوكسي، إيثوكسي، أيزوبروبوكسي، كلورو، برومو وفلورو.

٢٤- مركب بالصيغة (II-CC):



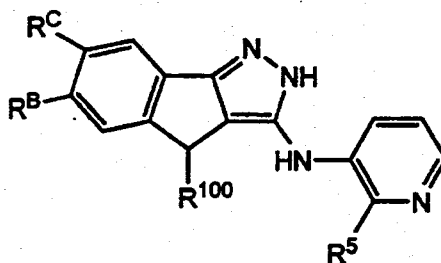
(II-CC)

حيث:

- R^{100} يختار من الفئة التي تتكون من: H وألكيل؛
 R^B و R^C يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي؛ و
 R^5 يختار من الفئة التي تتكون من: ألكيل، سيانو، هيدروكسي، ألكوكسي وهالوجين؛
 أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات، أو ملح مقبول صيدلياً منه.

- ٢٥- مركب وفقاً لعنصر الحماية ٢٤ حيث R^{100} يختار من الفئة التي تتكون من: H، مثيل،
 إيثيل؛ R^B و R^C يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من: ميثوكسي
 وإيثوكسي؛ و R^5 يختار من الفئة التي تتكون من: ميثوكسي، إيثوكسي، أيزوبروبوكسي،
 كلورو، مثيل، سيانو وهيدروكسي.

٢٦- مركب بالصيغة (II-DD):



(II-DD)

حيث:

- R^C يمثل $-O(CH_2)_3OH$ ؛
 R^{100} يختار من الفئة التي تتكون من: H وألكيل؛
 R^B يختار من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي؛ و
 R^5 يختار من الفئة التي تتكون من: ألكيل، سيانو، هيدروكسي، ألكوكسي وهالوجين؛

1

7

Y

4

1

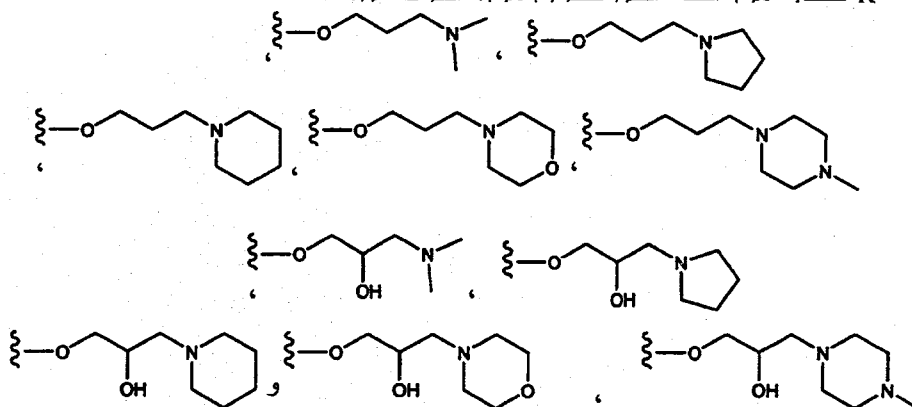
Y



3

9

7



- ١٨ (أريل SO_2)-N؛ حيث R^{100} يختار من: ألكيل، هيدروكسي، أريل، ألكوكسي، أكسو، -
- ١٩ NH_2 ، $\text{N}(\text{ألكيل})-\text{N}(\text{ألكيل})$ ، $\text{NH}(\text{ألكيل})$ ، $\text{N}(\text{OH})$ أو NH_2OH ؛ شريطة أنه عندما L^2 يمثل -
- ٢٠ CH_2CH_2 ، فإنه لا يمثل أي من R^6 أو R^7 ألكيل $\text{CH}_2-(\text{C}=\text{O})\text{NH}$ ، -
- ٢١ $\text{CH}_2-(\text{C}=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، أو ألكيل $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{O}$ ؛ شريطة أنه عندما L^2 يمثل -
- ٢٢ $\text{OCH}(R^{100})$ ، R^{100} يمثل ألكوكسي، و H يمثل فنيل، فإن R^5 لا
- ٢٣
- ٢٤ يمثل $\text{C}(\text{O})\text{NH}-\text{NH}_2$ ؛ وشريطة أنه عندما L^2 يمثل $\text{O}-$ أو $\text{S}-$ ، فإن R^6 أو R^7 لا
- ٢٥ يمثل أي منهما CH_3 ؛ $\frac{2}{3} \text{X}^1 - \text{A}^{20} - \text{G}$
- ٢٦ R^{10} يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من و
- ٢٧ $\text{X}^1 - \text{A}^{20} - \text{Y}^1 - \text{A}^{21}$ ؛
- ٢٨ حيث X^1 و Y^1 غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة
- ٢٩ التي تتكون من: $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، -
- ٣٠ $\text{C}(\text{O})\text{NH}-$ ، $\text{C}(\text{O})\text{O}-$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(\text{O})$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(\text{O})$ ، -
- ٣١ $\text{NH}-$ ، NH_2 ، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{SO}_2$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(\text{O})\text{O}-$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(\text{O})\text{NH}-$ ، -
- ٣٢ $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}$ ، $\text{NHC}(\text{O})\text{O}-$ ، $\text{NHC}(\text{O})\text{O}-$ ، NH_2SO_2 ، $\text{O}-$ ، $\text{C}(\text{O})$ ، -
- ٣٣ OC ، $\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، $\text{OC}(\text{O})\text{NH}-$ ، $\text{OC}(\text{O})\text{O}-$ ، $\text{S}-$ ، $\text{SO}-$ ، SO_2 ، -
- ٣٤ $\text{SO}_2\text{NH}-$ و $\text{SO}_2\text{N}(\text{ألكيل})$ ؛
- ٣٥ A^{20} غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛ و
- ٣٦ A^{21} يختار من ألكيل، ألكينيل أو H ؛
- ٣٧ حيث عندما يمثل A^{20} أو A^{21} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل أو الألكينيل
- ٣٨ بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل
- ٣٩ أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن،
- ٤٠ ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، -
- ٤١ $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{ألكيل})$ ، -

- ٤٢ ألكيل $C(=O)O$ (ألكيل) N ، ألكيل SO_2 (ألكيل) N ، ألكيل $NHC(=O)$ ،
 ٤٣ $(ألكيل)_2N(ألكيل)NHC(=O)$ ، $NHC(=O)NH_2$ ، ألكيل $NHC(=O)NH$ ،
 ٤٤ ألكيل $NHC(=O)O$ ، ألكيل $NHSO_2$ ، ألكيل $OC(=O)$ ،
 ٤٥ $(ألكيل)_2N(ألكيل)OC(=O)$ ، ألكيل $OC(=O)NH$ ، ألكيل $OC(=O)O$ ،
 ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل؛

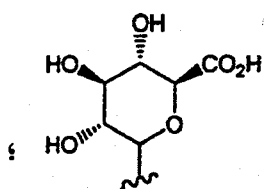
(G)

يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير

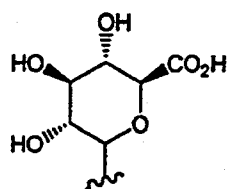
- ٤٧
 ٤٨ مشبعة جزئياً، أريل مخطط، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو
 ٤٩ عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث
 ٥٠ يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخطط،
 ٥١ الألكيل الحلقي المخطط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المخطط
 ٥٢ المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من
 ٥٣ هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي،
 ٥٤ ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل $NHC(=O)$ ، ألكيل $C(=O)N$ ، أو ثاني
 ٥٥ ألكيل أمينو، $NHC(=O)NH_2$ ، ألكيل $NHC(=O)NH$ ، ألكيل $C(=O)NH$ (ألكيل) N ،
 ٥٦ ألكيل $OC(=O)NH$ ، ألكيل $NHC(=O)O$ ، ألكيل $C(=O)O$ (ألكيل) N ،
 ٥٧ ألكيل $NHSO_2$ ، ألكيل SO_2 (ألكيل) N ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن،
 ٥٨ ألكيل SO_2 ، ألكيل SO_2 مهلجن، $(ألكيل)_2N(ألكيل)NHC(=O)$ ،
 ٥٩ أو $(ألكيل)_2N(ألكيل)OC(=O)$ ؛

- ٦٠ s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛
 ٦١ m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه يكون حاصل
 ٦٢ جمع m و s مساوياً لعدد صحيح تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛
 ٦٣ R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H؛



شريطة أن R^4 لا يمثل



(ب)

٦٤

٦٥

(ج) $-CH_2-$ يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: $-H$ ، ميثيل، ألكيل- O ، -

٦٦

$-CH(CH_3)OH$ ، CH_2OH ، ألكيل- $O(C=O)$ ، $-(C=O)OH$ ، ألكيل- $O(C=O)$ ، -

٦٧

أريل- $O(C=O)$ ، أريل مخطط- $O(C=O)$ ، $-(C=O)NH_2$ ، ألكيل- $(C=O)NH$ ، -

٦٨

$(\text{ألكيل})_2N(C=O)$ ، ألكيل- $(C=O)$ ، $-OCH_3$ فنيل- أو ألكيل- $OC(=O)$ فنيل؛

٦٩

(د) $-(C=O)(CH_2CH_2O)_{1-10}$ ينتهي بـ $-H$ ، ميثيل، اثيل أو بنزيل؛

٧٠

(هـ) $-(C=O)CH_2O(CH_2CH_2O)_{1-10}$ ينتهي بـ $-H$ ، ميثيل، اثيل أو بنزيل؛

٧١

(و) ألكيل- $(C=O)$ أو ألكيل حلقي $-(C=O)(C_{3-6})$ ، حيث يمكن أن يحمل

٧٢

ألكيل- $(C=O)$ المذكور وألكيل حلقي $-(C=O)(C_{3-6})$ المذكور بشكل

٧٣

اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: $-OH$ ، ألكيل- O ،

٧٤

أريل ألكيل- O ، $-NH_2$ ، ألكيل- NH ، $-(\text{ألكيل})_2N$ ، ألكيل حلقي مخطط،

٧٥

ألكيل- $NHC(=O)$ ، ألكيل- $NHSO_2$ أو ألكيل- $OC(=O)$ ؛

٧٦

(ز) أريل $-(CH_2)_{1-3}(C=O)$ ، أريل- $(C=O)$ ، أريل مخطط $-(CH_2)_{1-3}(C=O)$ أو

٧٧

أريل مخطط $-(C=O)$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $-(CH_2)_{1-3}(C=O)$ المذكور،

٧٨

أريل- $(C=O)$ المذكور، أريل مخطط $-(CH_2)_{1-3}(C=O)$ المذكور وأريل

٧٩

مخطط $-(C=O)$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل

٨٠

على حدة من: $-OH$ ، ألكيل- O ، $-NH_2$ ، ألكيل- NH ، $-(\text{ألكيل})_2N$ ، ألكيل

٨١

حلقي مخطط، ألكيل- $NHC(=O)$ ، ألكيل- $NHSO_2$ ، هالوجين، نتريل أو

٨٢

ألكيل- $OC(=O)$ ؛

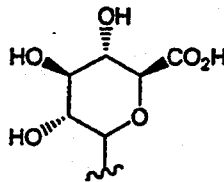
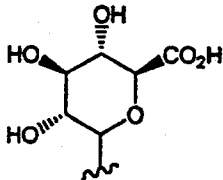
٨٣

(ح) $-(C=O)(CH_2)_{1-6}C(=O)-$ ينتهي بميثيل، اثيل، $-OH$ ، ألكيل- O ، $-NH_2$ ، ألكيل- NH ،

٨٤

- ٨٥ $(\text{ألكيل})_2\text{-N}$ أو ألكيل حلقي مخطط؛
- ٨٦ (ح) ألكيل-ألكيل OC(=O)C(=O) ينتهي بـ -OH ، ألكيل -O ، -NH_2 ، ألكيل -NH ،
- ٨٧ $(\text{ألكيل})_2\text{-N}$ أو ألكيل حلقي مخطط؛
- ٨٨ (ط) $\text{-C(=O)O(CH}_2\text{CH}_2\text{O)-}_{1-10}$ ينتهي بـ H ، مثيل، اثيل أو بنزيل؛
- ٨٩ (ي) ألكيل -C(=O)O أو ألكيل حلقي $\text{-C(=O)O(C}_{3-6}\text{)}$ ، حيث يمكن أن يحمل
- ٩٠ ألكيل -C(=O)O المذكور، وألكيل حلقي $\text{-C(=O)O(C}_{3-6}\text{)}$ المذكور بشكل اختياري
- ٩١ مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH ، ألكيل -O ، -NH_2 ،
- ٩٢ ألكيل -NH ، $(\text{ألكيل})_2\text{-N}$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل -NHC(=O) ،
- ٩٣ ألكيل -NHSO_2 ، ألكيل -OC(=O) ، -C(=O)OH ، ألكيل -C(=O)O ، -
- ٩٤ C(=O)NH_2 ، ألكيل -C(=O)NH أو $(\text{ألكيل})_2\text{-N(=O)-C(=O)}$ ؛
- ٩٥ (ك) أريل $\text{-C(=O)O(CH}_2\text{)}_{1-3}$ ، أريل -C(=O)O ، أريل مخطط $\text{-C(=O)O(CH}_2\text{)}_{1-3}$ أو أريل
- ٩٦ مخطط -C(=O)O ، حيث يمكن أن يحمل أريل $\text{-C(=O)O(CH}_2\text{)}_{1-3}$ المذكور،
- ٩٧ أريل -C(=O)O المذكور، أريل مخطط $\text{-C(=O)O(CH}_2\text{)}_{1-3}$ المذكور أو أريل
- ٩٨ مخطط -C(=O)O المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل
- ٩٩ على حدة من: -OH ، ألكيل -O ، -NH_2 ، ألكيل -NH ، $(\text{ألكيل})_2\text{-N}$ ، ألكيل حلقي
- ١٠٠ مخطط، ألكيل -NHC(=O) ، ألكيل -NHSO_2 ، هالوجين، نتريل أو
- ١٠١ ألكيل -OC(=O) ؛
- ١٠٢ (ل) $\text{-C(=O)NH(CH}_2\text{CH}_2\text{O)-}_{1-10}$ ينتهي بـ -H ، مثيل، اثيل، بنزيل، $\text{-CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$ ،
- ١٠٣ ألكيل $\text{-CH}_2\text{CH}_2\text{NH}$ ، $(\text{ألكيل})_2\text{-CH}_2\text{CH}_2\text{N}$ ، $\text{-CH}_2\text{CH}_2$ ، ١-بيروليدينيل،
- ١٠٤ $\text{-CH}_2\text{CH}_2$ ، ١-بيبريدينيل، $\text{-CH}_2\text{CH}_2$ ، ٤-مورفولينيل، $\text{-CH}_2\text{CH}_2$ ، ١-بيبرازينيل،
- ١٠٥ $\text{-CH}_2\text{CH}_2$ ، ١-(٤- CH_3)-بيبرازينيل، أو ألكيل -C(=O) ؛
- ١٠٦ (م) -C(=O)NH_2 ، ألكيل $\text{-C(=O)NH(C}_{1-20}\text{)}$ ، ألكيل حلقي $\text{-C(=O)NH(C}_{3-6}\text{)}$ أو
- ١٠٧ $(\text{ألكيل})_2\text{-N(=O)-C(=O)}$ ، حيث يمكن أن يحمل ألكيل $\text{-C(=O)NH(C}_{1-20}\text{)}$ المذكور،
- ١٠٨ ألكيل حلقي $\text{-C(=O)NH(C}_{3-6}\text{)}$ المذكور و $(\text{ألكيل})_2\text{-N(=O)-C(=O)}$ المذكور بشكل
- ١٠٩ اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH ، ألكيل -O ،

- ١١٠ NH_2 ، ألكيل NH ، N (ألكيل) N ، ألكيل حلقي مخطط،
- ١١١ ألكيل $\text{NHC}(\text{O})$ ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل $\text{OC}(\text{O})$ ،
- ١١٢ ألكيل $\text{OC}(\text{O})$ ، ألكيل $\text{NHC}(\text{O})$ ، ألكيل $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ ،
- ١١٣ ألكيل $\text{C}(\text{O})\text{O}$ ، ألكيل $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $\text{C}(\text{O})\text{NH}$ ، أو $\text{C}(\text{O})\text{N}$ (ألكيل) $\text{C}(\text{O})$ ؛
- ١١٤ وحيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل $\text{NHC}(\text{O})$ المذكور بشكل اختياري
- ١١٥ مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، OH ،
- ١١٦ ألكيل O ، NH_2 ، ألكيل NH ، N (ألكيل) N ، هالوجين أو نتريل؛
- ١١٧ (ن) أريل $\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2)_{1-3}$ ، أريل $\text{C}(\text{O})\text{NH}$ ، أريل مخطط $\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2)_{1-3}$ ، أو
- ١١٨ أريل مخطط $\text{C}(\text{O})\text{NH}$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2)_{1-3}$ ،
- ١١٩ المذكور، أريل $\text{C}(\text{O})\text{NH}$ ، المذكور، أريل مخطط $\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2)_{1-3}$ ،
- ١٢٠ المذكور، وأريل مخطط $\text{C}(\text{O})\text{NH}$ ، المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة
- ١٢١ أو أكثر تختار كل على حدة من: OH ، ألكيل O ، NH_2 ، ألكيل NH ،
- ١٢٢ N (ألكيل) N ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل $\text{NHC}(\text{O})$ ، ألكيل NHSO_2 ،
- ١٢٣ هالوجين، نتريل أو ألكيل $\text{OC}(\text{O})$ ؛
- ١٢٤ (ع) $\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH})_{0-3}$ ينتهي بـ H ، مثيل، اثيل،
- ١٢٥ ألكيل $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}$ ، $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}$ (ألكيل) CH_2CH_2 ، CH_2CH_2 - ١ بيروليدينيل،
- ١٢٦ CH_2CH_2 - ١ بيريريدينيل، CH_2CH_2 - ٤ - مورفولينيل، CH_2CH_2 - ١ -
- ١٢٧ بيريرازينيل، CH_2CH_2 - ١ - (٤ - CH_3) - بيريرازينيل، $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ ، -
- ١٢٨ $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$ ، $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$ ، ألكيل $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})$ - أو أريل $\text{C}(\text{O})$ ؛
- ١٢٩ حيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل $\text{C}(\text{O})$ المذكور بشكل اختياري
- ١٣٠ مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، OH ، ألكيل O ،
- ١٣١ NH_2 ، ألكيل NH ، N (ألكيل) N ، هالوجين أو نتريل؛
- ١٣٢ (ف) $\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ ؛
- ١٣٣ (ق) ألكيل $\text{C}(\text{S})\text{NH}$ ؛
- ١٣٤ (ر) $\text{C}(\text{S})\text{N}$ (ألكيل) $\text{C}(\text{S})$ ؛

- ١٣٥ (ش) $-\text{SO}_2\text{NH}_2$
- ١٣٦ (ت) ألكيل $-\text{SO}_2\text{NH}$
- ١٣٧ (ث) $-\text{SO}_2\text{N}(\text{ألكيل})_2$
- ١٣٨ (خ) $-\text{P}(=\text{O})(\text{OCH}_3)_2$ و
- ١٣٩ (ذ) $-\text{P}(=\text{O})(\text{OCH}_2\text{CH}_3)_2$
- ١٤٠ شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود
- ١٤١  R^4 يختار من الفئة التي تتكون من: H و ؛ شريطة أنه إذا كان
- ١٤٢  R^6 أو R^7 يمثل فإن R^4 يمثل H
- ١٤٣
- ١٤٤ L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من ألكيل
- ١٤٥ ديل، كز بونيل أو $-\text{SO}_2-$
- (H)
- ١٤٦ يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير
- ١٤٧ مشبعة جزئياً، أركيل، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به
- ١٤٨ تسعة أو عشرة أعضاء، أريل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، وألكيل
- ١٤٩ حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛
- ١٥٠ r يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ و
- ١٥١ R^5 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكيل، ألكيل أمينو، ألكيلوكسي،
- ١٥٢ أمينو، $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ ، سيانو، ثاني ألكيل أمينو،

- ١٥٣ هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل-SO₂ مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن،
 ١٥٤ هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل C(=O)N(ألكيل)،
 ١٥٥ $N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)$ ، ألكيل C(=O)NH(ألكيل)، ألكيل C(=O)O(ألكيل)،
 ١٥٦ ألكيل SO₂(ألكيل)، ألكيل NHC(=O)، $NHC(=O)N(ألكيل)_2$ ، $NHC(=O)NH_2$ ،
 ١٥٧ ألكيل NH C(=O)NHC(=O)، ألكيل O(ألكيل)NHC(=O)، ألكيل NH SO₂، نثرو،
 ١٥٨ $\begin{matrix} \text{F} \\ \text{---} \end{matrix} \text{V} \text{---} \text{B}^{10}$ ،
 ألكيل، $-V-B^{10}-W-B^{20}$ ؛ حيث

- ١٥٩ W و V غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون
 ١٦٠ من: $-C(=O)-$ ، $-C(=O)N(ألكيل)-$ ، $-C(=O)NH-$ ، $-C(=O)O-$ ، $-N(ألكيل)-$ ،
 ١٦١ $-C(=O)N(ألكيل)-$ ، $-N(ألكيل)C(=O)NH-$ ، $-N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)-$ ،
 ١٦٢ $-N(ألكيل)C(=O)O-$ ، $-N(ألكيل)SO_2-$ ، $-NH-$ ، $-NHC(=O)-$ ، $-NHC(=O)N(ألكيل)-$ ،
 ١٦٣ $-NHC(=O)O-$ ، $-NH_2$ ، $-O-$ ، $-OC(=O)-$ ، $-OC(=O)N(ألكيل)-$ ،
 ١٦٤ $-OC(=O)NH-$ ، $-OC(=O)O-$ ، $-S-$ ، $-SO-$ ، $-SO_2-$ ، $-SO_2N(ألكيل)-$ و $-SO_2NH-$ ،
 ١٦٥ B¹⁰ غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛
 ١٦٦ B²⁰ غير موجود أو يختار من ألكيل، ألكينيل أو H؛
 ١٦٧ حيث عندما يمثل B¹⁰ أو B²⁰ ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل أو
 ١٦٨ الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:
 ١٦٩ ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن،
 ١٧٠ ألكيل SO₂-مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل C(=O)N(ألكيل)،
 ١٧١ $N(ألكيل)C(=O)NH_2$ ، $N(ألكيل)C(=O)NH(ألكيل)$ ،
 ١٧٢ ألكيل C(=O)O(ألكيل)، ألكيل SO₂(ألكيل)، ألكيل NHC(=O)،
 ١٧٣ $NHC(=O)N(ألكيل)_2$ ، $NHC(=O)NH_2$ ، $NHC(=O)NH(ألكيل)$ ،
 ١٧٤ ألكيل O(ألكيل)NHC(=O)، ألكيل NH SO₂،
 ١٧٥

١٧٣ $(\text{الكيـل} \text{—} \text{ل})\text{N}(\text{OC}(=\text{O})\text{—})\text{—} \text{الكيـل} \text{—} \text{ل} \text{OC}(=\text{O})\text{—}$ ، $\text{الكيـل} \text{—} \text{ل} \text{OC}(=\text{O})\text{NH} \text{—}$ ، $\text{الكيـل} \text{—} \text{ل} \text{OC}(=\text{O})\text{O} \text{—}$ ،
 $\text{الكيـل} \text{—} \text{ل} \text{SO}_2 \text{—}$ ، ثيو أو ثيو ألكيل؛ و

(F)

١٧٤

يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير

١٧٥

١٧٦ مشبعة جزئياً، أريل مخطط، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو

١٧٧ عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء،

١٧٨ حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل

١٧٩ المخطط، الألكيل الحلقي المخطط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي

١٨٠ المخطط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من:

١٨١ ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن،

١٨٢ ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، أريل مخطط،

١٨٣ هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيـل})$ ،

١٨٤ $(\text{الكيـل} \text{—} \text{ل})\text{N}(\text{C}(=\text{O})\text{—})\text{N}(\text{الكيـل})$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{الكيـل})$ ، $\text{N}(\text{الكيـل})$ ،

١٨٥ ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{الكيـل})$ ، ألكيل $\text{SO}_2(\text{الكيـل})$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ،

١٨٦ $(\text{الكيـل})\text{N}(\text{NHC}(=\text{O})\text{—})$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ،

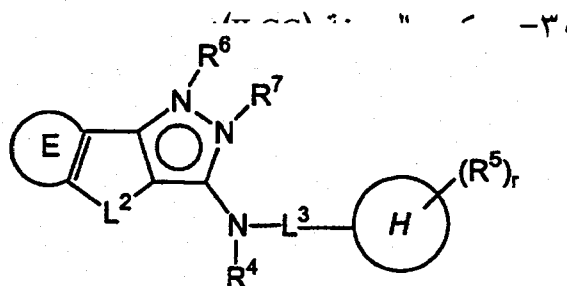
١٨٧ ألكيل NHSO_2 ، نيترو، $(\text{الكيـل})\text{N}(\text{OC}(=\text{O})\text{—})$ ، ألكيل $\text{OC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو

ألكيل؛

١٨٨

أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه.

١

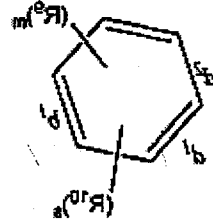


(II-GG)

٢

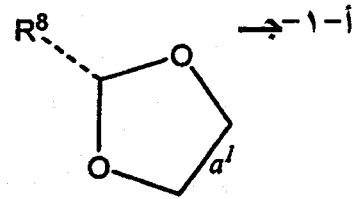


يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:



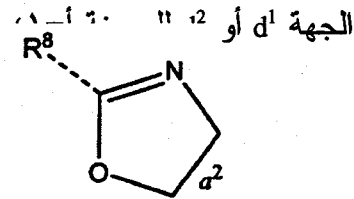
(الصيغة أ-١)،

حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II-GG) وتحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-١'، أ-١-ب و



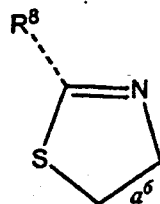
(الصيغة أ-١-أ')،

حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ' من جهة a^1 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على



(الصيغة أ-١-ب)،

حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و



١٥

(الصيغة أ-١-ج)،

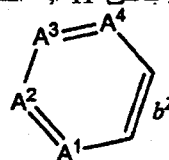
١٦

حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على

١٧

الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

حيث R^8 يمثل H أو ألكيل؛



١٨

(الصيغة أ-٢)،

١٩

حيث ترتبط الصيغة أ-٢ من جهة b^2 بالحلقة L^2 في الصيغة (II-GG)؛ ويمثل A^2 ، A^1 ،

٢٠

A^4 ، A^3 (i) -N-؛ أو (ii) -C- يحمل بديلاً من H أو ألكوكسي، حيث يمكن أن يحمل

٢١

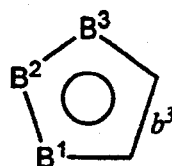
الألكوكسي أيضاً بشكل اختياري بديلاً من ألكوكسي على ذرة كربون طرفية أو ما لا

٢٢

يزيد عن ٣ ذرات هالوجين على ذرة كربون طرفية؛ شريطة أن يمثل واحداً على

٢٣

الأقل من A^1 ، A^2 ، A^3 ، A^4 أو اثنين على الأكثر -N-؛ و



٢٤

(الصيغة أ-٣)،

٢٥

حيث ترتبط الصيغة أ-٣ من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II-GG)؛ ويمثل كل من

٢٦

B^1 ، B^2 و B^3 على حدة (i) -CH- يحمل بديلاً بشكل اختياري من ألكيل، أريل،

٢٧

ألكوكسي، أو هالوجين، (ii) -S-، (iii) -O- أو (iv) -N-؛ شريطة أن واحد على

٢٨

الأكثر من B^1 ، B^2 أو B^3 يمثل -S- أو -O-، و، شريطة أنه عندما B^1 ، B^2 أو B^3 يمثل S

٢٩

- ٣٠ أو -O-، فإن أعضاء الحلقة المجاورة لا تمثل -S- أو -O-؛
- ٣١ R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي، ألكيل، ألكيل أمينو،
- ٣٢ أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن،
- ٣٣ ألكيل-SO₂-مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل-C(=O)-N(ألكيل)،
- ٣٤ N_2 (ألكيل)-C(=O)-N(ألكيل)، ألكيل-NH-C(=O)-N(ألكيل)، ألكيل-C(=O)-O-N(ألكيل)،
- ٣٥ ألكيل-SO₂-N(ألكيل)، ألكيل-NHC(=O)-N(ألكيل)، -NHC(=O)-N(ألكيل)، -NHC(=O)-NH₂،
- ٣٦ ألكيل-NHC(=O)-NH-، ألكيل-NHC(=O)-O-، ألكيل-NHC(=O)-، ألكيل-NHSO₂-، نثرو،
- ٣٧ N_2 (ألكيل)-OC(=O)-NH-، ألكيل-OC(=O)-NH-، ألكيل-SO₂-، ثيو و ثيو ألكيل؛
- ٣٨ L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون
- ٣٩ من: -O(CH₂)₁₋₄، -O-، -C(R¹⁰⁰)₂، -C(=R¹⁰⁰)، -CH(R¹⁰⁰)، -(CH₂)₁₋₄،
- ٤٠ -OCH(R¹⁰⁰)، -OC(R¹⁰⁰)₂، -S-، -NH-، -N(ألكيل منخفض)-، -N(ألكيل)-CO-
- ٤١ -N(أريل)-، -N(ألكيل-CO₂)-، -N(ألكيل-CONH)-، -N(ألكيل-SO₂)- و
- ٤٢ (أريل-SO₂-N)؛ حيث R^{100} يختار من: ألكيل، هيدروكسي، أريل، ألكوكسي، أكسو، -
- ٤٣ NH₂، N_2 (ألكيل)-N(ألكيل)، -NH(ألكيل)، -N(OH) أو -NH-OH؛ شريطة أنه عندما L^2
- ٤٤ $\textcircled{H}$
- ٤٥ يمثل -OCH(R¹⁰⁰)، R^{100} يمثل ألكوكسي، و يمثل فنيل، فإن R^5 لا يمثل -
- ٤٦ $\textcircled{G}$ -A²⁰-X¹- $\sum_{\sum}$
- ٤٧ R^{10} يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من
- ٤٨ $-X^1-A^{20}-Y^1-A^{21}$ ؛
- ٤٩ حيث X^1 و Y^1 غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي
- ٥٠ تتكون من: -N(ألكيل)-C(=O)-N(ألكيل)-، -N(ألكيل)-C(=O)-NH-، -C(=O)-NH-
- ٥١ -O-C(=O)-N(ألكيل)-، -N(ألكيل)-C(=O)-N(ألكيل)-، -N(ألكيل)-C(=O)-NH-
- ٥٢ -O-C(=O)-N(ألكيل)-SO₂-N(ألكيل)-، -NH-، -NHC(=O)-، -N(ألكيل)-C(=O)-

- ٥٣ NHC ، $\text{NHC}(\text{=O})\text{NH}$ ، $\text{NHC}(\text{=O})\text{O}$ ، $-\text{NHC}(\text{=O})\text{O}-$ ، $-\text{NHSO}_2-$ ، $-\text{O}-$ ، $-\text{OC}(\text{=O})-$ ، $-(\text{ألكيل})\text{N}(\text{=O})-$
- ٥٤ OC ، $-\text{OC}(\text{=O})\text{NH}-$ ، $-\text{OC}(\text{=O})\text{O}-$ ، $-\text{S}-$ ، $-\text{SO}-$ ، $-\text{SO}_2-$ ، $-(\text{ألكيل})\text{N}(\text{=O})\text{SO}_2-$ و $-\text{SO}_2\text{NH}-$ ؛
- ٥٥ A^{20} غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛ و
- ٥٦ A^{21} يختار من ألكيل، ألكينيل أو H ؛
- ٥٧ حيث عندما يمثل A^{20} أو A^{21} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل أو الألكينيل
- ٥٨ بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكوكسي، ألكيل
- ٥٩ أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن،
- ٦٠ ألكيل SO_2 -مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل $\text{C}(\text{=O})\text{N}(\text{ألكيل})-$ ،
- ٦١ $-(\text{ألكيل})\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(\text{=O})\text{N}-$ ، $\text{NH}_2\text{C}(\text{=O})\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، ألكيل $\text{C}(\text{=O})\text{NH}(\text{ألكيل})-$ ،
- ٦٢ ألكيل $\text{C}(\text{=O})\text{O}(\text{ألكيل})\text{N}-$ ، ألكيل $\text{SO}_2(\text{ألكيل})\text{N}-$ ، ألكيل $\text{NHC}(\text{=O})-$ ،
- ٦٣ $-(\text{ألكيل})\text{N}(\text{ألكيل})\text{NHC}(\text{=O})-$ ، $\text{NH}_2\text{NHC}(\text{=O})-$ ، ألكيل $\text{NHC}(\text{=O})\text{NH}-$ ،
- ٦٤ ألكيل $\text{O}(\text{ألكيل})\text{NHC}(\text{=O})-$ ، ألكيل NHSO_2- ، ألكيل $\text{OC}(\text{=O})-$ ،
- ٦٥ $-(\text{ألكيل})\text{N}(\text{ألكيل})\text{OC}(\text{=O})-$ ، ألكيل $\text{OC}(\text{=O})\text{NH}-$ ، ألكيل $\text{OC}(\text{=O})\text{O}-$ ،
- ألكيل SO_2- ، ثيو أو ثيو ألكيل؛

(G)

يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير

- ٦٧
- ٦٨ مشبعة جزئياً، أريل مخطط، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو
- ٦٩ عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث
- ٧٠ يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخطط،
- ٧١ الألكيل الحلقي المخطط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المخطط
- ٧٢ المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من
- ٧٣ هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي،
- ٧٤ ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل $\text{NHC}(\text{=O})-$ ، ألكيل $\text{C}(\text{=O})\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، أو ثاني
- ٧٥ ألكيل أمينو، $\text{NH}_2\text{NHC}(\text{=O})-$ ، ألكيل $\text{NHC}(\text{=O})\text{NH}-$ ، ألكيل $\text{C}(\text{=O})\text{NH}(\text{ألكيل})-$ ،

- ٧٦ ألكيل-OC(=O)NH، ألكيل-NHC(=O)O، ألكيل-C(=O)O(ألكيل)-N،
 ٧٧ ألكيل-NHSO₂، ألكيل-SO₂(ألكيل)-N، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل-SO₂،
 ٧٨ ألكيل-SO₂ مهلجن، (ألكيل)₂N(ألكيل)-NHC(=O)N، (ألكيل)₂N(ألكيل)-C(=O)N(ألكيل)-N أو
 ٧٩ (ألكيل)₂N(ألكيل)-OC(=O)-؛

s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

٨٠ -...
 ٨١ ع) عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما لا يحمل

بديلاً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع

ع)

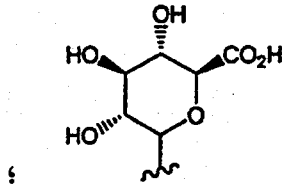
m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤، وعندما يحمل

٨٣ بديلاً واحداً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s

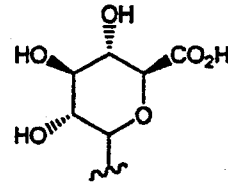
٨٤ يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

٨٥ R⁶ و R⁷ يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H ؛



شريطة أن R⁴ لا يمثل



(ب)

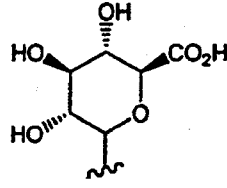
٨٨ (ج) ألكيل؛

٨٩ (د) OH ألكيل-C(=O)؛ و

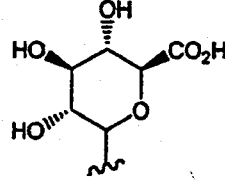
٩٠ (هـ) ألكوكسي-CH₂O-C(=O)؛

٩٢ شريطة أنه عندما يكون R⁶ موجوداً، فإن R⁷ يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما

يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود
 R^4 يختار من الفئة التي تتكون من: H و
 ؛ شريطة أنه إذا



كان R^6 أو R^7 يمثل
 فإن R^4 يمثل H؛



L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من ألكيل
 ديبيل، كربونيل أو $-SO_2-$ ؛

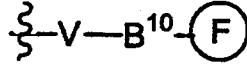


يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير

مشبعة جزئياً، أركيل، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به
 تسعة أو عشرة أعضاء، أريل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، وألكيل
 حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛

r يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ و

R^5 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكيل، ألكيل أمينو، ألكيلوكسي،
 أمينو، $-C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)OH$ ، $-C(=O)OH$ ، سيانو، ثاني ألكيل أمينو،
 هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل $-SO_2-$ مهلجن، ثيو ألكيل
 مهلجن، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل $-C(=O)N$ (ألكيل)،
 $-N$ (ألكيل) $-C(=O)N$ (ألكيل)، ألكيل $-C(=O)NH$ (ألكيل)، ألكيل $-C(=O)O$ (ألكيل)،
 ألكيل $-SO_2$ (ألكيل)، ألكيل $-NHC(=O)N$ (ألكيل)، ألكيل $-NHC(=O)NH_2$ ،
 ألكيل $-NHC(=O)NH$ (ألكيل)، ألكيل $-NHC(=O)O$ (ألكيل)، ألكيل $-NHSO_2$ ، نترو،
 $-OC(=O)N$ (ألكيل)، ألكيل $-OC(=O)NH$ (ألكيل)، ألكيل $-SO_2$ ، $-SO_2NH_2$ ، ثيو،



١١٠

ثيو ألكيل، و $\text{V-B}^{10}\text{-W-B}^{20}$ ؛ حيث:

١١١

V و W غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون

١١٢

من: C(=O)- ، C(=O)N(ألكيل)- ، C(=O)NH- ، C(=O)O- ، N(ألكيل)- ،

١١٣

N(ألكيل)C(=O)- ، $\text{N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)-}$ ، N(ألكيل)C(=O)NH- ،

١١٤

N(ألكيل)C(=O)O- ، $\text{N(ألكيل)SO}_2\text{-}$ ، NH- ، NHC(=O)- ، N(ألكيل)- ،

١١٥

NHC ، NHC(=O)NH- ، NHC(=O)O- ، $\text{NHSO}_2\text{-}$ ، O- ، OC(=O)- ،

١١٦

N(ألكيل)- ، OC(=O)NH- ، OC(=O)N(ألكيل)- ، S- ، SO- ، $\text{SO}_2\text{-}$ ، N(ألكيل)- ،

١١٧

SO_2N و $\text{SO}_2\text{NH-}$ ؛

١١٨

B^{10} غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛

١١٩

B^{20} غير موجود أو يختار من ألكيل، ألكينيل أو H ؛

١٢٠

حيث عندما يمثل B^{10} أو B^{20} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل أو

١٢١

الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:

١٢٢

ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي

١٢٣

مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي،

١٢٤

ألكيل C(=O)N(ألكيل)- ، N(ألكيل)- ، $\text{N(ألكيل)C(=O)N(ألكيل)-}$ ،

١٢٥

N(ألكيل)C(=O)NH_2 ، ألكيل C(=O)NH ، N(ألكيل)C(=O)NH ،

١٢٦

ألكيل C(=O)O ، N(ألكيل)C(=O)O ، ألكيل SO_2 ، N(ألكيل)- ، ألكيل NHC(=O)- ،

١٢٧

N(ألكيل)NHC(=O)- ، NHC(=O)NH_2 ، ألكيل NHC(=O)NH ، ألكيل NHC(=O)O ،

١٢٨

ألكيل NHSO_2 ، ألكيل OC(=O)- ، OC(=O)N(ألكيل)- ، OC(=O)NH ،

١٢٩

ألكيل OC(=O)- ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل؛ و

١٢٩

يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير

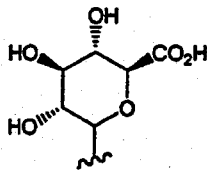
١٣٠

- ١٣١ مشبعة جزئياً، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو
- ١٣٢ عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء،
- ١٣٣ حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل
- ١٣٤ المخلط، الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي
- ١٣٥ المخلط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من:
- ١٣٦ ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن،
- ١٣٧ ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، أريل مخلط،
- ١٣٨ هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل $\text{C}(=\text{O})$ (ألكيل) N ،
- ١٣٩ N (ألكيل) $\text{C}(=\text{O})$ N (ألكيل) $\text{C}(=\text{O})$ NH (ألكيل) N ، ألكيل
- ١٤٠ ألكيل O $\text{C}(=\text{O})$ (ألكيل) N ، ألكيل SO_2 (ألكيل) N ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})$ NHC ،
- ١٤١ N (ألكيل) $\text{C}(=\text{O})$ NHC ، $\text{NHC}(=\text{O})$ NH_2 ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ NH ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ O ،
- ١٤٢ ألكيل NHSO_2 ، نيترو، N (ألكيل) $\text{OC}(=\text{O})$ ، ألكيل $\text{OC}(=\text{O})$ NH ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو
- ١٤٣ ألكيل؛

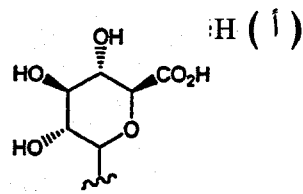
١ أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه.

٢

٣ ٣١- مركب وفقاً لعنصر الحماية ٣٠، حيث R^7 غير موجود و R^6 يختار من الفئة التي تتكون من:



؛

شريطة أن R^4 لا يمثل

٤

(ب)

(ج) مثيل؛

٥

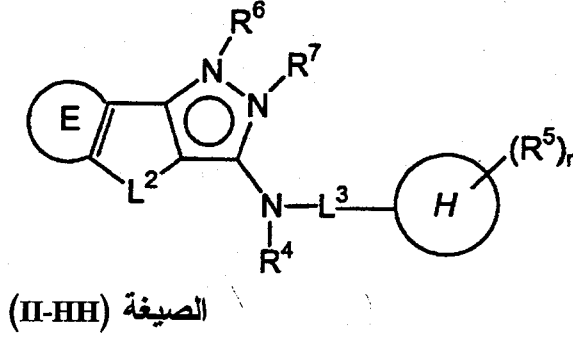
(د) $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{OH}$ ؛ و

٦

(هـ) مثنوكسي $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{O}$ ؛

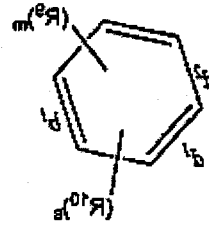
٧

٣٢- مركب بالصيغة (II-HH):



حيث:

يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:

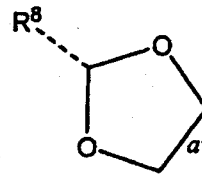


(الصيغة أ-١)،

حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b¹ بالحلقة L² في الصيغة (II-HH) وتحمل بشكل

اختياري بديلاً واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:

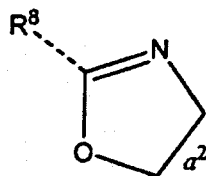
أ-١-ج:



(الصيغة أ-١-أ')

١٠ حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ' من جهة a^1 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على

١١ الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

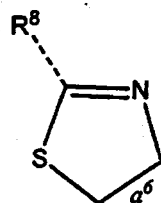


١٢

(الصيغة أ-١-ب)،

١٣ حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على

١٤ الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و



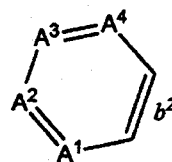
١٥

(الصيغة أ-١-ج)،

١٦ حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين

١٧ على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

١٨ حيث R^8 يمثل H أو ألكيل؛



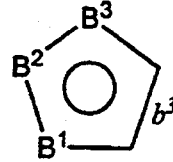
(الصيغة أ-٢)،

١٩

٢٠ حيث ترتبط الصيغة أ-٢ من جهة b^2 بالحلقة L^2 في الصيغة (II-HH)، ويمثل

٢١ A^1, A^2, A^3, A^4 ؛ (i) -N؛ أو (ii) -C- يحمل بديلاً من H أو ألكوكسي، حيث يمكن أن

- ٢٢ يحمل الألكوكسي أيضاً بشكل اختياري بديلاً من الأوكسي على ذرة كربون طرفية أو
 ٢٣ ما لا يزيد عن ٣ ذرات هالوجين على ذرة كربون طرفية؛ شريطة أن يمثل واحداً
 ٢٤ على الأقل من A^1, A^2, A^3, A^4 أو اثنين على الأكثر -N-؛ و



٢٥

(الصيغة أ-٣)،

- ٢٦ حيث ترتبط الصيغة أ-٣ من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II-HH)، ويمثل كل من
 ٢٧ B^1, B^2 و B^3 على حدة (i) -CH- يحمل بشكل اختياري بديلاً من الأكيل، أريل،
 ٢٨ الأوكسي أو هالوجين، (ii) -S-؛ (iii) -O-؛ أو (iv) -N-؛ شريطة أن واحداً على
 ٢٩ الأكثر من B^1, B^2 أو B^3 يمثل -S- أو -O-، و، شريطة أنه عندما B^1, B^2 أو B^3 يمثل
 ٣٠ -S- أو -O- فإن أعضاء الحلقة المجاورة لا تمثل -S- أو -O-؛
 ٣١ R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: الأوكسي، الأكيل، الأكيل أمينو،
 ٣٢ أمينو، سيانو، ثاني أكيل أمينو، هالوجين، الأكيل مهالجين، الأيلوكسي
 ٣٣ مهالجين، أكيل SO_2 مهالجين، ثيو أكيل مهالجين، هيدروكسي، أكيل $C(=O)$ (أكيل)-
 ٣٤ N ، N_2 (أكيل) $C(=O)N$ (أكيل)-، أكيل $C(=O)NH$ (أكيل)-، أكيل $C(=O)O$ (أكيل)-
 ٣٥ N ، أكيل SO_2 (أكيل)-، أكيل $NHC(=O)$ ، أكيل $NHC(=O)N$ (أكيل)-،
 ٣٦ $NHC(=O)NH_2$ ، أكيل $NHC(=O)NH$ ، أكيل $NHC(=O)O$ ، أكيل $NHC(=O)N$ ،
 ٣٧ $NHSO_2$ ، نيترو، N_2 (أكيل) $OC(=O)N$ ، أكيل $OC(=O)NH$ ، أكيل SO_2 ،
 ٣٨ ثيو وثيو أكيل؛
 ٣٩ L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من: $-(CH_2)-$ ، -
 ٤٠ $-CH(CH_3)-$ ، $-CH(CH_2CH_3)-$ و -O-، شريطة أنه عندما L^2 يمثل -O-، فإن R^6 أو R^7
 ٤١ لا يمثل أي منهما $-CH_3$ ؛

٤٢ R^{10} يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من $\text{X}^1 - A^{20} - \text{G}$ و $\text{X}^1 - A^{20} - Y^1 - A^{21}$ ٤٣

٤٤ حيث X^1 و Y^1 غير موجودين أو يختار كل منهما على

٤٥ حدة من الفئة التي تتكون من:

٤٦ $-\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})-$ ،

٤٧ $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ ،

٤٨ $-\text{NHC}(=\text{O})-$ ، $-\text{NH}-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{SO}_2-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ ،

٤٩ $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}-$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{O}-$ ، $-\text{O}-$ ، $-\text{NH}\text{SO}_2-$ ، $-\text{SO}_2-$ ،

٥٠ $-\text{OC}(=\text{O})\text{O}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})\text{NH}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، $-\text{SO}_2\text{NH}-$ و $-\text{SO}_2\text{N}(\text{ألكيل})-$ ٥١

٥٢ A^{20} غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛ و

٥٣ A^{21} يختار من ألكيل، ألكينيل أو H ؛

٥٤ حيث عندما يمثل A^{20} أو A^{21} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل أو

٥٥ الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:

٥٦ ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي

٥٧ مهارجن، ألكيل SO_2 مهارجن، ثيو ألكيل مهارجن، هيدروكسي،

٥٨ ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ،

٥٩ $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ألكيل، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ ألكيل، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ألكيل،

٦٠ ألكيل SO_2 ألكيل، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ ألكيل، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ،

٦١ $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ألكيل، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ألكيل، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ألكيل، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ألكيل،

٦٢ NHSO_2 ألكيل، $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ألكيل، $-\text{OC}(=\text{O})\text{NH}$ ألكيل،

ألكيل $-\text{OC}(=\text{O})\text{O}$ ألكيل، $-\text{SO}_2$ ألكيل، ثيو أو ثيو ألكيل؛

(G)

٦٣ يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير

- ٦٤ مشبعة جزئياً، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو
٦٥ عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث
٦٦ يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخلط،
٦٧ الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المخلط
٦٨ المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من
٦٩ هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي،
٧٠ ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل NHC(=O) ، ألكيل C(=O)(الكيل)N ، أو ثاني
٧١ ألكيل أمينو، NHC(=O)NH ألكيل، NHC(=O)NH ألكيل C(=O)NH(الكيل)N ،
٧٢ ألكيل OC(=O)NH ألكيل، NHC(=O)O ألكيل، C(=O)O(الكيل)N ،
٧٣ ألكيل NHSO_2 ، ألكيل $\text{SO}_2(الكيل)N$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ،
٧٤ ألكيل SO_2 مهلجن، NHC(=O)N(الكيل)_2 ، C(=O)N(الكيل)N أو
٧٥ OC(=O)N(الكيل)_2 ؛

s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما لا يحمل

(E)

بديلاً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و

(E)

s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤، وعندما يحمل

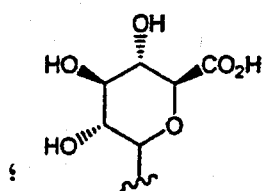
بديلاً

واحداً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل جمع m و s

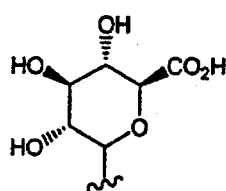
يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H؛



شريطة أن R^4 لا يمثل



(ب)

٨٤

٨٥

(ج) $-CH_2-$ يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: H ، ميثيل، ألكيل- O ، -

٨٦

CH_2OH ، $-CH(CH_3)OH$ ، ألكيل- $O(C=O)$ ، $-(C=O)OH$ ، ألكيل- $C(=O)$ ، -

٨٧

أريل- $O(C=O)$ ، أريل مخطط- $O(C=O)$ ، $-(C=O)NH_2$ ، ألكيل- $NH(C=O)$ ، -

٨٨

$(\text{ألكيل-}N(C=O))_2$ ، ألكيل- $C(=O)$ ، CH_3O -فني-ل أو ألكيل-ل-

٨٩

$OC(=O)$ -فني-ل؛

٩٠

(د) $-C(=O)(CH_2CH_2O)_{1-10}$ ينتهي بـ H ، ميثيل، اثيل أو بنزيل؛

٩١

(هـ) $-C(=O)CH_2O(CH_2CH_2O)_{1-10}$ ينتهي بـ H ، ميثيل، اثيل أو بنزيل؛

٩٢

(و) ألكيل- $C(=O)$ أو ألكيل حلقي $-C(=O)(C_{3-6})$ ، حيث يمكن أن يحمل

٩٣

ألكيل- $C(=O)$ المذكور وألكيل حلقي $-C(=O)(C_{3-6})$ المذكور بشكل

٩٤

اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: OH ، ألكيل-

٩٥

O ، أريل ألكيل- O ، NH_2 ، ألكيل- NH ، $(\text{ألكيل-}N)_2$ ، ألكيل حلقي مخطط،

٩٦

ألكيل- $NHC(=O)$ ، ألكيل- $NHSO_2$ أو ألكيل- $OC(=O)$ ؛

٩٧

(ز) أريل $-C(=O)(CH_2)_{1-3}$ ، أريل $-C(=O)$ ، أريل مخطط $-C(=O)(CH_2)_{1-3}$ أو أريل

٩٨

مخطط $-C(=O)$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $-C(=O)(CH_2)_{1-3}$ المذكور،

٩٩

أريل $-C(=O)$ المذكور، أريل مخطط $-C(=O)(CH_2)_{1-3}$ المذكور وأريل

١٠٠

مخطط $-C(=O)$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار

١٠١

كل على حدة من: OH ، ألكيل- O ، NH_2 ، ألكيل- NH ، $(\text{ألكيل-}N)_2$ ، ألكيل

١٠٢

حلقي مخطط، ألكيل- $NHC(=O)$ ، ألكيل- $NHSO_2$ ، هالوجين، نتريل أو

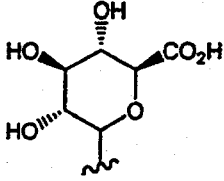
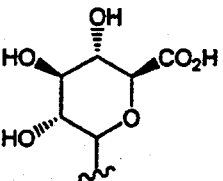
١٠٣

ألكيل- $OC(=O)$ ؛

١٠٤

- ١٠٥ (ح) $-C(=O)(CH_2)_{1-6}C(=O)-$ ينتهي بمثيل، اثيل، $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ،
 ١٠٦ $N(ألكيل)_2$ أو ألكيل حلقي مخطط؛
- ١٠٧ (ح) ألكيل $-OC(=O)ألكيل$ $-C(=O)-$ ينتهي بـ $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ،
 ١٠٨ $N(ألكيل)_2$ أو ألكيل حلقي مخطط؛
- ١٠٩ (ط) $-C(=O)O(CH_2CH_2O)_{1-10}$ ينتهي بـ H ، مثيل، اثيل أو بنزيل؛
- ١١٠ (ي) ألكيل $-C(=O)O$ أو ألكيل حلقي $-C(=O)O(C_{3-6})$ ، حيث يمكن أن يحمل
 ١١١ ألكيل $-C(=O)O$ المذكور، وألكيل حلقي $-C(=O)O(C_{3-6})$ المذكور بشكل
 ١١٢ اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: $-OH$ ، ألكيل-
 ١١٣ O ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل-
 ١١٤ $NHC(=O)$ ، ألكيل $-NHSO_2$ ، ألكيل $-OC(=O)$ ، $-C(=O)OH$ ،
 ١١٥ ألكيل $-C(=O)O$ ، $-C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)NH$ أو $N(ألكيل)_2$ $-C(=O)-$ ؛
- ١١٦ (ك) أريل $-C(=O)O(CH_2)_{1-3}$ ، أريل $-C(=O)O$ ، أريل مخطط $-C(=O)O(CH_2)_{1-3}$ أو أريل
 ١١٧ مخطط $-C(=O)O$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $-C(=O)O(CH_2)_{1-3}$ المذكور،
 ١١٨ أريل $-C(=O)O$ المذكور، أريل مخطط $-C(=O)O(CH_2)_{1-3}$ المذكور أو أريل
 ١١٩ مخطط $-C(=O)O$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار
 ١٢٠ كل على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $N(ألكيل)_2$ ، ألكيل
 ١٢١ حلقي مخطط، ألكيل $-NHC(=O)$ ، ألكيل $-NHSO_2$ ، هالوجين، نتريل أو
 ١٢٢ ألكيل $-OC(=O)-$ ؛
- ١٢٣ (ل) $-C(=O)NH(CH_2CH_2O)_{1-10}$ ينتهي بـ H ، مثيل، اثيل، بنزيل، -
 ١٢٤ $CH_2CH_2NH_2$ ، ألكيل $-CH_2CH_2NH$ ، $N(ألكيل)_2$ ، $-CH_2CH_2N$ ، $-CH_2CH_2-1$ ،
 ١٢٥ بيروليدينيل، $-CH_2CH_2-1$ ، بييريدينيل، $-CH_2CH_2-4$ ، مورفولينيل، $-CH_2CH_2-1$ ،
 ١٢٦ بييرازينيل، $-CH_2CH_2-1$ ، (CH_3-4) ، بييرازينيل، أو ألكيل $-C(=O)-$ ؛
- ١٢٧ (م) $-C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)NH(C_{1-20})$ ، ألكيل حلقي $-C(=O)NH(C_{3-6})$ أو
 ١٢٨ $N(ألكيل)_2$ $-C(=O)N$ ، حيث يمكن أن يحمل ألكيل $-C(=O)NH(C_{1-20})$ المذكور،
 ١٢٩ ألكيل حلقي $-C(=O)NH(C_{3-6})$ المذكور و $N(ألكيل)_2$ $-C(=O)N$ المذكور بشكل

- ١٣٠ اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH، ألكيل-
- ١٣١ O ، NH_2 ، ألكيل-NH، $\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل-
- ١٣٢ $\text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل-NHSO₂، ألكيل-OC(=O)، ألكينيل-
- ١٣٣ $\text{OC}(=\text{O})$ ، أرييل-NHC(=O)، $\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ ، ألكيل- $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ، -
- ١٣٤ $\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل-C(=O)NH، أو $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ؛ وحيث يمكن أن
- ١٣٥ يحمل جزء الأريل في أريل-NHC(=O) المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة
- ١٣٦ واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، -OH، ألكيل-O، -
- ١٣٧ NH_2 ، ألكيل-NH، $\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، هالوجين أو نتريل؛
- ١٣٨ (ن) أريل-C(=O)NH(CH₂)₁₋₃، أريل-C(=O)NH، أريل مخطط-C(=O)NH(CH₂)₁₋₃ أو
- ١٣٩ أريل مخطط-C(=O)NH، حيث يمكن أن يحمل أريل-C(=O)NH(CH₂)₁₋₃
- ١٤٠ المذكور، أريل-C(=O)NH، المذكور، أريل مخطط-C(=O)NH(CH₂)₁₋₃
- ١٤١ المذكور، وأريل مخطط-C(=O)NH، المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة
- ١٤٢ واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH،
- ١٤٣ $\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل-NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂،
- ١٤٤ هالوجين، نتريل أو ألكيل-OC(=O)؛
- ١٤٥ (ع) $\text{C}(=\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH})_{0-3}$ ينتهي بـ -H، ميثيل، اثيل،
- ١٤٦ ألكيل-CH₂CH₂NH، $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، -CH₂CH₂-١-بيروليدينيل،
- ١٤٧ -CH₂CH₂-١-بييريدينيل، -CH₂CH₂-٤-مورفولينيل، -CH₂CH₂-١-
- ١٤٨ بيبرازينيل، -CH₂CH₂-١-(٤-CH₃)-بيبرازينيل، -CH₂CH₂OH، -
- ١٤٩ $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$ ، -CH₂CH₂OCH₂CH₃، ألكيل-CH₂CH₂OC(=O) أو أريل-C(=O)؛
- ١٥٠ حيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل-C(=O) المذكور بشكل اختياري
- ١٥١ مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، -OH، ألكيل-O، -
- ١٥٢ NH_2 ، ألكيل-NH، $\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، هالوجين أو نتريل؛
- ١٥٣ (ف) $\text{C}(=\text{S})\text{NH}_2$ ؛
- ١٥٤ (ق) ألكيل-C(=S)NH؛

- ١٥٥ (ر) $(\text{الكيل})_2\text{N}-\text{C}(=\text{S})-$
- ١٥٦ (ش) $-\text{SO}_2\text{NH}_2-$
- ١٥٧ (ت) $-\text{SO}_2\text{NH}(\text{الكيل})-$
- ١٥٨ (ث) $(\text{الكيل})_2\text{N}-\text{SO}_2-$
- ١٥٩ (خ) $(\text{OCH}_3)_2\text{P}(=\text{O})-$ و
- ١٦٠ (ذ) $(\text{OCH}_2\text{CH}_3)_2\text{P}(=\text{O})-$
- ١٦١ شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود
- ١٦٢  R^4 يختار من الفئة التي تتكون من: H و ؛ شريطة أنه إذا
- ١٦٣  كان R^6 أو R^7 يمثل فإن R^4 يمثل H؛
- ١٦٤
- ١٦٥ L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من ألكيل
- ١٦٦ ديبيل، ك، ن، أو $-\text{SO}_2-$
- (H)
- ١٦٧ يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية
- ١٦٨ غير مشبعة جزئياً، أراكيل، أريل مخطط، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع
- ١٦٩ بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، أريل مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة
- ١٧٠ أعضاء، وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛
- ١٧١ r يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ و
- ١٧٢ R^5 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكيل، ألكيل أمينو، ألكيلوكسي،

- ١٧٣ أمينو، $-C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)O$ ، $-C(=O)OH$ ، $-CH_2OH$ ، سيانو، ثاني ألكيل
- ١٧٤ أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل
- ١٧٥ مهلجن، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل $C(=O)N$ (ألكيل)، $-N$ ،
- ١٧٦ 2 (ألكيل) $C(=O)N$ (ألكيل)، ألكيل NH $C(=O)N$ (ألكيل)، $-N$ ،
- ١٧٧ ألكيل $C(=O)O$ (ألكيل)، $-N$ ، ألكيل SO_2 (ألكيل)، $-N$ ، ألكيل $NHC(=O)$ ،
- ١٧٨ 2 (ألكيل) $NHC(=O)N$ ، $-NHC(=O)NH_2$ ، ألكيل $NHC(=O)NH$ ، ألكيل $NHC(=O)O$ ،
- ألكيل $NHSO_2$ ، نثرو، 2 (ألكيل) $OC(=O)N$ ، ألكيل $OC(=O)NH$ ، ألكيل SO_2 ، $-SO_2NH_2$ ،
- ١٧٩ $\sum V-B^{10}-\textcircled{F}$
- ١٨٠ ثيو، ثيو ألكيل، و $-V-B^{10}-W-B^{20}$ ؛ حيث
- ١٨١ V و W غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من
- ١٨٢ الفئة التي تتكون من: $-C(=O)$ ، $-(\text{ألكيل})C(=O)N$ ، $-C(=O)NH$ ، $-C(=O)O$ ،
- ١٨٣ $-(\text{ألكيل})N$ ، $-(\text{ألكيل})C(=O)N$ ، $-(\text{ألكيل})C(=O)N$ ، $-N$ ،
- ١٨٤ $NHC(=O)N$ (ألكيل)، $-N$ ، $NHC(=O)O$ (ألكيل)، $-N$ ، SO_2 (ألكيل)، $-N$ ، NH ، $-(=O)$ ،
- ١٨٥ NHC ، $NHC(=O)N$ (ألكيل)، $-NHC(=O)NH$ ، $-NHC(=O)O$ ، $-NHSO_2$ ، $-O$ ،
- ١٨٦ $OC(=O)$ ، $OC(=O)N$ (ألكيل)، $OC(=O)NH$ ، $OC(=O)O$ ، $-S$ ، $-SO$ ، $-SO_2$ ،
- ١٨٧ $-(\text{ألكيل})SO_2N$ و $-SO_2NH$ ؛
- ١٨٨ B^{10} غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛
- ١٨٩ B^{20} غير موجود أو يختار من ألكيل، ألكينيل أو H ؛
- ١٩٠ حيث عندما يمثل B^{10} أو B^{20} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل
- ١٩١ أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:
- ١٩٢ ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي
- ١٩٣ مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي،
- ١٩٤ ألكيل $C(=O)N$ (ألكيل)، 2 (ألكيل) $C(=O)N$ (ألكيل)، $-N$ ،
- ١٩٥ NH_2 $C(=O)N$ (ألكيل)، ألكيل NH $C(=O)N$ (ألكيل)، ألكيل $C(=O)O$ (ألكيل)، $-N$ ،

- ١٩٦ الأكيل SO_2 (الكيل)N-، الأكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ، $(\text{الكيل})_2\text{NHC}(=\text{O})$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ،
 ١٩٧ NHC ، الأكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، الأكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NHSO}_2$ ،
 ١٩٨ الأكيل $\text{OC}(=\text{O})$ ، $(\text{الكيل})_2\text{NOC}(=\text{O})$ ، الأكيل $\text{NOC}(=\text{O})\text{NH}$ ، الأكيل $\text{OC}(=\text{O})\text{O}$ ،
 الأكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو الأكيل؛ و

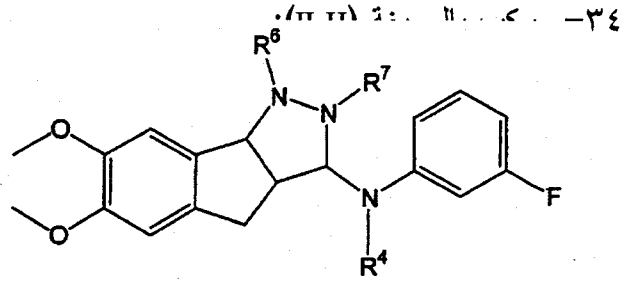
(F)

يختار من من الفئة التي تتكون من: أريل، الأكيل حلقي، حلقة كربونية غير

- ٢٠٠
 ٢٠١ مشبعة جزئياً، أريل مخطط، الأكيل حلقي مخطط، الأكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة
 ٢٠٣ أو عشرة أعضاء والأكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء،
 ٢٠٤ حيث يحمل الأريل، الأكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل
 ٢٠٥ المخطط، الأكيل الحلقي المخطط، الأكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الأكيل الحلقي
 ٢٠٦ المخطط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة
 ٢٠٧ من: الأوكسي، الأكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني الأكيل أمينو، هالوجين، الأوكسي
 ٢٠٨ مهلجن، الأكيل مهلجن، الأكيل SO_2 مهلجن، ثيو الأكيل مهلجن، أريل
 ٢٠٩ مخطط، هيدروكسي، هيدروكسي الأكيل، الأكيل $\text{C}(=\text{O})$ (الكيل)N-،
 ٢١٠ $(\text{الكيل})_2\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ (الكيل)، الأكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ (الكيل)N-،
 ٢١١ الأكيل $\text{OC}(=\text{O})\text{N}$ (الكيل)، الأكيل SO_2 (الكيل)N-، الأكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ،
 ٢١٢ $(\text{الكيل})_2\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، الأكيل $\text{OC}(=\text{O})$ ،
 ٢١٣ NHC ، الأكيل NHSO_2 ، نترو، $(\text{الكيل})_2\text{NOC}(=\text{O})$ ، الأكيل $\text{OC}(=\text{O})\text{NH}$ ، الأكيل-
 ٢١٤ SO_2 ، ثيو أو ثيو الأكيل؛

أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه.

- ١
 ٢ ٣٣- مركب وفقاً لعنصر الحماية ٣٢، حيث L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة
 التي تتكون من: $-(\text{CH}_2)-$ ، $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ ، $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-$.

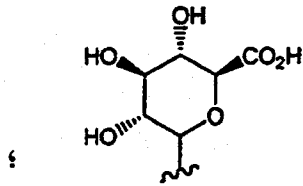


الصيغة (II-JJ)

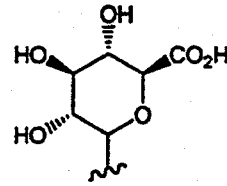
حيث:

R^6 و R^7 يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:

(أ) H؛



شريطة أن R^4 لا يمثل



(ب)

(ج) CH_2 - يحمل مجموعة بديلة واحدة تختار من: H، ميثيل، ألكيل-O، -

CH_2OH ، $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OH}$ ، ألكيل-O(C=O)، $\text{OH}(\text{C}=\text{O})$ ، ألكيل-O(C=O)،

أريل-O(C=O)، أريل مخلوط-O(C=O)، $\text{NH}_2(\text{C}=\text{O})$ ، ألكيل-NH(C=O)،

$\text{N}(\text{ألكيل})(\text{ألكيل})$ ، ألكيل-O(C=O)، OCH_3 -فنييل- أو ألكيل-

$\text{OC}(\text{O})$ -فنييل؛

(د) $\text{C}(\text{O})(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{1-10}$ ينتهي بـ H، ميثيل، ايثيل أو بنزيل؛

(هـ) $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{1-10}$ ينتهي بـ H، ميثيل، ايثيل أو بنزيل؛

(و) ألكيل-O(C=O) أو ألكيل حلقي $\text{C}(\text{O})(\text{C}_{3-6})$ ، حيث يمكن أن يحمل

ألكيل-O(C=O) المذكور وألكيل حلقي $\text{C}(\text{O})(\text{C}_{3-6})$ المذكور بشكل

- ١٧ اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: $-OH$ ، ألكيل-
- ١٨ O ، أريل ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $-N$ (ألكيل) $_2$ ، ألكيل حلقي مخطط،
- ١٩ ألكيل $-NHC(=O)$ ، ألكيل $-NHSO_2$ أو ألكيل $-OC(=O)$ ؛
- ٢٠ (ز) أريل $-C(=O)(CH_2)_{1-3}$ ، أريل $-C(=O)$ ، أريل مخطط $-C(=O)(CH_2)_{1-3}$ أو
- ٢١ أريل مخطط $-C(=O)$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $-C(=O)(CH_2)_{1-3}$ المذكور،
- ٢٢ أريل $-C(=O)$ المذكور، أريل مخطط $-C(=O)(CH_2)_{1-3}$ المذكور وأريل
- ٢٣ مخطط $-C(=O)$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار
- ٢٤ كل على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ، $-N$ (ألكيل) $_2$ ،
- ٢٥ ألكيل حلقي مخطط، ألكيل $-NHC(=O)$ ، ألكيل $-NHSO_2$ ، هالوجين، نتريل
- ٢٦ أو ألكيل $-OC(=O)$ ؛
- ٢٧ (ح) $-C(=O)(CH_2)_{1-6}C(=O)-$ ينتهي بمثيل، اثيل، $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ،
- ٢٨ $-N$ (ألكيل) $_2$ أو ألكيل حلقي مخطط؛
- ٢٩ (ح ح) ألكيل $-OC(=O)$ ألكيل $-C(=O)$ ينتهي بـ $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ، ألكيل $-NH$ ،
- ٣٠ $-N$ (ألكيل) $_2$ أو ألكيل حلقي مخطط؛
- ٣١ (ط) $-C(=O)O(CH_2CH_2O)_{1-10}$ ينتهي بـ H ، مثيل، اثيل أو بنزيل؛
- ٣٢ (ي) ألكيل $-C(=O)O$ أو ألكيل حلقي $-C(=O)O(C_{3-6})$ ، حيث يمكن أن يحمل
- ٣٣ ألكيل $-C(=O)O$ المذكور وألكيل حلقي $-C(=O)O(C_{3-6})$ المذكور بشكل اختياري
- ٣٤ مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: $-OH$ ، ألكيل $-O$ ، $-NH_2$ ،
- ٣٥ ألكيل $-NH$ ، $-N$ (ألكيل) $_2$ ، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل $-NHC(=O)$ ،
- ٣٦ ألكيل $-NHSO_2$ ، ألكيل $-OC(=O)$ ، ألكيل $-C(=O)OH$ ، ألكيل $-C(=O)O$ ، -
- ٣٧ $-C(=O)NH_2$ ، ألكيل $-C(=O)NH$ أو $-C(=O)N$ (ألكيل) $_2$ ؛
- ٣٨ (ك) أريل $-C(=O)O(CH_2)_{1-3}$ ، أريل $-C(=O)O$ ، أريل مخطط $-C(=O)O(CH_2)_{1-3}$ أو أريل
- ٣٩ مخطط $-C(=O)O$ ، حيث يمكن أن يحمل أريل $-C(=O)O(CH_2)_{1-3}$ المذكور،
- ٤٠ أريل $-C(=O)O$ المذكور، أريل مخطط $-C(=O)O(CH_2)_{1-3}$ المذكور أو أريل
- ٤١ مخطط $-C(=O)O$ المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار

- ٤٢ كل على حدة من: -OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH، -N(ألكيل)₂، ألكيل
- ٤٣ حلقي مخطط، ألكيل-NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂، هالوجين، نتريل أو
- ٤٤ ألكيل-OC(=O)؛
- ٤٥ (ل) -C(=O)NH(CH₂CH₂O-)₁₋₁₀ ينتهي بـ -H، ميثيل، إيثيل، بنزيل، -
- ٤٦ -CH₂CH₂NH₂، ألكيل-CH₂CH₂NH، -CH₂CH₂N(ألكيل)₂، -CH₂CH₂N(ألكيل)₂، -CH₂CH₂-1-
- ٤٧ بيروليدينيل، -CH₂CH₂-1-بيبريدينييل، -CH₂CH₂-4-مورفولينيل، -CH₂CH₂-1-
- ٤٨ بيبرازينيل، -CH₂CH₂-1-(CH₃-4)-بيبرازينيل، أو ألكيل-C(=O)؛
- ٤٩ (م) -C(=O)NH₂، ألكيل-C(=O)NH(C₁₋₂₀)، ألكيل حلقي-C(=O)NH(C₃₋₆)، أو
- ٥٠ -N(ألكيل)₂-C(=O)N، حيث يمكن أن يحمل ألكيل-C(=O)NH(C₁₋₂₀) المذكور،
- ٥١ ألكيل حلقي-C(=O)NH(C₃₋₆) المذكور و -N(ألكيل)₂-C(=O)N المذكور بشكل
- ٥٢ اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH، ألكيل-
- ٥٣ O، -NH₂، ألكيل-NH، -N(ألكيل)₂، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل-
- ٥٤ NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂، ألكيل-OC(=O)، ألكيل-نيل-
- ٥٥ OC(=O)، أرييل-ألكيل-NHC(=O)، -C(=O)OH، ألكيل-OC(=O)-C(=O)-، -
- ٥٦ C(=O)NH₂، ألكيل-C(=O)NH، أو -N(ألكيل)₂-C(=O)N؛ وحيث يمكن أن
- ٥٧ يحمل جزء الأريل في أرييل-NHC(=O) المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة
- ٥٨ واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، -OH، ألكيل-O، -
- ٥٩ NH₂، ألكيل-NH، -N(ألكيل)₂، هالوجين أو نتريل؛
- ٦٠ (ن) أرييل-C(=O)NH(CH₂)₁₋₃، أرييل-C(=O)NH، أرييل مخطط-C(=O)NH(CH₂)₁₋₃ أو
- ٦١ أرييل مخطط-C(=O)NH، حيث يمكن أن يحمل أرييل-C(=O)NH(CH₂)₁₋₃
- ٦٢ المذكور، أرييل-C(=O)NH، المذكور، أرييل مخطط-C(=O)NH(CH₂)₁₋₃
- ٦٣ المذكور وأرييل مخطط-C(=O)NH، المذكور بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة
- ٦٤ أو أكثر تختار كل على حدة من: -OH، ألكيل-O، -NH₂، ألكيل-NH،
- ٦٥ -N(ألكيل)₂، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل-NHC(=O)، ألكيل-NHSO₂،
- ٦٦ هالوجين، نتريل أو ألكيل-OC(=O)؛

- (ع) $-C(=O)NHCH_2CH_2NH(CH_2CH_2NH-)_{0-3}$ ينتهي بـ H-، ميثيل، اثيل،
 الكيل- CH_2CH_2NH- ، $(الكيل)_2-CH_2CH_2N-$ ، $1-CH_2CH_2-$ بيروليدينيل،
 $1-CH_2CH_2-$ بيريردينيل، $4-CH_2CH_2-$ مورفولينيل، $1-CH_2CH_2-$
 بيرازينيل، $1-CH_2CH_2-$ (٤- CH_3) بيربرازينيل، $-CH_2CH_2OH$ ،
 $CH_2CH_2OCH_3$ ، $CH_2CH_2OCH_2CH_3$ ، ألكيل $-CH_2CH_2OC(=O)-$ أو أريل $-C(=O)-$ ؛
 حيث يمكن أن يحمل جزء الأريل في أريل $-C(=O)-$ المذكور بشكل اختياري
 مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من: ألكيل، OH-، ألكيل-O،
 NH_2- ، ألكيل-NH، $N(الكيل)_2-$ ، هالوجين أو نتريل؛

(ف) $-C(=S)NH_2$ ؛ ٧٥

(ق) ألكيل $-C(=S)NH-$ ؛ ٧٦

(ر) $-C(=S)N(الكيل)_2$ ؛ ٧٧

(ش) $-SO_2NH_2$ ؛ ٧٨

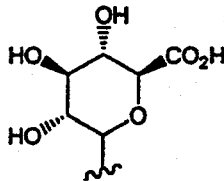
(ت) ألكيل $-SO_2NH-$ ؛ ٧٩

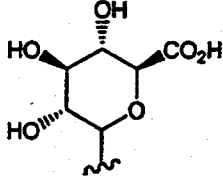
(ث) $-SO_2N(الكيل)_2$ ؛ ٨٠

(خ) $-P(=O)(OCH_3)_2$ ؛ و ٨١

(ذ) $-P(=O)(OCH_2CH_3)_2$ ؛ ٨٢

شريطة أنه عندما يكون R^6 موجوداً، فإن R^7 يكون غير موجود؛ وشريطة أنه عندما ٨٣

يكون R^7 موجوداً، فإن R^6 يكون غير موجود

 R^4 يختار من الفئة التي تتكون من: H و ؛ شريطة أنه إذا كان ٨٤

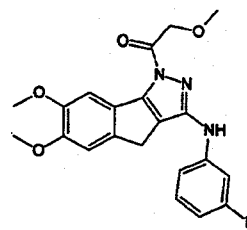
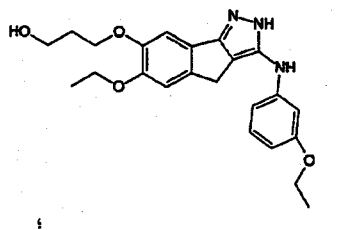
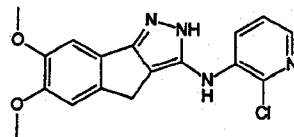
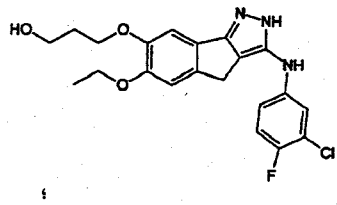
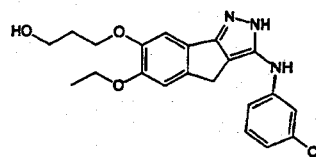
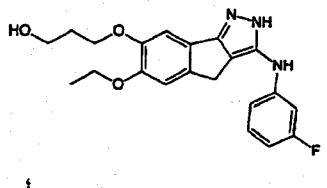
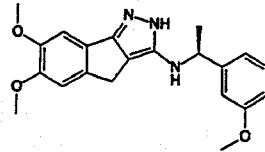
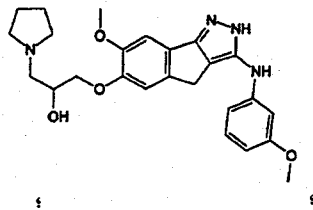
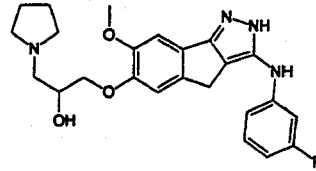
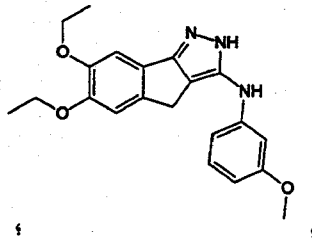
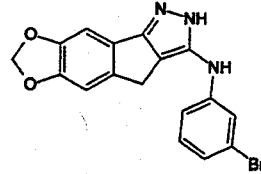
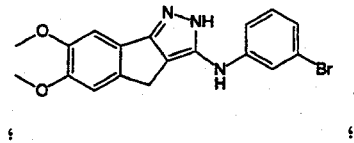
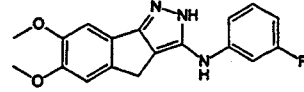
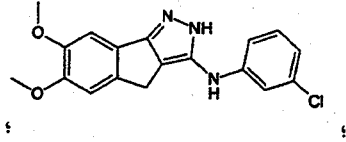

 R^6 أو R^7 يمثل ٨٥
 فإن R^4 يمثل H؛

٨٦

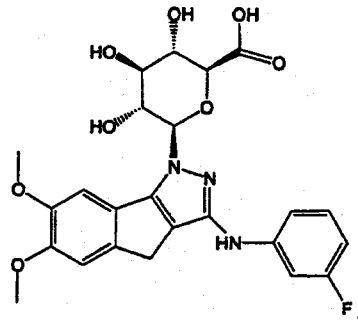
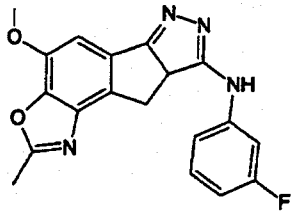
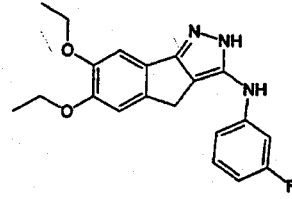
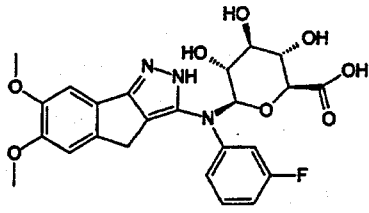
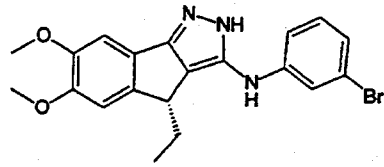
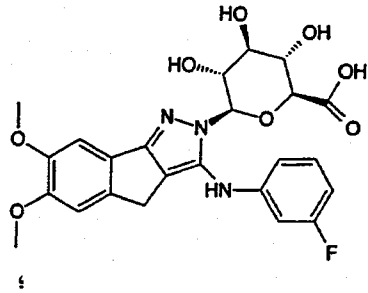
أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه.

١

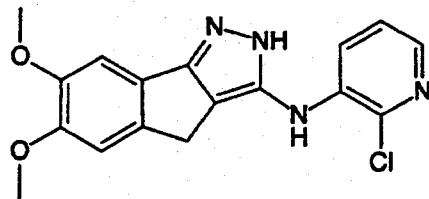
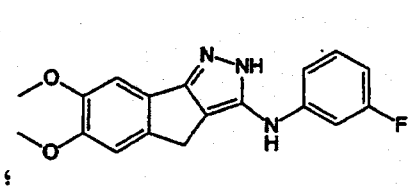
٣٥

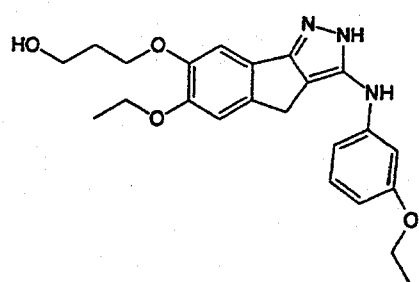


٢

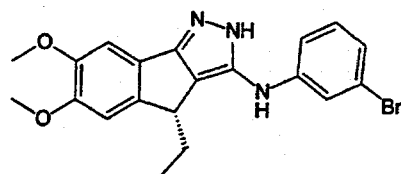


٣٦- مركب يختار من الفئة التي تتكون من:



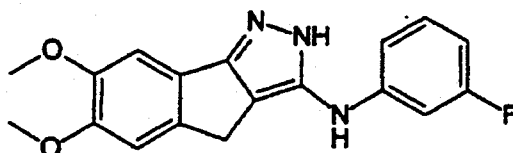


٩٠



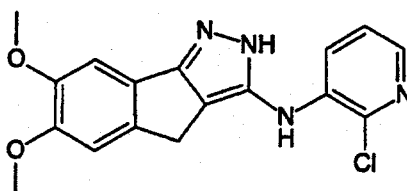
٣

٣٧- مركب بالصيغة التالية:



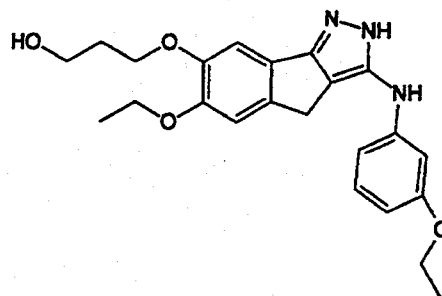
٢

٣٨- مركب.



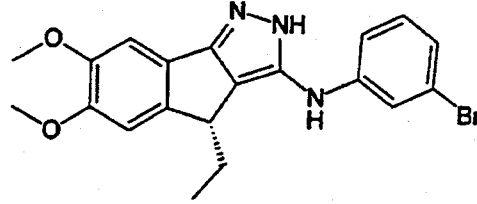
٢

٣٩- مركب بالصيغة التالية:



٢

٤٠- مر ١١... ١١... ١١... ١١...



٤١- مركب يختار من الفئة التي تتكون من:

- ١- [٣]- (٣-كلورو-فنيـل أمينو)-٧-مئوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-جـ]
- ٢- بيرازوليلوكسي (٦)-[٣]-بيروليدينيل (١)-بروبانول (٢)؛
- ٣- [٧-مئوكسي-٦-(٣-مئوكسي-بروبوكسي)-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-جـ]
- ٤- بيرازوليل (٣)-[٣-مئوكسي-فنيـل)-أمين؛
- ٥- [١-٧-مئوكسي-٣-(٣-مئوكسي-فنيـل أمينو)-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-جـ]
- ٦- [١-٧-مئوكسي-٣-(٣-مئوكسي-فنيـل أمينو)-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-جـ]
- ٧- [١-٧-مئوكسي-٣-(٣-مئوكسي-فنيـل أمينو)-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-جـ]
- ٨- [١-٧-مئوكسي-٣-(٣-مئوكسي-فنيـل أمينو)-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-جـ]
- ٩- [١-٧-مئوكسي-٣-(٣-مئوكسي-فنيـل أمينو)-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-جـ]
- ١٠- بيرازوليل (٣)-أمين؛
- ١١- [١-٣-(٣-فلورو-فنيـل أمينو)-٧-مئوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-جـ]
- ١٢- بيرازوليلوكسي (٦)-[٣]-بيروليدينيل (١)-بروبانول (٢)؛
- ١٣- [٣]- (٣-٢،٦-ثاني كلورو-بنزيل أمينو)-٧-مئوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو
- ١٤- [١،٢-جـ]-بيرازوليلوكسي (٦)-[١-٢،٢-ديول؛
- ١٥- (٣-مئوكسي-فنيـل)-[٧-مئوكسي-٦-(٣-بيروليدينيل (١)-بروبوكسي)-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-جـ]
- ١٦- بيرازوليل (٣)-[٣]-أمين؛
- ١٧- [٦،٧-ثاني إئوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-جـ]-بيرازوليل (٣)-[٣]-
- ١٨- مئوكسي-فنيـل)-أمين؛
- ١٩- [٣]- (٣-فلورو-فنيـل أمينو)-٧-مئوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-جـ]

بیرازولیلوکسی (۶) [بروبان-۱،۲-دیول؛	۲۰
۳- [۳- (۳- کلورو-فنیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-	۲۱
بیرازولیلوکسی (۶) [بروبانول (۱)؛	۲۲
۳- [۷-مٹوکسی-۳- (۳-مٹوکسی-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-	۲۳
ج- [بیرازولیلوکسی (۶) [بروبان-۱،۲-دیول؛	۲۴
۳- [۷-مٹوکسی-۳- (۳-مٹوکسی-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-	۲۵
ج- [بیرازولیلوکسی (۶) [بروبانول (۱)؛	۲۶
(۲،۶-ثانی کلورو-بنزیل)- (۶،۷-ثانی اٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-	۲۷
ج- [بیرازولیل (۳)-آمین؛	۲۸
(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]- [بیرازولیل (۳)- (۳)-	۲۹
فلورو-فنیل)-آمین؛	۳۰
۱- [۳- (۳- کلورو-۴-فلورو-فنیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو	۳۱
[۱،۲-ج]- [بیرازولیلوکسی (۶) [۳-بیرولیڈینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۳۲
۳- [۳- (۲،۶-ثانی کلورو-بنزیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو	۳۳
[۱،۲-ج]- [بیرازولیلوکسی (۶) [بروبانول (۱)؛	۳۴
(۲-کلورو-بنزیل)- (۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-	۳۵
بیرازولیل (۳)-آمین؛	۳۶
(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)- [۶- (۳-ثانی مٹیل آمینو-بروبوکسی)-۷-مٹوکسی-	۳۷
۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]- [بیرازولیل (۳)-آمین؛	۳۸
(۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]- [بیرازولیل (۳)-میتا-تولیل-آمین؛	۳۹
۳- [۳- (۲-کلورو-بنزیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-	۴۰
بیرازولیلوکسی (۶) [بروبان-۱،۲-دیول؛	۴۱
۱- [۳- (۲،۶-ثانی کلورو-بنزیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو	۴۲
[۱،۲-ج]- [بیرازولیلوکسی (۶) [۳-بیرولیڈینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۴۳
۳- [۳- (۳- کلورو-فنیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-	۴۴

بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبان-۱،۲-دیول؛	۴۵
(۲)-برومو-بنزیل)- (۶،۷-ثانی متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۴۶
بیرازولیل (۳)-[آمین؛	۴۷
(۳)-برومو-فنیل)- (۷-متوکسی-۶- (۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی	۴۸
هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-[آمین؛	۴۹
۱- [۶-ایثوکسی-۳- (۳-متوکسی-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۵۰
بیرازولیلوکسی (۷)-[۳-بیرویلیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۵۱
(۶)-فلورو-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)- (۲)-	۵۲
مثیل-بنزیل)-آمین؛	۵۳
۱- [۷-متوکسی-۳- (بیرویلیدینیل (۳) آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۵۴
بیرازولیلوکسی (۶)-[۳-بیرویلیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۵۵
(۳)-کلورو-فنیل)- (۷-متوکسی-۶- (۳)- (۴-مثیل-بیبرازینیل (۱)-بروبوکسی)-	۵۶
۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-{آمین؛	۵۷
[۶،۷-ثنائی- (۳-متوکسی-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۵۸
بیرازولیل (۳)-[(۳-کلورو-فنیل)-آمین؛	۵۹
۳- [۷- (۳-هیدروکسی-بروبوکسی)-۳- (۳-متوکسی-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی	۶۰
هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛	۶۱
(۳)-کلورو-فنیل)- (۶،۷-ثانی متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۶۲
بیرازولیل (۳)-[آمین؛	۶۳
(۶،۷-ثانی متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)- (۳)-	۶۴
مثیل کبریتانیل-فنیل)-آمین؛	۶۵
(۳)-فلورو-فنیل)- (۶- (۳-ایمیدازولیل (۱)-بروبوکسی)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی	۶۶
هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-[آمین؛	۶۷
۳- [۳- (۲،۶-ثانی فلورو-بنزیل آمینو)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو	۶۸
[۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبان-۱،۲-دیول؛	۶۹

- ۷۰- ۳-۳-(۳-کلورو-فنیل آمینو)-۷-(۳-هیدروکسی-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی هیدرو-
 ۷۱- ایندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛
 ۷۲- ۳-۳-(۲-کلورو-بنزیل آمینو)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-ایندینو [۱،۲-ج-]
 ۷۳- بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛
 ۷۴- ۳-۳-(۲،۶-ثانی فلورو-بنزیل آمینو)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-ایندینو
 ۷۵- [۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛
 ۷۶- ۱-۶-ایوکسی-۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-ایندینو [۱،۲-ج-]
 ۷۷- بیرازولیلوکسی (۷)-[۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛
 ۷۸- [۶،۷-ثانی- (۳-متوکسی-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی هیدرو-ایندینو [۱،۲-ج-]
 ۷۹- بیرازولیل (۳)-[۳-فلورو-فنیل]-آمین؛
 ۸۰- (۳-فلورو-فنیل)-(۷-میل-۲،۴-ثانی هیدرو-ایندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳))-
 ۸۱- آمین؛
 ۸۲- (۲،۵-ثانی فلورو-فنیل)-(۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-ایندینو [۱،۲-ج-]
 ۸۳- بیرازولیل (۳))-آمین؛
 ۸۴- [۶،۷-ثانی- (۳-متوکسی-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی هیدرو-ایندینو [۱،۲-ج-]
 ۸۵- بیرازولیل (۳)-[۳-متوکسی-فنیل]-آمین؛
 ۸۶- (۳-فلورو-فنیل)-(۴-متوکسی-۲-میل-۹،۸-ثانی هیدرو-۳-اکسا-۱،۶،۷-
 ۸۷- تریازا-حلقی بنتا [ب]-as-اینداسینیل (۸))-آمین؛
 ۸۸- ۱-۳-(۲-کلورو-بنزیل آمینو)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-ایندینو [۱،۲-ج-]
 ۸۹- بیرازولیلوکسی (۶)-[۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛
 ۹۰- ۳-(۶،۷-ثانی متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-ایندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)
 ۹۱- آمینو)-بنزامید؛
 ۹۲- (۳-کلورو-فنیل)-[۷-متوکسی-۶-(۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی
 ۹۳- هیدرو-ایندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳))-آمین؛
 ۹۴- ۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-ایندینو [۱،۲-ج-]

بیرازولول (۶)؛	۹۵
۳-۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-	۹۶
بیرازولیلوکسی (۶) [بروبانول (۱)؛	۹۷
۳-۷-ایٹوکسی-۳-(۳-متوکسی-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-	۹۸
بیرازولیلوکسی (۶) [بروبانول (۱)؛	۹۹
{۷-متوکسی-۶-[۳-(۴-مثیل-بیرازینیل (۱))-بروبوکسی]-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیل (۳)]-(۳-متوکسی-فنیل)-آمین؛	۱۰۰
(۳-فلورو-فنیل)-{۷-متوکسی-۶-[۳-(۴-مثیل-بیرازینیل (۱))-بروبوکسی]-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیل (۳)]-(۳-متوکسی-فنیل)-آمین؛	۱۰۱
(۳-فلورو-فنیل)-{۷-متوکسی-۶-[۳-(۴-مثیل-بیرازینیل (۱))-بروبوکسی]-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیل (۳)]-(۳-متوکسی-فنیل)-آمین؛	۱۰۲
[۶-(۳-ثانی مثیل آمینو-بروبوکسی)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیل (۳)]-(۳-متوکسی-فنیل)-آمین؛	۱۰۳
[۶-(۳-ثانی مثیل آمینو-بروبوکسی)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیل (۳)]-(۳-متوکسی-فنیل)-آمین؛	۱۰۴
[۶-(۳-ثانی مثیل آمینو-بروبوکسی)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیل (۳)]-(۳-متوکسی-فنیل)-آمین؛	۱۰۵
(۶،۷-ثانی متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیل (۳)]-فنیل-آمین؛	۱۰۶
(۶،۷-ثانی متوکسی-۴-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیل (۳)]-فلورو-فنیل)-آمین؛	۱۰۷
(۶،۷-ثانی متوکسی-۴-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیل (۳)]-فلورو-فنیل)-آمین؛	۱۰۸
(۶،۷-ثانی متوکسی-۴-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیل (۳)]-فلورو-فنیل)-آمین؛	۱۰۹
(۶،۷-ثانی متوکسی-۴-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیل (۳)]-فلورو-فنیل)-آمین؛	۱۱۰
(۶،۷-ثانی متوکسی-۴-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیل (۳)]-فلورو-فنیل)-آمین؛	۱۱۱
(۶،۷-ثانی متوکسی-۴-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیل (۳)]-فلورو-فنیل)-آمین؛	۱۱۲
(۶،۷-ثانی متوکسی-۴-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیل (۳)]-فلورو-فنیل)-آمین؛	۱۱۳
۱-۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۶،۷-ثانی متوکسی-H۴-اینڈینو [۱،۲-ج]-	۱۱۴
بیرازولیل (۱) [۲-متوکسی-ایٹانول؛	۱۱۵
۱-۳-(۲،۶-ثانی فلورو-بنزیل آمینو)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیلوکسی (۶)]-۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۱۱۶
۳-۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷-(۳-هیدروکسی-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیلوکسی (۶)]-۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۱۱۷
۳-۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷-(۳-هیدروکسی-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیلوکسی (۶)]-۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۱۱۸
اینڈینو [۱،۲-ج]-[بیرازولیلوکسی (۶)]-۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۱۱۹

۱۲۰	ایستر مثیل لحمض ۳- [۷-مٹوکسی-۶- (۳-بیرولیدینیل (۱-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی
۱۲۱	هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳) آمینو-بنزویک؛
۱۲۲	(۲،۶-ثانی فلورو-بنزیل)- (۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-
۱۲۳	ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین؛
۱۲۴	(۶-فلورو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)-۳-
۱۲۵	مٹوکسی-فنیل)-آمین؛
۱۲۶	۱- [۶-ایٹوکسی-۳- (بیریدینیل (۳) آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-]
۱۲۷	بیرازولیلوکسی (۷)- [۳-بیرولیدینیل (۱-بروبانول (۲)؛
۱۲۸	۱- [۳- (۲-فلورو-بنزیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-]
۱۲۹	بیرازولیلوکسی (۶)- [۳-بیرولیدینیل (۱-بروبانول (۲)؛
۱۳۰	(۳-برومو-فنیل)- (۶،۷-ثانی مٹوکسی-۴-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-
۱۳۱	ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین؛
۱۳۲	(۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- (۳-مٹوکسی-فنیل)-آمین؛
۱۳۳	۳- [۳- (۳-ایٹوکسی-فنیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-]
۱۳۴	بیرازولیلوکسی (۶)- [بروبان-۱،۲-دیول؛
۱۳۵	۳- [۳- (۳-کلورو-فنیل آمینو)-۶-ایٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-]
۱۳۶	بیرازولیلوکسی (۷)- [بروبانول (۱)؛
۱۳۷	(۲-کلورو-بیریدینیل ((۳)- (۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-
۱۳۸	ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین؛
۱۳۹	(۷-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- (۳-فلورو-فنیل)-
۱۴۰	آمین؛
۱۴۱	[۵- (۳-ثانی مثیل آمینو-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-]
۱۴۲	بیرازولیل (۳)- [۳-فلورو-فنیل)-آمین؛
۱۴۳	(۳-برومو-فنیل)- (۶-فلورو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-]
۱۴۴	بیرازولیل ((۳)-آمین؛

(۴، ۲-ثاني هيدرو-إندينو [۱، ۲-ج-] بيرازوليل ((۳))-(۳-فلورو-فنيل)-أمين؛	۱۴۵
إستر ۲-[[۳-((۳-فلورو-فنيل أمينو)-۶، ۷-ثاني مٹوكسي-H۴-إندينو [۱، ۲-ج-]-	۱۴۶
بيرازوليل (۱)]]-۲-أكسو-إثيل لحمض مٹوكسي-أسيتيك؛	۱۴۷
(۶-فلورو-۲، ۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱، ۲-ج-] بيرازوليل ((۳))-(۴-فلورو-فنيل)-	۱۴۸
أمين؛	۱۴۹
۳-[[۳-((۳-إٹوكسي-فنيل أمينو)-۷-مٹوكسي-۲، ۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱، ۲-ج-]-	۱۵۰
بيرازوليلوكسي (۶)]]-بروبانول (۱)؛	۱۵۱
(۶-فلورو-۷-مٹوكسي-۲، ۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱، ۲-ج-] بيرازوليل ((۳))-(۳)-	۱۵۲
فلورو-فنيل)-أمين؛	۱۵۳
(۶، ۷-ثاني مٹوكسي-۲، ۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱، ۲-ج-] بيرازوليل ((۳))-(۳)-	۱۵۴
مٹوكسي-فنيل)-أمين؛	۱۵۵
(۵، ۳-ثاني فلورو-فنيل)-((۶، ۷-ثاني مٹوكسي-۲، ۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱، ۲-ج-]	۱۵۶
بيرازوليل ((۳))-أمين؛	۱۵۷
۳-[[۳-((۳-كلورو-۴-فلورو-فنيل أمينو)-۷-مٹوكسي-۲، ۴-ثاني هيدرو-إندينو	۱۵۸
[۱، ۲-ج-] بيرازوليلوكسي (۶)]]-بروبان-۱، ۲-ديول؛	۱۵۹
(۳-فلورو-فنيل)-((۷-مٹوكسي-۶-((۳-مورفولينيل (۴)-بروبوكسي)-۲، ۴-ثاني	۱۶۰
هيدرو-إندينو [۱، ۲-ج-] بيرازوليل ((۳))-أمين؛	۱۶۱
(۳-إٹوكسي-فنيل)-((۴-إثيل-۶، ۷-ثاني مٹوكسي-۲، ۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱، ۲-ج-	۱۶۲
ج-] بيرازوليل ((۳))-أمين؛	۱۶۳
۳-[[۳-((۳-كلورو-۴-فلورو-فنيل أمينو)-۷-مٹوكسي-۲، ۴-ثاني هيدرو-إندينو	۱۶۴
[۱، ۲-ج-] بيرازوليلوكسي (۶)]]-بروبانول (۱)؛	۱۶۵
۱-[[۶-إٹوكسي-۳-((۳-إٹوكسي-فنيل أمينو)-۲، ۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱، ۲-ج-]-	۱۶۶
بيرازوليلوكسي (۷)]]-۳-بيروليدينيل (۱)-بروبانول (۲)؛	۱۶۷
۳-[[۳-((۲-فلورو-بنزيل أمينو)-۷-مٹوكسي-۲، ۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱، ۲-ج-]-	۱۶۸
بيرازوليلوكسي (۶)]]-بروبانول (۱)؛	۱۶۹

۶،۷-ثاني مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل ((۳))-۳-	۱۷۰
ايزوبروبوكسي-فنيل)-امين؛	۱۷۱
۳-۳-۶-اٹوكسي-۳-۳-فلورو-فنيل امينو)-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]	۱۷۲
بيرازوليلوكسي (۷)-[بروبانول (۱)؛	۱۷۳
۶-۶-فلورو-۷-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل ((۳))-۴-	۱۷۴
فلورو-فنيل)-امين؛	۱۷۵
۳-۳-۲-فلورو-بنزيل امينو)-۷-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]	۱۷۶
بيرازوليلوكسي (۶)-[بروبان-۱،۲-ديول؛	۱۷۷
۳-۳-۷-اٹوكسي-۳-۳-فلورو-فنيل امينو)-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]	۱۷۸
بيرازوليلوكسي (۶)-[بروبانول (۱)؛	۱۷۹
۶،۷-ثاني مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل ((۳))-ميتا-	۱۸۰
توليل-امين؛	۱۸۱
۳-۳-۶-اٹوكسي-۳-۳-مٹوكسي-فنيل امينو)-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]	۱۸۲
بيرازوليلوكسي (۷)-[بروبانول (۱)؛	۱۸۳
۳-۳-كلورو-۴-فلورو-فنيل)-۶،۷-ثاني اٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]	۱۸۴
ج-] بيرازوليل ((۳))-امين؛	۱۸۵
N3-۳-۳-فلورو-فنيل)-۶،۷-ثاني مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]	۱۸۶
بيرازول-۳،۵-ثاني امين؛	۱۸۷
۶-۶-برومو-۷-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل ((۳))-۳-	۱۸۸
مٹوكسي-فنيل)-امين؛	۱۸۹
۳-۳-كلورو-۴-فلورو-فنيل)-۶-فلورو-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]	۱۹۰
بيرازوليل ((۳))-امين؛	۱۹۱
۷-مٹوكسي-۶-۳-مورفولينيل (۴)-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]	۱۹۲
ج-] بيرازوليل ((۳)-[۳-مٹوكسي-فنيل)-امين؛	۱۹۳
۳-۳-فلورو-فنيل)-۷-مٹوكسي-۶-۳-مٹوكسي-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني هيدرو-	۱۹۴

۱۹۵	۱،۲-جـ] بيرازوليل (۳)-[امين؛
۱۹۶	(۳-فلورو-فنيل)-(۷-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-جـ] بيرازوليل
۱۹۷	((۳)-امين؛
۱۹۸	(۳-فلورو-فنيل)-(۷-مٹوكسي-۶-(۳-بيروليدينيل (۱)-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني
۱۹۹	هيدرو-يندينو [۱،۲-جـ] بيرازوليل (۳)-[امين؛
۲۰۰	إستر ۳-(۳-فلورو-فنيل أمينو)-۶،۷-ثاني مٹوكسي-H۴-يندينو [۱،۲-جـ]-
۲۰۱	بيرازوليل (۱) مثيل لحمض أسيتيك؛
۲۰۲	۶-(۳-مٹوكسي-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-جـ] بيرازوليل
۲۰۳	(۳)-[فنيل-امين؛
۲۰۴	(۶،۷-ثاني مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-جـ] بيرازوليل (۳)-((۳)-
۲۰۵	إثوكسي-فنيل)-امين؛
۲۰۶	(۶-فلورو-۷-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-جـ] بيرازوليل (۳)-((۳)-
۲۰۷	بيريدينيل (۳)-امين؛
۲۰۸	۳-۳-(۳-كلورو-۴-فلورو-فنيل أمينو)-۷-(۳-هيدروكسي-بروبوكسي)-۲،۴-
۲۰۹	ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-جـ] بيرازوليلوكسي (۶)-[بروبانول (۱)؛
۲۱۰	(۳-فلورو-فنيل)-(H۲-۸-أكسا-۲،۳-ديازا-حلقي بنتا [۱]-يندينيل (۱)-امين؛
۲۱۱	(۳-كلورو-۴-فلورو-فنيل)-(۷-مٹوكسي-۶-(۳-بيروليدينيل (۱)-بروبوكسي)-
۲۱۲	۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-جـ] بيرازوليل (۳)-[امين؛
۲۱۳	۳-۷-(۳-هيدروكسي-بروبوكسي)-۳-(بيريدينيل (۳) أمينو)-۲،۴-ثاني هيدرو-
۲۱۴	يندينو [۱،۲-جـ] بيرازوليلوكسي (۶)-[بروبانول (۱)؛
۲۱۵	(۶،۷-ثاني إثوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-جـ] بيرازوليل (۳)-((۳)-
۲۱۶	فلورو-فنيل)-امين؛
۲۱۷	إستر مثيل لحمض ۳-[۶،۷-ثاني مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-جـ]
۲۱۸	بيرازوليل (۳) أمينو]-بنزويك؛
۲۱۹	(۲،۵-ثاني مٹوكسي-فنيل)-(۶-فلورو-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-جـ]

۱-۳- (۷-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳) آمینو)-فنیل-]	۲۴۵
ایثانول؛	۲۴۶
۷،۶-ثانی متوکسی-۴-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل	۲۴۷
(۳)-((۳-اٹوکسی-فنیل)-آمین؛	۲۴۸
(۳-برومو-فنیل)- (۴-اٹیل-۶،۷-ثانی متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-	۲۴۹
ج-] بیرازولیل (۳)-آمین؛	۲۵۰
N3- (۳-متوکسی-فنیل)- (۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازول-۳،۶-ثانی	۲۵۱
آمین؛	۲۵۲
۳-۳- (۳-اٹوکسی-فنیل آمینو)-۷- (۳-هیدروکسی-بروبوکسی)- (۲،۴-ثانی	۲۵۳
هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛	۲۵۴
۴-۳- (۳-فلورو-فنیل آمینو)- (۶،۷-ثانی متوکسی-۴-H-اندینو [۱،۲-ج-]	۲۵۵
بیرازولیل (۱)-[۴-اکسو-بیوتیرامید؛	۲۵۶
(۴-متوکسی-۲-مثیل-۶،۹-ثانی هیدرو-۳-اکسا-۱،۶،۷-تریازا-حلقی بنتا [ب-]	۲۵۷
as-انداسینیل ((۸)- (۳-متوکسی-فنیل)-آمین؛	۲۵۸
(۷-متوکسی-H۲-۸-اکسا-۲،۳-دیازا-حلقی بنتا [ا]-اندینیل (۱)-فنیل-آمین؛	۲۵۹
۳-۳- (۲-مثیل-بنزیل آمینو)- (۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی	۲۶۰
(۵)-[بروبانول (۱)؛	۲۶۱
(۷،۶-ثانی اٹوکسی-۴-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل	۲۶۲
(۳)-((۳-متوکسی-فنیل)-آمین؛	۲۶۳
۳-۷-اٹوکسی-۳- (بیریدینیل (۳) آمینو)- (۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۲۶۴
بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛	۲۶۵
(۶،۲-ثانی کلورو-بنزیل)- (۵- (۳-مورفولینیل (۴-بروبوکسی)- (۲،۴-ثانی	۲۶۷
هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-آمین؛	۲۶۸
۳-۳- (۳-فلورو-فنیل آمینو)- (۶-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۲۶۹
بیرازولول (۷)؛	۲۷۰

۶،۷-ثاني-(۳-مٹوكسي-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-]	۲۷۱
بيرازوليل ((۳))-(۳-كلورو-۴-فلورو-فنيل)-امين؛	۲۷۲
(۵-كلورو-۲-مٹوكسي-فنيل)-(۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل	۲۷۳
((۳))-امين؛	۲۷۴
(۴-فلورو-فنيل)-(۷-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل	۲۷۵
((۳))-امين؛	۲۷۶
(۶-فلورو-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل ((۳))-(۴-مٹوكسي-	۲۷۷
فنيل)-امين؛	۲۷۸
(۲،۶-ثاني كلورو-بنزيل)-(۶،۷-ثاني مٹوكسي-۴-مٹيل-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو	۲۷۹
[۱،۲-ج-] بيرازوليل ((۳))-امين؛	۲۸۰
استر ۳-(۳-فلورو-فنيل أمينو)-(۶،۷-ثاني مٹوكسي-H۴-اندينو [۱،۲-ج-]-	۲۸۱
بيرازوليل (۱) مٹيل لحمض بيوتيريك؛	۲۸۲
مٹيل أميد لحمض ۵-[۳-(۳-فلورو-فنيل أمينو)-(۶،۷-ثاني مٹوكسي-H۴-اندينو	۲۸۳
[۱،۲-ج-] بيرازوليل (۱))-۵-أكسو-بنتانويك؛	۲۸۴
۱-[۳-(۶،۷-ثاني مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل (۳)	۲۸۵
أمينو)-فنيل]-اينانول؛	۲۸۶
(۳-فلورو-فنيل)-(۵-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل	۲۸۷
((۳))-امين؛	۲۸۸
(۳-كلورو-۴-مٹوكسي-فنيل)-(۷-مٹيل-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-]	۲۸۹
بيرازوليل ((۳))-امين؛	۲۹۰
۳-(۶،۷-ثاني مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل (۳)	۲۹۱
أمينو)-فنول؛	۲۹۲
حمض ۴-[۳-(۳-فلورو-فنيل أمينو)-(۶،۷-ثاني مٹوكسي-H۴-اندينو [۱،۲-ج-]-	۲۹۳
بيرازوليل (۱))-۴-أكسو بيوتيريك؛	۲۹۴
۱-[۳-(۳-فلورو-فنيل أمينو)-(۶،۷-ثاني مٹوكسي-H۴-اندينو [۱،۲-ج-]-	۲۹۵

بیرازولیل (۲)-[۳-بیرویلیدینیل (۱)-بروبان-۱،۳-دیون؛	۲۹۶
N-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-	۲۹۷
ج-] بیرازولیل (۵)-[اسیتامید؛	۲۹۸
(۶،۷)-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-((۳)-	۲۹۹
ایٹیل-فنیل)-آمین؛	۳۰۰
(۳)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)	۳۰۱
آمینو)-فنیل]-میٹانول؛	۳۰۲
(۶،۷)-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-((۳)-	۳۰۳
ثانی مٹوکسی-فنیل)-آمین؛	۳۰۴
(۳)-بنزیلوکسی-فنیل)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-]	۳۰۵
بیرازولیل (۳)-((۳)-آمین؛	۳۰۶
(۳)-کلورو-۴-فلورو-فنیل)-۶-۳-ایمیدازولیل (۱)-بروبوکسی)-۷-مٹوکسی-	۳۰۷
۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-[آمین؛	۳۰۸
(۶،۷)-ثانی ایزوبروبوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-((۳)-	۳۰۹
(۳)-فلورو-فنیل)-آمین؛	۳۱۰
ایستر ایٹیل لحمض ۳-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-H-انڈینو	۳۱۱
[۱،۲-ج-] بیرازولیل (۱)-[۳-اکسو-بروبیونیک؛	۳۱۲
۳-۶-ایٹوکسی-۳-۳-ایٹوکسی-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-]	۳۱۳
بیرازولیلوکسی (۷)-[بروبانول (۱)؛	۳۱۴
[۷-مٹوکسی-۶-۳-مورفولینیل (۴)-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-	۳۱۵
ج-] بیرازولیل (۳)-[بیریدینیل (۳)-آمین؛	۳۱۶
(۶،۷)-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-((۳)-	۳۱۷
ثالث فلورو مٹیل-فنیل)-آمین؛	۳۱۸
(۲)-کلورو-بیریدینیل (۳)-((۳)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۴-مٹیل-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو	۳۱۹
[۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-[آمین؛	۳۲۰

۳۲۱	إستر مثیل لحمض ۳- [۷-مٹوکسی-۶- (۳-مورفولینیل (۴-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی
۳۲۲	هیدرو إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳) آمینو-بنزویک؛
۳۲۳	(۳،۵-ثانی مٹوکسی-فنیل)- (۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-]
۳۲۴	بیرازولیل ((۳)-آمین؛
۳۲۵	۱- [۳- (۳-فلورو-فنیل آمینو)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۴-H-إندینو- [۱،۲-ج-]
۳۲۶	بیرازولیل ((۱)- [۲-هیدروکسی-ایٹانول؛
۳۲۷	(۳-برومو-فنیل)- (۴-ایٹیل-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-]
۳۲۸	ج- [بیرازولیل ((۳)-آمینو؛
۳۲۹	(۵،۷-ثانی هیدرو-۱-ثیا-۴،۵-دیازا-حلقی بنتا [أ] بنتالینیل (۶))- (۳-مٹوکسی-فنیل)- آمین؛
۳۳۰	۳۳۱
۳۳۱	(۶-کلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- (۳-مٹوکسی-فنیل)- آمین؛
۳۳۲	(۶-کلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- (۳-مٹوکسی-فنیل)- آمین؛
۳۳۳	(۴،۲-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- (۲،۵-ثانی مٹوکسی-فنیل)- آمین؛
۳۳۴	(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)- (۶-فلورو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- آمین؛
۳۳۵	(۶-کلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- (۳-مٹوکسی-۴-فلورو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- آمین؛
۳۳۶	(۶-کلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- (۳-مٹوکسی-۴-فلورو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- آمین؛
۳۳۷	(۶-کلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- (۳-مٹوکسی-۴-فلورو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- آمین؛
۳۳۸	(۷-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- فنیل-آمین؛
۳۳۹	۳۴۰
۳۴۰	إستر ۴-فلورو-فنیل لحمض ۳- (۳-فلورو-فنیل آمینو)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۴-H-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازول (۲)-کربوکسیلیک؛
۳۴۱	(۳- (۳-کلورو-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- (۳-مٹوکسی-۴-فلورو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- آمین؛
۳۴۲	(۳- (۳-کلورو-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- (۳-مٹوکسی-۴-فلورو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- آمین؛
۳۴۳	بیرازولیلوکسی (۵)- [بروبانول (۱)؛
۳۴۴	(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۴،۲-ثانی هیدرو-إندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)- (۲-مثیل-بنزیل)- آمین؛
۳۴۵	

۳-۷-مٹوکسی-۳-(بیریدینیل (۳) آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج-]	۳۴۶
بیرازولیلوکسی (۶)-[۱،۲-بروبان-۱،۲-دیول؛	۳۴۷
(۳،۴-ثانی مٹوکسی-فنیل)-(۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج-]	۳۴۸
بیرازولیل (۳)-[۱،۲-بروبان-۱،۲-دیول؛	۳۴۹
۳-۶-مٹوکسی-۳-(بیریدینیل (۳) آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج-]	۳۵۰
بیرازولیلوکسی (۷)-[۱،۲-بروبانول (۱)؛	۳۵۱
۳-۳-(۳-برومو-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج-]	۳۵۲
بیرازولیلوکسی (۵)-[۱،۲-بروبان-۱،۲-دیول؛	۳۵۳
(۲،۵-ثانی فلورو-فنیل)-(۷-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج-]	۳۵۴
(۳)-[۱،۲-بروبان-۱،۲-دیول؛	۳۵۵
(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج-]	۳۵۶
ثالث فلورو مثیل کبریتانیل-فنیل)-[۱،۲-بروبان-۱،۲-دیول؛	۳۵۷
(۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج-]	۳۵۸
مثیل-فنیل)-[۱،۲-بروبان-۱،۲-دیول؛	۳۵۹
(۳-برومو-فنیل)-(۴-ایٹیل-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج-]	۳۶۰
[۱،۲-بروبان-۱،۲-دیول؛	۳۶۱
۵-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج-]	۳۶۲
(۲،۹-ثانی هیدرو-۵،۷-دیوکسا-۲،۳-دیازا-حلقی بنتا [۱]-s-اینڈاسینیل (۱)-[۱،۲-ج-]	۳۶۳
مٹوکسی-فنیل)-[۱،۲-بروبان-۱،۲-دیول؛	۳۶۴
(۲،۳-ثانی مٹوکسی-بنزیل)-(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج-]	۳۶۵
[۱،۲-بروبان-۱،۲-دیول؛	۳۶۶
(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)-(H۲-۸-اکسا-۲،۳-دیازا-حلقی بنتا [۱]-اینڈینیل (۱)-[۱،۲-ج-]	۳۶۷
آمین؛	۳۶۸
(۲-مورفولینیل (۴)-ایٹیل)-آمید لحمض ۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۶،۷-ثانی	۳۶۹
مٹوکسی-H۴-اینڈینو [۱،۲-ج-]	۳۷۰

۶،۷-ثاني مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج] بيرازوليل ((۳))-۲-	۳۷۱
فلورو-فنيل)-امين؛	۳۷۲
۶-((۳-ثاني مٹيل امينو-بروبوكسي))-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج]	۳۷۳
بيرازوليل ((۳))-۳-فلورو-فنيل)-امين؛	۳۷۴
۳-كلورو-۴-فلورو-فنيل)-۶،۷-ثاني مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج]	۳۷۵
بيرازوليل ((۳))-امين؛	۳۷۶
۳-كلورو-فنيل)-۲،۹-ثاني هيدرو-۵،۷-ديوكسا-۲،۳-ديازا-حلقي بنتا [۱]-s-	۳۷۷
ينداسينيل ((۱))-امين؛	۳۷۸
۶-فلورو-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج] بيرازوليل ((۳))-H۱-يندوليل	۳۷۹
((۵))-امين؛	۳۸۰
۳-كلورو-فنيل)-۴-ايتيل-۶،۷-ثاني مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج]	۳۸۱
بيرازوليل ((۳))-امين؛	۳۸۲
۳-۳-۳-كلورو-۴-فلورو-فنيل امينو)-۶-ايتوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو	۳۸۳
[۱،۲-ج] بيرازوليلوكسي (۷)-بروبانول (۱)؛	۳۸۴
۳-۳-برومو-فنيل)-۲،۹-ثاني هيدرو-۵،۷-ديوكسا-۲،۳-ديازا-حلقي بنتا [۱]-s-	۳۸۵
ينداسينيل ((۱))-امين؛	۳۸۶
استر ۲-۳-۳-فلورو-فنيل امينو)-۶،۷-ثاني مٹوكسي-۴-H-يندينو [۱،۲-ج]	۳۸۷
بيرازوليل ((۱))-۲-اڪسو-ايتيل لحمض ايزوبيوتيريك؛	۳۸۹
۵،۷-ثاني هيدرو-۱-ايتا-۴،۵-ديازا-حلقي بنتا [۱] بنتالينيل ((۶))-۳-ايتوكسي-فنيل)-امين؛	۳۹۰
۶،۷-ثاني ايتوكسي-۴-مٹيل-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج] بيرازوليل	۳۹۲
((۳))-۳-فلورو-فنيل)-امين؛	۳۹۳
۲-بيروليدينيل ((۱)-ايتيل)-اميد لحمض ۳-۳-فلورو-فنيل امينو)-۶،۷-ثاني مٹوكسي-۴-H-يندينو [۱،۲-ج] بيرازول-۱-كربوكسيليك؛	۳۹۴
استر ايتيل لحمض ۳-۶،۷-ثاني مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج]	۳۹۵
استر ايتيل لحمض ۳-۶،۷-ثاني مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج]	۳۹۶

بیرازولیل (۳)-أمینو-بنزویك؛	۳۹۷
(۶)-كلورو-۲،۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-((۳)-فلورو-	۳۹۸
فنیل)-أمین؛	۳۹۹
(۶،۷)-ثاني أيزوبروبوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-((۳)-	۴۰۰
(۳)-مٹوكسي-فنیل)-أمین؛	۴۰۱
(۲،۵)-ثاني فلورو-فنیل)- (۶)-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱،۲-ج-]	۴۰۲
بیرازولیل (۳)-أمین؛	۴۰۳
(۶،۷)-ثاني إٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-((۳)-۲-	۴۰۴
فلورو-بنزیل)-أمین؛	۴۰۵
(۶،۷)-ثاني مٹوكسي-۴-مٹیل-۲،۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱،۲-ج-] بیرازولیل	۴۰۶
(۳)-فنیل)-أمین؛	۴۰۷
(۳)-كلورو-۴-فلورو-فنیل)- (۷)-مٹوكسي-۶- (۳)-مورفولينیل (۴)-بروبوكسي)-	۴۰۸
۲،۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-[أمین؛	۴۰۹
(۳)-برومو-فنیل)- (۶)-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱،۲-ج-] بیرازولیل	۴۱۰
(۳)-[أمین؛	۴۱۱
(۳)-برومو-فنیل)- (۶،۷)-ثاني إٹوكسي-۴-مٹیل-۲،۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱،۲-	۴۱۲
ج-] بیرازولیل (۳)-[أمین؛	۴۱۳
(۶،۷)-ثاني مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-((۳)-۳-	۴۱۴
مٹوكسي-بنزیل)-أمین؛	۴۱۵
(H۱)-إندولیل (۵)- (۷)-مٹیل-۲،۴-ثاني هيدرو-إندينو [۱،۲-ج-] بیرازولیل	۴۱۶
(۳)-[أمین؛	۴۱۷
۱- (۳)- (۳)-فلورو-فنیل أمينو)- ۶،۷-ثاني مٹوكسي- H۴-إندينو [۱،۲-ج-]	۴۱۸
بیرازولیل (۲)-[إيثانون؛	۴۱۹
(۲،۹)-ثاني هيدرو-۵،۷-ديوكسا-۲،۳-ديازا-حلقي بنتا [A]-s-إنداسينیل (۱)-((۱)-۳-	۴۲۰
فلورو-فنیل)-أمین؛	۴۲۱

(٦،٧-ثاني مٲوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج] بيرازوليل ((٣)-٢)-	٤٢٢
ثالث فلورو مٲيل-بنزيل)-أمين؛	٤٢٣
إستر ٣-(٣-فلورو-فنيل أمينو)-٦،٧-ثاني مٲوكسي-H٤-إندينو [١،٢-ج]-	٤٢٤
بيرازوليل (٢) مٲيل لحمض أسيتيك؛	٤٢٥
(٣-كلورو-بنزيل)-٦،٧-ثاني مٲوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج]-	٤٢٦
بيرازوليل ((٣)-أمين؛	٤٢٧
(٦،٧-ثاني إٲوكسي-٤-مٲيل-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج] بيرازوليل	٤٢٨
((٣)-(٤-فلورو-فنيل)-أمين؛	٤٢٩
(٤-إٲيل-٦،٧-ثاني مٲوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج] بيرازوليل	٤٣٠
((٣)-(٣-فلورو-فنيل)-أمين؛	٤٣١
إستر إٲيل لحمض ٣-[[٦،٧-ثاني مٲوكسي-٣-فنيل أمينو-H٤-إندينو [١،٢-ج]-	٤٣٢
بيرازول-٢-كربونيل)-أمينو]-بروبيونيك؛	٤٣٣
(٢،٥-ثاني فلورو-فنيل)-(٤-مٲيل-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج] بيرازوليل	٤٣٤
((٣)-أمين؛	٤٣٥
(٦،٧-ثاني مٲوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج] بيرازوليل ((٣)-	٤٣٦
بيريدينيل (٢)-أمين؛	٤٣٧
(٦-فلورو-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج] بيرازوليل ((٣)-فنيل-أمين؛	٤٣٨
(٣-كلورو-٤-فلورو فنيل)-[٧-مٲوكسي-٦-(٣-مٲوكسي-بروبوكسي)-٢،٤-ثاني	٤٣٩
هيدرو-إندينو [١،٢-ج] بيرازوليل ((٣)-أمين؛	٤٤٠
بنزيل-(٦،٧-ثاني إٲوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج] بيرازوليل ((٣)-	٤٤١
أمين؛	٤٤٢
(٣-كلورو-فنيل)-(٥،٧-ثاني هيدرو-١-ٲيا-٤،٥-ديازا-حلقي بنتا [أ] بنتالينيل	٤٤٣
((٦)-أمين؛	٤٤٤
(٦،٧-ثاني إٲوكسي-٤-مٲيل-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج] بيرازوليل	٤٤٥
((٣)-بيريدينيل (٣)-أمين؛	٤٤٦

- ٤٤٧ (٧-بنزيلوكسي-٦-مٹوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج-] بيرازوليل ((٣))-
- ٤٤٨ (٣-فلورو-فنييل)-أمين؛
- ٤٤٩ (٦-برومو-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج-] بيرازوليل ((٣))-(٣-فلورو-
- ٤٥٠ فنييل)-أمين؛
- ٤٥١ N3-فنييل-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج-] بيرازول-٣،٦-ثاني أمين؛
- ٤٥٢ إستر ٤-كلورو-فنييل لحمض ٣-(٣-فلورو-فنييل أمينو)-٦،٧-ثاني مٹوكسي-H٤-
- ٤٥٣ إندينو [١،٢-ج-] بيرازول-١-كربوكسيليك؛
- ٤٥٤ (٧،٦-ثاني مٹوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج-] بيرازوليل ((٣))-(٢)-
- ٤٥٥ فلورو-بنزيل)-أمين؛
- ٤٥٦ ٣-٣-(٢،٦-ثاني فلورو-بنزيل أمينو)-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج-]-
- ٤٥٧ بيرازوليلوكسي (٥)-[بروبانول (١)؛
- ٤٥٨ (٣-مٹوكسي-فنييل)-٦-(٣-مٹوكسي-بروبوكسي)-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج-]
- ٤٥٩ [ج-] بيرازوليل ((٣))-أمين؛ و
- ٤٦٠ ٦-(٣-ثاني مثيل أمينو-بروبوكسي)-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج-]
- بيرازوليل ((٣))-٤-فلورو-فنييل)-أمين.

١

٤٢- مركب يختار من الفئة التي تتكون من:

٢

- ٣ (٥-مٹوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج-] بيرازوليل ((٣))-فنييل-أمين؛
- ٤ إستر مثيل لحمض ٣-(٦،٧-ثاني مٹوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج-]
- ٥ بيرازوليل (٣) أمينو)-بنزويك؛
- ٦ (٧،٦-ثاني مٹوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج-] بيرازوليل ((٣))-(٢)-
- ٧ فلورو-فنييل)-أمين؛
- ٨ (٧،٦-ثاني مٹوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج-] بيرازوليل ((٣))-(٤)-
- ٩ فلورو-فنييل)-أمين؛
- ١٠ (٧،٦-ثاني مٹوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-ج-] بيرازوليل ((٣))-(٣)-

فلورو-فنیل)-آمین؛	۱۱
(۷-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)-فنیل-آمین؛	۱۲
(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)-۳-	۱۳
ثالث فلورو مثیل-فنیل)-آمین؛	۱۴
(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)-۳-	۱۵
مٹوکسی-فنیل)-آمین؛	۱۶
(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)-۳-	۱۷
بیریدینیل (۳)-آمین؛	۱۸
(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)-میتا-	۱۹
تولیل-آمین؛	۲۰
(۳)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)	۲۱
آمینو)-فنیل]-میتانول؛	۲۲
(۳)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)	۲۳
آمینو)-فنول؛	۲۴
(۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)-فنیل-آمین؛	۲۵
(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)-۳،۵-	۲۶
ثانی مٹوکسی-فنیل)-آمین؛	۲۷
(۳-برومو-فنیل)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۲۸
بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۲۹
(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-	۳۰
ج-] بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۳۱
(۳-بنزیلوکسی-فنیل)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۳۲
بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۳۳
[۵-(۳-ثانی مثیل آمینو-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۳۴
بیرازولیل ((۳)-۳-فلورو-فنیل)-آمین؛	۳۵

- ۳۶ (۲،۹-ثاني هيدرو-۵،۷-ديوكسا-۲،۳-ديازا-حلقي بنتا [A]-s-انداسينيل (۱))-۳-
- ۳۷ مئوكسي-فنيل)-امين؛
- ۳۸ ۳-(۶،۷-ثاني مئوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-بيرازوليل (۳)
- ۳۹ امينو)-بنزاميد؛
- ۴۰ N3-(۳-مئوكسي-فنيل)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-بيرازول-۳،۶-ثاني
- ۴۱ امين؛
- ۴۲ N3-(۳-كلورو-فنيل)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-بيرازول-۳،۶-ثاني
- ۴۳ امين؛
- ۴۴ (۳-برومو-فنيل)-۶-(۴-مئيل-بييرازينيل (۱))-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-
- ۴۵ ج]-بيرازوليل (۳)-امين؛
- ۴۶ (۳-كلورو-فنيل)-۶-(۴-مئيل-بييرازينيل (۱))-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-
- ۴۷ ج]-بيرازوليل (۳)-امين؛
- ۴۸ (۳-كلورو-فنيل)-۲،۹-ثاني هيدرو-۵،۷-ديوكسا-۲،۳-ديازا-حلقي بنتا [A]-s-
- ۴۹ انداسينيل (۱))-امين؛
- ۵۰ ۷-مئوكسي-۶-(۳-مورفولينيل (۴)-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-
- ۵۱ ج]-بيرازوليل (۳)-بيريدنيل (۳)-امين؛
- ۵۲ (۳-برومو-فنيل)-۷-مئوكسي-۶-(۳-مورفولينيل (۴)-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني
- ۵۳ هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-بيرازوليل (۳)-امين؛
- ۵۴ ۷-مئوكسي-۶-(۳-مورفولينيل (۴)-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-
- ۵۵ ج]-بيرازوليل (۳)-۳-مئوكسي-فنيل)-امين؛
- ۵۶ (۳-كلورو-فنيل)-۷-مئوكسي-۶-(۳-مورفولينيل (۴)-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني
- ۵۷ هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-بيرازوليل (۳)-امين؛
- ۵۸ ايسر مئيل لحمض ۳-[۷-مئوكسي-۶-(۳-مورفولينيل (۴)-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني
- ۵۹ هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-بيرازوليل (۳) امينو]-بنزويك؛
- ۶۰ (۳-فلورو-فنيل)-۷-مئوكسي-۶-(۳-مورفولينيل (۴)-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني

هيدرو-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل (٣)-[امين؛	٦١
[٦- (٣-مٹوكسي-بروبوكسي)-٢،٤-ثاني هيدرو-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل	٦٢
(٣)-[فنيل-امين؛	٦٣
(٣-مٹوكسي-فنيل)-[٧-مٹوكسي-٦- (٣-بيروليدينيل (١-بروبوكسي)-٢،٤-ثاني	٦٤
هيدرو-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل (٣)-[امين؛	٦٥
استر مثيل لحمض ٣-[٧-مٹوكسي-٦- (٣-بيروليدينيل (١-بروبوكسي)-٢،٤-ثاني	٦٦
هيدرو-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل (٣) امينو-بنزويك؛	٦٧
[٦- (٣-ثاني مثيل امينو-بروبوكسي)-٢،٤-ثاني هيدرو-اندينو [١،٢-ج]	٦٨
بيرازوليل (٣)-[٣-فلورو-فنيل]-امين؛	٦٩
(٦،٧-ثاني ايزوبروبوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل (٣)-	٧٠
(٣-فلورو-فنيل)-امين؛	٧١
(٤-فلورو-فنيل)-[٧-مٹوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل	٧٢
(٣)-[امين؛	٧٣
(٣-فلورو-فنيل)-[٧-مٹوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل	٧٤
(٣)-[امين؛	٧٥
(٣-فلورو-فنيل)-[٧-مٹوكسي-٦- (٣-بيروليدينيل (١-بروبوكسي)-٢،٤-ثاني	٧٦
هيدرو-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل (٣)-[امين؛	٧٧
(٣-كلورو-٤-فلورو-فنيل)-[٧-مٹوكسي-٦- (٣-بيروليدينيل (١-بروبوكسي)-	٧٨
٢،٤-ثاني هيدرو-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل (٣)-[امين؛	٧٩
(٣-فلورو-فنيل)-[٧-مٹوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل (٣)-	٨٠
امين؛	٨١
(٢،٥-ثاني فلورو-فنيل)-[٧-مٹوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل	٨٢
(٣)-[امين؛	٨٣
(٦-كلورو-٢،٤-ثاني هيدرو-اندينو [١،٢-ج] بيرازوليل (٣)-[بيروليدينيل (٣)-	٨٤
امين؛	٨٥

(۶-کلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج] بیرازولیل ((۳)-(۳-مٹوکسی-	۸۶
فنیل)-آمین؛	۸۷
[۶-(۳-ثانی مٹیل آمینو-بروبوکسی)-(۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-	۸۸
ج]-بیرازولیل ((۳)-[۳-فلورو-فنیل)-آمین؛	۸۹
(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)-[۶-(۳-ثانی مٹیل آمینو-بروبوکسی)-(۷-مٹوکسی-	۹۰
۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۹۱
(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)-[۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-	۹۲
بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۹۳
(۵،۲-ثانی مٹوکسی-فنیل)-[۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-	۹۴
بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۹۵
(۵،۳-ثانی مٹوکسی-فنیل)-[۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-	۹۶
بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۹۷
(۴،۳-ثانی مٹوکسی-فنیل)-[۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-	۹۸
بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۹۹
(۵،۳-ثانی فلورو-فنیل)-[۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-	۱۰۰
بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۱۰۱
(۷،۶-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-بیرازولیل ((۳)-(۳-	۱۰۲
مٹیل کبریتانیل-فنیل)-آمین؛	۱۰۳
(۷،۶-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۲،۱-ج]-بیرازولیل ((۳)-(۳-	۱۰۴
ایٹیل-فنیل)-آمین؛	۱۰۵
(۷،۶-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-بیرازولیل ((۳)-(۳-	۱۰۶
ثالث فلورو مٹیل کبریتانیل-فنیل)-آمین؛	۱۰۷
(۳-کلورو-فنیل)-{۷-مٹوکسی-۶-[۳-۴-مٹیل-بیرازینیل ((۱)-بروبوکسی]-}	۱۰۸
۲،۴-ثانی هیدرو-انڈینو [۱،۲-ج]-بیرازولیل ((۳)-{آمین؛	۱۰۹
{۷-مٹوکسی-۶-[۳-۴-مٹیل-بیرازینیل ((۱)-بروبوکسی]-} ۲،۴-ثانی هیدرو-	۱۱۰

۱۱۱	۱،۲-جـ [بیرازولیل (۳)]- (۳-مٹوکسی-فنیل)-آمین؛
۱۱۲	(۳-فلورو-فنیل)- (۷-مٹوکسی-۶-۳-۴-مٹیل-بیرازینیل (۱))-بروبوکسی- [
۱۱۳	۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ [بیرازولیل (۳)]-آمین؛
۱۱۴	(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ [بیرازولیل (۳)]- (۲)-
۱۱۵	مٹیل-بنزیل)-آمین؛
۱۱۶	(۳-فلورو-فنیل)- (۶-۳-ایمیدازولیل (۱)-بروبوکسی)- (۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی
۱۱۷	هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ [بیرازولیل (۳)]-آمین؛
۱۱۸	(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)- (۶-۳-ایمیدازولیل (۱)-بروبوکسی)- (۷-مٹوکسی-
۱۱۹	۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ [بیرازولیل (۳)]-آمین؛
۱۲۰	(۲-کلورو-بنزیل)- (۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ [
۱۲۱	بیرازولیل (۳)]-آمین؛
۱۲۲	(۵،۷-ثانی هیدرو-۱-ثیا-۴،۵-دیازا-حلقی بنتا [ا] بنتالینیل (۶)]- (۳-مٹوکسی-
۱۲۳	فنیل)-آمین؛
۱۲۴	(۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ [بیرازولیل (۳)]- (۴-مٹوکسی-
۱۲۵	فنیل)-آمین؛
۱۲۶	(۲،۵-ثانی فلورو-فنیل)- (۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ [
۱۲۷	بیرازولیل (۳)]-آمین؛
۱۲۸	(۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ [بیرازولیل (۳)]- (۴-ثالث فلورو
۱۲۹	مٹیل-فنیل)-آمین؛
۱۳۰	(۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ [بیرازولیل (۳)]-میتا-تولیل-آمین؛
۱۳۱	(۳-فلورو-فنیل)- (۷-مٹوکسی-۶-۳-مٹوکسی-بروبوکسی)- (۲،۴-ثانی هیدرو-
۱۳۲	اینڈینو [۱،۲-جـ [بیرازولیل (۳)]-آمین؛
۱۳۳	[۷-مٹوکسی-۶- (۳-مٹوکسی-بروبوکسی)- (۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ [
۱۳۴	بیرازولیل (۳)]- (۳-مٹوکسی-فنیل)-آمین؛
۱۳۵	(۶،۷-ثانی اٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۲،۱-جـ [بیرازولیل (۳)]- (۳)-

مٹوکسی-فنیل)-آمین؛	۱۳۶
(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)-(۶،۷-ثانی اٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲]-	۱۳۷
ج- [بیرازولیل (۳))-آمین؛	۱۳۸
(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۴-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲]-ج- [بیرازولیل	۱۳۹
(۳))- (۳-فلورو-فنیل)-آمین؛	۱۴۰
(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۴-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲]-ج- [بیرازولیل	۱۴۱
(۳))- (۳-مٹوکسی-فنیل)-آمین؛	۱۴۲
(۳-برومو-فنیل)-(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۴-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲]-	۱۴۳
ج- [بیرازولیل (۳))-آمین؛	۱۴۴
۳- [۳- (۳-کلورو-فنیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲]-ج- [	۱۴۵
بیرازولیلوکسی (۶)) [بروبان-۱،۲-دیول؛	۱۴۶
۳- [۷-مٹوکسی-۳- (۳-مٹوکسی-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲]-	۱۴۷
ج- [بیرازولیلوکسی (۶)) [بروبان-۱،۲-دیول؛	۱۴۸
۳- [۳- (۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو	۱۴۹
[۱،۲]-ج- [بیرازولیلوکسی (۶)) [بروبان-۱،۲-دیول؛	۱۵۰
۳- [۳- (۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۴،۲-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲]-ج- [	۱۵۱
بیرازولیلوکسی (۶)) [بروبان-۱،۲-دیول؛	۱۵۲
۳- [۷-مٹوکسی-۳- (بیریدینیل (۳) آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲]-ج- [	۱۵۳
بیرازولیلوکسی (۶)) [بروبان-۱،۲-دیول؛	۱۵۴
۳- [۳- (۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲]-ج- [	۱۵۵
بیرازولیلوکسی (۶)) [بروبانول (۱)؛	۱۵۶
۳- [۷-مٹوکسی-۳- (۳-مٹوکسی-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲]-	۱۵۷
ج- [بیرازولیلوکسی (۶)) [بروبانول (۱)؛	۱۵۸
۳- [۳- (۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو	۱۵۹
[۱،۲]-ج- [بیرازولیلوکسی (۶)) [بروبانول (۱)؛	۱۶۰

فنیل]-ایٹانول؛	۱۸۶
(۲-کلورو-بنزیل)-۶،۷-ثانی ایتوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ]	۱۸۷
بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۱۸۸
(۲،۶-ثانی کلورو-بنزیل)-۶،۷-ثانی ایتوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ]	۱۸۹
جـ [بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۱۹۰
(۷-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ] بیرازولیل ((۳)-فنیل-آمین؛	۱۹۱
(۳-کلورو-۴-متوکسی-فنیل)-۷-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ]	۱۹۲
بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۱۹۳
۱-۳-۷-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ] بیرازولیل (۳) آمینو-فنیل]-	۱۹۴
ایٹانول؛	۱۹۵
(۲،۶-ثانی فلورو-بنزیل)-۶،۷-ثانی متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ]	۱۹۶
جـ [بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۱۹۷
(۲،۳-ثانی متوکسی-بنزیل)-۶،۷-ثانی متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ]	۱۹۸
جـ [بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۱۹۹
(۲،۵-ثانی کلورو-بنزیل)-۶،۷-ثانی متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ]	۲۰۰
جـ [بیرازولیل ((۳)-آمین؛	۲۰۱
(۷-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ] بیرازولیل ((۳)-۳-فلورو-فنیل)-	۲۰۲
آمین؛	۲۰۳
(۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ] بیرازولیل ((۳)-۳-فلورو-فنیل)-آمین؛	۲۰۴
(۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ] بیرازولیل ((۳)-۲،۵-ثانی متوکسی-فنیل)-	۲۰۵
آمین؛	۲۰۶
(۵-کلورو-۲-متوکسی-فنیل)-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ] بیرازولیل	۲۰۷
((۳)-آمین؛	۲۰۸
(۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ] بیرازولیل ((۳)-۳-متوکسی-فنیل)-آمین؛	۲۰۹
(۶،۷-ثانی ایتوکسی-۴-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-جـ] بیرازولیل	۲۱۰

۲۱۱	((۳))-(۳-مٹوکسی-فنیل)-آمین؛
۲۱۲	(۶-فلورو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-بیرازولیل ((۳))-(۳)-
۲۱۳	فلورو-فنیل)-آمین؛
۲۱۴	(۳-برومو-فنیل)- (۶-فلورو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-
۲۱۵	بیرازولیل ((۳))-آمین؛
۲۱۶	(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)- (۶-فلورو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو
۲۱۷	[۱،۲-ج]-بیرازولیل ((۳))-آمین؛
۲۱۸	(۶-فلورو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-بیرازولیل ((۳))-(۳)-
۲۱۹	مٹوکسی-فنیل)-آمین؛
۲۲۰	(۶-فلورو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-بیرازولیل ((۳))-(۴)-
۲۲۱	فلورو-فنیل)-آمین؛
۲۲۲	۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-
۲۲۳	بیرازولول (۶)؛
۲۲۴	(۶-فلورو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-بیرازولیل ((۳))-
۲۲۵	بیریدینیل (۳)-آمین؛
۲۲۶	۳-[۶-ایٹوکسی-۳-(۳-فلورو-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-
۲۲۷	بیرازولیلوکسی (۷)-[۷-بروبانول (۱)؛
۲۲۸	۳-[۶-ایٹوکسی-۳-(۳-مٹوکسی-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-
۲۲۹	بیرازولیلوکسی (۷)-[۷-بروبانول (۱)؛
۲۳۰	۳-[۳-(۳-کلورو-فنیل آمینو)-۶-ایٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-
۲۳۱	بیرازولیلوکسی (۷)-[۷-بروبانول (۱)؛
۲۳۲	(۶-برومو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-بیرازولیل ((۳))-(۳)-
۲۳۳	فلورو-فنیل)-آمین؛
۲۳۴	(۶-برومو-۷-مٹوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اینڈینو [۱،۲-ج]-بیرازولیل ((۳))-(۳)-
۲۳۵	مٹوکسی-فنیل)-آمین؛

- ۲۳۶ ۳- [۶- ائوکسی-۳- (بیریدینیل (۳) آمینو)-۴،۲- ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج-]
- ۲۳۷ بیرازولیلوکسی (۷)-[بروبانول (۱)؛
- ۲۳۸ ۳- [۷- (۳- هیدروکسی- بروبوکسی)-۳- (بیریدینیل (۳) آمینو)-۲،۴- ثانی هیدرو-
- ۲۳۹ ایندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛
- ۲۴۰ ۳- [۳- (۳- کلورو- فنیل آمینو)-۷- (۳- هیدروکسی- بروبوکسی)-۲،۴- ثانی هیدرو-
- ۲۴۱ ایندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛
- ۲۴۲ ۶،۷- ثانی متوکسی-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-((۳)-
- ۲۴۳ ائوکسی- فنیل)- آمین؛
- ۲۴۴ ۳- [۳- (۳- ائوکسی- فنیل آمینو)-۷- متوکسی-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج-]
- ۲۴۵ بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛
- ۲۴۶ (۲- کلورو- بیریدینیل (۳)-((۶،۷- ثانی متوکسی-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج-]
- ۲۴۷ [بیرازولیل (۳)- آمین؛
- ۲۴۸ ۳- [۳- (۳- ائوکسی- فنیل آمینو)-۷- متوکسی-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج-]
- ۲۴۹ بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبان-۱،۲- دیول؛
- ۲۵۰ (۳- فلورو- فنیل)- (H۲-۸- اکسا-۲،۳- دیازا- حلقی بنتا [۱]- ایندینیل (۱)- آمین؛
- ۲۵۱ (۳- کلورو- ۴- فلورو- فنیل)- (H۲-۸- اکسا-۲،۳- دیازا- حلقی بنتا [۱]- ایندینیل (۱)-
- ۲۵۲ آمین؛
- ۲۵۳ ۳- [۷- ائوکسی-۳- (۳- فلورو- فنیل آمینو)-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج-]
- ۲۵۴ بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛
- ۲۵۵ ۳- [۷- ائوکسی-۳- (بیریدینیل (۳) آمینو)-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج-]
- ۲۵۶ بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛
- ۲۵۷ ۳- [۷- ائوکسی-۳- (۳- متوکسی- فنیل آمینو)-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج-]
- ۲۵۸ بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛
- ۲۵۹ ۳- [۳- (۲- کلورو- بنزیل آمینو)-۷- متوکسی-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج-]
- ۲۶۰ بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛

۳-۳-(۲-فلورو-بنزىل آمينو)-۷-متوكسى-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۲۶۱
بىرازوليلوكسى (۶)-[بروبانول (۱)؛	۲۶۲
۳-۳-(۲-فلورو-بنزىل آمينو)-۷-متوكسى-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۲۶۳
بىرازوليلوكسى (۶)-[بروبان-۱،۲-ديول؛	۲۶۴
۳-۳-۶-اٲوكسى-(۳-اٲوكسى-فنيل آمينو)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۲۶۵
بىرازوليلوكسى (۷)-[بروبانول (۱)؛	۲۶۶
۳-۳-(۳-كلورو-۴-فلورو-فنيل آمينو)-۷-(۳-هيدروكسى-بروبوكسى)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۲۶۷
بىرازوليلوكسى (۶)-[بروبانول (۱)؛	۲۶۸
۱-۳-(۲،۶-ثاني كلورو-بنزىل آمينو)-۷-متوكسى-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۲۶۹
بىرازوليلوكسى (۶)-[۳-بيروليدينيل (۱)-بروبانول (۲)؛	۲۷۰
۱-۳-(۲،۶-ثاني فلورو-بنزىل آمينو)-۷-متوكسى-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۲۷۱
بىرازوليلوكسى (۶)-[۳-بيروليدينيل (۱)-بروبانول (۲)؛	۲۷۲
۱-۳-(۲-كلورو-بنزىل آمينو)-۷-متوكسى-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۲۷۳
بىرازوليلوكسى (۶)-[۳-بيروليدينيل (۱)-بروبانول (۲)؛	۲۷۴
۱-۳-(۲-فلورو-بنزىل آمينو)-۷-متوكسى-۴،۲-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۲۷۵
بىرازوليلوكسى (۶)-[۳-بيروليدينيل (۱)-بروبانول (۲)؛	۲۷۶
۳-۳-(۳-فلورو-فنيل آمينو)-۷-(۳-هيدروكسى-بروبوكسى)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۲۷۷
بىرازوليلوكسى (۶)-[بروبانول (۱)؛	۲۷۸
۳-۷-(۳-هيدروكسى-بروبوكسى)-۳-(۳-متوكسى-فنيل آمينو)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۲۷۹
بىرازوليلوكسى (۶)-[بروبانول (۱)؛	۲۸۰
۳-۳-(۳-اٲوكسى-فنيل آمينو)-۷-(۳-هيدروكسى-بروبوكسى)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۲۸۱
بىرازوليلوكسى (۶)-[بروبانول (۱)؛	۲۸۲
(۲،۶-ثاني كلورو-بنزىل)-[۵-(۳-مورفولينيل (۴)-بروبوكسى)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۲۸۳
بىرازوليل (۳)-[امين؛	۲۸۴
(۳-برومو-فنيل)-[۴-اٲيل-۶،۷-ثاني متوكسى-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۲۸۵

جـ [بیرازولیل ((۳) - آمین؛	۲۸۶
(۳) - فلورو - فنیل - (۵ - متوکسی - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ] بیرازولیل	۲۸۷
((۳) - آمین؛	۲۸۸
(۶) - فلورو - ۷ - متوکسی - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ] بیرازولیل ((۳) - (۲) -	۲۸۹
مثیل - بنزیل - آمین؛	۲۹۰
۱ - [۳ - (۳ - فلورو - فنیل آمینو) - ۶، ۷ - ثانی متوکسی - H۴ - ایندینو [۱، ۲ - جـ] -	۲۹۱
بیرازولیل ((۱) - [۲ - هیدروکسی - اینانون؛	۲۹۲
۳ - [۳ - (۳ - کلورو - فنیل آمینو) - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ] -	۲۹۳
بیرازولیلوکسی ((۵) - [بروبانول ((۱)؛	۲۹۴
۳ - [۳ - (۲ - مثیل - بنزیل آمینو) - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ] - بیرازولیلوکسی	۲۹۵
((۵) - [بروبانول ((۱)؛	۲۹۶
۳ - [۳ - (۲، ۶ - ثانی کلورو - بنزیل آمینو) - ۷ - متوکسی - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو	۲۹۷
[۱، ۲ - جـ] - بیرازولیلوکسی ((۶) - [بروبانول ((۱)؛	۲۹۸
۳ - [۳ - (۲، ۶ - ثانی فلورو - بنزیل آمینو) - ۷ - متوکسی - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو	۲۹۹
[۱، ۲ - جـ] - بیرازولیلوکسی ((۶) - [بروبانول ((۱)؛	۳۰۰
۳ - [۳ - (۲، ۶ - ثانی کلورو - بنزیل آمینو) - ۷ - متوکسی - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو	۳۰۱
[۱، ۲ - جـ] - بیرازولیلوکسی ((۶) - [بروبان - ۱، ۲ - دیول؛	۳۰۲
۳ - [۳ - (۲ - کلورو - بنزیل آمینو) - ۷ - متوکسی - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ] -	۳۰۳
بیرازولیلوکسی ((۶) - [بروبان - ۱، ۲ - دیول؛	۳۰۴
۳ - [۳ - (۲، ۶ - ثانی فلورو - بنزیل آمینو) - ۷ - متوکسی - ۴، ۲ - ثانی هیدرو - ایندینو	۳۰۵
[۱، ۲ - جـ] - بیرازولیلوکسی ((۶) - [بروبان - ۱، ۲ - دیول؛	۳۰۶
ایستر ایثیل لحمض ۳ - [۳ - (۳ - فلورو - فنیل آمینو) - ۶، ۷ - ثانی متوکسی - H۴ - ایندینو	۳۰۷
[۱، ۲ - جـ] - بیرازولیل ((۱) - [۳ - اکسو - بروبیونیک؛	۳۰۸
۱ - [۶ - (۶ - متوکسی - ۳ - (۳ - فلورو - فنیل آمینو) - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ] -	۳۰۹
بیرازولیلوکسی ((۷) - [۳ - بیرویلیدینیل ((۱) - [بروبانول ((۲)؛	۳۱۰

۱- [۶- إٹوکسي-۳- (بيريدينيل (۳) أمينو)-۲،۴- ثاني هيدرو- إندينو [۱،۲-ج]-	۳۱۱
بيرازوليلوكسي (۷)- [۳- بيروليدينيل (۱)- بروبانول (۲)؛	۳۱۲
۱- [۶- إٹوکسي-۳- (۳- مٹوکسي- فنيل أمينو)-۲،۴- ثاني هيدرو- إندينو [۱،۲-ج]-	۳۱۳
بيرازوليلوكسي (۷)- [۳- بيروليدينيل (۱)- بروبانول (۲)؛	۳۱۴
۱- [۶- إٹوکسي-۳- (۳- إٹوکسي- فنيل أمينو)-۲،۴- ثاني هيدرو- إندينو [۱،۲-ج]-	۳۱۵
بيرازوليلوكسي (۷)- [۳- بيروليدينيل (۱)- بروبانول (۲)؛	۳۱۶
۱- [۳- (۳- فلورو- فنيل أمينو)-۶،۷- ثاني مٹوکسي- H۴- إندينو [۱،۲-ج]-	۳۱۷
بيرازوليل (۱)- [۲- مٹوکسي- ايثانول؛	۳۱۸
حمض ۴- [۳- (۳- فلورو- فنيل أمينو)-۶،۷- ثاني مٹوکسي- H۴- إندينو [۱،۲-ج]-	۳۱۹
بيرازوليل (۱)- [۴- أکسو- بيوتيريك؛	۳۲۰
إستر ۲- [۳- (۳- فلورو- فنيل أمينو)-۶،۷- ثاني مٹوکسي- H۴- إندينو [۱،۲-ج]-	۳۲۱
بيرازوليل (۱)- [۲- أکسو- إثيل لحمض أسيتيك؛	۳۲۲
۳- [۳- (۳- برومو- فنيل أمينو)-۲،۴- ثاني هيدرو- إندينو [۱،۲-ج]-	۳۲۳
بيرازوليلوكسي (۵)- [۵- بروبان-۱،۲- ديول؛	۳۲۴
إستر ۲- [۳- (۳- فلورو- فنيل أمينو)-۶،۷- ثاني مٹوکسي- H۴- إندينو [۱،۲-ج]-	۳۲۵
بيرازوليل (۱)- [۲- أکسو- إثيل لحمض مٹوکسي أسيتيك؛	۳۲۶
(۳- برومو- فنيل)- (۴- إثيل-۶،۷- ثاني مٹوکسي- ۱،۴- ثاني هيدرو- إندينو [۱،۲-ج]-	۳۲۷
ج- [بيرازوليل (۳)- أمين؛	۳۲۸
إستر ۳- (۳- فلورو- فنيل أمينو)-۶،۷- ثاني مٹوکسي- H۴- إندينو [۱،۲-ج]-	۳۲۹
بيرازوليل (۱) مثيل لحمض بيوتيريك؛	۳۳۰
إستر ۳- (۳- فلورو- فنيل أمينو)-۶،۷- ثاني مٹوکسي- H۴- إندينو [۱،۲-ج]-	۳۳۱
بيرازوليل (۱) مثيل لحمض أسيتيك؛	۳۳۲
إستر ۳- (۳- فلورو- فنيل أمينو)-۶،۷- ثاني مٹوکسي- H۴- إندينو [۱،۲-ج]-	۳۳۳
بيرازوليل (۲)- مثيل لحمض أسيتيك؛	۳۳۴
إستر ۴- فلورو- فنيل لحمض ۳- (۳- فلورو- فنيل أمينو)-۶،۷- ثاني مٹوکسي- H۴-	۳۳۵

۳۳۶	۱،۲-جـ-بیرازول-۲-کربوکسیلیک؛
۳۳۷	مئیل امید لحمض ۵-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو-۶،۷-ثانی مئوکسی- H_4 -إندینو
۳۳۸	۱،۲-جـ-بیرازولیل (۱)-۵-اکسو-بنتانویک؛
۳۳۹	(۲-مورفولینیل (۴)-إئیل)-امید لحمض ۳-۳-فلورو-فنیل آمینو-۶،۷-ثانی
۳۴۰	مئوکسی- H_4 -إندینو ۱،۲-جـ-بیرازول-۱-کربوکسیلیک؛
۳۴۱	۴-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو-۶،۷-ثانی مئوکسی- H_4 -إندینو ۱،۲-جـ-
۳۴۲	بیرازولیل (۱)-۴-اکسو-بیوتیرامید؛
۳۴۳	۱-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو-۶،۷-ثانی مئوکسی- H_4 -إندینو ۱،۲-جـ-
۳۴۴	بیرازولیل (۲)-۳-بیرولیدینیل (۱)-برویان-۱،۳-دیون؛
۳۴۵	(۳-برومو-فنیل)-۶،۷-ثانی مئوکسی-۴-مئیل-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو ۱،۲-
۳۴۶	جـ-بیرازولیل (۳)-أمین؛
۳۴۷	(۶،۷-ثانی مئوکسی-۴-مئیل-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو ۱،۲-جـ-بیرازولیل
۳۴۸	(۳)-۳-إئوکسی-فنیل)-أمین؛
۳۴۹	(۳-برومو-فنیل)-۴-إئیل-۶،۷-ثانی مئوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو ۱،۲-
۳۵۰	جـ-بیرازولیل (۳)-أمین؛
۳۵۱	(۳-إئوکسی-فنیل)-۴-إئیل-۶،۷-ثانی مئوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو ۱،۲-
۳۵۲	جـ-بیرازولیل (۳)-أمین؛
۳۵۳	N-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو-۶،۷-ثانی مئوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو ۱،۲-
۳۵۴	جـ-بیرازولیل (۵)-أسیتامید؛
۳۵۵	N3-۳-۳-فلورو-فنیل-۶،۷-ثانی مئوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو ۱،۲-جـ-
۳۵۶	بیرازول-۳،۵-ثانی أمین؛
۳۵۷	(۲-کلورو-بیرویدینیل (۳)-۶،۷-ثانی مئوکسی-۴-مئیل-۲،۴-ثانی هیدرو-إندینو
۳۵۸	۱،۲-جـ-بیرازولیل (۳)-أمین؛
۳۵۹	(۴-مئوکسی-۲-مئیل-۶،۹-ثانی هیدرو-۳-اکسا-۱،۶،۷-تریازا-حلقی بنتا [ب]-
۳۶۰	as-إنداسینیل (۸)-۳-مئوکسی-فنیل)-أمین؛

(٢-برومو-بنزيل)-٦,٧-ثاني مٲوكسي-٢,٤-ثاني هيدرو-إندينو [١,٢-جـ]	٣٦١
بيرازوليل ((٣)-أمين؛	٣٦٢
(٥-برومو-بيريدينيل ((٢)-٦,٧-ثاني مٲوكسي-٢,٤-ثاني هيدرو-إندينو [١,٢-	٣٦٣
جـ] بيرازوليل ((٣)-أمين؛	٣٦٤
(٦,٧-ثاني مٲوكسي-٢,٤-ثاني هيدرو-إندينو [١,٢-جـ] بيرازوليل ((٣)-٣-	٣٦٥
أيزوبروبوكسي-فنيـل)-أمين؛	٣٦٦
(٦,٧-ثاني كلورو-بنزيل)-٦,٧-ثاني مٲوكسي-٤-مٲيل-٢,٤-ثاني هيدرو-إندينو	٣٦٧
[١,٢-جـ] بيرازوليل ((٣)-أمين؛	٣٦٨
(٦,٧-ثاني إٲوكسي-٢,٤-ثاني هيدرو-إندينو [١,٢-جـ] بيرازوليل ((٣)-٣-	٣٦٩
فلورو-فنيـل)-أمين؛	٣٧٠
(٧-مٲوكسي-H٢-٨-أكسا-٢,٣-ديازا-١-حلقي بنتا [أ]-إندينيل ((١)-فنيـل)-أمين؛	٣٧١
(٣-فلورو-فنيـل)-٤-مٲوكسي-٢-مٲيل-٩,٨-ثاني هيدرو-٣-أكسا-١,٦,٧-	٣٧٢
تريازا-١-حلقي بنتا [ب]-as-إنداسينيل ((٨)-أمين؛ و	٣٧٣
٣-(٣-فلورو-فنيـل أمينو)-٦-مٲوكسي-٢,٤-ثاني هيدرو-إندينو [١,٢-جـ]	٣٧٤
بيرازولول (٧).	

٤٣- مركب يختار من الفئة التي تتكون من:	٢
إستر مٲيل لحمض ٣-(٦,٧-ثاني مٲوكسي-٢,٤-ثاني هيدرو-إندينو [١,٢-جـ]	٣
بيرازوليل (٣) أمينو)-بنزويك؛	٤
(٦,٧-ثاني مٲوكسي-٢,٤-ثاني هيدرو-إندينو [١,٢-جـ] بيرازوليل ((٣)-٤-	٥
فلورو-فنيـل)-أمين؛	٦
(٦,٧-ثاني مٲوكسي-٢,٤-ثاني هيدرو-إندينو [١,٢-جـ] بيرازوليل ((٣)-٣-	٧
فلورو-فنيـل)-أمين؛	٨
(٦,٧-ثاني مٲوكسي-٢,٤-ثاني هيدرو-إندينو [١,٢-جـ] بيرازوليل ((٣)-٣-	٩
مٲوكسي-فنيـل)-أمين؛	١٠

- ۱۱ (۶،۷-ثاني مٹوکسي-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل ((۳)-
- ۱۲ بيريدينيل (۳)-امين؛
- ۱۳ (۶،۷-ثاني مٹوکسي-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل ((۳)-ميتا-
- ۱۴ توليل-امين؛
- ۱۵ (۷-مٹوکسي-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل ((۳)-فنيل-امين؛
- ۱۶ (۳-برومو-فنيل)-(۶،۷-ثاني مٹوکسي-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-]
- ۱۷ بيرازوليل ((۳)-امين؛
- ۱۸ [۵-(۳-ثاني مٹيل امينو-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-]
- ۱۹ بيرازوليل ((۳)-[۳-فلورو-فنيل]-امين؛
- ۲۰ ۳-(۶،۷-ثاني مٹوکسي-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل (۳)
- ۲۱ امينو)-بنزاميد؛
- ۲۲ N3-(۳-مٹوکسي-فنيل)-(۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-] بيرازول-۳،۶-ثاني
- ۲۳ امين؛
- ۲۴ N3-(۳-كلورو-فنيل)-(۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-] بيرازول-۳،۶-ثاني
- ۲۵ امين؛
- ۲۶ (۳-برومو-فنيل)-(۶-۴-مٹيل-بييرازينيل ((۱)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-
- ۲۷ ج-] بيرازوليل ((۳)-امين؛
- ۲۸ (۳-كلورو-فنيل)-(۶-۴-مٹيل-بييرازينيل ((۱)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-
- ۲۹ ج-] بيرازوليل ((۳)-امين؛
- ۳۰ (۳-برومو-فنيل)-(۷-مٹوکسي-۶-(۳-مورفولينيل (۴)-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني
- ۳۱ هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين؛
- ۳۲ [۷-مٹوکسي-۶-(۳-مورفولينيل (۴)-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني هيدرو-اندينو [۱،۲-
- ۳۳ ج-] بيرازوليل ((۳)-[۳-مٹوکسي-فنيل]-امين؛
- ۳۴ (۳-كلورو-فنيل)-(۷-مٹوکسي-۶-(۳-مورفولينيل (۴)-بروبوكسي)-۲،۴-ثاني
- ۳۵ هيدرو-اندينو [۱،۲-ج-] بيرازوليل ((۳)-امين؛

(۳-فلورو-فنیل)-(۷-متوکسی-۶-(۳-مورفولینیل (۴-بروبوکسی)-۴،۲-ثانی	۳۶
هیدرو-اندينو [۱،۲-ج] بیرازولیل (۳)-[۳]-آمین؛	۳۷
۶-(۳-متوکسی-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج] بیرازولیل	۳۸
(۳)-[۳]-فنیل-آمین؛	۳۹
(۳-متوکسی-فنیل)-(۷-متوکسی-۶-(۳-بیرولیدینیل (۱-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی	۴۰
هیدرو-اندينو [۱،۲-ج] بیرازولیل (۳)-[۳]-آمین؛	۴۱
استر مثیل لحمض ۳-(۷-متوکسی-۶-(۳-بیرولیدینیل (۱-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی	۴۲
هیدرو-اندينو [۱،۲-ج] بیرازولیل (۳) آمینو-بنزویک؛	۴۳
(۴-فلورو-فنیل)-(۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج] بیرازولیل	۴۴
(۳)-[۳]-آمین؛	۴۵
(۳-فلورو-فنیل)-(۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج] بیرازولیل	۴۶
(۳)-[۳]-آمین؛	۴۷
(۳-فلورو-فنیل)-(۷-متوکسی-۶-(۳-بیرولیدینیل (۱-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی	۴۸
هیدرو-اندينو [۱،۲-ج] بیرازولیل (۳)-[۳]-آمین؛	۴۹
(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)-(۷-متوکسی-۶-(۳-بیرولیدینیل (۱-بروبوکسی)-	۵۰
۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج] بیرازولیل (۳)-[۳]-آمین؛	۵۱
(۳-فلورو-فنیل)-(۷-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج] بیرازولیل (۳)-[۳]-	۵۲
آمین؛	۵۳
۶-(۳-ثانی مثیل آمینو-بروبوکسی)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-	۵۴
ج] بیرازولیل (۳)-[۳]-فلورو-فنیل-آمین؛	۵۵
(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)-(۶-(۳-ثانی مثیل آمینو-بروبوکسی)-۷-متوکسی-	۵۶
۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج] بیرازولیل (۳)-[۳]-آمین؛	۵۷
(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل)-(۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج]	۵۸
بیرازولیل (۳)-[۳]-آمین؛	۵۹
(۲،۵-ثانی متوکسی-فنیل)-(۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج]	۶۰

بیرازولیل ((۳) - آمین؛	۶۱
(۳، ۵ - ثانی فلورو - فنیل) - (۶، ۷ - ثانی متوکسی - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - ج -	۶۲
بیرازولیل ((۳) - آمین؛	۶۳
(۶، ۷ - ثانی متوکسی - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - ج - بیرازولیل ((۳) - (۳) -	۶۴
مثیل کبریتانیل - فنیل) - آمین؛	۶۵
(۳ - کلورو - فنیل) - {۷ - متوکسی - ۶ - (۳) - (۴ - مثیل - بیرازینیل (۱) - بروبوکسی -	۶۶
۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - ج - بیرازولیل (۳) - آمین؛	۶۷
{۷ - متوکسی - ۶ - (۳) - (۴ - مثیل - بیرازینیل (۱) - بروبوکسی - ۲، ۴ - ثانی هیدرو -	۶۸
ایندینو [۱، ۲ - ج - بیرازولیل (۳) - {۳ - متوکسی - فنیل) - آمین؛	۶۹
(۳ - فلورو - فنیل) - {۷ - متوکسی - ۶ - (۳) - (۴ - مثیل - بیرازینیل (۱) - بروبوکسی -	۷۰
۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - ج - بیرازولیل (۳) - آمین؛	۷۱
(۳ - فلورو - فنیل) - (۶ - (۳ - ایمیدازولیل (۱) - بروبوکسی - ۷ - متوکسی - ۲، ۴ - ثانی	۷۲
هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - ج - بیرازولیل (۳) - آمین؛	۷۳
(۲ - کلورو - بنزیل) - (۶، ۷ - ثانی متوکسی - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - ج -	۷۴
بیرازولیل ((۳) - آمین؛	۷۵
(۲، ۵ - ثانی فلورو - فنیل) - (۶ - فلورو - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - ج -	۷۶
بیرازولیل ((۳) - آمین؛	۷۷
(۶ - فلورو - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - ج - بیرازولیل (۳) - میتا - تولیل - آمین؛	۷۸
(۳ - فلورو - فنیل) - (۷ - متوکسی - ۶ - (۳ - متوکسی - بروبوکسی) - ۲، ۴ - ثانی هیدرو -	۷۹
ایندینو [۱، ۲ - ج - بیرازولیل (۳) - آمین؛	۸۰
[۷ - متوکسی - ۶ - (۳ - متوکسی - بروبوکسی) - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - ج -	۸۱
بیرازولیل ((۳) - (۳ - متوکسی - فنیل) - آمین؛	۸۲
(۶، ۷ - ثانی ائوکسی - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ - ج - بیرازولیل ((۳) - (۳) -	۸۳
متوکسی - فنیل) - آمین؛	۸۴
(۳ - کلورو - ۴ - فلورو - فنیل) - (۶، ۷ - ثانی ائوکسی - ۲، ۴ - ثانی هیدرو - ایندینو [۱، ۲ -	۸۵

جـ [بیرازولیل (۳) - آمین؛	۸۶
(۶، ۷) - ثانی مٹوکسی - ۴ - مٹیل - ۲، ۴ - ثانی ہیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ] بیرازولیل	۸۷
(۳) - (۳ - فلورو - فنیل) - آمین؛	۸۸
(۶، ۷) - ثانی مٹوکسی - ۴ - مٹیل - ۲، ۴ - ثانی ہیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ] بیرازولیل	۸۹
(۳) - (۳ - مٹوکسی - فنیل) - آمین؛	۹۰
(۳ - برومو - فنیل) - (۶، ۷) - ثانی مٹوکسی - ۴ - مٹیل - ۲، ۴ - ثانی ہیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ]	۹۱
جـ [بیرازولیل (۳) - آمین؛	۹۲
۳ - (۳ - کلورو - فنیل آمینو) - ۷ - مٹوکسی - ۲، ۴ - ثانی ہیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ] -	۹۳
بیرازولیلوکسی (۶) [۱، ۲ - بروبان - دیول؛	۹۴
۳ - (۷ - مٹوکسی - ۳ - (۳ - مٹوکسی - فنیل آمینو) - ۲، ۴ - ثانی ہیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ]	۹۵
جـ [بیرازولیلوکسی (۶) [۱، ۲ - بروبان - دیول؛	۹۶
۳ - (۳ - کلورو - ۴ - فلورو - فنیل آمینو) - ۷ - مٹوکسی - ۲، ۴ - ثانی ہیدرو - ایندینو	۹۷
[۱، ۲ - جـ] بیرازولیلوکسی (۶) [۱، ۲ - بروبان - دیول؛	۹۸
۳ - (۳ - فلورو - فنیل آمینو) - ۷ - مٹوکسی - ۲، ۴ - ثانی ہیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ] -	۹۹
بیرازولیلوکسی (۶) [۱، ۲ - بروبان - دیول؛	۱۰۰
۳ - (۷ - مٹوکسی - ۳ - (۳ - مٹوکسی - فنیل آمینو) - ۲، ۴ - ثانی ہیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ]	۱۰۱
جـ [بیرازولیلوکسی (۶) [۱ - بروبانول (۱)؛	۱۰۲
۳ - (۳ - کلورو - ۴ - فلورو - فنیل آمینو) - ۷ - مٹوکسی - ۲، ۴ - ثانی ہیدرو - ایندینو	۱۰۳
[۱، ۲ - جـ] بیرازولیلوکسی (۶) [۱ - بروبانول (۱)؛	۱۰۴
۳ - (۳ - کلورو - فنیل آمینو) - ۷ - مٹوکسی - ۲، ۴ - ثانی ہیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ] -	۱۰۵
بیرازولیلوکسی (۶) [۱ - بروبانول (۱)؛	۱۰۶
۱ - (۳ - فلورو - فنیل آمینو) - ۷ - مٹوکسی - ۲، ۴ - ثانی ہیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ] -	۱۰۷
بیرازولیلوکسی (۶) [۱ - بیرولیڈینیل (۱) - بروبانول (۲)؛	۱۰۸
۱ - (۷ - مٹوکسی - ۳ - (۳ - مٹوکسی - فنیل آمینو) - ۲، ۴ - ثانی ہیدرو - ایندینو [۱، ۲ - جـ]	۱۰۹
جـ [بیرازولیلوکسی (۶) [۱ - بیرولیڈینیل (۱) - بروبانول (۲)؛	۱۱۰

۱-۳-(۳-کلورو-۴-فلورو-فنیل آمینو)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو	۱۱۱
[۱،۲-ج] بیرازولیلوکسي (۶)-۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۱۱۲
۱-۷-متوکسي-۳-(بیريدینیل (۳) آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۱۱۳
بیرازولیلوکسي (۶)-۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۱۱۴
۱-۳-(۳-کلورو-فنیل آمینو)-۷-متوکسي-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۱۱۵
بیرازولیلوکسي (۶)-۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۱۱۶
[۶،۷-ثنائي-(۳-متوکسي-بروبوکسي)-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۱۱۷
بیرازولیل (۳)-[۳-فلورو-فنیل]-آمین؛	۱۱۸
[۶،۷-ثنائي-(۳-متوکسي-بروبوکسي)-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۱۱۹
بیرازولیل (۳)-[۳-متوکسي-فنیل]-آمین؛	۱۲۰
[۶،۷-ثنائي-(۳-متوکسي-بروبوکسي)-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۱۲۱
بیرازولیل (۳)-[۳-کلورو-فنیل]-آمین؛	۱۲۲
[۶،۷-ثنائي-(۳-متوکسي-بروبوکسي)-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۱۲۳
بیرازولیل (۳)-[۳-بیريدینیل (۳)-آمین؛	۱۲۴
۱-۳-(۶-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج] بیرازولیل (۳) آمینو)-	۱۲۵
فنیل]-ایثانول؛	۱۲۶
(۲-کلورو-بنزیل)-(۶،۷-ثانی إتوکسي-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج]-	۱۲۷
بیرازولیل (۳)-آمین؛	۱۲۸
(۲،۶-ثانی کلورو-بنزیل)-(۶،۷-ثانی إتوکسي-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-	۱۲۹
ج]-بیرازولیل (۳)-آمین؛	۱۳۰
(۷-فلورو-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج] بیرازولیل (۳)-فنیل-آمین؛	۱۳۱
۱-۳-(۷-مثیل-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-ج] بیرازولیل (۳) آمینو)-فنیل]-	۱۳۲
ایثانول؛	۱۳۳
(۲،۶-ثانی فلورو-بنزیل)-(۶،۷-ثانی متوکسي-۲،۴-ثانی هیدرو-اندينو [۱،۲-	۱۳۴
ج]-بیرازولیل (۳)-آمین؛	۱۳۵

۱۳۶	(۲،۵-ثاني كلورو-بنزيل)-(۶،۷-ثاني مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-])
۱۳۷	[بيرا زوليل (۳)-امين؛
۱۳۸	(۷-فلورو-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]) بيرا زوليل (۳)-((۳-فلورو-فنيل)-
۱۳۹	امين؛
۱۴۰	(۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]) بيرا زوليل (۳)-((۳-فلورو-فنيل)-امين؛
۱۴۱	(۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]) بيرا زوليل (۳)-((۳-مٹوكسي-فنيل)-امين؛
۱۴۲	(۶،۷-ثاني ايثوكسي-۴-مٹيل-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]) بيرا زوليل
۱۴۳	((۳)-((۳-مٹوكسي-فنيل)-امين؛
۱۴۴	(۶-فلورو-۷-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]) بيرا زوليل (۳)-((۳)-
۱۴۵	فلورو-فنيل)-امين؛
۱۴۶	(۳-برومو-فنيل)-((۶-فلورو-۷-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-])
۱۴۷	بيرا زوليل (۳)-امين؛
۱۴۸	(۶-فلورو-۷-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]) بيرا زوليل (۳)-((۳)-
۱۴۹	مٹوكسي-فنيل)-امين؛
۱۵۰	(۶-فلورو-۷-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]) بيرا زوليل (۳)-((۴)-
۱۵۱	فلورو-فنيل)-امين؛
۱۵۲	۳-((۳-فلورو-فنيل امينو)-۷-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-])-
۱۵۳	بيرا زولول (۶)؛
۱۵۴	(۶-فلورو-۷-مٹوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-]) بيرا زوليل (۳)-((۳)-
۱۵۵	بيريدينيل (۳)-امين؛
۱۵۶	۳-((۶-ايتوكسي-۳-((۳-فلورو-فنيل امينو)-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-])-
۱۵۷	بيرا زوليلوكسي (۷)-[[بروبانول (۱)؛
۱۵۸	۳-((۶-ايتوكسي-۳-((۳-مٹوكسي-فنيل امينو)-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-])-
۱۵۹	بيرا زوليلوكسي (۷)-[[بروبانول (۱)؛
۱۶۰	۳-((۳-كلورو-فنيل امينو)-۶-ايتوكسي-۲،۴-ثاني هيدرو-يندينو [۱،۲-ج-])-

- ۱۶۱ بیرازولیلوکسی (۷)-[بروبانول (۱)؛
- ۱۶۲ (۶)-برومو-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-((۳)-۳-
 ۱۶۳ فلورو-فنیل)-آمین؛
- ۱۶۴ (۶)-برومو-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-((۳)-۳-
 ۱۶۵ متوکسی-فنیل)-آمین؛
- ۱۶۶ ۳-۷-((۳)-هیدروکسی-بروبوکسی)-۳-بیریدینیل (۳) آمینو-۲،۴-ثانی هیدرو-
 ۱۶۷ اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛
- ۱۶۸ ۳-۳-((۳)-کلورو-فنیل آمینو)-۷-۳-هیدروکسی-بروبوکسی)-۲،۴-ثانی هیدرو-
 ۱۶۹ اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛
- ۱۷۰ (۶،۷)-ثانی متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل (۳)-((۳)-۳-
 ۱۷۱ (۳-هیدروکسی-فنیل)-آمین؛
- ۱۷۲ ۳-۳-((۳)-هیدروکسی-فنیل آمینو)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]
 ۱۷۳ بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛
- ۱۷۴ (۲)-کلورو-بیریدینیل (۳)-((۶،۷)-ثانی متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]
 ۱۷۵ [بیرازولیل (۳)-آمین؛
- ۱۷۶ ۳-۳-((۳)-هیدروکسی-فنیل آمینو)-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]
 ۱۷۷ بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبان-۱،۲-دیول؛
- ۱۷۸ (۳)-فلورو-فنیل)-((۲-H-۸-اکسا-۲،۳-دیازا-حلقی بنتا [۱]-اندینیل (۱)-آمین؛
- ۱۷۹ (۳)-کلورو-۴-فلورو-فنیل)-((۲-H-۸-اکسا-۲،۳-دیازا-حلقی بنتا [۱]-اندینیل (۱)-
 ۱۸۰ آمین؛
- ۱۸۱ ۳-۷-((۳)-هیدروکسی-فلورو-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]
 ۱۸۲ بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛
- ۱۸۳ ۳-۷-((۳)-هیدروکسی-بیریدینیل (۳) آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]
 ۱۸۴ بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛
- ۱۸۵ ۳-۷-((۳)-هیدروکسی-فلورو-فنیل آمینو)-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]

بیرازولیلوکسی (۶) [[بروبانول (۱)؛	۱۸۶
۳- (۳- (۲- کلورو-بنزیل آمینو)-۷- متوکسی-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج]-	۱۸۷
بیرازولیلوکسی (۶) [[بروبانول (۱)؛	۱۸۸
۳- (۳- (۲- فلورو-بنزیل آمینو)-۷- متوکسی-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج]-	۱۸۹
بیرازولیلوکسی (۶) [[بروبانول (۱)؛	۱۹۰
۳- (۳- (۲- فلورو-بنزیل آمینو)-۷- متوکسی-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج]-	۱۹۱
بیرازولیلوکسی (۶) [[بروبان-۱،۲- دیول؛	۱۹۲
۳- (۳- (۳- کلورو-۴- فلورو-فنیل آمینو)-۷- (۳- هیدروکسی-بروبوکسی)-۲،۴-	۱۹۳
ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج]- بیرازولیلوکسی (۶) [[بروبانول (۱)؛	۱۹۴
۱- (۳- (۲،۶- ثانی کلورو-بنزیل آمینو)-۷- متوکسی-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو	۱۹۵
[۱،۲-ج]- بیرازولیلوکسی (۶) [[۳- بیرولیدینیل (۱) -بروبانول (۲)؛	۱۹۶
۱- (۳- (۲،۶- ثانی فلورو-بنزیل آمینو)-۷- متوکسی-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو	۱۹۷
[۱،۲-ج]- بیرازولیلوکسی (۶) [[۳- بیرولیدینیل (۱) -بروبانول (۲)؛	۱۹۸
۱- (۳- (۲- کلورو-بنزیل آمینو)-۷- متوکسی-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج]-	۱۹۹
بیرازولیلوکسی (۶) [[۳- بیرولیدینیل (۱) -بروبانول (۲)؛	۲۰۰
۱- (۳- (۲- فلورو-بنزیل آمینو)-۷- متوکسی-۲،۴- ثانی هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج]-	۲۰۱
بیرازولیلوکسی (۶) [[۳- بیرولیدینیل (۱) -بروبانول (۲)؛	۲۰۲
۳- (۳- (۳- فلورو-فنیل آمینو)-۷- (۳- هیدروکسی-بروبوکسی)-۲،۴- ثانی هیدرو-	۲۰۳
ایندینو [۱،۲-ج]- بیرازولیلوکسی (۶) [[بروبانول (۱)؛	۲۰۴
۳- (۷- (۳- هیدروکسی-بروبوکسی)-۳- (۳- متوکسی-فنیل آمینو)-۲،۴- ثانی	۲۰۵
هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج]- بیرازولیلوکسی (۶) [[بروبانول (۱)؛	۲۰۶
۳- (۳- (۳- ائوکسی-فنیل آمینو)-۷- (۳- هیدروکسی-بروبوکسی)-۲،۴- ثانی	۲۰۷
هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج]- بیرازولیلوکسی (۶) [[بروبانول (۱)؛	۲۰۸
(۲،۶- ثانی کلورو-بنزیل)-[۵- (۳- مورفولینیل (۴) -بروبوکسی)-۲،۴- ثانی	۲۰۹
هیدرو- ایندینو [۱،۲-ج]- بیرازولیل (۳) [[آمین؛	۲۱۰

(۳)-فلورو-فنیل)-(۵-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل	۲۱۱
((۳)-آمین؛	۲۱۲
(۶)-فلورو-۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیل ((۳)-(۲)-	۲۱۳
مثیل-بنزیل)-(آمین؛	۲۱۴
۳-۳-((۲-مثیل-بنزیل آمینو)-(۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی	۲۱۵
(۵)-[بروبانول (۱)؛	۲۱۶
۳-۳-((۲،۶-ثانی کلورو-بنزیل آمینو)-(۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو	۲۱۷
[۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛	۲۱۸
۳-۳-((۲،۶-ثانی فلورو-بنزیل آمینو)-(۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو	۲۱۹
[۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبانول (۱)؛	۲۲۰
۳-۳-((۲،۶-ثانی کلورو-بنزیل آمینو)-(۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو	۲۲۱
[۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبان-۱،۲-دیول؛	۲۲۲
۳-۳-((۲-کلورو-بنزیل آمینو)-(۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۲۲۳
بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبان-۱،۲-دیول؛	۲۲۴
۳-۳-((۲،۶-ثانی فلورو-بنزیل آمینو)-(۷-متوکسی-۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو	۲۲۵
[۱،۲-ج-] بیرازولیلوکسی (۶)-[بروبان-۱،۲-دیول؛	۲۲۶
۱-۶-[[توکسی-۳-((۳-فلورو-فنیل آمینو)-(۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۲۲۷
بیرازولیلوکسی (۷)-[[۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۲۲۸
۱-۶-[[توکسی-۳-((۳-بیرویدینیل (۳) آمینو)-(۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۲۲۹
بیرازولیلوکسی (۷)-[[۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۲۳۰
۱-۶-[[توکسی-۳-((۳-متوکسی-فنیل آمینو)-(۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۲۳۱
بیرازولیلوکسی (۷)-[[۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۲۳۲
۱-۶-[[توکسی-۳-((۳-[[توکسی-فنیل آمینو)-(۲،۴-ثانی هیدرو-اندینو [۱،۲-ج-]	۲۳۳
بیرازولیلوکسی (۷)-[[۳-بیرولیدینیل (۱)-بروبانول (۲)؛	۲۳۴
۱-۳-((۳-فلورو-فنیل آمینو)-(۶،۷-ثانی متوکسی- H_4 -اندینو [۱،۲-ج-]	۲۳۵

بیرازولیل (۱)-۲-مٹوکسی-ایٹانوں؛	۲۳۶
ایستر ۲-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو-۶،۷-ثانی مٹوکسی- H_4 -ہندینو [۱،۲-ج]-	۲۳۷
بیرازولیل (۱)-۲-اکسو-ایٹیل لحمض آسیٹیک؛	۲۳۸
ایستر ۲-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو-۶،۷-ثانی مٹوکسی- H_4 -ہندینو [۱،۲-ج]-	۲۳۹
بیرازولیل (۱)-۲-اکسو-ایٹیل لحمض مٹوکسی آسیٹیک؛	۲۴۰
ایستر ۳-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو-۶،۷-ثانی مٹوکسی- H_4 -ہندینو [۱،۲-ج]-	۲۴۱
بیرازولیل (۱) مٹیل لحمض آسیٹیک؛	۲۴۲
۴-۳-۳-۳-فلورو-فنیل آمینو-۶،۷-ثانی مٹوکسی- H_4 -ہندینو [۱،۲-ج]-	۲۴۳
بیرازولیل (۱)-۴-اکسو-بیوتیرامید؛	۲۴۴
(۳-برومو-فنیل)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۴-مٹیل-۲،۴-ثانی ہیدرو-ہندینو [۱،۲-ج]-	۲۴۵
ج-بیرازولیل (۳)-آمین؛	۲۴۶
(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۴-مٹیل-۲،۴-ثانی ہیدرو-ہندینو [۱،۲-ج]- بیرازولیل	۲۴۷
(۳)-۳-ایٹوکسی-فنیل)-آمین؛	۲۴۸
(۳-برومو-فنیل)-۴-ایٹیل-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی ہیدرو-ہندینو [۱،۲-ج]-	۲۴۹
ج-بیرازولیل (۳)-آمین؛	۲۵۰
(۳-ایٹوکسی-فنیل)-۴-ایٹیل-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی ہیدرو-ہندینو [۱،۲-ج]-	۲۵۱
ج-بیرازولیل (۳)-آمین؛	۲۵۲
N3-۳-۳-۳-فلورو-فنیل)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی ہیدرو-ہندینو [۱،۲-ج]-	۲۵۳
بیرازول-۳،۵-ثانی آمین؛	۲۵۴
(۴-مٹوکسی-۲-مٹیل-۶،۹-ثانی ہیدرو-۳-اکسا-۱،۶،۷-تریازا-حلقی بنتا [ب]-	۲۵۵
as-ہنداسینیل (۸)-۳-مٹوکسی-فنیل)-آمین؛	۲۵۶
(۲-برومو-بنزیل)-۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی ہیدرو-ہندینو [۱،۲-ج]-	۲۵۷
بیرازولیل (۳)-آمین؛	۲۵۸
(۶،۷-ثانی مٹوکسی-۲،۴-ثانی ہیدرو-ہندینو [۱،۲-ج]- بیرازولیل (۳)-۳-	۲۵۹
ایزوبروبوکسی-فنیل)-آمین؛	۲۶۰

- ٢٦١ (٧،٦-ثاني إيثوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-جـ] بيرازوليل (٣)-٣)-
 ٢٦٢ فلورو-فنيل)-أمين؛
 ٢٦٣ (٧-مئوكسي-H٢-٨-أكسا-٢،٣-ديازا-حلقي بنتا [أ]-إندينيل (١))-فنيل-أمين؛
 ٢٦٤ (٣-فلورو-فنيل)-(٤-مئوكسي-٢-مئيل-٨،٩-ثاني هيدرو-٣-أكسا-١،٦،٧-
 ٢٦٥ تريازا-حلقي بنتا [ب]-إنداسينيل (٨))-أمين؛ و
 ٢٦٦ ٣-(٣-فلورو-فنيل أمينو)-٦-مئوكسي-٢،٤-ثاني هيدرو-إندينو [١،٢-جـ]
 بيرازولول (٧).

٢ ٤٤- تركيب صيدلي يشتمل على مادة حاملة مقبولة صيدلياً ومركب وفقاً لعناصر الحماية
 ١، ٧، ٢٠، ٢٢، ٢٤، ٢٦، ٢٨-٣٠، ٣٢، ٣٤، و ٣٦-٤٣.

٢ ٤٥- تركيب صيدلي محضر بخلط مركب وفقاً لعناصر الحماية ١، ٧، ٢٠، ٢٢، ٢٤،
 ٢٦، ٢٨-٣٠، ٣٢، ٣٤، و ٣٦-٤٣ ومادة حاملة مقبولة صيدلياً.

٢ ٤٦- عملية لتحضير تركيب صيدلي تتضمن خلط مركب وفقاً لعناصر الحماية ١، ٧، ٢٠،
 ٢٢، ٢٤، ٢٦، ٢٨-٣٠، ٣٢، ٣٤، و ٣٦-٤٣ ومادة حاملة مقبولة صيدلياً.

٢ ٤٧- طريقة لعلاج اضطراب مرتبط بمستقبل PDGF (عامل النمو المشتق من الصفائح
 ٣ الدموية) أو اضطراب تكاثر خلايا عند كائن بحاجة لهذا العلاج تتضمن إعطاء هذا
 ٤ الكائن مقدار فعال علاجياً من المركب وفقاً لعناصر الحماية ١، ٧، ٢٠، ٢٢، ٢٤،
 ٢٦، ٢٨-٣٠، ٣٢، ٣٤، و ٣٦-٤٣.

٢ ٤٨- طريقة لعلاج اضطراب تكاثر خلايا أو اضطراب مرتبط بمستقبل PDGF عند كائن
 ٣ بحاجة لهذا العلاج تتضمن إعطاء هذا الكائن مقدار فعال علاجياً من التركيب وفقاً
 لعنصر الحماية ٤٤.

٤٩- الطريقة وفقاً لعنصر الحماية ٤٨ حيث يكون اضطراب تكاثر الخلايا المذكور عبارة
عن اضطراب ورمي.

٥٠- الطريقة وفقاً لعنصر الحماية ٤٩ حيث يكون الاضطراب الورمي المذكور عبارة عن
سرطان يختار من الفئة التي تتكون من سرطان ورم دقيقي، سرطان رئة، سرطان
ثدي، سرطان قولون ومستقيم، سرطان بروسات، سرطان معدي، سرطان مريئي،
سرطان قولون، سرطان بنكرياسي، سرطان مبيضي، ورم ميلانيني، سوء نمو
نخاعي، ورم نخاعي متعدد، ورم ليمفي ولوكيميا.

٥١- الطريقة وفقاً لعنصر الحماية ٥٠ حيث يختار مرض اللوكيميا المذكور من لوكيميا
مزمنة نخاعية المنشأ (CML)؛ لوكيميا حادة متعلقة بالخلايا الليمفية (ALL)؛ لوكيميا
مزمنة أليفة الأصباغ المتعادلة (CNL)؛ لوكيميا حادة عديمة التمايز (AUL)؛ ولوكيميا
حادة نخاعية المنشأ (AML).

٥٢- الطريقة وفقاً لعنصر الحماية ٤٨ حيث لا يكون اضطراب تكاثر الخلايا المذكور
عبارة عن اضطراب ورمي.

٥٣- الطريقة وفقاً لعنصر الحماية ٥٢ حيث يختار اضطراب تكاثر الخلايا المذكور من
التصلب العصيدي، الأمراض الوعائية المستحثة بزرع الأعضاء، تكوين بطانة
جديدة، تليف الرئة، الانتكاس البقي، معاودة التضيق، التليف الرئوي، التهاب كبيبات
الكلية، تصلب كبيبات الكلية، سوء النمو الخلقي للكلية متعددة الأكياس، تليف الكلية،
اعتلال الشبكية الديابيطي والتهاب المفاصل شبه الروماتزمي.

٥٤- طريقة لعلاج اضطراب تكاثر خلايا أو اضطراب مرتبط بمستقبل PDGF عند كائن

٣ بحاجة لهذا العلاج تتضمن إعطاء مقدار فعال علاجياً من مركب وفقاً لعناصر
٤ الحماية ١، ٧، ٢٠، ٢٢، ٢٤، ٢٦، ٢٨-٣٠، ٣٢، ٣٤، و ٣٦-٤٣ في توليفة مع
٥ علاج واحد أو أكثر يتم اختياره من الفئة التي تتكون من علاج كيميائي، علاج
بالأشعة، علاج بالجينات وعلاج مناعي.

١
٢ ٥٥- طريقة لعلاج اضطراب تكاثر خلايا أو اضطراب مرتبط بـ PDGF-R عند كائن
٣ بحاجة لهذا العلاج تتضمن تصريف مضبوط لمقدار فعال علاجياً من مركب وفقاً
٤ لعناصر الحماية ١، ٧، ٢٠، ٢٢، ٢٤، ٢٦، ٢٨-٣٠، ٣٢، ٣٤، و ٣٦-٤٣، عن
طريق إطلاقه من أداة طبية داخل تجويف الأنبوبة.

١
٢ ٥٦- الطريقة وفقاً لعنصر الحماية ٥٥ حيث يكون اضطراب تكاثر الخلايا المذكور أو
٣ الاضطراب المرتبط بـ PDGF-R عبارة عن معاودة التضيق، التكاثر النسيجي
البطاني، التصلب العصيدي أو الالتهاب، في جدران الأوعية.

١
٢ ٥٧- أداة لتصريف عقار تشتمل على أداة طبية داخل تجويف الأنبوبة ومقدار فعال علاجياً
٣ من مركب وفقاً لعناصر الحماية ١، ٧، ٢٠، ٢٢، ٢٤، ٢٦، ٢٨-٣٠، ٣٢، ٣٤، و
٤٣-٣٦.

١
٢ ٥٨- الأداة لتصريف عقار وفقاً لعنصر الحماية ٥٧، حيث تكون الأداة الطبية داخل تجويف
الأنبوبة عبارة عن واقية طعم.

١
٢ ٥٩- طريقة لعلاج اضطراب تكاثر خلايا أو اضطراب مرتبط بمستقبل PDGF عند كائن
٣ بحاجة لهذا العلاج، تتضمن إعطاء هذا الكائن مقدار فعال علاجياً من مركب وفقاً
٤ لعناصر الحماية ١، ٧، ٢٠، ٢٢، ٢٤، ٢٦، ٢٨-٣٠، ٣٢، ٣٤، و ٣٦-٤٣،
بالاقتران مع عامل استهداف.

٦٠- الطريقة وفقاً لعنصر الحماية ٥٩، حيث يكون اضطراب تكاثر الخلايا المذكور عبارة
 عن اضطراب ورمي يختار من سرطان ورم دبقي، سرطان رئة، سرطان ثدي،
 سرطان قولون ومستقيم، سرطان بروتات، سرطان معدي، سرطان مريئي، سرطان
 قولون، سرطان بنكرياسي، سرطان مبيضي، ورم ميلانيني، سوء نمو نخاعي، ورم
 نخاعي متعدد، لوكيميا وورم ليفي.

٦١- تركيب صيدلي يشتمل على مركب وفقاً لعناصر الحماية ١، ٧، ٢٠، ٢٢، ٢٤، ٢٦،
 ٢٨-٣٠، ٣٢، ٣٤، و ٣٦-٤٣، بالاقتران مع عامل استهداف ومادة حاملة مقبولة
 صيدلياً.

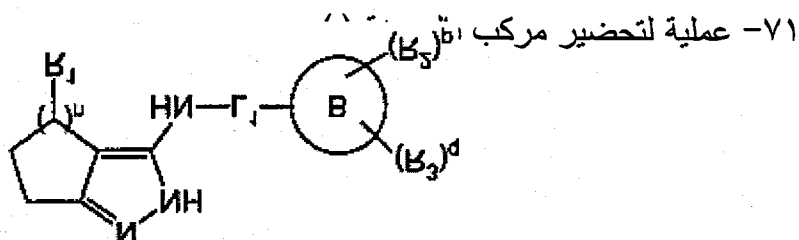
٦٢- تركيب صيدلي محضر بخلط مركب وفقاً لعناصر الحماية ١، ٧، ٢٠، ٢٢، ٢٤،
 ٢٦، ٢٨-٣٠، ٣٢، ٣٤، و ٣٦-٤٣، بالاقتران مع عامل استهداف ومادة حاملة
 مقبولة صيدلياً.

٦٣- عملية لتحضير تركيب صيدلي يتضمن خلط مركب وفقاً لعناصر الحماية ١، ٧، ٢٠،
 ٢٢، ٢٤، ٢٦، ٢٨-٣٠، ٣٢، ٣٤، و ٣٦-٤٣، بالاقتران مع عامل استهداف ومادة
 حاملة مقبولة صيدلياً.

٦٤- طريقة لتمييز مثبطات كيناز PDGF-R جديدة تتضمن الخطوات التالية:
 (أ) تحديد بنية ثلاثية الأبعاد للمركب بالصيغة I أو II في عدم وجود أو وجود متعدد
 بيتيد يشتمل على الحقل الحفازي لكيناز PDGF-R؛
 (ب) تحليل البنية ثلاثية الأبعاد للمركب وحده أو للتفاعل التبادلي بين الجزيئي بين
 المركب المذكور و PDGF-R؛
 (جـ) اختيار مركب يحاكي بنية المركب وحده أو يتضمن التفاعل التبادلي المتوقع؛

- ٨ (د) تخليق المركب المصمم المذكور؛ و
- (هـ) تحديد قدرة الجزيء على الارتباط مع كيناز PDGF-R وتنشيط فعاليته.
- ١
- ٢ ٦٥- طريقة لتمييز مثبطات كيناز c-Abl جديدة تتضمن الخطوات التالية:
- ٣ (أ) تحديد بنية ثلاثية الأبعاد للمركب بالصيغة I أو II في عدم وجود أو وجود متعدد
- ٤ بيتيد يشتمل على حقل حفازي لكيناز c-Abl؛
- ٥ (ب) تحليل البنية ثلاثية الأبعاد للمركب وحده أو للتفاعل التبادلي بين الجزيئي بين
- ٦ المركب المذكور و c-Abl؛
- ٧ (ج) اختيار مركب يحاكي بنية المركب وحده أو يتضمن التفاعل التبادلي المتوقع؛
- ٨ (د) تخليق المركب المصمم المذكور؛ و
- (هـ) تحديد قدرة الجزيء على الارتباط مع كيناز c-Abl وتنشيط فعاليته.
- ١
- ٢ ٦٦- طريقة لتقليل أو تنشيط فعالية كيناز PDGF-R في خلية تتضمن خطوة ملاسة الخلية
- مع مركب بالصيغة (I) أو (II).
- ١
- ٢ ٦٧- طريقة لتقليل أو تنشيط فعالية كيناز PDGF-R عند كائن تتضمن خطوة إعطاء هذا
- الكائن مركب بالصيغة (I) أو (II).
- ١
- ٢ ٦٨- طريقة لتقليل أو تنشيط فعالية كيناز c-Abl في خلية تتضمن خطوة ملاسة الخلية مع
- مركب بالصيغة (I) أو (II).
- ١
- ٢ ٦٩- طريقة لتقليل أو تنشيط فعالية كيناز c-Abl عند كائن خاضع للمعالجة تتضمن خطوة
- إعطاء الكائن الخاضع للمعالجة مركب بالصيغة (I) أو (II).
- ١
- ٢ ٧٠- طريقة لتنشيط تكاثر خلايا في خلية تتضمن خطوة ملاسة الخلية مع مركب بالصيغة

(I) أو (II).



(I)

حيث:

n يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من ١ إلى ٤؛

 R^1 يختار من الفئة التي تتكون من هيدروجين، ألكيل منخفض، -OH،ألكسو، $-NH_2$ ، (ألكيل)-NH و $-N(ألكيل)_2$ ؛

يختار من الفئة التي تتكون من مجموعة أريل، أريل مخلط أحادي الحلقة

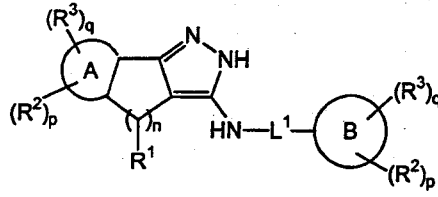
به خمسة أو ستة أعضاء، أريل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء،

ألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مدمج مع

بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث ترتبط مجموعة الأريل المخلط المدمج مع

البنزو، الألكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو أو الألكيل

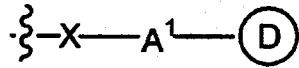
الحلقي المدمج مع البنزو بالجزء على نحو يكفل ارتباط حلقة



من الجزيء؛

الفنيل بشكل مباشر بالجزء

P يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛



و $-X-A^1-Y-A^2$ ؛

R^2 يختار من الفئة التي تتكون من

حيث،

X و Y غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من

$-NH-$ ، $-O-$ ، $-N(\text{الكيل})-$ ، $-S-$ ، $-SO-$ ، $-SO_2-$ ، $-OC(=O)-$ ، $-C(=O)O-$ ، $-NHC(=O)-$ ،

$-C(=O)N(\text{الكيل})-$ ، $-OC(=O)N(\text{الكيل})-$ ، $-OC(=O)O-$ ، $-NHC(=O)O-$ ،

$-OC(=O)NH-$ ، $-NHC(=O)NH-$ ، $-OC(=O)N(\text{الكيل})-$ ، $-N(\text{الكيل})C(=O)O-$ ،

$-NHC(=O)N(\text{الكيل})-$ ، $-N(\text{الكيل})C(=O)N(\text{الكيل})-$ ، $-NHC(=O)N(\text{الكيل})-$ ،

$-SO_2NH-$ ، $-NHSO_2$ ، $-SO_2N(\text{الكيل})-$ و $-N(\text{الكيل})SO_2$ ؛

A^1 غير موجود أو يختار من الكيل أو الكينيل؛

A^2 يختار من الكيل، الكينيل أو H؛ حيث، عندما يمثل A^1 أو A^2 الكيل أو الكينيل،

فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة

واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من هالوجين، سيانو، هيدروكسي، ألكوكسي،

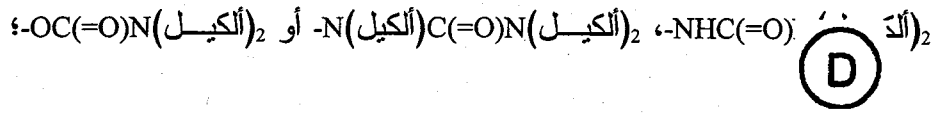
ثيو، ألكوكسي مهلجن، ألكيل $-OC(=O)-$ ، ألكيل $-OC(=O)O-$ ، أمينو، ألكيل أمينو،

ألكيل $-NHC(=O)-$ ، ألكيل $-C(=O)N(\text{الكيل})-$ ، ثنائي ألكيل أمينو، $-NHC(=O)NH_2$ ،

$-NHC(=O)NH(\text{الكيل})-$ ، ألكيل $-C(=O)NH(\text{الكيل})-$ ، $-NHC(=O)NH_2$ ، ألكيل $-NHC(=O)NH_2$ ،

$-OC(=O)NH$ ، ألكيل $-NHC(=O)O-$ ، ألكيل $-C(=O)O(\text{الكيل})-$ ، ألكيل $-NHSO_2$ ،

ألكيل $-SO_2N(\text{الكيل})-$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل $-SO_2$ ، ألكيل $-SO_2$ مهلجن،



٣٣

يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير

٣٤

مشبعة جزئياً، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو

٣٥

عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث

٣٦

يمكن أن يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل

٣٧

المخلط، الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي

٣٨

المخلط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من

٣٩

هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي،

٤٠

ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})$ ، أو ثاني ألكيل

٤١

أمينو، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{الكيل})$ ،

٤٢

$\text{OC}(=\text{O})\text{NH}(\text{الكيل})$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{الكيل})$ ، ألكيل NHSO_2 ،

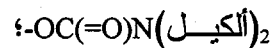
٤٣

ألكيل $\text{SO}_2(\text{الكيل})$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ، ألكيل -

٤٤

SO_2 مهلجن، $_2(\text{الكيل})\text{N}(\text{الكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})_2$ أو

٤٥



٤٦

q يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛

٤٧

R^3 يختار من الفئة التي تتكون من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو،

٤٨

سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل -

٤٩

$\text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الكيل})$ ، أو ثاني ألكيل أمينو، -

٥٠

$\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{الكيل})$ ، ألكيل -

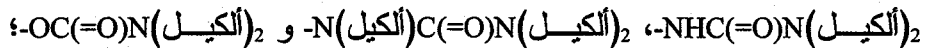
٥١

$\text{OC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{الكيل})$ ، ألكيل NHSO_2 ،

٥٢

ألكيل $\text{SO}_2(\text{الكيل})$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ، ألكيل مهلجن،

٥٣



٥٤

شريطة أن يكون حاصل جمع p و q مساوياً لعدد صحيح تتراوح قيمته من صفر إلى

٥٥

٤٤

٥٦

١٢١. موجود أو يختار من الفئة التي تتكون من ألكيل؛

(B)

٥٧

يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير

٥٨

مشبعة جزئياً، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة

٥٩

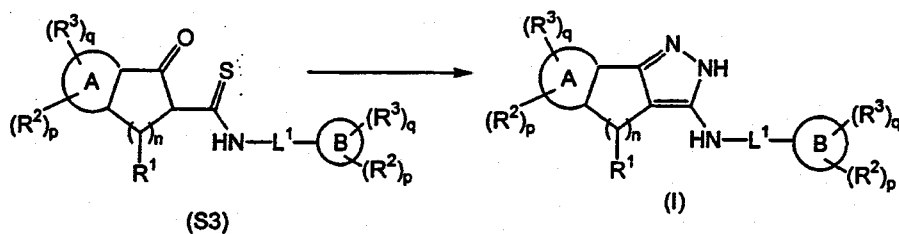
أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛

٦٠

أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه،

٦١

تتضمن:



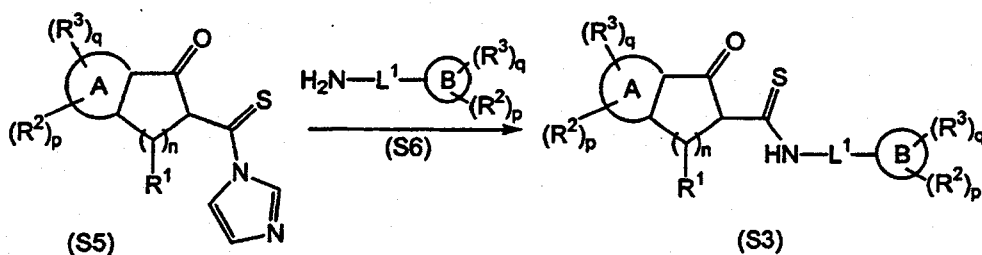
٦٢

٦٣

مفاعلة مركب بالصيغة (S3) مع هيدرازين، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (I).

١

٧٢- العملية وفقاً لعنصر الحماية ٧١، تتضمن أيضاً



٢

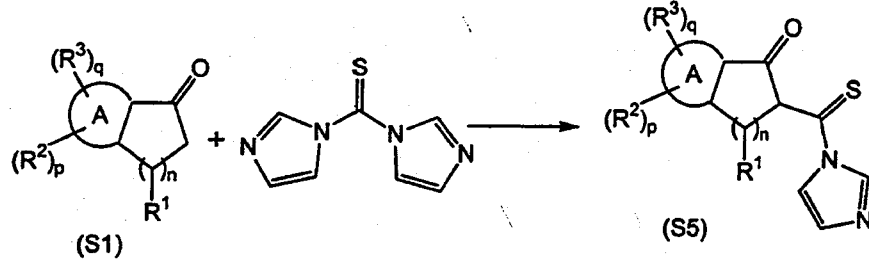
٣

مفاعلة مركب بالصيغة (S5) مع مركب بالصيغة (S6)، في مذيب لا بروتوني، لإنتاج

٤

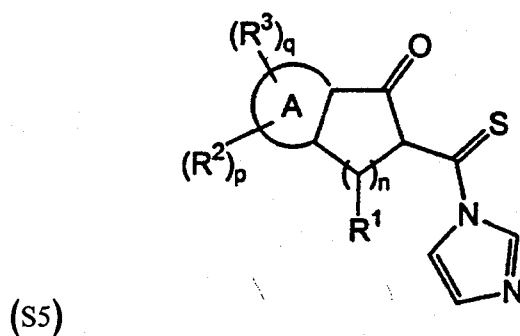
١ المركب المقابل بالصيغة (S3).

٧٣- العملية وفقاً لعنصر الحماية ٧٢، تتضمن أيضاً



٣ مفاعلة مركب بالصيغة (S1) مع ١،١'-ثيوكربونيل إيميدازول، في وجود قاعدة، في
٤ مذيب لا بروتوني، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (S5).

٧٤- عملية لتحضير مركب بالصيغة (S5):



حيث:

n يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من ١ إلى ٤؛

R¹ يختار من الفئة التي تتكون من هيدروجين، ألكيل منخفض، -OH،

ألكوكسي، أكسو، -NH₂، (ألكيل)-NH، و (ألكيل)₂-N؛

A يختار من الفئة التي تتكون من مجموعة أريل، أريل مخطط أحادي

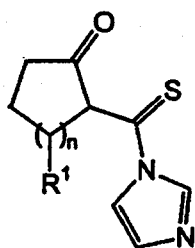
الحلقة به خمسة أو ستة أعضاء، أريل مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة

أعضاء، ألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي

مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث ترتبط مجموعة الأريل المخطط

المدمج مع البنزو، الألكيل الحلقي المخطط المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المدمج

مع البنزو بالجزيء على نحو يكفل ارتباط حلقة الفينيل بشكل



ن الجزيء؛

مباشر بالجزء

P يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

١٤

١٥

R^2 يختار من الفئة التي تتكون من $\text{X}-\text{A}^1-\text{Y}-\text{A}^2$ و $\text{X}-\text{A}^1-\text{D}$ ؛

حيث،

١٦

X و Y غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من

١٧

$-\text{NHC}(=\text{O})-$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})-$ ، $-\text{SO}_2-$ ، $-\text{SO}-$ ، $-\text{S}-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، $-\text{NH}-$ ، $-\text{O}-$

١٨

$-\text{NHC}(=\text{O})\text{O}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})\text{O}-$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})-$

١٩

$-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})\text{NH}-$

٢٠

$-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})-$

٢١

$-\text{SO}_2\text{N}(\text{ألكيل})-$ و $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{SO}_2-$ ، $-\text{SO}_2\text{NH}-$ ، $-\text{NHSO}_2-$ ؛

٢٢

A^1 غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛

٢٣

A^2 يختار من ألكيل، ألكينيل أو H؛ حيث، عندما يمثل A^1 أو A^2 ألكيل أو ألكينيل،

٢٤

فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة

٢٥

واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من هالوجين، سيانو، هيدروكسي، ألكوكسي،

٢٦

ثيو، ألكوكسي مهلجن، ألكيل $-\text{OC}(=\text{O})-$ ، ألكيل $-\text{OC}(=\text{O})\text{O}-$ ، أمينو، ألكيل

٢٧

أمينو، ألكيل $-\text{NHC}(=\text{O})-$ ، ألكيل $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})-$ ، ثاني ألكيل أمينو، -

٢٨

$-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ ألكيل $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ،

٢٩

$-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ألكيل $-\text{OC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $-\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ،

٣٠

ألكيل $-\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ألكيل $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{SO}_2$ ، ألكيل $-\text{NHSO}_2$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل

٣١

مهلجن، ألكيل $-\text{SO}_2$ ، ألكيل $-\text{SO}_2$ مهلجن، $-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ،

٣٢

$-\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ أو $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ؛

٣٣

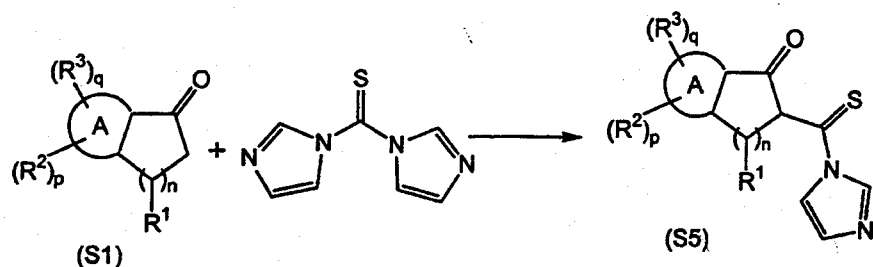
٣٤

يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير



٣٥

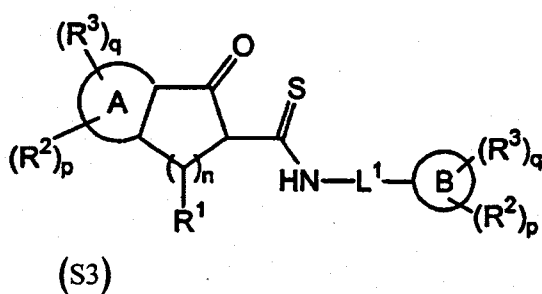
- ٣٦ مشبعة جزئياً، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو
- ٣٧ عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث
- ٣٨ يمكن أن يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل
- ٣٩ المخلط، الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي
- ٤٠ المخلط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من
- ٤١ هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي،
- ٤٢ ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل NHC(=O) ، ألكيل C(=O)(الكيل)N ، أو ثاني ألكيل
- ٤٣ أمينو، NHC(=O)NH_2 ، ألكيل NHC(=O)NH ، ألكيل C(=O)NH(الكيل)N ،
- ٤٤ (الكيل)OC(=O)NH ، ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل C(=O)O(الكيل)N ، ألكيل NHSO_2 ،
- ٤٥ ألكيل $\text{SO}_2(الكيل)N$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ،
- ٤٦ ألكيل SO_2 مهلجن، NHC(=O)N(الكيل)_2 ، C(=O)N(الكيل)N ، أو
- ٤٧ OC(=O)N(الكيل)_2 ؛
- ٤٨ q يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛
- ٤٩ R^3 يختار من الفئة التي تتكون من هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو،
- ٥٠ سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل-
- ٥١ NHC(=O) ، ألكيل C(=O)(الكيل)N ، أو ثاني ألكيل أمينو، -
- ٥٢ NHC(=O)NH_2 ، ألكيل NHC(=O)NH ، ألكيل C(=O)NH(الكيل)N ، ألكيل-
- ٥٣ OC(=O)NH ، ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل C(=O)O(الكيل)N ، ألكيل NHSO_2 ،
- ٥٤ ألكيل $\text{SO}_2(الكيل)N$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ، ألكيل مهلجن،
- ٥٥ NHC(=O)N(الكيل)_2 ، C(=O)N(الكيل)N و OC(=O)N(الكيل)_2 ؛
- ٥٦ شريطة أن يكون حاصل جمع p و q مساوياً لعدد صحيح تتراوح قيمته من صفر إلى
- ٥٧ ٤؛
- ٥٨ أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه؛
- ٥٩ تتضمن



٦٠

٦١ مفاعلة مركب بالصيغة (S1) مع ١،١-ثيوكربونيل إيميدازول، في وجود قاعدة، في
٦٢ مذيب لا بروتوني، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (S5).

١ ٧٥- عملية لتحضير مركب بالصيغة (S3):



٢

٣ حيث:

٤ n يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من ١ إلى ٤؛

٥ R¹ يختار من الفئة التي تتكون من هيدروجين، ألكيل منخفض، -OH،

٦ ألكوكسي، أكسو، -NH₂، (ألكيل)-NH، و (ألكيل)₂-N؛

٧ ختار من الفئة التي تتكون من مجموعة أريل، أريل مخلط أحادي الحلقة

(A)

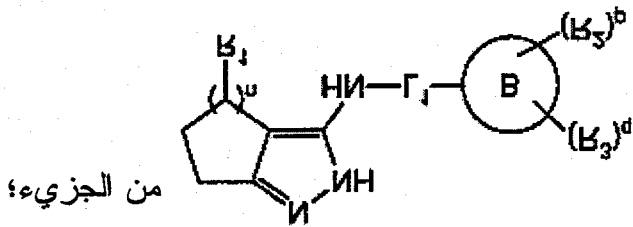
٨ به خمسة أو ستة أعضاء، أريل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء،

٩ الأكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء والأكيل حلقي مدمج مع

١٠ بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث ترتبط مجموعة الأريل المخلط المدمج مع

١١ البنزو، الأكيل الحلقي المخلط المدمج مع البنزو أو الأكيل الحلقي

١٢ المدمج مع البنزو بالجزء على نحو يكفل ارتباط حلقة



الفنيل بشكل مباشر بالجزء

P يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

١٥ R^2 يختار من الفئة التي تتكون من $\text{X}-A^1-\text{Y}-A^2$ و $\text{X}-A^1$ (D) حيث،

١٦ X و Y غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من

١٧ -NHC(=O)-، -C(=O)O-، -OC(=O)-، -SO₂-، -SO-، -S-، -N(الكيل)-، -NH-، -O-

١٨ -NHC(=O)O-، -OC(=O)O-، -C(=O)N(الكيل)-، -C(=O)NH-، -N(الكيل)C(=O)-

١٩ -NHC(=O)NH-، -OC(=O)N(الكيل)-، -N(الكيل)C(=O)O-، -OC(=O)NH-

٢٠ -NHC(=O)N(الكيل)-، -N(الكيل)C(=O)NH-، -NHC(=O)N(الكيل)-، -N(الكيل)C(=O)N(الكيل)-

٢١ -NHC(=O)N(الكيل)-، -N(الكيل)C(=O)NH-، -NHC(=O)N(الكيل)-، -N(الكيل)C(=O)N(الكيل)-

٢٢ A^1 غير موجود أو يختار من الكيل أو الكينيل؛

٢٣ A^2 يختار من الكيل، الكينيل أو H؛ حيث، عندما يمثل A^1 أو A^2 الكيل أو الكينيل،

٧

٨

٩

١٠

١١

١٢

١٣

١٤

١٥

١٦

١٧

١٨

١٩

٢٠

٢١

٢٢

٢٣

٢٤

- ٢٥ فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة
- ٢٦ واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من هالوجين، سيانو، هيدروكسي، ألكوكسي،
- ٢٧ ثيو، ألكوكسي مهلجن، ألكيل-OC(=O)-، ألكيل-OC(=O)-، أمينو، ألكيل
- ٢٨ أمينو، ألكيل-NHC(=O)-، ألكيل-C(=O)N(الـ)، ثاني ألكيل أمينو، -NHC(=O)NH₂-،
- ٢٩ -الـ-NHC(=O)NH-، ألكيل-NH-C(=O)N(الـ)-، -N-C(=O)NH₂-، ألكيل-NH-C(=O)NH₂-،
- ٣٠ ألكيل-OC(=O)NH-، ألكيل-NHC(=O)O-، ألكيل-C(=O)O(الـ)-، ألكيل-NHSO₂-،
- ٣١ ألكيل-SO₂N(الـ)-، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل-SO₂-، ألكيل-SO₂-مهلجن،
- ٣٢ -NHC(=O)N(الـ)₂-، -N(الـ)C(=O)N(الـ)- أو -OC(=O)N(الـ)₂-؛

٣٣ يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير



- ٣٤ مشبعة جزئياً، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو
- ٣٥ عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث
- ٣٦ يمكن أن يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل
- ٣٧ المخلط، الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي
- ٣٨ المخلط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من
- ٣٩ هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي،
- ٤٠ ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل-NHC(=O)-، ألكيل-C(=O)N(الـ)-، أو ثاني ألكيل
- ٤١ أمينو، -NHC(=O)NH₂-، ألكيل-NHC(=O)NH-، ألكيل-NH-C(=O)N(الـ)-،
- ٤٢ (الـ)-OC(=O)NH-، ألكيل-NHC(=O)O-، ألكيل-C(=O)O(الـ)-، ألكيل-NHSO₂-،
- ٤٣ ألكيل-SO₂N(الـ)-، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل-SO₂-، ألكيل-SO₂-مهلجن،
- ٤٤ ألكيل-SO₂-مهلجن، -NHC(=O)N(الـ)₂-، -N(الـ)C(=O)N(الـ)- أو
- ٤٥ -OC(=O)N(الـ)₂-؛

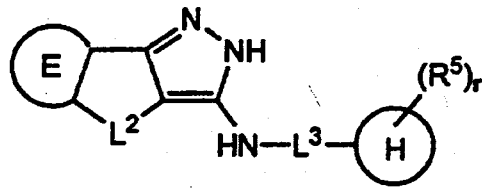
٤٦ q يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛

المركب المقابل بالصيغة (S3).

٦٤

٧٦- عملية لتحضير مركب بالصيغة (IIa):

١



٢

(IIa)

حيث:

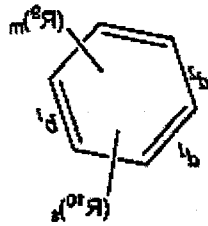
٣

يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:



٤

(الصيغة أ-١)،



٥

حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II) وتحمل بشكل

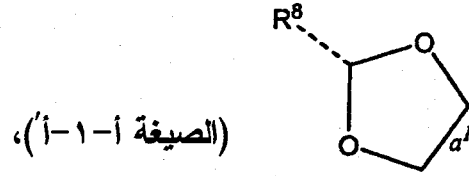
٦

اختياري بديلاً واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-١'، أ-١-ب و

٧

أ-١-ج:

٨



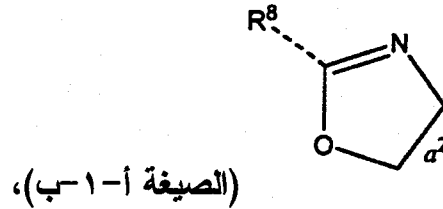
٩

حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ' من جهة a^1 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على

١٠

الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

١١



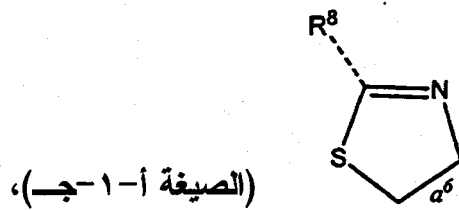
١٢

حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على

١٣

الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و

١٤



١٥

حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين

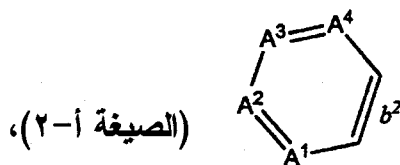
١٦

على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

١٧

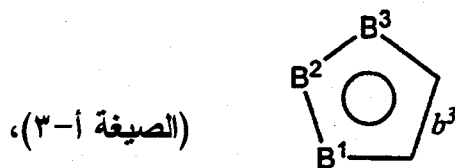
حيث R^8 يمثل H أو ألكيل؛

١٨



١٩

- ٢٠ حيث ترتبط الصيغة أ-٢ من جهة b^2 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، ويمثل A^1 ،
 ٢١ A^2 ، A^3 ، A^4 ؛ -N-(i) أو (ii) -C- يحمل بديلاً من H أو الكوكسي، حيث يمكن أن يحمل
 ٢٢ الألكوكسي أيضاً بشكل اختياري بديلاً من الكوكسي على ذرة كربون طرفية أو ما لا
 ٢٣ يزيد عن ٣ ذرات هالوجين على ذرة كربون طرفية؛ شريطة أن يمثل واحداً على
 ٢٤ الأقل من A^1 ، A^2 ، A^3 ، A^4 أو اثنين على الأكثر -N-؛ و



٢٥

- ٢٦ حيث ترتبط الصيغة أ-٣ من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، ويمثل كل من B^1 ،
 ٢٧ B^2 و B^3 على حدة (i) -CH- يحمل بشكل اختياري بديلاً من الأكيل، أريل، الكوكسي
 ٢٨ أو هالوجين، (ii) -S-؛ (iii) -O-؛ أو (iv) -N-؛ شريطة أن واحداً على الأكثر من
 ٢٩ B^1 ، B^2 أو B^3 يمثل -S- أو -O-، و، شريطة أنه عندما B^1 ، B^2 أو B^3 يمثل -S- أو -
 ٣٠ O- فإن أعضاء الحلقة المجاورة لا تمثل -S- أو -O-؛
 ٣١ R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: الكوكسي، الأكيل، الأكيل أمينو،
 ٣٢ أمينو، سيانو، ثاني الأكيل أمينو، هالوجين، الأكيل مهلجن، الأكيلوكسي مهلجن،
 ٣٣ الأكيل SO_2 -مهلجن، ثيو الأكيل مهلجن، هيدروكسي، الأكيل $C(=O)$ (الأكيل)-N،
 ٣٤ N_2 (الأكيل) $C(=O)N$ (الأكيل)-N، الأكيل $C(=O)NH$ (الأكيل)-N، الأكيل $C(=O)O$ (الأكيل)-N،

- ٣٥ ألكيل SO_2 (ألكيل) N ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ (ألكيل) $_2$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ،
- ٣٦ ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل NHSO_2 ، نترو،
- ٣٧ $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ (ألكيل) $_2$ ، ألكيل $\text{OC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $\text{OC}(=\text{O})$ ، ألكيل SO_2 ، ثيو وثيو ألكيل؛
- ٣٨ L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون
- ٣٩ من: $-(\text{CH}_2)_{1-4}$ ، $-\text{CH}(\text{R}^{100})-$ ، $-\text{C}(=\text{R}^{100})-$ ، $-\text{C}(\text{R}^{100})_2-$ ، $-\text{O}-$ ، $-\text{O}(\text{CH}_2)_{1-4}$ ،
- ٤٠ $-\text{OCH}(\text{R}^{100})-$ ، $-\text{OC}(\text{R}^{100})_2-$ ، $-\text{S}-$ ، $-\text{NH}-$ ، (ألكيل منخفض) N ، (ألكيل CO) N ،
- ٤١ (أريل) N ، (ألكيل CO_2) N ، (ألكيل CONH) N ، (ألكيل SO_2) N و
- ٤٢ (أريل SO_2) N ؛ حيث يحمل R^{100} بديلاً واحداً أو بديلين يختار كل منهما على حدة من:
- ٤٣ ألكيل، هيدروكسي، أريل، ألكوكسي، أكسو، NH_2 ، N (ألكيل) N (ألكيل)، $\text{NHC}(=\text{O})$ ، $\text{N}(\text{OH})$
- ٤٤ أو NH_2OH ؛ شريطة أنه عندما L_2 يمثل $-\text{OCH}(\text{R}^{100})-$ ، R^{100} يمثل ألكوكسي،

٤٥ و H يمثل فنيل، فإن R^5 لا يمثل $-\text{C}(=\text{O})\text{NH-NH}_2$ ؛

٤٦ R^{10} يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من

$\text{X}^1 - \text{A}^{20} - \text{G}$ حيث G يمثل فنيل، فإن R^5 لا يمثل $-\text{C}(=\text{O})\text{NH-NH}_2$ ؛

$\text{X}^1 - \text{A}^{20} - \text{Y}^1 - \text{A}^{21}$ ؛

- ٤٧
- ٤٨ حيث X^1 و Y^1 غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي
- ٤٩ تتكون من: (ألكيل) $\text{C}(=\text{O})\text{N}$ (ألكيل)، (ألكيل) $\text{C}(=\text{O})\text{N}$ (ألكيل)، $\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ ، $\text{C}(=\text{O})\text{N}$ (ألكيل)،
- ٥٠ $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ، (ألكيل) N ، (ألكيل) $\text{C}(=\text{O})$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، (ألكيل) $\text{C}(=\text{O})\text{N}$ ، (ألكيل) $\text{C}(=\text{O})\text{N}$ ،
- ٥١ $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ،
- ٥٢ $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ،
- ٥٣ $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ،
- ٥٤ $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ،
- ٥٥ $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}$ ،

- ٥٦ حيث عندما يمثل A^{20} أو A^{21} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل أو
 ٥٧ الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:
 ٥٨ ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن،
 ٥٩ ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل $C(=O)(\text{ألكيل})N$ ،
 ٦٠ $(\text{ألكيل})_2C(=O)N(\text{ألكيل})$ ، $N(\text{ألكيل})C(=O)NH_2$ ، ألكيل $C(=O)NH(\text{ألكيل})$ ،
 ٦١ N ، ألكيل $C(=O)O(\text{ألكيل})N$ ، ألكيل $SO_2(\text{ألكيل})N$ ، ألكيل $NHC(=O)$ ،
 ٦٢ $(\text{ألكيل})_2NHC(=O)$ ، $NHC(=O)NH_2$ ، ألكيل $NHC(=O)NH$ ، ألكيل
 ٦٣ $NHC(=O)O$ ، ألكيل $NHSO_2$ ، ألكيل $OC(=O)$ ، $(\text{ألكيل})_2NOC(=O)$ ،
 ٦٤ ألكيل $OC(=O)NH$ ، ألكيل $OC(=O)O$ ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل؛

٦٥ **G** يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير

- ٦٦ مشبعة جزئياً، أريل مخطط، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة
 ٦٧ أو عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛
 ٦٨ حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل
 ٦٩ المخطط، الألكيل الحلقي المخطط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي
 ٧٠ المخطط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من
 ٧١ هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي،
 ٧٢ ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل $NHC(=O)$ ، ألكيل $C(=O)(\text{ألكيل})N$ ، أو ثاني
 ٧٣ ألكيل أمينو، $NHC(=O)NH_2$ ، ألكيل $NHC(=O)NH$ ، ألكيل $C(=O)NH(\text{ألكيل})N$ ،
 ٧٤ ألكيل $OC(=O)NH$ ، ألكيل $NHC(=O)O$ ، ألكيل $C(=O)O(\text{ألكيل})N$ ،
 ٧٥ ألكيل $NHSO_2$ ، ألكيل $SO_2(\text{ألكيل})N$ ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ،
 ٧٦ ألكيل SO_2 مهلجن، $(\text{ألكيل})_2NHC(=O)$ ، $(\text{ألكيل})_2NOC(=O)(\text{ألكيل})N$ أو

٧٧ $(\text{الكيل})_2\text{N}(\text{OC}=\text{O})-$ ؛

٧٨ s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

٧٩ m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما لا يحمل

٨٠ (E) بديلاً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل

٨١ جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤، وعندما يحمل

٨٢ (E) بديلاً واحداً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل

٨٣ جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

٨٤ L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من ألكيل

٨٥ دييل، كربونيل أو $-\text{SO}_2-$ ؛

٨٦ (H) يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير مشبعة

٨٧ جزئياً، أركيل، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة

٨٨ أو عشرة أعضاء، أريل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء، وألكيل

٨٩ حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛

٩٠ r يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ و

٩١ R^5 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكيل، ألكيل أمينو، ألكيلوكسي،

٩٢ أمينو، $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $-\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ، $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ ، $-\text{CH}_2\text{OH}$ ، سيانو، ثاني ألكيل

٩٣ أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل

- ٩٤ مهلجن، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل C(=O) (ألكيل) N-،
 ٩٥ $(\text{ألكيل})_2\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ (ألكيل) N-،
 ٩٦ ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ (ألكيل) N-، ألكيل SO_2 (ألكيل) N-، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ،
 ٩٧ $(\text{ألكيل})_2\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ألكيل، $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ألكيل،
 ٩٨ ألكيل NHSO_2 ، نيترو، $(\text{ألكيل})_2\text{N}(\text{ألكيل})\text{OC}(=\text{O})$ ، ألكيل $\text{NH}(\text{ألكيل})\text{OC}(=\text{O})$ ، ألكيل SO_2 ، SO_2NH_2 ،

٩٩ ثيو، ثيو ألكيل، $\text{F} \text{---} \text{B}^{10} \text{---} \text{V} \text{---} \text{B}^{20} \text{---} \text{W} \text{---} \text{V}$ ؛ حيث

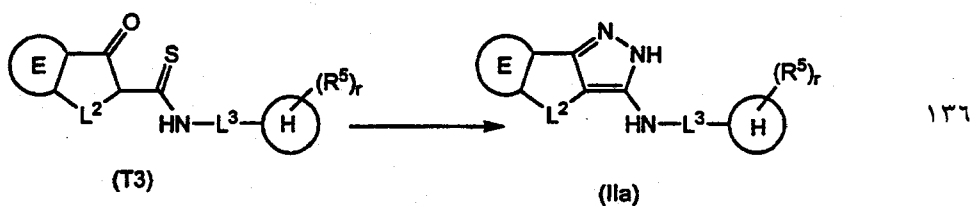
- ١٠٠ W و V غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي تتكون من:
 ١٠١ $\text{C}(=\text{O})$ ، $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، $\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ ، $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})$ ، $\text{C}(=\text{O})$ (ألكيل) N-،
 ١٠٢ N، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ،
 ١٠٣ $\text{SO}_2\text{N}(\text{ألكيل})$ ، NH ، $\text{NHC}(=\text{O})$ ، $\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ،

- ١٠٤ $-\text{OC}(=\text{O})$ ، $-\text{O}-$ ، $-\text{NHSO}_2-$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{O}-$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}-$
- ١٠٥ $-\text{SO}_2-$ ، $-\text{SO}-$ ، $-\text{S}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})\text{O}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})\text{NH}-$ ، $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{الـكـيـل})-$
- ١٠٦ $-\text{SO}_2\text{NH}-$ و $-\text{SO}_2\text{N}(\text{الـكـيـل})-$
- ١٠٧ B^{10} غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛
- ١٠٨ B^{20} غير موجود أو يختار من ألكيل، ألكينيل أو H؛
- ١٠٩ حيث عندما يمثل B^{10} أو B^{20} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الألكيل
- ١١٠ أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:
- ١١١ ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي
- ١١٢ مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي،
- ١١٣ ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الـكـيـل})$ ، $\text{N}(\text{الـكـيـل})_2\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الـكـيـل})$ ،
- ١١٤ $\text{NH}_2\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{الـكـيـل})$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{الـكـيـل})$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{الـكـيـل})$ ،
- ١١٥ ألكيل $\text{SO}_2(\text{الـكـيـل})$ ، ألكيل $-\text{NHC}(=\text{O})$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{N}(\text{الـكـيـل})_2$ ، $-\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ،
- ١١٦ ألكيل $-\text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل $-\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيل $-\text{NHSO}_2$ ، ألكيل $-\text{OC}(=\text{O})$ ،
- ١١٧ $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{الـكـيـل})_2$ ، ألكيل $-\text{OC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $-\text{OC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيل $-\text{SO}_2$ ، ثيو أو ثيو
- ١١٨ ألكيل؛ و

١١٩ (F) يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير

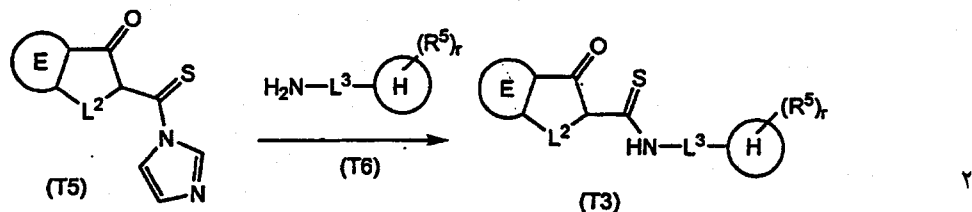
- ١٢٠ مشبعة جزئياً، أريل مخطط، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو
- ١٢١ عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء،
- ١٢٢ حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل
- ١٢٣ المخطط، الألكيل الحلقي المخطط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي
- ١٢٤ المخطط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة
- ١٢٥ من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي
- ١٢٦ مهلجن، ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، أريل

- ١٢٧ مخطط، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل $C(=O)N$ (ألكيل)، $-N$
- ١٢٨ $_2$ (ألكيل) $N(=O)C(=O)NH$ ألكيل، $-N$ (ألكيل) $C(=O)N$ (ألكيل)، $-N$
- ١٢٩ ألكيل $O(=O)C(=O)N$ (ألكيل)، $-N$ ألكيل SO_2 (ألكيل)، $-NHC(=O)$ ألكيل، $-NHC(=O)$
- ١٣٠ $_2$ (ألكيل) $N(=O)NHC(=O)$ ، $-NHC(=O)NH_2$ ألكيل $NHC(=O)NH$ ، ألكيل $O(=O)-$
- ١٣١ NHC ألكيل SO_2NH ، نثرو، $_2$ (ألكيل) $N(=O)OC$ ، ألكيل $OC(=O)NH$ ، ألكيل-
- ١٣٢ SO_2 ، ثيو أو ثيو ألكيل؛
- ١٣٣ أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه؛
- ١٣٤ تتضمن:
- ١٣٥ مفاعلة مركب بالصيغة (T3) مع هيدرازين،



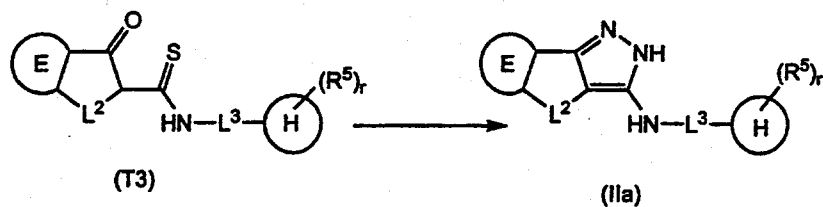
- ١٣٦ لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (IIa).

١ ٧٧- العملية وفقاً لعنصر الحماية ٧٦، تتضمن أيضاً



- ٢ مفاعلة مركب بالصيغة (T5) مع مركب بالصيغة (T6)، في مذيب لابتوتوني، لإنتاج
- ٣ المركب المقابل بالصيغة (T3).
- ٤

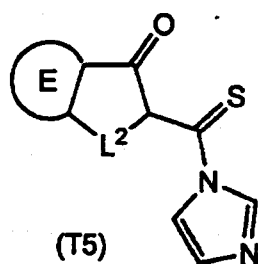
٧٨- العملية وفقاً لعنصر الحماية ٧٧، تتضمن أيضاً



٣ مفاعلة مركب بالصيغة (T1) مع ١،١'-ثيوكربونيل ثاني إيميدازول، في وجود

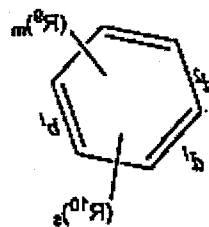
٤ قاعدة، في مذيب لا بروتوني، لإنتاج المركب المقابل بالصيغة (T5)؛

٧٩- عملية لتحضير مركب بالصيغة (T5):



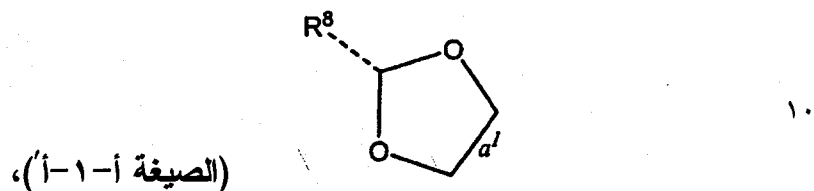
حيث:

٥ يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:

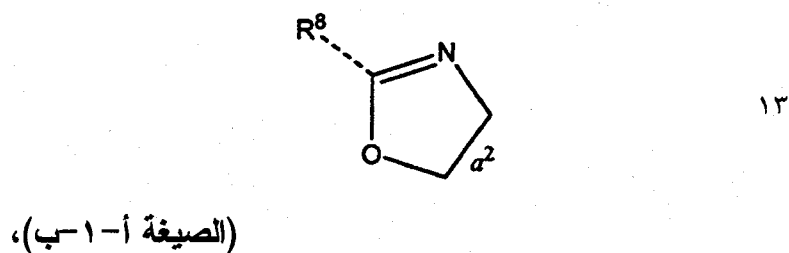


(الصيغة أ-١)،

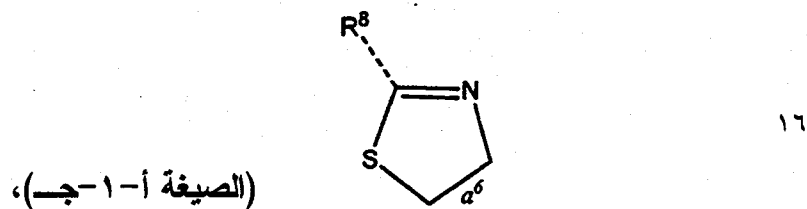
- ٧ حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II) وتحمل بشكل
٨ اختياري بديلاً واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١-أ'، أ-١-ب و
٩ أ-١-ج:



- ١١ حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ' من جهة a^1 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على
١٢ الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛



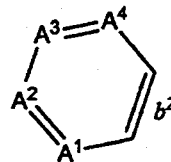
- ١٤ حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على
١٥ الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و



- ١٤ حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين
١٨ على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

حيث R^8 يمثل H أو ألكيل؛

١٩



(الصيغة أ-٢)،

٢٠

حيث ترتبط الصيغة أ-٢ من جهة b^2 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، ويمثل A^1 ،

٢١

A^2 ، A^3 ، A^4 ؛ (i) -N-؛ أو (ii) -C- يحمل بديلاً من H أو ألكوكسي، حيث يمكن أن يحمل

٢٢

الألكوكسي أيضاً بشكل اختياري بديلاً من ألكوكسي على ذرة كربون طرفية أو ما لا

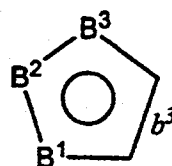
٢٣

يزيد عن ٣ ذرات هالوجين على ذرة كربون طرفية؛ شريطة أن يمثل واحداً على

٢٤

الأقل من A^1 ، A^2 ، A^3 ، A^4 أو اثنين على الأكثر -N-؛ و

٢٥



(الصيغة أ-٣)،

٢٦

حيث ترتبط الصيغة أ-٣ من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، ويمثل كل من B^1 ،

٢٧

B^2 و B^3 على حدة (i) -CH- يحمل بشكل اختياري بديلاً من ألكيل، أريل، ألكوكسي

٢٨

أو هالوجين، (ii) -S-؛ (iii) -O-؛ أو (iv) -N-؛ شريطة أن واحداً على الأكثر من

٢٩

B^1 ، B^2 أو B^3 يمثل -S- أو -O-، و، شريطة أنه عندما B^1 ، B^2 أو B^3 يمثل -S- أو -

٣٠

O- فإن أعضاء الحلقة المجاورة لا تمثل -S- أو -O-؛

٣١

R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: ألكوكسي، ألكيل، ألكيل أمينو،

٣٢

أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكيل مهلجن، ألكيلوكسي مهلجن، ألكيل-

٣٣

SO_2 مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل $C(=O)$ (ألكيل)-N،

٣٤

N (ألكيل) $C(=O)N$ (ألكيل)-N، ألكيل $C(=O)NH$ (ألكيل)-N،

٣٥

- ٣٦ الأكيل C(=O)O(الكيل)N-، الأكيل SO₂(الكيل)N-، الأكيل NHC(=O)-،
 ٣٧ (الكيل)₂N(الكيل)NHC(=O)-، NHC(=O)NH₂-، الأكيل NHC(=O)NH-،
 ٣٨ الأكيل O(الكيل)NHC(=O)-، الأكيل NHSO₂-، نثرو، (الكيل)₂-،
 ٣٩ OC(=O)N، الأكيل NH(=O)OC-، الأكيل SO₂-، ثيو وثيو أكيل؛
 ٤٠ L² يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون
 ٤١ من: -(CH₂)₁₋₄، -CH(R¹⁰⁰)، -C(=R¹⁰⁰)، -C(R¹⁰⁰)₂، -O-، -O(CH₂)₁₋₄،
 ٤٢ -OCH(R¹⁰⁰)، -OC(R¹⁰⁰)₂، -S-، -NH-، (الكيل منخض)N-، (الكيل CO)N-،
 ٤٣ -N(ريل)N-، (الكيل CO₂)N-، (الكيل CONH)N-، (الكيل SO₂)N- و
 ٤٤ (ريل SO₂)N-؛ حيث R¹⁰⁰ يختار من: الأكيل، هيدروكسي، ريل، الكوكسي، أكسو، -
 ٤٥ NH₂، (الكيل)N(الكيل)NH-، N(OH)= أو NH₂OH؛

٤٦ R¹⁰ يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من $\sum_{i=1}^2 X^1-A^{20}-G$ و

٤٧ ؛-X¹-A²⁰-Y¹-A²¹

- ٤٨ حيث X¹ و Y¹ غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي
 ٤٩ تتكون من: -(الكيل)N(الكيل)C(=O)-، -(الكيل)N(الكيل)C(=O)-، -C(=O)NH-،
 ٥٠ O-OC(=O)-، -(الكيل)N(الكيل)C(=O)-، -N(الكيل)C(=O)NH-،
 ٥١ O-OC(=O)N(الكيل)-، -N(الكيل)SO₂-، -NH-، -NHC(=O)-،
 ٥٢ -(الكيل)N(الكيل)NHC(=O)-، -NHC(=O)NH-، -NHC(=O)O-، -NHSO₂-، -O-،
 ٥٣ OC-، -(الكيل)N(الكيل)OC(=O)-، -OC(=O)NH-، -OC(=O)O-، -S-، -SO-، -SO₂-،
 ٥٤ -(الكيل)N(الكيل)SO₂- و -SO₂NH-؛

٥٥ A²⁰ غير موجود أو يختار من الأكيل أو ألكينيل؛ و

٥٦ A²¹ يختار من الأكيل، ألكينيل أو H؛

- ٥٧ حيث عندما يمثل A²⁰ أو A²¹ أكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الأكيل أو
 ٥٨ الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:
 ٥٩ ألكوكسي، أكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني الأكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن،

- ٦٠ ألكيل SO_2 -مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل $\text{C}(=\text{O})$ (ألكيل)-N،
 ٦١ $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{ألكيل})$ -N،
 ٦٢ ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{ألكيل})$ -N، ألكيل $\text{SO}_2(\text{ألكيل})$ -N، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ،
 ٦٣ $\text{N}(\text{ألكيل})\text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل-
 ٦٤ $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيل NHSO_2 ، ألكيل $\text{OC}(=\text{O})$ ، $(\text{ألكيل})_2$ ،
 ٦٥ $\text{OC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $\text{OC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو
 ٦٦ ألكيل؛

٦٧ (G) يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير

- ٦٨ مشبعة جزئياً، أريل مخطط، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو
 ٦٩ عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث
 ٧٠ يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخطط،
 ٧١ الألكيل الحلقي المخطط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المخطط
 ٧٢ المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من
 ٧٣ هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي،
 ٧٤ ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})$ (ألكيل)-N، أو ثاني
 ٧٥ ألكيل أمينو، $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}_2$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{ألكيل})$ -N،
 ٧٦ ألكيل $\text{OC}(=\text{O})\text{NH}$ ، ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{ألكيل})$ -N،
 ٧٧ ألكيل NHSO_2 ، ألكيل $\text{SO}_2(\text{ألكيل})$ -N، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ،
 ٧٨ ألكيل SO_2 -مهلجن، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{NHC}(=\text{O})$ ، $\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ -N أو
 ٧٩ $\text{N}(\text{ألكيل})\text{OC}(=\text{O})$ ؛

٨٠ s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

٨١ m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ شريطة أنه عندما لا يحمل

٨٢ يحمل $\textcircled{\text{E}}$ بديلاً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل

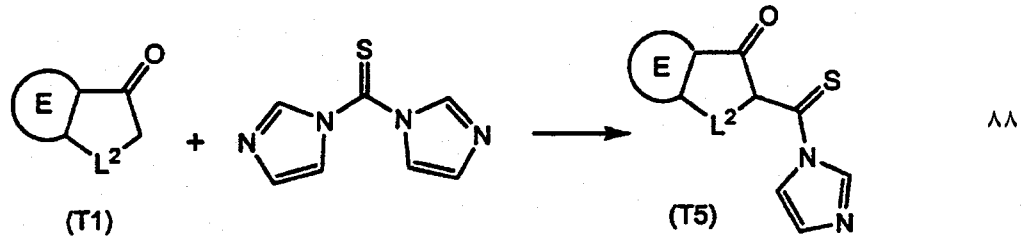
٨٣ جمع s و m يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤، وعندما يحمل

٨٤ $\textcircled{\text{E}}$ بديلاً واحداً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن حاصل

٨٥ جمع s و m يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛

٨٦ أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه؛

٨٧ تتضمن

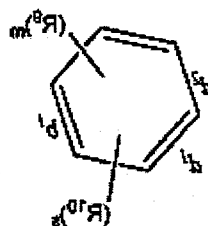


حيث:

٣

(E) يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ-٢ و أ-٣:

٤



٥

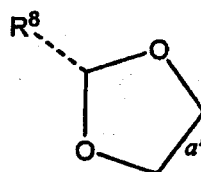
(الصيغة أ-١)،

حيث ترتبط الصيغة أ-١ من جهة b^1 بالحلقة L^2 في الصيغة (II) وتحمل بشكل اختياري بديلاً واحداً يختار من الفئة التي تتكون من الصيغ أ-١، أ'-١، أ-١-ب و أ-١-ج:

٦

٧

٨



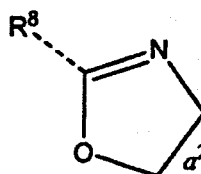
٩

(الصيغة أ-١-أ')،

حيث ترتبط الصيغة أ-١-أ' من جهة a^1 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

١٠

١١

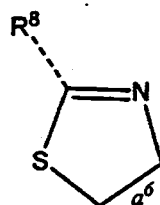


١٢

(الصيغة أ-١-ب)،

١٣ حيث ترتبط الصيغة أ-١-ب من جهة a^2 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين على

١٤ الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛ و



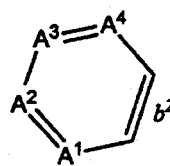
١٥

(الصيغة أ-١-ج)،

١٦ حيث ترتبط الصيغة أ-١-ج من جهة a^6 بذرتي الكربون المتجاورتين الواقعتين

١٧ على الجهة d^1 أو d^2 للصيغة أ-١؛

١٨ حيث R^8 يمثل H أو ألكيل؛



١٩

(الصيغة أ-٢)،

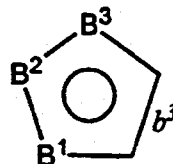
٢٠ حيث ترتبط الصيغة أ-٢ من جهة b^2 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، ويمثل A^1 ،

٢١ A^2 ، A^3 ، A^4 ؛ -N-(i) أو -C- (ii) يحمل بديلاً من H أو ألكوكسي، حيث يمكن أن يحمل

٢٢ الألكوكسي أيضاً بشكل اختياري بديلاً من ألكوكسي على ذرة كربون طرفية أو ما لا

٢٣ يزيد عن ٣ ذرات هالوجين على ذرة كربون طرفية؛ شريطة أن يمثل واحداً على

٢٤ الأقل من A^1 ، A^2 ، A^3 ، A^4 أو اثنين على الأكثر -N-؛ و



٢٥

(الصيغة أ-٣)،

- ٢٦ حيث ترتبط الصيغة أ-٣ من جهة b^3 بالحلقة L^2 في الصيغة (II)، ويمثل كل من B^1 ،
- ٢٧ B^2 و B^3 على حدة (i) -CH- يحمل بشكل اختياري بدلاً من الأكيل، أريل، الكوكسي
- ٢٨ أو هالوجين، (ii) -S-؛ (iii) -O-؛ أو (iv) -N-؛ شريطة أن واحداً على الأكثر من
- ٢٩ B^1 ، B^2 أو B^3 يمثل -S- أو -O-، و، شريطة أنه عندما B^1 ، B^2 أو B^3 يمثل -S- أو -
- ٣٠ -O- فإن أعضاء الحلقة المجاورة لا تمثل -S- أو -O-؛
- ٣١ R^9 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: الأكيل، الأكيل أمينو،
- ٣٢ أمينو، سيانو، ثاني الأكيل أمينو، هالوجين، الأكيل مهلجن، الأكيلوكسي مهلجن،
- ٣٣ الأكيل-SO₂-مهلجن، ثيو الأكيل مهلجن، هيدروكسي، الأكيلC(=O)(الأكيل)-N،
- ٣٤ $_2$ (الأكيل)N(الأكيل)C(=O)NH(الأكيل)-N، الأكيلC(=O)NH(الأكيل)-N،
- ٣٥ الأكيلC(=O)O(الأكيل)-N، الأكيلSO₂(الأكيل)-N، الأكيلNHC(=O)-،
- ٣٦ $_2$ (الأكيل)N(الأكيل)NHC(=O)-، الأكيلNHC(=O)NH(الأكيل)-NHC(=O)-،
- ٣٧ الأكيلO(الأكيل)NHC(=O)-، الأكيلNH(الأكيل)SO₂-، نثرو، $_2$ (الأكيل)N(الأكيل)OC(=O)-،
- ٣٨ الأكيلNH(الأكيل)OC(=O)-، الأكيلSO₂-، ثيو وثيو الأكيل؛
- ٣٩ L^2 يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون
- ٤٠ من: -N-، -(CH₂)₁₋₄-، -CH(R¹⁰⁰)-، -C(=R¹⁰⁰)-، -C(R¹⁰⁰)₂-، -O-، -O(CH₂)₁₋₄-،
- ٤١ -OCH(R¹⁰⁰)-، -OC(R¹⁰⁰)₂-، -S-، -NH-، -الأكيل منخض)-N، -الأكيلCO)-N،
- ٤٢ -أريل)-N، -الأكيلCO₂)-N، -الأكيلCONH)-N، -الأكيلSO₂)-N و
- ٤٣ (أريلSO₂)-N؛ حيث R^{100} يختار من: الأكيل، هيدروكسي، أريل، الكوكسي، أكسو، -
- ٤٤ NH_2 ، $_2$ (الأكيل)-N(الأكيل)-NH، -N(OH) = أو -NH₂OH؛

- ٤٥ R^{10} يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من $\text{---} \text{A}^{20} \text{---} \text{G}$ و $\text{---} \text{X}^1 \text{---} \text{A}^{20} \text{---} \text{Y}^1 \text{---} \text{A}^{21}$
- ٤٦ ؛

- ٤٨ حيث X^1 و Y^1 غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة من الفئة التي
- ٤٩ تتكون من: -الأكيلC(=O)N(الأكيل)-، -الأكيلC(=O)N(الأكيل)-، -C(=O)NH-، -
- ٥٠ -O(الأكيل)C(=O)-، -N(الأكيل)C(=O)-، -N(الأكيل)C(=O)NH-، -N(الأكيل)C(=O)O-

- ٥١ $\text{NHC(=O)-, -NH-, -N(الـكـيـل)SO}_2\text{-, -N(الـكـيـل)C(=O)O-}$
- ٥٢ $\text{-(=O), -O-, -NH-SO}_2\text{-, -NHC(=O)O-, -NHC(=O)NH-, -NHC(=O)N(الـكـيـل)-}$
- ٥٣ $\text{OC-, -SO}_2\text{-, -SO-, -S-, -OC(=O)O-, -OC(=O)NH-, -OC(=O)N(الـكـيـل)-}$
- ٥٤ $\text{-(الـكـيـل)SO}_2\text{N- و -SO}_2\text{NH-}$

٥٥ A^{20} غير موجود أو يختار من ألكيل أو ألكينيل؛ و

٥٦ A^{21} يختار من ألكيل، ألكينيل أو H؛

- ٥٧ حيث عندما يمثل A^{20} أو A^{21} ألكيل أو ألكينيل، فإنه يمكن أن يحمل الألكيل أو
- ٥٨ الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:
- ٥٩ ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي مهلجن،
- ٦٠ ألكيل SO_2 -مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، هيدروكسي، ألكيل $\text{C(=O)(الـكـيـل)-N-}$ ،
- ٦١ $\text{N(الـكـيـل)C(=O)N(الـكـيـل)-}$ ، $\text{N(الـكـيـل)C(=O)NH}_2$ ، ألكيل $\text{C(=O)NH(الـكـيـل)-N-}$ ،
- ٦٢ ألكيل $\text{C(=O)O(الـكـيـل)-N-}$ ، ألكيل $\text{SO}_2(الـكـيـل)-N-$ ، ألكيل NHC(=O)- ،
- ٦٣ $\text{N(الـكـيـل)NHC(=O)-}$ ، ألكيل NHC(=O)NH- ، ألكيل $\text{NHC(=O)NH(الـكـيـل)-}$ ،
- ٦٤ $\text{O(الـكـيـل)NHC(=O)-}$ ، ألكيل NHSO_2- ، ألكيل OC(=O)- ، $\text{N(الـكـيـل)OC(=O)-}$ ،
- ٦٥ ألكيل $\text{NH(الـكـيـل)OC(=O)-}$ ، ألكيل OC(=O)O- ، ألكيل SO_2- ، ثيو أو ثيو ألكيل؛

٦٦ (G) يختار من الفئة التي تتكون من: أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير

- ٦٧ مشبعة جزئياً، أريل مخطط، ألكيل حلقي مخطط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو
- ٦٨ عشرة أعضاء وألكيل حلقي مخطط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛ حيث
- ٦٩ يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل المخطط،
- ٧٠ الألكيل الحلقي المخطط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي المخطط
- ٧١ المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة من
- ٧٢ هالوجين، هيدروكسي، أمينو، ثيو، نترو، سيانو، ألكيل، ألكيل مهلجن، ألكوكسي،
- ٧٣ ألكوكسي مهلجن، ألكيل أمينو، ألكيل NHC(=O)- ، ألكيل $\text{C(=O)(الـكـيـل)-N-}$ ، أو ثاني

- ٧٤ ألكيل أمينو، NHC(=O)NH_2 ، ألكيل NHC(=O)NH ، ألكيل C(=O)NH (ألكيل) N ،
- ٧٥ ألكيل OC(=O)NH ، ألكيل NHC(=O)O ، ألكيل C(=O)O (ألكيل) N ،
- ٧٦ ألكيل NHSO_2 ، ألكيل SO_2 (ألكيل) N ، ثيو ألكيل، ثيو ألكيل مهلجن، ألكيل SO_2 ،
- ٧٧ ألكيل SO_2 مهلجن، NHC(=O)N (ألكيل) $_2$ ، NHC(=O)N (ألكيل) C(=O)N (ألكيل) N ، أو
- ٧٨ OC(=O)N (ألكيل) $_2$ ؛
- ٧٩ s يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛
- ٨٠ m يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛
- ٨١ شريطة أنه عندما لا يحمل (E) بديلاً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج،
- ٨٢ فإن حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤، وعندما
- ٨٣ يحمل (E) بديلاً واحداً من الصيغة أ-١-أ'، أ-١-ب أو أ-١-ج، فإن
- ٨٤ حاصل جمع m و s يساوي عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٢؛
- ٨٥ L^3 غير موجود أو يمثل مجموعة رابطة تختار من الفئة التي تتكون من ألكيل
- ٨٦ دييل، كربونيل أو SO_2 ؛
- ٨٧ يختار من الفئة التي تتكون من أريل، ألكيل حلقي، حلقة كربونية غير (H)
- ٨٨ مشبعة جزئياً، أرالكيل، أريل مخلط، ألكيل حلقي مخلط، ألكيل حلقي مدمج مع بنزو
- ٨٩ به تسعة أو عشرة أعضاء، أريل مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء،
- ٩٠ وألكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء؛
- ٩١ r يمثل عدداً صحيحاً تتراوح قيمته من صفر إلى ٤؛ و

- ٩٢ R^5 يختار كل على حدة من الفئة التي تتكون من: الكيل، الكيل أمينو، الكيلوكسي،
 ٩٣ أمينو، $-C(=O)NH_2$ ، الكيل $-C(=O)O$ ، $-C(=O)OH$ ، $-CH_2OH$ ، سيانو، ثاني الكيل
 ٩٤ أمينو، هالوجين، الكيل مهلجن، الكيلوكسي مهلجن، الكيل $-SO_2$ مهلجن، ثيو الكيل
 ٩٥ مهلجن، هيدروكسي، هيدروكسي الكيل، الكيل $-C(=O)N$ (الكيل)،
 ٩٦ $-N$ (الكيل) $-C(=O)N$ (الكيل)، الكيل $-C(=O)NH$ (الكيل)،
 ٩٧ الكيل $-C(=O)O$ (الكيل)، الكيل $-SO_2$ (الكيل)، الكيل $-NHC(=O)$ ،
 ٩٨ $-NHC(=O)N$ (الكيل)، $-NHC(=O)NH_2$ ، الكيل $-NHC(=O)$ ،
 ٩٩ الكيل $-NHSO_2$ ، نثرو، $-OC(=O)N$ (الكيل)، الكيل $-OC(=O)NH$ ، الكيل $-SO_2NH_2$ ،

١٠٠ ثيو، ثيو الكيل، $\textcircled{F} - B^{10} - V - \textcircled{F}$ ؛ حيث $-V - B^{10} - W - B^{20}$ ؛

- ١٠١ V و W غير موجودين أو يختار كل منهما على حدة
 ١٠٢ من الفئة التي تتكون من: $-C(=O)$ ، $-C(=O)N$ (الكيل)، $-C(=O)NH$ ،
 ١٠٣ $-C(=O)O$ ، $-C(=O)N$ (الكيل)، $-C(=O)NH$ (الكيل)،
 ١٠٤ $-N$ (الكيل) $-C(=O)N$ (الكيل)، $-N$ (الكيل) $-C(=O)NH$ ،
 ١٠٥ $-C(=O)O$ (الكيل)، $-N$ (الكيل) $-SO_2$ ، $-NH$ ، $-NHC(=O)$ ،
 ١٠٦ $-NHC(=O)NH$ ، $-NHC(=O)O$ ، $-NHSO_2$ ، $-O$ ، $-OC(=O)$ ،
 ١٠٧ $-OC(=O)N$ (الكيل)، $-OC(=O)NH$ ، $-OC(=O)O$ ، $-S$ ، $-SO$ ، $-SO_2$ ، $-C(=O)N$ (الكيل)،
 ١٠٨ SO_2N و $-SO_2NH$ ؛

١٠٩ B^{10} غير موجود أو يختار من الكيل أو الكينيل؛

١١٠ B^{20} غير موجود أو يختار من الكيل، الكينيل أو H ؛

- ١١١ حيث عندما يمثل B^{10} أو B^{20} الكيل أو الكينيل، فإنه يمكن أن تحمل مجموعة الأكيل
 ١١٢ أو الألكينيل بشكل اختياري مجموعة بديلة واحدة أو أكثر تختار كل على حدة من:
 ١١٣ الكوكسي، الكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني الكيل أمينو، هالوجين، الكوكسي
 ١١٤ مهلجن، الكيل $-SO_2$ مهلجن، ثيو الكيل مهلجن، هيدروكسي،

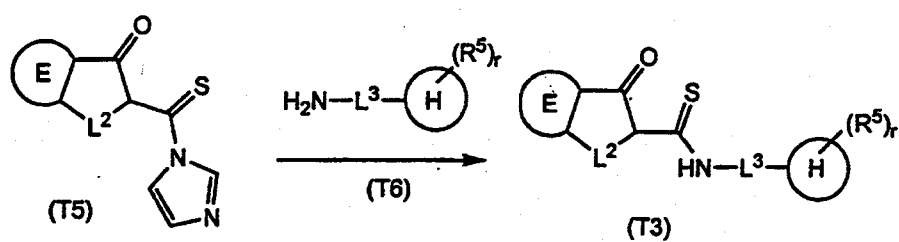
ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})_2$ ، -N(ألكيل) $\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ،	١١٥
$\text{NH}_2\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{ألكيل})$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{ألكيل})$ ، -N(ألكيل) $\text{C}(=\text{O})\text{O}(\text{ألكيل})$ ،	١١٦
ألكيل $\text{SO}_2\text{N}(\text{ألكيل})$ ، -NHC(=O)ألكيل، -NHC(=O)N(ألكيل) $_2$ ، -NHC(=O)NH $_2$ ،	١١٧
ألكيل $\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ ، -NHC(=O)ألكيل، ألكيل $\text{O}(\text{ألكيل})\text{NHC}(=\text{O})$ ، -NH $\text{SO}_2\text{ألكيل}$ ، ألكيل $\text{C}(=\text{O})\text{OC}(=\text{O})$ ،	١١٨
$\text{N}(\text{ألكيل})\text{C}(=\text{O})\text{OC}(=\text{O})$ ، ألكيل $\text{NHOC}(=\text{O})$ ، ألكيل $\text{O}(\text{ألكيل})\text{OC}(=\text{O})$ ، ألكيل SO_2 ، ثيو أو ثيو	١١٩
ألكيل؛ و	١٢٠

١٢١ (F) يختار من الفئة التي تتكوّن من: أريّل، ألكيل حلقّي، حلقة كربونية غير

١٢٢ مشبعة جزئياً، أريل مخلط، الأكيل حلقي مخلط، الأكيل حلقي مدمج مع بنزو به تسعة أو
١٢٣ عشرة أعضاء والأكيل حلقي مخلط مدمج مع بنزو به تسعة أو عشرة أعضاء،
١٢٤ حيث يحمل الأريل، الألكيل الحلقي، الحلقة الكربونية غير المشبعة جزئياً، الأريل
١٢٥ المخلط، الألكيل الحلقي المخلط، الألكيل الحلقي المدمج مع البنزو أو الألكيل الحلقي
١٢٦ المخلط المدمج مع البنزو بشكل اختياري بديلاً واحداً أو أكثر يختار كل على حدة
١٢٧ من: ألكوكسي، ألكيل أمينو، أمينو، سيانو، ثاني ألكيل أمينو، هالوجين، ألكوكسي
١٢٨ مهلجن، ألكيل مهلجن، ألكيل-SO₂-مهلجن، ثيو ألكيل مهلجن، أريل
١٢٩ مخلط، هيدروكسي، هيدروكسي ألكيل، ألكيل C(=O) (ألكيل)-N،
١٣٠ $(\text{ألكيل})_2\text{C(=O)N(ألكيل)-N}$ ، ألكيل C(=O)NH (ألكيل)-N،
١٣١ ألكيل C(=O)O (ألكيل)-N، ألكيل SO₂ (ألكيل)-N، ألكيل C(=O)NHC(=O)-N،
١٣٢ $(\text{ألكيل})_2\text{N(ألكيل)-NHC(=O)NH}_2$ ، ألكيل NHC(=O)NH (ألكيل)-N، ألكيل O(=O)-
١٣٣ NHC، ألكيل-SO₂-N، نثرو، $(\text{ألكيل})_2\text{N(ألكيل)-OC(=O)-}$ ، ألكيل NH(=O)OC(=O)-، ألكيل-SO₂-
١٣٤ ثيو أو ثيو ألكيل؛

١٣٥ أو زمير ضوئي، بد، صنو فراغي، راسيمات أو ملح مقبول صيدلياً منه؛

١٣٦ تتضمن:



١٣٧

مفاعلة مركب بالصيغة (T5) مع مركب بالصيغة (T6)، في مذيب لابروتوني، لإنتاج
المركب المقابل بالصيغة (T3).

١٣٨

١٣٩