(19)国家知识产权局

(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 112437768 B
(45)授权公告日 2025.06.24

(21)申请号 201980046137.1
(22)申请日 2019.05.10
(65)同一申请的已公布的文献号
申请公布号 CN 112437768 A
(43)申请公布日 2021.03.02
(30)优先权数据
62/670,116 2018.05.11 US
(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2021.01.08
(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/US2019/031824 2019.05.10
(87)PCT国际申请的公布数据
WO2019/217890 EN 2019.11.14
(73)专利权人 英联邦高等教育系统坦普尔大学
地址 美国宾夕法尼亚州
专利权人 普莱韦蒂克斯有限责任公司
(72)发明人 D·J·坎尼 B·E·布拉斯 K·M·布拉特纳 D·A·皮平
(74)专利代理机构 北京市君合律师事务所 11517
专利代理师 何筝 顾云峰
(51)Int.Cl.
C07D 207/20(2006.01)
C07D 209/96(2006.01)
C07D 401/06(2006.01)
C07D 401/12(2006.01)
C07D 471/10(2006.01)
C07D 487/04(2006.01)
A61P 25/00(2006.01)
A61K 31/497(2006.01)
A61K 31/4015(2006.01)
(56)对比文件
US 5066651 A,1991.11.19
审查员 史娇阳

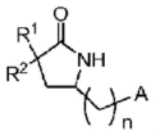
权利要求书14页 说明书841页

(54)发明名称

作为5-羟色胺受体7调节剂的新型官能化内酰胺及其使用方法

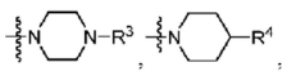
(57)摘要

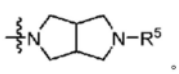
本发明的药物组合物包含在治疗与5-羟色胺受体7活性失调有关的疾病时具有疾病改善作用的式(I)的官能化内酰胺衍生物。



(I)

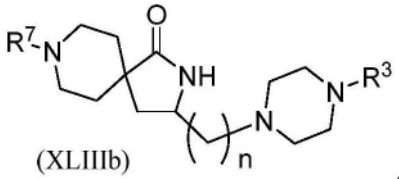
A选自由如下(基团)组成的组：





CN 112437768 B

1.一种具有式(XLIIIb)的化合物：



(XLIIIb)，

或其可药用盐,其中：

R^3为苯基或取代的苯基,其中取代基选自由羟基、卤素、氰基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{1-6}卤代烷基组成的组；

R^7选自由COR^8、CO_2R^9和SO_2R^{10c}组成的组；

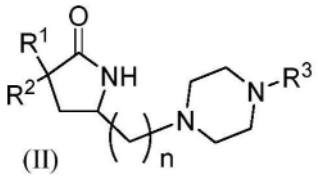
R^8选自由C_{1-6}直链烷基和C_{3-7}支链烷基组成的组；

R^9选自由C_{1-6}直链烷基和C_{3-7}支链烷基组成的组；

R^{10c}是C_{1-6}直链烷基或C_{3-7}支链烷基;和

n为1、2、3或4。

2.一种具有式(II)的化合物：



(II)

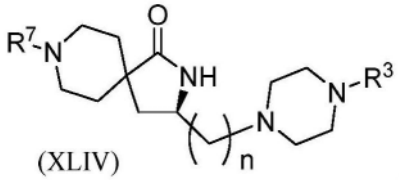
或其可药用盐,其中：

R^1和R^2各自为C_{1-6}直链烷基；

R^3为苯基或取代的苯基,其中取代基选自由羟基、卤素、氰基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{1-6}卤代烷基组成的组;和

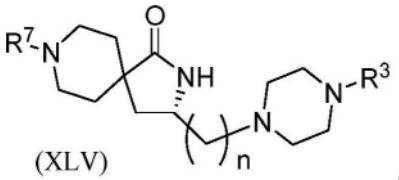
n为1、2、3或4。

3.如权利要求1所述的化合物,具有式(XLIV)：



(XLIV) 或

式(XLV)：



(XLV)，

或其可药用盐。

4.如权利要求2所述的化合物或其可药用盐,其中R^1和R^2各自为乙基和/或n为2。

5.如权利要求1所述的化合物,其中R^3选自由羟基苯基、氟苯基、氯苯基、溴苯基、氰基苯基、甲苯基、甲氧基苯基、二氟苯基、二氯苯基、氯氟苯基、二甲基苯基、三氟甲基苯基、二(三氟甲基)苯基组成的组。

6.如权利要求1所述的化合物,其中R^3选自由4-羟基苯基、3-氟苯基、4-氟苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、3,4-二氯苯基、4-氟-3-氯苯基、4-氰基苯基、2-甲氧基苯基、2-甲基苯基、3-甲基苯基、4-甲基苯基、和4-三氟甲基苯基组成的组。

7.如权利要求6所述的化合物,其中R^3为4-氟苯基。

8.如权利要求1所述的化合物,其中R^8、R^9或R^{10c}是C_{1-6}直链烷基。

9.如权利要求8所述的化合物,其中R^7是COR^8。

10.如权利要求8所述的化合物,其中R^7是CO_2R^9。

11.如权利要求8所述的化合物,其中R^7是SO_2R^{10c}。

12.如权利要求2所述的化合物,其中R^3选自由羟基苯基、氟苯基、氯苯基、溴苯基、氰基苯基、甲苯基、甲氧基苯基、二氟苯基、二氯苯基、异丙基苯基、氯氟苯基、二甲基苯基、三氟甲基苯基、二(三氟甲基)苯基组成的组。

13.如权利要求2所述的化合物,其中R^3选自由4-羟基苯基、3-氟苯基、4-氟苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、3,4-二氯苯基、4-氟-3-氯苯基、4-氰基苯基、2-甲氧基苯基、2-甲基苯基、3-甲基苯基、4-甲基苯基、2-异丙基苯基和4-三氟甲基苯基组成的组。

14.如权利要求13所述的化合物,其中R^3是4-氟苯基。

15.如权利要求2所述的化合物,其中所述化合物选自表1中所述的化合物:

表1

条目	R^1	R^2	n	R^3	条目	R^1	R^2	n	R^3
1	甲基	甲基	1	苯基	177	乙基	乙基	1	苯基
2	甲基	甲基	2	苯基	178	乙基	乙基	2	苯基
3	甲基	甲基	3	苯基	179	乙基	乙基	3	苯基
4	甲基	甲基	4	苯基	180	乙基	乙基	4	苯基
5	甲基	甲基	1	4-OH-苯基	181	乙基	乙基	1	4-OH-苯基
6	甲基	甲基	2	4-OH-苯基	182	乙基	乙基	2	4-OH-苯基
7	甲基	甲基	3	4-OH-苯基	183	乙基	乙基	3	4-OH-苯基
8	甲基	甲基	4	4-OH-苯基	184	乙基	乙基	4	4-OH-苯基
9	甲基	甲基	1	3-OH-苯基	185	乙基	乙基	1	3-OH-苯基
10	甲基	甲基	2	3-OH-苯基	186	乙基	乙基	2	3-OH-苯基

条目	R^1	R^2	n	R^3	条目	R^1	R^2	n	R^3
11	甲基	甲基	3	3-OH-苯基	187	乙基	乙基	3	3-OH-苯基
12	甲基	甲基	4	3-OH-苯基	188	乙基	乙基	4	3-OH-苯基
13	甲基	甲基	1	2-OH-苯基	189	乙基	乙基	1	2-OH-苯基
14	甲基	甲基	2	2-OH-苯基	190	乙基	乙基	2	2-OH-苯基
15	甲基	甲基	3	2-OH-苯基	191	乙基	乙基	3	2-OH-苯基
16	甲基	甲基	4	2-OH-苯基	192	乙基	乙基	4	2-OH-苯基
17	甲基	甲基	1	4-OMe-苯基	193	乙基	乙基	1	4-OMe-苯基
18	甲基	甲基	2	4-OMe-苯基	194	乙基	乙基	2	4-OMe-苯基
19	甲基	甲基	3	4-OMe-苯基	195	乙基	乙基	3	4-OMe-苯基
20	甲基	甲基	4	4-OMe-苯基	196	乙基	乙基	4	4-OMe-苯基
21	甲基	甲基	1	3-OMe-苯基	197	乙基	乙基	1	3-OMe-苯基
22	甲基	甲基	2	3-OMe-苯基	198	乙基	乙基	2	3-OMe-苯基
23	甲基	甲基	3	3-OMe-苯基	199	乙基	乙基	3	3-OMe-苯基
24	甲基	甲基	4	3-OMe-苯基	200	乙基	乙基	4	3-OMe-苯基
25	甲基	甲基	1	2-OMe-苯基	201	乙基	乙基	1	2-OMe-苯基
26	甲基	甲基	2	2-OMe-苯基	202	乙基	乙基	2	2-OMe-苯基
27	甲基	甲基	3	2-OMe-苯基	203	乙基	乙基	3	2-OMe-苯基
28	甲基	甲基	4	2-OMe-苯基	204	乙基	乙基	4	2-OMe-苯基
29	甲基	甲基	1	4-CN-苯基	205	乙基	乙基	1	4-CN-苯基
30	甲基	甲基	2	4-CN-苯基	206	乙基	乙基	2	4-CN-苯基
31	甲基	甲基	3	4-CN-苯基	207	乙基	乙基	3	4-CN-苯基
32	甲基	甲基	4	4-CN-苯基	208	乙基	乙基	4	4-CN-苯基
33	甲基	甲基	1	3-CN-苯基	209	乙基	乙基	1	3-CN-苯基
34	甲基	甲基	2	3-CN-苯基	210	乙基	乙基	2	3-CN-苯基
35	甲基	甲基	3	3-CN-苯基	211	乙基	乙基	3	3-CN-苯基
36	甲基	甲基	4	3-CN-苯基	212	乙基	乙基	4	3-CN-苯基
37	甲基	甲基	1	2-CN-苯基	213	乙基	乙基	1	2-CN-苯基
38	甲基	甲基	2	2-CN-苯基	214	乙基	乙基	2	2-CN-苯基
39	甲基	甲基	3	2-CN-苯基	215	乙基	乙基	3	2-CN-苯基
40	甲基	甲基	4	2-CN-苯基	216	乙基	乙基	4	2-CN-苯基
41	甲基	甲基	1	4-Me-苯基	217	乙基	乙基	1	4-Me-苯基
42	甲基	甲基	2	4-Me-苯基	218	乙基	乙基	2	4-Me-苯基
43	甲基	甲基	3	4-Me-苯基	219	乙基	乙基	3	4-Me-苯基
44	甲基	甲基	4	4-Me-苯基	220	乙基	乙基	4	4-Me-苯基
45	甲基	甲基	1	3-Me-苯基	221	乙基	乙基	1	3-Me-苯基
46	甲基	甲基	2	3-Me-苯基	222	乙基	乙基	2	3-Me-苯基
47	甲基	甲基	3	3-Me-苯基	223	乙基	乙基	3	3-Me-苯基
48	甲基	甲基	4	3-Me-苯基	224	乙基	乙基	4	3-Me-苯基
49	甲基	甲基	1	2-Me-苯基	225	乙基	乙基	1	2-Me-苯基
50	甲基	甲基	2	2-Me-苯基	226	乙基	乙基	2	2-Me-苯基

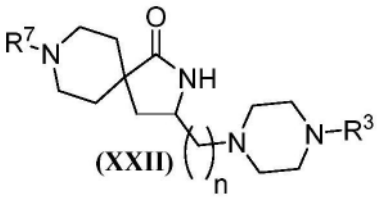
条目	R^1	R^2	n	R^3	条目	R^1	R^2	n	R^3
51	甲基	甲基	3	2-Me-苯基	227	乙基	乙基	3	2-Me-苯基
52	甲基	甲基	4	2-Me-苯基	228	乙基	乙基	4	2-Me-苯基
53	甲基	甲基	1	4-F-苯基	229	乙基	乙基	1	4-F-苯基
54	甲基	甲基	2	4-F-苯基	230	乙基	乙基	2	4-F-苯基
55	甲基	甲基	3	4-F-苯基	231	乙基	乙基	3	4-F-苯基
56	甲基	甲基	4	4-F-苯基	232	乙基	乙基	4	4-F-苯基
57	甲基	甲基	1	3-F-苯基	233	乙基	乙基	1	3-F-苯基
58	甲基	甲基	2	3-F-苯基	234	乙基	乙基	2	3-F-苯基
59	甲基	甲基	3	3-F-苯基	235	乙基	乙基	3	3-F-苯基
60	甲基	甲基	4	3-F-苯基	236	乙基	乙基	4	3-F-苯基
61	甲基	甲基	1	2-F-苯基	237	乙基	乙基	1	2-F-苯基
62	甲基	甲基	2	2-F-苯基	238	乙基	乙基	2	2-F-苯基
63	甲基	甲基	3	2-F-苯基	239	乙基	乙基	3	2-F-苯基
64	甲基	甲基	4	2-F-苯基	240	乙基	乙基	4	2-F-苯基
65	甲基	甲基	1	4-Cl-苯基	241	乙基	乙基	1	4-Cl-苯基
66	甲基	甲基	2	4-Cl-苯基	242	乙基	乙基	2	4-Cl-苯基
67	甲基	甲基	3	4-Cl-苯基	243	乙基	乙基	3	4-Cl-苯基
68	甲基	甲基	4	4-Cl-苯基	244	乙基	乙基	4	4-Cl-苯基
69	甲基	甲基	1	3-Cl-苯基	245	乙基	乙基	1	3-Cl-苯基
70	甲基	甲基	2	3-Cl-苯基	246	乙基	乙基	2	3-Cl-苯基
71	甲基	甲基	3	3-Cl-苯基	247	乙基	乙基	3	3-Cl-苯基
72	甲基	甲基	4	3-Cl-苯基	248	乙基	乙基	4	3-Cl-苯基
73	甲基	甲基	1	2-Cl-苯基	249	乙基	乙基	1	2-Cl-苯基
74	甲基	甲基	2	2-Cl-苯基	250	乙基	乙基	2	2-Cl-苯基
75	甲基	甲基	3	2-Cl-苯基	251	乙基	乙基	3	2-Cl-苯基
76	甲基	甲基	4	2-Cl-苯基	252	乙基	乙基	4	2-Cl-苯基
77	甲基	甲基	1	4-Br-苯基	253	乙基	乙基	1	4-Br-苯基
78	甲基	甲基	2	4-Br-苯基	254	乙基	乙基	2	4-Br-苯基
79	甲基	甲基	3	4-Br-苯基	255	乙基	乙基	3	4-Br-苯基
80	甲基	甲基	4	4-Br-苯基	256	乙基	乙基	4	4-Br-苯基
81	甲基	甲基	1	3-Br-苯基	257	乙基	乙基	1	3-Br-苯基
82	甲基	甲基	2	3-Br-苯基	258	乙基	乙基	2	3-Br-苯基
83	甲基	甲基	3	3-Br-苯基	259	乙基	乙基	3	3-Br-苯基
84	甲基	甲基	4	3-Br-苯基	260	乙基	乙基	4	3-Br-苯基
85	甲基	甲基	1	2-Br-苯基	261	乙基	乙基	1	2-Br-苯基
86	甲基	甲基	2	2-Br-苯基	262	乙基	乙基	2	2-Br-苯基
87	甲基	甲基	3	2-Br-苯基	263	乙基	乙基	3	2-Br-苯基
88	甲基	甲基	4	2-Br-苯基	264	乙基	乙基	4	2-Br-苯基
89	甲基	甲基	1	4-CF_3-苯基	265	乙基	乙基	1	4-CF_3-苯基
90	甲基	甲基	2	4-CF_3-苯基	266	乙基	乙基	2	4-CF_3-苯基

条目	R^1	R^2	n	R^3	条目	R^1	R^2	n	R^3
91	甲基	甲基	3	4-CF_3-苯基	267	乙基	乙基	3	4-CF_3-苯基
92	甲基	甲基	4	4-CF_3-苯基	268	乙基	乙基	4	4-CF_3-苯基
93	甲基	甲基	1	3-CF_3-苯基	269	乙基	乙基	1	3-CF_3-苯基
94	甲基	甲基	2	3-CF_3-苯基	270	乙基	乙基	2	3-CF_3-苯基
95	甲基	甲基	3	3-CF_3-苯基	271	乙基	乙基	3	3-CF_3-苯基
96	甲基	甲基	4	3-CF_3-苯基	272	乙基	乙基	4	3-CF_3-苯基
97	甲基	甲基	1	2-CF_3-苯基	273	乙基	乙基	1	2-CF_3-苯基
98	甲基	甲基	2	2-CF_3-苯基	274	乙基	乙基	2	2-CF_3-苯基
99	甲基	甲基	3	2-CF_3-苯基	275	乙基	乙基	3	2-CF_3-苯基
100	甲基	甲基	4	2-CF_3-苯基	276	乙基	乙基	4	2-CF_3-苯基
101	甲基	甲基	1	4-iPr-苯基	277	乙基	乙基	1	4-iPr-苯基
102	甲基	甲基	2	4-iPr-苯基	278	乙基	乙基	2	4-iPr-苯基
103	甲基	甲基	3	4-iPr-苯基	279	乙基	乙基	3	4-iPr-苯基
104	甲基	甲基	4	4-iPr-苯基	280	乙基	乙基	4	4-iPr-苯基
105	甲基	甲基	1	3-iPr-苯基	281	乙基	乙基	1	3-iPr-苯基
106	甲基	甲基	2	3-iPr-苯基	282	乙基	乙基	2	3-iPr-苯基
107	甲基	甲基	3	3-iPr-苯基	283	乙基	乙基	3	3-iPr-苯基
108	甲基	甲基	4	3-iPr-苯基	284	乙基	乙基	4	3-iPr-苯基
109	甲基	甲基	1	2-iPr-苯基	285	乙基	乙基	1	2-iPr-苯基
110	甲基	甲基	2	2-iPr-苯基	286	乙基	乙基	2	2-iPr-苯基
111	甲基	甲基	3	2-iPr-苯基	287	乙基	乙基	3	2-iPr-苯基
112	甲基	甲基	4	2-iPr-苯基	288	乙基	乙基	4	2-iPr-苯基
125	甲基	甲基	1	2,3-二-Me-苯基	301	乙基	乙基	1	2,3-二-Me-苯基
126	甲基	甲基	2	2,3-二-Me-苯基	302	乙基	乙基	2	2,3-二-Me-苯基
127	甲基	甲基	3	2,3-二-Me-苯基	303	乙基	乙基	3	2,3-二-Me-苯基
128	甲基	甲基	4	2,3-二-Me-苯基	304	乙基	乙基	4	2,3-二-Me-苯基
129	甲基	甲基	1	2,4-二-Me-苯基	305	乙基	乙基	1	2,4-二-Me-苯基
130	甲基	甲基	2	2,4-二-Me-苯基	306	乙基	乙基	2	2,4-二-Me-苯基
131	甲基	甲基	3	2,4-二-Me-苯基	307	乙基	乙基	3	2,4-二-Me-苯基
132	甲基	甲基	4	2,4-二-Me-苯基	308	乙基	乙基	4	2,4-二-Me-苯基
133	甲基	甲基	1	2,5-二-Me-苯基	309	乙基	乙基	1	2,5-二-Me-苯基
134	甲基	甲基	2	2,5-二-Me-苯基	310	乙基	乙基	2	2,5-二-Me-苯基
135	甲基	甲基	3	2,5-二-Me-苯基	311	乙基	乙基	3	2,5-二-Me-苯基
136	甲基	甲基	4	2,5-二-Me-苯基	312	乙基	乙基	4	2,5-二-Me-苯基
137	甲基	甲基	1	2,6-二-Me-苯基	313	乙基	乙基	1	2,6-二-Me-苯基
138	甲基	甲基	2	2,6-二-Me-苯基	314	乙基	乙基	2	2,6-二-Me-苯基
139	甲基	甲基	3	2,6-二-Me-苯基	315	乙基	乙基	3	2,6-二-Me-苯基
140	甲基	甲基	4	2,6-二-Me-苯基	316	乙基	乙基	4	2,6-二-Me-苯基
141	甲基	甲基	1	2,6-二-iPr-苯基	317	乙基	乙基	1	2,6-二-iPr-苯基
142	甲基	甲基	2	2,6-二-iPr-苯基	318	乙基	乙基	2	2,6-二-iPr-苯基
143	甲基	甲基	3	2,6-二-iPr-苯基	319	乙基	乙基	3	2,6-二-iPr-苯基
144	甲基	甲基	4	2,6-二-iPr-苯基	320	乙基	乙基	4	2,6-二-iPr-苯基

或其可药用盐。

16.如权利要求15所述的化合物,其中R^1和R^2各自为乙基。

17.一种式(XXII)的化合物,其具有如表16中所述的结构:



(XXII)

条目	n	R^7	R^3	条目	n	R^7	R^3
13	1	COMe	苯基	791	1	COMe	4-OH-苯基
14	2	COMe	苯基	792	2	COMe	4-OH-苯基
15	3	COMe	苯基	793	3	COMe	4-OH-苯基
16	4	COMe	苯基	794	4	COMe	4-OH-苯基
17	1	CO_2Me	苯基	795	1	CO_2Me	4-OH-苯基
18	2	CO_2Me	苯基	796	2	CO_2Me	4-OH-苯基
19	3	CO_2Me	苯基	797	3	CO_2Me	4-OH-苯基
20	4	CO_2Me	苯基	798	4	CO_2Me	4-OH-苯基
21	1	CO_2tBu	苯基	799	1	CO_2tBu	4-OH-苯基
22	2	CO_2tBu	苯基	800	2	CO_2tBu	4-OH-苯基
23	3	CO_2tBu	苯基	801	3	CO_2tBu	4-OH-苯基
24	4	CO_2tBu	苯基	802	4	CO_2tBu	4-OH-苯基
29	1	SO_2Me	苯基	807	1	SO_2Me	4-OH-苯基
30	2	SO_2Me	苯基	808	2	SO_2Me	4-OH-苯基
31	3	SO_2Me	苯基	809	3	SO_2Me	4-OH-苯基
32	4	SO_2Me	苯基	810	4	SO_2Me	4-OH-苯基
49	1	COMe	3-OH-苯基	827	1	COMe	2-OH-苯基
50	2	COMe	3-OH-苯基	828	2	COMe	2-OH-苯基
51	3	COMe	3-OH-苯基	829	3	COMe	2-OH-苯基
52	4	COMe	3-OH-苯基	830	4	COMe	2-OH-苯基
53	1	CO_2Me	3-OH-苯基	831	1	CO_2Me	2-OH-苯基
54	2	CO_2Me	3-OH-苯基	832	2	CO_2Me	2-OH-苯基
55	3	CO_2Me	3-OH-苯基	833	3	CO_2Me	2-OH-苯基
56	4	CO_2Me	3-OH-苯基	834	4	CO_2Me	2-OH-苯基
57	1	CO_2tBu	3-OH-苯基	835	1	CO_2tBu	2-OH-苯基
58	2	CO_2tBu	3-OH-苯基	836	2	CO_2tBu	2-OH-苯基
59	3	CO_2tBu	3-OH-苯基	837	3	CO_2tBu	2-OH-苯基
60	4	CO_2tBu	3-OH-苯基	838	4	CO_2tBu	2-OH-苯基
65	1	SO_2Me	3-OH-苯基	843	1	SO_2Me	2-OH-苯基

66	2	SO_2Me	3-OH-苯基	844	2	SO_2Me	2-OH-苯基
67	3	SO_2Me	3-OH-苯基	845	3	SO_2Me	2-OH-苯基
68	4	SO_2Me	3-OH-苯基	846	4	SO_2Me	2-OH-苯基
121	1	COMe	3-OMe-苯基	863	1	COMe	4-OMe-苯基
122	2	COMe	3-OMe-苯基	864	2	COMe	4-OMe-苯基
123	3	COMe	3-OMe-苯基	865	3	COMe	4-OMe-苯基
124	4	COMe	3-OMe-苯基	866	4	COMe	4-OMe-苯基
125	1	CO_2Me	3-OMe-苯基	867	1	CO_2Me	4-OMe-苯基
126	2	CO_2Me	3-OMe-苯基	868	2	CO_2Me	4-OMe-苯基
127	3	CO_2Me	3-OMe-苯基	869	3	CO_2Me	4-OMe-苯基
128	4	CO_2Me	3-OMe-苯基	870	4	CO_2Me	4-OMe-苯基
129	1	CO_2tBu	3-OMe-苯基	871	1	CO_2tBu	4-OMe-苯基
130	2	CO_2tBu	3-OMe-苯基	872	2	CO_2tBu	4-OMe-苯基
131	3	CO_2tBu	3-OMe-苯基	873	3	CO_2tBu	4-OMe-苯基
132	4	CO_2tBu	3-OMe-苯基	874	4	CO_2tBu	4-OMe-苯基
137	1	SO_2Me	3-OMe-苯基	879	1	SO_2Me	4-OMe-苯基
138	2	SO_2Me	3-OMe-苯基	880	2	SO_2Me	4-OMe-苯基
139	3	SO_2Me	3-OMe-苯基	881	3	SO_2Me	4-OMe-苯基
140	4	SO_2Me	3-OMe-苯基	882	4	SO_2Me	4-OMe-苯基
157	1	COMe	4-CN-苯基	899	1	COMe	2-OMe-苯基
158	2	COMe	4-CN-苯基	900	2	COMe	2-OMe-苯基
159	3	COMe	4-CN-苯基	901	3	COMe	2-OMe-苯基
160	4	COMe	4-CN-苯基	902	4	COMe	2-OMe-苯基
161	1	CO_2Me	4-CN-苯基	903	1	CO_2Me	2-OMe-苯基
162	2	CO_2Me	4-CN-苯基	904	2	CO_2Me	2-OMe-苯基
163	3	CO_2Me	4-CN-苯基	905	3	CO_2Me	2-OMe-苯基
164	4	CO_2Me	4-CN-苯基	906	4	CO_2Me	2-OMe-苯基
165	1	CO_2tBu	4-CN-苯基	907	1	CO_2tBu	2-OMe-苯基
166	2	CO_2tBu	4-CN-苯基	908	2	CO_2tBu	2-OMe-苯基
167	3	CO_2tBu	4-CN-苯基	909	3	CO_2tBu	2-OMe-苯基
168	4	CO_2tBu	4-CN-苯基	910	4	CO_2tBu	2-OMe-苯基
173	1	SO_2Me	4-CN-苯基	915	1	SO_2Me	2-OMe-苯基
174	2	SO_2Me	4-CN-苯基	916	2	SO_2Me	2-OMe-苯基
175	3	SO_2Me	4-CN-苯基	917	3	SO_2Me	2-OMe-苯基
176	4	SO_2Me	4-CN-苯基	918	4	SO_2Me	2-OMe-苯基
193	1	COMe	2-CN-苯基	935	1	COMe	3-CN-苯基
194	2	COMe	2-CN-苯基	936	2	COMe	3-CN-苯基
195	3	COMe	2-CN-苯基	937	3	COMe	3-CN-苯基
196	4	COMe	2-CN-苯基	938	4	COMe	3-CN-苯基
197	1	CO_2Me	2-CN-苯基	939	1	CO_2Me	3-CN-苯基
198	2	CO_2Me	2-CN-苯基	940	2	CO_2Me	3-CN-苯基

199	3	CO_2Me	2-CN-苯基	941	3	CO_2Me	3-CN-苯基
200	4	CO_2Me	2-CN-苯基	942	4	CO_2Me	3-CN-苯基
201	1	CO_2tBu	2-CN-苯基	943	1	CO_2tBu	3-CN-苯基
202	2	CO_2tBu	2-CN-苯基	944	2	CO_2tBu	3-CN-苯基
203	3	CO_2tBu	2-CN-苯基	945	3	CO_2tBu	3-CN-苯基
204	4	CO_2tBu	2-CN-苯基	946	4	CO_2tBu	3-CN-苯基
209	1	SO_2Me	2-CN-苯基	951	1	SO_2Me	3-CN-苯基
210	2	SO_2Me	2-CN-苯基	952	2	SO_2Me	3-CN-苯基
211	3	SO_2Me	2-CN-苯基	953	3	SO_2Me	3-CN-苯基
212	4	SO_2Me	2-CN-苯基	954	4	SO_2Me	3-CN-苯基
229	1	COMe	3-Me-苯基	971	1	COMe	2-Me-苯基
230	2	COMe	3-Me-苯基	972	2	COMe	2-Me-苯基
231	3	COMe	3-Me-苯基	973	3	COMe	2-Me-苯基
232	4	COMe	3-Me-苯基	974	4	COMe	2-Me-苯基
233	1	CO_2Me	3-Me-苯基	975	1	CO_2Me	2-Me-苯基
234	2	CO_2Me	3-Me-苯基	976	2	CO_2Me	2-Me-苯基
235	3	CO_2Me	3-Me-苯基	977	3	CO_2Me	2-Me-苯基
236	4	CO_2Me	3-Me-苯基	978	4	CO_2Me	2-CN-苯基
237	1	CO_2tBu	3-Me-苯基	979	1	CO_2tBu	2-Me-苯基
238	2	CO_2tBu	3-Me-苯基	980	2	CO_2tBu	2-Me-苯基
239	3	CO_2tBu	3-Me-苯基	981	3	CO_2tBu	2-Me-苯基
240	4	CO_2tBu	3-Me-苯基	982	4	CO_2tBu	2-Me-苯基
245	1	SO_2Me	3-Me-苯基	987	1	SO_2Me	2-Me-苯基
246	2	SO_2Me	3-Me-苯基	988	2	SO_2Me	2-Me-苯基
247	3	SO_2Me	3-Me-苯基	989	3	SO_2Me	2-Me-苯基
248	4	SO_2Me	3-Me-苯基	990	4	SO_2Me	2-Me-苯基
265	1	COMe	2-F-苯基	1007	1	COMe	4-Me-苯基
266	2	COMe	2-F-苯基	1008	2	COMe	4-Me-苯基
267	3	COMe	2-F-苯基	1009	3	COMe	4-Me-苯基
268	4	COMe	2-F-苯基	1010	4	COMe	4-Me-苯基
269	1	CO_2Me	2-F-苯基	1011	1	CO_2Me	4-Me-苯基
270	2	CO_2Me	2-F-苯基	1012	2	CO_2Me	4-Me-苯基
271	3	CO_2Me	2-F-苯基	1013	3	CO_2Me	4-Me-苯基
272	4	CO_2Me	2-F-苯基	1014	4	CO_2Me	4-Me-苯基
273	1	CO_2tBu	2-F-苯基	1015	1	CO_2tBu	4-Me-苯基
274	2	CO_2tBu	2-F-苯基	1016	2	CO_2tBu	4-Me-苯基
275	3	CO_2tBu	2-F-苯基	1017	3	CO_2tBu	4-Me-苯基
276	4	CO_2tBu	2-F-苯基	1018	4	CO_2tBu	4-Me-苯基
281	1	SO_2Me	2-F-苯基	1023	1	SO_2Me	4-Me-苯基
282	2	SO_2Me	2-F-苯基	1024	2	SO_2Me	4-Me-苯基
283	3	SO_2Me	2-F-苯基	1025	3	SO_2Me	4-Me-苯基

284	4	SO_2Me	2-F-苯基	1026	4	SO_2Me	4-Me-苯基
301	1	COMe	4-F-苯基	1043	1	COMe	3-F-苯基
302	2	COMe	4-F-苯基	1044	2	COMe	3-F-苯基
303	3	COMe	4-F-苯基	1045	3	COMe	3-F-苯基
304	4	COMe	4-F-苯基	1046	4	COMe	3-F-苯基
305	1	CO_2Me	4-F-苯基	1047	1	CO_2Me	3-F-苯基
306	2	CO_2Me	4-F-苯基	1048	2	CO_2Me	3-F-苯基
307	3	CO_2Me	4-F-苯基	1049	3	CO_2Me	3-F-苯基
308	4	CO_2Me	4-F-苯基	1050	4	CO_2Me	3-F-苯基
309	1	CO_2tBu	4-F-苯基	1051	1	CO_2tBu	3-F-苯基
310	2	CO_2tBu	4-F-苯基	1052	2	CO_2tBu	3-F-苯基
311	3	CO_2tBu	4-F-苯基	1053	3	CO_2tBu	3-F-苯基
312	4	CO_2tBu	4-F-苯基	1054	4	CO_2tBu	3-F-苯基
317	1	SO_2Me	4-F-苯基	1059	1	SO_2Me	3-F-苯基
318	2	SO_2Me	4-F-苯基	1060	2	SO_2Me	3-F-苯基
319	3	SO_2Me	4-F-苯基	1061	3	SO_2Me	3-F-苯基
320	4	SO_2Me	4-F-苯基	1062	4	SO_2Me	3-F-苯基
337	1	COMe	3-Cl-苯基	1079	1	COMe	2-Cl-苯基
338	2	COMe	3-Cl-苯基	1080	2	COMe	2-Cl-苯基
339	3	COMe	3-Cl-苯基	1081	3	COMe	2-Cl-苯基
340	4	COMe	3-Cl-苯基	1082	4	COMe	2-Cl-苯基
341	1	CO_2Me	3-Cl-苯基	1083	1	CO_2Me	2-Cl-苯基
342	2	CO_2Me	3-Cl-苯基	1084	2	CO_2Me	2-Cl-苯基
343	3	CO_2Me	3-Cl-苯基	1085	3	CO_2Me	2-Cl-苯基
344	4	CO_2Me	3-Cl-苯基	1086	4	CO_2Me	2-Cl-苯基
345	1	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1087	1	CO_2tBu	2-Cl-苯基
346	2	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1088	2	CO_2tBu	2-Cl-苯基
347	3	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1089	3	CO_2tBu	2-Cl-苯基
348	4	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1090	4	CO_2tBu	2-Cl-苯基
353	1	SO_2Me	3-Cl-苯基	1095	1	SO_2Me	2-Cl-苯基
354	2	SO_2Me	3-Cl-苯基	1096	2	SO_2Me	2-Cl-苯基
355	3	SO_2Me	3-Cl-苯基	1097	3	SO_2Me	2-Cl-苯基
356	4	SO_2Me	3-Cl-苯基	1098	4	SO_2Me	2-Cl-苯基
373	1	COMe	2-Br-苯基	1115	1	COMe	4-Cl-苯基
374	2	COMe	2-Br-苯基	1116	2	COMe	4-Cl-苯基
375	3	COMe	2-Br-苯基	1117	3	COMe	4-Cl-苯基
376	4	COMe	2-Br-苯基	1118	4	COMe	4-Cl-苯基
377	1	CO_2Me	2-Br-苯基	1119	1	CO_2Me	4-Cl-苯基
378	2	CO_2Me	2-Br-苯基	1120	2	CO_2Me	4-Cl-苯基
379	3	CO_2Me	2-Br-苯基	1121	3	CO_2Me	4-Cl-苯基
380	4	CO_2Me	2-Br-苯基	1122	4	CO_2Me	4-Cl-苯基

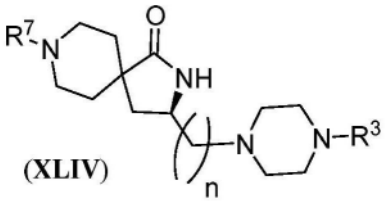
381	1	CO_2tBu	2-Br-苯基	1123	1	CO_2tBu	4-Cl-苯基
382	2	CO_2tBu	2-Br-苯基	1124	2	CO_2tBu	4-Cl-苯基
383	3	CO_2tBu	2-Br-苯基	1125	3	CO_2tBu	4-Cl-苯基
384	4	CO_2tBu	2-Br-苯基	1126	4	CO_2tBu	4-Cl-苯基
389	1	SO_2Me	2-Br-苯基	1131	1	SO_2Me	4-Cl-苯基
390	2	SO_2Me	2-Br-苯基	1132	2	SO_2Me	4-Cl-苯基
391	3	SO_2Me	2-Br-苯基	1133	3	SO_2Me	4-Cl-苯基
392	4	SO_2Me	2-Br-苯基	1134	4	SO_2Me	4-Cl-苯基
409	1	COMe	4-Br-苯基	1151	1	COMe	3-Br-苯基
410	2	COMe	4-Br-苯基	1152	2	COMe	3-Br-苯基
411	3	COMe	4-Br-苯基	1153	3	COMe	3-Br-苯基
412	4	COMe	4-Br-苯基	1154	4	COMe	3-Br-苯基
413	1	CO_2Me	4-Br-苯基	1155	1	CO_2Me	3-Br-苯基
414	2	CO_2Me	4-Br-苯基	1156	2	CO_2Me	3-Br-苯基
415	3	CO_2Me	4-Br-苯基	1157	3	CO_2Me	3-Br-苯基
416	4	CO_2Me	4-Br-苯基	1158	4	CO_2Me	3-Br-苯基
417	1	CO_2tBu	4-Br-苯基	1159	1	CO_2tBu	3-Br-苯基
418	2	CO_2tBu	4-Br-苯基	1160	2	CO_2tBu	3-Br-苯基
419	3	CO_2tBu	4-Br-苯基	1161	3	CO_2tBu	3-Br-苯基
420	4	CO_2tBu	4-Br-苯基	1162	4	CO_2tBu	3-Br-苯基
425	1	SO_2Me	4-Br-苯基	1167	1	SO_2Me	3-Br-苯基
426	2	SO_2Me	4-Br-苯基	1168	2	SO_2Me	3-Br-苯基
427	3	SO_2Me	4-Br-苯基	1169	3	SO_2Me	3-Br-苯基
428	4	SO_2Me	4-Br-苯基	1170	4	SO_2Me	3-Br-苯基
445	1	COMe	3-CF_3-苯基	1187	1	COMe	2-CF_3-苯基
446	2	COMe	3-CF_3-苯基	1188	2	COMe	2-CF_3-苯基
447	3	COMe	3-CF_3-苯基	1189	3	COMe	2-CF_3-苯基
448	4	COMe	3-CF_3-苯基	1190	4	COMe	2-CF_3-苯基
449	1	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1191	1	CO_2Me	2-CF_3-苯基
450	2	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1192	2	CO_2Me	2-CF_3-苯基
451	3	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1193	3	CO_2Me	2-CF_3-苯基
452	4	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1194	4	CO_2Me	2-CF_3-苯基
453	1	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1195	1	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
454	2	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1196	2	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
455	3	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1197	3	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
456	4	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1198	4	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
461	1	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1203	1	SO_2Me	2-CF_3-苯基
462	2	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1204	2	SO_2Me	2-CF_3-苯基
463	3	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1205	3	SO_2Me	2-CF_3-苯基
464	4	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1206	4	SO_2Me	2-CF_3-苯基
481	1	COMe	2-iPr-苯基	1223	1	COMe	4-CF_3-苯基

482	2	COMe	2-iPr-苯基	1224	2	COMe	4-CF_3-苯基
483	3	COMe	2-iPr-苯基	1225	3	COMe	4-CF_3-苯基
484	4	COMe	2-iPr-苯基	1226	4	COMe	4-CF_3-苯基
485	1	CO_2Me	2-iPr-苯基	1227	1	CO_2Me	4-CF_3-苯基
486	2	CO_2Me	2-iPr-苯基	1228	2	CO_2Me	4-CF_3-苯基
487	3	CO_2Me	2-iPr-苯基	1229	3	CO_2Me	4-CF_3-苯基
488	4	CO_2Me	2-iPr-苯基	1230	4	CO_2Me	4-CF_3-苯基
489	1	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1231	1	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
490	2	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1232	2	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
491	3	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1233	3	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
492	4	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1234	4	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
497	1	SO_2Me	2-iPr-苯基	1239	1	SO_2Me	4-CF_3-苯基
498	2	SO_2Me	2-iPr-苯基	1240	2	SO_2Me	4-CF_3-苯基
499	3	SO_2Me	2-iPr-苯基	1241	3	SO_2Me	4-CF_3-苯基
500	4	SO_2Me	2-iPr-苯基	1242	4	SO_2Me	4-CF_3-苯基
517	1	COMe	4-iPr-苯基	1259	1	COMe	3-iPr-苯基
518	2	COMe	4-iPr-苯基	1260	2	COMe	3-iPr-苯基
519	3	COMe	4-iPr-苯基	1261	3	COMe	3-iPr-苯基
520	4	COMe	4-iPr-苯基	1262	4	COMe	3-iPr-苯基
521	1	CO_2Me	4-iPr-苯基	1263	1	CO_2Me	3-iPr-苯基
522	2	CO_2Me	4-iPr-苯基	1264	2	CO_2Me	3-iPr-苯基
523	3	CO_2Me	4-iPr-苯基	1265	3	CO_2Me	3-iPr-苯基
524	4	CO_2Me	4-iPr-苯基	1266	4	CO_2Me	3-iPr-苯基
525	1	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1267	1	CO_2tBu	3-iPr-苯基
526	2	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1268	2	CO_2tBu	3-iPr-苯基
527	3	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1269	3	CO_2tBu	3-iPr-苯基
528	4	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1270	4	CO_2tBu	3-iPr-苯基
533	1	SO_2Me	4-iPr-苯基	1275	1	SO_2Me	3-iPr-苯基
534	2	SO_2Me	4-iPr-苯基	1276	2	SO_2Me	3-iPr-苯基
535	3	SO_2Me	4-iPr-苯基	1277	3	SO_2Me	3-iPr-苯基
536	4	SO_2Me	4-iPr-苯基	1278	4	SO_2Me	3-iPr-苯基
589	1	COMe	2,4-二-Me-苯基	1367	1	COMe	2,6-二-Me-苯基
590	2	COMe	2,4-二-Me-苯基	1368	2	COMe	2,6-二-Me-苯基
591	3	COMe	2,4-二-Me-苯基	1369	3	COMe	2,6-二-Me-苯基
592	4	COMe	2,4-二-Me-苯基	1370	4	COMe	2,6-二-Me-苯基
593	1	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1371	1	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
594	2	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1372	2	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
595	3	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1373	3	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
596	4	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1374	4	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
597	1	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1375	1	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
598	2	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1376	2	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基

599	3	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1377	3	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
600	4	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1378	4	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
605	1	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1383	1	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基
606	2	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1384	2	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基
607	3	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1385	3	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基
608	4	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1386	4	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基
625	1	COMe	2,6-二-iPr-苯基				
626	2	COMe	2,6-二-iPr-苯基				
627	3	COMe	2,6-二-iPr-苯基				
628	4	COMe	2,6-二-iPr-苯基				
629	1	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基				
630	2	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基				
631	3	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基				
632	4	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基				
633	1	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基				
634	2	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基				
635	3	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基				
636	4	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基				
641	1	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基				
642	2	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基				
643	3	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基				
644	4	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基				

或其可药用盐。

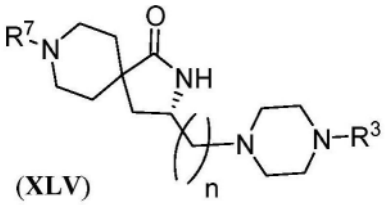
18.如权利要求1所述的化合物,其中所述化合物选自表37或38中所述的化合物:



(XLIV)

表37:

n	R^3	R^7
2	3-Cl-苯基	乙酰基
2	4-F-苯基	乙酰基
2	4-F-苯基	$MeSO_2$
2	3-Cl-苯基	$MeSO_2$
3	3-Cl-苯基	$MeSO_2$
3	4-F-苯基	$MeSO_2$



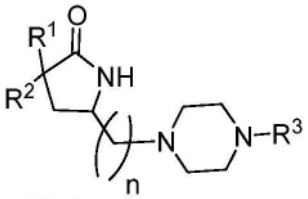
(XLV)

表 38:

n	R^3	R^7
2	3-Cl-苯基	$MeSO_2$
2	4-F-苯基	$MeSO_2$
2	3-Cl-苯基	乙酰基
2	4-F-苯基	乙酰基

或其可药用盐。

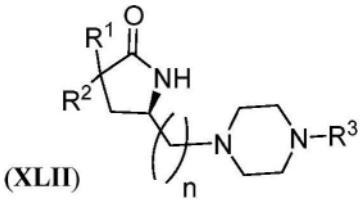
19.如权利要求2所述的化合物,其中所述化合物选自表34-36中任一项所述的化合物:



(XLI)

表34:

n	R^1	R^2	R^3
2	乙基	乙基	4-F-苯基
2	乙基	乙基	4-Cl-苯基
2	乙基	乙基	2-iPr-苯基
2	乙基	乙基	4-Me-苯基
2	乙基	乙基	4-OH-苯基
2	乙基	乙基	苯基

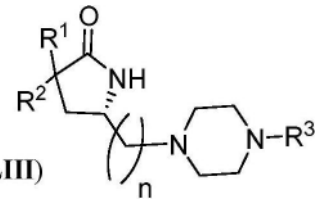


(XLII)

表35:

n	R^1	R^2	R^3
1	乙基	乙基	2-iPr-苯基
1	乙基	乙基	4-F-苯基
1	乙基	乙基	4-Me-苯基

n	R^1	R^2	R^3
1	乙基	乙基	苯基
1	乙基	乙基	3-Cl-苯基
2	乙基	乙基	4-Me-苯基
2	乙基	乙基	4-F-苯基
2	乙基	乙基	3,4-二-Cl-苯基
2	乙基	乙基	4-F-3-Cl-苯基
2	乙基	乙基	3-Cl-苯基
2	乙基	乙基	苯基
2	乙基	乙基	2-Cl-苯基
2	乙基	乙基	3-F-苯基
2	乙基	乙基	2-Me-苯基
2	乙基	乙基	3-Me-苯基
2	乙基	乙基	2-OMe-苯基
2	乙基	乙基	4-CN-苯基
2	乙基	乙基	4-CF_3-苯基



(XLIII)

表36:

n	R^1	R^2	R^3
2	乙基	乙基	4-Me-苯基

或其可药用盐。

20.一种组合物,其包含有效量的至少一种如权利要求1-19中任一项所述的化合物或其可药用盐。

21.如权利要求20所述的组合物,还包含至少一种赋形剂。

22.如权利要求1-19中任一项所述的化合物或其可药用盐在制备用于治疗与5-羟色胺受体7活性失调有关的疾病的药物中的用途。

23.如权利要求22所述的用途,其中所述药物还包含至少一种赋形剂。

24.如权利要求22或23所述的用途,其中所述与5-羟色胺受体7活性失调有关的疾病选自由昼夜节律紊乱、抑郁症、精神分裂症、神经源性炎症、高血压、外周血管疾病、偏头痛、神经病理性疼痛、末梢性疼痛、异常性疼痛、体温调节障碍、学习障碍、记忆障碍、海马信号传导障碍、睡眠障碍、注意力缺陷/多动障碍、焦虑症、回避型人格障碍、早泄、进食障碍、经前期综合征、经前期烦躁障碍、季节性情感障碍、双相障碍、炎性肠病(IBD)、肠炎、癫痫疾病、药物成瘾、酒精成瘾、乳腺癌、肝纤维化、慢性肝损伤、肝细胞癌、小肠神经内分泌肿瘤和肺损伤组成的组。

25.如权利要求22或23所述的用途,其中所述与5-羟色胺受体7活性失调有关的疾病是炎性肠病(IBD)或肠炎。

作为5-羟色胺受体7调节剂的新型官能化内酰胺及其使用方法

[0001] 相关申请的交叉引用

[0002] 本专利申请要求2018年5月11日提交的美国临时专利申请号62/670,116的权益，该专利申请全文以引用方式并入本文。

[0003] 联邦资助研究声明

[0004] 美国政府拥有本发明的已缴费许可证，并且在有限的情况下有权要求专利所有人按照美国国家糖尿病与消化和肾脏疾病研究所授予的授权号143DK115254-01和美国国立精神卫生研究所授予的授权号HHSN-271-2008-00025-C规定的合理条款许可他人。

技术领域

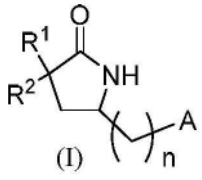
[0005] 本发明的实施方案涉及可用作5-羟色胺受体7(5-HT_7)活性调节剂的新型化合物及其使用方法。实施方案还涉及可用于治疗与5-羟色胺受体7活性失调相关的疾病的全新化学型。

背景技术

[0006] 血清素于20世纪40年代后期被发现并且存在于外周和中枢神经系统中[Physiol.Res,60(2011)15-25;Psychopharmacology 213(2011)167-169]。血清素或5-羟色胺(5-HT)是吲哚烷基胺基团的单胺神经递质，其作用于神经细胞的突触。已发现七个不同的血清素受体家族，并且基于序列相似性、信号转导偶联和药理学特征克隆了至少20个亚群。七个5-HT受体家族命名为5-HT_1、5-HT_2、5-HT_3、5-HT_4、5-HT_5、5-HT_6和5-HT_7，这些受体中的每一个继而具有亚族或亚群。已对所有七个家族的信号转导机制进行了研究，并且已知5-HT_1和5-HT_5受体的激活导致细胞内cAMP减少，而5-HT_2、5-HT_3、5-HT_4、5-HT_6和5-HT_7的激活导致细胞内IP3和DAG增加。脑中的5-HT途径是CNS疾病领域中药物开发的重要靶标。神经递质与其G蛋白偶联受体结合，参与多种作用，包括认知、情绪、焦虑、注意力、食欲、心血管功能、血管收缩、睡眠(ACS Medicinal Chemistry Letters,2011,2,929-932;Physiological Research,2011,60,15-25)、炎性肠病(IBD)和肠炎(WO 2012058769,Khan,W.I.等人,Journal of Immunology,2013,190,4795-4804)、癫痫、癫痫疾病(Epilepsy Research(2007)75,39)、药物成瘾和酒精成瘾(Hauser,S.R.等人,Frontiers in Neuroscience,2015,8,1-9)等。

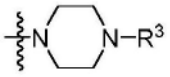
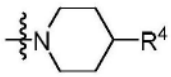
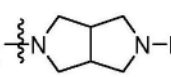
发明内容

[0007] 本发明涉及新型5-羟色胺受体7(5-HT7)活性调节剂，即式(I)的化合物，

[0008] 

(I)

[0009] 包括其对映体、非对映体、水合物、溶剂化物、可药用盐、前药和复合物,其中:

[0010] A选自由  、  和  组成的组;

[0011] R^1选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基组成的组;

[0012] R^2选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基组成的组;

[0013] 或者R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有5至7个环原子的环,该环任选地包含双键;

[0014] 或者R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有6至8个环原子的环,该环原子包含选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组的部分;

[0015] R^3选自由任选取代的苯基、任选取代的萘-1-基、任选取代的萘-2-基、任选取代的2-吡啶基、任选取代的3-吡啶基、任选取代的4-吡啶基和 组成的组;

[0016] R^4选自由任选取代的苯基、任选取代的萘-1-基、任选取代的萘-2-基、任选取代的2-吡啶基、任选取代的3-吡啶基、任选取代的4-吡啶基和 组成的组;

[0017] R^5选自由任选取代的苯基、任选取代的萘-1-基、任选取代的萘-2-基、任选取代的2-吡啶基、任选取代的3-吡啶基、任选取代的4-吡啶基和 组成的组;

[0018] R^6选自由任选取代的苯基、任选取代的萘-1-基、任选取代的萘-2-基、任选取代的2-吡啶基、任选取代的3-吡啶基和任选取代的4-吡啶基组成的组;

[0019] R^7选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、任选取代的苯基、任选取代的苄基、COR^8、CO_2R^9、$CONR^{10a}R^{10b}$、$SO_2NR^{10a}R^{10b}$和SO_2R^{10c}组成的组;

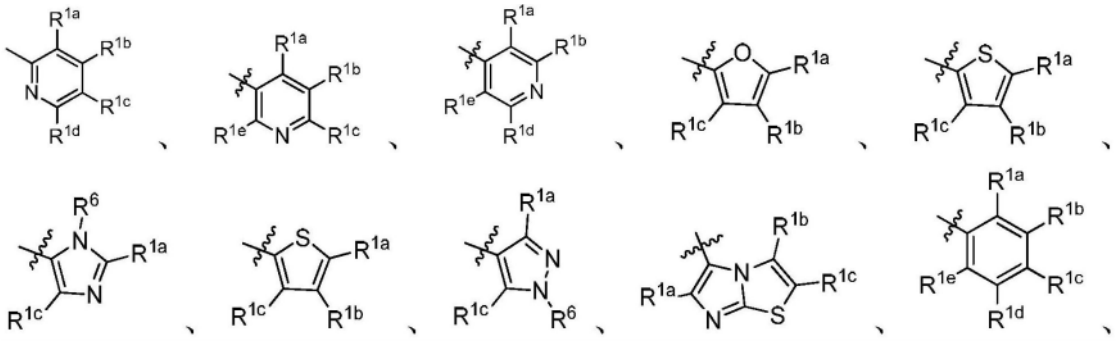
[0020] R^8选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

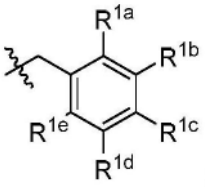
[0021] R^9选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

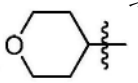
[0022] R^{10a}选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0023] R^{10b}选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0024] R^{10c}选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、$-(CH_2)_qCN$、$-(CH_2)_qSO_2R^{11}$、$-(CH_2)_qOR^{12}$、





和 

组成的组；

[0025] R^{11}选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0026] R^{12}选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0027] R^{1a}、R^{1b}、R^{1c}、R^{1d}和R^{1e}在每次出现时独立地选自由H、OH、NO_2、卤素、CN、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、-S(C_{1-6}直链烷基)、S(C_{3-7}支链烷基)、-S(C_{3-7}环烷基)、COR^{13}、CO_2R^{14}、$CONR^{15a}R^{15b}$、$SO_2NR^{15a}R^{15b}$、$NR^{16a}R^{16b}$、$NR^{16a}COR^{17}$、$NR^{16a}SO_2R^{18}$和$NR^{16a}SO_2NR^{19a}R^{19b}$组成的组；

[0028] R^{13}在每次出现时独立地选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0029] R^{14}在每次出现时独立地选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0030] R^{15a}在每次出现时独立地选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0031] R^{15b}在每次出现时独立地选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0032] R^{16a}在每次出现时独立地选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0033] R^{16b}在每次出现时独立地选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0034] R^{17}在每次出现时独立地选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

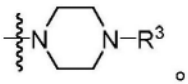
[0035] R^{18}在每次出现时独立地选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0036] R^{19a}在每次出现时独立地选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0037] R^{19b}在每次出现时独立地选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

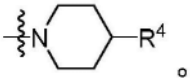
[0038] n为1、2、3或4；

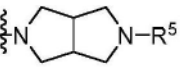
[0039] m为1、2或3。

[0040] 在实施方案中，A为 

。在实施方案中，n为1、2或3。在实施方案中，n为1或2。在实施方案中，n为1。在实施方案中，n为2。在实施方案中，R^1和R^2中的每个为未取代的C_{1-6}烷基(例如，R^1和R^2中的每个为甲基，或者R^1和R^2中的每个为乙基)。在实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成5至8元环(例如，C_3-C_8环烷基、C_5-C_8环烯基或包含环原子NR^7的5至8元环)。在实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成环丙基、环丁基、环戊基、环戊烯基、环己基、环己烯基、环庚基、环庚烯基、环辛基、环辛烯基、吡咯烷基或

哌啶基,其中所述吡咯烷基或哌啶基中的氮原子为NR^7。在实施方案中,R^7为烷基磺酰基-SO_2R^{10c}(例如,-SO_2Me)或酰基-COR^8(例如,乙酰基)。在实施方案中,R^3为苯基或吡啶基。在实施方案中,R^3为未取代的。在实施方案中,R^3为取代的(例如,被1、2、3、4或5个取代基取代的苯基或被1、2、3或4个取代基取代的吡啶基)。在实施方案中,取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^{n}Pr、-O^{i}Pr、-OCF_3、-Me、-Et、-^{n}Pr、-^{i}Pr、-CF_3、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

[0041] 在实施方案中,A为  。在实施方案中,n为1、2或3。在实施方案中,n为1或2。在实施方案中,n为1。在实施方案中,n为2。在实施方案中,R^1和R^2中的每个为未取代的C_{1-6}烷基(例如,R^1和R^2中的每个为甲基,或者R^1和R^2中的每个为乙基)。在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成5至8元环(例如,C_3-C_8环烷基、C_5-C_8环烯基或包含环原子NR^7的5至8元环)。在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成环丙基、环丁基、环戊基、环戊烯基、环己基、环己烯基、环庚基、环庚烯基、环辛基、环辛烯基、吡咯烷基或哌啶基,其中所述吡咯烷基或哌啶基中的氮原子为NR^7。在实施方案中,R^7为烷基磺酰基-SO_2R^{10c}(例如,-SO_2Me)或酰基-COR^8(例如,乙酰基)。在实施方案中,R^4为苯基或吡啶基。在实施方案中,R^4为未取代的。在实施方案中,R^4为取代的(例如,被1、2、3、4或5个取代基取代的苯基或被1、2、3或4个取代基取代的吡啶基)。在实施方案中,取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^{n}Pr、-O^{i}Pr、-OCF_3、-Me、-Et、-^{n}Pr、-^{i}Pr、-CF_3、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

[0042] 在实施方案中,A为  。在实施方案中,n为1、2或3。在实施方案中,n为1或2。在实施方案中,n为1。在实施方案中,n为2。在实施方案中,R^1和R^2中的每个为未取代的C_{1-6}烷基(例如,R^1和R^2中的每个为甲基,或者R^1和R^2中的每个为乙基)。在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成5至8元环(例如,C_3-C_8环烷基、C_5-C_8环烯基或包含环原子NR^7的5至8元环)。在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成环丙基、环丁基、环戊基、环戊烯基、环己基、环己烯基、环庚基、环庚烯基、环辛基、环辛烯基、吡咯烷基或哌啶基,其中所述吡咯烷基或哌啶基中的氮原子为NR^7。在实施方案中,R^7为烷基磺酰基-SO_2R^{10c}(例如,-SO_2Me)或酰基-COR^8(例如,乙酰基)。在实施方案中,R^5为苯基或吡啶基。在实施方案中,R^5为未取代的。在实施方案中,R^5为取代的(例如,被1、2、3、4或5个取代基取代的苯基或被1、2、3或4个取代基取代的吡啶基)。在实施方案中,取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^{n}Pr、-O^{i}Pr、-OCF_3、-Me、-Et、-^{n}Pr、-^{i}Pr、-CF_3、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

[0043] 在实施方案中,化合物为根据本文所述的任何式或其可药用盐。在实施方案中,化合物为本文所述的任何化合物或其可药用盐(例如,本文所述的表1至表39中的任一个中描述的化合物或其可药用盐)。在实施方案中,化合物为表34至表39中的任一个中描述的任何化合物或其可药用盐。

[0044] 在实施方案中,化合物在内酰胺的氮取代的碳上具有S构型。在实施方案中,化合物在内酰胺的氮取代的碳上具有R构型。

[0045] 本发明还涉及包含下列的组合物:

[0046] 有效量的一种或多种根据本发明的化合物以及赋形剂。

[0047] 本发明还涉及一种用于治疗或预防涉及5-羟色胺受体7活性失调的疾病的方法，所述疾病包括例如昼夜节律紊乱、抑郁症、精神分裂症、神经源性炎症、高血压、外周血管疾病、偏头痛、神经病理性疼痛、末梢性疼痛、异常性疼痛、体温调节障碍、学习障碍、记忆障碍、海马信号传导障碍、睡眠障碍、注意力缺陷/多动障碍、焦虑症、回避型人格障碍、早泄、进食障碍、经前期综合征、经前期烦躁障碍、季节性情感障碍、双相障碍、炎性肠病(IBD)、肠炎、癫痫、癫痫疾病、药物成瘾、酒精成瘾、乳腺癌、肝纤维化、慢性肝损伤、肝细胞癌、小肠神经内分泌肿瘤和肺损伤，所述方法包括向受试者施用有效量的根据本发明的化合物或组合物。

[0048] 本发明还涉及一种用于治疗或预防涉及5-羟色胺受体7活性失调的疾病的方法，所述疾病包括例如昼夜节律紊乱、抑郁症、精神分裂症、神经源性炎症、高血压、外周血管疾病、偏头痛、神经病理性疼痛、末梢性疼痛、异常性疼痛、体温调节障碍、学习障碍、记忆障碍、海马信号传导障碍、睡眠障碍、注意力缺陷/多动障碍、焦虑症、回避型人格障碍、早泄、进食障碍、经前期综合征、经前期烦躁障碍、季节性情感障碍、双相障碍、炎性肠病(IBD)、肠炎、癫痫、癫痫疾病、药物成瘾、酒精成瘾、乳腺癌、肝纤维化、慢性肝损伤、肝细胞癌、小肠神经内分泌肿瘤和肺损伤，其中所述方法包括向受试者施用包含有效量的一种或多种根据本发明的化合物以及赋形剂的组合物。

[0049] 本发明还涉及一种用于治疗或预防疾病或病症的方法，所述疾病或病症与昼夜节律紊乱、抑郁症、精神分裂症、神经源性炎症、高血压、外周血管疾病、偏头痛、神经病理性疼痛、末梢性疼痛、异常性疼痛、体温调节障碍、学习障碍、记忆障碍、海马信号传导障碍、睡眠障碍、注意力缺陷/多动障碍、焦虑症、回避型人格障碍、早泄、进食障碍、经前期综合征、经前期烦躁障碍、季节性情感障碍、双相障碍、炎性肠病(IBD)、肠炎、癫痫、癫痫疾病、药物成瘾、酒精成瘾、乳腺癌、肝纤维化、慢性肝损伤、肝细胞癌、小肠神经内分泌肿瘤和肺损伤以及涉及5-羟色胺受体7活性失调的疾病相关。所述方法包括向受试者施用有效量的根据本发明的化合物或组合物。

[0050] 本发明还涉及一种用于治疗或预防疾病或病症的方法，所述疾病或病症与昼夜节律紊乱、抑郁症、精神分裂症、神经源性炎症、高血压、外周血管疾病、偏头痛、神经病理性疼痛、末梢性疼痛、异常性疼痛、体温调节障碍、学习障碍、记忆障碍、海马信号传导障碍、睡眠障碍、注意力缺陷/多动障碍、焦虑症、回避型人格障碍、早泄、进食障碍、经前期综合征、经前期烦躁障碍、季节性情感障碍、双相障碍、炎性肠病(IBD)、肠炎、癫痫、癫痫疾病、药物成瘾、酒精成瘾、乳腺癌、肝纤维化、慢性肝损伤、肝细胞癌、小肠神经内分泌肿瘤和肺损伤以及涉及5-羟色胺受体7活性失调的疾病相关，其中所述方法包括向受试者施用包含有效量的一种或多种根据本发明的化合物以及赋形剂的组合物。

[0051] 本发明还涉及一种用于治疗或预防与5-羟色胺受体7活性失调有关的疾病或病症的方法。所述方法包括向受试者施用有效量的根据本发明的化合物或组合物。

[0052] 本发明还涉及一种用于治疗或预防与5-羟色胺受体7活性失调有关的疾病或病症的方法，其中所述方法包括向受试者施用包含有效量的一种或多种根据本发明的化合物以及赋形剂的组合物。

[0053] 本发明还涉及一种用于制备本发明的5-羟色胺受体7活性调节剂的方法。

[0054] 在实施方案中,疾病或病症是炎性肠病(IBD)。

[0055] 通过阅读下面的具体实施方式和所附权利要求,上述和其他目的、特征和优点对于本领域的普通技术人员将变得显而易见。除非另外指明,否则本文中的所有百分比、比率和比例均按重量计。除非另外指明,否则所有温度均以摄氏度(℃)为单位。所有引用的文献的相关部分以引用方式并入本文;对任何文献的引用不应理解为承认就本发明而言其为现有技术。

具体实施方式

[0056] 有证据表明5-HT_7受体在多种医学疾病中的作用。5-HT_7受体活性调节剂可能对患有这些疾病的患者具有有益作用。其中5-HT_7失调发挥作用并且通过治疗剂调节5-HT_7受体活性可能是治疗性缓解的可行方法的疾病包括但不限于昼夜节律紊乱、抑郁症、精神分裂症、神经源性炎症、高血压、外周血管疾病、偏头痛(Vanhoenacker,P.等人,Trends in Pharmacological Sciences,2000,21,2,70-77)、神经病理性疼痛、末梢性疼痛、异常性疼痛(EP1875899)、体温调节障碍、学习障碍、记忆障碍、海马信号传导障碍、睡眠障碍(WO20100197700)、注意力缺陷/多动障碍(ADHD)(WO20100069390)、焦虑症、回避型人格障碍、早泄、进食障碍、经前期综合征、经前期烦躁障碍、季节性情感障碍、双相障碍(WO20040229874)、炎性肠病(IBD)、肠炎(WO 2012058769,Khan,W.I.等人,Journal of Immunology,2013,190,4795-4804)、癫痫、癫痫疾病(Epilepsy Research(2007)75,39)、药物成瘾、酒精成瘾(Hauser,S.R.等人,Frontiers in Neuroscience,2015,8,1-9)、乳腺癌(Gautam,J.Molecular Cancer,2016,15,75,1-14,Gautam,J.Breast Cancer Research and Treatment,2017,161,29-40)、肝纤维化、慢性肝损伤(Halici,Z.International Immunopharmacology,2017,43,227-235)、肝细胞癌(Bian,Z.X.Molecular Oncology,2016,10,195-212)、小肠神经内分泌肿瘤(Modlin,I.M.Cancer Science,2013,104,7,844-855)和肺损伤(Halici,Z.Immunology,2013,1271-1283)。

[0057] 因此,长期需要新的5-HT_7调节剂,其将为患有与5-羟色胺受体7活性失调相关的疾病的患者提供治疗性缓解。本发明解决了鉴定能够治疗与5-羟色胺受体7活性失调相关的疾病的新型5-HT7调节剂的需求。本发明解决了开发新治疗剂的需求,该治疗剂用于治疗和预防昼夜节律紊乱、抑郁症、精神分裂症、神经源性炎症、高血压、外周血管疾病、偏头痛、神经病理性疼痛、末梢性疼痛、异常性疼痛、体温调节障碍、学习障碍、记忆障碍、海马信号传导障碍、睡眠障碍、注意力缺陷/多动障碍、焦虑症、回避型人格障碍、早泄、进食障碍、经前期综合征、经前期烦躁障碍、季节性情感障碍、双相障碍、炎性肠病(IBD)、肠炎、癫痫、癫痫疾病、药物成瘾、酒精成瘾、乳腺癌、肝纤维化、慢性肝损伤、肝细胞癌、小肠神经内分泌肿瘤和肺损伤。

[0058] 本发明的5-羟色胺受体7活性调节剂能够治疗和预防与5-羟色胺受体7活性失调有关的疾病,例如昼夜节律紊乱、抑郁症、精神分裂症、神经源性炎症、高血压、外周血管疾病、偏头痛、神经病理性疼痛、末梢性疼痛、异常性疼痛、体温调节障碍、学习障碍、记忆障碍、海马信号传导障碍、睡眠障碍、注意力缺陷/多动障碍、焦虑症、回避型人格障碍、早泄、进食障碍、经前期综合征、经前期烦躁障碍、季节性情感障碍、双相障碍、炎性肠病(IBD)、肠炎、癫痫、癫痫疾病、药物成瘾、酒精成瘾、乳腺癌、肝纤维化、慢性肝损伤、肝细胞癌、小肠神

经内分泌肿瘤和肺损伤。已发现5-羟色胺受体7在多种医学疾病中起作用,因此,5-HT_7受体活性调节剂可能对患有这些疾病的患者具有有益作用。其中5-HT_7失调发挥作用并且通过治疗剂调节5-HT_7受体活性可能是治疗性缓解的可行方法的疾病包括但不限于昼夜节律紊乱、抑郁症、精神分裂症、神经源性炎症、高血压、外周血管疾病、偏头痛(Vanhoenacker,P.等人,Trends in Pharmacological Sciences,2000,21,2,70-77)、神经病理性疼痛、末梢性疼痛、异常性疼痛(EP1875899)、体温调节障碍、学习障碍、记忆障碍、海马信号传导障碍、睡眠障碍(WO20100197700)、注意力缺陷/多动障碍(ADHD)(WO20100069390)、焦虑症、回避型人格障碍、早泄、进食障碍、经前期综合征、经前期烦躁障碍、季节性情感障碍、双相障碍(WO20040229874)、炎性肠病(IBD)、肠炎(WO 2012058769)、癫痫、癫痫疾病(Epilepsy Research(2007)75,39)、药物成瘾、酒精成瘾(Hauser,S.R.等人,Frontiers in Neuroscience,2015,8,1-9)、乳腺癌(Gautam,J.Molecular Cancer,2016,15,75,1-14,Gautam,J.Breast Cancer Research and Treatment,2017,161,29-40)、肝纤维化、慢性肝损伤(Halici,Z.International Immunopharmacology,2017,43,227-235)、肝细胞癌(Bian,Z.X.Molecular Oncology,2016,10,195-212)、小肠神经内分泌肿瘤(Modlin,I.M.Cancer Science,2013,104,7,844-855)和肺损伤(Halici,Z.Immunology,2013,1271-1283)。

[0059] 不希望受理论限制,据信本发明的5-羟色胺受体7受体活性调节剂可以改善、减轻或以其他方式使得控制与5-羟色胺受体7活性失调相关的疾病。这些疾病包括但不限于昼夜节律紊乱、抑郁症、精神分裂症、神经源性炎症、高血压、外周血管疾病、偏头痛、神经病理性疼痛、末梢性疼痛、异常性疼痛、体温调节障碍、学习障碍、记忆障碍、海马信号传导障碍、睡眠障碍、注意力缺陷/多动障碍、焦虑症、回避型人格障碍、早泄、进食障碍、经前期综合征、经前期烦躁障碍、季节性情感障碍、双相障碍、炎性肠病(IBD)、肠炎、癫痫、癫痫疾病、药物成瘾、酒精成瘾、乳腺癌、肝纤维化、慢性肝损伤、肝细胞癌、小肠神经内分泌肿瘤和肺损伤。

[0060] 在实施方案中,疾病是抑郁症、精神分裂症、焦虑症或躁郁症。在实施方案中,疾病是抑郁症。在实施方案中,疾病是精神分裂症。在实施方案中,疾病是焦虑症。在实施方案中,疾病是躁郁症。

[0061] 在实施方案中,疾病是注意力缺陷/多动障碍。

[0062] 在实施方案中,疾病是回避型人格障碍。

[0063] 在实施方案中,疾病是季节性情感障碍。

[0064] 在实施方案中,疾病是昼夜节律紊乱或海马信号传导障碍。在实施方案中,疾病是昼夜节律紊乱。在实施方案中,疾病是海马信号传导障碍。

[0065] 在实施方案中,疾病是神经源性炎症。

[0066] 在实施方案中,疾病是神经性疼痛、末梢性疼痛或异常性疼痛。在实施方案中,疾病是神经性疼痛。在实施方案中,疾病是末梢性疼痛。在实施方案中,疾病是异常性疼痛。

[0067] 在实施方案中,疾病是偏头痛。

[0068] 在实施方案中,疾病是癫痫或癫痫疾病。在实施方案中,疾病是癫痫。在实施方案中,疾病是癫痫疾病。

[0069] 在实施方案中,疾病是学习障碍或记忆障碍。在实施方案中,疾病是学习障碍。在

实施方案中,疾病是记忆障碍。

[0070] 在实施方案中,疾病是进食障碍。

[0071] 在实施方案中,疾病是药物成瘾或酒精成瘾。

[0072] 在实施方案中,疾病是睡眠障碍。

[0073] 在实施方案中,疾病是高血压或外周血管疾病。在实施方案中,疾病是高血压。在实施方案中,疾病是外周血管疾病。

[0074] 在实施方案中,疾病是体温调节障碍。

[0075] 在实施方案中,疾病是早泄。

[0076] 在实施方案中,疾病是经前期综合征或经前期烦躁障碍。在实施方案中,疾病是经前期综合症。在实施方案中,疾病是经前期烦躁障碍。

[0077] 在实施方案中,疾病是炎性肠病(IBD)或肠炎。在实施方案中,疾病是炎性肠病(IBD)。在实施方案中,疾病是肠炎。

[0078] 在实施方案中,疾病是乳腺癌。

[0079] 在实施方案中,疾病是肝纤维化、慢性肝损伤或肝细胞癌。在实施方案中,疾病是肝纤维化。在实施方案中,疾病是慢性肝损伤。在实施方案中,疾病是肝细胞癌。

[0080] 在实施方案中,疾病是小肠神经内分泌肿瘤。

[0081] 在实施方案中,疾病是肺损伤。

[0082] 在实施方案中,疾病是炎性肠病(IBD)。

[0083] 在实施方案中,本文所述的化合物是血清素5HT7受体的选择性调节剂。在实施方案中,与其他靶标(例如,其他血清素受体)相比,本文所述的化合物可以更有效地结合血清素5HT7受体。在实施方案中,化合物可以在特定组织或器官中选择性结合血清素5HT7受体。

[0084] 在实施方案中,本文所述的化合物可以具有用于有效治疗(例如,本文所述的任何疾病或病症的治疗)的特别有利的性质。例如,在CNS或精神障碍的治疗中,本文所述的化合物可以表现出有利的有效血脑屏障通透性。替代地,在非CNS或非精神障碍的治疗中,本文所述的化合物将不具有高的血脑屏障通透性(例如,脱靶效应将被降低)。不受理论的束缚,化合物的分子元素可以是获得所需生物靶向的有效策略。

[0085] 例如,本文所述的化合物可以在受试者的肠中选择性结合血清素5HT7受体。因此,化合物可用于治疗或预防炎性肠病(IBD)或肠炎。

[0086] 在整个说明书中,当组合物被描述为具有、包括或包含特定组分时,或者在方法被描述为具有、包括或包含特定的方法步骤时,可以设想,本教导内容的组合物也基本上由所列举组分组成或者由所列举组分组成,并且本教导内容的方法也基本上由所列举方法步骤组成或者由所列举方法步骤组成。

[0087] 在应用中,其中元素或组分被称为包括在所列举元素或组分中和/或选自所列举元素或组分,应当理解,所述元素或组分可以是所列举元素或组分中的任一个,并且可以选自所列举元素或组分中的两个或更多个。

[0088] 除非另外明确说明,否则本文中单数的使用包括复数(反之亦然)。另外,在定量值之前使用术语“约”时,除非另外明确说明,否则本教导内容还包括具体定量值本身。

[0089] 应当理解,只要本教导内容仍然可操作,步骤的顺序或执行某些动作的顺序是不重要的。此外,可以同时进行两个或更多个步骤或动作。

[0090] 如本文所用,术语“卤素”应意指氯、溴、氟和碘。

[0091] 如本文所用,除非另有说明,否则“烷基”和/或“脂族”无论单独使用还是作为取代基基团的一部分使用,均指具有1至20个碳原子或在该范围内的任何数目(例如1至6个碳原子或1至4个碳原子)的直链和支链碳链。碳原子的指定数目(例如C_{1-6})应独立地指烷基部分中的碳原子数目或指较大的含烷基的取代基的烷基部分的碳原子数目。烷基基团的非限制性实例包括甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基等。烷基基团可以任选地被取代。取代的烷基基团的非限制性实例包括羟甲基、氯甲基、三氟甲基、氨基甲基、1-氯乙基、2-羟乙基、1,2-二氟乙基、3-羧丙基等。在具有多个烷基基团的取代基如(C_{1-6}烷基)$_2$氨基中,烷基基团可以相同或不同。

[0092] 如本文所用,术语“烯基”和“炔基”基团无论单独使用还是作为取代基基团的一部分使用,是指具有2个或更多个、优选2至20个碳原子的直链和支链碳链,其中烯基链在链中具有至少一个双键,炔基链在链中具有至少一个三键。烯基基团和炔基基团可以任选地被取代。烯基基团的非限制性实例包括乙烯基、3-丙烯基、1-丙烯基(也为2-甲基乙烯基)、异丙烯基(也为2-甲基乙烯-2-基)、丁烯-4-基等。取代的烯基基团的非限制性实例包括2-氯乙烯基(也为2-氯代乙烯基)、4-羟基丁烯-1-基、7-羟基-7-甲基辛-4-烯-2-基、7-羟基-7-甲基辛-3,5-二烯-2-基等。炔基基团的非限制性实例包括乙炔基、丙-2-炔基(也为炔丙基)、丙炔-1-基和2-甲基-己-4-炔-1-基。取代的炔基基团的非限制性实例包括5-羟基-5-甲基己-3-炔基、6-羟基-6-甲基庚-3-炔-2-基、5-羟基-5-乙基庚-3-炔基等。

[0093] 如本文所用,“环烷基”无论单独使用还是作为另一基团的一部分使用,是指包含例如具有3至14个环碳原子、优选3至7个或3至6个环碳原子或者甚至3至4个环碳原子的环化烷基、烯基和炔基基团并且任选地含有一个或多个(例如,1、2或3个)双键或三键的非芳族含碳环。环烷基基团可以是单环(例如,环己基)或多环(例如,含有稠合、桥连和/或螺环体系)的,其中碳原子位于环系的内部或外部。环烷基基团的任何合适的环位置可以共价连接到限定的化学结构。环烷基环可以任选地被取代。环烷基基团的非限制性实例包括:环丙基、2-甲基-环丙基、环丙烯基、环丁基、2,3-二羟基环丁基、环丁烯基、环戊基、环戊烯基、环戊二烯基、环己基、环己烯基、环庚基、环辛基、十氢萘基、2,5-二甲基环戊基、3,5-二氯环己基、4-羟基环己基、3,3,5-三甲基环己-1-基、八氢并环戊二烯基、八氢-1H-茚基、3a,4,5,6,7,7a-六氢-3H-茚-4-基、十氢薁基;双环[6.2.0]癸基、十氢萘基和十二氢-1H-芴基。术语“环烷基”还包括作为双环烃环的碳环,其非限制性实例包括双环-[2.1.1]己基、双环[2.2.1]庚基、双环[3.1.1]庚基、1,3-二甲基[2.2.1]庚-2-基、双环[2.2.2]辛基和双环[3.3.3]十一烷基。

[0094] “卤代烷基”旨在包括被1个或多个卤素取代的具有指定碳原子数的支链和直链饱和脂族烃基。卤代烷基基团包括全卤代烷基基团,其中烷基基团的所有氢已被卤素置换(例如,-CF_3、-CF_2CF_3)。除卤素之外,卤代烷基还可任选地被一个或多个取代基取代。卤代烷基基团的实例包括但不限于氟甲基、二氯乙基、三氟甲基、三氯甲基、五氟乙基和五氯乙基基团。

[0095] 术语“烷氧基”是指基团-O-烷基,其中烷基基团如上文所定义。烷氧基基团任选地可以被取代。术语C_3-C_6环烷氧基是指含有3至6个碳原子和至少一个氧原子的环(例如,四氢呋喃、四氢-2H-吡喃)。C_3-C_6环烷氧基任选地可以被取代。

[0096] 术语“卤代烷氧基”是指基团-O-卤代烷基,其中卤代烷基基团如上文所定义。卤代烷氧基基团的实例包括但不限于氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基和五氟乙氧基。

[0097] 其中单独使用或作为另一基团的一部分使用的术语“芳基”在本文中定义为6个碳成员的不饱和芳族单环或含10至14个碳成员的不饱和芳族多环。芳基环可以是例如各自任选地被能够置换一个或多个氢原子的一个或多个部分取代的苯环或萘环。芳基基团的非限制性实例包括:苯基、亚萘-1-基、亚萘-2-基、4-氟苯基、2-羟基苯基、3-甲基苯基、2-氨基-4-氟苯基、2-(N,N-二乙基氨基)苯基、2-氰基苯基、2,6-二叔丁基苯基、3-甲氧基苯基、8-羟基亚萘-2-基-4,5-二甲氧基亚萘-1-基和6-氰基-亚萘-1-基。芳基基团还包括例如与一个或多个饱和或部分饱和的碳环(例如,双环[4.2.0]辛-1,3,5-三烯基、茚满基)稠合的苯环或萘环,其可在芳族环和/或饱和环或部分饱和环的一个或多个碳原子被取代。

[0098] 术语“芳基烷基”或“芳烷基”是指基团-烷基-芳基,其中烷基和芳基基团如本文所定义。本发明的芳烷基基团任选地被取代。芳烷基基团的实例包括例如苄基、1-苯基乙基、2-苯基乙基、3-苯基丙基、2-苯基丙基、芴基甲基等。

[0099] 术语“杂环”和/或“杂环基”无论单独使用还是作为另一基团的一部分使用,在本文中被定义为具有3至20个原子的一个或多个环,其中至少一个环中的至少一个原子是选自氮(N)、氧(O)或硫(S)的杂原子,并且其中包含杂原子的环是非芳族的。在包含2个或更多个稠合环的杂环基团中,带有非杂原子的环可为芳基(例如,二氢吲哚基、四氢喹啉基、苯并二氢吡喃基)。示例性杂环基团具有3至14个环原子,其中1至5个是独立地选自氮(N)、氧(O)或硫(S)的杂原子。杂环基团中的一个或多个N或S原子可以被氧化。杂环基团可以任选地被取代。

[0100] 具有单个环的杂环单元的非限制性实例包括:双吖丙啶基、吖丙啶基、尿唑基、吖丁啶基、吡唑烷基、咪唑烷基、噁唑烷基、异噁唑啉基、异噁唑基、噻唑烷基、异噻唑基、异噻唑啉基、噁噻唑烷酮基、噁唑烷酮基、乙内酰脲基、四氢呋喃基、吡咯烷基、吗啉基、哌嗪基、哌啶基、二氢吡喃基、四氢吡喃基、哌啶-2-酮基(戊内酰胺)、2,3,4,5-四氢-1H-氮杂卓基、2,3-二氢-1H-吲哚和1,2,3,4-四氢-喹啉。具有2个或更多个环的杂环单元的非限制性实例包括:六氢-1H-吡咯嗪基、3a,4,5,6,7,7a-六氢-1H-苯并[d]咪唑基、3a,4,5,6,7,7a-六氢-1H-吲哚基、1,2,3,4-四氢喹啉基、苯并二氢吡喃基、异苯并二氢吡喃基、二氢吲哚基、异吲哚啉基和十氢-1H-环辛[b]吡咯基。

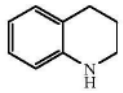
[0101] 术语“杂芳基”无论单独使用还是作为另一基团的一部分使用,在本文中被定义为具有5至20个原子的一个或多个环,其中至少一个环中的至少一个原子是选自氮(N)、氧(O)或硫(S)的杂原子,并且其中包含杂原子的环中的至少一个是芳族的。在包含2个或更多个稠合环的杂芳基基团中,带有非杂原子的环可为碳环(例如,6,7-二氢-5H-环戊嘧啶)或芳基(例如,苯并呋喃基、苯并噻吩基、吲哚基)。示例性杂芳基基团具有5至14个环原子,并且含有1至5个独立地选自氮(N)、氧(O)或硫(S)的环杂原子。杂芳基基团中的一个或多个N或S原子可以被氧化。杂芳基基团可以被取代。含有单个环的杂芳基环的非限制性实例包括:1,2,3,4-四唑基、[1,2,3]三唑基、[1,2,4]三唑基、三嗪基、噻唑基、1H-咪唑基、噁唑基、呋喃基、噻吩基、嘧啶基、2-苯基嘧啶基、吡啶基、3-甲基吡啶基和4-二甲基氨基吡啶基。含有2个或更多个稠环的杂芳基环的非限制性实例包括:苯并呋喃基、苯并噻吩基、苯并噁唑基、苯并噻唑基、苯并三唑基、噌啉基、萘啶基、菲啶基、7H-嘌呤基、9H-嘌呤基、6-氨基-9H-嘌呤

基、5H-吡咯并[3,2-d]嘧啶基、7H-吡咯并[2,3-d]嘧啶基、吡啶并[2,3-d]嘧啶基、2-苯基苯并[d]噻唑基、1H-吲哚基、4,5,6,7-四氢-1-H-吲哚基、喹喔啉基、5-甲基喹喔啉基、喹唑啉基、喹啉基、8-羟基-喹啉基、1H-苯并[d]咪唑-2(3H)-酮基、1H-苯并[d]咪唑基和异喹啉基。

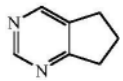
[0102] 如上所述的杂芳基基团的一个非限制性实例是C_1-C_5杂芳基,其具有1至5个碳环原子和至少一个作为独立地选自氮(N)、氧(O)或硫(S)的杂原子的其他环原子(优选1至4个作为杂原子的其他环原子)。C_1-C_5杂芳基的实例包括但不限于三嗪基、噻唑-2-基、噻唑-4-基、咪唑-1-基、1H-咪唑-2-基、1H-咪唑-4-基、异噁唑啉-5-基、呋喃-2-基、呋喃-3-基、噻吩-2-基、噻吩-4-基、嘧啶-2-基、嘧啶-4-基、嘧啶-5-基、吡啶-2-基、吡啶-3-基和吡啶-4-基。

[0103] 除非另有说明,否则当两个取代基合在一起形成具有指定环原子数的环(例如,R^2和R^3与它们所连接的氮(N)合在一起形成具有3至7个环成员的环)时,该环可具有碳原子和任选的一个或多个(例如,1至3个)独立地选自氮(N)、氧(O)或硫(S)的另外的杂原子。环可以是饱和的或部分饱和的,并且可以任选地被取代。

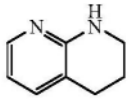
[0104] 出于本发明的目的,包含单个杂原子的稠环单元以及螺环、双环等将被认为属于对应于含杂原子的环的环状家族。例如,出于本发明的目的,具有下式的1,2,3,4-四氢喹啉:

[0105] 

[0106] 被认为是杂环单元。出于本发明的目的,具有下式的6,7-二氢-5H-环戊嘧啶:

[0107] 

[0108] 被认为是杂芳基单元。当稠环单元在饱和环和芳基环中都含有杂原子时,芳基环将占优势并确定为环所指定的类别类型。例如,出于本发明的目的,具有下式的1,2,3,4-四氢-[1,8]萘啶:

[0109] 

[0110] 被认为是杂芳基单元。

[0111] 每当术语或其任一前缀词根出现于取代基的名称中时,该名称应解释为包括本文提供的那些限制。例如,每当术语“烷基”或“芳基”或它们的任一前缀词根出现于取代基(例如,芳基烷基、烷基氨基)的名称中时,该名称应解释为包括上述对“烷基”和“芳基”给予的那些限制。

[0112] 术语“取代的”用于整个说明书中。术语“取代的”在本文中被定义为无论是无环的还是环状的,都具有被一个或若干个(例如,1至10个)如下文所定义的取代基置换的一个或多个氢原子的部分。取代基能够一次置换单个部分的一个或两个氢原子。另外,这些取代基可以置换两个相邻碳上的两个氢原子以形成所述取代基、新的部分或单元。例如,需要单个氢原子置换的取代单元包括卤素、羟基等。两个氢原子置换包括羰基、肟基等。从相邻碳原子进行的两个氢原子置换包括环氧树脂等。术语“取代的”在整个说明书中用于表示部分可具有被取代基置换的一个或多个氢原子。当部分被描述为“取代的”时,可以置换任何数目的氢原子。例如,二氟甲基是取代的C_1烷基;三氟甲基是取代的C_1烷基;4-羟基苯基是取代的芳环;(N,N-二甲基-5-氨基)辛基是取代的C_8烷基;3-胍基丙基是取代的C_3烷基;并且2-羧基

吡啶基是取代的杂芳基。

[0113] 本文定义的可变基团(例如本文定义的烷基、烯基、炔基、环烷基、烷氧基、芳氧基、芳基、杂环和杂芳基基团)无论单独使用还是作为另一基团的一部分使用,可以任选地被取代。任选取代的基团将如此表示。

[0114] 以下是可取代部分上的氢原子的取代基的非限制性实例:卤素(氯(Cl)、溴(Br)、氟(F)和碘(I))、-CN、-NO_2、氧(=O)、-OR^{26}、-SR^{26}、-$N(R^{26})_2$、-$NR^{26}C(O)R^{26}$、-SO_2R^{26}、-SO_2OR^{26}、-$SO_2N(R^{26})_2$、-$C(O)R^{26}$、-$C(O)OR^{26}$、-$C(O)N(R^{26})_2$、C_{1-6}烷基、C_{1-6}卤代烷基、C_{1-6}烷氧基、C_{2-8}烯基、C_{2-8}炔基、C_{3-14}环烷基、芳基、杂环或杂芳基,其中烷基、卤代烷基、烯基、炔基、烷氧基、环烷基、芳基、杂环和杂芳基基团中的每一个任选地被1-10个(例如,1-6或1-4个)独立地选自卤素、-CN、-NO_2、氧和R^{26}的基团取代;其中R^{26}在每次出现时独立地为氢、-OR^{27}、-SR^{27}、-$C(O)R^{27}$、-$C(O)OR^{27}$、-$C(O)N(R^{27})_2$、-SO_2R^{27}、-$S(O)_2OR^{27}$、-$N(R^{27})_2$、-$NR^{27}C(O)R^{27}$、C_{1-6}烷基、C_{1-6}卤代烷基、C_{2-8}烯基、C_{2-8}炔基、环烷基(例如,C_{3-6}环烷基)、芳基、杂环或杂芳基,或者两个R^{26}单元与它们所键合的原子合在一起形成任选取代的碳环或杂环,其中所述碳环或杂环具有3至7个环原子;其中R^{27}在每次出现时独立地为氢、C_{1-6}烷基、C_{1-6}环烷基、C_{2-8}烯基、C_{2-8}炔基、环烷基(例如,C_{3-6}环烷基)、芳基、杂环或杂芳基,或者两个R^{27}单元与它们所键合的原子合在一起形成任选取代的碳环或杂环,其中所述碳环或杂环优选地具有3至7个环原子。

[0115] 在一些实施方案中,取代基选自

[0116] i)-OR^{28};例如,-OH、-OCH_3、-OCH_2CH_3、-$OCH_2CH_2CH_3$;

[0117] ii)-$C(O)R^{28}$;例如,-$COCH_3$、-$COCH_2CH_3$、-$COCH_2CH_2CH_3$;

[0118] iii)-$C(O)OR^{28}$;例如,-CO_2CH_3、-$CO_2CH_2CH_3$、-$CO_2CH_2CH_2CH_3$;

[0119] iv)-$C(O)N(R^{28})_2$;例如,-$CONH_2$、-$CONHCH_3$、-$CON(CH_3)_2$;

[0120] v)-$N(R^{28})_2$;例如,-NH_2、-$NHCH_3$、-$N(CH_3)_2$、-$NH(CH_2CH_3)$;

[0121] vi)卤素:-F、-Cl、-Br和-I;

[0122] vii)-CH_eX_g;其中X为卤素,m为0至2,e+g=3;例如,-CH_2F、-CHF_2、-CF_3、-CCl_3或-CBr_3;

[0123] viii)viii)-SO_2R^{28};例如,-SO_2H、-SO_2CH_3、-$SO_2C_6H_5$;

[0124] ix)ix)C_1-C_6直链、支链或环状烷基;

[0125] x)x)氰基;

[0126] xi)xi)硝基;

[0127] xii)xii)$N(R^{28})C(O)R^{28}$;

[0128] xiii)xiii)氧(=O);

[0129] xiv)xiv)杂环;以及

[0130] xv)xv)杂芳基。

[0131] 其中每个R^{28}独立地为氢、任选取代的C_1-C_6直链或支链烷基(例如,任选取代的C_1-C_4直链或支链烷基)或任选取代的C_3-C_6环烷基(例如,任选取代的C_3-C_4环烷基);或者两个R^{28}单元可以合在一起形成包含3-7个环原子的环。在某些方面,每个R^{28}独立地为氢、任选地被卤素或C_3-C_6环烷基取代的C_1-C_6直链或支链烷基,或者C_3-C_6环烷基。

[0132] 在本说明书中的各处,化合物的取代基以组或范围的形式公开。具体地讲,描述包括这些组和范围中的成员的每一个单独子组合。例如,术语"C_{1-6}烷基"具体地讲旨在单独公

开C_1、C_2、C_3、C_4、C_5、C_6、C_1-C_6、C_1-C_5、C_1-C_4、C_1-C_3、C_1-C_2、C_2-C_6、C_2-C_5、C_2-C_4、C_2-C_3、C_3-C_6、C_3-C_5、C_3-C_4、C_4-C_6、C_4-C_5和C_5-C_6烷基。

[0133] 出于本发明的目的,术语“化合物”、“类似物”和“物质组合物”同样代表本文所述的5-羟色胺受体7活性调节剂,包括所有对映体形式、非对映体形式的盐等,并且术语“化合物”、“类似物”和“物质组合物”在本说明书中可互换使用。

[0134] 本文所述的化合物可含有不对称原子(也称为手性中心),并且一些化合物可含有一个或多个不对称原子或中心,因此可产生光学异构体(对映体)和非对映体。本文所公开的本教导内容和化合物包括这样的对映体和非对映体,以及外消旋和拆分的对映体纯R和S立体异构体,以及R和S立体异构体的其他混合物及其可药用盐。光学异构体可通过本领域技术人员已知的标准工序以纯形式获得,所述标准工序包括但不限于非对映体盐形成、动力学拆分和不对称合成。本教导内容还涵盖含有烯基部分(例如,烯烃和亚胺)的化合物的顺式和反式异构体。还应当理解,本教导内容涵盖所有可能的区域异构体及其混合物,这些可通过本领域技术人员已知的标准分离工序以纯形式获得,所述标准分离工序包括但不限于柱色谱、薄层色谱和高效液相色谱。

[0135] 可使用有机碱和无机碱形成本教导内容的化合物的可药用盐,其可具有酸性部分。可以设想单阴离子盐和多阴离子盐,具体取决于可用于去质子化的酸性氢的数量。与碱形成的合适的盐包括金属盐,例如碱金属盐或碱土金属盐,例如钠盐、钾盐或镁盐;氨盐和有机胺盐,例如与吗啉、硫代吗啉、哌啶、吡咯烷、单、二或三-低级烷基胺(例如,乙基-叔丁基胺、二乙基胺、二异丙基胺、三乙基胺、三丁基胺或二甲基丙基胺),或者单羟基、二羟基或三羟基低级烷基胺(例如,单乙醇胺、二乙醇胺或三乙醇胺)。无机碱的具体非限制性实例包括$NaHCO_3$、Na_2CO_3、$KHCO_3$、K_2CO_3、Cs_2CO_3、LiOH、NaOH、KOH、NaH_2PO_4、Na_2HPO_4和Na_3PO_4。也可以形成内盐。类似地,当本文所公开的化合物含有碱性部分时,可以使用有机酸和无机酸形成盐。例如,盐可以由以下酸形成:乙酸、丙酸、乳酸、苯磺酸、苯甲酸、樟脑磺酸、柠檬酸、酒石酸、琥珀酸、二氯乙酸、乙烯磺酸、甲酸、富马酸、葡糖酸、谷氨酸、马尿酸、氢溴酸、盐酸、羟乙磺酸、乳酸、马来酸、苹果酸、丙二酸、扁桃酸、甲磺酸、粘酸、萘磺酸、硝酸、草酸、双羟萘酸、泛酸、磷酸、邻苯二甲酸、丙酸、琥珀酸、硫酸、酒石酸、甲苯磺酸和樟脑磺酸,以及其他已知的可药用酸。

[0136] 当任何变量在任何成分或任何公式中出现多于一次时,其在每次出现时的定义与其在所有其他时候出现时的定义无关(例如,在N(R9)2中,每个R9可以彼此相同或不同)。只有在这种组合产生稳定的化合物时,取代基和/或变量的组合才是允许的。

[0137] 如本文所用的术语“治疗”是指部分或完全地减轻、抑制、改善和/或缓解患者怀疑患有的病症。

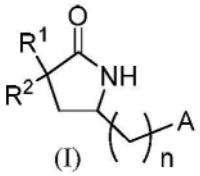
[0138] 如本文所用,“治疗有效”和“有效剂量”是指引发期望的生物活性或效果的物质或量。

[0139] 除非另有说明,否则术语“受试者”或“患者”可互换使用,并且是指哺乳动物如人类患者和非人类灵长类动物,以及实验动物如兔、大鼠和小鼠,以及其他动物。因此,如本文所用的术语“受试者”或“患者”意指可以施用本发明化合物的任何哺乳动物患者或受试者。在本发明的一个示例性实施方案中,为了鉴定根据本发明的方法进行治疗的受试患者,采用公认的筛选方法来确定与靶向或疑似疾病或病症相关的风险因素或者确定受试者中现

有疾病或病症的状态。这些筛选方法包括例如常规检查,以确定可能与靶向或疑似疾病或病症相关的风险因素。这些和其他常规方法使临床医生能够使用本发明的方法和化合物选择需要治疗的患者。

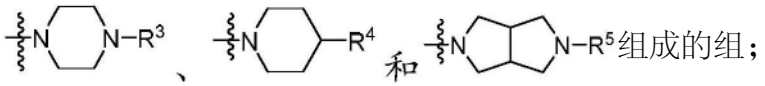
[0140] 5-羟色胺受体7活性调节剂

[0141] 本发明涉及新型5-羟色胺受体7(5-HT7)活性调节剂,即式(I)的化合物,

[0142] 

(I)

[0143] 包括其对映体、非对映体、水合物、溶剂化物、可药用盐、前药和复合物,其中:

[0144] A选自由  组成的组;

[0145] R^1选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基组成的组;

[0146] R^2选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基组成的组;

[0147] 或者R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有5至7个环原子的环,该环任选地包含双键;

[0148] 或者R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有6至8个环原子的环,该环原子包含选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组的部分;

[0149] R^3选自由任选取代的苯基、任选取代的萘-1-基、任选取代的萘-2-基、任选取代的2-吡啶基、任选取代的3-吡啶基、任选取代的4-吡啶基和 组成的组;

[0150] R^4选自由任选取代的苯基、任选取代的萘-1-基、任选取代的萘-2-基、任选取代的2-吡啶基、任选取代的3-吡啶基、任选取代的4-吡啶基和 组成的组;

[0151] R^5选自由任选取代的苯基、任选取代的萘-1-基、任选取代的萘-2-基、任选取代的2-吡啶基、任选取代的3-吡啶基、任选取代的4-吡啶基和 组成的组;

[0152] R^6选自由任选取代的苯基、任选取代的萘-1-基、任选取代的萘-2-基、任选取代的2-吡啶基、任选取代的3-吡啶基和任选取代的4-吡啶基组成的组;

[0153] R^7选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、任选取代的苯基、任选取代的苄基、COR^8、CO_2R^9、$CONR^{10a}R^{10b}$、$SO_2NR^{10a}R^{10b}$和SO_2R^{10c}组成的组;

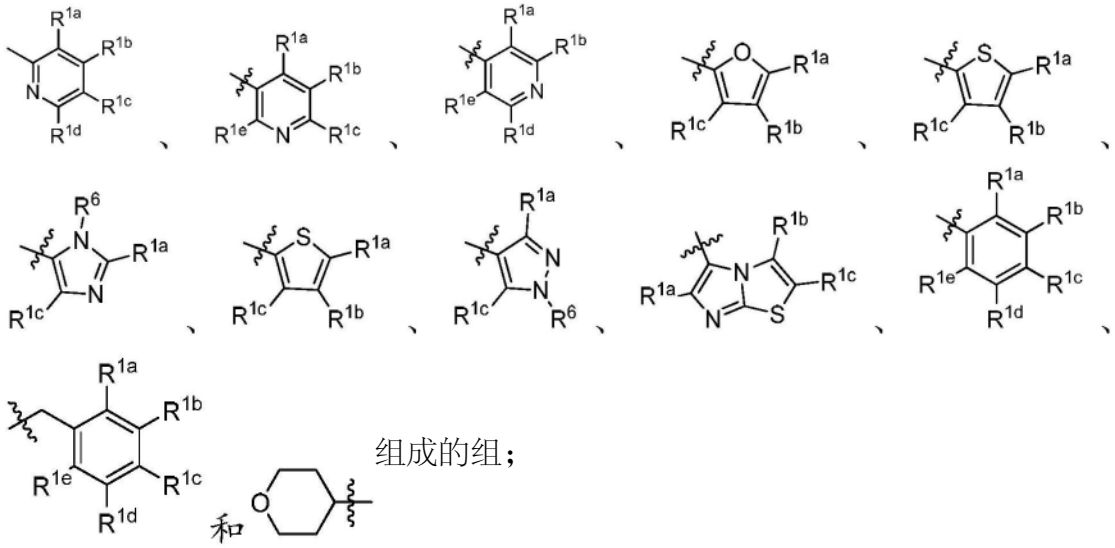
[0154] R^8选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0155] R^9选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0156] R^{10a}选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0157] R^{10b}选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0158] R^{10c}选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、$-(CH_2)_qCN$、$-(CH_2)_qSO_2R^{11}$、$-(CH_2)_qOR^{12}$、



组成的组；

[0159] R^{11}选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0160] R^{12}选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0161] R^{1a}、R^{1b}、R^{1c}、R^{1d}和R^{1e}在每次出现时独立地选自由H、OH、NO_2、卤素、CN、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、-S(C_{1-6}直链烷基)、S(C_{3-7}支链烷基)、-S(C_{3-7}环烷基)、COR^{13}、CO_2R^{14}、$CONR^{15a}R^{15b}$、$SO_2NR^{15a}R^{15b}$、$NR^{16a}R^{16b}$、$NR^{16a}COR^{17}$、$NR^{16a}SO_2R^{18}$和$NR^{16a}SO_2NR^{19a}R^{19b}$组成的组；

[0162] R^{13}在每次出现时独立地选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0163] R^{14}在每次出现时独立地选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0164] R^{15a}在每次出现时独立地选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0165] R^{15b}在每次出现时独立地选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0166] R^{16a}在每次出现时独立地选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0167] R^{16b}在每次出现时独立地选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0168] R^{17}在每次出现时独立地选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0169] R^{18}在每次出现时独立地选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

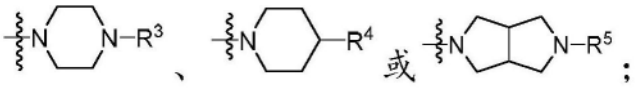
[0170] R^{19a}在每次出现时独立地选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0171] R^{19b}在每次出现时独立地选自由C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0172] n为1、2、3或4；

[0173] m为1、2或3。

[0174] 在实施方案中，

[0175] A为  ；

[0176] 每个R^1和R^2独立地为C_{1-6}直链烷基或C_{3-7}支链烷基；或者R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成5至8元环，

[0177] 其中所述5至8元环是饱和的或包含碳-碳双键和/或环原子O、S、SO、SO_2或NR^7；

[0178] 每个R^3、R^4和R^5独立地为任选取代的苯基、任选取代的2-吡啶基、任选取代的3-吡啶基或任选取代的4-吡啶基；

[0179] R^6独立地为任选取代的苯基、任选取代的2-吡啶基、任选取代的3-吡啶基或任选取代的4-吡啶基；

[0180] R^7独立地为H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、COR^8或SO_2R^{10c}；

[0181] R^8选自由H、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

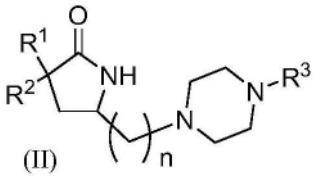
[0182] R^{10c}为C_{1-6}直链烷基或C_{3-7}支链烷基；

[0183] n为1、2、3或4；并且

[0184] m为1、2或3。

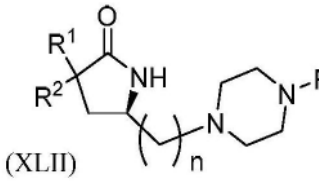
[0185] 在实施方案中，n为1、2或3。在实施方案中，n为1。在实施方案中，n为2。在实施方案中，n为3。

[0186] 本发明的实施方案包括具有式(II)的化合物：

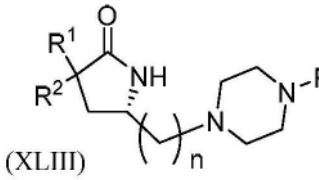
[0187] 
(II)

[0188] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物。

[0189] 在实施方案中，化合物具有式(XLII)：

[0190] 
(XLII) 或其可药用盐。

[0191] 在实施方案中，化合物具有式(XLIII)：

[0192] 
(XLIII) 或其可药用盐。

[0193] 在实施方案中，n为1、2或3。在实施方案中，n为1。在实施方案中，n为2。在实施方案中，n为3。在实施方案中，n为1或2。

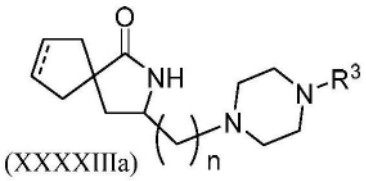
[0194] 在实施方案中，R^1和R^2中的每个为未取代的C_{1-6}烷基。在实施方案中，R^1和R^2中的每个为乙基。在实施方案中，R^1和R^2中的每个为甲基。

[0195] 在实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成5至8元环，该环任选地包含一个碳-碳双键和/或选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组的环原子。

[0196] 在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成C_3-C_8环烷基或C_5-C_8环烯基。

[0197] 在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成选自由环丙基、环丁基、环戊基、环戊烯基、环己基、环己烯基、环庚基、环庚烯基、环辛基和环辛烯基组成的组的C_3-C_8环烷基或C_5-C_8环烯基。在实施方案中,所述C_3-C_8环烷基或C_5-C_8环烯基为未取代的。在实施方案中,所述C_3-C_8环烷基或C_5-C_8环烯基被1、2、3或4个取代基(例如,本文所述的1或2个取代基)取代。在实施方案中,所述取代基选自氧(=O)、羟基、卤基、氰基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{1-6}卤代烷基、C_{3-8}环烷基和3至8元杂环基。在实施方案中,所述取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^{n}Pr、-O^{i}Pr、-OCF_3、-Me、-Et、-^{n}Pr、-^{i}Pr、-CF_3、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

[0198] 在实施方案中,化合物具有根据式(XXXXIIIa)的结构:

[0199] 

(XXXXIIIa) 或,

[0200] 其可药用盐,其中------表示单键或双键。

[0201] 在实施方案中,------表示单键。

[0202] 在实施方案中,------表示双键。

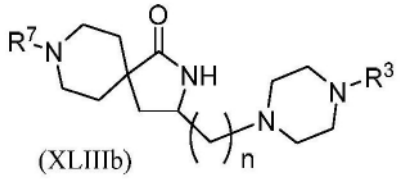
[0203] 在实施方案中,被氮取代的内酰胺立构中心具有R-构型。

[0204] 在实施方案中,被氮取代的内酰胺立构中心具有S-构型。

[0205] 在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成包含环原子NR^7的5至8元环。在实施方案中,所述5至8元环不被进一步取代。在实施方案中,所述5至8元环还包含1、2、3或4个取代基(例如,如本文所述的1或2个取代基)。在实施方案中,所述取代基选自氧(=O)、羟基、卤基、氰基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{1-6}卤代烷基、C_{3-8}环烷基和3至8元杂环基。在实施方案中,所述取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^{n}Pr、-O^{i}Pr、-OCF_3、-Me、-Et、-^{n}Pr、-^{i}Pr、-CF_3、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

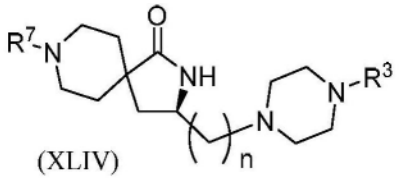
[0206] 在实施方案中,R^1和R^2合在一起形成吡咯烷基或哌啶基,其中氮原子为NR^7。在实施方案中,所述吡咯烷基或哌啶基不被进一步取代。在实施方案中,所述吡咯烷基或哌啶基还包含1、2、3或4个如本文所述的取代基。

[0207] 在实施方案中,化合物具有式(XLIIIb)

[0208] 

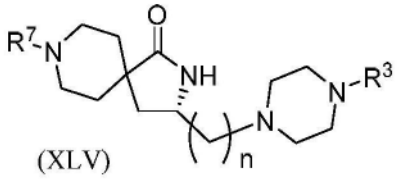
(XLIIIb) 或其可药用盐。,

[0209] 在实施方案中,化合物具有式(XLIV)

[0210]  或其可药用盐。

(XLIV)

[0211] 在实施方案中,化合物具有式(XLV)

[0212]  或其可药用盐。

(XLV)

[0213] 在实施方案中,n为1、2或3。在实施方案中,n为1。在实施方案中,n为2。在实施方案中,n为3。在实施方案中,n为1或2。

[0214] 在实施方案中,R^7为COR^8,并且R^8为C_{1-6}直链烷基。

[0215] 在实施方案中,R^7为乙酰基。

[0216] 在实施方案中,R^7为SO_2R^{10c},并且R^{10c}为C_{1-6}直链烷基。

[0217] 在实施方案中,R^{10c}为甲基(即,R^7为SO_2Me)。

[0218] 在实施方案中,R^3为未取代的苯基。

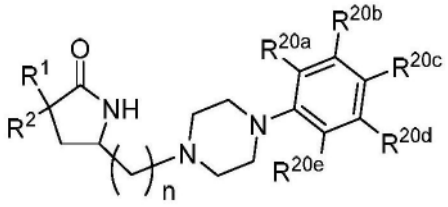
[0219] 在实施方案中,R^3为取代的苯基。在实施方案中,R^3是被1、2、3、4或5个取代基取代的苯基(例如,被如本文所述的1或2个取代基取代的苯基)。在实施方案中,取代基选自由羟基、卤基、氰基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{1-6}卤代烷基、C_{3-8}环烷基和3至8元杂环基组成的组。在实施方案中,所述取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^{n}Pr、-O^{i}Pr、-OCF_3、-Me、-Et、-^{n}Pr、-^{i}Pr、-CF_3、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

[0220] 在实施方案中,R^3选自由羟基苯基、氟苯基、氯苯基、溴苯基、氰基苯基、甲苯基、甲氧基苯基、二氟苯基、二氯苯基、氯氟苯基、二甲基苯基、三氟甲基苯基、二(三氟甲基)苯基组成的组。

[0221] 在实施方案中,R^3选自由4-羟基苯基、3-氟苯基、4-氟苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、3,4-二氯苯基、4-氟-3-氯苯基、4-氰基苯基、2-甲氧基苯基、2-甲基苯基、3-甲基苯基、4-甲基苯基、2-异丙基苯基、4-三氟甲基苯基、2-吗啉代苯基和4-甲基-2-吗啉代苯基组成的组。

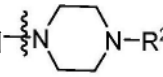
[0222] 在实施方案中,R^3为2-吡啶基。在实施方案中,R^3为3-吡啶基。在实施方案中,R^3为4-吡啶基。在实施方案中,所述吡啶基为未取代的。在实施方案中,所述吡啶基被1、2、3或4个取代基取代(例如,吡啶基被如本文所述的1或2个取代基取代)。在实施方案中,取代基选自由羟基、卤基、氰基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{1-6}卤代烷基、C_{3-8}环烷基和3至8元杂环基组成的组。在实施方案中,所述取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^{n}Pr、-O^{i}Pr、-OCF_3、-Me、-Et、-^{n}Pr、-^{i}Pr、-CF_3、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

[0223] 本发明的实施方案包括具有式(IIa)的化合物:

[0224] 

(IIa)

[0225] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0226] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[0227] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0228] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0229] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

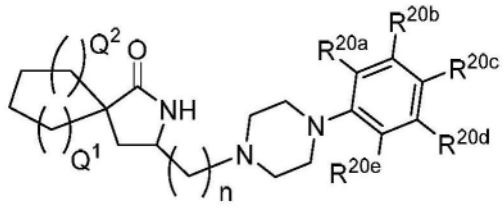
[0230] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0231] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0232] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0233] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}和R^{20e}中的至少3个为氢。

[0234] 本发明的实施方案包括具有式(IIb)的化合物:

[0235] 

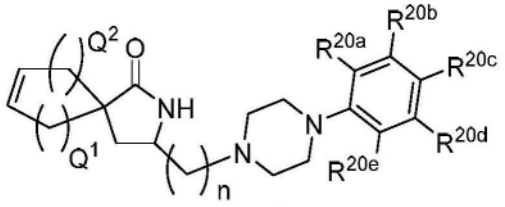
(IIb)

[0236] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0237] Q^1为1或2;

[0238] 并且Q^2为1或2。

[0239] 本发明的实施方案包括具有式(IIc)的化合物:

[0240] 

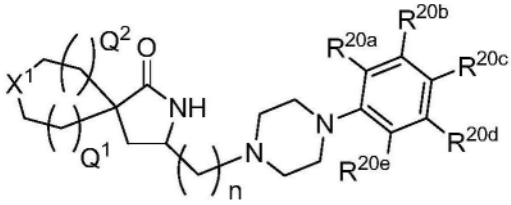
(IIc)

[0241] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0242] Q^1为1或2；

[0243] 并且Q^2为1或2。

[0244] 本发明的实施方案包括具有式(IId)的化合物：

[0245] 

(IId)

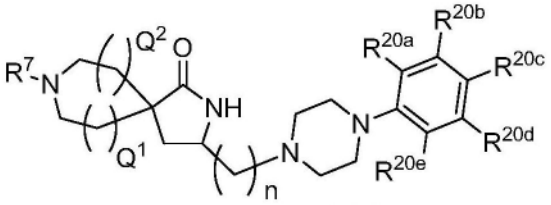
[0246] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0247] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[0248] Q^1为1或2；

[0249] 并且Q^2为1或2。

[0250] 本发明的实施方案包括具有式(IId-1)的化合物：

[0251] 

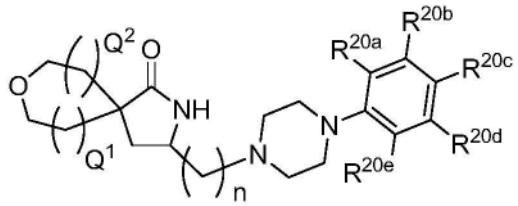
(IId-1)

[0252] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0253] Q^1为1或2；

[0254] 并且Q^2为1或2。

[0255] 本发明的实施方案包括具有式(IId-2)的化合物：

[0256] 

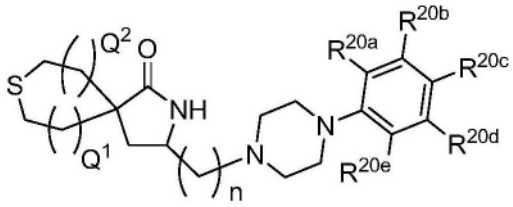
(IId-2)

[0257] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0258] Q^1为1或2；

[0259] 并且Q^2为1或2。

[0260] 本发明的实施方案包括具有式(IId-3)的化合物：

[0261] 

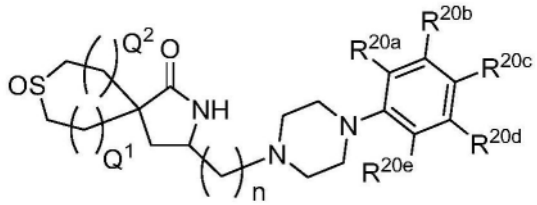
(IId-3)

[0262] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0263] Q^1为1或2;

[0264] 并且Q^2为1或2。

[0265] 本发明的实施方案包括具有式(IId-4)的化合物:

[0266] 

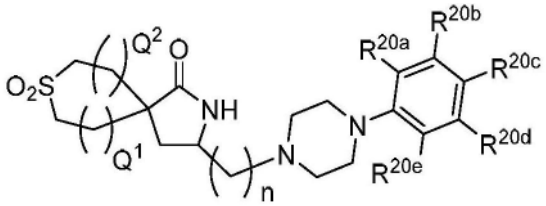
(IId-4)

[0267] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0268] Q^1为1或2;

[0269] 并且Q^2为1或2。

[0270] 本发明的实施方案包括具有式(IId-5)的化合物:

[0271] 

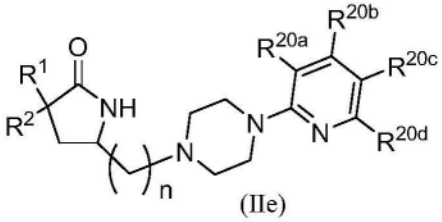
(IId-5)

[0272] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0273] Q^1为1或2;

[0274] 并且Q^2为1或2。

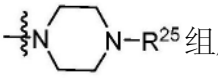
[0275] 本发明的实施方案包括具有式(IIe)的化合物:

[0276] 

(IIe)

[0277] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0278] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、-

$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[0279] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0280] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0281] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

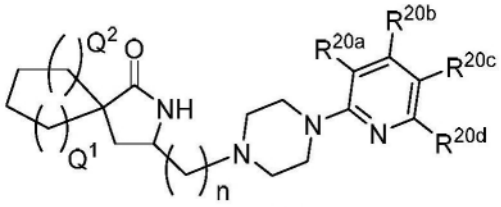
[0282] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0283] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0284] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0285] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}中的至少3个为氢。

[0286] 本发明的实施方案包括具有式(IIf)的化合物：

[0287] 

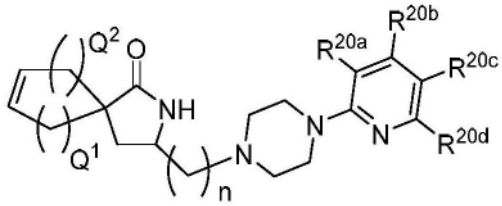
(IIf)

[0288] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0289] Q^1为1或2；

[0290] 并且Q^2为1或2。

[0291] 本发明的实施方案包括具有式(IIg)的化合物：

[0292] 

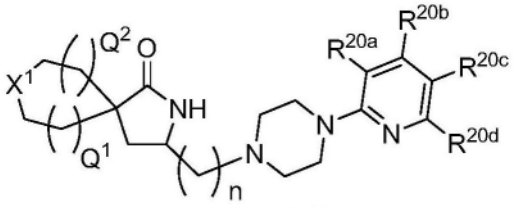
(IIg)

[0293] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0294] Q^1为1或2；

[0295] 并且Q^2为1或2。

[0296] 本发明的实施方案包括具有式(IIh)的化合物：

[0297] 

(IIh)

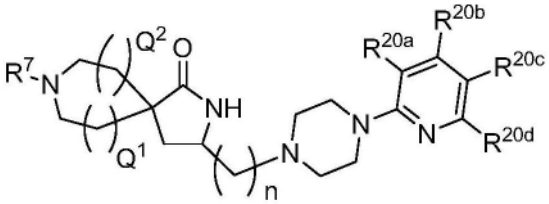
[0298] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0299] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[0300] Q^1为1或2;

[0301] 并且Q^2为1或2。

[0302] 本发明的实施方案包括具有式(IIh-1)的化合物:

[0303] 

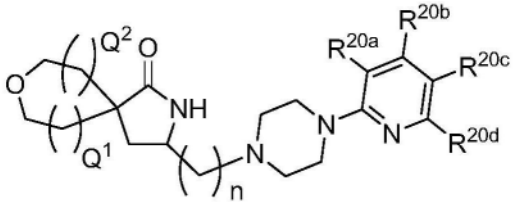
(IIh-1)

[0304] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0305] Q^1为1或2;

[0306] 并且Q^2为1或2。

[0307] 本发明的实施方案包括具有式(IIh-2)的化合物:

[0308] 

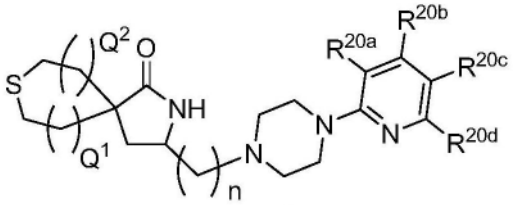
(IIh-2)

[0309] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0310] Q^1为1或2;

[0311] 并且Q^2为1或2。

[0312] 本发明的实施方案包括具有式(IIh-3)的化合物:

[0313] 

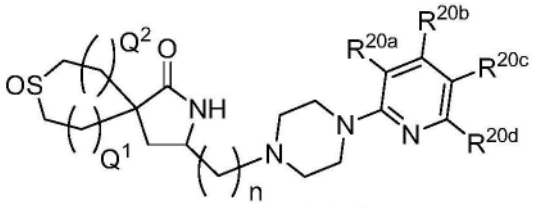
(IIh-3)

[0314] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0315] Q^1为1或2;

[0316] 并且Q^2为1或2。

[0317] 本发明的实施方案包括具有式(IIh-4)的化合物:

[0318] 

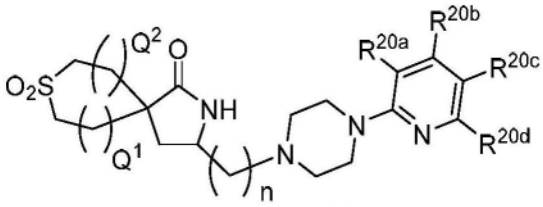
(IIh-4)

[0319] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0320] Q^1为1或2;

[0321] 并且Q^2为1或2。

[0322] 本发明的实施方案包括具有式(IIh-5)的化合物:

[0323] 

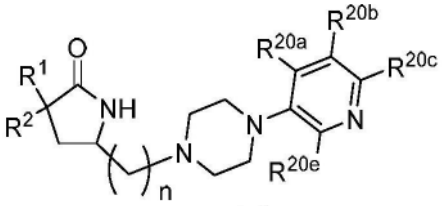
(IIh-5)

[0324] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0325] Q^1为1或2;

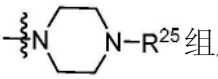
[0326] 并且Q^2为1或2。

[0327] 本发明的实施方案包括具有式(IIi)的化合物:

[0328] 

(IIi)

[0329] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0330] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、-$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[0331] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0332] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0333] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

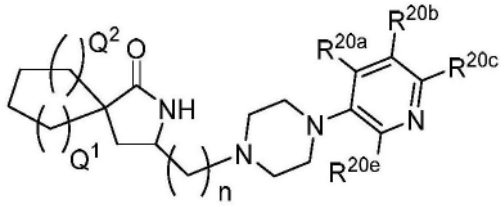
[0334] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0335] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0336] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0337] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20e}中的至少2个为氢。

[0338] 本发明的实施方案包括具有式(IIj)的化合物：

[0339] 

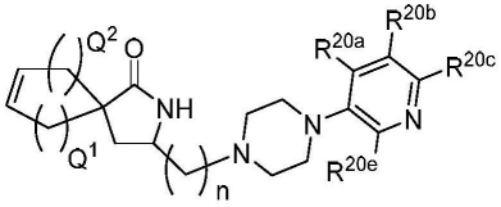
(IIj)

[0340] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0341] Q^1为1或2；

[0342] 并且Q^2为1或2。

[0343] 本发明的实施方案包括具有式(IIk)的化合物：

[0344] 

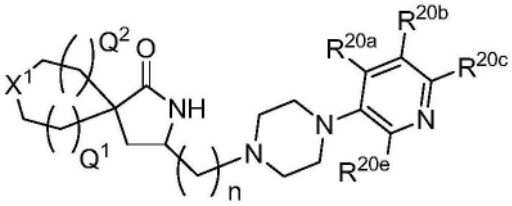
(IIk)

[0345] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0346] Q^1为1或2；

[0347] 并且Q^2为1或2。

[0348] 本发明的实施方案包括具有式(IIL)的化合物：

[0349] 

(IIL)

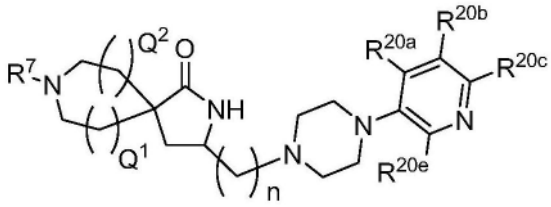
[0350] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0351] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[0352] Q^1为1或2；

[0353] 并且Q^2为1或2。

[0354] 本发明的实施方案包括具有式(IIL-1)的化合物：

[0355] 

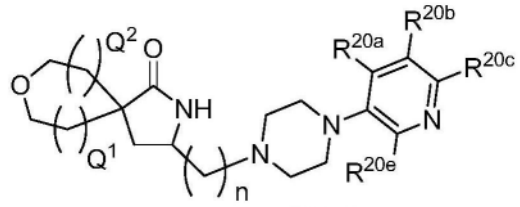
(IIL-1)

[0356] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0357] Q^1为1或2;

[0358] 并且Q^2为1或2。

[0359] 本发明的实施方案包括具有式(IIL-2)的化合物:

[0360] 

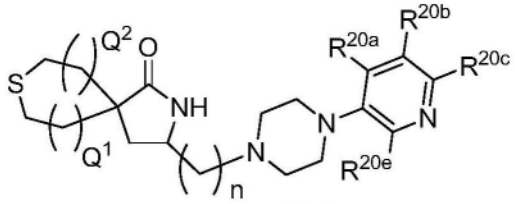
(IIL-2)

[0361] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0362] Q^1为1或2;

[0363] 并且Q^2为1或2。

[0364] 本发明的实施方案包括具有式(IIL-3)的化合物:

[0365] 

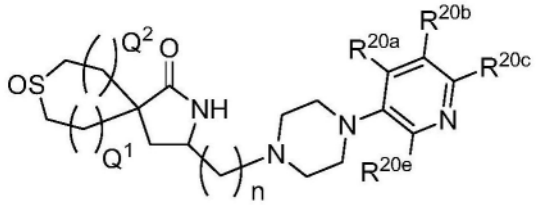
(IIL-3)

[0366] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0367] Q^1为1或2;

[0368] 并且Q^2为1或2。

[0369] 本发明的实施方案包括具有式(IIL-4)的化合物:

[0370] 

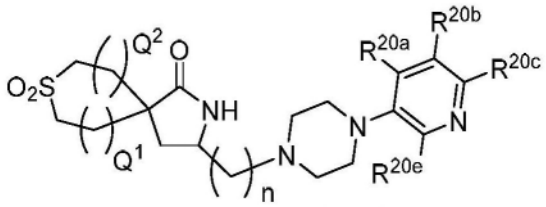
(IIL-4)

[0371] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0372] Q^1为1或2;

[0373] 并且Q^2为1或2。

[0374] 本发明的实施方案包括具有式(IIL-5)的化合物:

[0375] 

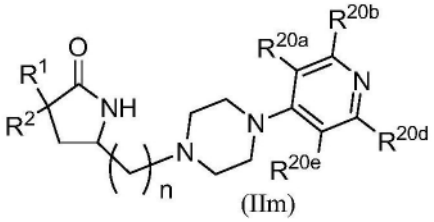
(IIL-5)

[0376] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0377] Q^1为1或2;

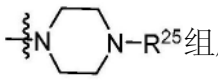
[0378] 并且Q^2为1或2。

[0379] 本发明的实施方案包括具有式(IIm)的化合物:

[0380] 

(IIm)

[0381] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0382] R^{20a}、R^{20b}、R^{20cd}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[0383] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0384] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0385] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

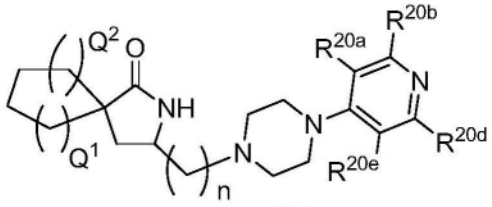
[0386] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0387] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0388] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0389] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}中的至少3个为氢。

[0390] 本发明的实施方案包括具有式(IIn)的化合物:

[0391] 

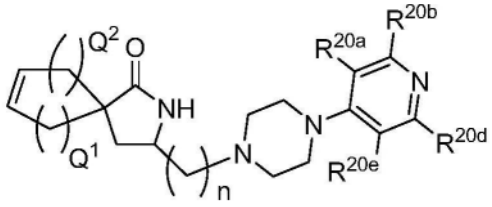
(IIn)

[0392] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0393] Q^1为1或2;

[0394] 并且Q^2为1或2。

[0395] 本发明的实施方案包括具有式(IIo)的化合物:

[0396] 

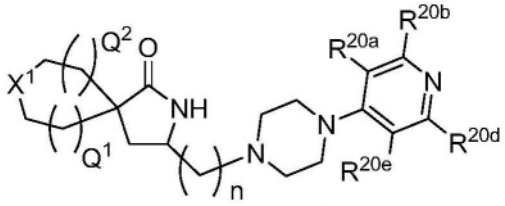
(IIo)

[0397] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0398] Q^1为1或2;

[0399] 并且Q^2为1或2。

[0400] 本发明的实施方案包括具有式(IIp)的化合物:

[0401] 

(IIp)

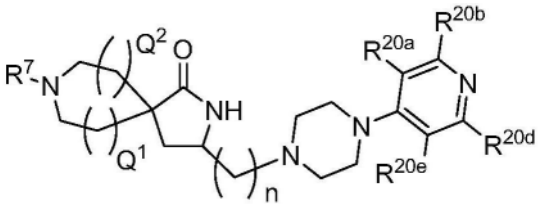
[0402] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0403] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[0404] Q^1为1或2;

[0405] 并且Q^2为1或2。

[0406] 本发明的实施方案包括具有式(IIp-1)的化合物:

[0407] 

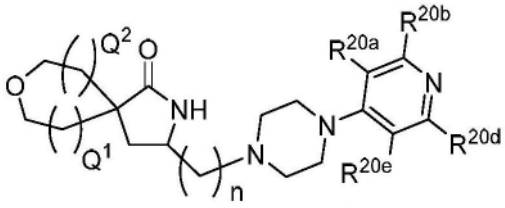
(IIp-1)

[0408] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0409] Q^1为1或2;

[0410] 并且Q^2为1或2。

[0411] 本发明的实施方案包括具有式(IIp-2)的化合物:

[0412] 

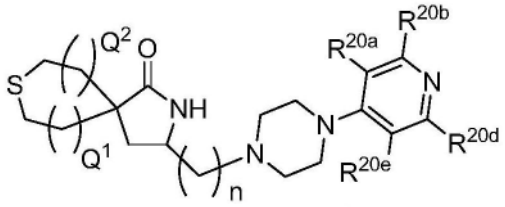
(IIp-2)

[0413] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0414] Q^1为1或2;

[0415] 并且Q^2为1或2。

[0416] 本发明的实施方案包括具有式(IIp-3)的化合物:

[0417] 

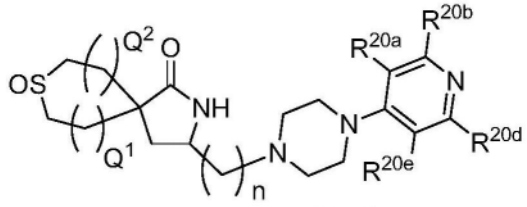
(IIp-3)

[0418] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0419] Q^1为1或2;

[0420] 并且Q^2为1或2。

[0421] 本发明的实施方案包括具有式(IIp-4)的化合物:

[0422] 

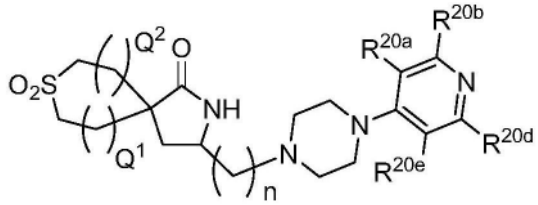
(IIp-4)

[0423] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0424] Q^1为1或2;

[0425] 并且Q^2为1或2。

[0426] 本发明的实施方案包括具有式(IIp-5)的化合物:

[0427] 

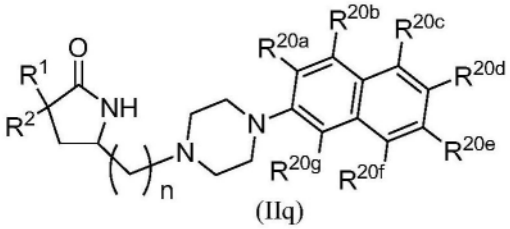
(IIp-5)

[0428] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0429] Q^1为1或2;

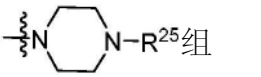
[0430] 并且Q^2为1或2。

[0431] 本发明的实施方案包括具有式(IIq)的化合物:

[0432] 

(IIq)

[0433] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0434] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[0435] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0436] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0437] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

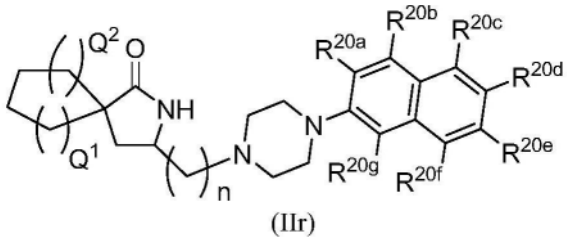
[0438] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0439] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0440] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0441] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}中的至少5个为氢。

[0442] 本发明的实施方案包括具有式(IIr)的化合物：

[0443] 

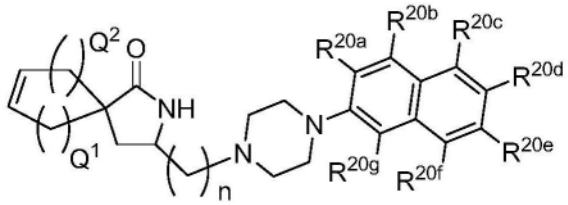
(IIr)

[0444] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0445] Q^1为1或2；

[0446] 并且Q^2为1或2。

[0447] 本发明的实施方案包括具有式(IIs)的化合物：

[0448] 

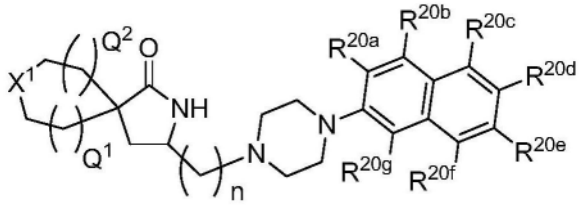
(IIs)

[0449] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0450] Q^1为1或2;

[0451] 并且Q^2为1或2。

[0452] 本发明的实施方案包括具有式(IIt)的化合物:

[0453] 

(IIt)

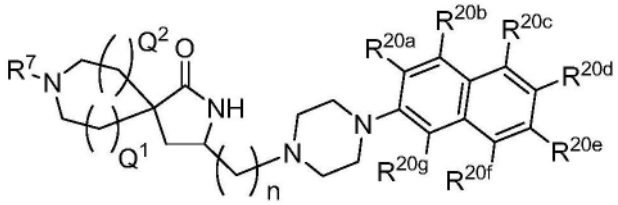
[0454] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0455] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[0456] Q^1为1或2;

[0457] 并且Q^2为1或2。

[0458] 本发明的实施方案包括具有式(IIt-1)的化合物:

[0459] 

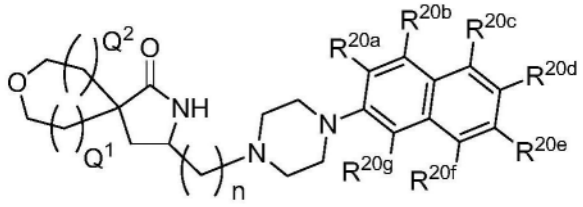
(IIt-1)

[0460] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0461] Q^1为1或2;

[0462] 并且Q^2为1或2。

[0463] 本发明的实施方案包括具有式(IIt-2)的化合物:

[0464] 

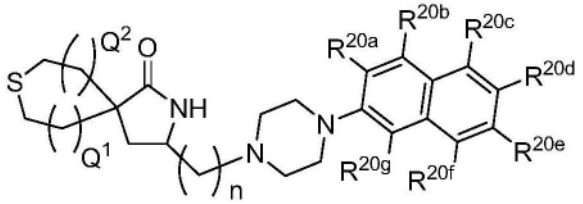
(IIt-2)

[0465] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0466] Q^1为1或2;

[0467] 并且Q^2为1或2。

[0468] 本发明的实施方案包括具有式(IIt-3)的化合物:

[0469] 

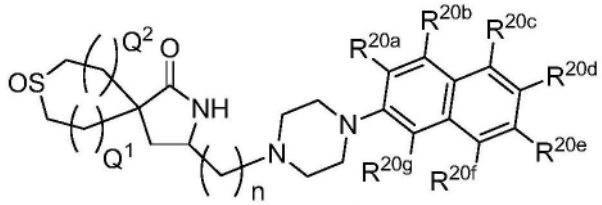
(IIt-3)

[0470] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0471] Q^1为1或2;

[0472] 并且Q^2为1或2。

[0473] 本发明的实施方案包括具有式(IIt-4)的化合物:

[0474] 

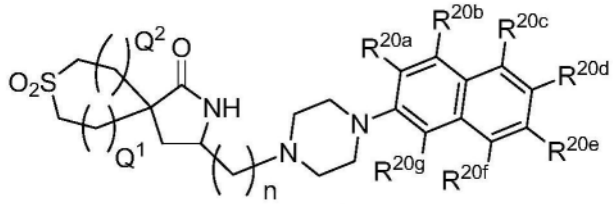
(IIt-4)

[0475] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0476] Q^1为1或2;

[0477] 并且Q^2为1或2。

[0478] 本发明的实施方案包括具有式(IIt-5)的化合物:

[0479] 

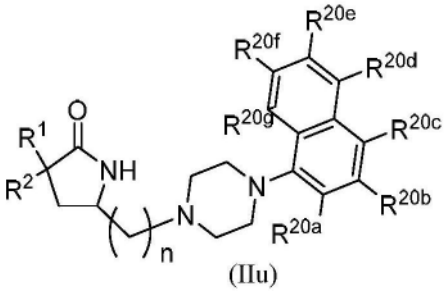
(IIt-5)

[0480] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0481] Q^1为1或2;

[0482] 并且Q^2为1或2。

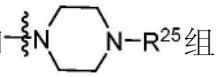
[0483] 本发明的实施方案包括具有式(IIu)的化合物:

[0484] 

(IIu)

[0485] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0486] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、

SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[0487] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0488] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0489] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

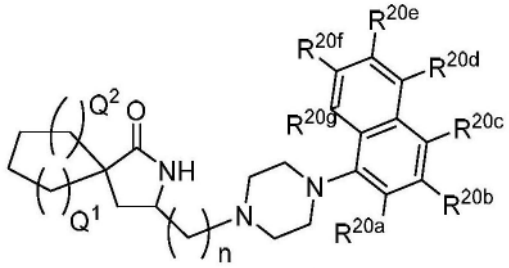
[0490] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0491] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0492] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0493] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}中的至少5个为氢。

[0494] 本发明的实施方案包括具有式(IIv)的化合物：

[0495] 

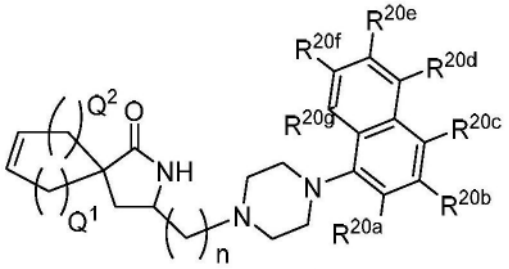
(IIv)

[0496] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0497] Q^1为1或2；

[0498] 并且Q^2为1或2。

[0499] 本发明的实施方案包括具有式(IIw)的化合物：

[0500] 

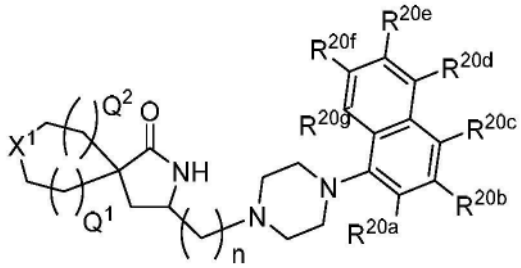
(IIw)

[0501] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0502] Q^1为1或2；

[0503] 并且Q^2为1或2。

[0504] 本发明的实施方案包括具有式(IIx)的化合物：

[0505] 

(IIx)

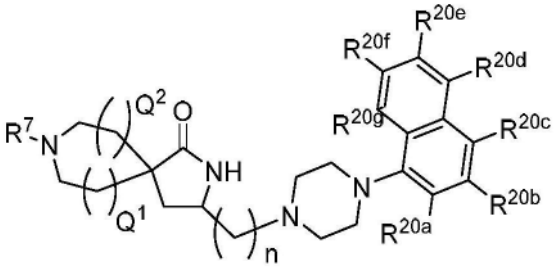
[0506] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0507] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[0508] Q^1为1或2；

[0509] 并且Q^2为1或2。

[0510] 本发明的实施方案包括具有式(IIx-1)的化合物：

[0511] 

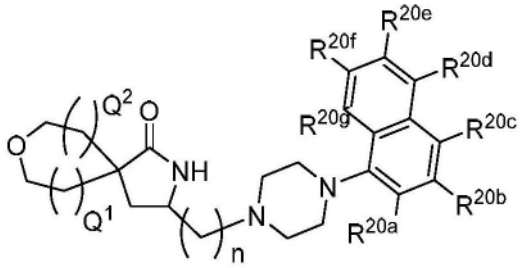
(IIx-1)

[0512] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0513] Q^1为1或2；

[0514] 并且Q^2为1或2。

[0515] 本发明的实施方案包括具有式(IIx-2)的化合物：

[0516] 

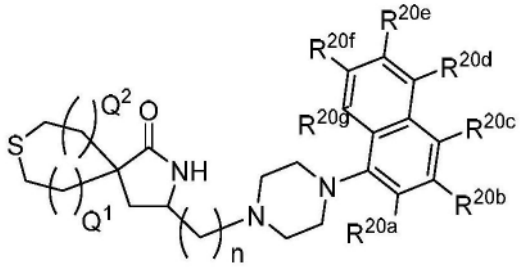
(IIx-2)

[0517] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0518] Q^1为1或2；

[0519] 并且Q^2为1或2。

[0520] 本发明的实施方案包括具有式(IIx-3)的化合物：

[0521] 

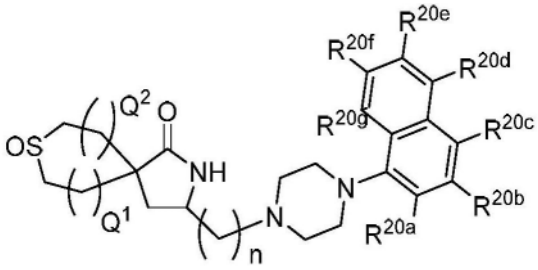
(IIx-3)

[0522] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0523] Q^1为1或2;

[0524] 并且Q^2为1或2。

[0525] 本发明的实施方案包括具有式(IIx-4)的化合物:

[0526] 

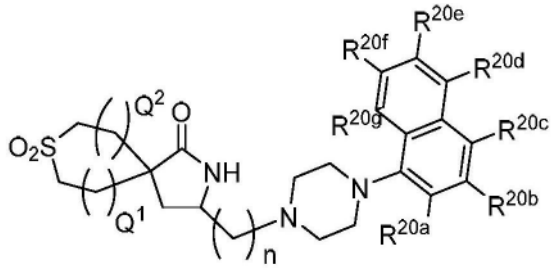
(IIx-4)

[0527] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0528] Q^1为1或2;

[0529] 并且Q^2为1或2。

[0530] 本发明的实施方案包括具有式(IIx-5)的化合物:

[0531] 

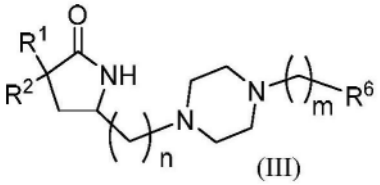
(IIx-5)

[0532] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0533] Q^1为1或2;

[0534] 并且Q^2为1或2。

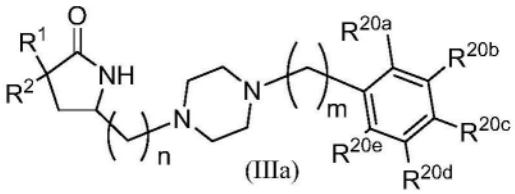
[0535] 本发明的实施方案包括具有式(III)的化合物:

[0536] 

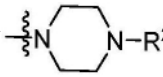
(III)

[0537] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物。

[0538] 本发明的实施方案包括具有式(IIIa)的化合物:

[0539] 
(IIIa)

[0540] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0541] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[0542] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0543] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0544] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

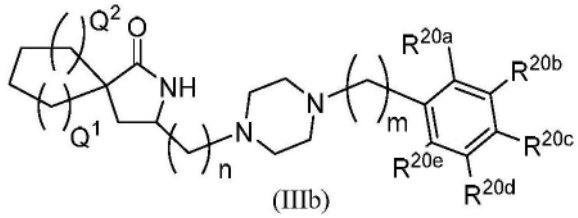
[0545] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0546] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0547] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0548] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}和R^{20e}中的至少3个为氢。

[0549] 本发明的实施方案包括具有式(IIIb)的化合物:

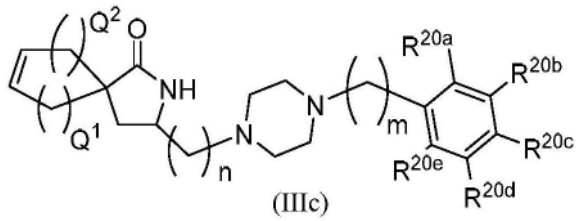
[0550] 
(IIIb)

[0551] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0552] Q^1为1或2;

[0553] 并且Q^2为1或2。

[0554] 本发明的实施方案包括具有式(IIIc)的化合物:

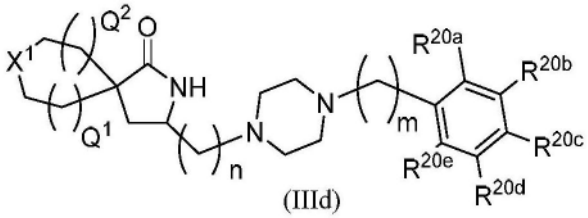
[0555] 
(IIIc)

[0556] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0557] Q^1为1或2；

[0558] 并且Q^2为1或2。

[0559] 本发明的实施方案包括具有式(IIId)的化合物：

[0560] 

(IIId)

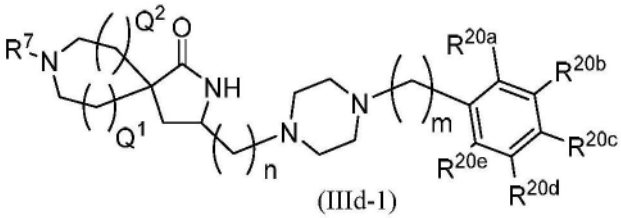
[0561] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0562] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[0563] Q^1为1或2；

[0564] 并且Q^2为1或2。

[0565] 本发明的实施方案包括具有式(IIId-1)的化合物：

[0566] 

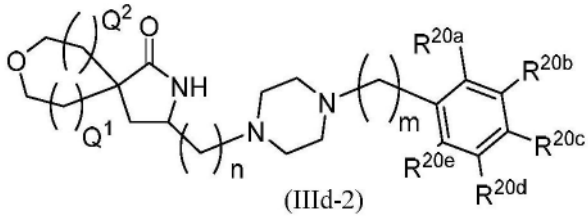
(IIId-1)

[0567] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0568] Q^1为1或2；

[0569] 并且Q^2为1或2。

[0570] 本发明的实施方案包括具有式(IIId-2)的化合物：

[0571] 

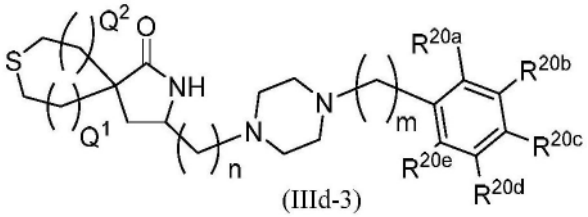
(IIId-2)

[0572] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0573] Q^1为1或2；

[0574] 并且Q^2为1或2。

[0575] 本发明的实施方案包括具有式(IIId-3)的化合物：

[0576] 

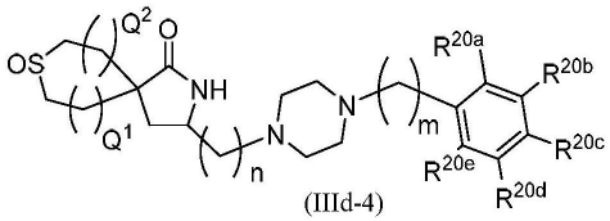
(IIId-3)

[0577] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0578] Q^1为1或2；

[0579] 并且Q^2为1或2。

[0580] 本发明的实施方案包括具有式(IIId-4)的化合物：

[0581] 

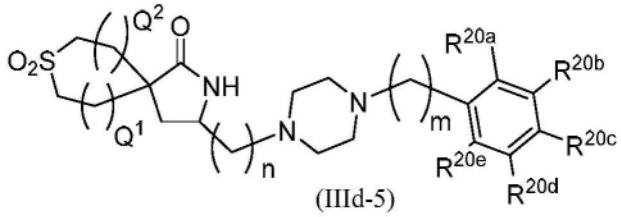
(IIId-4)

[0582] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0583] Q^1为1或2；

[0584] 并且Q^2为1或2。

[0585] 本发明的实施方案包括具有式(IIId-5)的化合物：

[0586] 

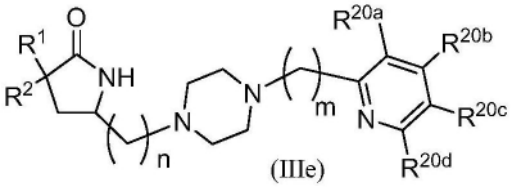
(IIId-5)

[0587] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0588] Q^1为1或2；

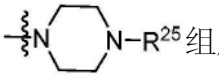
[0589] 并且Q^2为1或2。

[0590] 本发明的实施方案包括具有式(IIIe)的化合物：

[0591] 

(IIIe)

[0592] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0593] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[0594] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0595] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0596] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

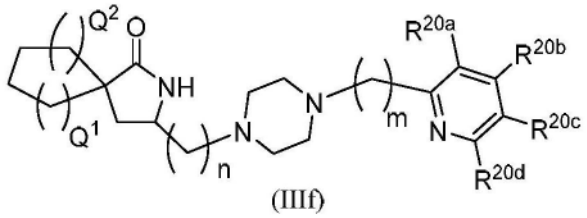
[0597] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0598] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0599] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0600] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}中的至少2个为氢。

[0601] 本发明的实施方案包括具有式(IIIf)的化合物：

[0602] 

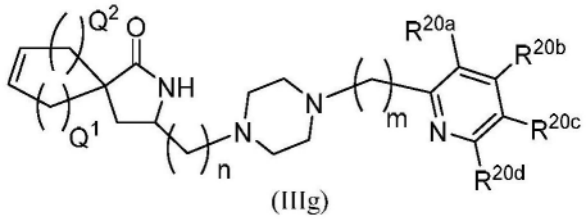
(IIIf)

[0603] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0604] Q^1为1或2；

[0605] 并且Q^2为1或2。

[0606] 本发明的实施方案包括具有式(IIIg)的化合物：

[0607] 

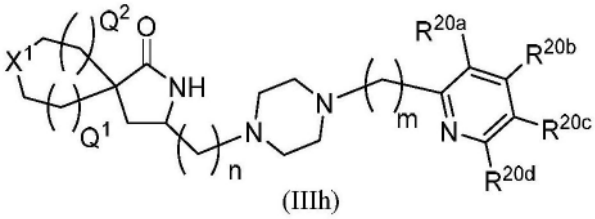
(IIIg)

[0608] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0609] Q^1为1或2；

[0610] 并且Q^2为1或2。

[0611] 本发明的实施方案包括具有式(IIIh)的化合物：

[0612] 

(IIIh)

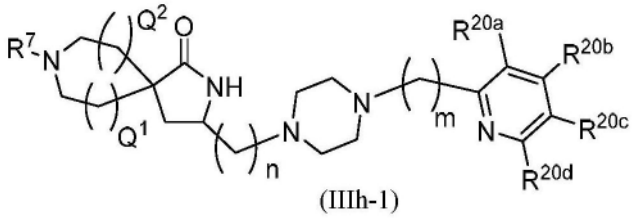
[0613] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0614] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[0615] Q^1为1或2；

[0616] 并且Q^2为1或2。

[0617] 本发明的实施方案包括具有式(IIIh-1)的化合物：

[0618] 

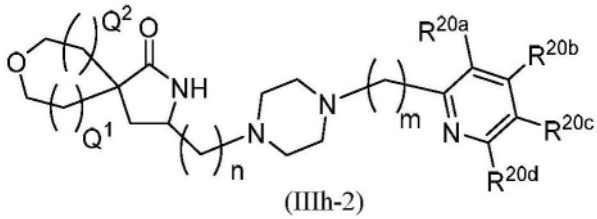
(IIIh-1)

[0619] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0620] Q^1为1或2;

[0621] 并且Q^2为1或2。

[0622] 本发明的实施方案包括具有式(IIIh-2)的化合物:

[0623] 

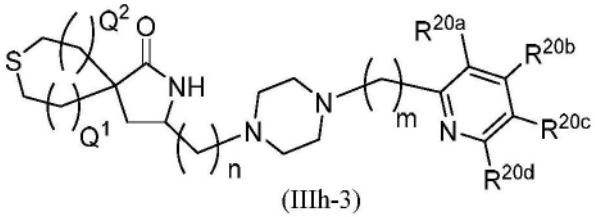
(IIIh-2)

[0624] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0625] Q^1为1或2;

[0626] 并且Q^2为1或2。

[0627] 本发明的实施方案包括具有式(IIIh-3)的化合物:

[0628] 

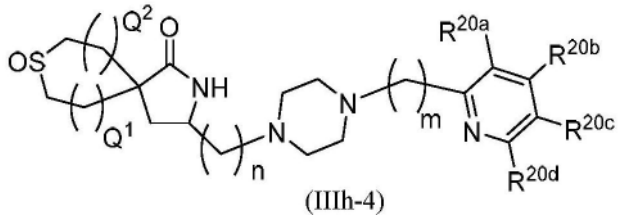
(IIIh-3)

[0629] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0630] Q^1为1或2;

[0631] 并且Q^2为1或2。

[0632] 本发明的实施方案包括具有式(IIIh-4)的化合物:

[0633] 

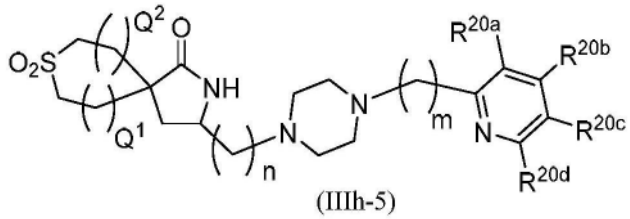
(IIIh-4)

[0634] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0635] Q^1为1或2;

[0636] 并且Q^2为1或2。

[0637] 本发明的实施方案包括具有式(IIIh-5)的化合物:

[0638] 

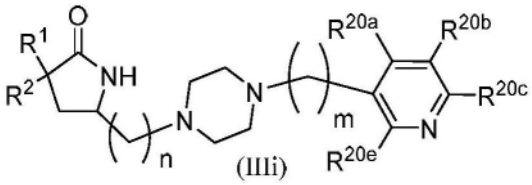
(IIIh-5)

[0639] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0640] Q^1为1或2;

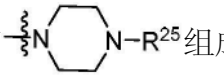
[0641] 并且Q^2为1或2。

[0642] 本发明的实施方案包括具有式(IIIi)的化合物：

[0643] 

(IIIi)

[0644] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0645] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[0646] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0647] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0648] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

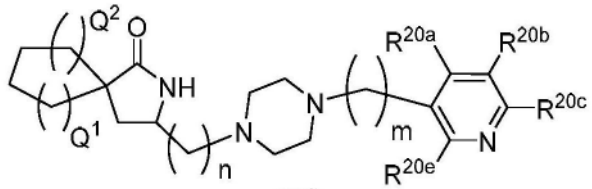
[0649] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0650] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0651] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0652] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20e}中的至少2个为氢。

[0653] 本发明的实施方案包括具有式(IIIj)的化合物：

[0654] 

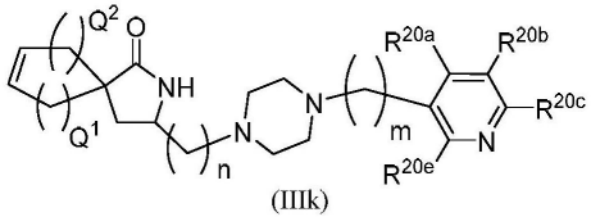
(IIIj)

[0655] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0656] Q^1为1或2；

[0657] 并且Q^2为1或2。

[0658] 本发明的实施方案包括具有式(IIIk)的化合物：

[0659] 

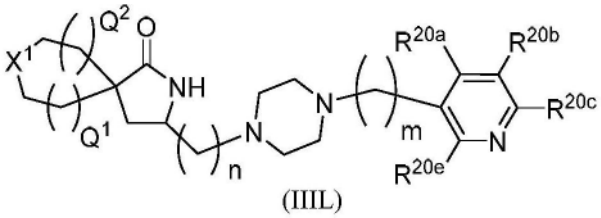
(IIIk)

[0660] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0661] Q^1为1或2;

[0662] 并且Q^2为1或2。

[0663] 本发明的实施方案包括具有式(IIIL)的化合物:

[0664] 

(IIIL)

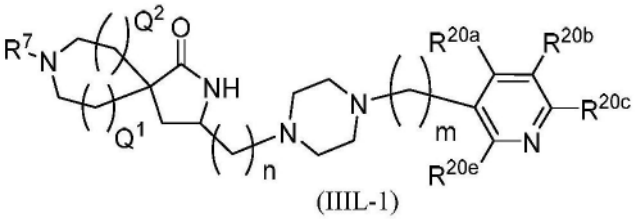
[0665] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0666] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[0667] Q^1为1或2;

[0668] 并且Q^2为1或2。

[0669] 本发明的实施方案包括具有式(IIIL-1)的化合物:

[0670] 

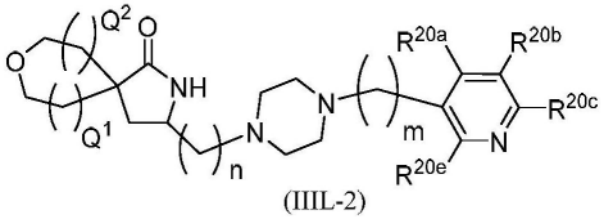
(IIIL-1)

[0671] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0672] Q^1为1或2;

[0673] 并且Q^2为1或2。

[0674] 本发明的实施方案包括具有式(IIIL-2)的化合物:

[0675] 

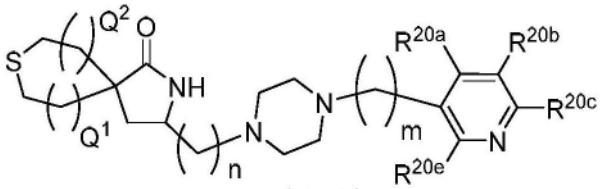
(IIIL-2)

[0676] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0677] Q^1为1或2;

[0678] 并且Q^2为1或2。

[0679] 本发明的实施方案包括具有式(IIIL-3)的化合物:

[0680] 

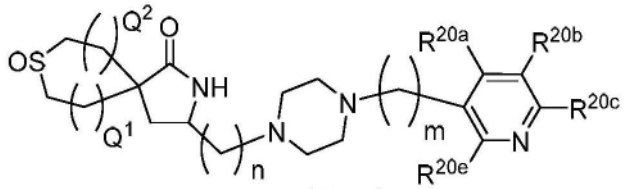
(IIIL-3)

[0681] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0682] Q^1为1或2;

[0683] 并且Q^2为1或2。

[0684] 本发明的实施方案包括具有式(IIIL-4)的化合物:

[0685] 

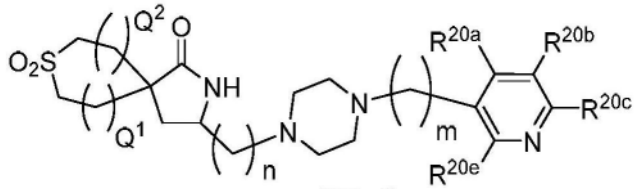
(IIIL-4)

[0686] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0687] Q^1为1或2;

[0688] 并且Q^2为1或2。

[0689] 本发明的实施方案包括具有式(IIIL-5)的化合物:

[0690] 

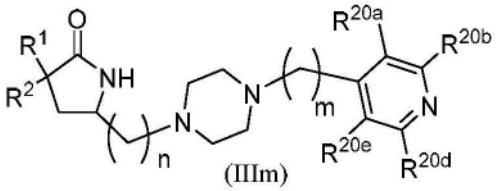
(IIIL-5)

[0691] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0692] Q^1为1或2;

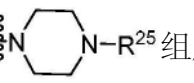
[0693] 并且Q^2为1或2。

[0694] 本发明的实施方案包括具有式(IIIm)的化合物:

[0695] 

(IIIm)

[0696] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0697] R^{20a}、R^{20b}、R^{20d}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、-$NR^{23a}R^{23b}$、NHC(O)R^{24}、C(O)NHR^{24}、C(O)N$(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[0698] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的

组；

[0699] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0700] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

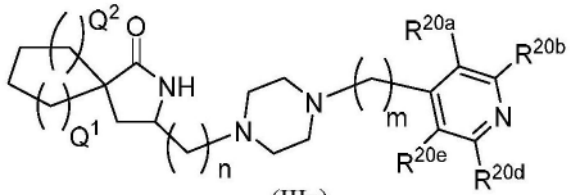
[0701] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0702] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0703] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0704] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}中的至少2个为氢。

[0705] 本发明的实施方案包括具有式(IIIn)的化合物：

[0706] 

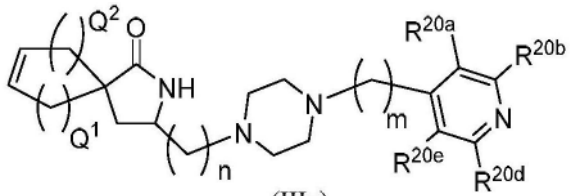
(IIIn)

[0707] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0708] Q^1为1或2；

[0709] 并且Q^2为1或2。

[0710] 本发明的实施方案包括具有式(IIIo)的化合物：

[0711] 

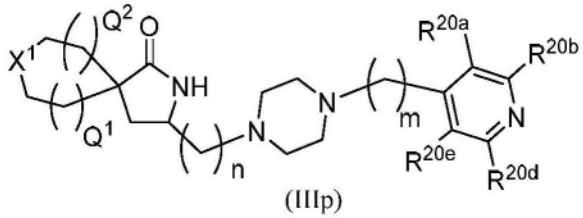
(IIIo)

[0712] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0713] Q^1为1或2；

[0714] 并且Q^2为1或2。

[0715] 本发明的实施方案包括具有式(IIIp)的化合物：

[0716] 

(IIIp)

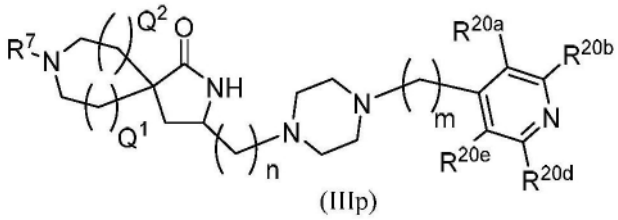
[0717] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0718] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[0719] Q^1为1或2；

[0720] 并且Q^2为1或2。

[0721] 本发明的实施方案包括具有式(IIIp-1)的化合物：

[0722] 

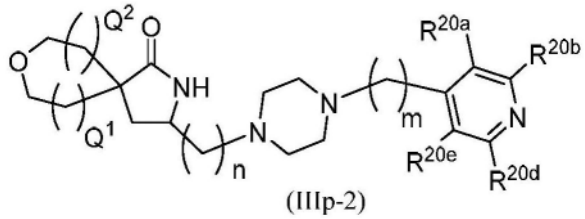
(IIIp)

[0723] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0724] Q^1为1或2；

[0725] 并且Q^2为1或2。

[0726] 本发明的实施方案包括具有式(IIIp-2)的化合物：

[0727] 

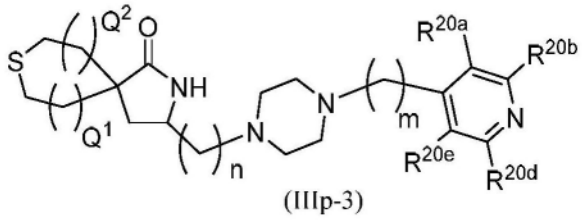
(IIIp-2)

[0728] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0729] Q^1为1或2；

[0730] 并且Q^2为1或2。

[0731] 本发明的实施方案包括具有式(IIIp-3)的化合物：

[0732] 

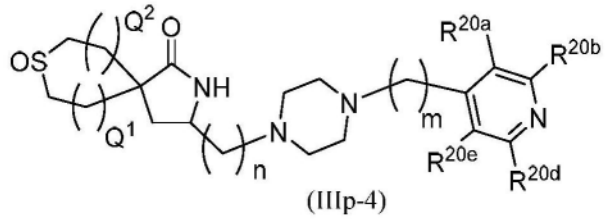
(IIIp-3)

[0733] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0734] Q^1为1或2；

[0735] 并且Q^2为1或2。

[0736] 本发明的实施方案包括具有式(IIIp-4)的化合物：

[0737] 

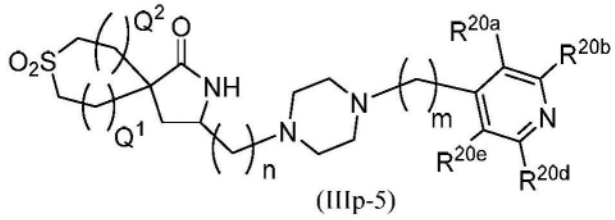
(IIIp-4)

[0738] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0739] Q^1为1或2；

[0740] 并且Q^2为1或2。

[0741] 本发明的实施方案包括具有式(IIIp-5)的化合物：

[0742] 

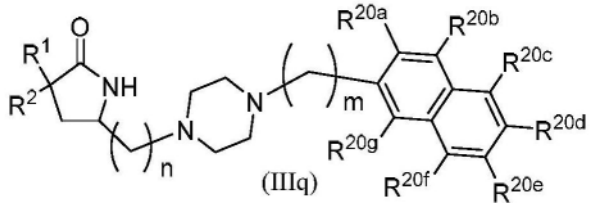
(IIIp-5)

[0743] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0744] Q^1为1或2;

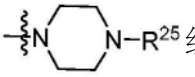
[0745] 并且Q^2为1或2。

[0746] 本发明的实施方案包括具有式(IIIq)的化合物:

[0747] 

(IIIq)

[0748] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0749] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和 

组成的组;

[0750] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0751] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0752] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

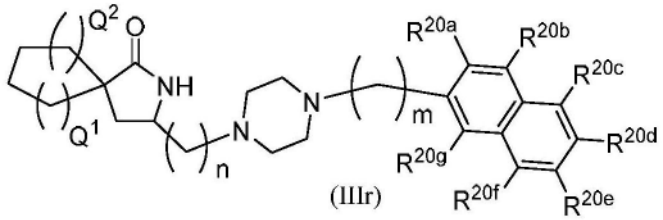
[0753] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0754] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0755] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0756] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}中的至少5个为氢。

[0757] 本发明的实施方案包括具有式(IIIr)的化合物:

[0758] 

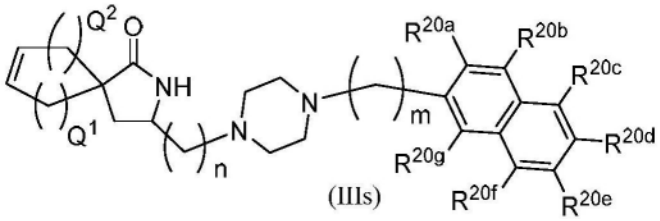
(IIIr)

[0759] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0760] Q^1为1或2;

[0761] 并且Q^2为1或2。

[0762] 本发明的实施方案包括具有式(IIIs)的化合物:

[0763] 

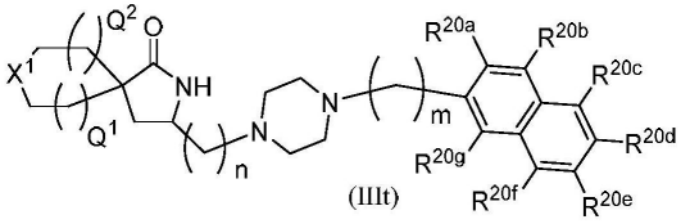
(IIIs)

[0764] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0765] Q^1为1或2;

[0766] 并且Q^2为1或2。

[0767] 本发明的实施方案包括具有式(IIIt)的化合物:

[0768] 

(IIIt)

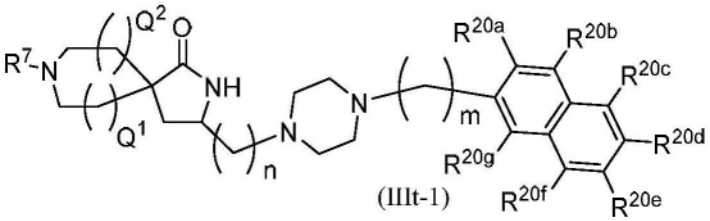
[0769] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0770] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[0771] Q^1为1或2;

[0772] 并且Q^2为1或2。

[0773] 本发明的实施方案包括具有式(IIIt-1)的化合物:

[0774] 

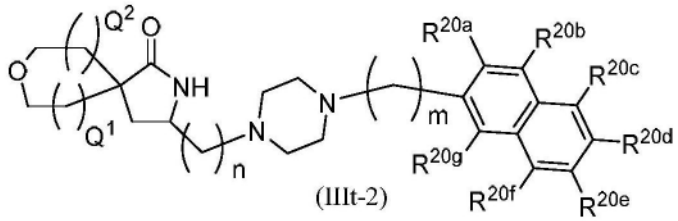
(IIIt-1)

[0775] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0776] Q^1为1或2;

[0777] 并且Q^2为1或2。

[0778] 本发明的实施方案包括具有式(IIIt-2)的化合物:

[0779] 

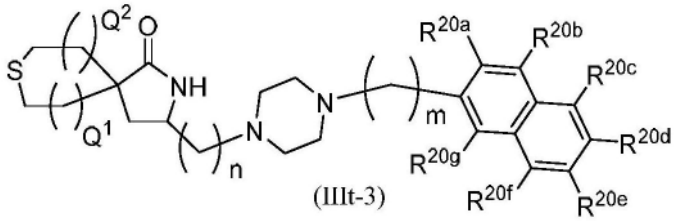
(IIIt-2)

[0780] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0781] Q^1为1或2;

[0782] 并且Q^2为1或2。

[0783] 本发明的实施方案包括具有式(IIIt-3)的化合物:

[0784] 

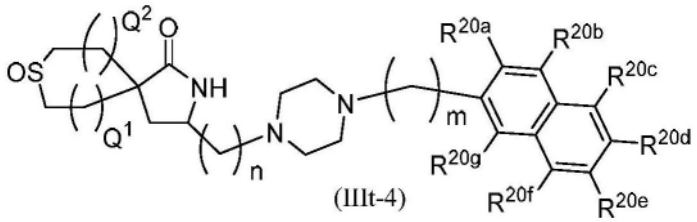
(IIIt-3)

[0785] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0786] Q^1为1或2;

[0787] 并且Q^2为1或2。

[0788] 本发明的实施方案包括具有式(IIIt-4)的化合物:

[0789] 

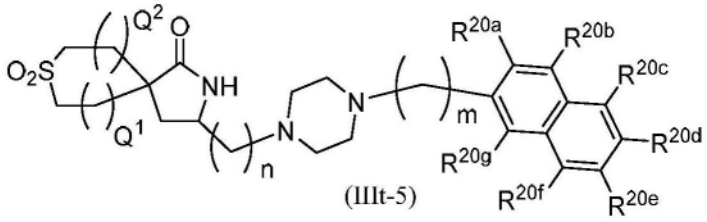
(IIIt-4)

[0790] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0791] Q^1为1或2;

[0792] 并且Q^2为1或2。

[0793] 本发明的实施方案包括具有式(IIIt-5)的化合物:

[0794] 

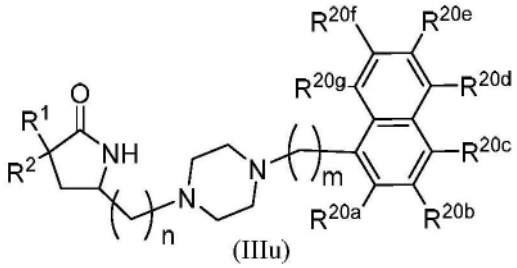
(IIIt-5)

[0795] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0796] Q^1为1或2;

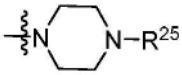
[0797] 并且Q^2为1或2。

[0798] 本发明的实施方案包括具有式(IIIu)的化合物:

[0799] 

(IIIu)

[0800] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0801] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[0802] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0803] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0804] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

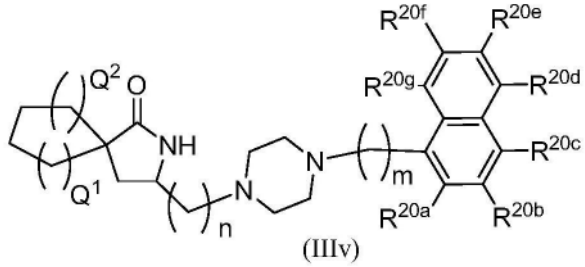
[0805] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0806] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0807] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0808] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}中的至少5个为氢。

[0809] 本发明的实施方案包括具有式(IIIv)的化合物:

[0810] 

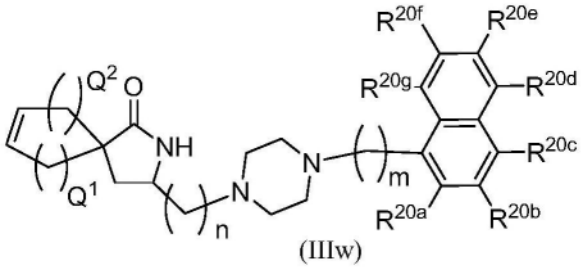
(IIIv)

[0811] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0812] Q^1为1或2;

[0813] 并且Q^2为1或2。

[0814] 本发明的实施方案包括具有式(IIIw)的化合物:

[0815] 

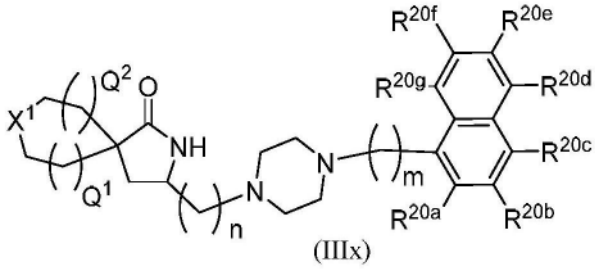
(IIIw)

[0816] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0817] Q^1为1或2；

[0818] 并且Q^2为1或2。

[0819] 本发明的实施方案包括具有式(IIIx)的化合物：

[0820] 

(IIIx)

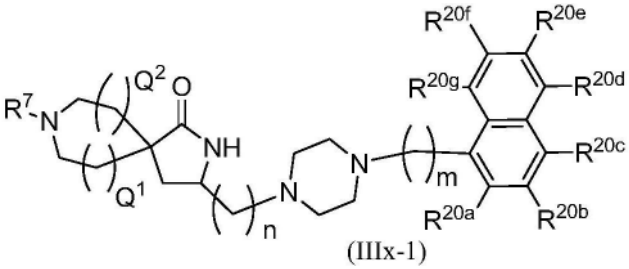
[0821] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0822] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[0823] Q^1为1或2；

[0824] 并且Q^2为1或2。

[0825] 本发明的实施方案包括具有式(IIIx-1)的化合物：

[0826] 

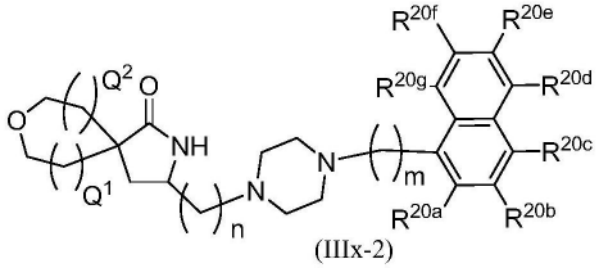
(IIIx-1)

[0827] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0828] Q^1为1或2；

[0829] 并且Q^2为1或2。

[0830] 本发明的实施方案包括具有式(IIIx-2)的化合物：

[0831] 

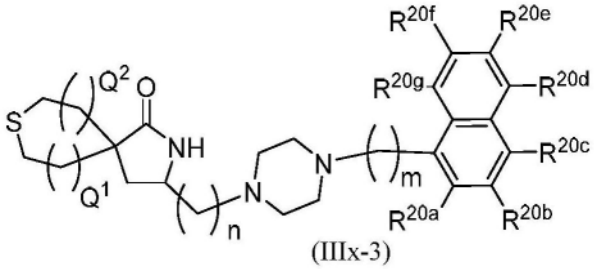
(IIIx-2)

[0832] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0833] Q^1为1或2；

[0834] 并且Q^2为1或2。

[0835] 本发明的实施方案包括具有式(IIIx-3)的化合物：

[0836] 

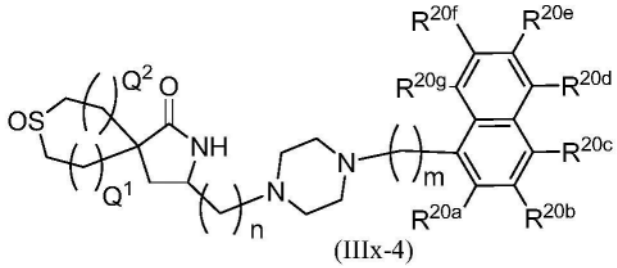
(IIIx-3)

[0837] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0838] Q^1为1或2；

[0839] 并且Q^2为1或2。

[0840] 本发明的实施方案包括具有式(IIIx-4)的化合物：

[0841] 

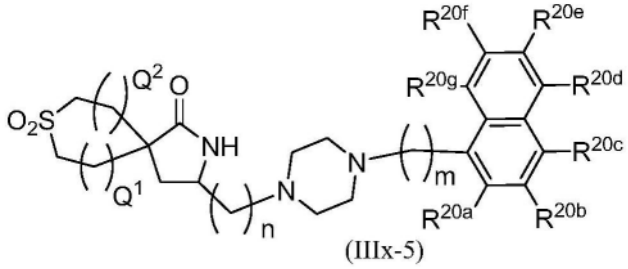
(IIIx-4)

[0842] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0843] Q^1为1或2；

[0844] 并且Q^2为1或2。

[0845] 本发明的实施方案包括具有式(IIIx-5)的化合物：

[0846] 

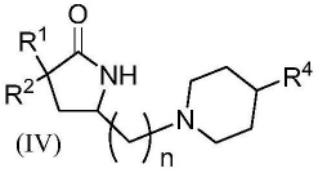
(IIIx-5)

[0847] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0848] Q^1为1或2；

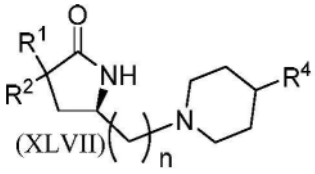
[0849] 并且Q^2为1或2。

[0850] 本发明的实施方案包括具有式(IV)的化合物：

[0851] 

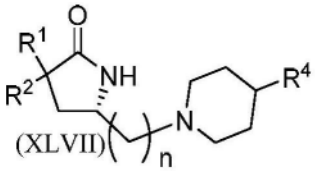
[0852] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物。

[0853] 在实施方案中,化合物具有根据式(XLVII)的结构,

[0854]  或其可药用盐。

,

[0855] 在实施方案中,化合物具有根据式(XLVII)的结构,

[0856]  或其可药用盐。

,

[0857] 在实施方案中,n为1、2或3。在实施方案中,n为1。在实施方案中,n为2。在实施方案中,n为1或2。

[0858] 在实施方案中,R^1和R^2中的每个为未取代的C_{1-6}烷基。在实施方案中,R^1和R^2中的每个为乙基。在实施方案中,R^1和R^2中的每个为甲基。

[0859] 在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成5至8元环,该环任选地包含一个碳-碳双键和/或选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组的环原子。

[0860] 在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成C_3-C_8环烷基或C_5-C_8环烯基。

[0861] 在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成选自由环丙基、环丁基、环戊基、环戊烯基、环己基、环己烯基、环庚基、环庚烯基、环辛基和环辛烯基组成的组的C_3-C_8环烷基或C_5-C_8环烯基。在实施方案中,所述C_3-C_8环烷基或C_5-C_8环烯基为未取代的。在实施方案中,所述C_3-C_8环烷基或C_5-C_8环烯基被1、2、3或4个取代基(例如,本文所述的1或2个取代基)取代。在实施方案中,所述取代基选自氧(=O)、羟基、卤基、氰基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{1-6}卤代烷基、C_{3-8}环烷基和3至8元杂环基。在实施方案中,所述取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^nPr、-O^iPr、-OCF_3、-Me、-Et、-^nPr、-^iPr、-CF_3、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

[0862] 在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成包含环原子NR^7的5至8元环。在实施方案中,所述5至8元环不被进一步取代。在实施方案中,所述5至8元环还包含1、2、3或4个取代基(例如,如本文所述的1或2个取代基)。在实施方案中,所述取代基选自氧(=O)、羟基、卤基、氰基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{1-6}卤代烷基、C_{3-8}环烷基和3至8元杂环基。在实施方案中,所述取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^nPr、-O^iPr、-OCF_3、-Me、-Et、-^nPr、-^iPr、-CF_3、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

[0863] 在实施方案中,R^1和R^2合在一起形成吡咯烷基或哌啶基,其中氮原子为NR^7。在实施方案中,所述吡咯烷基或哌啶基不被进一步取代。在实施方案中,所述吡咯烷基或哌啶基还包含1、2、3或4个如本文所述的取代基。

[0864] 在实施方案中,R^7为COR^8,并且R^8为C_{1-6}直链烷基。

[0865] 在实施方案中,R^7为乙酰基。

[0866] 在实施方案中,R^7为SO_2R^{10c},并且R^{10c}为C_{1-6}直链烷基。

[0867] 在实施方案中,R^{10c}为甲基(即,R^7为SO_2Me)。

[0868] 在实施方案中,R^4为苯基。

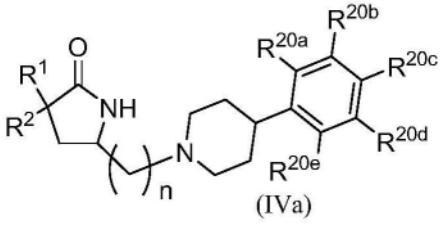
[0869] 在实施方案中,R^4为取代的苯基。在实施方案中,R^4是被1、2、3、4或5个取代基取代的苯基(例如,被如本文所述的1或2个取代基取代的苯基)。在实施方案中,取代基选自由羟基、卤基、氰基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{1-6}卤代烷基、C_{3-8}环烷基和3至8元杂环基组成的组。在实施方案中,所述取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^{n}Pr、-O^{i}Pr、-OCF_3、-Me、-Et、-^{n}Pr、-^{i}Pr、-CF_3、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

[0870] 在实施方案中,R^4选自由羟基苯基、氟苯基、氯苯基、溴苯基、氰基苯基、甲苯基、甲氧基苯基、二氟苯基、二氯苯基、氯氟苯基、二甲基苯基、三氟甲基苯基、二(三氟甲基)苯基组成的组。

[0871] 在实施方案中,R^4选自由4-羟基苯基、3-氟苯基、4-氟苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、3,4-二氯苯基、4-氟-3-氯苯基、4-氰基苯基、2-甲氧基苯基、2-甲基苯基、3-甲基苯基、4-甲基苯基、2-异丙基苯基、4-三氟甲基苯基、2-吗啉代苯基和4-甲基-2-吗啉代苯基组成的组。

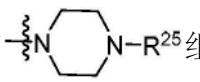
[0872] 在实施方案中,R^4为吡啶基。在实施方案中,R^4为2-吡啶基。在实施方案中,R^4为3-吡啶基。在实施方案中,R^4为4-吡啶基。在实施方案中,所述吡啶基为未取代的。在实施方案中,所述吡啶基被1、2、3或4个取代基取代(例如,吡啶基被如本文所述的1或2个取代基取代)。在实施方案中,取代基选自由羟基、卤基、氰基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{1-6}卤代烷基、C_{3-8}环烷基和3至8元杂环基组成的组。在实施方案中,所述取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^{n}Pr、-O^{i}Pr、-OCF_3、-Me、-Et、-^{n}Pr、-^{i}Pr、-CF_3、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

[0873] 本发明的实施方案包括具有式(IVa)的化合物:

[0874] 

(IVa)

[0875] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0876] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、-$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和 

组成的组;

[0877] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0878] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0879] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成

的组；

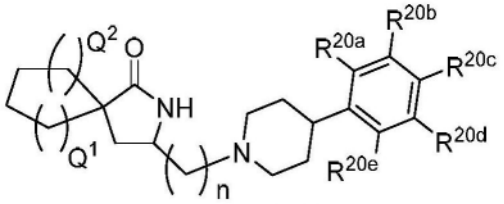
[0880] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0881] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0882] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[0883] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}和R^{20e}中的至少3个为氢。

[0884] 本发明的实施方案包括具有式(IVb)的化合物：

[0885] 

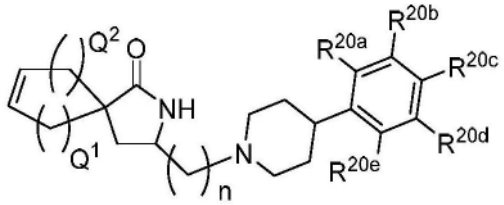
(IVb)

[0886] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0887] Q^1为1或2；

[0888] 并且Q^2为1或2。

[0889] 本发明的实施方案包括具有式(IVc)的化合物：

[0890] 

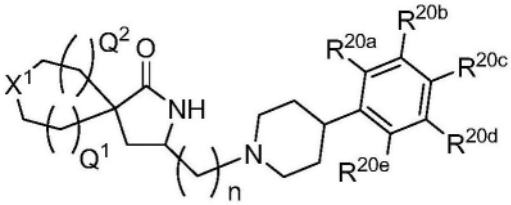
(IVc)

[0891] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0892] Q^1为1或2；

[0893] 并且Q^2为1或2。

[0894] 本发明的实施方案包括具有式(IVd)的化合物：

[0895] 

(IVd)

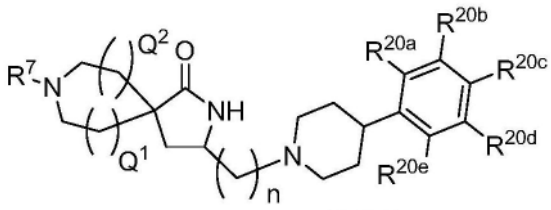
[0896] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0897] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[0898] Q^1为1或2；

[0899] 并且Q^2为1或2。

[0900] 本发明的实施方案包括具有式(IVd-1)的化合物：

[0901] 

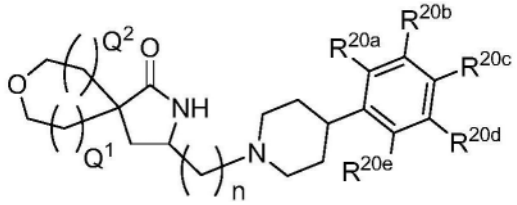
(IVd-1)

[0902] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0903] Q^1为1或2;

[0904] 并且Q^2为1或2。

[0905] 本发明的实施方案包括具有式(IVd-2)的化合物:

[0906] 

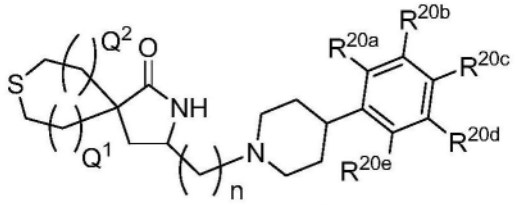
(IVd-2)

[0907] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0908] Q^1为1或2;

[0909] 并且Q^2为1或2。

[0910] 本发明的实施方案包括具有式(IVd-3)的化合物:

[0911] 

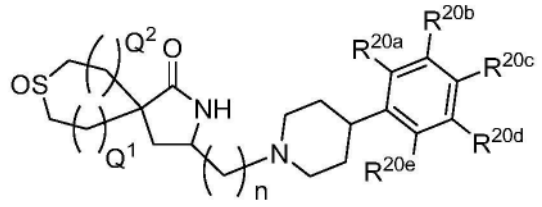
(IVd-3)

[0912] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0913] Q^1为1或2;

[0914] 并且Q^2为1或2。

[0915] 本发明的实施方案包括具有式(IVd-4)的化合物:

[0916] 

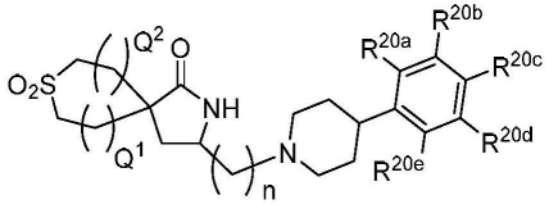
(IVd-4)

[0917] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0918] Q^1为1或2;

[0919] 并且Q^2为1或2。

[0920] 本发明的实施方案包括具有式(IVd-5)的化合物:

[0921] 

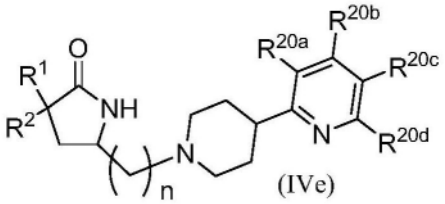
(IVd-5)

[0922] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0923] Q^1为1或2;

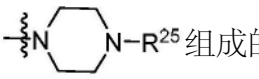
[0924] 并且Q^2为1或2。

[0925] 本发明的实施方案包括具有式(IVe)的化合物:

[0926] 

(IVe)

[0927] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0928] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和 

组成的组;

[0929] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0930] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0931] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

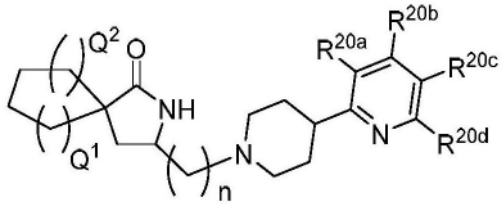
[0932] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0933] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0934] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0935] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}中的至少2个为氢。

[0936] 本发明的实施方案包括具有式(IVf)的化合物:

[0937] 

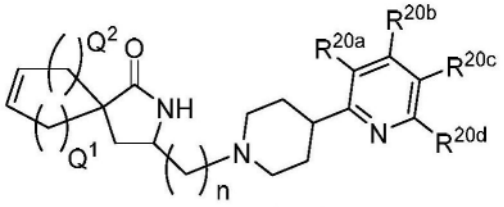
(IVf)

[0938] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0939] Q^1为1或2;

[0940] 并且Q^2为1或2。

[0941] 本发明的实施方案包括具有式(IVg)的化合物:

[0942] 

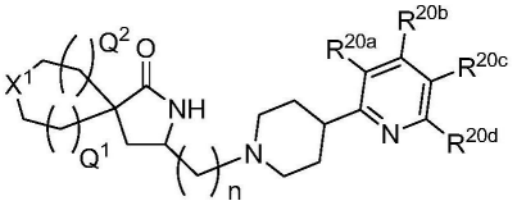
(IVg)

[0943] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0944] Q^1为1或2;

[0945] 并且Q^2为1或2。

[0946] 本发明的实施方案包括具有式(IVh)的化合物:

[0947] 

(IVh)

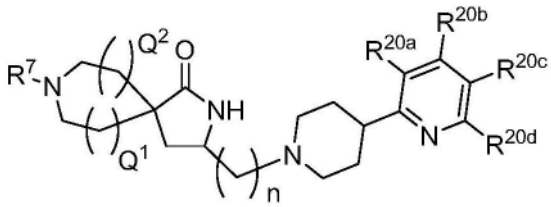
[0948] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0949] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[0950] Q^1为1或2;

[0951] 并且Q^2为1或2。

[0952] 本发明的实施方案包括具有式(IVh-1)的化合物:

[0953] 

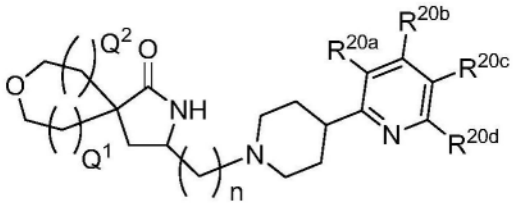
(IVh-1)

[0954] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0955] Q^1为1或2;

[0956] 并且Q^2为1或2。

[0957] 本发明的实施方案包括具有式(IVh-2)的化合物:

[0958] 

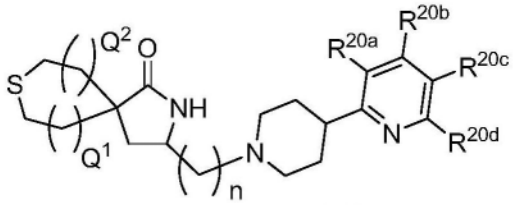
(IVh-2)

[0959] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0960] Q^1为1或2；

[0961] 并且Q^2为1或2。

[0962] 本发明的实施方案包括具有式(IVh-3)的化合物：

[0963] 

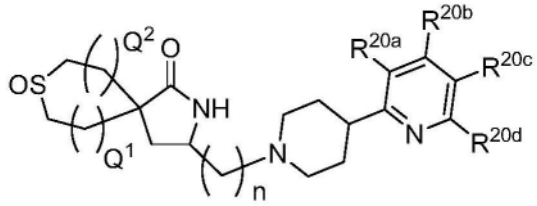
(IVh-3)

[0964] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0965] Q^1为1或2；

[0966] 并且Q^2为1或2。

[0967] 本发明的实施方案包括具有式(IVh-4)的化合物：

[0968] 

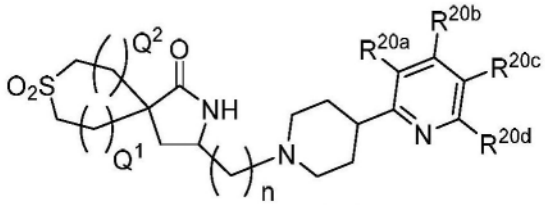
(IVh-4)

[0969] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0970] Q^1为1或2；

[0971] 并且Q^2为1或2。

[0972] 本发明的实施方案包括具有式(IVh-5)的化合物：

[0973] 

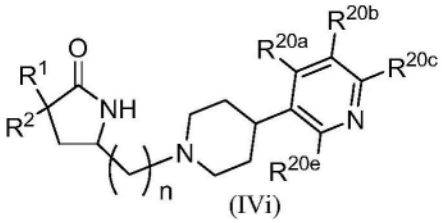
(IVh-5)

[0974] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[0975] Q^1为1或2；

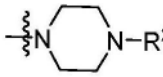
[0976] 并且Q^2为1或2。

[0977] 本发明的实施方案包括具有式(IVi)的化合物：

[0978] 

(IVi)

[0979] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0980] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、-$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[0981] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0982] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0983] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

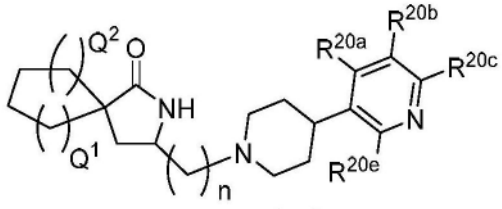
[0984] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0985] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0986] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[0987] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20e}中的至少2个为氢。

[0988] 本发明的实施方案包括具有式(IVj)的化合物:

[0989] 

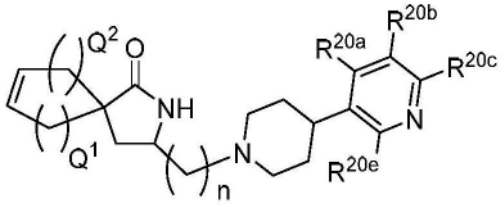
(IVj)

[0990] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0991] Q^1为1或2;

[0992] 并且Q^2为1或2。

[0993] 本发明的实施方案包括具有式(IVk)的化合物:

[0994] 

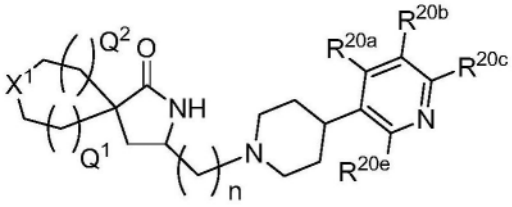
(IVk)

[0995] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[0996] Q^1为1或2;

[0997] 并且Q^2为1或2。

[0998] 本发明的实施方案包括具有式(IVL)的化合物:

[0999] 

(IVL)

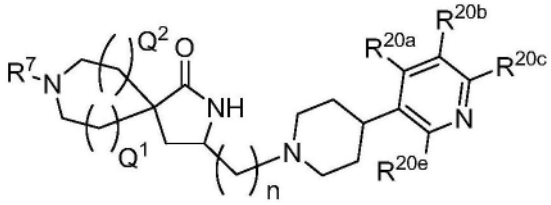
[1000] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1001] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[1002] Q^1为1或2;

[1003] 并且Q^2为1或2。

[1004] 本发明的实施方案包括具有式(IVL-1)的化合物:

[1005] 

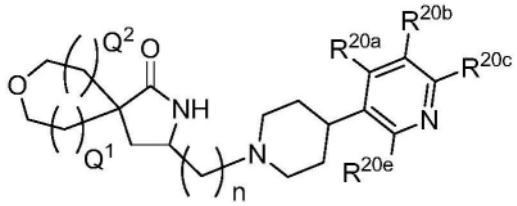
(IVL-1)

[1006] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1007] Q^1为1或2;

[1008] 并且Q^2为1或2。

[1009] 本发明的实施方案包括具有式(IVL-2)的化合物:

[1010] 

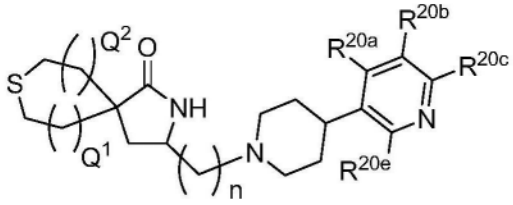
(IVL-2)

[1011] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1012] Q^1为1或2;

[1013] 并且Q^2为1或2。

[1014] 本发明的实施方案包括具有式(IVL-3)的化合物:

[1015] 

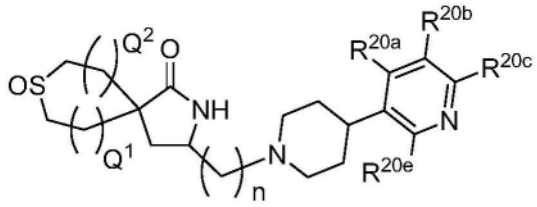
(IVL-3)

[1016] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1017] Q^1为1或2;

[1018] 并且Q^2为1或2。

[1019] 本发明的实施方案包括具有式(IVL-4)的化合物:

[1020] 

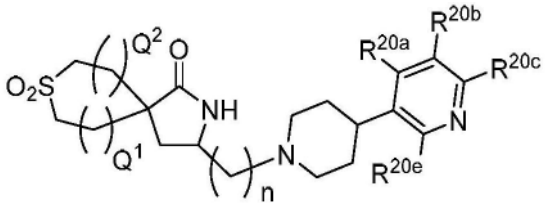
(IVL-4)

[1021] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1022] Q^1为1或2;

[1023] 并且Q^2为1或2。

[1024] 本发明的实施方案包括具有式(IVL-5)的化合物:

[1025] 

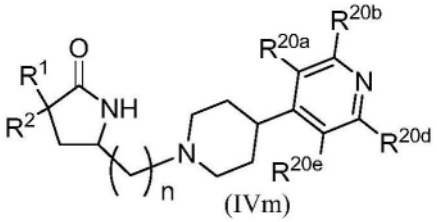
(IVL-5)

[1026] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1027] Q^1为1或2;

[1028] 并且Q^2为1或2。

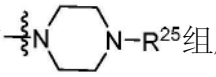
[1029] 本发明的实施方案包括具有式(IVm)的化合物:

[1030] 

(IVm)

[1031] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1032] R^{20a}、R^{20b}、R^{20d}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、-

$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[1033] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1034] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1035] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

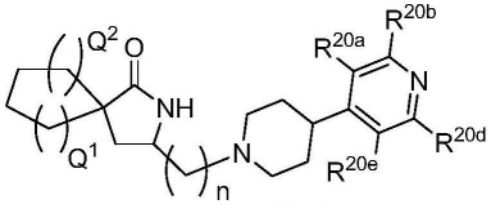
[1036] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1037] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1038] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1039] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}中的至少2个为氢。

[1040] 本发明的实施方案包括具有式(IVn)的化合物：

[1041] 

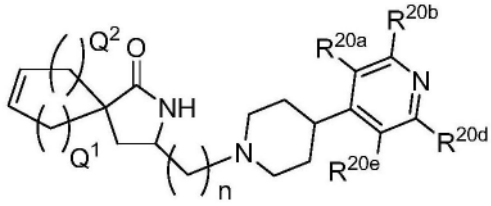
(IVn)

[1042] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1043] Q^1为1或2；

[1044] 并且Q^2为1或2。

[1045] 本发明的实施方案包括具有式(IVo)的化合物：

[1046] 

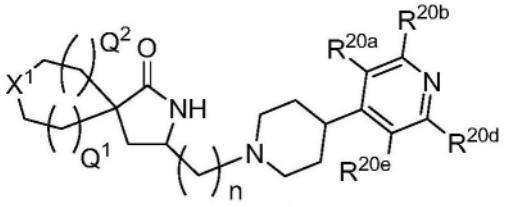
(IVo)

[1047] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1048] Q^1为1或2；

[1049] 并且Q^2为1或2。

[1050] 本发明的实施方案包括具有式(IVp)的化合物：

[1051] 

(IVp)

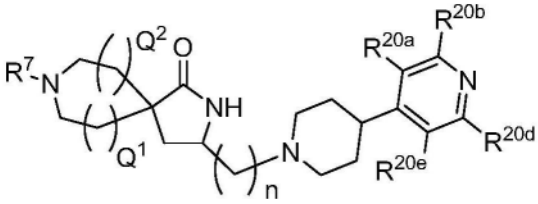
[1052] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1053] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[1054] Q^1为1或2;

[1055] 并且Q^2为1或2。

[1056] 本发明的实施方案包括具有式(IVp-1)的化合物:

[1057] 

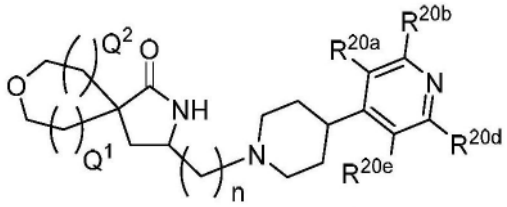
(IVp-1)

[1058] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1059] Q^1为1或2;

[1060] 并且Q^2为1或2。

[1061] 本发明的实施方案包括具有式(IVp-2)的化合物:

[1062] 

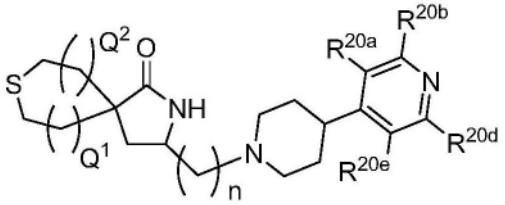
(IVp-2)

[1063] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1064] Q^1为1或2;

[1065] 并且Q^2为1或2。

[1066] 本发明的实施方案包括具有式(IVp-3)的化合物:

[1067] 

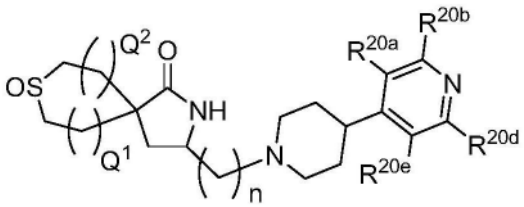
(IVp-3)

[1068] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1069] Q^1为1或2;

[1070] 并且Q^2为1或2。

[1071] 本发明的实施方案包括具有式(IVp-4)的化合物:

[1072] 

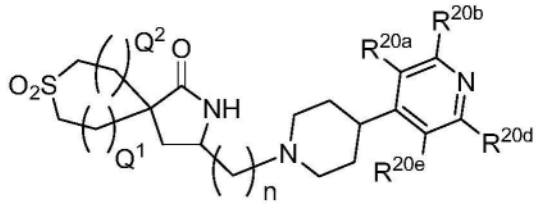
(IVp-4)

[1073] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1074] Q^1为1或2;

[1075] 并且Q^2为1或2。

[1076] 本发明的实施方案包括具有式(IVp-5)的化合物:

[1077] 

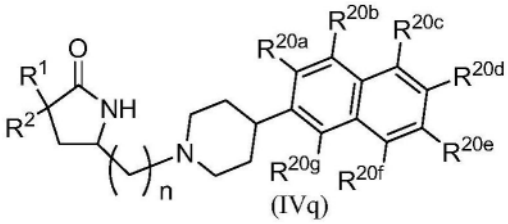
(IVp-5)

[1078] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1079] Q^1为1或2;

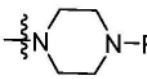
[1080] 并且Q^2为1或2。

[1081] 本发明的实施方案包括具有式(IVq)的化合物:

[1082] 

(IVq)

[1083] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1084] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、-$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[1085] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1086] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1087] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1088] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成

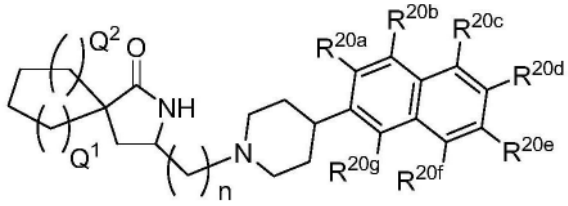
的组；

[1089] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1090] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1091] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}中的至少5个为氢。

[1092] 本发明的实施方案包括具有式(IVr)的化合物：

[1093] 

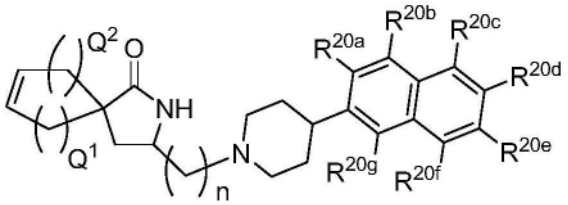
(IVr)

[1094] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1095] Q^1为1或2；

[1096] 并且Q^2为1或2。

[1097] 本发明的实施方案包括具有式(IVs)的化合物：

[1098] 

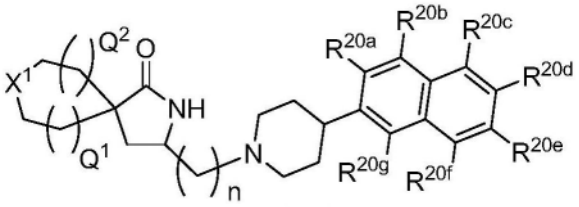
(IVs)

[1099] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1100] Q^1为1或2；

[1101] 并且Q^2为1或2。

[1102] 本发明的实施方案包括具有式(IVt)的化合物：

[1103] 

(IVt)

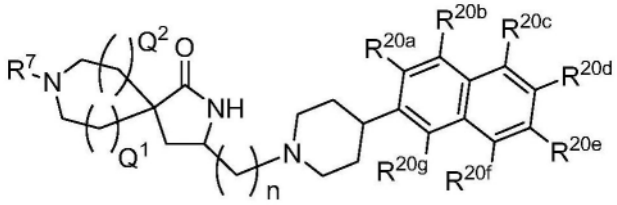
[1104] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1105] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[1106] Q^1为1或2；

[1107] 并且Q^2为1或2。

[1108] 本发明的实施方案包括具有式(IVt-1)的化合物：

[1109] 

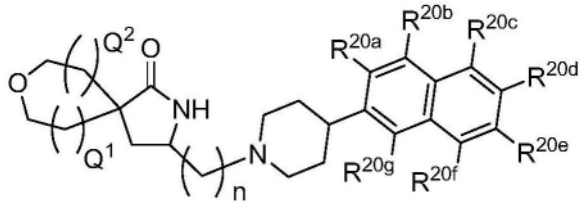
(IVt-1)

[1110] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1111] Q^1为1或2;

[1112] 并且Q^2为1或2。

[1113] 本发明的实施方案包括具有式(IVt-2)的化合物:

[1114] 

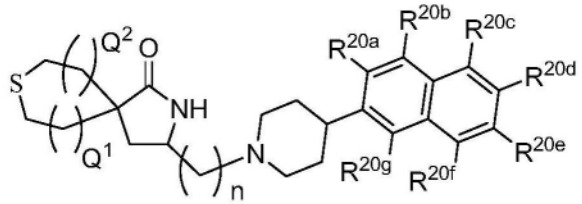
(IVt-2)

[1115] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1116] Q^1为1或2;

[1117] 并且Q^2为1或2。

[1118] 本发明的实施方案包括具有式(IVt-3)的化合物:

[1119] 

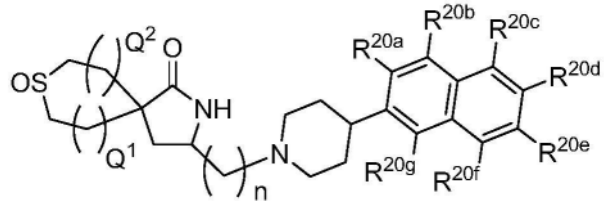
(IVt-3)

[1120] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1121] Q^1为1或2;

[1122] 并且Q^2为1或2。

[1123] 本发明的实施方案包括具有式(IVt-4)的化合物:

[1124] 

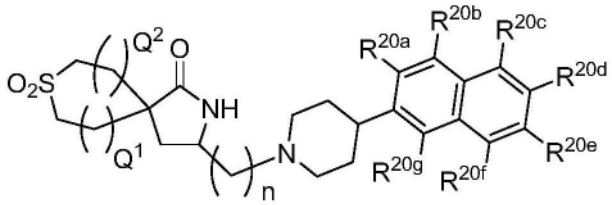
(IVt-4)

[1125] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1126] Q^1为1或2;

[1127] 并且Q^2为1或2。

[1128] 本发明的实施方案包括具有式(IVt-5)的化合物:

[1129] 

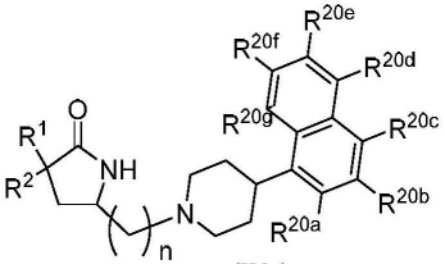
(IVt-5)

[1130] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1131] Q^1为1或2;

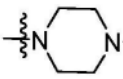
[1132] 并且Q^2为1或2。

[1133] 本发明的实施方案包括具有式(IVu)的化合物:

[1134] 

(IVu)

[1135] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1136] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[1137] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1138] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1139] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

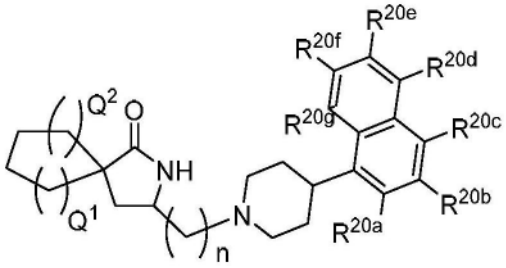
[1140] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1141] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1142] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1143] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}中的至少5个为氢。

[1144] 本发明的实施方案包括具有式(IVv)的化合物:

[1145] 

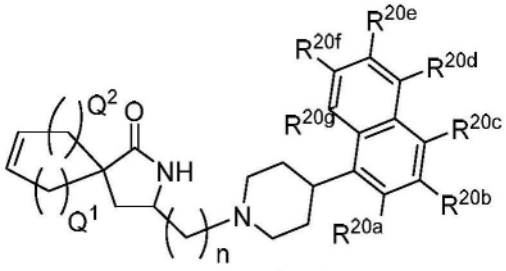
(IVv)

[1146] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1147] Q^1为1或2;

[1148] 并且Q^2为1或2。

[1149] 本发明的实施方案包括具有式(IVw)的化合物:

[1150] 

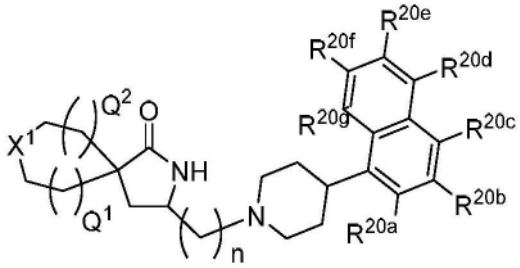
(IVw)

[1151] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1152] Q^1为1或2;

[1153] 并且Q^2为1或2。

[1154] 本发明的实施方案包括具有式(IVx)的化合物:

[1155] 

(IVx)

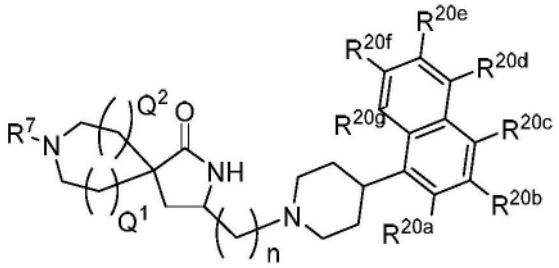
[1156] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1157] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[1158] Q^1为1或2;

[1159] 并且Q^2为1或2。

[1160] 本发明的实施方案包括具有式(IVx-1)的化合物:

[1161] 

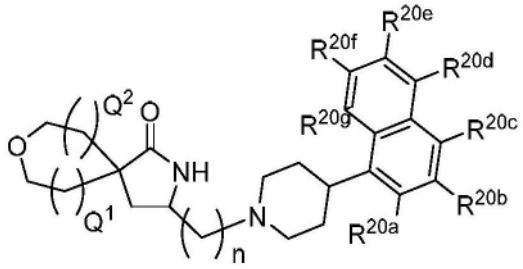
(IVx-1)

[1162] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1163] Q^1为1或2;

[1164] 并且Q^2为1或2。

[1165] 本发明的实施方案包括具有式(IVx-2)的化合物:

[1166] 

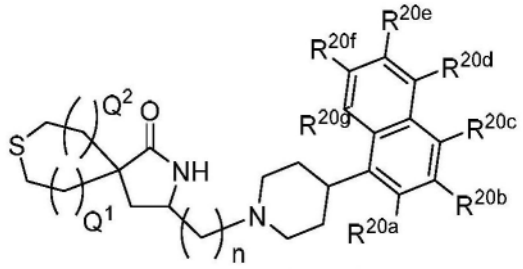
(IVx-2)

[1167] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1168] Q^1为1或2;

[1169] 并且Q^2为1或2。

[1170] 本发明的实施方案包括具有式(IVx-3)的化合物:

[1171] 

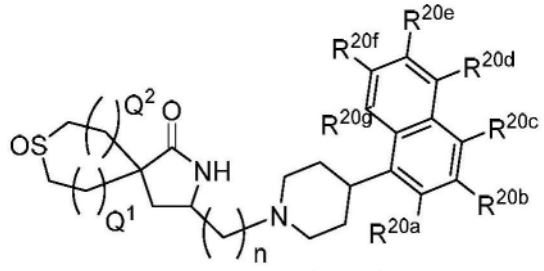
(IVx-3)

[1172] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1173] Q^1为1或2;

[1174] 并且Q^2为1或2。

[1175] 本发明的实施方案包括具有式(IVx-4)的化合物:

[1176] 

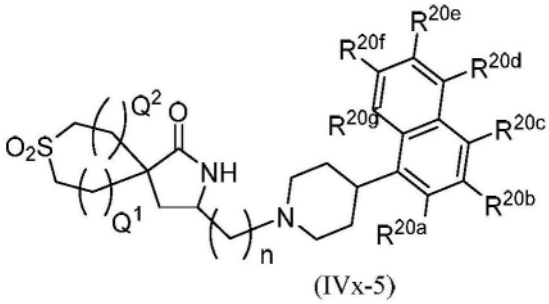
(IVx-4)

[1177] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1178] Q^1为1或2;

[1179] 并且Q^2为1或2。

[1180] 本发明的实施方案包括具有式(IVx-5)的化合物:

[1181] 

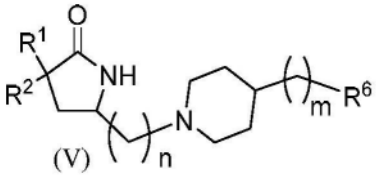
(IVx-5)

[1182] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1183] Q^1为1或2;

[1184] 并且Q^2为1或2。

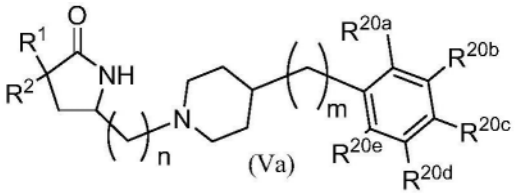
[1185] 本发明的实施方案包括具有式(V)的化合物:

[1186] 

(V)

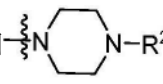
[1187] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物。

[1188] 本发明的实施方案包括具有式(Va)的化合物:

[1189] 

(Va)

[1190] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1191] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[1192] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1193] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1194] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1195] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成

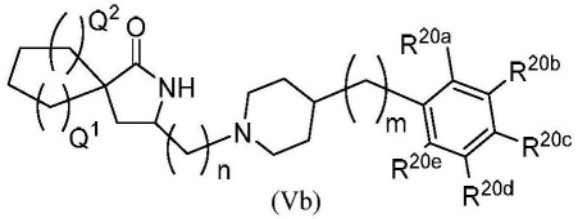
的组；

[1196] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1197] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1198] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}和R^{20e}中的至少3个为氢。

[1199] 本发明的实施方案包括具有式(Vb)的化合物：

[1200] 

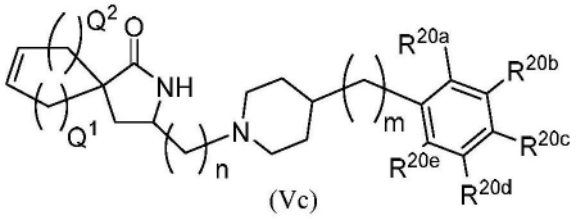
(Vb)

[1201] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1202] Q^1为1或2；

[1203] 并且Q^2为1或2。

[1204] 本发明的实施方案包括具有式(Vc)的化合物：

[1205] 

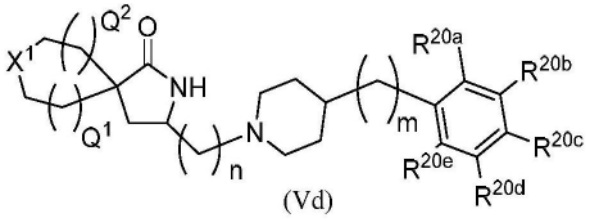
(Vc)

[1206] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1207] Q^1为1或2；

[1208] 并且Q^2为1或2。

[1209] 本发明的实施方案包括具有式(Vd)的化合物：

[1210] 

(Vd)

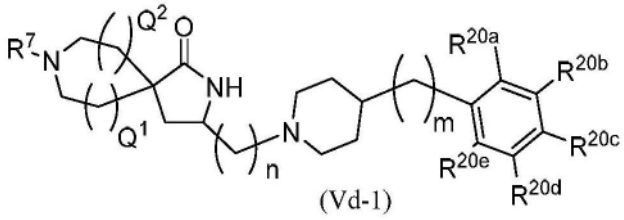
[1211] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1212] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[1213] Q^1为1或2；

[1214] 并且Q^2为1或2。

[1215] 本发明的实施方案包括具有式(Vd-1)的化合物：

[1216] 

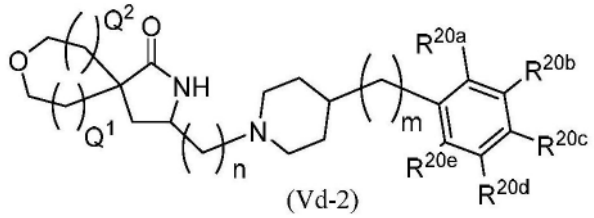
(Vd-1)

[1217] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1218] Q^1为1或2;

[1219] 并且Q^2为1或2。

[1220] 本发明的实施方案包括具有式(Vd-2)的化合物:

[1221] 

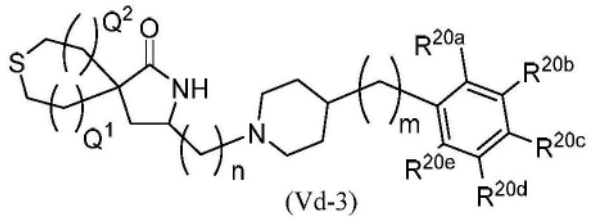
(Vd-2)

[1222] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1223] Q^1为1或2;

[1224] 并且Q^2为1或2。

[1225] 本发明的实施方案包括具有式(Vd-3)的化合物:

[1226] 

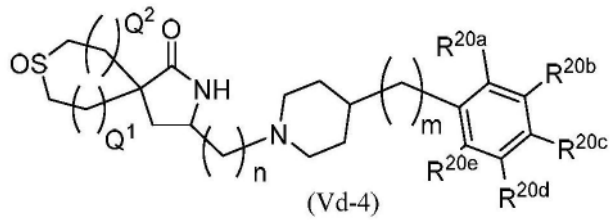
(Vd-3)

[1227] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1228] Q^1为1或2;

[1229] 并且Q^2为1或2。

[1230] 本发明的实施方案包括具有式(Vd-4)的化合物:

[1231] 

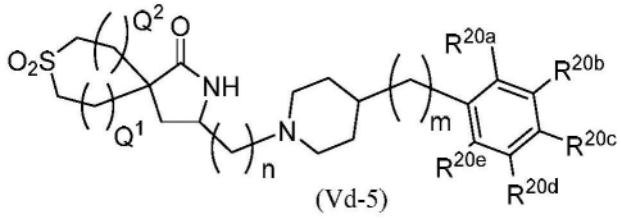
(Vd-4)

[1232] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1233] Q^1为1或2;

[1234] 并且Q^2为1或2。

[1235] 本发明的实施方案包括具有式(Vd-5)的化合物:

[1236] 

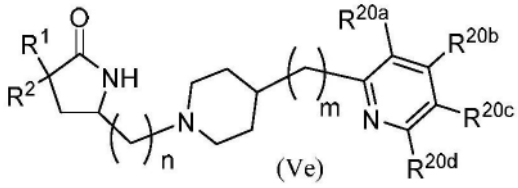
(Vd-5)

[1237] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1238] Q^1为1或2;

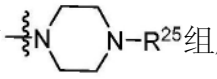
[1239] 并且Q^2为1或2。

[1240] 本发明的实施方案包括具有式(Ve)的化合物:

[1241] 

(Ve)

[1242] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1243] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、-$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和 

组成的组;

[1244] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1245] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1246] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

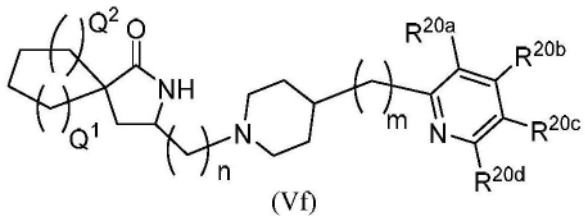
[1247] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1248] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1249] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1250] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}中的至少2个为氢。

[1251] 本发明的实施方案包括具有式(Vf)的化合物:

[1252] 

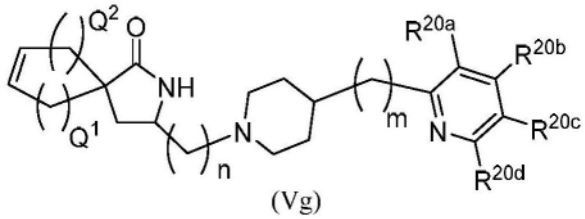
(Vf)

[1253] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1254] Q^1为1或2；

[1255] 并且Q^2为1或2。

[1256] 本发明的实施方案包括具有式(Vg)的化合物：

[1257] 

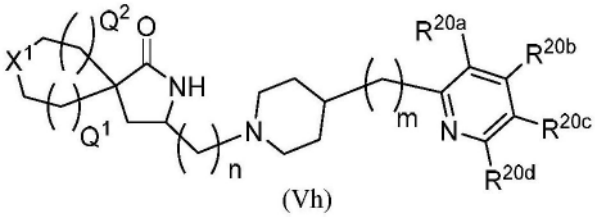
(Vg)

[1258] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1259] Q^1为1或2；

[1260] 并且Q^2为1或2。

[1261] 本发明的实施方案包括具有式(Vh)的化合物：

[1262] 

(Vh)

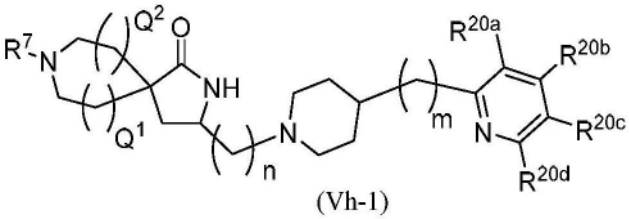
[1263] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1264] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[1265] Q^1为1或2；

[1266] 并且Q^2为1或2。

[1267] 本发明的实施方案包括具有式(Vh-1)的化合物：

[1268] 

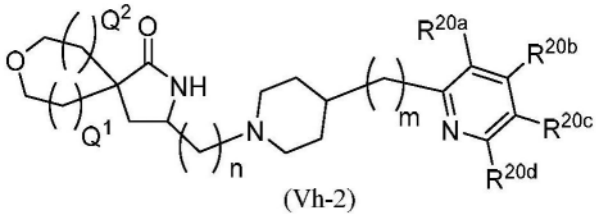
(Vh-1)

[1269] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1270] Q^1为1或2；

[1271] 并且Q^2为1或2。

[1272] 本发明的实施方案包括具有式(Vh-2)的化合物：

[1273] 

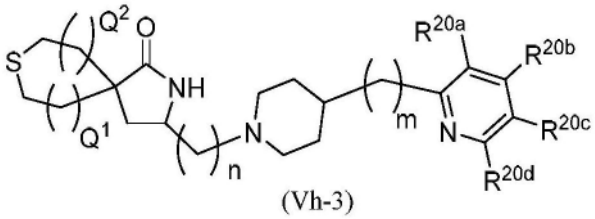
(Vh-2)

[1274] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1275] Q^1为1或2；

[1276] 并且Q^2为1或2。

[1277] 本发明的实施方案包括具有式(Vh-3)的化合物：

[1278] 

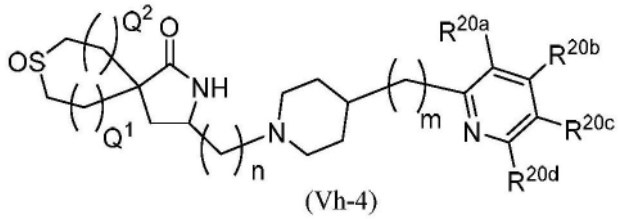
(Vh-3)

[1279] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1280] Q^1为1或2；

[1281] 并且Q^2为1或2。

[1282] 本发明的实施方案包括具有式(Vh-4)的化合物：

[1283] 

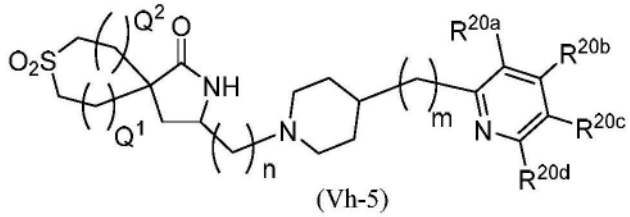
(Vh-4)

[1284] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1285] Q^1为1或2；

[1286] 并且Q^2为1或2。

[1287] 本发明的实施方案包括具有式(Vh-5)的化合物：

[1288] 

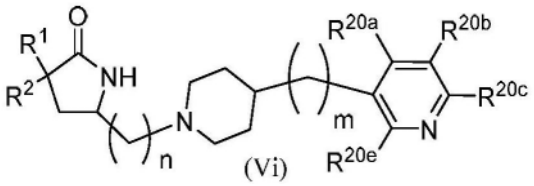
(Vh-5)

[1289] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1290] Q^1为1或2；

[1291] 并且Q^2为1或2。

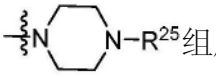
[1292] 本发明的实施方案包括具有式(Vi)的化合物：

[1293] 

(Vi)

[1294] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1295] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、-

$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[1296] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1297] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1298] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

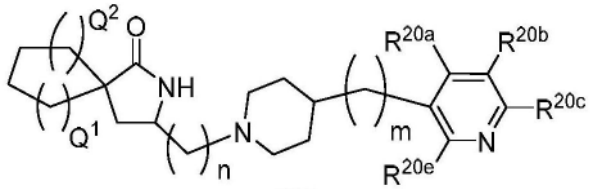
[1299] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1300] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1301] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1302] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20e}中的至少2个为氢。

[1303] 本发明的实施方案包括具有式(Vj)的化合物：

[1304] 

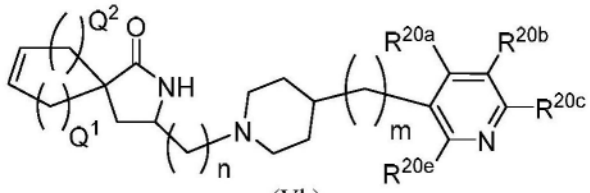
(Vj)

[1305] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1306] Q^1为1或2；

[1307] 并且Q^2为1或2。

[1308] 本发明的实施方案包括具有式(Vk)的化合物：

[1309] 

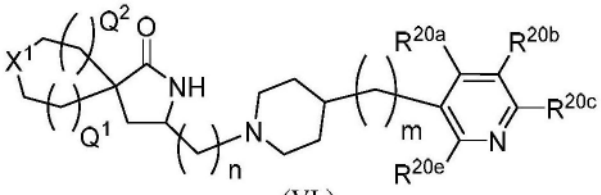
(Vk)

[1310] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1311] Q^1为1或2；

[1312] 并且Q^2为1或2。

[1313] 本发明的实施方案包括具有式(VL)的化合物：

[1314] 

(VL)

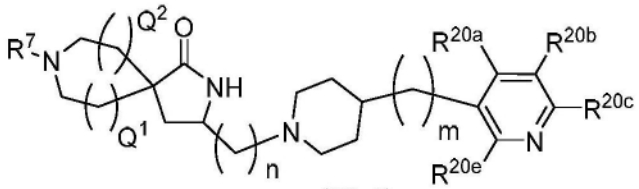
[1315] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1316] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[1317] Q^1为1或2；

[1318] 并且Q^2为1或2。

[1319] 本发明的实施方案包括具有式(VL-1)的化合物：

[1320] 

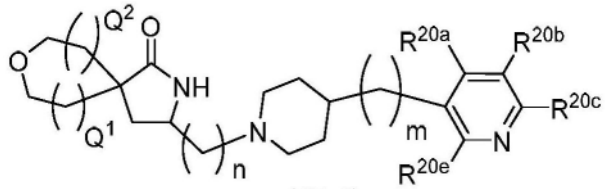
(VL-1)

[1321] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1322] Q^1为1或2；

[1323] 并且Q^2为1或2。

[1324] 本发明的实施方案包括具有式(VL-2)的化合物：

[1325] 

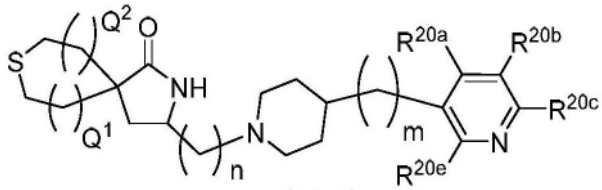
(VL-2)

[1326] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1327] Q^1为1或2；

[1328] 并且Q^2为1或2。

[1329] 本发明的实施方案包括具有式(VL-3)的化合物：

[1330] 

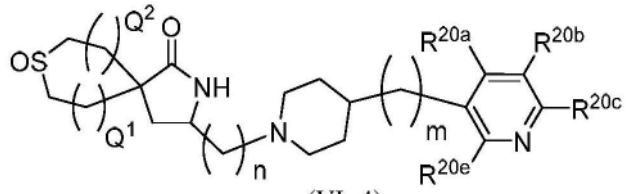
(VL-3)

[1331] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1332] Q^1为1或2；

[1333] 并且Q^2为1或2。

[1334] 本发明的实施方案包括具有式(VL-4)的化合物：

[1335] 

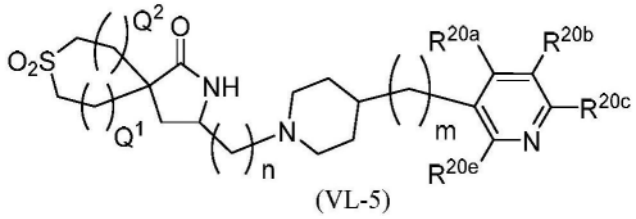
(VL-4)

[1336] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1337] Q^1为1或2；

[1338] 并且Q^2为1或2。

[1339] 本发明的实施方案包括具有式(VL-5)的化合物：

[1340] 

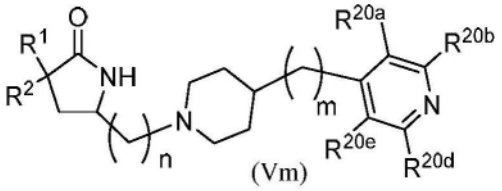
(VL-5)

[1341] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1342] Q^1为1或2；

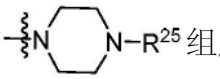
[1343] 并且Q^2为1或2。

[1344] 本发明的实施方案包括具有式(Vm)的化合物：

[1345] 

(Vm)

[1346] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1347] R^{20a}、R^{20b}、R^{20d}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[1348] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1349] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1350] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

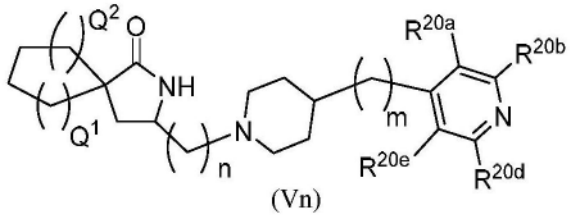
[1351] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1352] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1353] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1354] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}中的至少2个为氢。

[1355] 本发明的实施方案包括具有式(Vn)的化合物：

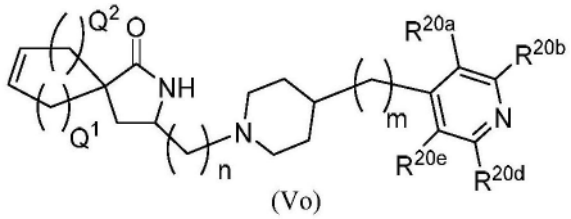
[1356] 
(Vn)

[1357] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1358] Q^1为1或2;

[1359] 并且Q^2为1或2。

[1360] 本发明的实施方案包括具有式(Vo)的化合物:

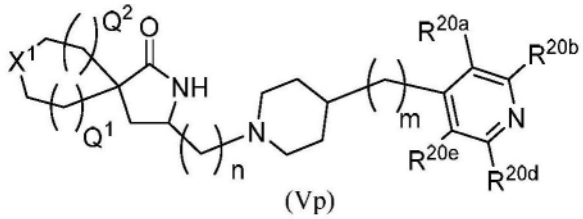
[1361] 
(Vo)

[1362] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1363] Q^1为1或2;

[1364] 并且Q^2为1或2。

[1365] 本发明的实施方案包括具有式(Vp)的化合物:

[1366] 
(Vp)

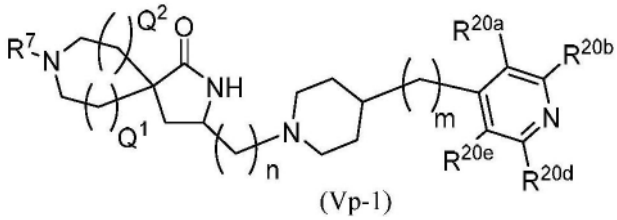
[1367] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1368] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[1369] Q^1为1或2;

[1370] 并且Q^2为1或2。

[1371] 本发明的实施方案包括具有式(Vp-1)的化合物:

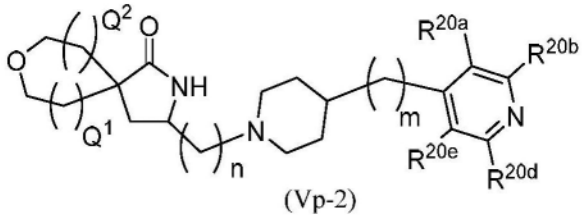
[1372] 
(Vp-1)

[1373] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1374] Q^1为1或2;

[1375] 并且Q^2为1或2。

[1376] 本发明的实施方案包括具有式(Vp-2)的化合物:

[1377] 

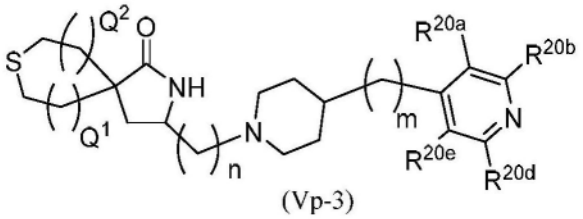
(Vp-2)

[1378] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1379] Q^1为1或2;

[1380] 并且Q^2为1或2。

[1381] 本发明的实施方案包括具有式(Vp-3)的化合物:

[1382] 

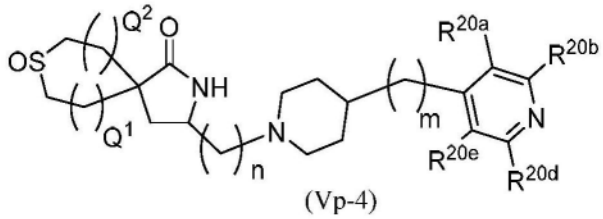
(Vp-3)

[1383] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1384] Q^1为1或2;

[1385] 并且Q^2为1或2。

[1386] 本发明的实施方案包括具有式(Vp-4)的化合物:

[1387] 

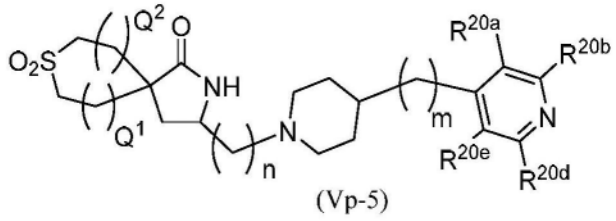
(Vp-4)

[1388] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1389] Q^1为1或2;

[1390] 并且Q^2为1或2。

[1391] 本发明的实施方案包括具有式(Vp-5)的化合物:

[1392] 

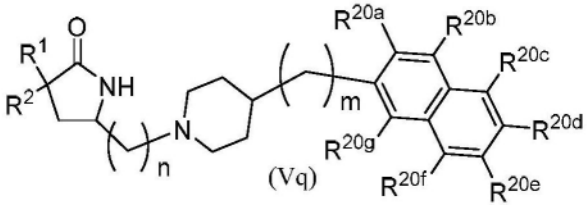
(Vp-5)

[1393] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

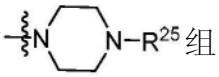
[1394] Q^1为1或2;

[1395] 并且Q^2为1或2。

[1396] 本发明的实施方案包括具有式(Vq)的化合物:

[1397] 

[1398] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1399] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[1400] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1401] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1402] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

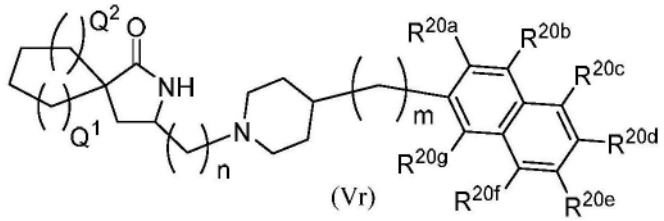
[1403] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1404] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1405] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1406] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}中的至少5个为氢。

[1407] 本发明的实施方案包括具有式(Vr)的化合物：

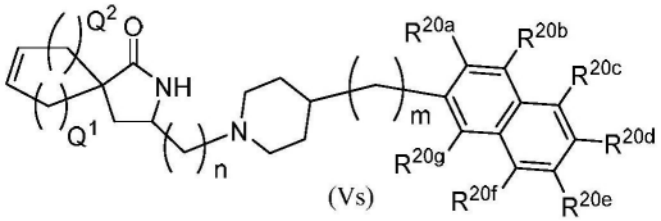
[1408] 

[1409] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1410] Q^1为1或2；

[1411] 并且Q^2为1或2。

[1412] 本发明的实施方案包括具有式(Vs)的化合物：

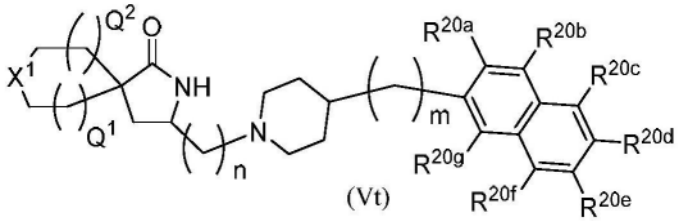
[1413] 

[1414] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1415] Q^1为1或2;

[1416] 并且Q^2为1或2。

[1417] 本发明的实施方案包括具有式(Vt)的化合物:

[1418] 

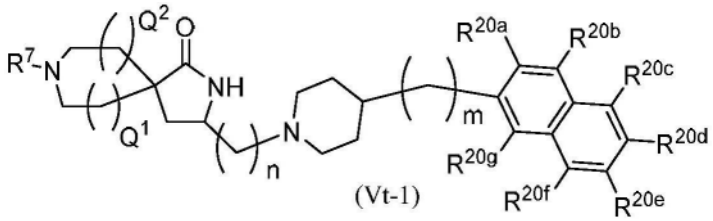
[1419] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1420] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[1421] Q^1为1或2;

[1422] 并且Q^2为1或2。

[1423] 本发明的实施方案包括具有式(Vt-1)的化合物:

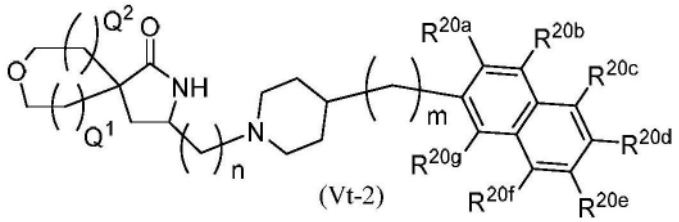
[1424] 

[1425] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1426] Q^1为1或2;

[1427] 并且Q^2为1或2。

[1428] 本发明的实施方案包括具有式(Vt-2)的化合物:

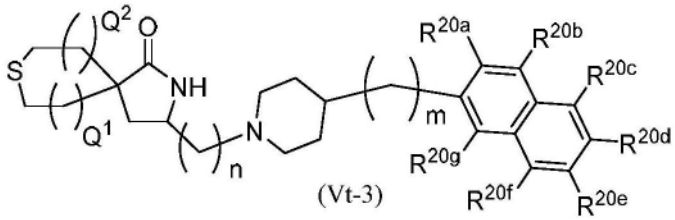
[1429] 

[1430] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1431] Q^1为1或2;

[1432] 并且Q^2为1或2。

[1433] 本发明的实施方案包括具有式(Vt-3)的化合物:

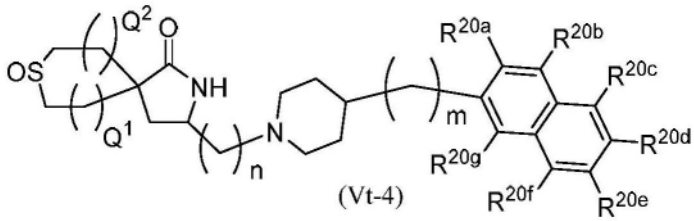
[1434] 

[1435] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1436] Q^1为1或2;

[1437] 并且Q^2为1或2。

[1438] 本发明的实施方案包括具有式(Vt-4)的化合物:

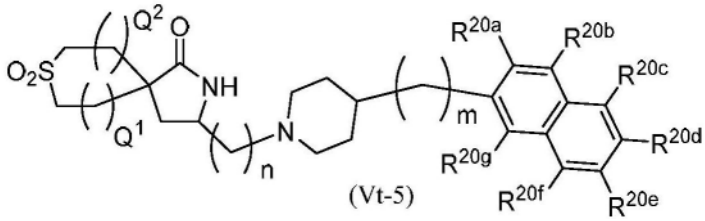
[1439] 

[1440] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1441] Q^1为1或2;

[1442] 并且Q^2为1或2。

[1443] 本发明的实施方案包括具有式(Vt-5)的化合物:

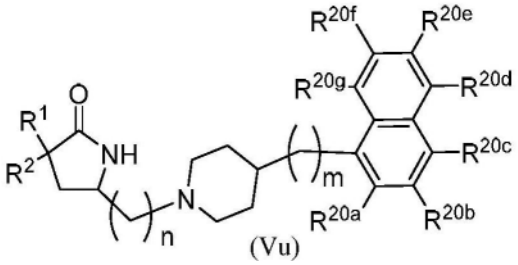
[1444] 

[1445] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1446] Q^1为1或2;

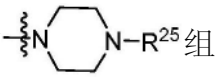
[1447] 并且Q^2为1或2。

[1448] 本发明的实施方案包括具有式(Vu)的化合物:

[1449] 

[1450] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1451] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、

SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[1452] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1453] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1454] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

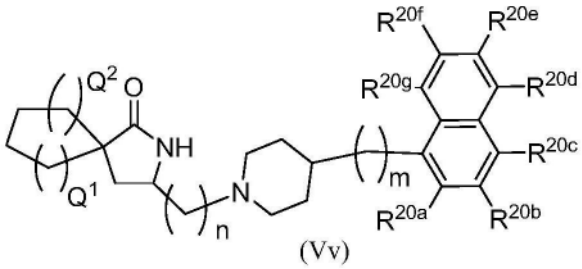
[1455] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1456] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1457] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1458] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}中的至少5个为氢。

[1459] 本发明的实施方案包括具有式(Vv)的化合物：

[1460] 

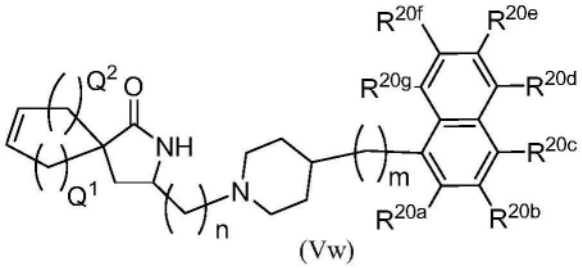
(Vv)

[1461] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1462] Q^1为1或2；

[1463] 并且Q^2为1或2。

[1464] 本发明的实施方案包括具有式(Vw)的化合物：

[1465] 

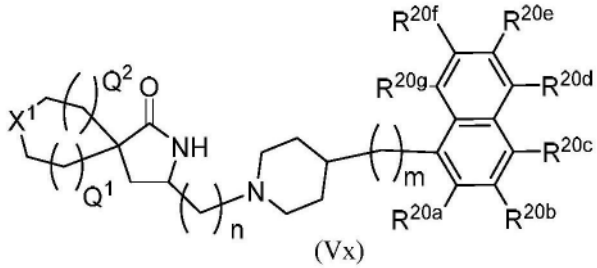
(Vw)

[1466] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1467] Q^1为1或2；

[1468] 并且Q^2为1或2。

[1469] 本发明的实施方案包括具有式(Vx)的化合物：

[1470] 

(Vx)

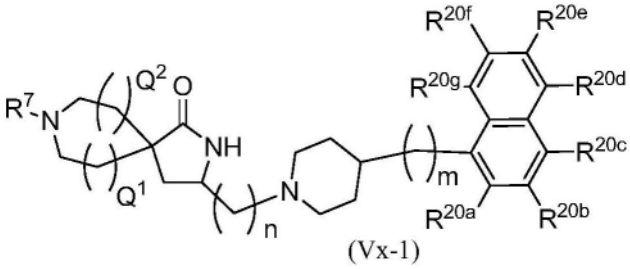
[1471] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1472] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[1473] Q^1为1或2;

[1474] 并且Q^2为1或2。

[1475] 本发明的实施方案包括具有式(Vx-1)的化合物:

[1476] 

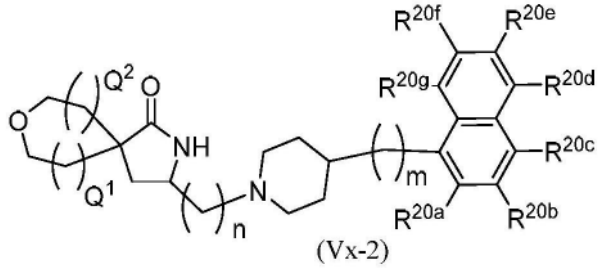
(Vx-1)

[1477] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1478] Q^1为1或2;

[1479] 并且Q^2为1或2。

[1480] 本发明的实施方案包括具有式(Vx-2)的化合物:

[1481] 

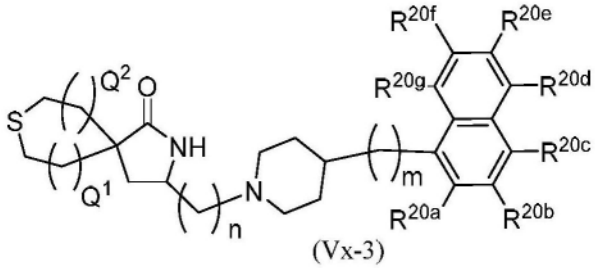
(Vx-2)

[1482] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1483] Q^1为1或2;

[1484] 并且Q^2为1或2。

[1485] 本发明的实施方案包括具有式(Vx-3)的化合物:

[1486] 

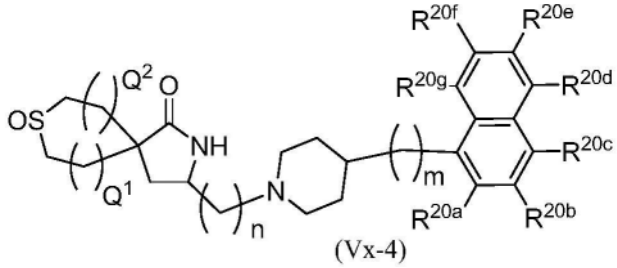
(Vx-3)

[1487] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1488] Q^1为1或2;

[1489] 并且Q^2为1或2。

[1490] 本发明的实施方案包括具有式(Vx-4)的化合物：

[1491] 

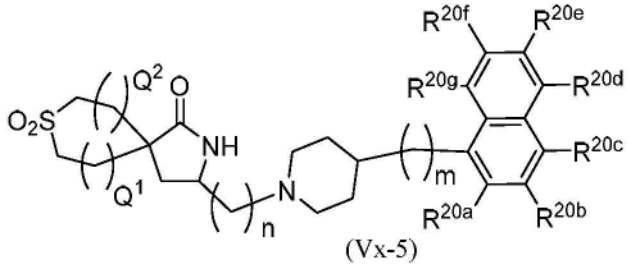
(Vx-4)

[1492] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1493] Q^1为1或2；

[1494] 并且Q^2为1或2。

[1495] 本发明的实施方案包括具有式(Vx-5)的化合物：

[1496] 

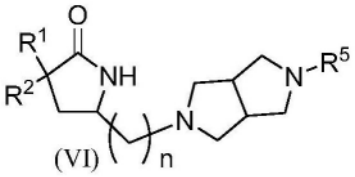
(Vx-5)

[1497] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1498] Q^1为1或2；

[1499] 并且Q^2为1或2。

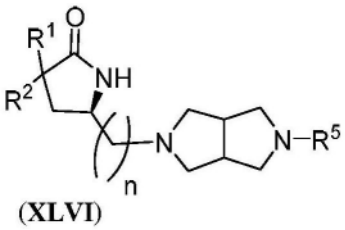
[1500] 本发明的实施方案包括具有式(VI)的化合物：

[1501] 

(VI)

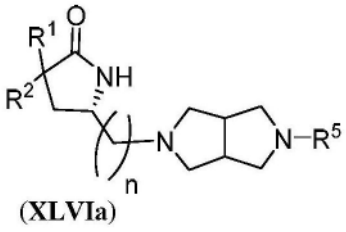
[1502] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物。

[1503] 在实施方案中，化合物具有根据式(XLVI)的结构

[1504] 

(XLVI) 或其可药用盐。

[1505] 在实施方案中，化合物具有根据式(XLVIa)的结构

[1506]  或其可药用盐。

(XLVIa)

,

[1507] 在实施方案中,n为1、2或3。在实施方案中,n为1。在实施方案中,n为2。在实施方案中,n为1或2。

[1508] 在实施方案中,R^1和R^2中的每个为未取代的C_{1-6}烷基。在实施方案中,R^1和R^2中的每个为乙基。在实施方案中,R^1和R^2中的每个为甲基。

[1509] 在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成5至8元环,该环任选地包含一个碳-碳双键和/或选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组的环原子。

[1510] 在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成C_3-C_8环烷基或C_5-C_8环烯基。

[1511] 在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成选自由环丙基、环丁基、环戊基、环戊烯基、环己基、环己烯基、环庚基、环庚烯基、环辛基和环辛烯基组成的组的C_3-C_8环烷基或C_5-C_8环烯基。在实施方案中,所述C_3-C_8环烷基或C_5-C_8环烯基为未取代的。在实施方案中,所述C_3-C_8环烷基或C_5-C_8环烯基被1、2、3或4个取代基(例如,本文所述的1或2个取代基)取代。在实施方案中,所述取代基选自氧(=O)、羟基、卤基、氰基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{1-6}卤代烷基、C_{3-8}环烷基和3至8元杂环基。在实施方案中,所述取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^{n}Pr、-O^{i}Pr、-OCF_3、-Me、-Et、-^{n}Pr、-^{i}Pr、-CF_3、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

[1512] 在实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成包含环原子NR^7的5至8元环。在实施方案中,所述5至8元环不被进一步取代。在实施方案中,所述5至8元环还包含1、2、3或4个取代基(例如,如本文所述的1或2个取代基)。在实施方案中,所述取代基选自氧(=O)、羟基、卤基、氰基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{1-6}卤代烷基、C_{3-8}环烷基和3至8元杂环基。在实施方案中,所述取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^{n}Pr、-O^{i}Pr、-OCF_3、-Me、-Et、-^{n}Pr、-^{i}Pr、-CF_3、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

[1513] 在实施方案中,R^1和R^2合在一起形成吡咯烷基或哌啶基,其中氮原子为NR^7。在实施方案中,所述吡咯烷基或哌啶基不被进一步取代。在实施方案中,所述吡咯烷基或哌啶基还包含1、2、3或4个如本文所述的取代基。

[1514] 在实施方案中,R^7为COR^8,并且R^8为C_{1-6}直链烷基。

[1515] 在实施方案中,R^7为乙酰基。

[1516] 在实施方案中,R^7为SO_2R^{10c},并且R^{10c}为C_{1-6}直链烷基。

[1517] 在实施方案中,R^{10c}为甲基(即,R^7为SO_2Me)。

[1518] 在实施方案中,R^5为苯基。

[1519] 在实施方案中,R^5为取代的苯基。在实施方案中,R^5是被1、2、3、4或5个取代基取代的苯基(例如,被如本文所述的1或2个取代基取代的苯基)。在实施方案中,取代基选自由羟基、卤基、氰基、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{1-6}卤代烷基、C_{3-8}环烷基和3至8元

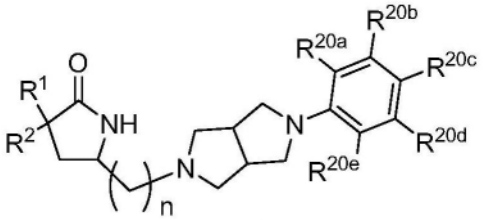
杂环基组成的组。在实施方案中,所述取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^{n}Pr、-O^{i}Pr、-OCF$_3$、-Me、-Et、-^{n}Pr、-^{i}Pr、-CF$_3$、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

[1520] 在实施方案中,R^{5}选自由羟基苯基、氟苯基、氯苯基、溴苯基、氰基苯基、甲苯基、甲氧基苯基、二氟苯基、二氯苯基、氯氟苯基、二甲基苯基、三氟甲基苯基、二(三氟甲基)苯基组成的组。

[1521] 在实施方案中,R^{5}选自由4-羟基苯基、3-氟苯基、4-氟苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、3,4-二氯苯基、4-氟-3-氯苯基、4-氰基苯基、2-甲氧基苯基、2-甲基苯基、3-甲基苯基、4-甲基苯基、2-异丙基苯基、4-三氟甲基苯基、2-吗啉代苯基和4-甲基-2-吗啉代苯基组成的组。

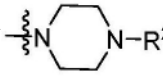
[1522] 在实施方案中,R^{5}为吡啶基。在实施方案中,R^{5}为2-吡啶基。在实施方案中,R^{5}为3-吡啶基。在实施方案中,R^{5}为4-吡啶基。在实施方案中,所述吡啶基为未取代的。在实施方案中,所述吡啶基被1、2、3或4个取代基取代(例如,吡啶基被如本文所述的1或2个取代基取代)。在实施方案中,取代基选自由羟基、卤基、氰基、C$_{1-6}$烷氧基、C$_{1-6}$直链烷基、C$_{3-7}$支链烷基、C$_{1-6}$卤代烷基、C$_{3-8}$环烷基和3至8元杂环基组成的组。在实施方案中,所述取代基选自由-OH、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-OMe、-OEt、-O^{n}Pr、-O^{i}Pr、-OCF$_3$、-Me、-Et、-^{n}Pr、-^{i}Pr、-CF$_3$、环戊基、环己基、吡咯烷基、哌啶基和吗啉代组成的组。

[1523] 本发明的实施方案包括具有式(VIa)的化合物:

[1524] 

(VIa)

[1525] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1526] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、-NO$_2$、-OH、卤素、C$_{1-6}$直链烷基、C$_{3-7}$支链烷基、C$_{3-7}$环烷基、C$_{1-6}$直链烷氧基、C$_{3-7}$支链烷氧基、C$_{3-7}$环烷氧基、C$_{1-6}$直链卤代烷基、C$_{3-7}$支链卤代烷基、C$_{1-6}$直链卤代烷氧基、C$_{3-7}$支链卤代烷氧基、SH、SC$_{1-6}$直链烷基、SC$_{3-7}$支链烷基、SC$_{3-7}$环烷基、SO$_2$C$_{1-6}$直链烷基、SO$_2$C$_{3-7}$支链烷基、SO$_2$C$_{3-7}$环烷基、SO$_2$NH$_2$、SO$_2$NHR^{21}、NHSO$_2$R^{22}、-NR^{23a}R^{23b}、NHC(O)R^{24}、C(O)NHR^{24}、C(O)N(R^{24})$_2$、吗啉代和  组成的组;

[1527] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C$_{1-6}$直链烷基、C$_{3-7}$支链烷基和C$_{3-7}$环烷基组成的组;

[1528] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C$_{1-6}$直链烷基、C$_{3-7}$支链烷基和C$_{3-7}$环烷基组成的组;

[1529] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C$_{1-6}$直链烷基、C$_{3-7}$支链烷基和C$_{3-7}$环烷基组成的组;

[1530] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C$_{1-6}$直链烷基、C$_{3-7}$支链烷基和C$_{3-7}$环烷基组成的组;

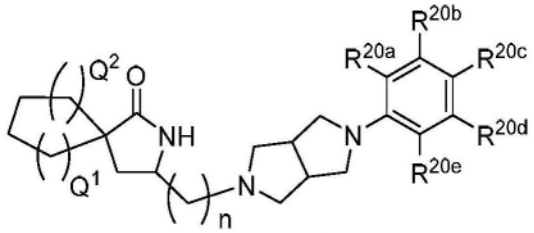
[1531] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C$_{1-6}$直链烷基、C$_{3-7}$支链烷基和C$_{3-7}$环烷基组成的

组；

[1532] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1533] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}和R^{20e}中的至少3个为氢。

[1534] 本发明的实施方案包括具有式(VIb)的化合物：

[1535] 

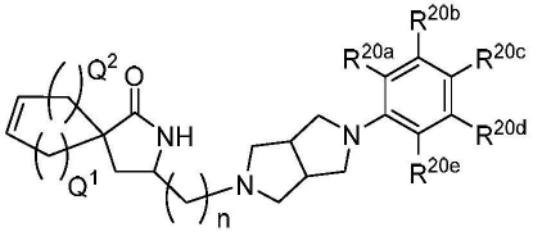
(VIb)

[1536] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1537] Q^1为1或2；

[1538] 并且Q^2为1或2。

[1539] 本发明的实施方案包括具有式(VIc)的化合物：

[1540] 

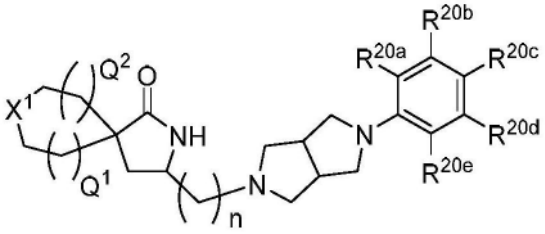
(VIc)

[1541] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1542] Q^1为1或2；

[1543] 并且Q^2为1或2。

[1544] 本发明的实施方案包括具有式(VId)的化合物：

[1545] 

(VId)

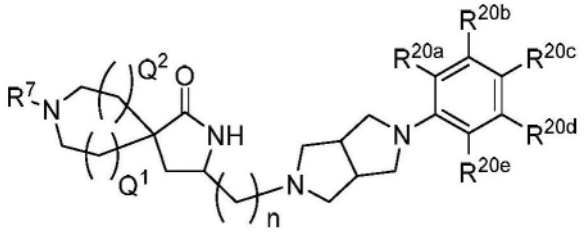
[1546] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1547] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[1548] Q^1为1或2；

[1549] 并且Q^2为1或2。

[1550] 本发明的实施方案包括具有式(Vid-1)的化合物：

[1551] 

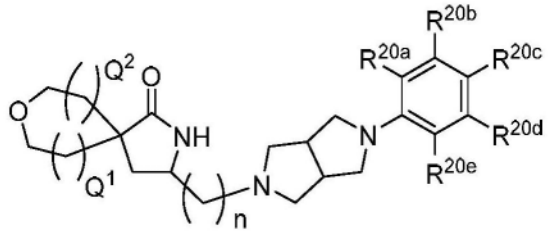
(VId-1)

[1552] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1553] Q^1为1或2;

[1554] 并且Q^2为1或2。

[1555] 本发明的实施方案包括具有式(Vid-2)的化合物:

[1556] 

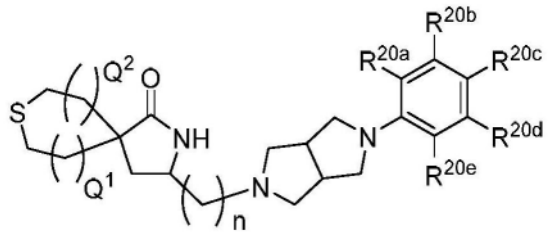
(VId-2)

[1557] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1558] Q^1为1或2;

[1559] 并且Q^2为1或2。

[1560] 本发明的实施方案包括具有式(Vid-3)的化合物:

[1561] 

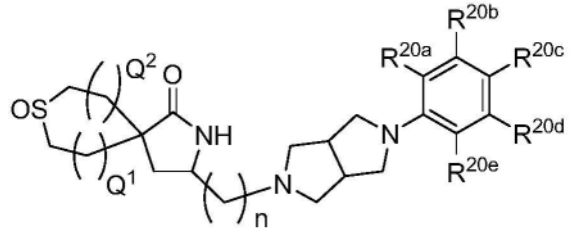
(VId-3)

[1562] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1563] Q^1为1或2;

[1564] 并且Q^2为1或2。

[1565] 本发明的实施方案包括具有式(Vid-4)的化合物:

[1566] 

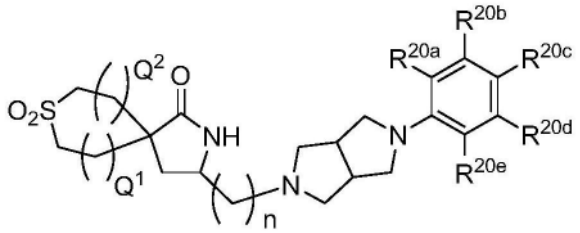
(VId-4)

[1567] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1568] Q^1为1或2;

[1569] 并且Q^2为1或2。

[1570] 本发明的实施方案包括具有式(Vid-5)的化合物：

[1571] 

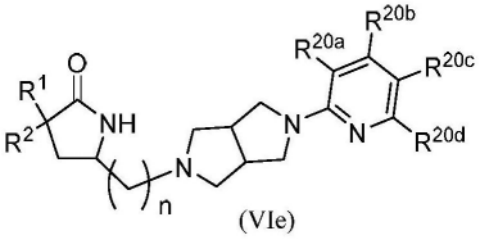
(VId-5)

[1572] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1573] Q^1为1或2；

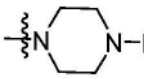
[1574] 并且Q^2为1或2。

[1575] 本发明的实施方案包括具有式(VIe)的化合物：

[1576] 

(VIe)

[1577] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1578] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[1579] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1580] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1581] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

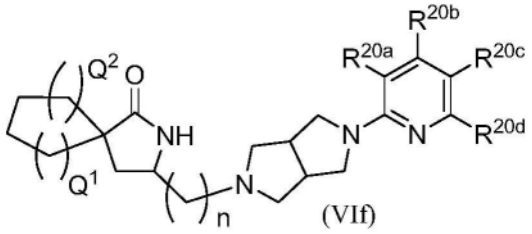
[1582] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1583] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1584] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1585] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}中的至少2个为氢。

[1586] 本发明的实施方案包括具有式(VIf)的化合物：

[1587] 

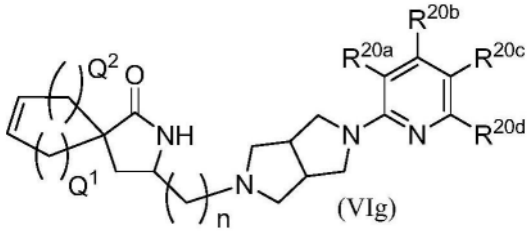
(VIf)

[1588] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1589] Q^1为1或2;

[1590] 并且Q^2为1或2。

[1591] 本发明的实施方案包括具有式(VIg)的化合物:

[1592] 

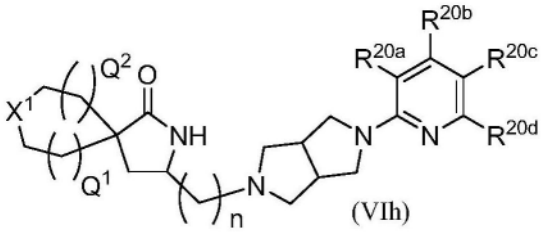
(VIg)

[1593] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1594] Q^1为1或2;

[1595] 并且Q^2为1或2。

[1596] 本发明的实施方案包括具有式(VIh)的化合物:

[1597] 

(VIh)

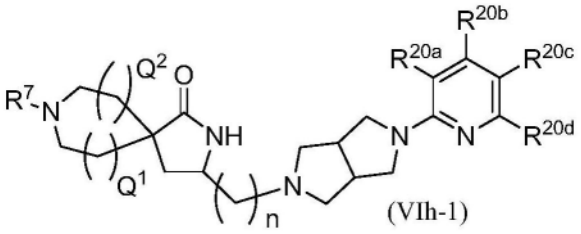
[1598] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1599] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[1600] Q^1为1或2;

[1601] 并且Q^2为1或2。

[1602] 本发明的实施方案包括具有式(VIh-1)的化合物:

[1603] 

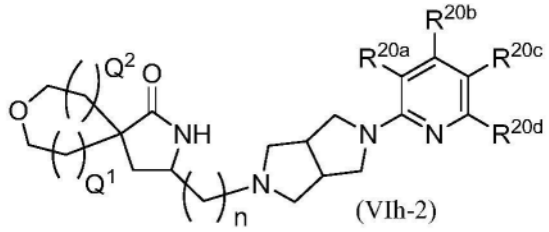
(VIh-1)

[1604] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1605] Q^1为1或2;

[1606] 并且Q^2为1或2。

[1607] 本发明的实施方案包括具有式(VIh-2)的化合物:

[1608] 

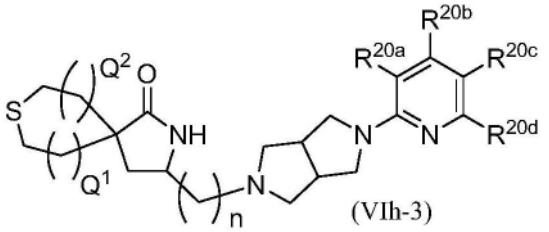
(VIh-2)

[1609] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1610] Q^1为1或2;

[1611] 并且Q^2为1或2。

[1612] 本发明的实施方案包括具有式(VIh-3)的化合物:

[1613] 

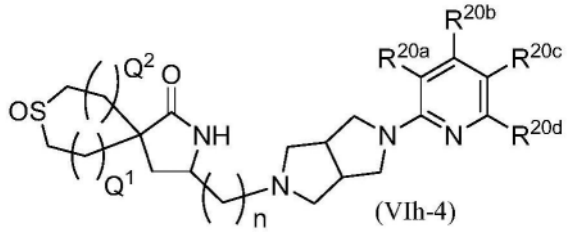
(VIh-3)

[1614] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1615] Q^1为1或2;

[1616] 并且Q^2为1或2。

[1617] 本发明的实施方案包括具有式(VIh-)的化合物:

[1618] 

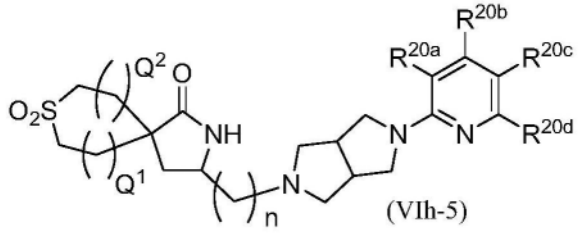
(VIh-4)

[1619] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1620] Q^1为1或2;

[1621] 并且Q^2为1或2。

[1622] 本发明的实施方案包括具有式(VIh-5)的化合物:

[1623] 

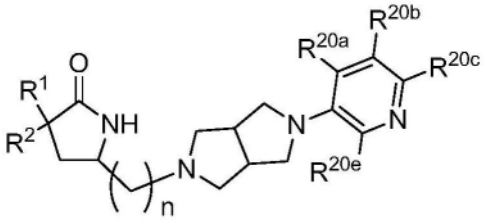
(VIh-5)

[1624] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1625] Q^1为1或2;

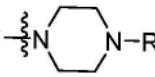
[1626] 并且Q^2为1或2。

[1627] 本发明的实施方案包括具有式(VIi)的化合物:

[1628] 

(VIc)

[1629] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1630] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、-$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[1631] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1632] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1633] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

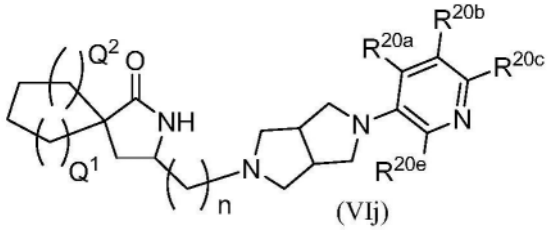
[1634] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1635] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1636] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1637] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20e}中的至少2个为氢。

[1638] 本发明的实施方案包括具有式(VIj)的化合物:

[1639] 

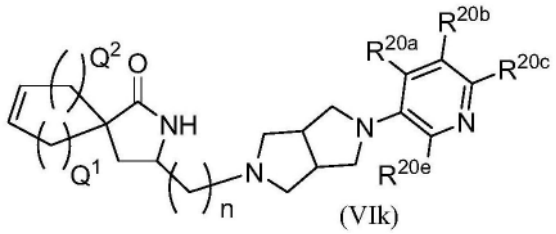
(VIj)

[1640] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1641] Q^1为1或2;

[1642] 并且Q^2为1或2。

[1643] 本发明的实施方案包括具有式(VIk)的化合物:

[1644] 

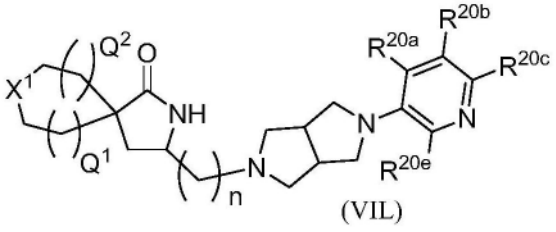
(VIk)

[1645] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1646] Q^1为1或2;

[1647] 并且Q^2为1或2。

[1648] 本发明的实施方案包括具有式(VIL)的化合物:

[1649] 

(VIL)

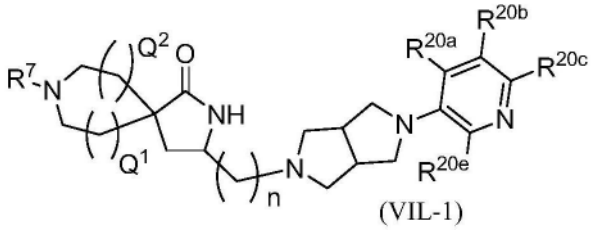
[1650] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1651] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[1652] Q^1为1或2;

[1653] 并且Q^2为1或2。

[1654] 本发明的实施方案包括具有式(VIL-1)的化合物:

[1655] 

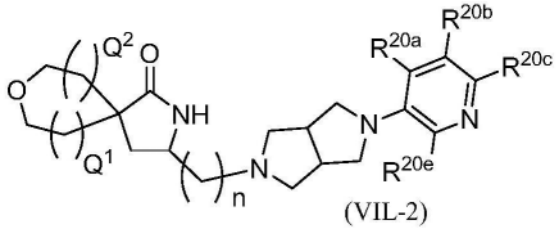
(VIL-1)

[1656] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1657] Q^1为1或2;

[1658] 并且Q^2为1或2。

[1659] 本发明的实施方案包括具有式(VIL-2)的化合物:

[1660] 

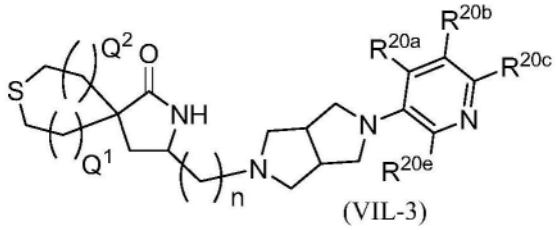
(VIL-2)

[1661] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1662] Q^1为1或2;

[1663] 并且Q^2为1或2。

[1664] 本发明的实施方案包括具有式(VIL-3)的化合物:

[1665] 

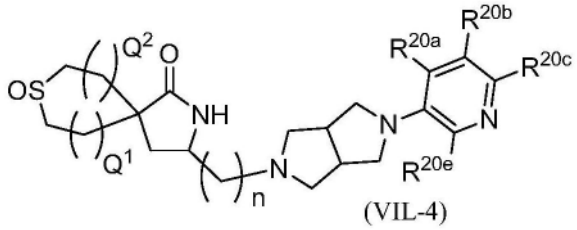
(VIL-3)

[1666] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1667] Q^1为1或2;

[1668] 并且Q^2为1或2。

[1669] 本发明的实施方案包括具有式(VIL-4)的化合物:

[1670] 

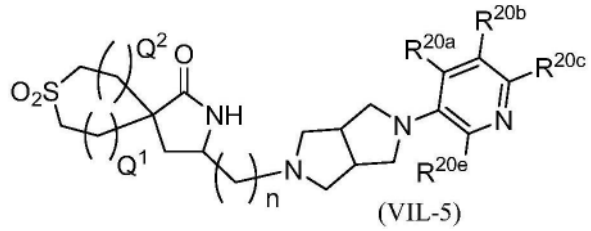
(VIL-4)

[1671] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1672] Q^1为1或2;

[1673] 并且Q^2为1或2。

[1674] 本发明的实施方案包括具有式(VIL-5)的化合物:

[1675] 

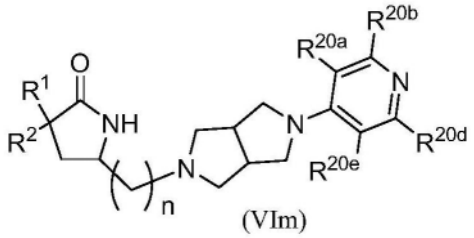
(VIL-5)

[1676] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1677] Q^1为1或2;

[1678] 并且Q^2为1或2。

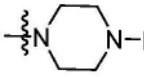
[1679] 本发明的实施方案包括具有式(VIm)的化合物:

[1680] 

(VIm)

[1681] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1682] R^{20a}、R^{20b}、R^{20d}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、-

$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[1683] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1684] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1685] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

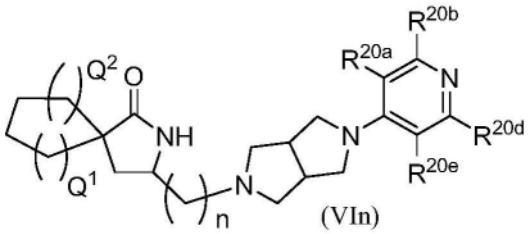
[1686] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1687] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1688] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1689] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}中的至少2个为氢。

[1690] 本发明的实施方案包括具有式(VIn)的化合物：

[1691] 

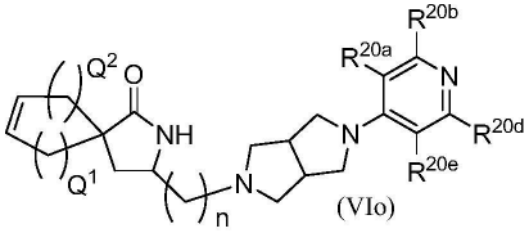
(VIn)

[1692] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1693] Q^1为1或2；

[1694] 并且Q^2为1或2。

[1695] 本发明的实施方案包括具有式(VIo)的化合物：

[1696] 

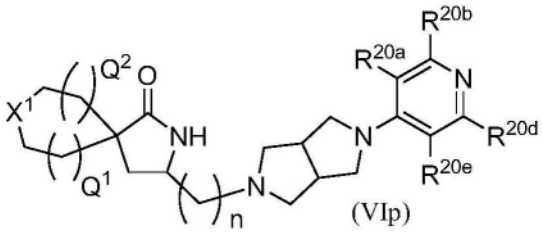
(VIo)

[1697] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1698] Q^1为1或2；

[1699] 并且Q^2为1或2。

[1700] 本发明的实施方案包括具有式(VIp)的化合物：

[1701] 

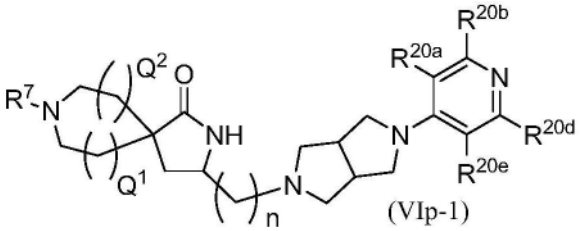
[1702] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1703] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[1704] Q^1为1或2;

[1705] 并且Q^2为1或2。

[1706] 本发明的实施方案包括具有式(VIp-1)的化合物:

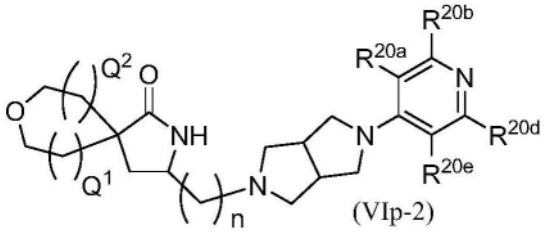
[1707] 

[1708] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1709] Q^1为1或2;

[1710] 并且Q^2为1或2。

[1711] 本发明的实施方案包括具有式(VIp-2)的化合物:

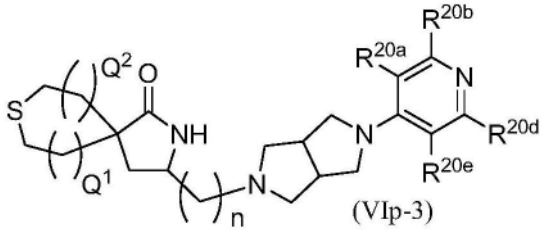
[1712] 

[1713] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1714] Q^1为1或2;

[1715] 并且Q^2为1或2。

[1716] 本发明的实施方案包括具有式(VIp-3)的化合物:

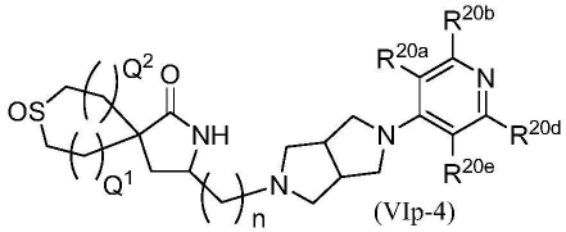
[1717] 

[1718] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1719] Q^1为1或2;

[1720] 并且Q^2为1或2。

[1721] 本发明的实施方案包括具有式(VIp-4)的化合物:

[1722] 

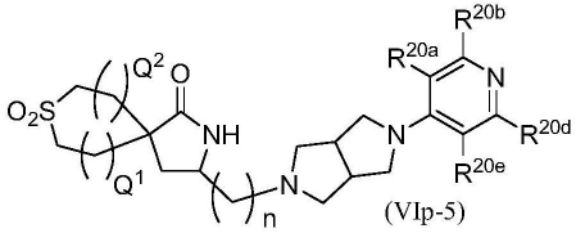
(VIp-4)

[1723] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1724] Q^1为1或2;

[1725] 并且Q^2为1或2。

[1726] 本发明的实施方案包括具有式(VIp-5)的化合物:

[1727] 

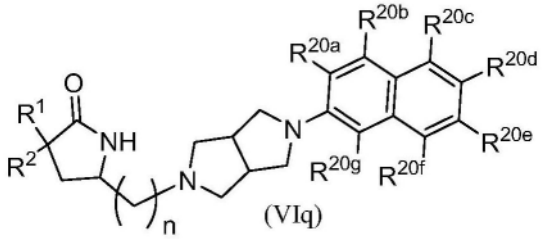
(VIp-5)

[1728] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1729] Q^1为1或2;

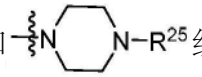
[1730] 并且Q^2为1或2。

[1731] 本发明的实施方案包括具有式(VIq)的化合物:

[1732] 

(VIq)

[1733] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1734] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[1735] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1736] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1737] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1738] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成

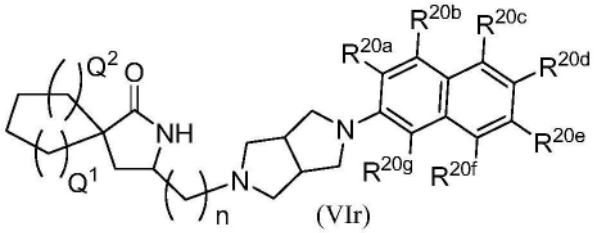
的组；

[1739] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1740] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1741] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}中的至少5个为氢。

[1742] 本发明的实施方案包括具有式(VIr)的化合物：

[1743] 

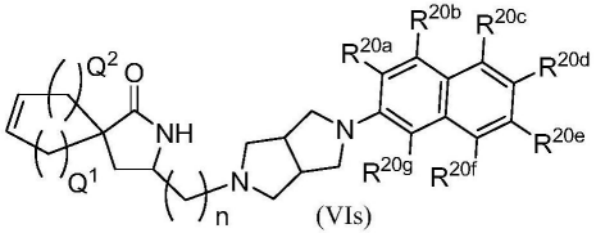
(VIr)

[1744] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1745] Q^1为1或2；

[1746] 并且Q^2为1或2。

[1747] 本发明的实施方案包括具有式(VIs)的化合物：

[1748] 

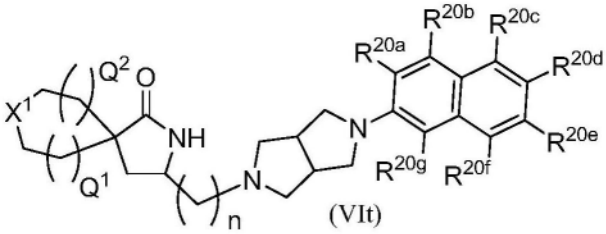
(VIs)

[1749] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1750] Q^1为1或2；

[1751] 并且Q^2为1或2。

[1752] 本发明的实施方案包括具有式(VIt)的化合物：

[1753] 

(VIt)

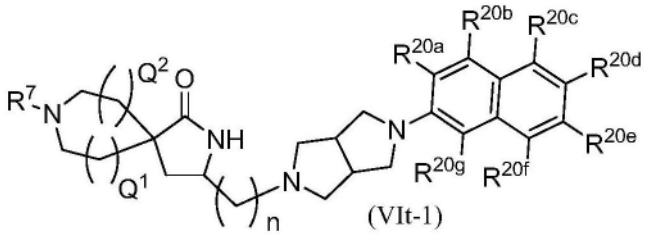
[1754] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1755] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[1756] Q^1为1或2；

[1757] 并且Q^2为1或2。

[1758] 本发明的实施方案包括具有式(VIt-1)的化合物：

[1759] 

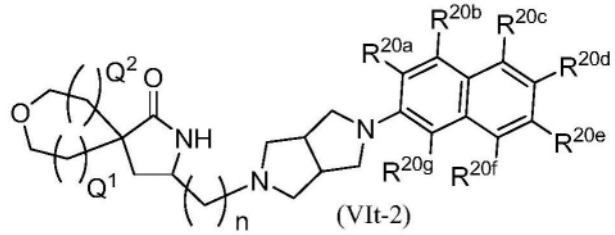
(VIt-1)

[1760] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1761] Q^1为1或2;

[1762] 并且Q^2为1或2。

[1763] 本发明的实施方案包括具有式(VIt-2)的化合物:

[1764] 

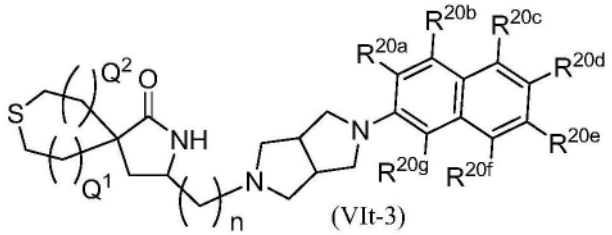
(VIt-2)

[1765] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1766] Q^1为1或2;

[1767] 并且Q^2为1或2。

[1768] 本发明的实施方案包括具有式(VIt-3)的化合物:

[1769] 

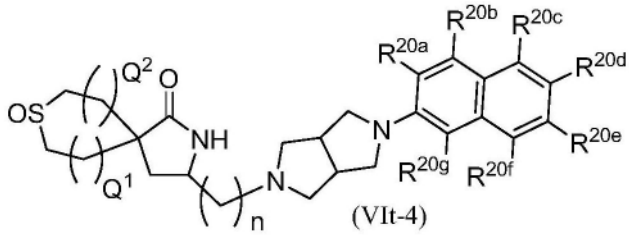
(VIt-3)

[1770] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1771] Q^1为1或2;

[1772] 并且Q^2为1或2。

[1773] 本发明的实施方案包括具有式(VIt-4)的化合物:

[1774] 

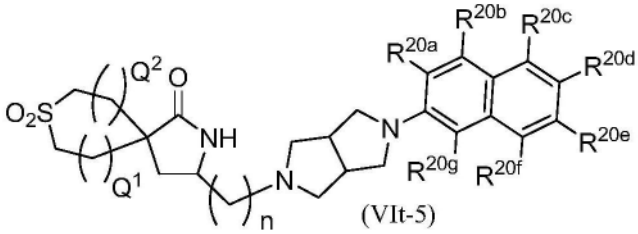
(VIt-4)

[1775] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1776] Q^1为1或2;

[1777] 并且Q^2为1或2。

[1778] 本发明的实施方案包括具有式(VIt-5)的化合物:

[1779] 

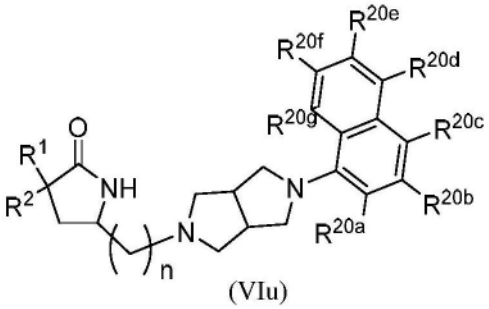
(VIt-5)

[1780] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1781] Q^1为1或2;

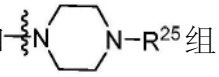
[1782] 并且Q^2为1或2。

[1783] 本发明的实施方案包括具有式(VIu)的化合物:

[1784] 

(VIu)

[1785] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1786] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和 

组成的组;

[1787] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1788] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1789] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

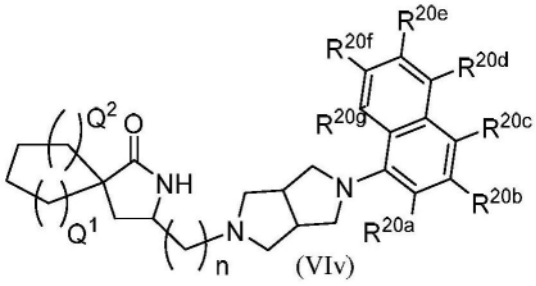
[1790] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1791] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1792] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1793] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}中的至少5个为氢。

[1794] 本发明的实施方案包括具有式(VIv)的化合物:

[1795] 

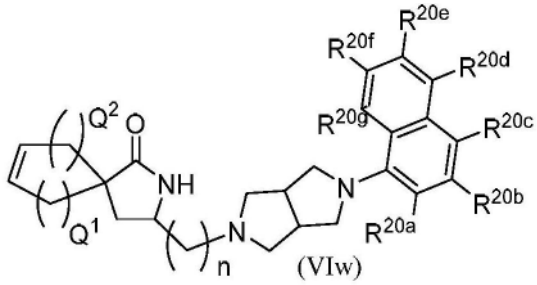
(VIv)

[1796] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1797] Q^1为1或2;

[1798] 并且Q^2为1或2。

[1799] 本发明的实施方案包括具有式(VIw)的化合物:

[1800] 

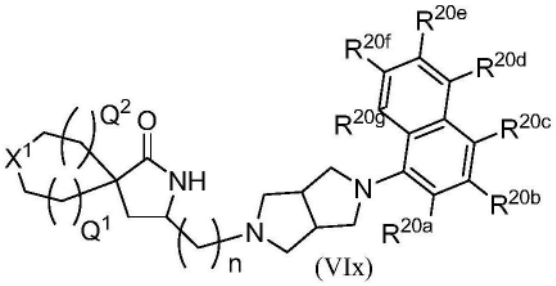
(VIw)

[1801] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1802] Q^1为1或2;

[1803] 并且Q^2为1或2。

[1804] 本发明的实施方案包括具有式(VIx)的化合物:

[1805] 

(VIx)

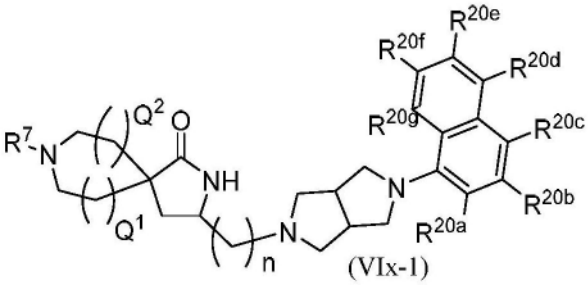
[1806] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1807] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[1808] Q^1为1或2;

[1809] 并且Q^2为1或2。

[1810] 本发明的实施方案包括具有式(VIx-1)的化合物:

[1811] 

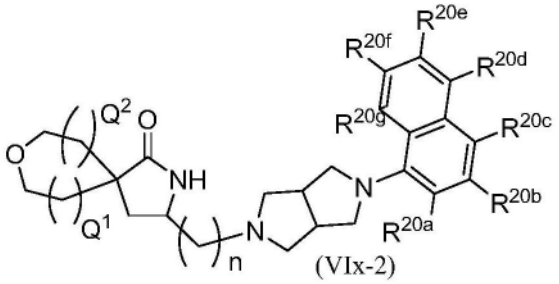
(VIx-1)

[1812] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1813] Q^1为1或2；

[1814] 并且Q^2为1或2。

[1815] 本发明的实施方案包括具有式(VIx-2)的化合物：

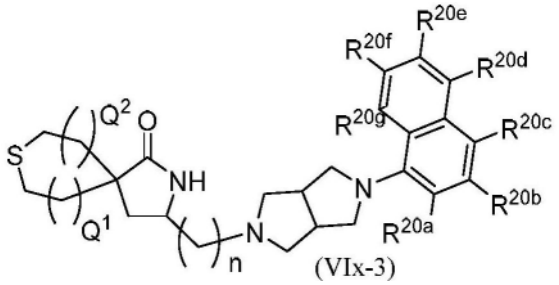
[1816] 

[1817] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1818] Q^1为1或2；

[1819] 并且Q^2为1或2。

[1820] 本发明的实施方案包括具有式(VIx-3)的化合物：

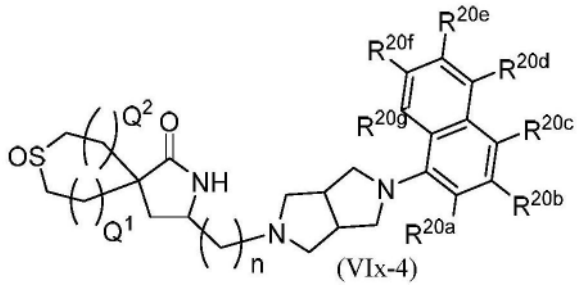
[1821] 

[1822] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1823] Q^1为1或2；

[1824] 并且Q^2为1或2。

[1825] 本发明的实施方案包括具有式(VIx-4)的化合物：

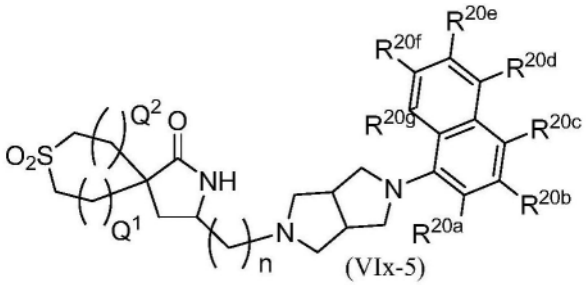
[1826] 

[1827] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1828] Q^1为1或2；

[1829] 并且Q^2为1或2。

[1830] 本发明的实施方案包括具有式(VIx-5)的化合物：

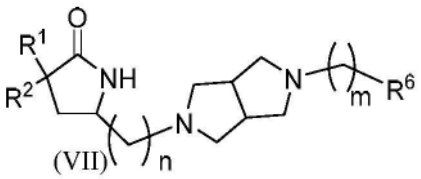
[1831] 

[1832] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1833] Q^1为1或2;

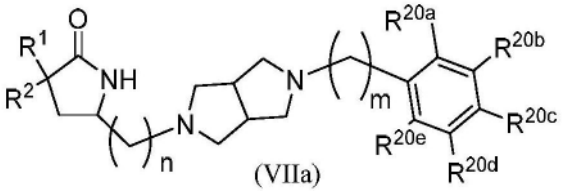
[1834] 并且Q^2为1或2。

[1835] 本发明的实施方案包括具有式(VII)的化合物:

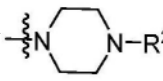
[1836] 

[1837] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物。

[1838] 本发明的实施方案包括具有式(VIIa)的化合物:

[1839] 

[1840] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1841] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[1842] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1843] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1844] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1845] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

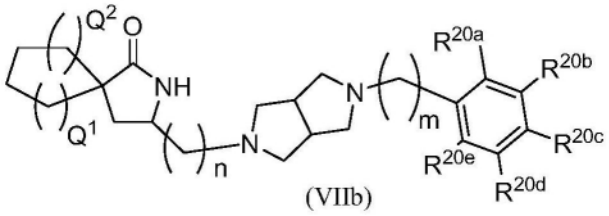
[1846] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[1847] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的

组；

[1848] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}和R^{20e}中的至少3个为氢。

[1849] 本发明的实施方案包括具有式(VIIb)的化合物：

[1850] 

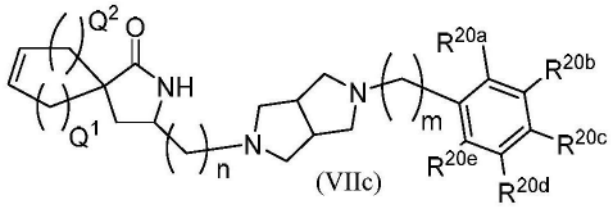
(VIIb)

[1851] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1852] Q^1为1或2；

[1853] 并且Q^2为1或2。

[1854] 本发明的实施方案包括具有式(VIIc)的化合物：

[1855] 

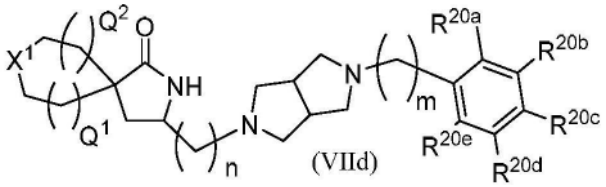
(VIIc)

[1856] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1857] Q^1为1或2；

[1858] 并且Q^2为1或2。

[1859] 本发明的实施方案包括具有式(VIId)的化合物：

[1860] 

(VIId)

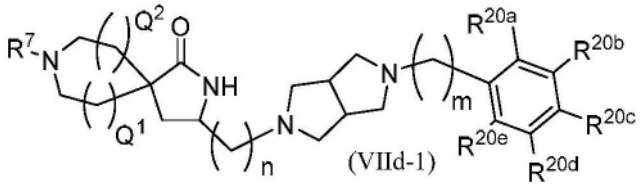
[1861] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1862] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[1863] Q^1为1或2；

[1864] 并且Q^2为1或2。

[1865] 本发明的实施方案包括具有式(VIId-1)的化合物：

[1866] 

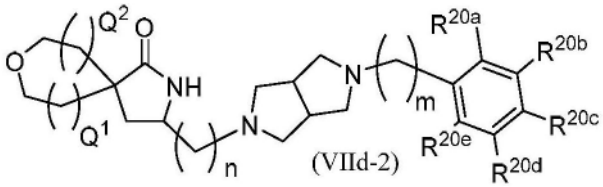
(VIId-1)

[1867] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1868] Q^1为1或2；

[1869] 并且Q^2为1或2。

[1870] 本发明的实施方案包括具有式(VIId-2)的化合物：

[1871] 

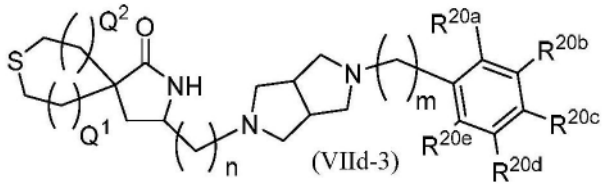
(VIId-2)

[1872] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1873] Q^1为1或2；

[1874] 并且Q^2为1或2。

[1875] 本发明的实施方案包括具有式(VIId-3)的化合物：

[1876] 

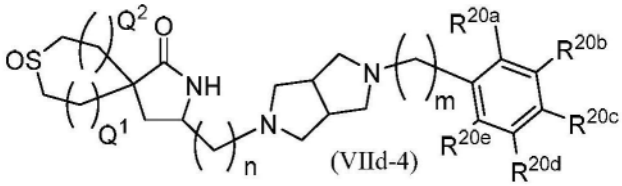
(VIId-3)

[1877] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1878] Q^1为1或2；

[1879] 并且Q^2为1或2。

[1880] 本发明的实施方案包括具有式(VIId-4)的化合物：

[1881] 

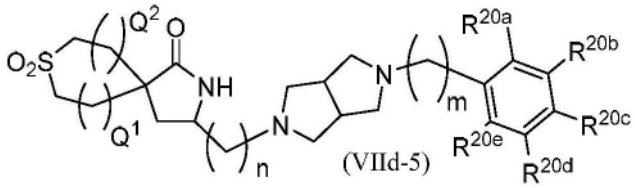
(VIId-4)

[1882] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1883] Q^1为1或2；

[1884] 并且Q^2为1或2。

[1885] 本发明的实施方案包括具有式(VIId-5)的化合物：

[1886] 

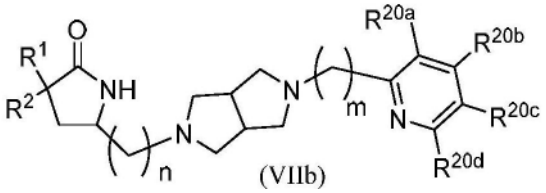
(VIId-5)

[1887] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1888] Q^1为1或2；

[1889] 并且Q^2为1或2。

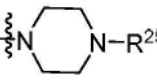
[1890] 本发明的实施方案包括具有式(VIIe)的化合物：

[1891] 

(VIIb)

[1892] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1893] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链

烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[1894] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1895] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1896] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

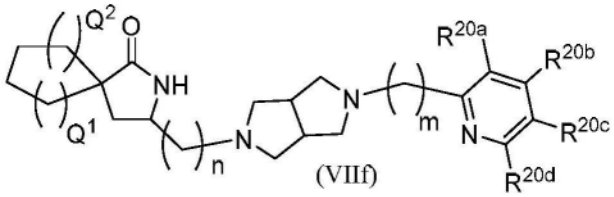
[1897] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1898] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1899] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1900] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}中的至少2个为氢。

[1901] 本发明的实施方案包括具有式(VIIf)的化合物：

[1902] 

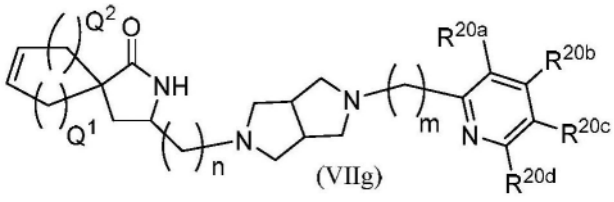
(VIIf)

[1903] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1904] Q^1为1或2；

[1905] 并且Q^2为1或2。

[1906] 本发明的实施方案包括具有式(VIIg)的化合物：

[1907] 

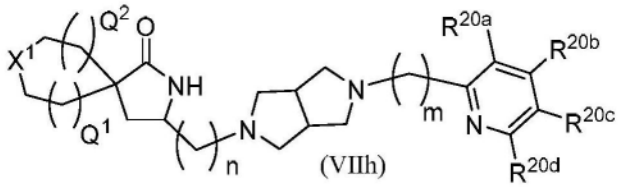
(VIIg)

[1908] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1909] Q^1为1或2；

[1910] 并且Q^2为1或2。

[1911] 本发明的实施方案包括具有式(VIIh)的化合物：

[1912] 

(VIIh)

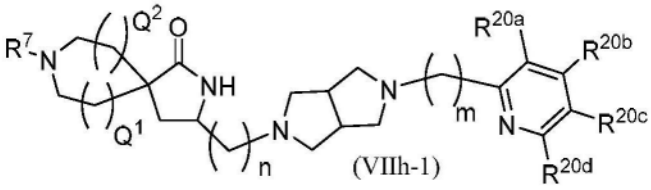
[1913] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1914] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[1915] Q^1为1或2;

[1916] 并且Q^2为1或2。

[1917] 本发明的实施方案包括具有式(VIIh-1)的化合物:

[1918] 

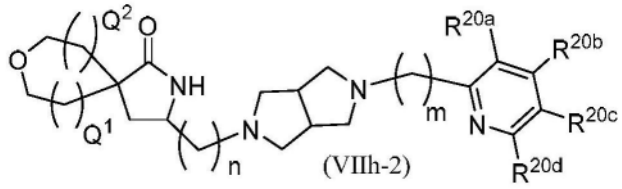
(VIIh-1)

[1919] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1920] Q^1为1或2;

[1921] 并且Q^2为1或2。

[1922] 本发明的实施方案包括具有式(VIIh-2)的化合物:

[1923] 

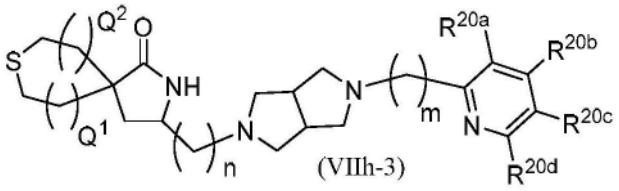
(VIIh-2)

[1924] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1925] Q^1为1或2;

[1926] 并且Q^2为1或2。

[1927] 本发明的实施方案包括具有式(VIIh-3)的化合物:

[1928] 

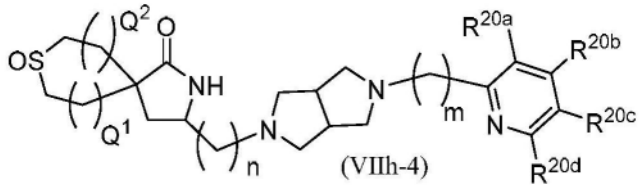
(VIIh-3)

[1929] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1930] Q^1为1或2;

[1931] 并且Q^2为1或2。

[1932] 本发明的实施方案包括具有式(VIIh-4)的化合物:

[1933] 

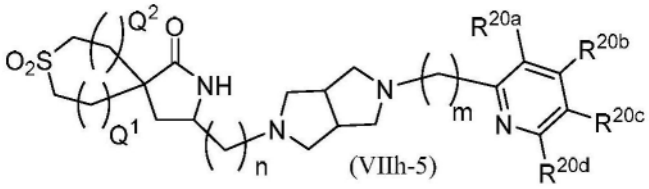
(VIIh-4)

[1934] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1935] Q^1为1或2；

[1936] 并且Q^2为1或2。

[1937] 本发明的实施方案包括具有式(VIIh-5)的化合物：

[1938] 

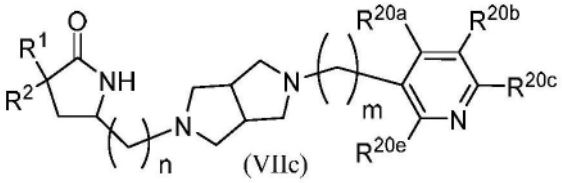
(VIIh-5)

[1939] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1940] Q^1为1或2；

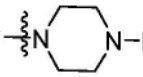
[1941] 并且Q^2为1或2。

[1942] 本发明的实施方案包括具有式(VIIi)的化合物：

[1943] 

(VIIc)

[1944] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[1945] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[1946] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1947] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1948] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

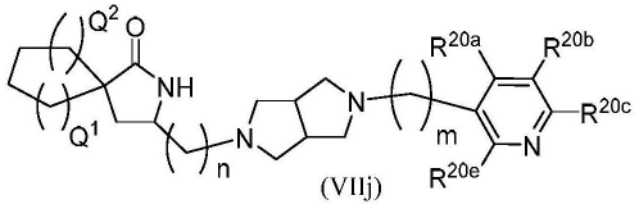
[1949] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1950] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1951] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1952] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20e}中的至少2个为氢。

[1953] 本发明的实施方案包括具有式(VIIj)的化合物：

[1954] 

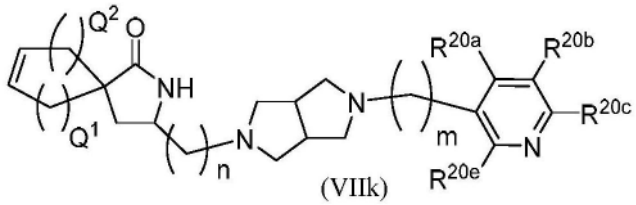
(VIIj)

[1955] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1956] Q^1为1或2;

[1957] 并且Q^2为1或2。

[1958] 本发明的实施方案包括具有式(VIIk)的化合物:

[1959] 

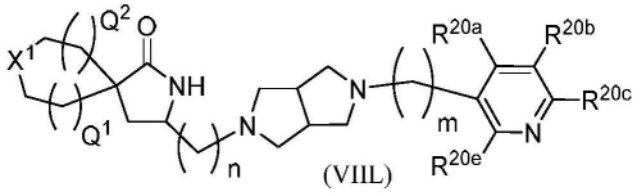
(VIIk)

[1960] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1961] Q^1为1或2;

[1962] 并且Q^2为1或2。

[1963] 本发明的实施方案包括具有式(VIIL)的化合物:

[1964] 

(VIIL)

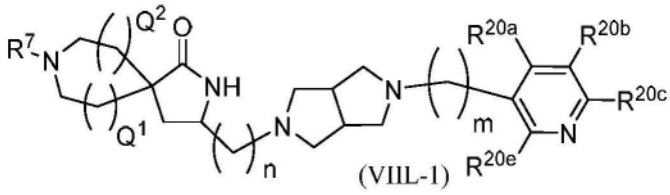
[1965] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1966] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[1967] Q^1为1或2;

[1968] 并且Q^2为1或2。

[1969] 本发明的实施方案包括具有式(VIIL-1)的化合物:

[1970] 

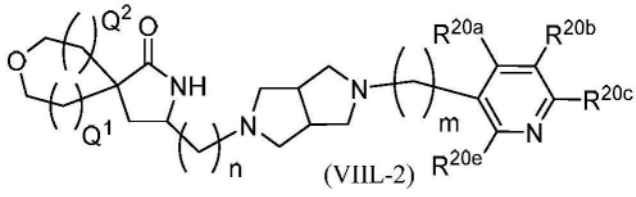
(VIIL-1)

[1971] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1972] Q^1为1或2;

[1973] 并且Q^2为1或2。

[1974] 本发明的实施方案包括具有式(VIIL-2)的化合物:

[1975] 

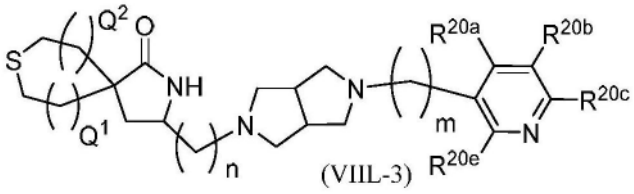
(VIIL-2)

[1976] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1977] Q^1为1或2;

[1978] 并且Q^2为1或2。

[1979] 本发明的实施方案包括具有式(VIIL-3)的化合物:

[1980] 

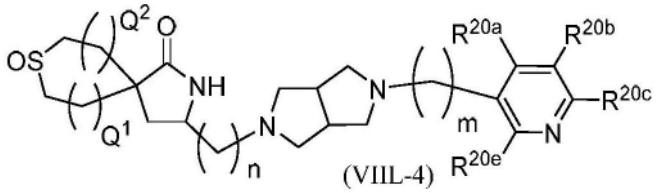
(VIIL-3)

[1981] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1982] Q^1为1或2;

[1983] 并且Q^2为1或2。

[1984] 本发明的实施方案包括具有式(VIIL-4)的化合物:

[1985] 

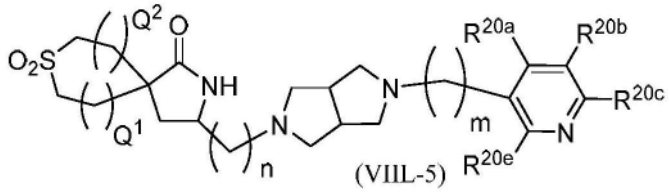
(VIIL-4)

[1986] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1987] Q^1为1或2;

[1988] 并且Q^2为1或2。

[1989] 本发明的实施方案包括具有式(VIIL-5)的化合物:

[1990] 

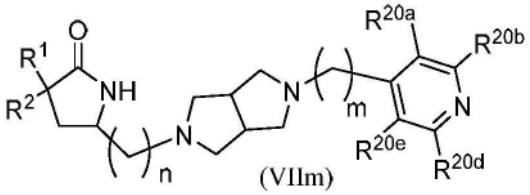
(VIIL-5)

[1991] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1992] Q^1为1或2;

[1993] 并且Q^2为1或2。

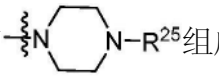
[1994] 本发明的实施方案包括具有式(VIIm)的化合物:

[1995] 

(VIIm)

[1996] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[1997] R^{20a}、R^{20b}、R^{20d}和R^{20e}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、-

$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组；

[1998] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[1999] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[2000] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

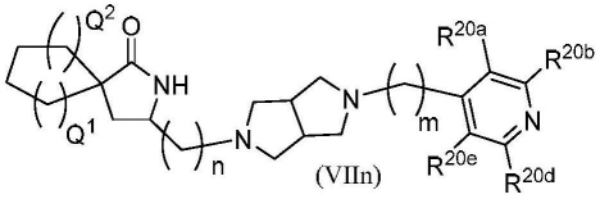
[2001] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[2002] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[2003] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组；

[2004] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}和R^{20d}中的至少2个为氢。

[2005] 本发明的实施方案包括具有式(VIIn)的化合物：

[2006] 

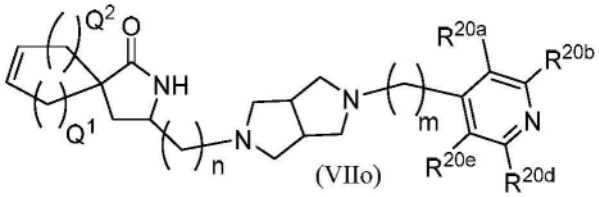
(VIIn)

[2007] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[2008] Q^1为1或2；

[2009] 并且Q^2为1或2。

[2010] 本发明的实施方案包括具有式(VIIo)的化合物：

[2011] 

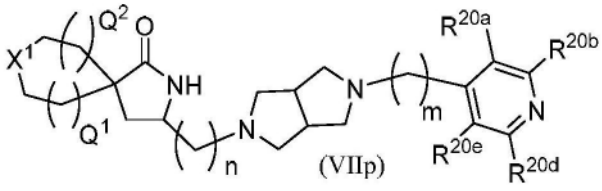
(VIIo)

[2012] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[2013] Q^1为1或2；

[2014] 并且Q^2为1或2。

[2015] 本发明的实施方案包括具有式(VIIp)的化合物：

[2016] 

(VIIp)

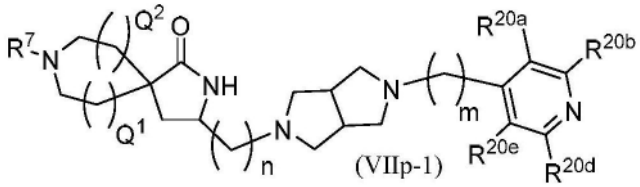
[2017] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[2018] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组；

[2019] Q^1为1或2；

[2020] 并且Q^2为1或2。

[2021] 本发明的实施方案包括具有式(VIIp-1)的化合物：

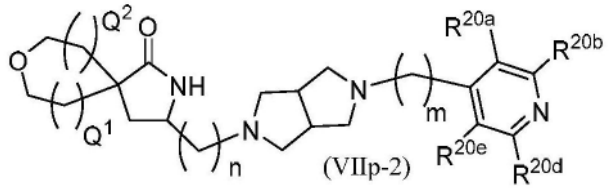
[2022] 

[2023] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[2024] Q^1为1或2；

[2025] 并且Q^2为1或2。

[2026] 本发明的实施方案包括具有式(VIIp-2)的化合物：

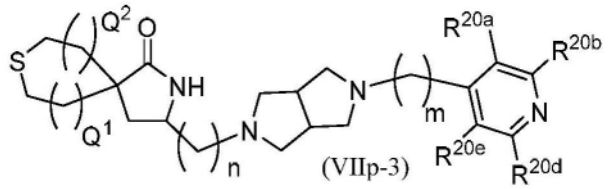
[2027] 

[2028] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[2029] Q^1为1或2；

[2030] 并且Q^2为1或2。

[2031] 本发明的实施方案包括具有式(VIIp-3)的化合物：

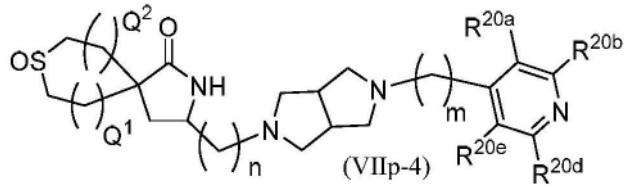
[2032] 

[2033] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[2034] Q^1为1或2；

[2035] 并且Q^2为1或2。

[2036] 本发明的实施方案包括具有式(VIIp-4)的化合物：

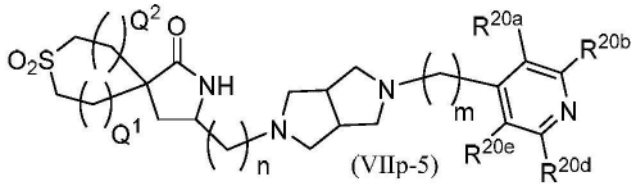
[2037] 

[2038] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物，其中

[2039] Q^1为1或2；

[2040] 并且Q^2为1或2。

[2041] 本发明的实施方案包括具有式(VIIp-5)的化合物：

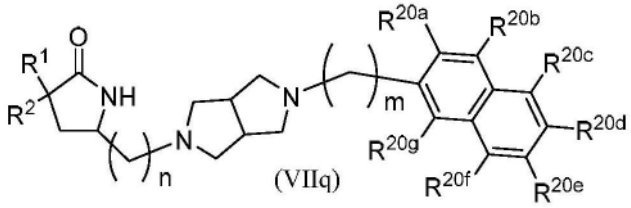
[2042] 

[2043] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

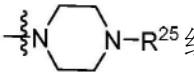
[2044] Q^1为1或2;

[2045] 并且Q^2为1或2。

[2046] 本发明的实施方案包括具有式(VIIq)的化合物:

[2047] 

[2048] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2049] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}独立地选自由氢、-CN、$-NO_2$、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、$-NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[2050] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[2051] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[2052] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

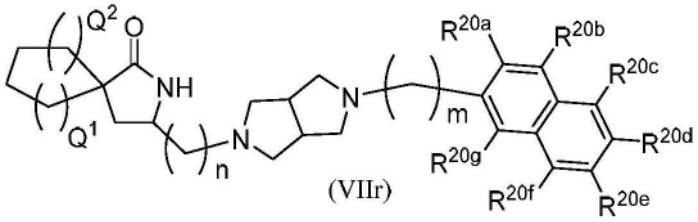
[2053] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[2054] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[2055] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[2056] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}中的至少5个为氢。

[2057] 本发明的实施方案包括具有式(VIIr)的化合物:

[2058] 

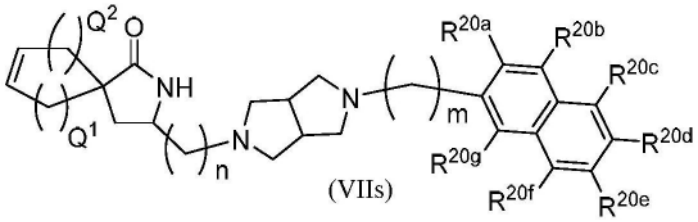
(VIIr)

[2059] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2060] Q^1为1或2;

[2061] 并且Q^2为1或2。

[2062] 本发明的实施方案包括具有式(VIIs)的化合物:

[2063] 

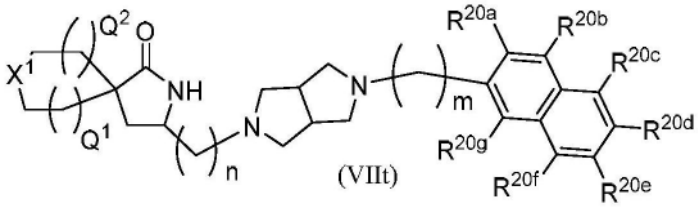
(VIIs)

[2064] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2065] Q^1为1或2;

[2066] 并且Q^2为1或2。

[2067] 本发明的实施方案包括具有式(VIIt)的化合物:

[2068] 

(VIIt)

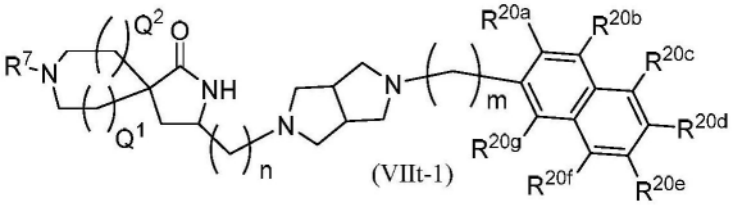
[2069] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2070] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[2071] Q^1为1或2;

[2072] 并且Q^2为1或2。

[2073] 本发明的实施方案包括具有式(VIIt-1)的化合物:

[2074] 

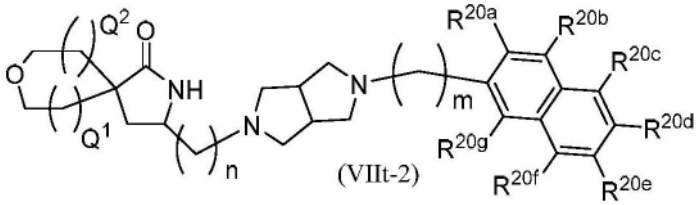
(VIIt-1)

[2075] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2076] Q^1为1或2;

[2077] 并且Q^2为1或2。

[2078] 本发明的实施方案包括具有式(VIIt-2)的化合物:

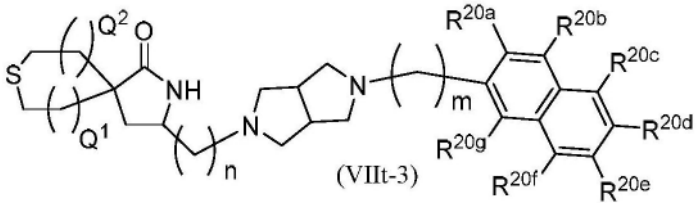
[2079] 

[2080] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2081] Q^1为1或2;

[2082] 并且Q^2为1或2。

[2083] 本发明的实施方案包括具有式(VIIt-3)的化合物:

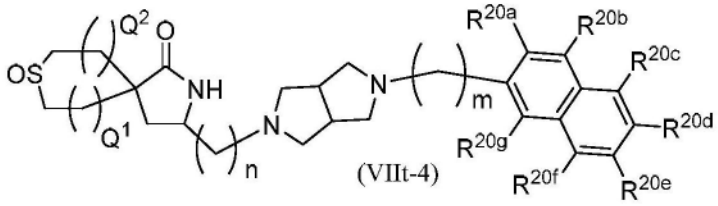
[2084] 

[2085] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2086] Q^1为1或2;

[2087] 并且Q^2为1或2。

[2088] 本发明的实施方案包括具有式(VIIt-4)的化合物:

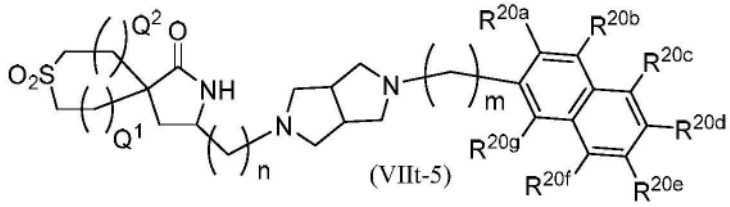
[2089] 

[2090] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2091] Q^1为1或2;

[2092] 并且Q^2为1或2。

[2093] 本发明的实施方案包括具有式(VIIt-5)的化合物:

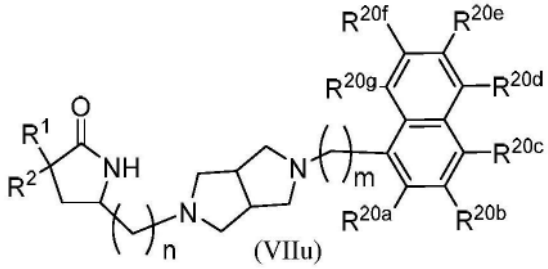
[2094] 

[2095] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

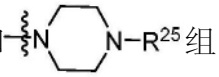
[2096] Q^1为1或2;

[2097] 并且Q^2为1或2。

[2098] 本发明的实施方案包括具有式(VIIu)的化合物:

[2099] 
(VIIu)

[2100] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2101] R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}独立地选自由氢、-CN、-NO_2、-OH、卤素、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基、C_{3-7}环烷基、C_{1-6}直链烷氧基、C_{3-7}支链烷氧基、C_{3-7}环烷氧基、C_{1-6}直链卤代烷基、C_{3-7}支链卤代烷基、C_{1-6}直链卤代烷氧基、C_{3-7}支链卤代烷氧基、SH、SC_{1-6}直链烷基、SC_{3-7}支链烷基、SC_{3-7}环烷基、SO_2C_{1-6}直链烷基、SO_2C_{3-7}支链烷基、SO_2C_{3-7}环烷基、SO_2NH_2、SO_2NHR^{21}、$NHSO_2R^{22}$、-$NR^{23a}R^{23b}$、$NHC(O)R^{24}$、$C(O)NHR^{24}$、$C(O)N(R^{24})_2$、吗啉代和  组成的组;

[2102] R^{21}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[2103] R^{22}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[2104] R^{23a}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

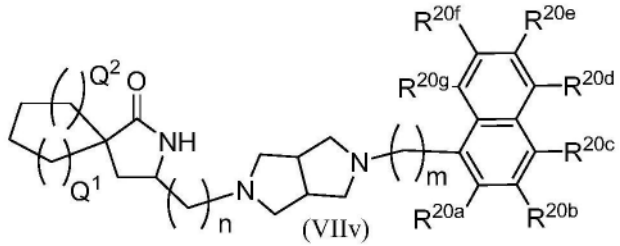
[2105] R^{23b}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[2106] R^{24}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[2107] R^{25}在每次出现时独立地选自由氢、C_{1-6}直链烷基、C_{3-7}支链烷基和C_{3-7}环烷基组成的组;

[2108] 并且R^{20a}、R^{20b}、R^{20c}、R^{20d}、R^{20e}、R^{20f}和R^{20g}中的至少5个为氢。

[2109] 本发明的实施方案包括具有式(VIIv)的化合物:

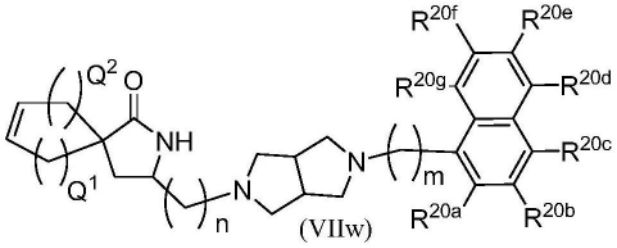
[2110] 
(VIIv)

[2111] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2112] Q^1为1或2;

[2113] 并且Q^2为1或2。

[2114] 本发明的实施方案包括具有式(VIIw)的化合物:

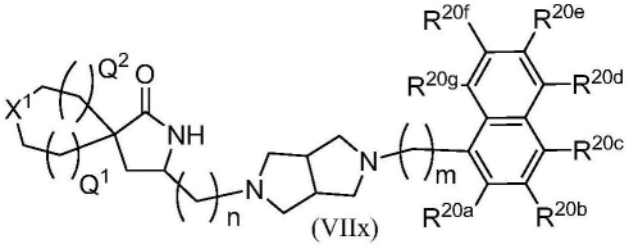
[2115] 

[2116] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2117] Q^1为1或2;

[2118] 并且Q^2为1或2。

[2119] 本发明的实施方案包括具有式(VIIx)的化合物:

[2120] 

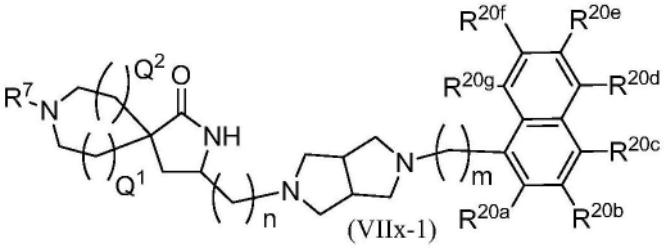
[2121] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2122] X^1选自由O、S、SO、SO_2和NR^7组成的组;

[2123] Q^1为1或2;

[2124] 并且Q^2为1或2。

[2125] 本发明的实施方案包括具有式(VIIx-1)的化合物:

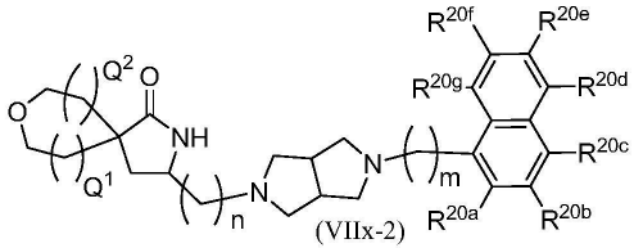
[2126] 

[2127] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2128] Q^1为1或2;

[2129] 并且Q^2为1或2。

[2130] 本发明的实施方案包括具有式(VIIx-2)的化合物:

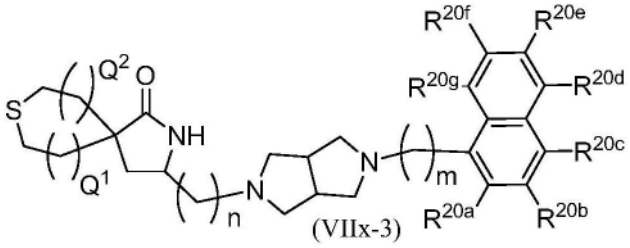
[2131] 

[2132] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2133] Q^1为1或2;

[2134] 并且Q^2为1或2。

[2135] 本发明的实施方案包括具有式(VIIx-3)的化合物:

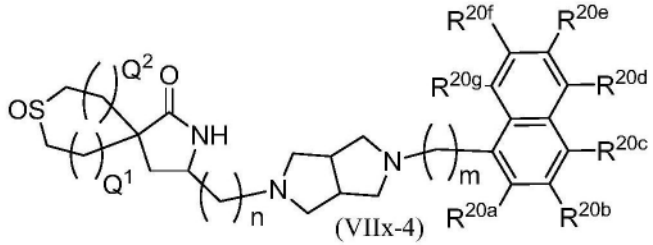
[2136] 

[2137] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2138] Q^1为1或2;

[2139] 并且Q^2为1或2。

[2140] 本发明的实施方案包括具有式(VIIx-4)的化合物:

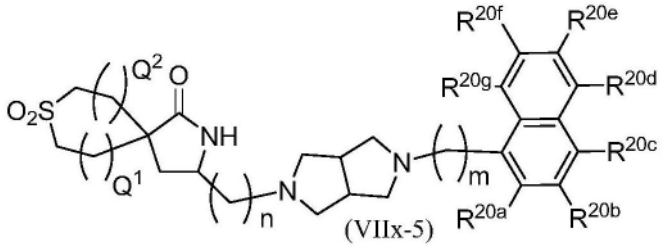
[2141] 

[2142] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2143] Q^1为1或2;

[2144] 并且Q^2为1或2。

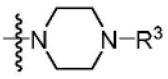
[2145] 本发明的实施方案包括具有式(VIIx-5)的化合物:

[2146] 

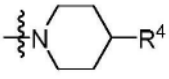
[2147] 包括其水合物、溶剂化物、对映体、非对映体、可药用盐和复合物,其中

[2148] Q^1为1或2;

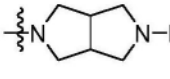
[2149] 并且Q^2为1或2。

[2150] 在一些实施方案中,A为 

。

[2151] 在一些实施方案中,A为 

。

[2152] 在一些实施方案中,A为 

。

[2153] 在一些实施方案中,R^1为氢。

[2154] 在一些实施方案中,R^1为C_{1-6}直链烷基。

[2155] 在一些实施方案中,R^1为C_{3-7}支链烷基。

[2156] 在一些实施方案中,R^2为氢。

[2157] 在一些实施方案中,R^2为C_{1-6}直链烷基。

[2158] 在一些实施方案中，R^2为C_{3-7}支链烷基。

[2159] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有5个环原子的环。

[2160] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有5个环原子并包含双键的环。

[2161] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有6个环原子的环。

[2162] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有6个环原子并包含双键的环。

[2163] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有7个环原子的环。

[2164] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有7个环原子并包含双键的环。

[2165] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有6个环原子的环，其中所述6个环原子中的一个为O。

[2166] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有7个环原子的环，其中所述7个环原子中的一个为O。

[2167] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有8个环原子的环，其中所述8个环原子中的一个为O。

[2168] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有6个环原子的环，其中所述6个环原子中的一个为S。

[2169] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有7个环原子的环，其中所述7个环原子中的一个为S。

[2170] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有8个环原子的环，其中所述8个环原子中的一个为S。

[2171] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有6个环原子的环，其中所述6个环原子中的一个为SO。

[2172] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有7个环原子的环，其中所述7个环原子中的一个为SO。

[2173] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有8个环原子的环，其中所述8个环原子中的一个为SO。

[2174] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有6个环原子的环，其中所述6个环原子中的一个为SO_2。

[2175] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有7个环原子的环，其中所述7个环原子中的一个为SO_2。

[2176] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有8个环原子的环，其中所述8个环原子中的一个为SO_2。

[2177] 在一些实施方案中，R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有6个环原子的环，其中所述6个环原子中的一个为NR^7。

[2178] 在一些实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有7个环原子的环,其中所述7个环原子中的一个为NR^7。

[2179] 在一些实施方案中,R^1和R^2与它们所键合的原子合在一起形成具有8个环原子的环,其中所述8个环原子中的一个为NR^7。

[2180] 在一些实施方案中,R^3为任选取代的苯基。

[2181] 在一些实施方案中,R^3为任选取代的萘-1-基。

[2182] 在一些实施方案中,R^3为任选取代的萘-2-基。

[2183] 在一些实施方案中,R^3为任选取代的2-吡啶基。

[2184] 在一些实施方案中,R^3为任选取代的3-吡啶基。

[2185] 在一些实施方案中,R^3为任选取代的4-吡啶基。

[2186] 在一些实施方案中,R^3为 。

[2187] 在一些实施方案中,R^4为任选取代的苯基。

[2188] 在一些实施方案中,R^4为任选取代的萘-1-基。

[2189] 在一些实施方案中,R^4为任选取代的萘-2-基。

[2190] 在一些实施方案中,R^4为任选取代的2-吡啶基。

[2191] 在一些实施方案中,R^4为任选取代的3-吡啶基。

[2192] 在一些实施方案中,R^4为任选取代的4-吡啶基。

[2193] 在一些实施方案中,R^4为 。

[2194] 在一些实施方案中,R^5为任选取代的苯基。

[2195] 在一些实施方案中,R^5为任选取代的萘-1-基。

[2196] 在一些实施方案中,R^5为任选取代的萘-2-基。

[2197] 在一些实施方案中,R^5为任选取代的2-吡啶基。

[2198] 在一些实施方案中,R^5为任选取代的3-吡啶基。

[2199] 在一些实施方案中,R^5为任选取代的4-吡啶基。

[2200] 在一些实施方案中,R^5为 。

[2201] 在一些实施方案中,R6为任选取代的苯基。

[2202] 在一些实施方案中,R^6为任选取代的萘-1-基。

[2203] 在一些实施方案中,R^6为任选取代的萘-2-基。

[2204] 在一些实施方案中,R^6为任选取代的2-吡啶基。

[2205] 在一些实施方案中,R^6为任选取代的3-吡啶基。

[2206] 在一些实施方案中,R^6为任选取代的4-吡啶基。

[2207] 在一些实施方案中,R^7为H。

[2208] 在一些实施方案中,R^7为C_{1-6}直链烷基。

[2209] 在一些实施方案中,R^7为C_{3-7}支链烷基。

[2210] 在一些实施方案中,R^7为C_{3-7}环烷基。

[2211] 在一些实施方案中,R^7为任选取代的苯基。

[2212] 在一些实施方案中,R^7为任选取代的苄基。

[2213] 在一些实施方案中,R^7为COR^8。

[2214] 在一些实施方案中,R^7为CO_2R^9。

[2215] 在一些实施方案中,R^7为$CONR^{10a}R^{10b}$。

[2216] 在一些实施方案中,R^7为$SO_2NR^{10a}R^{10b}$。

[2217] 在一些实施方案中,R^7为SO_2R^{10c}。

[2218] 在一些实施方案中,R^8被选择为H。

[2219] 在一些实施方案中,R^8为C_{1-6}直链烷基。

[2220] 在一些实施方案中,R^8为C_{3-7}支链烷基。

[2221] 在一些实施方案中,R^8为C_{3-7}环烷基。

[2222] 在一些实施方案中,R^9为C_{1-6}直链烷基。

[2223] 在一些实施方案中,R^9为C_{3-7}支链烷基。

[2224] 在一些实施方案中,R^9为C_{3-7}环烷基。

[2225] 在一些实施方案中,R^{10a}为H。

[2226] 在一些实施方案中,R^{10a}为C_{1-6}直链烷基。

[2227] 在一些实施方案中,R^{10a}为C_{3-7}支链烷基。

[2228] 在一些实施方案中,R^{10a}为C_{3-7}环烷基。

[2229] 在一些实施方案中,R^{10b}为H。

[2230] 在一些实施方案中,R^{10b}为C_{1-6}直链烷基。

[2231] 在一些实施方案中,R^{10b}为C_{3-7}支链烷基。

[2232] 在一些实施方案中,R^{10b}为C_{3-7}环烷基。

[2233] 在一些实施方案中,R^{10c}为C_{1-6}直链烷基。

[2234] 在一些实施方案中,R^{10c}为C_{3-7}支链烷基。

[2235] 在一些实施方案中,R^{10c}为C_{3-7}环烷基。

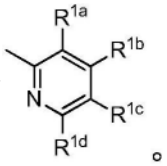
[2236] 在一些实施方案中,R^{10c}为C_{1-6}直链卤代烷基。

[2237] 在一些实施方案中,R^{10c}为C_{3-7}支链卤代烷基。

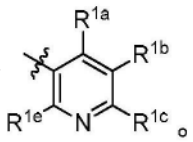
[2238] 在一些实施方案中,R^{10c}为$-(CH_2)_qCN$。

[2239] 在一些实施方案中,R^{10c}为$-(CH_2)_qSO_2R^{11}$。

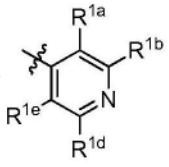
[2240] 在一些实施方案中,R^{10c}为$-(CH_2)_qOR^{12}$。

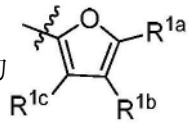
[2241] 在一些实施方案中,R^{10c}为 

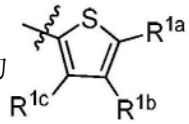
。

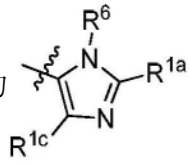
[2242] 在一些实施方案中,R^{10c}为 

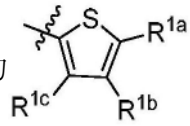
。

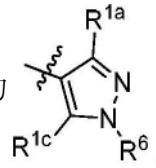
[2243] 在一些实施方案中，R^{10c}为  。

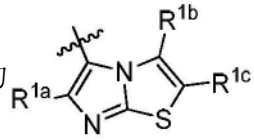
[2244] 在一些实施方案中，R^{10c}为  。

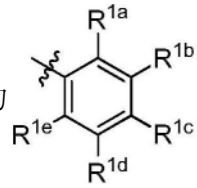
[2245] 在一些实施方案中，R^{10c}为  。

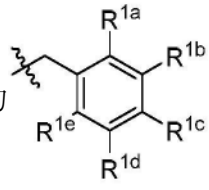
[2246] 在一些实施方案中，R^{10c}为  。

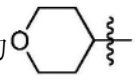
[2247] 在一些实施方案中，R^{10c}为  。

[2248] 在一些实施方案中，R^{10c}为  。

[2249] 在一些实施方案中，R^{10c}为  。

[2250] 在一些实施方案中，R^{10c}为  。

[2251] 在一些实施方案中，R^{10c}为  。

[2252] 在一些实施方案中，R^{10c}为  。

[2253] 在一些实施方案中，R^{11}为C_{1-6}直链烷基。

[2254] 在一些实施方案中，R^{11}为C_{3-7}支链烷基。

[2255] 在一些实施方案中，R^{11}为C_{3-7}环烷基。

[2256] 在一些实施方案中，R^{12}为C_{1-6}直链烷基。

[2257] 在一些实施方案中,R^{12}为C_{3-7}支链烷基。

[2258] 在一些实施方案中,R^{12}为C_{3-7}环烷基。

[2259] 在一些实施方案中,R^{1a}为H。

[2260] 在一些实施方案中,R^{1a}为OH。

[2261] 在一些实施方案中,R^{1a}为NO_2。

[2262] 在一些实施方案中,R^{1a}为卤素。

[2263] 在一些实施方案中,R^{1a}为CN。

[2264] 在一些实施方案中,R^{1a}为C_{1-6}直链烷基。

[2265] 在一些实施方案中,R^{1a}为C_{3-7}支链烷基。

[2266] 在一些实施方案中,R^{1a}为C_{3-7}环烷基。

[2267] 在一些实施方案中,R^{1a}为C_{1-6}直链烷氧基。

[2268] 在一些实施方案中,R^{1a}为C_{3-7}支链烷氧基。

[2269] 在一些实施方案中,R^{1a}为C_{3-7}环烷氧基。

[2270] 在一些实施方案中,R^{1a}为C_{1-6}直链卤代烷基。

[2271] 在一些实施方案中,R^{1a}为C_{3-7}支链卤代烷基。

[2272] 在一些实施方案中,R^{1a}为C_{1-6}直链卤代烷氧基。

[2273] 在一些实施方案中,R^{1a}为-S(C_{1-6}直链烷基)。

[2274] 在一些实施方案中,R^{1a}为S(C_{3-7}支链烷基)。

[2275] 在一些实施方案中,R^{1a}为-S(C_{3-7}环烷基)。

[2276] 在一些实施方案中,R^{1a}为COR^{13}。

[2277] 在一些实施方案中,R^{1a}为CO_2R^{14}。

[2278] 在一些实施方案中,R^{1a}为$CONR^{15a}R^{15b}$。

[2279] 在一些实施方案中,R^{1a}为$SO_2NR^{15a}R^{15b}$。

[2280] 在一些实施方案中,R^{1a}为$NR^{16a}R^{16b}$。

[2281] 在一些实施方案中,R^{1a}为$NR^{16a}COR^{17}$。

[2282] 在一些实施方案中,R^{1a}为$NR^{16a}SO_2R^{18}$。

[2283] 在一些实施方案中,R^{1a}为$NR^{16a}SO_2NR^{19a}R^{19b}$。

[2284] 在一些实施方案中,R^{1b}为H。

[2285] 在一些实施方案中,R^{1b}为OH。

[2286] 在一些实施方案中,R^{1b}为NO_2。

[2287] 在一些实施方案中,R^{1b}为卤素。

[2288] 在一些实施方案中,R^{1b}为CN。

[2289] 在一些实施方案中,R^{1b}为C_{1-6}直链烷基。

[2290] 在一些实施方案中,R^{1b}为C_{3-7}支链烷基。

[2291] 在一些实施方案中,R^{1b}为C_{3-7}环烷基。

[2292] 在一些实施方案中,R^{1b}为C_{1-6}直链烷氧基。

[2293] 在一些实施方案中,R^{1b}为C_{3-7}支链烷氧基。

[2294] 在一些实施方案中,R^{1b}为C_{3-7}环烷氧基。

[2295] 在一些实施方案中,R^{1b}为C_{1-6}直链卤代烷基。

[2296] 在一些实施方案中，R^{1b}为C_{3-7}支链卤代烷基。

[2297] 在一些实施方案中，R^{1b}为C_{1-6}直链卤代烷氧基。

[2298] 在一些实施方案中，R^{1b}为-S(C_{1-6}直链烷基)。

[2299] 在一些实施方案中，R^{1b}为S(C_{3-7}支链烷基)。

[2300] 在一些实施方案中，R^{1b}为-S(C_{3-7}环烷基)。

[2301] 在一些实施方案中，R^{1b}为COR^{13}。

[2302] 在一些实施方案中，R^{1b}为CO_2R^{14}。

[2303] 在一些实施方案中，R^{1b}为$CONR^{15a}R^{15b}$。

[2304] 在一些实施方案中，R^{1b}为$SO_2NR^{15a}R^{15b}$。

[2305] 在一些实施方案中，R^{1b}为$NR^{16a}R^{16b}$。

[2306] 在一些实施方案中，R^{1b}为$NR^{16a}COR^{17}$。

[2307] 在一些实施方案中，R^{1b}为$NR^{16a}SO_2R^{18}$。

[2308] 在一些实施方案中，R^{1b}为$NR^{16a}SO_2NR^{19a}R^{19b}$。

[2309] 在一些实施方案中，R^{1c}为H。

[2310] 在一些实施方案中，R^{1c}为OH。

[2311] 在一些实施方案中，R^{1c}为NO_2。

[2312] 在一些实施方案中，R^{1c}为卤素。

[2313] 在一些实施方案中，R^{1c}为CN。

[2314] 在一些实施方案中，R^{1c}为C_{1-6}直链烷基。

[2315] 在一些实施方案中，R^{1c}为C_{3-7}支链烷基。

[2316] 在一些实施方案中，R^{1c}为C_{3-7}环烷基。

[2317] 在一些实施方案中，R^{1c}为C_{1-6}直链烷氧基。

[2318] 在一些实施方案中，R^{1c}为C_{3-7}支链烷氧基。

[2319] 在一些实施方案中，R^{1c}为C_{3-7}环烷氧基。

[2320] 在一些实施方案中，R^{1c}为C_{1-6}直链卤代烷基。

[2321] 在一些实施方案中，R^{1c}为C_{3-7}支链卤代烷基。

[2322] 在一些实施方案中，R^{1c}为C_{1-6}直链卤代烷氧基。

[2323] 在一些实施方案中，R^{1c}为-S(C_{1-6}直链烷基)。

[2324] 在一些实施方案中，R^{1c}为S(C_{3-7}支链烷基)。

[2325] 在一些实施方案中，R^{1c}为-S(C_{3-7}环烷基)。

[2326] 在一些实施方案中，R^{1c}为COR^{13}。

[2327] 在一些实施方案中，R^{1c}为CO_2R^{14}。

[2328] 在一些实施方案中，R^{1c}为$CONR^{15a}R^{15b}$。

[2329] 在一些实施方案中，R^{1c}为$SO_2NR^{15a}R^{15b}$。

[2330] 在一些实施方案中，R^{1c}为$NR^{16a}R^{16b}$。

[2331] 在一些实施方案中，R^{1c}为$NR^{16a}COR^{17}$。

[2332] 在一些实施方案中，R^{1c}为$NR^{16a}SO_2R^{18}$。

[2333] 在一些实施方案中，R^{1c}为$NR^{16a}SO_2NR^{19a}R^{19b}$。

[2334] 在一些实施方案中，R^{1d}为H。

[2335] 在一些实施方案中,R^{1d}为OH。

[2336] 在一些实施方案中,R^{1d}为NO_2。

[2337] 在一些实施方案中,R^{1d}为卤素。

[2338] 在一些实施方案中,R^{1d}为CN。

[2339] 在一些实施方案中,R^{1d}为C_{1-6}直链烷基。

[2340] 在一些实施方案中,R^{1d}为C_{3-7}支链烷基。

[2341] 在一些实施方案中,R^{1d}为C_{3-7}环烷基。

[2342] 在一些实施方案中,R^{1d}为C_{1-6}直链烷氧基。

[2343] 在一些实施方案中,R^{1d}为C_{3-7}支链烷氧基。

[2344] 在一些实施方案中,R^{1d}为C_{3-7}环烷氧基。

[2345] 在一些实施方案中,R^{1d}为C_{1-6}直链卤代烷基。

[2346] 在一些实施方案中,R^{1d}为C_{3-7}支链卤代烷基。

[2347] 在一些实施方案中,R^{1d}为C_{1-6}直链卤代烷氧基。

[2348] 在一些实施方案中,R^{1d}为-S(C_{1-6}直链烷基)。

[2349] 在一些实施方案中,R^{1d}为S(C_{3-7}支链烷基)。

[2350] 在一些实施方案中,R^{1d}为-S(C_{3-7}环烷基)。

[2351] 在一些实施方案中,R^{1d}为COR^{13}。

[2352] 在一些实施方案中,R^{1d}为CO_2R^{14}。

[2353] 在一些实施方案中,R^{1d}为$CONR^{15a}R^{15b}$。

[2354] 在一些实施方案中,R^{1d}为$SO_2NR^{15a}R^{15b}$。

[2355] 在一些实施方案中,R^{1d}为$NR^{16a}R^{16b}$。

[2356] 在一些实施方案中,R^{1d}为$NR^{16a}COR^{17}$。

[2357] 在一些实施方案中,R^{1d}为$NR^{16a}SO_2R^{18}$。

[2358] 在一些实施方案中,R^{1d}为$NR^{16a}SO_2NR^{19a}R^{19b}$。

[2359] 在一些实施方案中,R^{1e}为H。

[2360] 在一些实施方案中,R^{1e}为OH。

[2361] 在一些实施方案中,R^{1e}为NO_2。

[2362] 在一些实施方案中,R^{1e}为卤素。

[2363] 在一些实施方案中,R^{1e}为CN。

[2364] 在一些实施方案中,R^{1e}为C_{1-6}直链烷基。

[2365] 在一些实施方案中,R^{1e}为C_{3-7}支链烷基。

[2366] 在一些实施方案中,R^{1e}为C_{3-7}环烷基。

[2367] 在一些实施方案中,R^{1e}为C_{1-6}直链烷氧基。

[2368] 在一些实施方案中,R^{1e}为C_{3-7}支链烷氧基。

[2369] 在一些实施方案中,R^{1e}为C_{3-7}环烷氧基。

[2370] 在一些实施方案中,R^{1e}为C_{1-6}直链卤代烷基。

[2371] 在一些实施方案中,R^{1e}为C_{3-7}支链卤代烷基。

[2372] 在一些实施方案中,R^{1e}为C_{1-6}直链卤代烷氧基。

[2373] 在一些实施方案中,R^{1e}为-S(C_{1-6}直链烷基)。

[2374] 在一些实施方案中，R^{1e}为S(C_{3-7}支链烷基)。

[2375] 在一些实施方案中，R^{1e}为-S(C_{3-7}环烷基)。

[2376] 在一些实施方案中，R^{1e}为COR^{13}。

[2377] 在一些实施方案中，R^{1e}为CO_2R^{14}。

[2378] 在一些实施方案中，R^{1e}为$CONR^{15a}R^{15b}$。

[2379] 在一些实施方案中，R^{1e}为$SO_2NR^{15a}R^{15b}$。

[2380] 在一些实施方案中，R^{1e}为$NR^{16a}R^{16b}$。

[2381] 在一些实施方案中，R^{1e}为$NR^{16a}COR^{17}$。

[2382] 在一些实施方案中，R^{1e}为$NR^{16a}SO_2R^{18}$。

[2383] 在一些实施方案中，R^{1e}为$NR^{16a}SO_2NR^{19a}R^{19b}$。

[2384] 在一些实施方案中，R^{13}为H。

[2385] 在一些实施方案中，R^{13}为C_{1-6}直链烷基。

[2386] 在一些实施方案中，R^{13}为C_{3-7}支链烷基。

[2387] 在一些实施方案中，R^{13}为C_{3-7}环烷基。

[2388] 在一些实施方案中，R^{14}为C_{1-6}直链烷基。

[2389] 在一些实施方案中，R^{14}为C_{3-7}支链烷基。

[2390] 在一些实施方案中，R^{14}为C_{3-7}环烷基。

[2391] 在一些实施方案中，R^{15a}为H。

[2392] 在一些实施方案中，R^{15a}为C_{1-6}直链烷基。

[2393] 在一些实施方案中，R^{15a}为C_{3-7}支链烷基。

[2394] 在一些实施方案中，R^{15a}为C_{3-7}环烷基。

[2395] 在一些实施方案中，R^{15b}为H。

[2396] 在一些实施方案中，R^{15b}为C_{1-6}直链烷基。

[2397] 在一些实施方案中，R^{15b}为C_{3-7}支链烷基。

[2398] 在一些实施方案中，R^{15b}为C_{3-7}环烷基。

[2399] 在一些实施方案中，R^{16a}为H。

[2400] 在一些实施方案中，R^{16a}为C_{1-6}直链烷基。

[2401] 在一些实施方案中，R^{16a}为C_{3-7}支链烷基。

[2402] 在一些实施方案中，R^{16a}为C_{3-7}环烷基。

[2403] 在一些实施方案中，R^{16b}为H。

[2404] 在一些实施方案中，R^{16b}为C_{1-6}直链烷基。

[2405] 在一些实施方案中，R^{16b}为C_{3-7}支链烷基。

[2406] 在一些实施方案中，R^{16b}为C_{3-7}环烷基。

[2407] 在一些实施方案中，R^{17}为H。

[2408] 在一些实施方案中，R^{17}为C_{1-6}直链烷基。

[2409] 在一些实施方案中，R^{17}为C_{3-7}支链烷基。

[2410] 在一些实施方案中，R^{17}为C_{3-7}环烷基。

[2411] 在一些实施方案中，R^{18}为C_{1-6}直链烷基。

[2412] 在一些实施方案中，R^{18}为C_{3-7}支链烷基。

[2413] 在一些实施方案中,R^{18}为C_{3-7}环烷基。

[2414] 在一些实施方案中,R^{19a}为C_{1-6}直链烷基。

[2415] 在一些实施方案中,R^{19a}为C_{3-7}支链烷基。

[2416] 在一些实施方案中,R^{19a}为C_{3-7}环烷基。

[2417] 在一些实施方案中,R^{19b}为C_{1-6}直链烷基。

[2418] 在一些实施方案中,R^{19b}为C_{3-7}支链烷基。

[2419] 在一些实施方案中,R^{19b}为C_{3-7}环烷基。

[2420] 在一些实施方案中,n为1。

[2421] 在一些实施方案中,n为2。

[2422] 在一些实施方案中,n为3。

[2423] 在一些实施方案中,n为4。

[2424] 在一些实施方案中,m为1。

[2425] 在一些实施方案中,m为2。

[2426] 在一些实施方案中,m为3。

[2427] 在一些实施方案中,R^{20a}为氢。

[2428] 在一些实施方案中,R^{20a}为-CN。

[2429] 在一些实施方案中,R^{20a}为$-NO_2$。

[2430] 在一些实施方案中,R^{20a}为OH。

[2431] 在一些实施方案中,R^{20a}为卤素。

[2432] 在一些实施方案中,R^{20a}为C_{1-6}直链烷基。

[2433] 在一些实施方案中,R^{20a}为C_{3-7}支链烷基。

[2434] 在一些实施方案中,R^{20a}为C_{3-7}环烷基。

[2435] 在一些实施方案中,R^{20a}为C_{1-6}直链烷氧基。

[2436] 在一些实施方案中,R^{20a}为C_{3-7}支链烷氧基。

[2437] 在一些实施方案中,R^{20a}为C_{3-7}环烷氧基。

[2438] 在一些实施方案中,R^{20a}为C_{1-6}直链卤代烷基。

[2439] 在一些实施方案中,R^{20a}为C_{3-7}支链卤代烷基。

[2440] 在一些实施方案中,R^{20a}为C_{1-6}直链卤代烷氧基。

[2441] 在一些实施方案中,R^{20a}为C_{3-7}支链卤代烷氧基。

[2442] 在一些实施方案中,R^{20a}为SH。

[2443] 在一些实施方案中,R^{20a}为SC_{1-6}直链烷基。

[2444] 在一些实施方案中,R^{20a}为SC_{3-7}支链烷基。

[2445] 在一些实施方案中,R^{20a}为SC_{3-7}环烷基。

[2446] 在一些实施方案中,R^{20a}为SO_2C_{1-6}直链烷基。

[2447] 在一些实施方案中,R^{20a}为SO_2C_{3-7}支链烷基。

[2448] 在一些实施方案中,R^{20a}为SO_2C_{3-7}环烷基。

[2449] 在一些实施方案中,R^{20a}为SO_2NH_2。

[2450] 在一些实施方案中,R^{20a}为SO_2NHR^{21}。

[2451] 在一些实施方案中,R^{20a}为$NHSO_2R^{22}$。

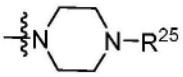
[2452] 在一些实施方案中，R^{20a}为-$NR^{23a}R^{23b}$。

[2453] 在一些实施方案中，R^{20a}为$NHC(O)R^{24}$。

[2454] 在一些实施方案中，R^{20a}为$C(O)NHR^{24}$。

[2455] 在一些实施方案中，R^{20a}为$C(O)N(R^{24})_2$。

[2456] 在一些实施方案中，R^{20a}为吗啉代。

[2457] 在一些实施方案中，R^{20a}为  。

[2458] 在一些实施方案中，R^{20b}为氢。

[2459] 在一些实施方案中，R^{20b}为-CN。

[2460] 在一些实施方案中，R^{20b}为-NO_2。

[2461] 在一些实施方案中，R^{20b}为-OH。

[2462] 在一些实施方案中，R^{20b}为卤素。

[2463] 在一些实施方案中，R^{20b}为C_{1-6}直链烷基。

[2464] 在一些实施方案中，R^{20b}为C_{3-7}支链烷基。

[2465] 在一些实施方案中，R^{20b}为C_{3-7}环烷基。

[2466] 在一些实施方案中，R^{20b}为C_{1-6}直链烷氧基。

[2467] 在一些实施方案中，R^{20b}为C_{3-7}支链烷氧基。

[2468] 在一些实施方案中，R^{20b}为C_{3-7}环烷氧基。

[2469] 在一些实施方案中，R^{20b}为C_{1-6}直链卤代烷基。

[2470] 在一些实施方案中，R^{20b}为C_{3-7}支链卤代烷基。

[2471] 在一些实施方案中，R^{20b}为C_{1-6}直链卤代烷氧基。

[2472] 在一些实施方案中，R^{20b}为C_{3-7}支链卤代烷氧基。

[2473] 在一些实施方案中，R^{20b}为SH。

[2474] 在一些实施方案中，R^{20b}为SC_{1-6}直链烷基。

[2475] 在一些实施方案中，R^{20b}为SC_{3-7}支链烷基。

[2476] 在一些实施方案中，R^{20b}为SC_{3-7}环烷基。

[2477] 在一些实施方案中，R^{20b}为SO_2C_{1-6}直链烷基。

[2478] 在一些实施方案中，R^{20b}为SO_2C_{3-7}支链烷基。

[2479] 在一些实施方案中，R^{20b}为SO_2C_{3-7}环烷基。

[2480] 在一些实施方案中，R^{20b}为SO_2NH_2。

[2481] 在一些实施方案中，R^{20b}为SO_2NHR^{21}。

[2482] 在一些实施方案中，R^{20b}为$NHSO_2R^{22}$。

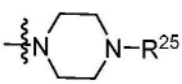
[2483] 在一些实施方案中，R^{20b}为-$NR^{23a}R^{23b}$。

[2484] 在一些实施方案中，R^{20b}为$NHC(O)R^{24}$。

[2485] 在一些实施方案中，R^{20b}为$C(O)NHR^{24}$。

[2486] 在一些实施方案中，R^{20b}为$C(O)N(R^{24})_2$。

[2487] 在一些实施方案中，R^{20b}为吗啉代。

[2488] 在一些实施方案中，R^{20b}为  。

[2489] 在一些实施方案中,R^{20c}为氢。

[2490] 在一些实施方案中,R^{20c}为-CN。

[2491] 在一些实施方案中,R^{20c}为$-NO_2$。

[2492] 在一些实施方案中,R^{20c}为-OH。

[2493] 在一些实施方案中,R^{20c}为卤素。

[2494] 在一些实施方案中,R^{20c}为C_{1-6}直链烷基。

[2495] 在一些实施方案中,R^{20c}为C_{3-7}支链烷基。

[2496] 在一些实施方案中,R^{20c}为C_{3-7}环烷基。

[2497] 在一些实施方案中,R^{20c}为C_{1-6}直链烷氧基。

[2498] 在一些实施方案中,R^{20c}为C_{3-7}支链烷氧基。

[2499] 在一些实施方案中,R^{20c}为C_{3-7}环烷氧基。

[2500] 在一些实施方案中,R^{20c}为C_{1-6}直链卤代烷基。

[2501] 在一些实施方案中,R^{20c}为C_{3-7}支链卤代烷基。

[2502] 在一些实施方案中,R^{20c}为C_{1-6}直链卤代烷氧基。

[2503] 在一些实施方案中,R^{20c}为C_{3-7}支链卤代烷氧基。

[2504] 在一些实施方案中,R^{20c}为SH。

[2505] 在一些实施方案中,R^{20c}为SC_{1-6}直链烷基。

[2506] 在一些实施方案中,R^{20c}为SC_{3-7}支链烷基。

[2507] 在一些实施方案中,R^{20c}为SC_{3-7}环烷基。

[2508] 在一些实施方案中,R^{20c}为SO_2C_{1-6}直链烷基。

[2509] 在一些实施方案中,R^{20c}为SO_2C_{3-7}支链烷基。

[2510] 在一些实施方案中,R^{20c}为SO_2C_{3-7}环烷基。

[2511] 在一些实施方案中,R^{20c}为SO_2NH_2。

[2512] 在一些实施方案中,R^{20c}为SO_2NHR^{21}。

[2513] 在一些实施方案中,R^{20c}为$NHSO_2R^{22}$。

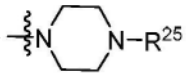
[2514] 在一些实施方案中,R^{20c}为$-NR^{23a}R^{23b}$。

[2515] 在一些实施方案中,R^{20c}为$NHC(O)R^{24}$。

[2516] 在一些实施方案中,R^{20c}为$C(O)NHR^{24}$。

[2517] 在一些实施方案中,R^{20c}为$C(O)N(R^{24})_2$。

[2518] 在一些实施方案中,R^{20c}为吗啉代。

[2519] 在一些实施方案中,R^{20c}为  。

[2520] 在一些实施方案中,R^{20d}为氢。

[2521] 在一些实施方案中,R^{20d}为-CN。

[2522] 在一些实施方案中,R^{20d}为$-NO_2$。

[2523] 在一些实施方案中,R^{20d}为-OH。

[2524] 在一些实施方案中,R^{20d}为卤素。

[2525] 在一些实施方案中,R^{20d}为C_{1-6}直链烷基。

[2526] 在一些实施方案中,R^{20d}为C_{3-7}支链烷基。

[2527] 在一些实施方案中,R^{20d}为C_{3-7}环烷基。

[2528] 在一些实施方案中,R^{20d}为C_{1-6}直链烷氧基。

[2529] 在一些实施方案中,R^{20d}为C_{3-7}支链烷氧基。

[2530] 在一些实施方案中,R^{20d}为C_{3-7}环烷氧基。

[2531] 在一些实施方案中,R^{20d}为C_{1-6}直链卤代烷基。

[2532] 在一些实施方案中,R^{20d}为C_{3-7}支链卤代烷基。

[2533] 在一些实施方案中,R^{20d}为C_{1-6}直链卤代烷氧基。

[2534] 在一些实施方案中,R^{20d}为C_{3-7}支链卤代烷氧基。

[2535] 在一些实施方案中,R^{20d}为SH。

[2536] 在一些实施方案中,R^{20d}为SC_{1-6}直链烷基。

[2537] 在一些实施方案中,R^{20d}为SC_{3-7}支链烷基。

[2538] 在一些实施方案中,R^{20d}为SC_{3-7}环烷基。

[2539] 在一些实施方案中,R^{20d}为SO_2C_{1-6}直链烷基。

[2540] 在一些实施方案中,R^{20d}为SO_2C_{3-7}支链烷基。

[2541] 在一些实施方案中,R^{20d}为SO_2C_{3-7}环烷基。

[2542] 在一些实施方案中,R^{20d}为SO_2NH_2。

[2543] 在一些实施方案中,R^{20d}为SO_2NHR^{21}。

[2544] 在一些实施方案中,R^{20d}为$NHSO_2R^{22}$。

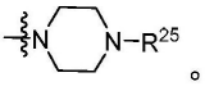
[2545] 在一些实施方案中,R^{20d}为$-NR^{23a}R^{23b}$。

[2546] 在一些实施方案中,R^{20d}为$NHC(O)R^{24}$。

[2547] 在一些实施方案中,R^{20d}为$C(O)NHR^{24}$。

[2548] 在一些实施方案中,R^{20d}为$C(O)N(R^{24})_2$。

[2549] 在一些实施方案中,R^{20d}为吗啉代。

[2550] 在一些实施方案中,R^{20d}为  。

[2551] 在一些实施方案中,R^{20e}为氢。

[2552] 在一些实施方案中,R^{20e}为-CN。

[2553] 在一些实施方案中,R^{20e}为$-NO_2$。

[2554] 在一些实施方案中,R^{20e}为-OH。

[2555] 在一些实施方案中,R^{20e}为卤素。

[2556] 在一些实施方案中,R^{20e}为C_{1-6}直链烷基。

[2557] 在一些实施方案中,R^{20e}为C_{3-7}支链烷基。

[2558] 在一些实施方案中,R^{20e}为C_{3-7}环烷基。

[2559] 在一些实施方案中,R^{20e}为C_{1-6}直链烷氧基。

[2560] 在一些实施方案中,R^{20e}为C_{3-7}支链烷氧基。

[2561] 在一些实施方案中,R^{20e}为C_{3-7}环烷氧基。

[2562] 在一些实施方案中,R^{20e}为C_{1-6}直链卤代烷基。

[2563] 在一些实施方案中,R^{20e}为C_{3-7}支链卤代烷基。

[2564] 在一些实施方案中,R^{20e}为C_{1-6}直链卤代烷氧基。

[2565] 在一些实施方案中，R^{20e}为C_{3-7}支链卤代烷氧基。

[2566] 在一些实施方案中，R^{20e}为SH。

[2567] 在一些实施方案中，R^{20e}为SC_{1-6}直链烷基。

[2568] 在一些实施方案中，R^{20e}为SC_{3-7}支链烷基。

[2569] 在一些实施方案中，R^{20e}为SC_{3-7}环烷基。

[2570] 在一些实施方案中，R^{20e}为SO_2C_{1-6}直链烷基。

[2571] 在一些实施方案中，R^{20e}为SO_2C_{3-7}支链烷基。

[2572] 在一些实施方案中，R^{20e}为SO_2C_{3-7}环烷基。

[2573] 在一些实施方案中，R^{20e}为SO_2NH_2。

[2574] 在一些实施方案中，R^{20e}为SO_2NHR^{21}。

[2575] 在一些实施方案中，R^{20e}为$NHSO_2R^{22}$。

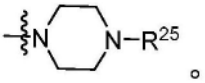
[2576] 在一些实施方案中，R^{20e}为$-NR^{23a}R^{23b}$。

[2577] 在一些实施方案中，R^{20e}为$NHC(O)R^{24}$。

[2578] 在一些实施方案中，R^{20e}为$C(O)NHR^{24}$。

[2579] 在一些实施方案中，R^{20e}为$C(O)N(R^{24})_2$。

[2580] 在一些实施方案中，R^{20e}为吗啉代。

[2581] 在一些实施方案中，R^{20e}为  。

[2582] 在一些实施方案中，R^{20f}为氢。

[2583] 在一些实施方案中，R^{20f}为-CN。

[2584] 在一些实施方案中，R^{20f}为$-NO_2$。

[2585] 在一些实施方案中，R^{20f}为-OH。

[2586] 在一些实施方案中，R^{20f}为卤素。

[2587] 在一些实施方案中，R^{20f}为C_{1-6}直链烷基。

[2588] 在一些实施方案中，R^{20f}为C_{3-7}支链烷基。

[2589] 在一些实施方案中，R^{20f}为C_{3-7}环烷基。

[2590] 在一些实施方案中，R^{20f}为C_{1-6}直链烷氧基。

[2591] 在一些实施方案中，R^{20f}为C_{3-7}支链烷氧基。

[2592] 在一些实施方案中，R^{20f}为C_{3-7}环烷氧基。

[2593] 在一些实施方案中，R^{20f}为C_{1-6}直链卤代烷基。

[2594] 在一些实施方案中，R^{20f}为C_{3-7}支链卤代烷基。

[2595] 在一些实施方案中，R^{20f}为C_{1-6}直链卤代烷氧基。

[2596] 在一些实施方案中，R^{20f}为C_{3-7}支链卤代烷氧基。

[2597] 在一些实施方案中，R^{20f}为SH。

[2598] 在一些实施方案中，R^{20f}为SC_{1-6}直链烷基。

[2599] 在一些实施方案中，R^{20f}为SC_{3-7}支链烷基。

[2600] 在一些实施方案中，R^{20f}为SC_{3-7}环烷基。

[2601] 在一些实施方案中，R^{20f}为SO_2C_{1-6}直链烷基。

[2602] 在一些实施方案中，R^{20f}为SO_2C_{3-7}支链烷基。

[2603] 在一些实施方案中，R^{20f}为SO_2C_{3-7}环烷基。

[2604] 在一些实施方案中，R^{20f}为SO_2NH_2。

[2605] 在一些实施方案中，R^{20f}为SO_2NHR^{21}。

[2606] 在一些实施方案中，R^{20f}为$NHSO_2R^{22}$。

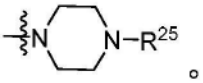
[2607] 在一些实施方案中，R^{20f}为$-NR^{23a}R^{23b}$。

[2608] 在一些实施方案中，R^{20f}为$NHC(O)R^{24}$。

[2609] 在一些实施方案中，R^{20f}为$C(O)NHR^{24}$。

[2610] 在一些实施方案中，R^{20f}为$C(O)N(R^{24})_2$。

[2611] 在一些实施方案中，R^{20f}为吗啉代。

[2612] 在一些实施方案中，R^{20f}为  。

[2613] 在一些实施方案中，R^{20g}为氢。

[2614] 在一些实施方案中，R^{20g}为-CN。

[2615] 在一些实施方案中，R^{20g}为$-NO_2$。

[2616] 在一些实施方案中，R^{20g}为-OH。

[2617] 在一些实施方案中，R^{20g}为卤素。

[2618] 在一些实施方案中，R^{20g}为C_{1-6}直链烷基。

[2619] 在一些实施方案中，R^{20g}为C_{3-7}支链烷基。

[2620] 在一些实施方案中，R^{20g}为C_{3-7}环烷基。

[2621] 在一些实施方案中，R^{20g}为C_{1-6}直链烷氧基。

[2622] 在一些实施方案中，R^{20g}为C_{3-7}支链烷氧基。

[2623] 在一些实施方案中，R^{20g}为C_{3-7}环烷氧基。

[2624] 在一些实施方案中，R^{20g}为C_{1-6}直链卤代烷基。

[2625] 在一些实施方案中，R^{20g}为C_{3-7}支链卤代烷基。

[2626] 在一些实施方案中，R^{20g}为C_{1-6}直链卤代烷氧基。

[2627] 在一些实施方案中，R^{20g}为C_{3-7}支链卤代烷氧基。

[2628] 在一些实施方案中，R^{20g}为SH。

[2629] 在一些实施方案中，R^{20g}为SC_{1-6}直链烷基。

[2630] 在一些实施方案中，R^{20g}为SC_{3-7}支链烷基。

[2631] 在一些实施方案中，R^{20g}为SC_{3-7}环烷基。

[2632] 在一些实施方案中，R^{20g}为SO_2C_{1-6}直链烷基。

[2633] 在一些实施方案中，R^{20g}为SO_2C_{3-7}支链烷基。

[2634] 在一些实施方案中，R^{20g}为SO_2C_{3-7}环烷基。

[2635] 在一些实施方案中，R^{20g}为SO_2NH_2。

[2636] 在一些实施方案中，R^{20g}为SO_2NHR^{21}。

[2637] 在一些实施方案中，R^{20g}为$NHSO_2R^{22}$。

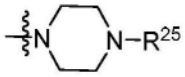
[2638] 在一些实施方案中，R^{20g}为$-NR^{23a}R^{23b}$。

[2639] 在一些实施方案中，R^{20g}为$NHC(O)R^{24}$。

[2640] 在一些实施方案中，R^{20g}为$C(O)NHR^{24}$。

[2641] 在一些实施方案中，R^{20g}为$C(O)N(R^{24})_2$。

[2642] 在一些实施方案中，R^{20g}为吗啉代。

[2643] 在一些实施方案中，R^{20g}为  。

[2644] 在一些实施方案中，R^{21}为氢。

[2645] 在一些实施方案中，R^{21}为C_{1-6}直链烷基。

[2646] 在一些实施方案中，R^{21}为C_{3-7}支链烷基。

[2647] 在一些实施方案中，R^{21}为C_{3-7}环烷基。

[2648] 在一些实施方案中，R^{22}为氢。

[2649] 在一些实施方案中，R^{22}为C_{1-6}直链烷基。

[2650] 在一些实施方案中，R^{22}为C_{3-7}支链烷基。

[2651] 在一些实施方案中，R^{22}为C_{3-7}环烷基。

[2652] 在一些实施方案中，R^{23a}为氢。

[2653] 在一些实施方案中，R^{23a}为C_{1-6}直链烷基。

[2654] 在一些实施方案中，R^{23a}为C_{3-7}支链烷基。

[2655] 在一些实施方案中，R^{23a}为C_{3-7}环烷基。

[2656] 在一些实施方案中，R^{23b}为氢。

[2657] 在一些实施方案中，R^{23b}为C_{1-6}直链烷基。

[2658] 在一些实施方案中，R^{23b}为C_{3-7}支链烷基。

[2659] 在一些实施方案中，R^{23b}为C_{3-7}环烷基。

[2660] 在一些实施方案中，R^{24}为氢。

[2661] 在一些实施方案中，R^{24}为C_{1-6}直链烷基。

[2662] 在一些实施方案中，R^{24}为C_{3-7}支链烷基。

[2663] 在一些实施方案中，R^{24}为C_{3-7}环烷基。

[2664] 在一些实施方案中，R^{25}为氢。

[2665] 在一些实施方案中，R^{25}为C_{1-6}直链烷基。

[2666] 在一些实施方案中，R^{25}为C_{3-7}支链烷基。

[2667] 在一些实施方案中，R^{25}为C_{3-7}环烷基。

[2668] 在一些实施方案中，Q^1为1。

[2669] 在一些实施方案中，Q^1为2。

[2670] 在一些实施方案中，Q^2为1。

[2671] 在一些实施方案中，Q^2为2。

[2672] 在一些实施方案中，X^1为O。

[2673] 在一些实施方案中，X^1为S。

[2674] 在一些实施方案中，X^1为SO。

[2675] 在一些实施方案中，X^1为SO_2。

[2676] 在一些实施方案中，X^1为NR^7。

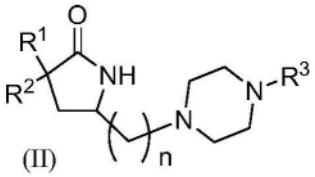
[2677] 示例性化合物

[2678] 示例性化合物包括本文所述的任何化合物。在本文所述的化合物或式未指定内酰

胺立构中心的构型(即,被内酰胺的氮取代的碳)的实施方案中没有指出,所述内酰胺立构中心可以具有R-构型。在其他实施方案中,所述内酰胺立体中心可以具有S-构型。

[2679] 在实施方案中,化合物为本文所述的任何化合物或其可药用盐。在实施方案中,化合物或其可药用盐描述于表1至表39中的任一个中。在实施方案中,化合物为表34至表39中的任一个中描述的化合物或其可药用盐。

[2680] 示例性实施方案包括具有式(II)的化合物

[2681] 

(II)

[2682] 或其可药用盐形式,如在下文表1中所定义。

[2683] 表1:

[2684]

条目	R^1	R^2	n	R^3	条目	R^1	R^2	n	R^3
1	甲基	甲基	1	苯基	177	乙基	乙基	1	苯基
2	甲基	甲基	2	苯基	178	乙基	乙基	2	苯基
3	甲基	甲基	3	苯基	179	乙基	乙基	3	苯基
4	甲基	甲基	4	苯基	180	乙基	乙基	4	苯基
5	甲基	甲基	1	4-OH-苯基	181	乙基	乙基	1	4-OH-苯基
6	甲基	甲基	2	4-OH-苯基	182	乙基	乙基	2	4-OH-苯基
7	甲基	甲基	3	4-OH-苯基	183	乙基	乙基	3	4-OH-苯基
8	甲基	甲基	4	4-OH-苯基	184	乙基	乙基	4	4-OH-苯基
9	甲基	甲基	1	3-OH-苯基	185	乙基	乙基	1	3-OH-苯基
10	甲基	甲基	2	3-OH-苯基	186	乙基	乙基	2	3-OH-苯基
11	甲基	甲基	3	3-OH-苯基	187	乙基	乙基	3	3-OH-苯基
12	甲基	甲基	4	3-OH-苯基	188	乙基	乙基	4	3-OH-苯基
13	甲基	甲基	1	2-OH-苯基	189	乙基	乙基	1	2-OH-苯基
14	甲基	甲基	2	2-OH-苯基	190	乙基	乙基	2	2-OH-苯基
15	甲基	甲基	3	2-OH-苯基	191	乙基	乙基	3	2-OH-苯基
16	甲基	甲基	4	2-OH-苯基	192	乙基	乙基	4	2-OH-苯基
17	甲基	甲基	1	4-OMe-苯基	193	乙基	乙基	1	4-OMe-苯基
18	甲基	甲基	2	4-OMe-苯基	194	乙基	乙基	2	4-OMe-苯基
19	甲基	甲基	3	4-OMe-苯基	195	乙基	乙基	3	4-OMe-苯基

[2685]

20	甲基	甲基	4	4-OMe-苯基	196	乙基	乙基	4	4-OMe-苯基
21	甲基	甲基	1	3-OMe-苯基	197	乙基	乙基	1	3-OMe-苯基
22	甲基	甲基	2	3-OMe-苯基	198	乙基	乙基	2	3-OMe-苯基
23	甲基	甲基	3	3-OMe-苯基	199	乙基	乙基	3	3-OMe-苯基
24	甲基	甲基	4	3-OMe-苯基	200	乙基	乙基	4	3-OMe-苯基
25	甲基	甲基	1	2-OMe-苯基	201	乙基	乙基	1	2-OMe-苯基
26	甲基	甲基	2	2-OMe-苯基	202	乙基	乙基	2	2-OMe-苯基
27	甲基	甲基	3	2-OMe-苯基	203	乙基	乙基	3	2-OMe-苯基
28	甲基	甲基	4	2-OMe-苯基	204	乙基	乙基	4	2-OMe-苯基
29	甲基	甲基	1	4-CN-苯基	205	乙基	乙基	1	4-CN-苯基
30	甲基	甲基	2	4-CN-苯基	206	乙基	乙基	2	4-CN-苯基
31	甲基	甲基	3	4-CN-苯基	207	乙基	乙基	3	4-CN-苯基
32	甲基	甲基	4	4-CN-苯基	208	乙基	乙基	4	4-CN-苯基
33	甲基	甲基	1	3-CN-苯基	209	乙基	乙基	1	3-CN-苯基
34	甲基	甲基	2	3-CN-苯基	210	乙基	乙基	2	3-CN-苯基
35	甲基	甲基	3	3-CN-苯基	211	乙基	乙基	3	3-CN-苯基
36	甲基	甲基	4	3-CN-苯基	212	乙基	乙基	4	3-CN-苯基
37	甲基	甲基	1	2-CN-苯基	213	乙基	乙基	1	2-CN-苯基
38	甲基	甲基	2	2-CN-苯基	214	乙基	乙基	2	2-CN-苯基
39	甲基	甲基	3	2-CN-苯基	215	乙基	乙基	3	2-CN-苯基
40	甲基	甲基	4	2-CN-苯基	216	乙基	乙基	4	2-CN-苯基
41	甲基	甲基	1	4-Me-苯基	217	乙基	乙基	1	4-Me-苯基
42	甲基	甲基	2	4-Me-苯基	218	乙基	乙基	2	4-Me-苯基
43	甲基	甲基	3	4-Me-苯基	219	乙基	乙基	3	4-Me-苯基
44	甲基	甲基	4	4-Me-苯基	220	乙基	乙基	4	4-Me-苯基
45	甲基	甲基	1	3-Me-苯基	221	乙基	乙基	1	3-Me-苯基
46	甲基	甲基	2	3-Me-苯基	222	乙基	乙基	2	3-Me-苯基

[2686]

47	甲基	甲基	3	3-Me-苯基	223	乙基	乙基	3	3-Me-苯基
48	甲基	甲基	4	3-Me-苯基	224	乙基	乙基	4	3-Me-苯基
49	甲基	甲基	1	2-Me-苯基	225	乙基	乙基	1	2-Me-苯基
50	甲基	甲基	2	2-Me-苯基	226	乙基	乙基	2	2-Me-苯基
51	甲基	甲基	3	2-Me-苯基	227	乙基	乙基	3	2-Me-苯基
52	甲基	甲基	4	2-Me-苯基	228	乙基	乙基	4	2-Me-苯基
53	甲基	甲基	1	4-F-苯基	229	乙基	乙基	1	4-F-苯基
54	甲基	甲基	2	4-F-苯基	230	乙基	乙基	2	4-F-苯基
55	甲基	甲基	3	4-F-苯基	231	乙基	乙基	3	4-F-苯基
56	甲基	甲基	4	4-F-苯基	232	乙基	乙基	4	4-F-苯基
57	甲基	甲基	1	3-F-苯基	233	乙基	乙基	1	3-F-苯基
58	甲基	甲基	2	3-F-苯基	234	乙基	乙基	2	3-F-苯基
59	甲基	甲基	3	3-F-苯基	235	乙基	乙基	3	3-F-苯基
60	甲基	甲基	4	3-F-苯基	236	乙基	乙基	4	3-F-苯基
61	甲基	甲基	1	2-F-苯基	237	乙基	乙基	1	2-F-苯基
62	甲基	甲基	2	2-F-苯基	238	乙基	乙基	2	2-F-苯基
63	甲基	甲基	3	2-F-苯基	239	乙基	乙基	3	2-F-苯基
64	甲基	甲基	4	2-F-苯基	240	乙基	乙基	4	2-F-苯基
65	甲基	甲基	1	4-Cl-苯基	241	乙基	乙基	1	4-Cl-苯基
66	甲基	甲基	2	4-Cl-苯基	242	乙基	乙基	2	4-Cl-苯基
67	甲基	甲基	3	4-Cl-苯基	243	乙基	乙基	3	4-Cl-苯基
68	甲基	甲基	4	4-Cl-苯基	244	乙基	乙基	4	4-Cl-苯基
69	甲基	甲基	1	3-Cl-苯基	245	乙基	乙基	1	3-Cl-苯基
70	甲基	甲基	2	3-Cl-苯基	246	乙基	乙基	2	3-Cl-苯基
71	甲基	甲基	3	3-Cl-苯基	247	乙基	乙基	3	3-Cl-苯基
72	甲基	甲基	4	3-Cl-苯基	248	乙基	乙基	4	3-Cl-苯基
73	甲基	甲基	1	2-Cl-苯基	249	乙基	乙基	1	2-Cl-苯基

[2687]

74	甲基	甲基	2	2-Cl-苯基	250	乙基	乙基	2	2-Cl-苯基
75	甲基	甲基	3	2-Cl-苯基	251	乙基	乙基	3	2-Cl-苯基
76	甲基	甲基	4	2-Cl-苯基	252	乙基	乙基	4	2-Cl-苯基
77	甲基	甲基	1	4-Br-苯基	253	乙基	乙基	1	4-Br-苯基
78	甲基	甲基	2	4-Br-苯基	254	乙基	乙基	2	4-Br-苯基
79	甲基	甲基	3	4-Br-苯基	255	乙基	乙基	3	4-Br-苯基
80	甲基	甲基	4	4-Br-苯基	256	乙基	乙基	4	4-Br-苯基
81	甲基	甲基	1	3-Br-苯基	257	乙基	乙基	1	3-Br-苯基
82	甲基	甲基	2	3-Br-苯基	258	乙基	乙基	2	3-Br-苯基
83	甲基	甲基	3	3-Br-苯基	259	乙基	乙基	3	3-Br-苯基
84	甲基	甲基	4	3-Br-苯基	260	乙基	乙基	4	3-Br-苯基
85	甲基	甲基	1	2-Br-苯基	261	乙基	乙基	1	2-Br-苯基
86	甲基	甲基	2	2-Br-苯基	262	乙基	乙基	2	2-Br-苯基
87	甲基	甲基	3	2-Br-苯基	263	乙基	乙基	3	2-Br-苯基
88	甲基	甲基	4	2-Br-苯基	264	乙基	乙基	4	2-Br-苯基
89	甲基	甲基	1	4-CF_3-苯基	265	乙基	乙基	1	4-CF_3-苯基
90	甲基	甲基	2	4-CF_3-苯基	266	乙基	乙基	2	4-CF_3-苯基
91	甲基	甲基	3	4-CF_3-苯基	267	乙基	乙基	3	4-CF_3-苯基
92	甲基	甲基	4	4-CF_3-苯基	268	乙基	乙基	4	4-CF_3-苯基
93	甲基	甲基	1	3-CF_3-苯基	269	乙基	乙基	1	3-CF_3-苯基
94	甲基	甲基	2	3-CF_3-苯基	270	乙基	乙基	2	3-CF_3-苯基
95	甲基	甲基	3	3-CF_3-苯基	271	乙基	乙基	3	3-CF_3-苯基
96	甲基	甲基	4	3-CF_3-苯基	272	乙基	乙基	4	3-CF_3-苯基
97	甲基	甲基	1	2-CF_3-苯基	273	乙基	乙基	1	2-CF_3-苯基
98	甲基	甲基	2	2-CF_3-苯基	274	乙基	乙基	2	2-CF_3-苯基
99	甲基	甲基	3	2-CF_3-苯基	275	乙基	乙基	3	2-CF_3-苯基
100	甲基	甲基	4	2-CF_3-苯基	276	乙基	乙基	4	2-CF_3-苯基

[2688]

101	甲基	甲基	1	4-iPr-苯基	277	乙基	乙基	1	4-iPr-苯基
102	甲基	甲基	2	4-iPr-苯基	278	乙基	乙基	2	4-iPr-苯基
103	甲基	甲基	3	4-iPr-苯基	279	乙基	乙基	3	4-iPr-苯基
104	甲基	甲基	4	4-iPr-苯基	280	乙基	乙基	4	4-iPr-苯基
105	甲基	甲基	1	3-iPr-苯基	281	乙基	乙基	1	3-iPr-苯基
106	甲基	甲基	2	3-iPr-苯基	282	乙基	乙基	2	3-iPr-苯基
107	甲基	甲基	3	3-iPr-苯基	283	乙基	乙基	3	3-iPr-苯基
108	甲基	甲基	4	3-iPr-苯基	284	乙基	乙基	4	3-iPr-苯基
109	甲基	甲基	1	2-iPr-苯基	285	乙基	乙基	1	2-iPr-苯基
110	甲基	甲基	2	2-iPr-苯基	286	乙基	乙基	2	2-iPr-苯基
111	甲基	甲基	3	2-iPr-苯基	287	乙基	乙基	3	2-iPr-苯基
112	甲基	甲基	4	2-iPr-苯基	288	乙基	乙基	4	2-iPr-苯基
113	甲基	甲基	1	4-NH_2-苯基	289	乙基	乙基	1	4-NH_2-苯基
114	甲基	甲基	2	4-NH_2-苯基	290	乙基	乙基	2	4-NH_2-苯基
115	甲基	甲基	3	4-NH_2-苯基	291	乙基	乙基	3	4-NH_2-苯基
116	甲基	甲基	4	4-NH_2-苯基	292	乙基	乙基	4	4-NH_2-苯基
117	甲基	甲基	1	3-NH_2-苯基	293	乙基	乙基	1	3-NH_2-苯基
118	甲基	甲基	2	3-NH_2-苯基	294	乙基	乙基	2	3-NH_2-苯基
119	甲基	甲基	3	3-NH_2-苯基	295	乙基	乙基	3	3-NH_2-苯基
120	甲基	甲基	4	3-NH_2-苯基	296	乙基	乙基	4	3-NH_2-苯基
121	甲基	甲基	1	2-NH_2-苯基	297	乙基	乙基	1	2-NH_2-苯基
122	甲基	甲基	2	2-NH_2-苯基	298	乙基	乙基	2	2-NH_2-苯基
123	甲基	甲基	3	2-NH_2-苯基	299	乙基	乙基	3	2-NH_2-苯基
124	甲基	甲基	4	2-NH_2-苯基	300	乙基	乙基	4	2-NH_2-苯基
125	甲基	甲基	1	2,3-二-Me-苯基	301	乙基	乙基	1	2,3-二-Me-苯基
126	甲基	甲基	2	2,3-二-Me-苯基	302	乙基	乙基	2	2,3-二-Me-苯基
127	甲基	甲基	3	2,3-二-Me-苯基	303	乙基	乙基	3	2,3-二-Me-苯基

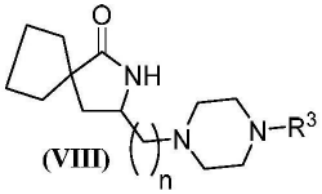
128	甲基	甲基	4	2,3-二-Me-苯基	304	乙基	乙基	4	2,3-二-Me-苯基
129	甲基	甲基	1	2,4-二-Me-苯基	305	乙基	乙基	1	2,4-二-Me-苯基
130	甲基	甲基	2	2,4-二-Me-苯基	306	乙基	乙基	2	2,4-二-Me-苯基
131	甲基	甲基	3	2,4-二-Me-苯基	307	乙基	乙基	3	2,4-二-Me-苯基
132	甲基	甲基	4	2,4-二-Me-苯基	308	乙基	乙基	4	2,4-二-Me-苯基
133	甲基	甲基	1	2,5-二-Me-苯基	309	乙基	乙基	1	2,5-二-Me-苯基
134	甲基	甲基	2	2,5-二-Me-苯基	310	乙基	乙基	2	2,5-二-Me-苯基
135	甲基	甲基	3	2,5-二-Me-苯基	311	乙基	乙基	3	2,5-二-Me-苯基
136	甲基	甲基	4	2,5-二-Me-苯基	312	乙基	乙基	4	2,5-二-Me-苯基
137	甲基	甲基	1	2,6-二-Me-苯基	313	乙基	乙基	1	2,6-二-Me-苯基
138	甲基	甲基	2	2,6-二-Me-苯基	314	乙基	乙基	2	2,6-二-Me-苯基
139	甲基	甲基	3	2,6-二-Me-苯基	315	乙基	乙基	3	2,6-二-Me-苯基
140	甲基	甲基	4	2,6-二-Me-苯基	316	乙基	乙基	4	2,6-二-Me-苯基
141	甲基	甲基	1	2,6-二-iPr-苯基	317	乙基	乙基	1	2,6-二-iPr-苯基
142	甲基	甲基	2	2,6-二-iPr-苯基	318	乙基	乙基	2	2,6-二-iPr-苯基
143	甲基	甲基	3	2,6-二-iPr-苯基	319	乙基	乙基	3	2,6-二-iPr-苯基
144	甲基	甲基	4	2,6-二-iPr-苯基	320	乙基	乙基	4	2,6-二-iPr-苯基
145	甲基	甲基	1	2-吗啉代-苯基	321	乙基	乙基	1	2-吗啉代-苯基
146	甲基	甲基	2	2-吗啉代-苯基	322	乙基	乙基	2	2-吗啉代-苯基
147	甲基	甲基	3	2-吗啉代-苯基	323	乙基	乙基	3	2-吗啉代-苯基
148	甲基	甲基	4	2-吗啉代-苯基	324	乙基	乙基	4	2-吗啉代-苯基
149	甲基	甲基	1	3-吗啉代-苯基	325	乙基	乙基	1	3-吗啉代-苯基
150	甲基	甲基	2	3-吗啉代-苯基	326	乙基	乙基	2	3-吗啉代-苯基
151	甲基	甲基	3	3-吗啉代-苯基	327	乙基	乙基	3	3-吗啉代-苯基
152	甲基	甲基	4	3-吗啉代-苯基	328	乙基	乙基	4	3-吗啉代-苯基
153	甲基	甲基	1	4-吗啉代-苯基	329	乙基	乙基	1	4-吗啉代-苯基
154	甲基	甲基	2	4-吗啉代-苯基	330	乙基	乙基	2	4-吗啉代-苯基

[2689]

[2690]

155	甲基	甲基	3	4-吗啉代-苯基	331	乙基	乙基	3	4-吗啉代-苯基
156	甲基	甲基	4	4-吗啉代-苯基	332	乙基	乙基	4	4-吗啉代-苯基
157	甲基	甲基	1	4-CN-2-吗啉代-苯基	333	乙基	乙基	1	4-CN-2-吗啉代-苯基
158	甲基	甲基	2	4-CN-2-吗啉代-苯基	334	乙基	乙基	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
159	甲基	甲基	3	4-CN-2-吗啉代-苯基	335	乙基	乙基	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
160	甲基	甲基	4	4-CN-2-吗啉代-苯基	336	乙基	乙基	4	4-CN-2-吗啉代-苯基
161	甲基	甲基	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基	337	乙基	乙基	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
162	甲基	甲基	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基	338	乙基	乙基	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
163	甲基	甲基	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基	339	乙基	乙基	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
164	甲基	甲基	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基	340	乙基	乙基	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
165	甲基	甲基	1	4-OH-2-吗啉代-苯基	341	乙基	乙基	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
166	甲基	甲基	2	4-OH-2-吗啉代-苯基	342	乙基	乙基	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
167	甲基	甲基	3	4-OH-2-吗啉代-苯基	343	乙基	乙基	3	4-OH-2-吗啉代-苯基
168	甲基	甲基	4	4-OH-2-吗啉代-苯基	344	乙基	乙基	4	4-OH-2-吗啉代-苯基
169	甲基	甲基	1	亚萘-1-基	345	乙基	乙基	1	亚萘-1-基
170	甲基	甲基	2	亚萘-1-基	346	乙基	乙基	2	亚萘-1-基
171	甲基	甲基	3	亚萘-1-基	347	乙基	乙基	3	亚萘-1-基
172	甲基	甲基	4	亚萘-1-基	348	乙基	乙基	4	亚萘-1-基
173	甲基	甲基	1	亚萘-2-基	349	乙基	乙基	1	亚萘-2-基
174	甲基	甲基	2	亚萘-2-基	350	乙基	乙基	2	亚萘-2-基
175	甲基	甲基	3	亚萘-2-基	351	乙基	乙基	3	亚萘-2-基
176	甲基	甲基	4	亚萘-2-基	352	乙基	乙基	4	亚萘-2-基

[2691] 示例性实施方案包括具有式(VIII)的化合物

[2692] 

(VIII)

[2693] 或其可药用盐形式,如在下文表2中所定义。

[2694] 表2

条目	n	R^3	条目	n	R^3
1	1	苯基	89	1	2-Br-苯基
2	2	苯基	90	2	2-Br-苯基
3	3	苯基	91	3	2-Br-苯基
4	4	苯基	92	4	2-Br-苯基
5	1	4-OH-苯基	93	1	4-CF_3-苯基
6	2	4-OH-苯基	94	2	4-CF_3-苯基
7	3	4-OH-苯基	95	3	4-CF_3-苯基
8	4	4-OH-苯基	96	4	4-CF_3-苯基
9	1	3-OH-苯基	97	1	3-CF_3-苯基
10	2	3-OH-苯基	98	2	3-CF_3-苯基
11	3	3-OH-苯基	99	3	3-CF_3-苯基
12	4	3-OH-苯基	100	4	3-CF_3-苯基
13	1	2-OH-苯基	101	1	2-CF_3-苯基
14	2	2-OH-苯基	102	2	2-CF_3-苯基
15	3	2-OH-苯基	103	3	2-CF_3-苯基
16	4	2-OH-苯基	104	4	2-CF_3-苯基
17	1	4-OMe-苯基	105	1	4-iPr-苯基
18	2	4-OMe-苯基	106	2	4-iPr-苯基
19	3	4-OMe-苯基	107	3	4-iPr-苯基
20	4	4-OMe-苯基	108	4	4-iPr-苯基
21	1	3-OMe-苯基	109	1	3-iPr-苯基
22	2	3-OMe-苯基	110	2	3-iPr-苯基

[2695]

[2696]

23	3	3-OMe-苯基	111	3	3-iPr-苯基
24	4	3-OMe-苯基	112	4	3-iPr-苯基
25	1	2-OMe-苯基	113	1	2-iPr-苯基
26	2	2-OMe-苯基	114	2	2-iPr-苯基
27	3	2-OMe-苯基	115	3	2-iPr-苯基
28	4	2-OMe-苯基	116	4	2-iPr-苯基
29	1	4-CN-苯基	117	1	4-NH_2-苯基
30	2	4-CN-苯基	118	2	4-NH_2-苯基
31	3	4-CN-苯基	119	3	4-NH_2-苯基
32	4	4-CN-苯基	120	4	4-NH_2-苯基
33	1	3-CN-苯基	121	1	3-NH_2-苯基
34	2	3-CN-苯基	122	2	3-NH_2-苯基
35	3	3-CN-苯基	123	3	3-NH_2-苯基
36	4	3-CN-苯基	124	4	3-NH_2-苯基
37	1	2-CN-苯基	125	1	2-NH_2-苯基
38	2	2-CN-苯基	126	2	2-NH_2-苯基
39	3	2-CN-苯基	127	3	2-NH_2-苯基
40	4	2-CN-苯基	128	4	2-NH_2-苯基
41	1	4-Me-苯基	129	1	2,3-二-Me-苯基
42	2	4-Me-苯基	130	2	2,3-二-Me-苯基
43	3	4-Me-苯基	131	3	2,3-二-Me-苯基
44	4	4-Me-苯基	132	4	2,3-二-Me-苯基
45	1	3-Me-苯基	133	1	2,4-二-Me-苯基
46	2	3-Me-苯基	134	2	2,4-二-Me-苯基
47	3	3-Me-苯基	135	3	2,4-二-Me-苯基
48	4	3-Me-苯基	136	4	2,4-二-Me-苯基
49	1	2-Me-苯基	137	1	2,5-二-Me-苯基

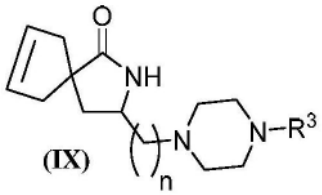
[2697]

50	2	2-Me-苯基	138	2	2,5-二-Me-苯基
51	3	2-Me-苯基	139	3	2,5-二-Me-苯基
52	4	2-Me-苯基	140	4	2,5-二-Me-苯基
53	1	4-F-苯基	141	1	2,6-二-Me-苯基
54	2	4-F-苯基	142	2	2,6-二-Me-苯基
55	3	4-F-苯基	143	3	2,6-二-Me-苯基
56	4	4-F-苯基	144	4	2,6-二-Me-苯基
57	1	3-F-苯基	145	1	2,6-二-iPr-苯基
58	2	3-F-苯基	146	2	2,6-二-iPr-苯基
59	3	3-F-苯基	147	3	2,6-二-iPr-苯基
60	4	3-F-苯基	148	4	2,6-二-iPr-苯基
61	1	2-F-苯基	149	1	2-吗啉代-苯基
62	2	2-F-苯基	150	2	2-吗啉代-苯基
63	3	2-F-苯基	151	3	2-吗啉代-苯基
64	4	2-F-苯基	152	4	2-吗啉代-苯基
65	1	4-Cl-苯基	153	1	3-吗啉代-苯基
66	2	4-Cl-苯基	154	2	3-吗啉代-苯基
67	3	4-Cl-苯基	155	3	3-吗啉代-苯基
68	4	4-Cl-苯基	156	4	3-吗啉代-苯基
69	1	3-Cl-苯基	157	1	4-吗啉代-苯基
70	2	3-Cl-苯基	158	2	4-吗啉代-苯基
71	3	3-Cl-苯基	159	3	4-吗啉代-苯基
72	4	3-Cl-苯基	160	4	4-吗啉代-苯基
73	1	2-Cl-苯基	161	1	4-CN-2-吗啉代-苯基
74	2	2-Cl-苯基	162	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
75	3	2-Cl-苯基	163	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
76	4	2-Cl-苯基	164	4	4-CN-2-吗啉代-苯基

[2698]

77	1	4-Br-苯基	165	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
78	2	4-Br-苯基	166	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
79	3	4-Br-苯基	167	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
80	4	4-Br-苯基	168	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
81	1	3-Br-苯基	169	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
82	2	3-Br-苯基	170	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
83	3	3-Br-苯基	171	3	4-OH-2-吗啉代-苯基
84	4	3-Br-苯基	172	4	4-OH-2-吗啉代-苯基
85	1	亚萘-1-基	173	1	亚萘-2-基
86	2	亚萘-1-基	174	2	亚萘-2-基
87	3	亚萘-1-基	175	3	亚萘-2-基
88	4	亚萘-1-基	176	4	亚萘-2-基

[2699] 示例性实施方案包括具有式(IX)的化合物

[2700] 

(IX)

[2701] 或其可药用盐形式,如在下文表3中所定义。

[2702] 表3

[2703]

条目	n	R^3	条目	n	R^3
1	1	苯基	89	1	2-Br-苯基
2	2	苯基	90	2	2-Br-苯基
3	3	苯基	91	3	2-Br-苯基
4	4	苯基	92	4	2-Br-苯基
5	1	4-OH-苯基	93	1	4-CF_3-苯基
6	2	4-OH-苯基	94	2	4-CF_3-苯基
7	3	4-OH-苯基	95	3	4-CF_3-苯基
8	4	4-OH-苯基	96	4	4-CF_3-苯基
9	1	3-OH-苯基	97	1	3-CF_3-苯基

[2704]

10	2	3-OH-苯基	98	2	3-CF_3-苯基
11	3	3-OH-苯基	99	3	3-CF_3-苯基
12	4	3-OH-苯基	100	4	3-CF_3-苯基
13	1	2-OH-苯基	101	1	2-CF_3-苯基
14	2	2-OH-苯基	102	2	2-CF_3-苯基
15	3	2-OH-苯基	103	3	2-CF_3-苯基
16	4	2-OH-苯基	104	4	2-CF_3-苯基
17	1	4-OMe-苯基	105	1	4-iPr-苯基
18	2	4-OMe-苯基	106	2	4-iPr-苯基
19	3	4-OMe-苯基	107	3	4-iPr-苯基
20	4	4-OMe-苯基	108	4	4-iPr-苯基
21	1	3-OMe-苯基	109	1	3-iPr-苯基
22	2	3-OMe-苯基	110	2	3-iPr-苯基
23	3	3-OMe-苯基	111	3	3-iPr-苯基
24	4	3-OMe-苯基	112	4	3-iPr-苯基
25	1	2-OMe-苯基	113	1	2-iPr-苯基
26	2	2-OMe-苯基	114	2	2-iPr-苯基
27	3	2-OMe-苯基	115	3	2-iPr-苯基
28	4	2-OMe-苯基	116	4	2-iPr-苯基
29	1	4-CN-苯基	117	1	4-NH_2-苯基
30	2	4-CN-苯基	118	2	4-NH_2-苯基
31	3	4-CN-苯基	119	3	4-NH_2-苯基
32	4	4-CN-苯基	120	4	4-NH_2-苯基
33	1	3-CN-苯基	121	1	3-NH_2-苯基
34	2	3-CN-苯基	122	2	3-NH_2-苯基
35	3	3-CN-苯基	123	3	3-NH_2-苯基
36	4	3-CN-苯基	124	4	3-NH_2-苯基

[2705]

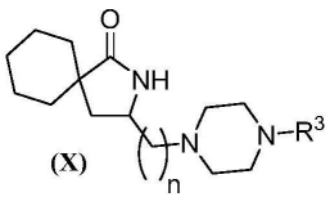
37	1	2-CN-苯基	125	1	2-NH_2-苯基
38	2	2-CN-苯基	126	2	2-NH_2-苯基
39	3	2-CN-苯基	127	3	2-NH_2-苯基
40	4	2-CN-苯基	128	4	2-NH_2-苯基
41	1	4-Me-苯基	129	1	2,3-二-Me-苯基
42	2	4-Me-苯基	130	2	2,3-二-Me-苯基
43	3	4-Me-苯基	131	3	2,3-二-Me-苯基
44	4	4-Me-苯基	132	4	2,3-二-Me-苯基
45	1	3-Me-苯基	133	1	2,4-二-Me-苯基
46	2	3-Me-苯基	134	2	2,4-二-Me-苯基
47	3	3-Me-苯基	135	3	2,4-二-Me-苯基
48	4	3-Me-苯基	136	4	2,4-二-Me-苯基
49	1	2-Me-苯基	137	1	2,5-二-Me-苯基
50	2	2-Me-苯基	138	2	2,5-二-Me-苯基
51	3	2-Me-苯基	139	3	2,5-二-Me-苯基
52	4	2-Me-苯基	140	4	2,5-二-Me-苯基
53	1	4-F-苯基	141	1	2,6-二-Me-苯基
54	2	4-F-苯基	142	2	2,6-二-Me-苯基
55	3	4-F-苯基	143	3	2,6-二-Me-苯基
56	4	4-F-苯基	144	4	2,6-二-Me-苯基
57	1	3-F-苯基	145	1	2,6-二-iPr-苯基
58	2	3-F-苯基	146	2	2,6-二-iPr-苯基
59	3	3-F-苯基	147	3	2,6-二-iPr-苯基
60	4	3-F-苯基	148	4	2,6-二-iPr-苯基
61	1	2-F-苯基	149	1	2-吗啉代-苯基
62	2	2-F-苯基	150	2	2-吗啉代-苯基
63	3	2-F-苯基	151	3	2-吗啉代-苯基

64	4	2-F-苯基	152	4	2-吗啉代-苯基
65	1	4-Cl-苯基	153	1	3-吗啉代-苯基
66	2	4-Cl-苯基	154	2	3-吗啉代-苯基
67	3	4-Cl-苯基	155	3	3-吗啉代-苯基
68	4	4-Cl-苯基	156	4	3-吗啉代-苯基
69	1	3-Cl-苯基	157	1	4-吗啉代-苯基
70	2	3-Cl-苯基	158	2	4-吗啉代-苯基
71	3	3-Cl-苯基	159	3	4-吗啉代-苯基
72	4	3-Cl-苯基	160	4	4-吗啉代-苯基
73	1	2-Cl-苯基	161	1	4-CN-2-吗啉代-苯基
74	2	2-Cl-苯基	162	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
75	3	2-Cl-苯基	163	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
76	4	2-Cl-苯基	164	4	4-CN-2-吗啉代-苯基
77	1	4-Br-苯基	165	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
78	2	4-Br-苯基	166	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
79	3	4-Br-苯基	167	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
80	4	4-Br-苯基	168	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
81	1	3-Br-苯基	169	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
82	2	3-Br-苯基	170	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
83	3	3-Br-苯基	171	3	4-OH-2-吗啉代-苯基
84	4	3-Br-苯基	172	4	4-OH-2-吗啉代-苯基
85	1	亚萘-1-基	173	1	亚萘-2-基
86	2	亚萘-1-基	174	2	亚萘-2-基
87	3	亚萘-1-基	175	3	亚萘-2-基
88	4	亚萘-1-基	176	4	亚萘-2-基

[2706]

[2707] 示例性实施方案包括具有式(X)的化合物

[2708]



(X)

[2709] 或其可药用盐形式,如在下文表4中所定义。

[2710] 表4

[2711]

条目	n	R^3	条目	n	R^3
1	1	苯基	89	1	2-Br-苯基
2	2	苯基	90	2	2-Br-苯基
3	3	苯基	91	3	2-Br-苯基
4	4	苯基	92	4	2-Br-苯基
5	1	4-OH-苯基	93	1	4-CF_3-苯基
6	2	4-OH-苯基	94	2	4-CF_3-苯基
7	3	4-OH-苯基	95	3	4-CF_3-苯基
8	4	4-OH-苯基	96	4	4-CF_3-苯基
9	1	3-OH-苯基	97	1	3-CF_3-苯基
10	2	3-OH-苯基	98	2	3-CF_3-苯基
11	3	3-OH-苯基	99	3	3-CF_3-苯基
12	4	3-OH-苯基	100	4	3-CF_3-苯基
13	1	2-OH-苯基	101	1	2-CF_3-苯基
14	2	2-OH-苯基	102	2	2-CF_3-苯基
15	3	2-OH-苯基	103	3	2-CF_3-苯基
16	4	2-OH-苯基	104	4	2-CF_3-苯基
17	1	4-OMe-苯基	105	1	4-iPr-苯基
18	2	4-OMe-苯基	106	2	4-iPr-苯基
19	3	4-OMe-苯基	107	3	4-iPr-苯基
20	4	4-OMe-苯基	108	4	4-iPr-苯基
21	1	3-OMe-苯基	109	1	3-iPr-苯基
22	2	3-OMe-苯基	110	2	3-iPr-苯基

[2712]

23	3	3-OMe-苯基	111	3	3-iPr-苯基
24	4	3-OMe-苯基	112	4	3-iPr-苯基
25	1	2-OMe-苯基	113	1	2-iPr-苯基
26	2	2-OMe-苯基	114	2	2-iPr-苯基
27	3	2-OMe-苯基	115	3	2-iPr-苯基
28	4	2-OMe-苯基	116	4	2-iPr-苯基
29	1	4-CN-苯基	117	1	4-NH_2-苯基
30	2	4-CN-苯基	118	2	4-NH_2-苯基
31	3	4-CN-苯基	119	3	4-NH_2-苯基
32	4	4-CN-苯基	120	4	4-NH_2-苯基
33	1	3-CN-苯基	121	1	3-NH_2-苯基
34	2	3-CN-苯基	122	2	3-NH_2-苯基
35	3	3-CN-苯基	123	3	3-NH_2-苯基
36	4	3-CN-苯基	124	4	3-NH_2-苯基
37	1	2-CN-苯基	125	1	2-NH_2-苯基
38	2	2-CN-苯基	126	2	2-NH_2-苯基
39	3	2-CN-苯基	127	3	2-NH_2-苯基
40	4	2-CN-苯基	128	4	2-NH_2-苯基
41	1	4-Me-苯基	129	1	2,3-二-Me-苯基
42	2	4-Me-苯基	130	2	2,3-二-Me-苯基
43	3	4-Me-苯基	131	3	2,3-二-Me-苯基
44	4	4-Me-苯基	132	4	2,3-二-Me-苯基
45	1	3-Me-苯基	133	1	2,4-二-Me-苯基
46	2	3-Me-苯基	134	2	2,4-二-Me-苯基
47	3	3-Me-苯基	135	3	2,4-二-Me-苯基
48	4	3-Me-苯基	136	4	2,4-二-Me-苯基
49	1	2-Me-苯基	137	1	2,5-二-Me-苯基

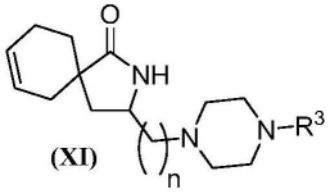
[2713]

50	2	2-Me-苯基	138	2	2,5-二-Me-苯基
51	3	2-Me-苯基	139	3	2,5-二-Me-苯基
52	4	2-Me-苯基	140	4	2,5-二-Me-苯基
53	1	4-F-苯基	141	1	2,6-二-Me-苯基
54	2	4-F-苯基	142	2	2,6-二-Me-苯基
55	3	4-F-苯基	143	3	2,6-二-Me-苯基
56	4	4-F-苯基	144	4	2,6-二-Me-苯基
57	1	3-F-苯基	145	1	2,6-二-iPr-苯基
58	2	3-F-苯基	146	2	2,6-二-iPr-苯基
59	3	3-F-苯基	147	3	2,6-二-iPr-苯基
60	4	3-F-苯基	148	4	2,6-二-iPr-苯基
61	1	2-F-苯基	149	1	2-吗啉代-苯基
62	2	2-F-苯基	150	2	2-吗啉代-苯基
63	3	2-F-苯基	151	3	2-吗啉代-苯基
64	4	2-F-苯基	152	4	2-吗啉代-苯基
65	1	4-Cl-苯基	153	1	3-吗啉代-苯基
66	2	4-Cl-苯基	154	2	3-吗啉代-苯基
67	3	4-Cl-苯基	155	3	3-吗啉代-苯基
68	4	4-Cl-苯基	156	4	3-吗啉代-苯基
69	1	3-Cl-苯基	157	1	4-吗啉代-苯基
70	2	3-Cl-苯基	158	2	4-吗啉代-苯基
71	3	3-Cl-苯基	159	3	4-吗啉代-苯基
72	4	3-Cl-苯基	160	4	4-吗啉代-苯基
73	1	2-Cl-苯基	161	1	4-CN-2-吗啉代-苯基
74	2	2-Cl-苯基	162	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
75	3	2-Cl-苯基	163	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
76	4	2-Cl-苯基	164	4	4-CN-2-吗啉代-苯基

[2714]

77	1	4-Br-苯基	165	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
78	2	4-Br-苯基	166	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
79	3	4-Br-苯基	167	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
80	4	4-Br-苯基	168	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
81	1	3-Br-苯基	169	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
82	2	3-Br-苯基	170	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
83	3	3-Br-苯基	171	3	4-OH-2-吗啉代-苯基
84	4	3-Br-苯基	172	4	4-OH-2-吗啉代-苯基
85	1	亚萘-1-基	173	1	亚萘-2-基
86	2	亚萘-1-基	174	2	亚萘-2-基
87	3	亚萘-1-基	175	3	亚萘-2-基
88	4	亚萘-1-基	176	4	亚萘-2-基

[2715] 示例性实施方案包括具有式(XI)的化合物

[2716] 

(XI)

[2717] 或其可药用盐形式,如在下文表5中所定义。

[2718] 表5

[2719]

条目	n	R^3	条目	n	R^3
1	1	苯基	85	1	2-Br-苯基
2	2	苯基	86	2	2-Br-苯基
3	3	苯基	87	3	2-Br-苯基
4	4	苯基	88	4	2-Br-苯基
5	1	4-OH-苯基	89	1	4-CF_3-苯基
6	2	4-OH-苯基	90	2	4-CF_3-苯基
7	3	4-OH-苯基	91	3	4-CF_3-苯基
8	4	4-OH-苯基	92	4	4-CF_3-苯基
9	1	3-OH-苯基	93	1	3-CF_3-苯基

[2720]

10	2	3-OH-苯基	94	2	3-CF_3-苯基
11	3	3-OH-苯基	95	3	3-CF_3-苯基
12	4	3-OH-苯基	96	4	3-CF_3-苯基
13	1	2-OH-苯基	97	1	2-CF_3-苯基
14	2	2-OH-苯基	98	2	2-CF_3-苯基
15	3	2-OH-苯基	99	3	2-CF_3-苯基
16	4	2-OH-苯基	100	4	2-CF_3-苯基
17	1	4-OMe-苯基	101	1	4-iPr-苯基
18	2	4-OMe-苯基	102	2	4-iPr-苯基
19	3	4-OMe-苯基	103	3	4-iPr-苯基
20	4	4-OMe-苯基	104	4	4-iPr-苯基
21	1	3-OMe-苯基	105	1	3-iPr-苯基
22	2	3-OMe-苯基	106	2	3-iPr-苯基
23	3	3-OMe-苯基	107	3	3-iPr-苯基
24	4	3-OMe-苯基	108	4	3-iPr-苯基
25	1	2-OMe-苯基	109	1	2-iPr-苯基
26	2	2-OMe-苯基	110	2	2-iPr-苯基
27	3	2-OMe-苯基	111	3	2-iPr-苯基
28	4	2-OMe-苯基	112	4	2-iPr-苯基
29	1	4-CN-苯基	113	1	4-NH_2-苯基
30	2	4-CN-苯基	114	2	4-NH_2-苯基
31	3	4-CN-苯基	115	3	4-NH_2-苯基
32	4	4-CN-苯基	116	4	4-NH_2-苯基
33	1	3-CN-苯基	117	1	3-NH_2-苯基
34	2	3-CN-苯基	118	2	3-NH_2-苯基
35	3	3-CN-苯基	119	3	3-NH_2-苯基
36	4	3-CN-苯基	120	4	3-NH_2-苯基

[2721]

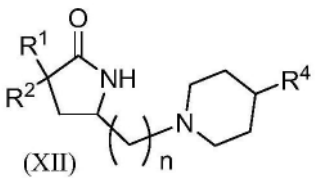
37	1	2-CN-苯基	121	1	2-NH_2-苯基
38	2	2-CN-苯基	122	2	2-NH_2-苯基
39	3	2-CN-苯基	123	3	2-NH_2-苯基
40	4	2-CN-苯基	124	4	2-NH_2-苯基
41	1	4-Me-苯基	125	1	2,3-二-Me-苯基
42	2	4-Me-苯基	126	2	2,3-二-Me-苯基
43	3	4-Me-苯基	127	3	2,3-二-Me-苯基
44	4	4-Me-苯基	128	4	2,3-二-Me-苯基
45	1	3-Me-苯基	129	1	2,4-二-Me-苯基
46	2	3-Me-苯基	130	2	2,4-二-Me-苯基
47	3	3-Me-苯基	131	3	2,4-二-Me-苯基
48	4	3-Me-苯基	132	4	2,4-二-Me-苯基
49	1	2-Me-苯基	133	1	2,5-二-Me-苯基
50	2	2-Me-苯基	134	2	2,5-二-Me-苯基
51	3	2-Me-苯基	135	3	2,5-二-Me-苯基
52	4	2-Me-苯基	136	4	2,5-二-Me-苯基
53	1	4-F-苯基	137	1	2,6-二-Me-苯基
54	2	4-F-苯基	138	2	2,6-二-Me-苯基
55	3	4-F-苯基	139	3	2,6-二-Me-苯基
56	4	4-F-苯基	140	4	2,6-二-Me-苯基
57	1	3-F-苯基	141	1	2,6-二-iPr-苯基
58	2	3-F-苯基	142	2	2,6-二-iPr-苯基
59	3	3-F-苯基	143	3	2,6-二-iPr-苯基
60	4	3-F-苯基	144	4	2,6-二-iPr-苯基
61	1	2-F-苯基	145	1	2-吗啉代-苯基
62	2	2-F-苯基	146	2	2-吗啉代-苯基
63	3	2-F-苯基	147	3	2-吗啉代-苯基

[2722]

64	4	2-F-苯基	148	4	2-吗啉代-苯基
65	1	4-Cl-苯基	149	1	3-吗啉代-苯基
66	2	4-Cl-苯基	150	2	3-吗啉代-苯基
67	3	4-Cl-苯基	151	3	3-吗啉代-苯基
68	4	4-Cl-苯基	152	4	3-吗啉代-苯基
69	1	3-Cl-苯基	153	1	4-吗啉代-苯基
70	2	3-Cl-苯基	154	2	4-吗啉代-苯基
71	3	3-Cl-苯基	155	3	4-吗啉代-苯基
72	4	3-Cl-苯基	156	4	4-吗啉代-苯基
73	1	2-Cl-苯基	157	1	4-CN-2-吗啉代-苯基
74	2	2-Cl-苯基	158	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
75	3	2-Cl-苯基	159	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
76	4	2-Cl-苯基	160	4	4-CN-2-吗啉代-苯基
77	1	4-Br-苯基	161	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
78	2	4-Br-苯基	162	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
79	3	4-Br-苯基	163	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
80	4	4-Br-苯基	164	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
81	1	3-Br-苯基	165	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
82	2	3-Br-苯基	166	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
83	3	3-Br-苯基	167	3	4-OH-2-吗啉代-苯基
84	4	3-Br-苯基	168	4	4-OH-2-吗啉代-苯基
85	1	亚萘-1-基	173	1	亚萘-2-基
86	2	亚萘-1-基	174	2	亚萘-2-基
87	3	亚萘-1-基	175	3	亚萘-2-基
88	4	亚萘-1-基	176	4	亚萘-2-基

[2723] 示例性实施方案包括具有式(XII)的化合物

[2724]



(XII)

[2725] 或其可药用盐形式,如在下文表6中所定义。

[2726] 表6:

[2727]

条目	R^1	R^2	n	R^4	条目	R^1	R^2	n	R^4
1	甲基	甲基	1	苯基	177	乙基	乙基	1	苯基
2	甲基	甲基	2	苯基	178	乙基	乙基	2	苯基
3	甲基	甲基	3	苯基	179	乙基	乙基	3	苯基
4	甲基	甲基	4	苯基	180	乙基	乙基	4	苯基
5	甲基	甲基	1	4-OH-苯基	181	乙基	乙基	1	4-OH-苯基
6	甲基	甲基	2	4-OH-苯基	182	乙基	乙基	2	4-OH-苯基
7	甲基	甲基	3	4-OH-苯基	183	乙基	乙基	3	4-OH-苯基
8	甲基	甲基	4	4-OH-苯基	184	乙基	乙基	4	4-OH-苯基
9	甲基	甲基	1	3-OH-苯基	185	乙基	乙基	1	3-OH-苯基
10	甲基	甲基	2	3-OH-苯基	186	乙基	乙基	2	3-OH-苯基
11	甲基	甲基	3	3-OH-苯基	187	乙基	乙基	3	3-OH-苯基
12	甲基	甲基	4	3-OH-苯基	188	乙基	乙基	4	3-OH-苯基
13	甲基	甲基	1	2-OH-苯基	189	乙基	乙基	1	2-OH-苯基
14	甲基	甲基	2	2-OH-苯基	190	乙基	乙基	2	2-OH-苯基
15	甲基	甲基	3	2-OH-苯基	191	乙基	乙基	3	2-OH-苯基
16	甲基	甲基	4	2-OH-苯基	192	乙基	乙基	4	2-OH-苯基
17	甲基	甲基	1	4-OMe-苯基	193	乙基	乙基	1	4-OMe-苯基
18	甲基	甲基	2	4-OMe-苯基	194	乙基	乙基	2	4-OMe-苯基
19	甲基	甲基	3	4-OMe-苯基	195	乙基	乙基	3	4-OMe-苯基
20	甲基	甲基	4	4-OMe-苯基	196	乙基	乙基	4	4-OMe-苯基
21	甲基	甲基	1	3-OMe-苯基	197	乙基	乙基	1	3-OMe-苯基
22	甲基	甲基	2	3-OMe-苯基	198	乙基	乙基	2	3-OMe-苯基

[2728]

23	甲基	甲基	3	3-OMe-苯基	199	乙基	乙基	3	3-OMe-苯基
24	甲基	甲基	4	3-OMe-苯基	200	乙基	乙基	4	3-OMe-苯基
25	甲基	甲基	1	2-OMe-苯基	201	乙基	乙基	1	2-OMe-苯基
26	甲基	甲基	2	2-OMe-苯基	202	乙基	乙基	2	2-OMe-苯基
27	甲基	甲基	3	2-OMe-苯基	203	乙基	乙基	3	2-OMe-苯基
28	甲基	甲基	4	2-OMe-苯基	204	乙基	乙基	4	2-OMe-苯基
29	甲基	甲基	1	4-CN-苯基	205	乙基	乙基	1	4-CN-苯基
30	甲基	甲基	2	4-CN-苯基	206	乙基	乙基	2	4-CN-苯基
31	甲基	甲基	3	4-CN-苯基	207	乙基	乙基	3	4-CN-苯基
32	甲基	甲基	4	4-CN-苯基	208	乙基	乙基	4	4-CN-苯基
33	甲基	甲基	1	3-CN-苯基	209	乙基	乙基	1	3-CN-苯基
34	甲基	甲基	2	3-CN-苯基	210	乙基	乙基	2	3-CN-苯基
35	甲基	甲基	3	3-CN-苯基	211	乙基	乙基	3	3-CN-苯基
36	甲基	甲基	4	3-CN-苯基	212	乙基	乙基	4	3-CN-苯基
37	甲基	甲基	1	2-CN-苯基	213	乙基	乙基	1	2-CN-苯基
38	甲基	甲基	2	2-CN-苯基	214	乙基	乙基	2	2-CN-苯基
39	甲基	甲基	3	2-CN-苯基	215	乙基	乙基	3	2-CN-苯基
40	甲基	甲基	4	2-CN-苯基	216	乙基	乙基	4	2-CN-苯基
41	甲基	甲基	1	4-Me-苯基	217	乙基	乙基	1	4-Me-苯基
42	甲基	甲基	2	4-Me-苯基	218	乙基	乙基	2	4-Me-苯基
43	甲基	甲基	3	4-Me-苯基	219	乙基	乙基	3	4-Me-苯基
44	甲基	甲基	4	4-Me-苯基	220	乙基	乙基	4	4-Me-苯基
45	甲基	甲基	1	3-Me-苯基	221	乙基	乙基	1	3-Me-苯基
46	甲基	甲基	2	3-Me-苯基	222	乙基	乙基	2	3-Me-苯基
47	甲基	甲基	3	3-Me-苯基	223	乙基	乙基	3	3-Me-苯基
48	甲基	甲基	4	3-Me-苯基	224	乙基	乙基	4	3-Me-苯基
49	甲基	甲基	1	2-Me-苯基	225	乙基	乙基	1	2-Me-苯基

[2729]

50	甲基	甲基	2	2-Me-苯基	226	乙基	乙基	2	2-Me-苯基
51	甲基	甲基	3	2-Me-苯基	227	乙基	乙基	3	2-Me-苯基
52	甲基	甲基	4	2-Me-苯基	228	乙基	乙基	4	2-Me-苯基
53	甲基	甲基	1	4-F-苯基	229	乙基	乙基	1	4-F-苯基
54	甲基	甲基	2	4-F-苯基	230	乙基	乙基	2	4-F-苯基
55	甲基	甲基	3	4-F-苯基	231	乙基	乙基	3	4-F-苯基
56	甲基	甲基	4	4-F-苯基	232	乙基	乙基	4	4-F-苯基
57	甲基	甲基	1	3-F-苯基	233	乙基	乙基	1	3-F-苯基
58	甲基	甲基	2	3-F-苯基	234	乙基	乙基	2	3-F-苯基
59	甲基	甲基	3	3-F-苯基	235	乙基	乙基	3	3-F-苯基
60	甲基	甲基	4	3-F-苯基	236	乙基	乙基	4	3-F-苯基
61	甲基	甲基	1	2-F-苯基	237	乙基	乙基	1	2-F-苯基
62	甲基	甲基	2	2-F-苯基	238	乙基	乙基	2	2-F-苯基
63	甲基	甲基	3	2-F-苯基	239	乙基	乙基	3	2-F-苯基
64	甲基	甲基	4	2-F-苯基	240	乙基	乙基	4	2-F-苯基
65	甲基	甲基	1	4-Cl-苯基	241	乙基	乙基	1	4-Cl-苯基
66	甲基	甲基	2	4-Cl-苯基	242	乙基	乙基	2	4-Cl-苯基
67	甲基	甲基	3	4-Cl-苯基	243	乙基	乙基	3	4-Cl-苯基
68	甲基	甲基	4	4-Cl-苯基	244	乙基	乙基	4	4-Cl-苯基
69	甲基	甲基	1	3-Cl-苯基	245	乙基	乙基	1	3-Cl-苯基
70	甲基	甲基	2	3-Cl-苯基	246	乙基	乙基	2	3-Cl-苯基
71	甲基	甲基	3	3-Cl-苯基	247	乙基	乙基	3	3-Cl-苯基
72	甲基	甲基	4	3-Cl-苯基	248	乙基	乙基	4	3-Cl-苯基
73	甲基	甲基	1	2-Cl-苯基	249	乙基	乙基	1	2-Cl-苯基
74	甲基	甲基	2	2-Cl-苯基	250	乙基	乙基	2	2-Cl-苯基
75	甲基	甲基	3	2-Cl-苯基	251	乙基	乙基	3	2-Cl-苯基
76	甲基	甲基	4	2-Cl-苯基	252	乙基	乙基	4	2-Cl-苯基

[2730]

77	甲基	甲基	1	4-Br-苯基	253	乙基	乙基	1	4-Br-苯基
78	甲基	甲基	2	4-Br-苯基	254	乙基	乙基	2	4-Br-苯基
79	甲基	甲基	3	4-Br-苯基	255	乙基	乙基	3	4-Br-苯基
80	甲基	甲基	4	4-Br-苯基	256	乙基	乙基	4	4-Br-苯基
81	甲基	甲基	1	3-Br-苯基	257	乙基	乙基	1	3-Br-苯基
82	甲基	甲基	2	3-Br-苯基	258	乙基	乙基	2	3-Br-苯基
83	甲基	甲基	3	3-Br-苯基	259	乙基	乙基	3	3-Br-苯基
84	甲基	甲基	4	3-Br-苯基	260	乙基	乙基	4	3-Br-苯基
85	甲基	甲基	1	2-Br-苯基	261	乙基	乙基	1	2-Br-苯基
86	甲基	甲基	2	2-Br-苯基	262	乙基	乙基	2	2-Br-苯基
87	甲基	甲基	3	2-Br-苯基	263	乙基	乙基	3	2-Br-苯基
88	甲基	甲基	4	2-Br-苯基	264	乙基	乙基	4	2-Br-苯基
89	甲基	甲基	1	4-CF_3-苯基	265	乙基	乙基	1	4-CF_3-苯基
90	甲基	甲基	2	4-CF_3-苯基	266	乙基	乙基	2	4-CF_3-苯基
91	甲基	甲基	3	4-CF_3-苯基	267	乙基	乙基	3	4-CF_3-苯基
92	甲基	甲基	4	4-CF_3-苯基	268	乙基	乙基	4	4-CF_3-苯基
93	甲基	甲基	1	3-CF_3-苯基	269	乙基	乙基	1	3-CF_3-苯基
94	甲基	甲基	2	3-CF_3-苯基	270	乙基	乙基	2	3-CF_3-苯基
95	甲基	甲基	3	3-CF_3-苯基	271	乙基	乙基	3	3-CF_3-苯基
96	甲基	甲基	4	3-CF_3-苯基	272	乙基	乙基	4	3-CF_3-苯基
97	甲基	甲基	1	2-CF_3-苯基	273	乙基	乙基	1	2-CF_3-苯基
98	甲基	甲基	2	2-CF_3-苯基	274	乙基	乙基	2	2-CF_3-苯基
99	甲基	甲基	3	2-CF_3-苯基	275	乙基	乙基	3	2-CF_3-苯基
100	甲基	甲基	4	2-CF_3-苯基	276	乙基	乙基	4	2-CF_3-苯基
101	甲基	甲基	1	4-iPr-苯基	277	乙基	乙基	1	4-iPr-苯基
102	甲基	甲基	2	4-iPr-苯基	278	乙基	乙基	2	4-iPr-苯基
103	甲基	甲基	3	4-iPr-苯基	279	乙基	乙基	3	4-iPr-苯基

[2731]

104	甲基	甲基	4	4-iPr-苯基	280	乙基	乙基	4	4-iPr-苯基
105	甲基	甲基	1	3-iPr-苯基	281	乙基	乙基	1	3-iPr-苯基
106	甲基	甲基	2	3-iPr-苯基	282	乙基	乙基	2	3-iPr-苯基
107	甲基	甲基	3	3-iPr-苯基	283	乙基	乙基	3	3-iPr-苯基
108	甲基	甲基	4	3-iPr-苯基	284	乙基	乙基	4	3-iPr-苯基
109	甲基	甲基	1	2-iPr-苯基	285	乙基	乙基	1	2-iPr-苯基
110	甲基	甲基	2	2-iPr-苯基	286	乙基	乙基	2	2-iPr-苯基
111	甲基	甲基	3	2-iPr-苯基	287	乙基	乙基	3	2-iPr-苯基
112	甲基	甲基	4	2-iPr-苯基	288	乙基	乙基	4	2-iPr-苯基
113	甲基	甲基	1	4-NH_2-苯基	289	乙基	乙基	1	4-NH_2-苯基
114	甲基	甲基	2	4-NH_2-苯基	290	乙基	乙基	2	4-NH_2-苯基
115	甲基	甲基	3	4-NH_2-苯基	291	乙基	乙基	3	4-NH_2-苯基
116	甲基	甲基	4	4-NH_2-苯基	292	乙基	乙基	4	4-NH_2-苯基
117	甲基	甲基	1	3-NH_2-苯基	293	乙基	乙基	1	3-NH_2-苯基
118	甲基	甲基	2	3-NH_2-苯基	294	乙基	乙基	2	3-NH_2-苯基
119	甲基	甲基	3	3-NH_2-苯基	295	乙基	乙基	3	3-NH_2-苯基
120	甲基	甲基	4	3-NH_2-苯基	296	乙基	乙基	4	3-NH_2-苯基
121	甲基	甲基	1	2-NH_2-苯基	297	乙基	乙基	1	2-NH_2-苯基
122	甲基	甲基	2	2-NH_2-苯基	298	乙基	乙基	2	2-NH_2-苯基
123	甲基	甲基	3	2-NH_2-苯基	299	乙基	乙基	3	2-NH_2-苯基
124	甲基	甲基	4	2-NH_2-苯基	300	乙基	乙基	4	2-NH_2-苯基
125	甲基	甲基	1	2,3-二-Me-苯基	301	乙基	乙基	1	2,3-二-Me-苯基
126	甲基	甲基	2	2,3-二-Me-苯基	302	乙基	乙基	2	2,3-二-Me-苯基
127	甲基	甲基	3	2,3-二-Me-苯基	303	乙基	乙基	3	2,3-二-Me-苯基
128	甲基	甲基	4	2,3-二-Me-苯基	304	乙基	乙基	4	2,3-二-Me-苯基
129	甲基	甲基	1	2,4-二-Me-苯基	305	乙基	乙基	1	2,4-二-Me-苯基
130	甲基	甲基	2	2,4-二-Me-苯基	306	乙基	乙基	2	2,4-二-Me-苯基

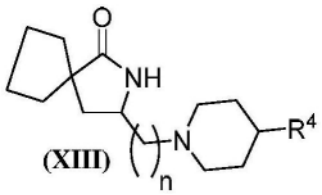
[2732]

131	甲基	甲基	3	2,4-二-Me-苯基	307	乙基	乙基	3	2,4-二-Me-苯基
132	甲基	甲基	4	2,4-二-Me-苯基	308	乙基	乙基	4	2,4-二-Me-苯基
133	甲基	甲基	1	2,5-二-Me-苯基	309	乙基	乙基	1	2,5-二-Me-苯基
134	甲基	甲基	2	2,5-二-Me-苯基	310	乙基	乙基	2	2,5-二-Me-苯基
135	甲基	甲基	3	2,5-二-Me-苯基	311	乙基	乙基	3	2,5-二-Me-苯基
136	甲基	甲基	4	2,5-二-Me-苯基	312	乙基	乙基	4	2,5-二-Me-苯基
137	甲基	甲基	1	2,6-二-Me-苯基	313	乙基	乙基	1	2,6-二-Me-苯基
138	甲基	甲基	2	2,6-二-Me-苯基	314	乙基	乙基	2	2,6-二-Me-苯基
139	甲基	甲基	3	2,6-二-Me-苯基	315	乙基	乙基	3	2,6-二-Me-苯基
140	甲基	甲基	4	2,6-二-Me-苯基	316	乙基	乙基	4	2,6-二-Me-苯基
141	甲基	甲基	1	2,6-二-iPr-苯基	317	乙基	乙基	1	2,6-二-iPr-苯基
142	甲基	甲基	2	2,6-二-iPr-苯基	318	乙基	乙基	2	2,6-二-iPr-苯基
143	甲基	甲基	3	2,6-二-iPr-苯基	319	乙基	乙基	3	2,6-二-iPr-苯基
144	甲基	甲基	4	2,6-二-iPr-苯基	320	乙基	乙基	4	2,6-二-iPr-苯基
145	甲基	甲基	1	2-吗啉代-苯基	321	乙基	乙基	1	2-吗啉代-苯基
146	甲基	甲基	2	2-吗啉代-苯基	322	乙基	乙基	2	2-吗啉代-苯基
147	甲基	甲基	3	2-吗啉代-苯基	323	乙基	乙基	3	2-吗啉代-苯基
148	甲基	甲基	4	2-吗啉代-苯基	324	乙基	乙基	4	2-吗啉代-苯基
149	甲基	甲基	1	3-吗啉代-苯基	325	乙基	乙基	1	3-吗啉代-苯基
150	甲基	甲基	2	3-吗啉代-苯基	326	乙基	乙基	2	3-吗啉代-苯基
151	甲基	甲基	3	3-吗啉代-苯基	327	乙基	乙基	3	3-吗啉代-苯基
152	甲基	甲基	4	3-吗啉代-苯基	328	乙基	乙基	4	3-吗啉代-苯基
153	甲基	甲基	1	4-吗啉代-苯基	329	乙基	乙基	1	4-吗啉代-苯基
154	甲基	甲基	2	4-吗啉代-苯基	330	乙基	乙基	2	4-吗啉代-苯基
155	甲基	甲基	3	4-吗啉代-苯基	331	乙基	乙基	3	4-吗啉代-苯基
156	甲基	甲基	4	4-吗啉代-苯基	332	乙基	乙基	4	4-吗啉代-苯基
157	甲基	甲基	1	4-CN-2-吗啉代-苯基	333	乙基	乙基	1	4-CN-2-吗啉代-苯基

[2733]

158	甲基	甲基	2	4-CN-2-吗啉代-苯基	334	乙基	乙基	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
159	甲基	甲基	3	4-CN-2-吗啉代-苯基	335	乙基	乙基	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
160	甲基	甲基	4	4-CN-2-吗啉代-苯基	336	乙基	乙基	4	4-CN-2-吗啉代-苯基
161	甲基	甲基	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基	337	乙基	乙基	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
162	甲基	甲基	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基	338	乙基	乙基	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
163	甲基	甲基	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基	339	乙基	乙基	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
164	甲基	甲基	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基	340	乙基	乙基	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
165	甲基	甲基	1	4-OH-2-吗啉代-苯基	341	乙基	乙基	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
166	甲基	甲基	2	4-OH-2-吗啉代-苯基	342	乙基	乙基	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
167	甲基	甲基	3	4-OH-2-吗啉代-苯基	343	乙基	乙基	3	4-OH-2-吗啉代-苯基
168	甲基	甲基	4	4-OH-2-吗啉代-苯基	344	乙基	乙基	4	4-OH-2-吗啉代-苯基
169	甲基	甲基	1	亚萘-1-基	345	乙基	乙基	1	亚萘-1-基
170	甲基	甲基	2	亚萘-1-基	346	乙基	乙基	2	亚萘-1-基
171	甲基	甲基	3	亚萘-1-基	347	乙基	乙基	3	亚萘-1-基
172	甲基	甲基	4	亚萘-1-基	348	乙基	乙基	4	亚萘-2-基
173	甲基	甲基	1	亚萘-2-基	349	乙基	乙基	1	亚萘-2-基
174	甲基	甲基	2	亚萘-2-基	350	乙基	乙基	2	亚萘-2-基
175	甲基	甲基	3	亚萘-2-基	351	乙基	乙基	3	亚萘-2-基
176	甲基	甲基	4	亚萘-2-基	352	乙基	乙基	4	亚萘-2-基

[2734] 示例性实施方案包括具有式(XIII)的化合物

[2735] 

(XIII)

[2736] 或其可药用盐形式,如在下文表7中所定义

[2737] 表7:

[2738]

条目	n	R^4	条目	n	R^4
1	1	苯基	85	1	2-Br-苯基
2	2	苯基	86	2	2-Br-苯基

[2739]

3	3	苯基	87	3	2-Br-苯基
4	4	苯基	88	4	2-Br-苯基
5	1	4-OH-苯基	89	1	4-CF_3-苯基
6	2	4-OH-苯基	90	2	4-CF_3-苯基
7	3	4-OH-苯基	91	3	4-CF_3-苯基
8	4	4-OH-苯基	92	4	4-CF_3-苯基
9	1	3-OH-苯基	93	1	3-CF_3-苯基
10	2	3-OH-苯基	94	2	3-CF_3-苯基
11	3	3-OH-苯基	95	3	3-CF_3-苯基
12	4	3-OH-苯基	96	4	3-CF_3-苯基
13	1	2-OH-苯基	97	1	2-CF_3-苯基
14	2	2-OH-苯基	98	2	2-CF_3-苯基
15	3	2-OH-苯基	99	3	2-CF_3-苯基
16	4	2-OH-苯基	100	4	2-CF_3-苯基
17	1	4-OMe-苯基	101	1	4-iPr-苯基
18	2	4-OMe-苯基	102	2	4-iPr-苯基
19	3	4-OMe-苯基	103	3	4-iPr-苯基
20	4	4-OMe-苯基	104	4	4-iPr-苯基
21	1	3-OMe-苯基	105	1	3-iPr-苯基
22	2	3-OMe-苯基	106	2	3-iPr-苯基
23	3	3-OMe-苯基	107	3	3-iPr-苯基
24	4	3-OMe-苯基	108	4	3-iPr-苯基
25	1	2-OMe-苯基	109	1	2-iPr-苯基
26	2	2-OMe-苯基	110	2	2-iPr-苯基
27	3	2-OMe-苯基	111	3	2-iPr-苯基
28	4	2-OMe-苯基	112	4	2-iPr-苯基
29	1	4-CN-苯基	113	1	4-NH_2-苯基

[2740]

30	2	4-CN-苯基	114	2	4-NH_2-苯基
31	3	4-CN-苯基	115	3	4-NH_2-苯基
32	4	4-CN-苯基	116	4	4-NH_2-苯基
33	1	3-CN-苯基	117	1	3-NH_2-苯基
34	2	3-CN-苯基	118	2	3-NH_2-苯基
35	3	3-CN-苯基	119	3	3-NH_2-苯基
36	4	3-CN-苯基	120	4	3-NH_2-苯基
37	1	2-CN-苯基	121	1	2-NH_2-苯基
38	2	2-CN-苯基	122	2	2-NH_2-苯基
39	3	2-CN-苯基	123	3	2-NH_2-苯基
40	4	2-CN-苯基	124	4	2-NH_2-苯基
41	1	4-Me-苯基	125	1	2,3-二-Me-苯基
42	2	4-Me-苯基	126	2	2,3-二-Me-苯基
43	3	4-Me-苯基	127	3	2,3-二-Me-苯基
44	4	4-Me-苯基	128	4	2,3-二-Me-苯基
45	1	3-Me-苯基	129	1	2,4-二-Me-苯基
46	2	3-Me-苯基	130	2	2,4-二-Me-苯基
47	3	3-Me-苯基	131	3	2,4-二-Me-苯基
48	4	3-Me-苯基	132	4	2,4-二-Me-苯基
49	1	2-Me-苯基	133	1	2,5-二-Me-苯基
50	2	2-Me-苯基	134	2	2,5-二-Me-苯基
51	3	2-Me-苯基	135	3	2,5-二-Me-苯基
52	4	2-Me-苯基	136	4	2,5-二-Me-苯基
53	1	4-F-苯基	137	1	2,6-二-Me-苯基
54	2	4-F-苯基	138	2	2,6-二-Me-苯基
55	3	4-F-苯基	139	3	2,6-二-Me-苯基
56	4	4-F-苯基	140	4	2,6-二-Me-苯基

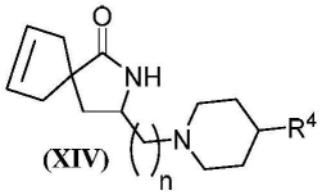
[2741]

57	1	3-F-苯基	141	1	2,6-二-iPr-苯基
58	2	3-F-苯基	142	2	2,6-二-iPr-苯基
59	3	3-F-苯基	143	3	2,6-二-iPr-苯基
60	4	3-F-苯基	144	4	2,6-二-iPr-苯基
61	1	2-F-苯基	145	1	2-吗啉代-苯基
62	2	2-F-苯基	146	2	2-吗啉代-苯基
63	3	2-F-苯基	147	3	2-吗啉代-苯基
64	4	2-F-苯基	148	4	2-吗啉代-苯基
65	1	4-Cl-苯基	149	1	3-吗啉代-苯基
66	2	4-Cl-苯基	150	2	3-吗啉代-苯基
67	3	4-Cl-苯基	151	3	3-吗啉代-苯基
68	4	4-Cl-苯基	152	4	3-吗啉代-苯基
69	1	3-Cl-苯基	153	1	4-吗啉代-苯基
70	2	3-Cl-苯基	154	2	4-吗啉代-苯基
71	3	3-Cl-苯基	155	3	4-吗啉代-苯基
72	4	3-Cl-苯基	156	4	4-吗啉代-苯基
73	1	2-Cl-苯基	157	1	4-CN-2-吗啉代-苯基
74	2	2-Cl-苯基	158	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
75	3	2-Cl-苯基	159	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
76	4	2-Cl-苯基	160	4	4-CN-2-吗啉代-苯基
77	1	4-Br-苯基	161	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
78	2	4-Br-苯基	162	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
79	3	4-Br-苯基	163	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
80	4	4-Br-苯基	164	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
81	1	3-Br-苯基	165	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
82	2	3-Br-苯基	166	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
83	3	3-Br-苯基	167	3	4-OH-2-吗啉代-苯基

[2742]

84	4	3-Br-苯基	168	4	4-OH-2-吗啉代-苯基
85	1	亚萘-1-基	173	1	亚萘-2-基
86	2	亚萘-1-基	174	2	亚萘-2-基
87	3	亚萘-1-基	175	3	亚萘-2-基
88	4	亚萘-1-基	176	4	亚萘-2-基

[2743] 示例性实施方案包括具有式(XIV)的化合物

[2744] 

(XIV)

[2745] 或其可药用盐形式,如在下文表8中所定义。

[2746] 表8:

[2747]

条目	n	R^4	条目	n	R^4
1	1	苯基	85	1	2-Br-苯基
2	2	苯基	86	2	2-Br-苯基
3	3	苯基	87	3	2-Br-苯基
4	4	苯基	88	4	2-Br-苯基
5	1	4-OH-苯基	89	1	4-CF_3-苯基
6	2	4-OH-苯基	90	2	4-CF_3-苯基
7	3	4-OH-苯基	91	3	4-CF_3-苯基
8	4	4-OH-苯基	92	4	4-CF_3-苯基
9	1	3-OH-苯基	93	1	3-CF_3-苯基
10	2	3-OH-苯基	94	2	3-CF_3-苯基
11	3	3-OH-苯基	95	3	3-CF_3-苯基
12	4	3-OH-苯基	96	4	3-CF_3-苯基
13	1	2-OH-苯基	97	1	2-CF_3-苯基
14	2	2-OH-苯基	98	2	2-CF_3-苯基
15	3	2-OH-苯基	99	3	2-CF_3-苯基
16	4	2-OH-苯基	100	4	2-CF_3-苯基

[2748]

17	1	4-OMe-苯基	101	1	4-iPr-苯基
18	2	4-OMe-苯基	102	2	4-iPr-苯基
19	3	4-OMe-苯基	103	3	4-iPr-苯基
20	4	4-OMe-苯基	104	4	4-iPr-苯基
21	1	3-OMe-苯基	105	1	3-iPr-苯基
22	2	3-OMe-苯基	106	2	3-iPr-苯基
23	3	3-OMe-苯基	107	3	3-iPr-苯基
24	4	3-OMe-苯基	108	4	3-iPr-苯基
25	1	2-OMe-苯基	109	1	2-iPr-苯基
26	2	2-OMe-苯基	110	2	2-iPr-苯基
27	3	2-OMe-苯基	111	3	2-iPr-苯基
28	4	2-OMe-苯基	112	4	2-iPr-苯基
29	1	4-CN-苯基	113	1	4-NH_2-苯基
30	2	4-CN-苯基	114	2	4-NH_2-苯基
31	3	4-CN-苯基	115	3	4-NH_2-苯基
32	4	4-CN-苯基	116	4	4-NH_2-苯基
33	1	3-CN-苯基	117	1	3-NH_2-苯基
34	2	3-CN-苯基	118	2	3-NH_2-苯基
35	3	3-CN-苯基	119	3	3-NH_2-苯基
36	4	3-CN-苯基	120	4	3-NH_2-苯基
37	1	2-CN-苯基	121	1	2-NH_2-苯基
38	2	2-CN-苯基	122	2	2-NH_2-苯基
39	3	2-CN-苯基	123	3	2-NH_2-苯基
40	4	2-CN-苯基	124	4	2-NH_2-苯基
41	1	4-Me-苯基	125	1	2,3-二-Me-苯基
42	2	4-Me-苯基	126	2	2,3-二-Me-苯基
43	3	4-Me-苯基	127	3	2,3-二-Me-苯基

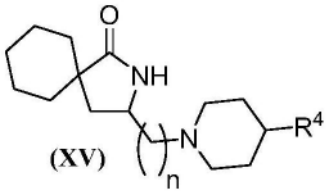
[2749]

44	4	4-Me-苯基	128	4	2,3-二-Me-苯基
45	1	3-Me-苯基	129	1	2,4-二-Me-苯基
46	2	3-Me-苯基	130	2	2,4-二-Me-苯基
47	3	3-Me-苯基	131	3	2,4-二-Me-苯基
48	4	3-Me-苯基	132	4	2,4-二-Me-苯基
49	1	2-Me-苯基	133	1	2,5-二-Me-苯基
50	2	2-Me-苯基	134	2	2,5-二-Me-苯基
51	3	2-Me-苯基	135	3	2,5-二-Me-苯基
52	4	2-Me-苯基	136	4	2,5-二-Me-苯基
53	1	4-F-苯基	137	1	2,6-二-Me-苯基
54	2	4-F-苯基	138	2	2,6-二-Me-苯基
55	3	4-F-苯基	139	3	2,6-二-Me-苯基
56	4	4-F-苯基	140	4	2,6-二-Me-苯基
57	1	3-F-苯基	141	1	2,6-二-iPr-苯基
58	2	3-F-苯基	142	2	2,6-二-iPr-苯基
59	3	3-F-苯基	143	3	2,6-二-iPr-苯基
60	4	3-F-苯基	144	4	2,6-二-iPr-苯基
61	1	2-F-苯基	145	1	2-吗啉代-苯基
62	2	2-F-苯基	146	2	2-吗啉代-苯基
63	3	2-F-苯基	147	3	2-吗啉代-苯基
64	4	2-F-苯基	148	4	2-吗啉代-苯基
65	1	4-Cl-苯基	149	1	3-吗啉代-苯基
66	2	4-Cl-苯基	150	2	3-吗啉代-苯基
67	3	4-Cl-苯基	151	3	3-吗啉代-苯基
68	4	4-Cl-苯基	152	4	3-吗啉代-苯基
69	1	3-Cl-苯基	153	1	4-吗啉代-苯基
70	2	3-Cl-苯基	154	2	4-吗啉代-苯基

[2750]

71	3	3-Cl-苯基	155	3	4-吗啉代-苯基
72	4	3-Cl-苯基	156	4	4-吗啉代-苯基
73	1	2-Cl-苯基	157	1	4-CN-2-吗啉代-苯基
74	2	2-Cl-苯基	158	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
75	3	2-Cl-苯基	159	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
76	4	2-Cl-苯基	160	4	4-CN-2-吗啉代-苯基
77	1	4-Br-苯基	161	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
78	2	4-Br-苯基	162	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
79	3	4-Br-苯基	163	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
80	4	4-Br-苯基	164	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
81	1	3-Br-苯基	165	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
82	2	3-Br-苯基	166	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
83	3	3-Br-苯基	167	3	4-OH-2-吗啉代-苯基
84	4	3-Br-苯基	168	4	4-OH-2-吗啉代-苯基
85	1	亚萘-1-基	173	1	亚萘-2-基
86	2	亚萘-1-基	174	2	亚萘-2-基
87	3	亚萘-1-基	175	3	亚萘-2-基
88	4	亚萘-1-基	176	4	亚萘-2-基

[2751] 示例性实施方案包括具有式(XV)的化合物

[2752] 

(XV)

[2753] 或其可药用盐形式,如在下文表9中所定义。

[2754] 表9:

[2755]

条目	n	R^4	条目	n	R^4
1	1	苯基	85	1	2-Br-苯基
2	2	苯基	86	2	2-Br-苯基
3	3	苯基	87	3	2-Br-苯基

[2756]

4	4	苯基	88	4	2-Br-苯基
5	1	4-OH-苯基	89	1	4-CF_3-苯基
6	2	4-OH-苯基	90	2	4-CF_3-苯基
7	3	4-OH-苯基	91	3	4-CF_3-苯基
8	4	4-OH-苯基	92	4	4-CF_3-苯基
9	1	3-OH-苯基	93	1	3-CF_3-苯基
10	2	3-OH-苯基	94	2	3-CF_3-苯基
11	3	3-OH-苯基	95	3	3-CF_3-苯基
12	4	3-OH-苯基	96	4	3-CF_3-苯基
13	1	2-OH-苯基	97	1	2-CF_3-苯基
14	2	2-OH-苯基	98	2	2-CF_3-苯基
15	3	2-OH-苯基	99	3	2-CF_3-苯基
16	4	2-OH-苯基	100	4	2-CF_3-苯基
17	1	4-OMe-苯基	101	1	4-iPr-苯基
18	2	4-OMe-苯基	102	2	4-iPr-苯基
19	3	4-OMe-苯基	103	3	4-iPr-苯基
20	4	4-OMe-苯基	104	4	4-iPr-苯基
21	1	3-OMe-苯基	105	1	3-iPr-苯基
22	2	3-OMe-苯基	106	2	3-iPr-苯基
23	3	3-OMe-苯基	107	3	3-iPr-苯基
24	4	3-OMe-苯基	108	4	3-iPr-苯基
25	1	2-OMe-苯基	109	1	2-iPr-苯基
26	2	2-OMe-苯基	110	2	2-iPr-苯基
27	3	2-OMe-苯基	111	3	2-iPr-苯基
28	4	2-OMe-苯基	112	4	2-iPr-苯基
29	1	4-CN-苯基	113	1	4-NH_2-苯基
30	2	4-CN-苯基	114	2	4-NH_2-苯基

[2757]

31	3	4-CN-苯基	115	3	4-NH_2-苯基
32	4	4-CN-苯基	116	4	4-NH_2-苯基
33	1	3-CN-苯基	117	1	3-NH_2-苯基
34	2	3-CN-苯基	118	2	3-NH_2-苯基
35	3	3-CN-苯基	119	3	3-NH_2-苯基
36	4	3-CN-苯基	120	4	3-NH_2-苯基
37	1	2-CN-苯基	121	1	2-NH_2-苯基
38	2	2-CN-苯基	122	2	2-NH_2-苯基
39	3	2-CN-苯基	123	3	2-NH_2-苯基
40	4	2-CN-苯基	124	4	2-NH_2-苯基
41	1	4-Me-苯基	125	1	2,3-二-Me-苯基
42	2	4-Me-苯基	126	2	2,3-二-Me-苯基
43	3	4-Me-苯基	127	3	2,3-二-Me-苯基
44	4	4-Me-苯基	128	4	2,3-二-Me-苯基
45	1	3-Me-苯基	129	1	2,4-二-Me-苯基
46	2	3-Me-苯基	130	2	2,4-二-Me-苯基
47	3	3-Me-苯基	131	3	2,4-二-Me-苯基
48	4	3-Me-苯基	132	4	2,4-二-Me-苯基
49	1	2-Me-苯基	133	1	2,5-二-Me-苯基
50	2	2-Me-苯基	134	2	2,5-二-Me-苯基
51	3	2-Me-苯基	135	3	2,5-二-Me-苯基
52	4	2-Me-苯基	136	4	2,5-二-Me-苯基
53	1	4-F-苯基	137	1	2,6-二-Me-苯基
54	2	4-F-苯基	138	2	2,6-二-Me-苯基
55	3	4-F-苯基	139	3	2,6-二-Me-苯基
56	4	4-F-苯基	140	4	2,6-二-Me-苯基
57	1	3-F-苯基	141	1	2,6-二-iPr-苯基

[2758]

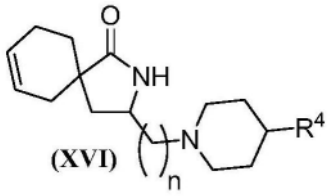
58	2	3-F-苯基	142	2	2,6-二-iPr-苯基
59	3	3-F-苯基	143	3	2,6-二-iPr-苯基
60	4	3-F-苯基	144	4	2,6-二-iPr-苯基
61	1	2-F-苯基	145	1	2-吗啉代-苯基
62	2	2-F-苯基	146	2	2-吗啉代-苯基
63	3	2-F-苯基	147	3	2-吗啉代-苯基
64	4	2-F-苯基	148	4	2-吗啉代-苯基
65	1	4-Cl-苯基	149	1	3-吗啉代-苯基
66	2	4-Cl-苯基	150	2	3-吗啉代-苯基
67	3	4-Cl-苯基	151	3	3-吗啉代-苯基
68	4	4-Cl-苯基	152	4	3-吗啉代-苯基
69	1	3-Cl-苯基	153	1	4-吗啉代-苯基
70	2	3-Cl-苯基	154	2	4-吗啉代-苯基
71	3	3-Cl-苯基	155	3	4-吗啉代-苯基
72	4	3-Cl-苯基	156	4	4-吗啉代-苯基
73	1	2-Cl-苯基	157	1	4-CN-2-吗啉代-苯基
74	2	2-Cl-苯基	158	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
75	3	2-Cl-苯基	159	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
76	4	2-Cl-苯基	160	4	4-CN-2-吗啉代-苯基
77	1	4-Br-苯基	161	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
78	2	4-Br-苯基	162	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
79	3	4-Br-苯基	163	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
80	4	4-Br-苯基	164	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
81	1	3-Br-苯基	165	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
82	2	3-Br-苯基	166	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
83	3	3-Br-苯基	167	3	4-OH-2-吗啉代-苯基
84	4	3-Br-苯基	168	4	4-OH-2-吗啉代-苯基

[2759]

85	1	亚萘-1-基	173	1	亚萘-2-基
86	2	亚萘-1-基	174	2	亚萘-2-基
87	3	亚萘-1-基	175	3	亚萘-2-基
88	4	亚萘-1-基	176	4	亚萘-2-基

[2760] 示例性实施方案包括具有式(XVI)的化合物

[2761]



[2762] 或其可药用盐形式,如在下文表10中所定义。

[2763] 表10:

[2764]

条目	n	R^4	条目	n	R^4
1	1	苯基	85	1	2-Br-苯基
2	2	苯基	86	2	2-Br-苯基
3	3	苯基	87	3	2-Br-苯基
4	4	苯基	88	4	2-Br-苯基
5	1	4-OH-苯基	89	1	4-CF_3-苯基
6	2	4-OH-苯基	90	2	4-CF_3-苯基
7	3	4-OH-苯基	91	3	4-CF_3-苯基
8	4	4-OH-苯基	92	4	4-CF_3-苯基
9	1	3-OH-苯基	93	1	3-CF_3-苯基
10	2	3-OH-苯基	94	2	3-CF_3-苯基
11	3	3-OH-苯基	95	3	3-CF_3-苯基
12	4	3-OH-苯基	96	4	3-CF_3-苯基
13	1	2-OH-苯基	97	1	2-CF_3-苯基
14	2	2-OH-苯基	98	2	2-CF_3-苯基
15	3	2-OH-苯基	99	3	2-CF_3-苯基
16	4	2-OH-苯基	100	4	2-CF_3-苯基
17	1	4-OMe-苯基	101	1	4-iPr-苯基

[2765]

18	2	4-OMe-苯基	102	2	4-iPr-苯基
19	3	4-OMe-苯基	103	3	4-iPr-苯基
20	4	4-OMe-苯基	104	4	4-iPr-苯基
21	1	3-OMe-苯基	105	1	3-iPr-苯基
22	2	3-OMe-苯基	106	2	3-iPr-苯基
23	3	3-OMe-苯基	107	3	3-iPr-苯基
24	4	3-OMe-苯基	108	4	3-iPr-苯基
25	1	2-OMe-苯基	109	1	2-iPr-苯基
26	2	2-OMe-苯基	110	2	2-iPr-苯基
27	3	2-OMe-苯基	111	3	2-iPr-苯基
28	4	2-OMe-苯基	112	4	2-iPr-苯基
29	1	4-CN-苯基	113	1	4-NH_2-苯基
30	2	4-CN-苯基	114	2	4-NH_2-苯基
31	3	4-CN-苯基	115	3	4-NH_2-苯基
32	4	4-CN-苯基	116	4	4-NH_2-苯基
33	1	3-CN-苯基	117	1	3-NH_2-苯基
34	2	3-CN-苯基	118	2	3-NH_2-苯基
35	3	3-CN-苯基	119	3	3-NH_2-苯基
36	4	3-CN-苯基	120	4	3-NH_2-苯基
37	1	2-CN-苯基	121	1	2-NH_2-苯基
38	2	2-CN-苯基	122	2	2-NH_2-苯基
39	3	2-CN-苯基	123	3	2-NH_2-苯基
40	4	2-CN-苯基	124	4	2-NH_2-苯基
41	1	4-Me-苯基	125	1	2,3-二-Me-苯基
42	2	4-Me-苯基	126	2	2,3-二-Me-苯基
43	3	4-Me-苯基	127	3	2,3-二-Me-苯基
44	4	4-Me-苯基	128	4	2,3-二-Me-苯基

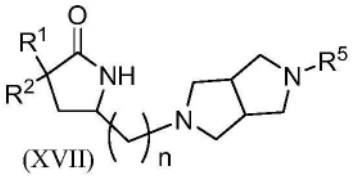
[2766]

45	1	3-Me-苯基	129	1	2,4-二-Me-苯基
46	2	3-Me-苯基	130	2	2,4-二-Me-苯基
47	3	3-Me-苯基	131	3	2,4-二-Me-苯基
48	4	3-Me-苯基	132	4	2,4-二-Me-苯基
49	1	2-Me-苯基	133	1	2,5-二-Me-苯基
50	2	2-Me-苯基	134	2	2,5-二-Me-苯基
51	3	2-Me-苯基	135	3	2,5-二-Me-苯基
52	4	2-Me-苯基	136	4	2,5-二-Me-苯基
53	1	4-F-苯基	137	1	2,6-二-Me-苯基
54	2	4-F-苯基	138	2	2,6-二-Me-苯基
55	3	4-F-苯基	139	3	2,6-二-Me-苯基
56	4	4-F-苯基	140	4	2,6-二-Me-苯基
57	1	3-F-苯基	141	1	2,6-二-iPr-苯基
58	2	3-F-苯基	142	2	2,6-二-iPr-苯基
59	3	3-F-苯基	143	3	2,6-二-iPr-苯基
60	4	3-F-苯基	144	4	2,6-二-iPr-苯基
61	1	2-F-苯基	145	1	2-吗啉代-苯基
62	2	2-F-苯基	146	2	2-吗啉代-苯基
63	3	2-F-苯基	147	3	2-吗啉代-苯基
64	4	2-F-苯基	148	4	2-吗啉代-苯基
65	1	4-Cl-苯基	149	1	3-吗啉代-苯基
66	2	4-Cl-苯基	150	2	3-吗啉代-苯基
67	3	4-Cl-苯基	151	3	3-吗啉代-苯基
68	4	4-Cl-苯基	152	4	3-吗啉代-苯基
69	1	3-Cl-苯基	153	1	4-吗啉代-苯基
70	2	3-Cl-苯基	154	2	4-吗啉代-苯基
71	3	3-Cl-苯基	155	3	4-吗啉代-苯基

72	4	3-Cl-苯基	156	4	4-吗啉代-苯基
73	1	2-Cl-苯基	157	1	4-CN-2-吗啉代-苯基
74	2	2-Cl-苯基	158	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
75	3	2-Cl-苯基	159	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
76	4	2-Cl-苯基	160	4	4-CN-2-吗啉代-苯基
77	1	4-Br-苯基	161	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
78	2	4-Br-苯基	162	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
79	3	4-Br-苯基	163	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
80	4	4-Br-苯基	164	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
81	1	3-Br-苯基	165	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
82	2	3-Br-苯基	166	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
83	3	3-Br-苯基	167	3	4-OH-2-吗啉代-苯基
84	4	3-Br-苯基	168	4	4-OH-2-吗啉代-苯基
85	1	亚萘-1-基	173	1	亚萘-2-基
86	2	亚萘-1-基	174	2	亚萘-2-基
87	3	亚萘-1-基	175	3	亚萘-2-基
88	4	亚萘-1-基	176	4	亚萘-2-基

[2767]

[2768] 示例性实施方案包括具有式(XVII)的化合物

[2769] 

(XVII)

[2770] 或其可药用盐形式,如在下文表11中所定义。

[2771] 表11:

[2772]

条目	R^1	R^2	n	R^5	条目	R^1	R^2	n	R^5
1	甲基	甲基	1	苯基	177	乙基	乙基	1	苯基
2	甲基	甲基	2	苯基	178	乙基	乙基	2	苯基
3	甲基	甲基	3	苯基	179	乙基	乙基	3	苯基
4	甲基	甲基	4	苯基	180	乙基	乙基	4	苯基

[2773]

5	甲基	甲基	1	4-OH-苯基	181	乙基	乙基	1	4-OH-苯基
6	甲基	甲基	2	4-OH-苯基	182	乙基	乙基	2	4-OH-苯基
7	甲基	甲基	3	4-OH-苯基	183	乙基	乙基	3	4-OH-苯基
8	甲基	甲基	4	4-OH-苯基	184	乙基	乙基	4	4-OH-苯基
9	甲基	甲基	1	3-OH-苯基	185	乙基	乙基	1	3-OH-苯基
10	甲基	甲基	2	3-OH-苯基	186	乙基	乙基	2	3-OH-苯基
11	甲基	甲基	3	3-OH-苯基	187	乙基	乙基	3	3-OH-苯基
12	甲基	甲基	4	3-OH-苯基	188	乙基	乙基	4	3-OH-苯基
13	甲基	甲基	1	2-OH-苯基	189	乙基	乙基	1	2-OH-苯基
14	甲基	甲基	2	2-OH-苯基	190	乙基	乙基	2	2-OH-苯基
15	甲基	甲基	3	2-OH-苯基	191	乙基	乙基	3	2-OH-苯基
16	甲基	甲基	4	2-OH-苯基	192	乙基	乙基	4	2-OH-苯基
17	甲基	甲基	1	4-OMe-苯基	193	乙基	乙基	1	4-OMe-苯基
18	甲基	甲基	2	4-OMe-苯基	194	乙基	乙基	2	4-OMe-苯基
19	甲基	甲基	3	4-OMe-苯基	195	乙基	乙基	3	4-OMe-苯基
20	甲基	甲基	4	4-OMe-苯基	196	乙基	乙基	4	4-OMe-苯基
21	甲基	甲基	1	3-OMe-苯基	197	乙基	乙基	1	3-OMe-苯基
22	甲基	甲基	2	3-OMe-苯基	198	乙基	乙基	2	3-OMe-苯基
23	甲基	甲基	3	3-OMe-苯基	199	乙基	乙基	3	3-OMe-苯基
24	甲基	甲基	4	3-OMe-苯基	200	乙基	乙基	4	3-OMe-苯基
25	甲基	甲基	1	2-OMe-苯基	201	乙基	乙基	1	2-OMe-苯基
26	甲基	甲基	2	2-OMe-苯基	202	乙基	乙基	2	2-OMe-苯基
27	甲基	甲基	3	2-OMe-苯基	203	乙基	乙基	3	2-OMe-苯基
28	甲基	甲基	4	2-OMe-苯基	204	乙基	乙基	4	2-OMe-苯基
29	甲基	甲基	1	4-CN-苯基	205	乙基	乙基	1	4-CN-苯基
30	甲基	甲基	2	4-CN-苯基	206	乙基	乙基	2	4-CN-苯基
31	甲基	甲基	3	4-CN-苯基	207	乙基	乙基	3	4-CN-苯基

[2774]

32	甲基	甲基	4	4-CN-苯基	208	乙基	乙基	4	4-CN-苯基
33	甲基	甲基	1	3-CN-苯基	209	乙基	乙基	1	3-CN-苯基
34	甲基	甲基	2	3-CN-苯基	210	乙基	乙基	2	3-CN-苯基
35	甲基	甲基	3	3-CN-苯基	211	乙基	乙基	3	3-CN-苯基
36	甲基	甲基	4	3-CN-苯基	212	乙基	乙基	4	3-CN-苯基
37	甲基	甲基	1	2-CN-苯基	213	乙基	乙基	1	2-CN-苯基
38	甲基	甲基	2	2-CN-苯基	214	乙基	乙基	2	2-CN-苯基
39	甲基	甲基	3	2-CN-苯基	215	乙基	乙基	3	2-CN-苯基
40	甲基	甲基	4	2-CN-苯基	216	乙基	乙基	4	2-CN-苯基
41	甲基	甲基	1	4-Me-苯基	217	乙基	乙基	1	4-Me-苯基
42	甲基	甲基	2	4-Me-苯基	218	乙基	乙基	2	4-Me-苯基
43	甲基	甲基	3	4-Me-苯基	219	乙基	乙基	3	4-Me-苯基
44	甲基	甲基	4	4-Me-苯基	220	乙基	乙基	4	4-Me-苯基
45	甲基	甲基	1	3-Me-苯基	221	乙基	乙基	1	3-Me-苯基
46	甲基	甲基	2	3-Me-苯基	222	乙基	乙基	2	3-Me-苯基
47	甲基	甲基	3	3-Me-苯基	223	乙基	乙基	3	3-Me-苯基
48	甲基	甲基	4	3-Me-苯基	224	乙基	乙基	4	3-Me-苯基
49	甲基	甲基	1	2-Me-苯基	225	乙基	乙基	1	2-Me-苯基
50	甲基	甲基	2	2-Me-苯基	226	乙基	乙基	2	2-Me-苯基
51	甲基	甲基	3	2-Me-苯基	227	乙基	乙基	3	2-Me-苯基
52	甲基	甲基	4	2-Me-苯基	228	乙基	乙基	4	2-Me-苯基
53	甲基	甲基	1	4-F-苯基	229	乙基	乙基	1	4-F-苯基
54	甲基	甲基	2	4-F-苯基	230	乙基	乙基	2	4-F-苯基
55	甲基	甲基	3	4-F-苯基	231	乙基	乙基	3	4-F-苯基
56	甲基	甲基	4	4-F-苯基	232	乙基	乙基	4	4-F-苯基
57	甲基	甲基	1	3-F-苯基	233	乙基	乙基	1	3-F-苯基
58	甲基	甲基	2	3-F-苯基	234	乙基	乙基	2	3-F-苯基

[2775]

59	甲基	甲基	3	3-F-苯基	235	乙基	乙基	3	3-F-苯基
60	甲基	甲基	4	3-F-苯基	236	乙基	乙基	4	3-F-苯基
61	甲基	甲基	1	2-F-苯基	237	乙基	乙基	1	2-F-苯基
62	甲基	甲基	2	2-F-苯基	238	乙基	乙基	2	2-F-苯基
63	甲基	甲基	3	2-F-苯基	239	乙基	乙基	3	2-F-苯基
64	甲基	甲基	4	2-F-苯基	240	乙基	乙基	4	2-F-苯基
65	甲基	甲基	1	4-Cl-苯基	241	乙基	乙基	1	4-Cl-苯基
66	甲基	甲基	2	4-Cl-苯基	242	乙基	乙基	2	4-Cl-苯基
67	甲基	甲基	3	4-Cl-苯基	243	乙基	乙基	3	4-Cl-苯基
68	甲基	甲基	4	4-Cl-苯基	244	乙基	乙基	4	4-Cl-苯基
69	甲基	甲基	1	3-Cl-苯基	245	乙基	乙基	1	3-Cl-苯基
70	甲基	甲基	2	3-Cl-苯基	246	乙基	乙基	2	3-Cl-苯基
71	甲基	甲基	3	3-Cl-苯基	247	乙基	乙基	3	3-Cl-苯基
72	甲基	甲基	4	3-Cl-苯基	248	乙基	乙基	4	3-Cl-苯基
73	甲基	甲基	1	2-Cl-苯基	249	乙基	乙基	1	2-Cl-苯基
74	甲基	甲基	2	2-Cl-苯基	250	乙基	乙基	2	2-Cl-苯基
75	甲基	甲基	3	2-Cl-苯基	251	乙基	乙基	3	2-Cl-苯基
76	甲基	甲基	4	2-Cl-苯基	252	乙基	乙基	4	2-Cl-苯基
77	甲基	甲基	1	4-Br-苯基	253	乙基	乙基	1	4-Br-苯基
78	甲基	甲基	2	4-Br-苯基	254	乙基	乙基	2	4-Br-苯基
79	甲基	甲基	3	4-Br-苯基	255	乙基	乙基	3	4-Br-苯基
80	甲基	甲基	4	4-Br-苯基	256	乙基	乙基	4	4-Br-苯基
81	甲基	甲基	1	3-Br-苯基	257	乙基	乙基	1	3-Br-苯基
82	甲基	甲基	2	3-Br-苯基	258	乙基	乙基	2	3-Br-苯基
83	甲基	甲基	3	3-Br-苯基	259	乙基	乙基	3	3-Br-苯基
84	甲基	甲基	4	3-Br-苯基	260	乙基	乙基	4	3-Br-苯基
85	甲基	甲基	1	2-Br-苯基	261	乙基	乙基	1	2-Br-苯基

[2776]

86	甲基	甲基	2	2-Br-苯基	262	乙基	乙基	2	2-Br-苯基
87	甲基	甲基	3	2-Br-苯基	263	乙基	乙基	3	2-Br-苯基
88	甲基	甲基	4	2-Br-苯基	264	乙基	乙基	4	2-Br-苯基
89	甲基	甲基	1	4-CF_3-苯基	265	乙基	乙基	1	4-CF_3-苯基
90	甲基	甲基	2	4-CF_3-苯基	266	乙基	乙基	2	4-CF_3-苯基
91	甲基	甲基	3	4-CF_3-苯基	267	乙基	乙基	3	4-CF_3-苯基
92	甲基	甲基	4	4-CF_3-苯基	268	乙基	乙基	4	4-CF_3-苯基
93	甲基	甲基	1	3-CF_3-苯基	269	乙基	乙基	1	3-CF_3-苯基
94	甲基	甲基	2	3-CF_3-苯基	270	乙基	乙基	2	3-CF_3-苯基
95	甲基	甲基	3	3-CF_3-苯基	271	乙基	乙基	3	3-CF_3-苯基
96	甲基	甲基	4	3-CF_3-苯基	272	乙基	乙基	4	3-CF_3-苯基
97	甲基	甲基	1	2-CF_3-苯基	273	乙基	乙基	1	2-CF_3-苯基
98	甲基	甲基	2	2-CF_3-苯基	274	乙基	乙基	2	2-CF_3-苯基
99	甲基	甲基	3	2-CF_3-苯基	275	乙基	乙基	3	2-CF_3-苯基
100	甲基	甲基	4	2-CF_3-苯基	276	乙基	乙基	4	2-CF_3-苯基
101	甲基	甲基	1	4-iPr-苯基	277	乙基	乙基	1	4-iPr-苯基
102	甲基	甲基	2	4-iPr-苯基	278	乙基	乙基	2	4-iPr-苯基
103	甲基	甲基	3	4-iPr-苯基	279	乙基	乙基	3	4-iPr-苯基
104	甲基	甲基	4	4-iPr-苯基	280	乙基	乙基	4	4-iPr-苯基
105	甲基	甲基	1	3-iPr-苯基	281	乙基	乙基	1	3-iPr-苯基
106	甲基	甲基	2	3-iPr-苯基	282	乙基	乙基	2	3-iPr-苯基
107	甲基	甲基	3	3-iPr-苯基	283	乙基	乙基	3	3-iPr-苯基
108	甲基	甲基	4	3-iPr-苯基	284	乙基	乙基	4	3-iPr-苯基
109	甲基	甲基	1	2-iPr-苯基	285	乙基	乙基	1	2-iPr-苯基
110	甲基	甲基	2	2-iPr-苯基	286	乙基	乙基	2	2-iPr-苯基
111	甲基	甲基	3	2-iPr-苯基	287	乙基	乙基	3	2-iPr-苯基
112	甲基	甲基	4	2-iPr-苯基	288	乙基	乙基	4	2-iPr-苯基

[2777]

113	甲基	甲基	1	4-NH_2-苯基	289	乙基	乙基	1	4-NH_2-苯基
114	甲基	甲基	2	4-NH_2-苯基	290	乙基	乙基	2	4-NH_2-苯基
115	甲基	甲基	3	4-NH_2-苯基	291	乙基	乙基	3	4-NH_2-苯基
116	甲基	甲基	4	4-NH_2-苯基	292	乙基	乙基	4	4-NH_2-苯基
117	甲基	甲基	1	3-NH_2-苯基	293	乙基	乙基	1	3-NH_2-苯基
118	甲基	甲基	2	3-NH_2-苯基	294	乙基	乙基	2	3-NH_2-苯基
119	甲基	甲基	3	3-NH_2-苯基	295	乙基	乙基	3	3-NH_2-苯基
120	甲基	甲基	4	3-NH_2-苯基	296	乙基	乙基	4	3-NH_2-苯基
121	甲基	甲基	1	2-NH_2-苯基	297	乙基	乙基	1	2-NH_2-苯基
122	甲基	甲基	2	2-NH_2-苯基	298	乙基	乙基	2	2-NH_2-苯基
123	甲基	甲基	3	2-NH_2-苯基	299	乙基	乙基	3	2-NH_2-苯基
124	甲基	甲基	4	2-NH_2-苯基	300	乙基	乙基	4	2-NH_2-苯基
125	甲基	甲基	1	2,3-二-Me-苯基	301	乙基	乙基	1	2,3-二-Me-苯基
126	甲基	甲基	2	2,3-二-Me-苯基	302	乙基	乙基	2	2,3-二-Me-苯基
127	甲基	甲基	3	2,3-二-Me-苯基	303	乙基	乙基	3	2,3-二-Me-苯基
128	甲基	甲基	4	2,3-二-Me-苯基	304	乙基	乙基	4	2,3-二-Me-苯基
129	甲基	甲基	1	2,4-二-Me-苯基	305	乙基	乙基	1	2,4-二-Me-苯基
130	甲基	甲基	2	2,4-二-Me-苯基	306	乙基	乙基	2	2,4-二-Me-苯基
131	甲基	甲基	3	2,4-二-Me-苯基	307	乙基	乙基	3	2,4-二-Me-苯基
132	甲基	甲基	4	2,4-二-Me-苯基	308	乙基	乙基	4	2,4-二-Me-苯基
133	甲基	甲基	1	2,5-二-Me-苯基	309	乙基	乙基	1	2,5-二-Me-苯基
134	甲基	甲基	2	2,5-二-Me-苯基	310	乙基	乙基	2	2,5-二-Me-苯基
135	甲基	甲基	3	2,5-二-Me-苯基	311	乙基	乙基	3	2,5-二-Me-苯基
136	甲基	甲基	4	2,5-二-Me-苯基	312	乙基	乙基	4	2,5-二-Me-苯基
137	甲基	甲基	1	2,6-二-Me-苯基	313	乙基	乙基	1	2,6-二-Me-苯基
138	甲基	甲基	2	2,6-二-Me-苯基	314	乙基	乙基	2	2,6-二-Me-苯基
139	甲基	甲基	3	2,6-二-Me-苯基	315	乙基	乙基	3	2,6-二-Me-苯基

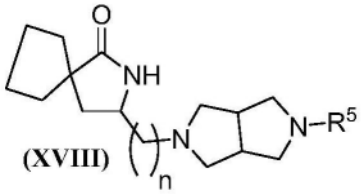
[2778]

140	甲基	甲基	4	2,6-二-Me-苯基	316	乙基	乙基	4	2,6-二-Me-苯基
141	甲基	甲基	1	2,6-二-iPr-苯基	317	乙基	乙基	1	2,6-二-iPr-苯基
142	甲基	甲基	2	2,6-二-iPr-苯基	318	乙基	乙基	2	2,6-二-iPr-苯基
143	甲基	甲基	3	2,6-二-iPr-苯基	319	乙基	乙基	3	2,6-二-iPr-苯基
144	甲基	甲基	4	2,6-二-iPr-苯基	320	乙基	乙基	4	2,6-二-iPr-苯基
145	甲基	甲基	1	2-吗啉代-苯基	321	乙基	乙基	1	2-吗啉代-苯基
146	甲基	甲基	2	2-吗啉代-苯基	322	乙基	乙基	2	2-吗啉代-苯基
147	甲基	甲基	3	2-吗啉代-苯基	323	乙基	乙基	3	2-吗啉代-苯基
148	甲基	甲基	4	2-吗啉代-苯基	324	乙基	乙基	4	2-吗啉代-苯基
149	甲基	甲基	1	3-吗啉代-苯基	325	乙基	乙基	1	3-吗啉代-苯基
150	甲基	甲基	2	3-吗啉代-苯基	326	乙基	乙基	2	3-吗啉代-苯基
151	甲基	甲基	3	3-吗啉代-苯基	327	乙基	乙基	3	3-吗啉代-苯基
152	甲基	甲基	4	3-吗啉代-苯基	328	乙基	乙基	4	3-吗啉代-苯基
153	甲基	甲基	1	4-吗啉代-苯基	329	乙基	乙基	1	4-吗啉代-苯基
154	甲基	甲基	2	4-吗啉代-苯基	330	乙基	乙基	2	4-吗啉代-苯基
155	甲基	甲基	3	4-吗啉代-苯基	331	乙基	乙基	3	4-吗啉代-苯基
156	甲基	甲基	4	4-吗啉代-苯基	332	乙基	乙基	4	4-吗啉代-苯基
157	甲基	甲基	1	4-CN-2-吗啉代-苯基	333	乙基	乙基	1	4-CN-2-吗啉代-苯基
158	甲基	甲基	2	4-CN-2-吗啉代-苯基	334	乙基	乙基	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
159	甲基	甲基	3	4-CN-2-吗啉代-苯基	335	乙基	乙基	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
160	甲基	甲基	4	4-CN-2-吗啉代-苯基	336	乙基	乙基	4	4-CN-2-吗啉代-苯基
161	甲基	甲基	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基	337	乙基	乙基	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
162	甲基	甲基	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基	338	乙基	乙基	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
163	甲基	甲基	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基	339	乙基	乙基	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基

[2779]

164	甲基	甲基	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基	340	乙基	乙基	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
165	甲基	甲基	1	4-OH-2-吗啉代-苯基	341	乙基	乙基	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
166	甲基	甲基	2	4-OH-2-吗啉代-苯基	342	乙基	乙基	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
167	甲基	甲基	3	4-OH-2-吗啉代-苯基	343	乙基	乙基	3	4-OH-2-吗啉代-苯基
168	甲基	甲基	4	4-OH-2-吗啉代-苯基	344	乙基	乙基	4	4-OH-2-吗啉代-苯基
169	甲基	甲基	1	亚萘-1-基	345	乙基	乙基	1	亚萘-1-基
170	甲基	甲基	2	亚萘-1-基	346	乙基	乙基	2	亚萘-1-基
171	甲基	甲基	3	亚萘-1-基	347	乙基	乙基	3	亚萘-1-基
172	甲基	甲基	4	亚萘-1-基	348	乙基	乙基	4	亚萘-1-基
173	甲基	甲基	1	亚萘-2-基	349	乙基	乙基	1	亚萘-2-基
174	甲基	甲基	2	亚萘-2-基	350	乙基	乙基	2	亚萘-2-基
175	甲基	甲基	3	亚萘-2-基	351	乙基	乙基	3	亚萘-2-基
176	甲基	甲基	4	亚萘-2-基	352	乙基	乙基	4	亚萘-2-基

[2780] 示例性实施方案包括具有式(XVIII)的化合物

[2781] 

(XVIII)

[2782] 或其可药用盐形式,如在下文表12中所定义

[2783] 表12:

[2784]

条目	n	R^5	条目	n	R^5
1	1	苯基	85	1	2-Br-苯基
2	2	苯基	86	2	2-Br-苯基
3	3	苯基	87	3	2-Br-苯基
4	4	苯基	88	4	2-Br-苯基
5	1	4-OH-苯基	89	1	4-CF_3-苯基
6	2	4-OH-苯基	90	2	4-CF_3-苯基
7	3	4-OH-苯基	91	3	4-CF_3-苯基

[2785]

8	4	4-OH-苯基	92	4	4-CF_3-苯基
9	1	3-OH-苯基	93	1	3-CF_3-苯基
10	2	3-OH-苯基	94	2	3-CF_3-苯基
11	3	3-OH-苯基	95	3	3-CF_3-苯基
12	4	3-OH-苯基	96	4	3-CF_3-苯基
13	1	2-OH-苯基	97	1	2-CF_3-苯基
14	2	2-OH-苯基	98	2	2-CF_3-苯基
15	3	2-OH-苯基	99	3	2-CF_3-苯基
16	4	2-OH-苯基	100	4	2-CF_3-苯基
17	1	4-OMe-苯基	101	1	4-iPr-苯基
18	2	4-OMe-苯基	102	2	4-iPr-苯基
19	3	4-OMe-苯基	103	3	4-iPr-苯基
20	4	4-OMe-苯基	104	4	4-iPr-苯基
21	1	3-OMe-苯基	105	1	3-iPr-苯基
22	2	3-OMe-苯基	106	2	3-iPr-苯基
23	3	3-OMe-苯基	107	3	3-iPr-苯基
24	4	3-OMe-苯基	108	4	3-iPr-苯基
25	1	2-OMe-苯基	109	1	2-iPr-苯基
26	2	2-OMe-苯基	110	2	2-iPr-苯基
27	3	2-OMe-苯基	111	3	2-iPr-苯基
28	4	2-OMe-苯基	112	4	2-iPr-苯基
29	1	4-CN-苯基	113	1	4-NH_2-苯基
30	2	4-CN-苯基	114	2	4-NH_2-苯基
31	3	4-CN-苯基	115	3	4-NH_2-苯基
32	4	4-CN-苯基	116	4	4-NH_2-苯基
33	1	3-CN-苯基	117	1	3-NH_2-苯基
34	2	3-CN-苯基	118	2	3-NH_2-苯基

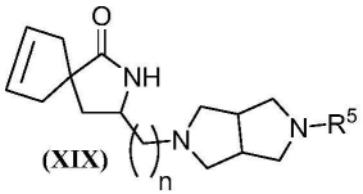
[2786]

35	3	3-CN-苯基	119	3	3-NH_2-苯基
36	4	3-CN-苯基	120	4	3-NH_2-苯基
37	1	2-CN-苯基	121	1	2-NH_2-苯基
38	2	2-CN-苯基	122	2	2-NH_2-苯基
39	3	2-CN-苯基	123	3	2-NH_2-苯基
40	4	2-CN-苯基	124	4	2-NH_2-苯基
41	1	4-Me-苯基	125	1	2,3-二-Me-苯基
42	2	4-Me-苯基	126	2	2,3-二-Me-苯基
43	3	4-Me-苯基	127	3	2,3-二-Me-苯基
44	4	4-Me-苯基	128	4	2,3-二-Me-苯基
45	1	3-Me-苯基	129	1	2,4-二-Me-苯基
46	2	3-Me-苯基	130	2	2,4-二-Me-苯基
47	3	3-Me-苯基	131	3	2,4-二-Me-苯基
48	4	3-Me-苯基	132	4	2,4-二-Me-苯基
49	1	2-Me-苯基	133	1	2,5-二-Me-苯基
50	2	2-Me-苯基	134	2	2,5-二-Me-苯基
51	3	2-Me-苯基	135	3	2,5-二-Me-苯基
52	4	2-Me-苯基	136	4	2,5-二-Me-苯基
53	1	4-F-苯基	137	1	2,6-二-Me-苯基
54	2	4-F-苯基	138	2	2,6-二-Me-苯基
55	3	4-F-苯基	139	3	2,6-二-Me-苯基
56	4	4-F-苯基	140	4	2,6-二-Me-苯基
57	1	3-F-苯基	141	1	2,6-二-iPr-苯基
58	2	3-F-苯基	142	2	2,6-二-iPr-苯基
59	3	3-F-苯基	143	3	2,6-二-iPr-苯基
60	4	3-F-苯基	144	4	2,6-二-iPr-苯基
61	1	2-F-苯基	145	1	2-吗啉代-苯基

[2787]

62	2	2-F-苯基	146	2	2-吗啉代-苯基
63	3	2-F-苯基	147	3	2-吗啉代-苯基
64	4	2-F-苯基	148	4	2-吗啉代-苯基
65	1	4-Cl-苯基	149	1	3-吗啉代-苯基
66	2	4-Cl-苯基	150	2	3-吗啉代-苯基
67	3	4-Cl-苯基	151	3	3-吗啉代-苯基
68	4	4-Cl-苯基	152	4	3-吗啉代-苯基
69	1	3-Cl-苯基	153	1	4-吗啉代-苯基
70	2	3-Cl-苯基	154	2	4-吗啉代-苯基
71	3	3-Cl-苯基	155	3	4-吗啉代-苯基
72	4	3-Cl-苯基	156	4	4-吗啉代-苯基
73	1	2-Cl-苯基	157	1	4-CN-2-吗啉代-苯基
74	2	2-Cl-苯基	158	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
75	3	2-Cl-苯基	159	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
76	4	2-Cl-苯基	160	4	4-CN-2-吗啉代-苯基
77	1	4-Br-苯基	161	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
78	2	4-Br-苯基	162	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
79	3	4-Br-苯基	163	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
80	4	4-Br-苯基	164	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
81	1	3-Br-苯基	165	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
82	2	3-Br-苯基	166	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
83	3	3-Br-苯基	167	3	4-OH-2-吗啉代-苯基
84	4	3-Br-苯基	168	4	4-OH-2-吗啉代-苯基
85	1	亚萘-1-基	173	1	亚萘-2-基
86	2	亚萘-1-基	174	2	亚萘-2-基
87	3	亚萘-1-基	175	3	亚萘-2-基
88	4	亚萘-1-基	176	4	亚萘-2-基

[2788] 示例性实施方案包括具有式(XIX)的化合物

[2789] 

(XIX)

[2790] 或其可药用盐形式,如在下文表13中所定义。

[2791] 表13:

[2792]

条目	n	R^5	条目	n	R^5
1	1	苯基	85	1	2-Br-苯基
2	2	苯基	86	2	2-Br-苯基
3	3	苯基	87	3	2-Br-苯基
4	4	苯基	88	4	2-Br-苯基
5	1	4-OH-苯基	89	1	4-CF_3-苯基
6	2	4-OH-苯基	90	2	4-CF_3-苯基
7	3	4-OH-苯基	91	3	4-CF_3-苯基
8	4	4-OH-苯基	92	4	4-CF_3-苯基
9	1	3-OH-苯基	93	1	3-CF_3-苯基
10	2	3-OH-苯基	94	2	3-CF_3-苯基
11	3	3-OH-苯基	95	3	3-CF_3-苯基
12	4	3-OH-苯基	96	4	3-CF_3-苯基
13	1	2-OH-苯基	97	1	2-CF_3-苯基
14	2	2-OH-苯基	98	2	2-CF_3-苯基
15	3	2-OH-苯基	99	3	2-CF_3-苯基
16	4	2-OH-苯基	100	4	2-CF_3-苯基
17	1	4-OMe-苯基	101	1	4-iPr-苯基
18	2	4-OMe-苯基	102	2	4-iPr-苯基
19	3	4-OMe-苯基	103	3	4-iPr-苯基
20	4	4-OMe-苯基	104	4	4-iPr-苯基
21	1	3-OMe-苯基	105	1	3-iPr-苯基
22	2	3-OMe-苯基	106	2	3-iPr-苯基

[2793]

23	3	3-OMe-苯基	107	3	3-iPr-苯基
24	4	3-OMe-苯基	108	4	3-iPr-苯基
25	1	2-OMe-苯基	109	1	2-iPr-苯基
26	2	2-OMe-苯基	110	2	2-iPr-苯基
27	3	2-OMe-苯基	111	3	2-iPr-苯基
28	4	2-OMe-苯基	112	4	2-iPr-苯基
29	1	4-CN-苯基	113	1	4-NH_2-苯基
30	2	4-CN-苯基	114	2	4-NH_2-苯基
31	3	4-CN-苯基	115	3	4-NH_2-苯基
32	4	4-CN-苯基	116	4	4-NH_2-苯基
33	1	3-CN-苯基	117	1	3-NH_2-苯基
34	2	3-CN-苯基	118	2	3-NH_2-苯基
35	3	3-CN-苯基	119	3	3-NH_2-苯基
36	4	3-CN-苯基	120	4	3-NH_2-苯基
37	1	2-CN-苯基	121	1	2-NH_2-苯基
38	2	2-CN-苯基	122	2	2-NH_2-苯基
39	3	2-CN-苯基	123	3	2-NH_2-苯基
40	4	2-CN-苯基	124	4	2-NH_2-苯基
41	1	4-Me-苯基	125	1	2,3-二-Me-苯基
42	2	4-Me-苯基	126	2	2,3-二-Me-苯基
43	3	4-Me-苯基	127	3	2,3-二-Me-苯基
44	4	4-Me-苯基	128	4	2,3-二-Me-苯基
45	1	3-Me-苯基	129	1	2,4-二-Me-苯基
46	2	3-Me-苯基	130	2	2,4-二-Me-苯基
47	3	3-Me-苯基	131	3	2,4-二-Me-苯基
48	4	3-Me-苯基	132	4	2,4-二-Me-苯基
49	1	2-Me-苯基	133	1	2,5-二-Me-苯基

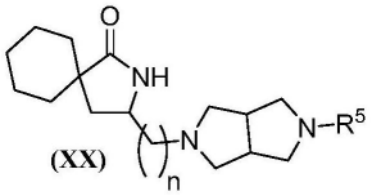
[2794]

50	2	2-Me-苯基	134	2	2,5-二-Me-苯基
51	3	2-Me-苯基	135	3	2,5-二-Me-苯基
52	4	2-Me-苯基	136	4	2,5-二-Me-苯基
53	1	4-F-苯基	137	1	2,6-二-Me-苯基
54	2	4-F-苯基	138	2	2,6-二-Me-苯基
55	3	4-F-苯基	139	3	2,6-二-Me-苯基
56	4	4-F-苯基	140	4	2,6-二-Me-苯基
57	1	3-F-苯基	141	1	2,6-二-iPr-苯基
58	2	3-F-苯基	142	2	2,6-二-iPr-苯基
59	3	3-F-苯基	143	3	2,6-二-iPr-苯基
60	4	3-F-苯基	144	4	2,6-二-iPr-苯基
61	1	2-F-苯基	145	1	2-吗啉代-苯基
62	2	2-F-苯基	146	2	2-吗啉代-苯基
63	3	2-F-苯基	147	3	2-吗啉代-苯基
64	4	2-F-苯基	148	4	2-吗啉代-苯基
65	1	4-Cl-苯基	149	1	3-吗啉代-苯基
66	2	4-Cl-苯基	150	2	3-吗啉代-苯基
67	3	4-Cl-苯基	151	3	3-吗啉代-苯基
68	4	4-Cl-苯基	152	4	3-吗啉代-苯基
69	1	3-Cl-苯基	153	1	4-吗啉代-苯基
70	2	3-Cl-苯基	154	2	4-吗啉代-苯基
71	3	3-Cl-苯基	155	3	4-吗啉代-苯基
72	4	3-Cl-苯基	156	4	4-吗啉代-苯基
73	1	2-Cl-苯基	157	1	4-CN-2-吗啉代-苯基
74	2	2-Cl-苯基	158	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
75	3	2-Cl-苯基	159	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
76	4	2-Cl-苯基	160	4	4-CN-2-吗啉代-苯基

[2795]

77	1	4-Br-苯基	161	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
78	2	4-Br-苯基	162	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
79	3	4-Br-苯基	163	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
80	4	4-Br-苯基	164	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
81	1	3-Br-苯基	165	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
82	2	3-Br-苯基	166	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
83	3	3-Br-苯基	167	3	4-OH-2-吗啉代-苯基
84	4	3-Br-苯基	168	4	4-OH-2-吗啉代-苯基
85	1	亚萘-1-基	173	1	亚萘-2-基
86	2	亚萘-1-基	174	2	亚萘-2-基
87	3	亚萘-1-基	175	3	亚萘-2-基
88	4	亚萘-1-基	176	4	亚萘-2-基

[2796] 示例性实施方案包括具有式(XX)的化合物

[2797] 

(XX)

[2798] 或其可药用盐形式,如在下文表14中所定义。

[2799] 表14:

[2800]

条目	n	R^5	条目	n	R^5
1	1	苯基	85	1	2-Br-苯基
2	2	苯基	86	2	2-Br-苯基
3	3	苯基	87	3	2-Br-苯基
4	4	苯基	88	4	2-Br-苯基
5	1	4-OH-苯基	89	1	4-CF_3-苯基
6	2	4-OH-苯基	90	2	4-CF_3-苯基
7	3	4-OH-苯基	91	3	4-CF_3-苯基
8	4	4-OH-苯基	92	4	4-CF_3-苯基
9	1	3-OH-苯基	93	1	3-CF_3-苯基

[2801]

10	2	3-OH-苯基	94	2	3-CF_3-苯基
11	3	3-OH-苯基	95	3	3-CF_3-苯基
12	4	3-OH-苯基	96	4	3-CF_3-苯基
13	1	2-OH-苯基	97	1	2-CF_3-苯基
14	2	2-OH-苯基	98	2	2-CF_3-苯基
15	3	2-OH-苯基	99	3	2-CF_3-苯基
16	4	2-OH-苯基	100	4	2-CF_3-苯基
17	1	4-OMe-苯基	101	1	4-iPr-苯基
18	2	4-OMe-苯基	102	2	4-iPr-苯基
19	3	4-OMe-苯基	103	3	4-iPr-苯基
20	4	4-OMe-苯基	104	4	4-iPr-苯基
21	1	3-OMe-苯基	105	1	3-iPr-苯基
22	2	3-OMe-苯基	106	2	3-iPr-苯基
23	3	3-OMe-苯基	107	3	3-iPr-苯基
24	4	3-OMe-苯基	108	4	3-iPr-苯基
25	1	2-OMe-苯基	109	1	2-iPr-苯基
26	2	2-OMe-苯基	110	2	2-iPr-苯基
27	3	2-OMe-苯基	111	3	2-iPr-苯基
28	4	2-OMe-苯基	112	4	2-iPr-苯基
29	1	4-CN-苯基	113	1	4-NH_2-苯基
30	2	4-CN-苯基	114	2	4-NH_2-苯基
31	3	4-CN-苯基	115	3	4-NH_2-苯基
32	4	4-CN-苯基	116	4	4-NH_2-苯基
33	1	3-CN-苯基	117	1	3-NH_2-苯基
34	2	3-CN-苯基	118	2	3-NH_2-苯基
35	3	3-CN-苯基	119	3	3-NH_2-苯基
36	4	3-CN-苯基	120	4	3-NH_2-苯基

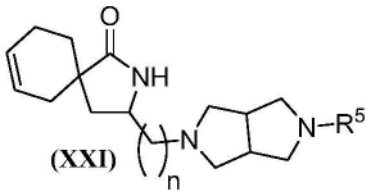
[2802]

37	1	2-CN-苯基	121	1	2-NH_2-苯基
38	2	2-CN-苯基	122	2	2-NH_2-苯基
39	3	2-CN-苯基	123	3	2-NH_2-苯基
40	4	2-CN-苯基	124	4	2-NH_2-苯基
41	1	4-Me-苯基	125	1	2,3-二-Me-苯基
42	2	4-Me-苯基	126	2	2,3-二-Me-苯基
43	3	4-Me-苯基	127	3	2,3-二-Me-苯基
44	4	4-Me-苯基	128	4	2,3-二-Me-苯基
45	1	3-Me-苯基	129	1	2,4-二-Me-苯基
46	2	3-Me-苯基	130	2	2,4-二-Me-苯基
47	3	3-Me-苯基	131	3	2,4-二-Me-苯基
48	4	3-Me-苯基	132	4	2,4-二-Me-苯基
49	1	2-Me-苯基	133	1	2,5-二-Me-苯基
50	2	2-Me-苯基	134	2	2,5-二-Me-苯基
51	3	2-Me-苯基	135	3	2,5-二-Me-苯基
52	4	2-Me-苯基	136	4	2,5-二-Me-苯基
53	1	4-F-苯基	137	1	2,6-二-Me-苯基
54	2	4-F-苯基	138	2	2,6-二-Me-苯基
55	3	4-F-苯基	139	3	2,6-二-Me-苯基
56	4	4-F-苯基	140	4	2,6-二-Me-苯基
57	1	3-F-苯基	141	1	2,6-二-iPr-苯基
58	2	3-F-苯基	142	2	2,6-二-iPr-苯基
59	3	3-F-苯基	143	3	2,6-二-iPr-苯基
60	4	3-F-苯基	144	4	2,6-二-iPr-苯基
61	1	2-F-苯基	145	1	2-吗啉代-苯基
62	2	2-F-苯基	146	2	2-吗啉代-苯基
63	3	2-F-苯基	147	3	2-吗啉代-苯基

[2803]

64	4	2-F-苯基	148	4	2-吗啉代-苯基
65	1	4-Cl-苯基	149	1	3-吗啉代-苯基
66	2	4-Cl-苯基	150	2	3-吗啉代-苯基
67	3	4-Cl-苯基	151	3	3-吗啉代-苯基
68	4	4-Cl-苯基	152	4	3-吗啉代-苯基
69	1	3-Cl-苯基	153	1	4-吗啉代-苯基
70	2	3-Cl-苯基	154	2	4-吗啉代-苯基
71	3	3-Cl-苯基	155	3	4-吗啉代-苯基
72	4	3-Cl-苯基	156	4	4-吗啉代-苯基
73	1	2-Cl-苯基	157	1	4-CN-2-吗啉代-苯基
74	2	2-Cl-苯基	158	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
75	3	2-Cl-苯基	159	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
76	4	2-Cl-苯基	160	4	4-CN-2-吗啉代-苯基
77	1	4-Br-苯基	161	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
78	2	4-Br-苯基	162	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
79	3	4-Br-苯基	163	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
80	4	4-Br-苯基	164	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
81	1	3-Br-苯基	165	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
82	2	3-Br-苯基	166	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
83	3	3-Br-苯基	167	3	4-OH-2-吗啉代-苯基
84	4	3-Br-苯基	168	4	4-OH-2-吗啉代-苯基
85	1	亚萘-1-基	173	1	亚萘-2-基
86	2	亚萘-1-基	174	2	亚萘-2-基
87	3	亚萘-1-基	175	3	亚萘-2-基
88	4	亚萘-1-基	176	4	亚萘-2-基

[2804] 示例性实施方案包括具有式(XXI)的化合物

[2805] 

(XXI)

[2806] 或其可药用盐形式,如在下文表15中所定义。

[2807] 表15:

[2808]

条目	n	R^5	条目	n	R^5
1	1	苯基	85	1	2-Br-苯基
2	2	苯基	86	2	2-Br-苯基
3	3	苯基	87	3	2-Br-苯基
4	4	苯基	88	4	2-Br-苯基
5	1	4-OH-苯基	89	1	4-CF_3-苯基
6	2	4-OH-苯基	90	2	4-CF_3-苯基
7	3	4-OH-苯基	91	3	4-CF_3-苯基
8	4	4-OH-苯基	92	4	4-CF_3-苯基
9	1	3-OH-苯基	93	1	3-CF_3-苯基
10	2	3-OH-苯基	94	2	3-CF_3-苯基
11	3	3-OH-苯基	95	3	3-CF_3-苯基
12	4	3-OH-苯基	96	4	3-CF_3-苯基
13	1	2-OH-苯基	97	1	2-CF_3-苯基
14	2	2-OH-苯基	98	2	2-CF_3-苯基
15	3	2-OH-苯基	99	3	2-CF_3-苯基
16	4	2-OH-苯基	100	4	2-CF_3-苯基
17	1	4-OMe-苯基	101	1	4-iPr-苯基
18	2	4-OMe-苯基	102	2	4-iPr-苯基
19	3	4-OMe-苯基	103	3	4-iPr-苯基
20	4	4-OMe-苯基	104	4	4-iPr-苯基
21	1	3-OMe-苯基	105	1	3-iPr-苯基
22	2	3-OMe-苯基	106	2	3-iPr-苯基

[2809]

23	3	3-OMe-苯基	107	3	3-iPr-苯基
24	4	3-OMe-苯基	108	4	3-iPr-苯基
25	1	2-OMe-苯基	109	1	2-iPr-苯基
26	2	2-OMe-苯基	110	2	2-iPr-苯基
27	3	2-OMe-苯基	111	3	2-iPr-苯基
28	4	2-OMe-苯基	112	4	2-iPr-苯基
29	1	4-CN-苯基	113	1	4-NH_2-苯基
30	2	4-CN-苯基	114	2	4-NH_2-苯基
31	3	4-CN-苯基	115	3	4-NH_2-苯基
32	4	4-CN-苯基	116	4	4-NH_2-苯基
33	1	3-CN-苯基	117	1	3-NH_2-苯基
34	2	3-CN-苯基	118	2	3-NH_2-苯基
35	3	3-CN-苯基	119	3	3-NH_2-苯基
36	4	3-CN-苯基	120	4	3-NH_2-苯基
37	1	2-CN-苯基	121	1	2-NH_2-苯基
38	2	2-CN-苯基	122	2	2-NH_2-苯基
39	3	2-CN-苯基	123	3	2-NH_2-苯基
40	4	2-CN-苯基	124	4	2-NH_2-苯基
41	1	4-Me-苯基	125	1	2,3-二-Me-苯基
42	2	4-Me-苯基	126	2	2,3-二-Me-苯基
43	3	4-Me-苯基	127	3	2,3-二-Me-苯基
44	4	4-Me-苯基	128	4	2,3-二-Me-苯基
45	1	3-Me-苯基	129	1	2,4-二-Me-苯基
46	2	3-Me-苯基	130	2	2,4-二-Me-苯基
47	3	3-Me-苯基	131	3	2,4-二-Me-苯基
48	4	3-Me-苯基	132	4	2,4-二-Me-苯基
49	1	2-Me-苯基	133	1	2,5-二-Me-苯基

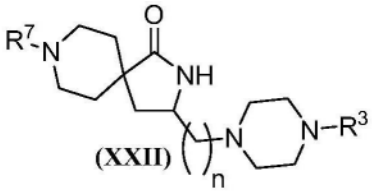
[2810]

50	2	2-Me-苯基	134	2	2,5-二-Me-苯基
51	3	2-Me-苯基	135	3	2,5-二-Me-苯基
52	4	2-Me-苯基	136	4	2,5-二-Me-苯基
53	1	4-F-苯基	137	1	2,6-二-Me-苯基
54	2	4-F-苯基	138	2	2,6-二-Me-苯基
55	3	4-F-苯基	139	3	2,6-二-Me-苯基
56	4	4-F-苯基	140	4	2,6-二-Me-苯基
57	1	3-F-苯基	141	1	2,6-二-iPr-苯基
58	2	3-F-苯基	142	2	2,6-二-iPr-苯基
59	3	3-F-苯基	143	3	2,6-二-iPr-苯基
60	4	3-F-苯基	144	4	2,6-二-iPr-苯基
61	1	2-F-苯基	145	1	2-吗啉代-苯基
62	2	2-F-苯基	146	2	2-吗啉代-苯基
63	3	2-F-苯基	147	3	2-吗啉代-苯基
64	4	2-F-苯基	148	4	2-吗啉代-苯基
65	1	4-Cl-苯基	149	1	3-吗啉代-苯基
66	2	4-Cl-苯基	150	2	3-吗啉代-苯基
67	3	4-Cl-苯基	151	3	3-吗啉代-苯基
68	4	4-Cl-苯基	152	4	3-吗啉代-苯基
69	1	3-Cl-苯基	153	1	4-吗啉代-苯基
70	2	3-Cl-苯基	154	2	4-吗啉代-苯基
71	3	3-Cl-苯基	155	3	4-吗啉代-苯基
72	4	3-Cl-苯基	156	4	4-吗啉代-苯基
73	1	2-Cl-苯基	157	1	4-CN-2-吗啉代-苯基
74	2	2-Cl-苯基	158	2	4-CN-2-吗啉代-苯基
75	3	2-Cl-苯基	159	3	4-CN-2-吗啉代-苯基
76	4	2-Cl-苯基	160	4	4-CN-2-吗啉代-苯基

[2811]

77	1	4-Br-苯基	161	1	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
78	2	4-Br-苯基	162	2	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
79	3	4-Br-苯基	163	3	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
80	4	4-Br-苯基	164	4	4-CH_3-2-吗啉代-苯基
81	1	3-Br-苯基	165	1	4-OH-2-吗啉代-苯基
82	2	3-Br-苯基	166	2	4-OH-2-吗啉代-苯基
83	3	3-Br-苯基	167	3	4-OH-2-吗啉代-苯基
84	4	3-Br-苯基	168	4	4-OH-2-吗啉代-苯基
85	1	亚萘-1-基	173	1	亚萘-2-基
86	2	亚萘-1-基	174	2	亚萘-2-基
87	3	亚萘-1-基	175	3	亚萘-2-基
88	4	亚萘-1-基	176	4	亚萘-2-基

[2812] 示例性实施方案包括具有式(XXII)的化合物

[2813] 

[2814] 或其可药用盐形式,如在下文表16中所定义。

[2815] 表16:

[2816]

条目	n	R^7	R^3	条目	n	R^7	R^3
1	1	H	苯基	779	1	H	4-OH-苯基
2	2	H	苯基	780	2	H	4-OH-苯基
3	3	H	苯基	781	3	H	4-OH-苯基
4	4	H	苯基	782	4	H	4-OH-苯基
5	1	Me	苯基	783	1	Me	4-OH-苯基
6	2	Me	苯基	784	2	Me	4-OH-苯基
7	3	Me	苯基	785	3	Me	4-OH-苯基
8	4	Me	苯基	786	4	Me	4-OH-苯基
9	1	CH_2Ph	苯基	787	1	CH_2Ph	4-OH-苯基

[2817]

10	2	CH_2Ph	苯基	788	2	CH_2Ph	4-OH-苯基
11	3	CH_2Ph	苯基	789	3	CH_2Ph	4-OH-苯基
12	4	CH_2Ph	苯基	790	4	CH_2Ph	4-OH-苯基
13	1	COMe	苯基	791	1	COMe	4-OH-苯基
14	2	COMe	苯基	792	2	COMe	4-OH-苯基
15	3	COMe	苯基	793	3	COMe	4-OH-苯基
16	4	COMe	苯基	794	4	COMe	4-OH-苯基
17	1	CO_2Me	苯基	795	1	CO_2Me	4-OH-苯基
18	2	CO_2Me	苯基	796	2	CO_2Me	4-OH-苯基
19	3	CO_2Me	苯基	797	3	CO_2Me	4-OH-苯基
20	4	CO_2Me	苯基	798	4	CO_2Me	4-OH-苯基
21	1	CO_2tBu	苯基	799	1	CO_2tBu	4-OH-苯基
22	2	CO_2tBu	苯基	800	2	CO_2tBu	4-OH-苯基
23	3	CO_2tBu	苯基	801	3	CO_2tBu	4-OH-苯基
24	4	CO_2tBu	苯基	802	4	CO_2tBu	4-OH-苯基
25	1	CONHMe	苯基	803	1	CONHMe	4-OH-苯基
26	2	CONHMe	苯基	804	2	CONHMe	4-OH-苯基
27	3	CONHMe	苯基	805	3	CONHMe	4-OH-苯基
28	4	CONHMe	苯基	806	4	CONHMe	4-OH-苯基
29	1	SO_2Me	苯基	807	1	SO_2Me	4-OH-苯基
30	2	SO_2Me	苯基	808	2	SO_2Me	4-OH-苯基
31	3	SO_2Me	苯基	809	3	SO_2Me	4-OH-苯基
32	4	SO_2Me	苯基	810	4	SO_2Me	4-OH-苯基
33	1	SO_2NH_2	苯基	811	1	SO_2NH_2	4-OH-苯基
34	2	SO_2NH_2	苯基	812	2	SO_2NH_2	4-OH-苯基
35	3	SO_2NH_2	苯基	813	3	SO_2NH_2	4-OH-苯基
36	4	SO_2NH_2	苯基	814	4	SO_2NH_2	4-OH-苯基

[2818]

37	1	H	3-OH-苯基	815	1	H	2-OH-苯基
38	2	H	3-OH-苯基	816	2	H	2-OH-苯基
39	3	H	3-OH-苯基	817	3	H	2-OH-苯基
40	4	H	3-OH-苯基	818	4	H	2-OH-苯基
41	1	Me	3-OH-苯基	819	1	Me	2-OH-苯基
42	2	Me	3-OH-苯基	820	2	Me	2-OH-苯基
43	3	Me	3-OH-苯基	821	3	Me	2-OH-苯基
44	4	Me	3-OH-苯基	822	4	Me	2-OH-苯基
45	1	CH_2Ph	3-OH-苯基	823	1	CH_2Ph	2-OH-苯基
46	2	CH_2Ph	3-OH-苯基	824	2	CH_2Ph	2-OH-苯基
47	3	CH_2Ph	3-OH-苯基	825	3	CH_2Ph	2-OH-苯基
48	4	CH_2Ph	3-OH-苯基	826	4	CH_2Ph	2-OH-苯基
49	1	COMe	3-OH-苯基	827	1	COMe	2-OH-苯基
50	2	COMe	3-OH-苯基	828	2	COMe	2-OH-苯基
51	3	COMe	3-OH-苯基	829	3	COMe	2-OH-苯基
52	4	COMe	3-OH-苯基	830	4	COMe	2-OH-苯基
53	1	CO_2Me	3-OH-苯基	831	1	CO_2Me	2-OH-苯基
54	2	CO_2Me	3-OH-苯基	832	2	CO_2Me	2-OH-苯基
55	3	CO_2Me	3-OH-苯基	833	3	CO_2Me	2-OH-苯基
56	4	CO_2Me	3-OH-苯基	834	4	CO_2Me	2-OH-苯基
57	1	CO_2tBu	3-OH-苯基	835	1	CO_2tBu	2-OH-苯基
58	2	CO_2tBu	3-OH-苯基	836	2	CO_2tBu	2-OH-苯基
59	3	CO_2tBu	3-OH-苯基	837	3	CO_2tBu	2-OH-苯基
60	4	CO_2tBu	3-OH-苯基	838	4	CO_2tBu	2-OH-苯基
61	1	CONHMe	3-OH-苯基	839	1	CONHMe	2-OH-苯基
62	2	CONHMe	3-OH-苯基	840	2	CONHMe	2-OH-苯基
63	3	CONHMe	3-OH-苯基	841	3	CONHMe	2-OH-苯基

[2819]

64	4	CONHMe	3-OH-苯基	842	4	CONHMe	2-OH-苯基
65	1	SO_2Me	3-OH-苯基	843	1	SO_2Me	2-OH-苯基
66	2	SO_2Me	3-OH-苯基	844	2	SO_2Me	2-OH-苯基
67	3	SO_2Me	3-OH-苯基	845	3	SO_2Me	2-OH-苯基
68	4	SO_2Me	3-OH-苯基	846	4	SO_2Me	2-OH-苯基
69	1	SO_2NH_2	3-OH-苯基	847	1	SO_2NH_2	2-OH-苯基
70	2	SO_2NH_2	3-OH-苯基	848	2	SO_2NH_2	2-OH-苯基
71	3	SO_2NH_2	3-OH-苯基	849	3	SO_2NH_2	2-OH-苯基
72	4	SO_2NH_2	3-OH-苯基	850	4	SO_2NH_2	2-OH-苯基
73	1	H	4-NO_2-苯基	851	1	H	4-OMe-苯基
74	2	H	4-NO_2-苯基	852	2	H	4-OMe-苯基
75	3	H	4-NO_2-苯基	853	3	H	4-OMe-苯基
76	4	H	4-NO_2-苯基	854	4	H	4-OMe-苯基
77	1	Me	4-NO_2-苯基	855	1	Me	4-OMe-苯基
78	2	Me	4-NO_2-苯基	856	2	Me	4-OMe-苯基
79	3	Me	4-NO_2-苯基	857	3	Me	4-OMe-苯基
80	4	Me	4-NO_2-苯基	858	4	Me	4-OMe-苯基
81	1	CH_2Ph	4-NO_2-苯基	859	1	CH_2Ph	4-OMe-苯基
82	2	CH_2Ph	4-NO_2-苯基	860	2	CH_2Ph	4-OMe-苯基
83	3	CH_2Ph	4-NO_2-苯基	861	3	CH_2Ph	4-OMe-苯基
84	4	CH_2Ph	4-NO_2-苯基	862	4	CH_2Ph	4-OMe-苯基
85	1	COMe	4-NO_2-苯基	863	1	COMe	4-OMe-苯基
86	2	COMe	4-NO_2-苯基	864	2	COMe	4-OMe-苯基
87	3	COMe	4-NO_2-苯基	865	3	COMe	4-OMe-苯基
88	4	COMe	4-NO_2-苯基	866	4	COMe	4-OMe-苯基
89	1	CO_2Me	4-NO_2-苯基	867	1	CO_2Me	4-OMe-苯基
90	2	CO_2Me	4-NO_2-苯基	868	2	CO_2Me	4-OMe-苯基

[2820]

91	3	CO_2Me	4-NO_2-苯基	869	3	CO_2Me	4-OMe-苯基
92	4	CO_2Me	4-NO_2-苯基	870	4	CO_2Me	4-OMe-苯基
93	1	CO_2tBu	4-NO_2-苯基	871	1	CO_2tBu	4-OMe-苯基
94	2	CO_2tBu	4-NO_2-苯基	872	2	CO_2tBu	4-OMe-苯基
95	3	CO_2tBu	4-NO_2-苯基	873	3	CO_2tBu	4-OMe-苯基
96	4	CO_2tBu	4-NO_2-苯基	874	4	CO_2tBu	4-OMe-苯基
97	1	CONHMe	4-NO_2-苯基	875	1	CONHMe	4-OMe-苯基
98	2	CONHMe	4-NO_2-苯基	876	2	CONHMe	4-OMe-苯基
99	3	CONHMe	4-NO_2-苯基	877	3	CONHMe	4-OMe-苯基
100	4	CONHMe	4-NO_2-苯基	878	4	CONHMe	4-OMe-苯基
101	1	SO_2Me	4-NO_2-苯基	879	1	SO_2Me	4-OMe-苯基
102	2	SO_2Me	4-NO_2-苯基	880	2	SO_2Me	4-OMe-苯基
103	3	SO_2Me	4-NO_2-苯基	881	3	SO_2Me	4-OMe-苯基
104	4	SO_2Me	4-NO_2-苯基	882	4	SO_2Me	4-OMe-苯基
105	1	SO_2NH_2	4-NO_2-苯基	883	1	SO_2NH_2	4-OMe-苯基
106	2	SO_2NH_2	4-NO_2-苯基	884	2	SO_2NH_2	4-OMe-苯基
107	3	SO_2NH_2	4-NO_2-苯基	885	3	SO_2NH_2	4-OMe-苯基
108	4	SO_2NH_2	4-NO_2-苯基	886	4	SO_2NH_2	4-OMe-苯基
109	1	H	3-OMe-苯基	887	1	H	2-OMe-苯基
110	2	H	3-OMe-苯基	888	2	H	2-OMe-苯基
111	3	H	3-OMe-苯基	889	3	H	2-OMe-苯基
112	4	H	3-OMe-苯基	890	4	H	2-OMe-苯基
113	1	Me	3-OMe-苯基	891	1	Me	2-OMe-苯基
114	2	Me	3-OMe-苯基	892	2	Me	2-OMe-苯基
115	3	Me	3-OMe-苯基	893	3	Me	2-OMe-苯基
116	4	Me	3-OMe-苯基	894	4	Me	2-OMe-苯基
117	1	CH_2Ph	3-OMe-苯基	895	1	CH_2Ph	2-OMe-苯基

[2821]

118	2	CH_2Ph	3-OMe-苯基	896	2	CH_2Ph	2-OMe-苯基
119	3	CH_2Ph	3-OMe-苯基	897	3	CH_2Ph	2-OMe-苯基
120	4	CH_2Ph	3-OMe-苯基	898	4	CH_2Ph	2-OMe-苯基
121	1	COMe	3-OMe-苯基	899	1	COMe	2-OMe-苯基
122	2	COMe	3-OMe-苯基	900	2	COMe	2-OMe-苯基
123	3	COMe	3-OMe-苯基	901	3	COMe	2-OMe-苯基
124	4	COMe	3-OMe-苯基	902	4	COMe	2-OMe-苯基
125	1	CO_2Me	3-OMe-苯基	903	1	CO_2Me	2-OMe-苯基
126	2	CO_2Me	3-OMe-苯基	904	2	CO_2Me	2-OMe-苯基
127	3	CO_2Me	3-OMe-苯基	905	3	CO_2Me	2-OMe-苯基
128	4	CO_2Me	3-OMe-苯基	906	4	CO_2Me	2-OMe-苯基
129	1	CO_2tBu	3-OMe-苯基	907	1	CO_2tBu	2-OMe-苯基
130	2	CO_2tBu	3-OMe-苯基	908	2	CO_2tBu	2-OMe-苯基
131	3	CO_2tBu	3-OMe-苯基	909	3	CO_2tBu	2-OMe-苯基
132	4	CO_2tBu	3-OMe-苯基	910	4	CO_2tBu	2-OMe-苯基
133	1	CONHMe	3-OMe-苯基	911	1	CONHMe	2-OMe-苯基
134	2	CONHMe	3-OMe-苯基	912	2	CONHMe	2-OMe-苯基
135	3	CONHMe	3-OMe-苯基	913	3	CONHMe	2-OMe-苯基
136	4	CONHMe	3-OMe-苯基	914	4	CONHMe	2-OMe-苯基
137	1	SO_2Me	3-OMe-苯基	915	1	SO_2Me	2-OMe-苯基
138	2	SO_2Me	3-OMe-苯基	916	2	SO_2Me	2-OMe-苯基
139	3	SO_2Me	3-OMe-苯基	917	3	SO_2Me	2-OMe-苯基
140	4	SO_2Me	3-OMe-苯基	918	4	SO_2Me	2-OMe-苯基
141	1	SO_2NH_2	3-OMe-苯基	919	1	SO_2NH_2	2-OMe-苯基
142	2	SO_2NH_2	3-OMe-苯基	920	2	SO_2NH_2	2-OMe-苯基
143	3	SO_2NH_2	3-OMe-苯基	921	3	SO_2NH_2	2-OMe-苯基
144	4	SO_2NH_2	3-OMe-苯基	922	4	SO_2NH_2	2-OMe-苯基

[2822]

145	1	H	4-CN-苯基	923	1	H	3-CN-苯基
146	2	H	4-CN-苯基	924	2	H	3-CN-苯基
147	3	H	4-CN-苯基	925	3	H	3-CN-苯基
148	4	H	4-CN-苯基	926	4	H	3-CN-苯基
149	1	Me	4-CN-苯基	927	1	Me	3-CN-苯基
150	2	Me	4-CN-苯基	928	2	Me	3-CN-苯基
151	3	Me	4-CN-苯基	929	3	Me	3-CN-苯基
152	4	Me	4-CN-苯基	930	4	Me	3-CN-苯基
153	1	CH_2Ph	4-CN-苯基	931	1	CH_2Ph	3-CN-苯基
154	2	CH_2Ph	4-CN-苯基	932	2	CH_2Ph	3-CN-苯基
155	3	CH_2Ph	4-CN-苯基	933	3	CH_2Ph	3-CN-苯基
156	4	CH_2Ph	4-CN-苯基	934	4	CH_2Ph	3-CN-苯基
157	1	COMe	4-CN-苯基	935	1	COMe	3-CN-苯基
158	2	COMe	4-CN-苯基	936	2	COMe	3-CN-苯基
159	3	COMe	4-CN-苯基	937	3	COMe	3-CN-苯基
160	4	COMe	4-CN-苯基	938	4	COMe	3-CN-苯基
161	1	CO_2Me	4-CN-苯基	939	1	CO_2Me	3-CN-苯基
162	2	CO_2Me	4-CN-苯基	940	2	CO_2Me	3-CN-苯基
163	3	CO_2Me	4-CN-苯基	941	3	CO_2Me	3-CN-苯基
164	4	CO_2Me	4-CN-苯基	942	4	CO_2Me	3-CN-苯基
165	1	CO_2tBu	4-CN-苯基	943	1	CO_2tBu	3-CN-苯基
166	2	CO_2tBu	4-CN-苯基	944	2	CO_2tBu	3-CN-苯基
167	3	CO_2tBu	4-CN-苯基	945	3	CO_2tBu	3-CN-苯基
168	4	CO_2tBu	4-CN-苯基	946	4	CO_2tBu	3-CN-苯基
169	1	CONHMe	4-CN-苯基	947	1	CONHMe	3-CN-苯基
170	2	CONHMe	4-CN-苯基	948	2	CONHMe	3-CN-苯基
171	3	CONHMe	4-CN-苯基	949	3	CONHMe	3-CN-苯基

[2823]

172	4	CONHMe	4-CN-苯基	950	4	CONHMe	3-CN-苯基
173	1	SO_2Me	4-CN-苯基	951	1	SO_2Me	3-CN-苯基
174	2	SO_2Me	4-CN-苯基	952	2	SO_2Me	3-CN-苯基
175	3	SO_2Me	4-CN-苯基	953	3	SO_2Me	3-CN-苯基
176	4	SO_2Me	4-CN-苯基	954	4	SO_2Me	3-CN-苯基
177	1	SO_2NH_2	4-CN-苯基	955	1	SO_2NH_2	3-CN-苯基
178	2	SO_2NH_2	4-CN-苯基	956	2	SO_2NH_2	3-CN-苯基
179	3	SO_2NH_2	4-CN-苯基	957	3	SO_2NH_2	3-CN-苯基
180	4	SO_2NH_2	4-CN-苯基	958	4	SO_2NH_2	3-CN-苯基
181	1	H	2-CN-苯基	959	1	H	2-Me-苯基
182	2	H	2-CN-苯基	960	2	H	2-Me-苯基
183	3	H	2-CN-苯基	961	3	H	2-Me-苯基
184	4	H	2-CN-苯基	962	4	H	2-Me-苯基
185	1	Me	2-CN-苯基	963	1	Me	2-Me-苯基
186	2	Me	2-CN-苯基	964	2	Me	2-Me-苯基
187	3	Me	2-CN-苯基	965	3	Me	2-Me-苯基
188	4	Me	2-CN-苯基	966	4	Me	2-Me-苯基
189	1	CH_2Ph	2-CN-苯基	967	1	CH_2Ph	2-Me-苯基
190	2	CH_2Ph	2-CN-苯基	968	2	CH_2Ph	2-Me-苯基
191	3	CH_2Ph	2-CN-苯基	969	3	CH_2Ph	2-Me-苯基
192	4	CH_2Ph	2-CN-苯基	970	4	CH_2Ph	2-Me-苯基
193	1	COMe	2-CN-苯基	971	1	COMe	2-Me-苯基
194	2	COMe	2-CN-苯基	972	2	COMe	2-Me-苯基
195	3	COMe	2-CN-苯基	973	3	COMe	2-Me-苯基
196	4	COMe	2-CN-苯基	974	4	COMe	2-Me-苯基
197	1	CO_2Me	2-CN-苯基	975	1	CO_2Me	2-Me-苯基
198	2	CO_2Me	2-CN-苯基	976	2	CO_2Me	2-Me-苯基

[2824]

199	3	CO_2Me	2-CN-苯基	977	3	CO_2Me	2-Me-苯基
200	4	CO_2Me	2-CN-苯基	978	4	CO_2Me	2-CN-苯基
201	1	CO_2tBu	2-CN-苯基	979	1	CO_2tBu	2-Me-苯基
202	2	CO_2tBu	2-CN-苯基	980	2	CO_2tBu	2-Me-苯基
203	3	CO_2tBu	2-CN-苯基	981	3	CO_2tBu	2-Me-苯基
204	4	CO_2tBu	2-CN-苯基	982	4	CO_2tBu	2-Me-苯基
205	1	CONHMe	2-CN-苯基	983	1	CONHMe	2-Me-苯基
206	2	CONHMe	2-CN-苯基	984	2	CONHMe	2-Me-苯基
207	3	CONHMe	2-CN-苯基	985	3	CONHMe	2-Me-苯基
208	4	CONHMe	2-CN-苯基	986	4	CONHMe	2-Me-苯基
209	1	SO_2Me	2-CN-苯基	987	1	SO_2Me	2-Me-苯基
210	2	SO_2Me	2-CN-苯基	988	2	SO_2Me	2-Me-苯基
211	3	SO_2Me	2-CN-苯基	989	3	SO_2Me	2-Me-苯基
212	4	SO_2Me	2-CN-苯基	990	4	SO_2Me	2-Me-苯基
213	1	SO_2NH_2	2-CN-苯基	991	1	SO_2NH_2	2-Me-苯基
214	2	SO_2NH_2	2-CN-苯基	992	2	SO_2NH_2	2-Me-苯基
215	3	SO_2NH_2	2-CN-苯基	993	3	SO_2NH_2	2-Me-苯基
216	4	SO_2NH_2	2-CN-苯基	994	4	SO_2NH_2	2-Me-苯基
217	1	H	3-Me-苯基	995	1	H	4-Me-苯基
218	2	H	3-Me-苯基	996	2	H	4-Me-苯基
219	3	H	3-Me-苯基	997	3	H	4-Me-苯基
220	4	H	3-Me-苯基	998	4	H	4-Me-苯基
221	1	Me	3-Me-苯基	999	1	Me	4-Me-苯基
222	2	Me	3-Me-苯基	1000	2	Me	4-Me-苯基
223	3	Me	3-Me-苯基	1001	3	Me	4-Me-苯基
224	4	Me	3-Me-苯基	1002	4	Me	4-Me-苯基
225	1	CH_2Ph	3-Me-苯基	1003	1	CH_2Ph	4-Me-苯基

[2825]

226	2	CH_2Ph	3-Me-苯基	1004	2	CH_2Ph	4-Me-苯基
227	3	CH_2Ph	3-Me-苯基	1005	3	CH_2Ph	4-Me-苯基
228	4	CH_2Ph	3-Me-苯基	1006	4	CH_2Ph	4-Me-苯基
229	1	COMe	3-Me-苯基	1007	1	COMe	4-Me-苯基
230	2	COMe	3-Me-苯基	1008	2	COMe	4-Me-苯基
231	3	COMe	3-Me-苯基	1009	3	COMe	4-Me-苯基
232	4	COMe	3-Me-苯基	1010	4	COMe	4-Me-苯基
233	1	CO_2Me	3-Me-苯基	1011	1	CO_2Me	4-Me-苯基
234	2	CO_2Me	3-Me-苯基	1012	2	CO_2Me	4-Me-苯基
235	3	CO_2Me	3-Me-苯基	1013	3	CO_2Me	4-Me-苯基
236	4	CO_2Me	3-Me-苯基	1014	4	CO_2Me	4-Me-苯基
237	1	CO_2tBu	3-Me-苯基	1015	1	CO_2tBu	4-Me-苯基
238	2	CO_2tBu	3-Me-苯基	1016	2	CO_2tBu	4-Me-苯基
239	3	CO_2tBu	3-Me-苯基	1017	3	CO_2tBu	4-Me-苯基
240	4	CO_2tBu	3-Me-苯基	1018	4	CO_2tBu	4-Me-苯基
241	1	CONHMe	3-Me-苯基	1019	1	CONHMe	4-Me-苯基
242	2	CONHMe	3-Me-苯基	1020	2	CONHMe	4-Me-苯基
243	3	CONHMe	3-Me-苯基	1021	3	CONHMe	4-Me-苯基
244	4	CONHMe	3-Me-苯基	1022	4	CONHMe	4-Me-苯基
245	1	SO_2Me	3-Me-苯基	1023	1	SO_2Me	4-Me-苯基
246	2	SO_2Me	3-Me-苯基	1024	2	SO_2Me	4-Me-苯基
247	3	SO_2Me	3-Me-苯基	1025	3	SO_2Me	4-Me-苯基
248	4	SO_2Me	3-Me-苯基	1026	4	SO_2Me	4-Me-苯基
249	1	SO_2NH_2	3-Me-苯基	1027	1	SO_2NH_2	4-Me-苯基
250	2	SO_2NH_2	3-Me-苯基	1028	2	SO_2NH_2	4-Me-苯基
251	3	SO_2NH_2	3-Me-苯基	1029	3	SO_2NH_2	4-Me-苯基
252	4	SO_2NH_2	3-Me-苯基	1030	4	SO_2NH_2	4-Me-苯基

[2826]

253	1	H	2-F-苯基	1031	1	H	3-F-苯基
254	2	H	2-F-苯基	1032	2	H	3-F-苯基
255	3	H	2-F-苯基	1033	3	H	3-F-苯基
256	4	H	2-F-苯基	1034	4	H	3-F-苯基
257	1	Me	2-F-苯基	1035	1	Me	3-F-苯基
258	2	Me	2-F-苯基	1036	2	Me	3-F-苯基
259	3	Me	2-F-苯基	1037	3	Me	3-F-苯基
260	4	Me	2-F-苯基	1038	4	Me	3-F-苯基
261	1	CH_2Ph	2-F-苯基	1039	1	CH_2Ph	3-F-苯基
262	2	CH_2Ph	2-F-苯基	1040	2	CH_2Ph	3-F-苯基
263	3	CH_2Ph	2-F-苯基	1041	3	CH_2Ph	3-F-苯基
264	4	CH_2Ph	2-F-苯基	1042	4	CH_2Ph	3-F-苯基
265	1	COMe	2-F-苯基	1043	1	COMe	3-F-苯基
266	2	COMe	2-F-苯基	1044	2	COMe	3-F-苯基
267	3	COMe	2-F-苯基	1045	3	COMe	3-F-苯基
268	4	COMe	2-F-苯基	1046	4	COMe	3-F-苯基
269	1	CO_2Me	2-F-苯基	1047	1	CO_2Me	3-F-苯基
270	2	CO_2Me	2-F-苯基	1048	2	CO_2Me	3-F-苯基
271	3	CO_2Me	2-F-苯基	1049	3	CO_2Me	3-F-苯基
272	4	CO_2Me	2-F-苯基	1050	4	CO_2Me	3-F-苯基
273	1	CO_2tBu	2-F-苯基	1051	1	CO_2tBu	3-F-苯基
274	2	CO_2tBu	2-F-苯基	1052	2	CO_2tBu	3-F-苯基
275	3	CO_2tBu	2-F-苯基	1053	3	CO_2tBu	3-F-苯基
276	4	CO_2tBu	2-F-苯基	1054	4	CO_2tBu	3-F-苯基
277	1	CONHMe	2-F-苯基	1055	1	CONHMe	3-F-苯基
278	2	CONHMe	2-F-苯基	1056	2	CONHMe	3-F-苯基
279	3	CONHMe	2-F-苯基	1057	3	CONHMe	3-F-苯基

[2827]

280	4	CONHMe	2-F-苯基	1058	4	CONHMe	3-F-苯基
281	1	SO_2Me	2-F-苯基	1059	1	SO_2Me	3-F-苯基
282	2	SO_2Me	2-F-苯基	1060	2	SO_2Me	3-F-苯基
283	3	SO_2Me	2-F-苯基	1061	3	SO_2Me	3-F-苯基
284	4	SO_2Me	2-F-苯基	1062	4	SO_2Me	3-F-苯基
285	1	SO_2NH_2	2-F-苯基	1063	1	SO_2NH_2	3-F-苯基
286	2	SO_2NH_2	2-F-苯基	1064	2	SO_2NH_2	3-F-苯基
287	3	SO_2NH_2	2-F-苯基	1065	3	SO_2NH_2	3-F-苯基
288	4	SO_2NH_2	2-F-苯基	1066	4	SO_2NH_2	3-F-苯基
289	1	H	4-F-苯基	1067	1	H	2-Cl-苯基
290	2	H	4-F-苯基	1068	2	H	2-Cl-苯基
291	3	H	4-F-苯基	1069	3	H	2-Cl-苯基
292	4	H	4-F-苯基	1070	4	H	2-Cl-苯基
293	1	Me	4-F-苯基	1071	1	Me	2-Cl-苯基
294	2	Me	4-F-苯基	1072	2	Me	2-Cl-苯基
295	3	Me	4-F-苯基	1073	3	Me	2-Cl-苯基
296	4	Me	4-F-苯基	1074	4	Me	2-Cl-苯基
297	1	CH_2Ph	4-F-苯基	1075	1	CH_2Ph	2-Cl-苯基
298	2	CH_2Ph	4-F-苯基	1076	2	CH_2Ph	2-Cl-苯基
299	3	CH_2Ph	4-F-苯基	1077	3	CH_2Ph	2-Cl-苯基
300	4	CH_2Ph	4-F-苯基	1078	4	CH_2Ph	2-Cl-苯基
301	1	COMe	4-F-苯基	1079	1	COMe	2-Cl-苯基
302	2	COMe	4-F-苯基	1080	2	COMe	2-Cl-苯基
303	3	COMe	4-F-苯基	1081	3	COMe	2-Cl-苯基
304	4	COMe	4-F-苯基	1082	4	COMe	2-Cl-苯基
305	1	CO_2Me	4-F-苯基	1083	1	CO_2Me	2-Cl-苯基
306	2	CO_2Me	4-F-苯基	1084	2	CO_2Me	2-Cl-苯基

[2828]

307	3	CO_2Me	4-F-苯基	1085	3	CO_2Me	2-Cl-苯基
308	4	CO_2Me	4-F-苯基	1086	4	CO_2Me	2-Cl-苯基
309	1	CO_2tBu	4-F-苯基	1087	1	CO_2tBu	2-Cl-苯基
310	2	CO_2tBu	4-F-苯基	1088	2	CO_2tBu	2-Cl-苯基
311	3	CO_2tBu	4-F-苯基	1089	3	CO_2tBu	2-Cl-苯基
312	4	CO_2tBu	4-F-苯基	1090	4	CO_2tBu	2-Cl-苯基
313	1	CONHMe	4-F-苯基	1091	1	CONHMe	2-Cl-苯基
314	2	CONHMe	4-F-苯基	1092	2	CONHMe	2-Cl-苯基
315	3	CONHMe	4-F-苯基	1093	3	CONHMe	2-Cl-苯基
316	4	CONHMe	4-F-苯基	1094	4	CONHMe	2-Cl-苯基
317	1	SO_2Me	4-F-苯基	1095	1	SO_2Me	2-Cl-苯基
318	2	SO_2Me	4-F-苯基	1096	2	SO_2Me	2-Cl-苯基
319	3	SO_2Me	4-F-苯基	1097	3	SO_2Me	2-Cl-苯基
320	4	SO_2Me	4-F-苯基	1098	4	SO_2Me	2-Cl-苯基
321	1	SO_2NH_2	4-F-苯基	1099	1	SO_2NH_2	2-Cl-苯基
322	2	SO_2NH_2	4-F-苯基	1100	2	SO_2NH_2	2-Cl-苯基
323	3	SO_2NH_2	4-F-苯基	1101	3	SO_2NH_2	2-Cl-苯基
324	4	SO_2NH_2	4-F-苯基	1102	4	SO_2NH_2	2-Cl-苯基
325	1	H	3-Cl-苯基	1103	1	H	4-Cl-苯基
326	2	H	3-Cl-苯基	1104	2	H	4-Cl-苯基
327	3	H	3-Cl-苯基	1105	3	H	4-Cl-苯基
328	4	H	3-Cl-苯基	1106	4	H	4-Cl-苯基
329	1	Me	3-Cl-苯基	1107	1	Me	4-Cl-苯基
330	2	Me	3-Cl-苯基	1108	2	Me	4-Cl-苯基
331	3	Me	3-Cl-苯基	1109	3	Me	4-Cl-苯基
332	4	Me	3-Cl-苯基	1110	4	Me	4-Cl-苯基
333	1	CH_2Ph	3-Cl-苯基	1111	1	CH_2Ph	4-Cl-苯基

[2829]

334	2	CH_2Ph	3-Cl-苯基	1112	2	CH_2Ph	4-Cl-苯基
335	3	CH_2Ph	3-Cl-苯基	1113	3	CH_2Ph	4-Cl-苯基
336	4	CH_2Ph	3-Cl-苯基	1114	4	CH_2Ph	4-Cl-苯基
337	1	COMe	3-Cl-苯基	1115	1	COMe	4-Cl-苯基
338	2	COMe	3-Cl-苯基	1116	2	COMe	4-Cl-苯基
339	3	COMe	3-Cl-苯基	1117	3	COMe	4-Cl-苯基
340	4	COMe	3-Cl-苯基	1118	4	COMe	4-Cl-苯基
341	1	CO_2Me	3-Cl-苯基	1119	1	CO_2Me	4-Cl-苯基
342	2	CO_2Me	3-Cl-苯基	1120	2	CO_2Me	4-Cl-苯基
343	3	CO_2Me	3-Cl-苯基	1121	3	CO_2Me	4-Cl-苯基
344	4	CO_2Me	3-Cl-苯基	1122	4	CO_2Me	4-Cl-苯基
345	1	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1123	1	CO_2tBu	4-Cl-苯基
346	2	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1124	2	CO_2tBu	4-Cl-苯基
347	3	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1125	3	CO_2tBu	4-Cl-苯基
348	4	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1126	4	CO_2tBu	4-Cl-苯基
349	1	CONHMe	3-Cl-苯基	1127	1	CONHMe	4-Cl-苯基
350	2	CONHMe	3-Cl-苯基	1128	2	CONHMe	4-Cl-苯基
351	3	CONHMe	3-Cl-苯基	1129	3	CONHMe	4-Cl-苯基
352	4	CONHMe	3-Cl-苯基	1130	4	CONHMe	4-Cl-苯基
353	1	SO_2Me	3-Cl-苯基	1131	1	SO_2Me	4-Cl-苯基
354	2	SO_2Me	3-Cl-苯基	1132	2	SO_2Me	4-Cl-苯基
355	3	SO_2Me	3-Cl-苯基	1133	3	SO_2Me	4-Cl-苯基
356	4	SO_2Me	3-Cl-苯基	1134	4	SO_2Me	4-Cl-苯基
357	1	SO_2NH_2	3-Cl-苯基	1135	1	SO_2NH_2	4-Cl-苯基
358	2	SO_2NH_2	3-Cl-苯基	1136	2	SO_2NH_2	4-Cl-苯基
359	3	SO_2NH_2	3-Cl-苯基	1137	3	SO_2NH_2	4-Cl-苯基
360	4	SO_2NH_2	3-Cl-苯基	1138	4	SO_2NH_2	4-Cl-苯基

[2830]

361	1	H	2-Br-苯基	1139	1	H	3-Br-苯基
362	2	H	2-Br-苯基	1140	2	H	3-Br-苯基
363	3	H	2-Br-苯基	1141	3	H	3-Br-苯基
364	4	H	2-Br-苯基	1142	4	H	3-Br-苯基
365	1	Me	2-Br-苯基	1143	1	Me	3-Br-苯基
366	2	Me	2-Br-苯基	1144	2	Me	3-Br-苯基
367	3	Me	2-Br-苯基	1145	3	Me	3-Br-苯基
368	4	Me	2-Br-苯基	1146	4	Me	3-Br-苯基
369	1	CH_2Ph	2-Br-苯基	1147	1	CH_2Ph	3-Br-苯基
370	2	CH_2Ph	2-Br-苯基	1148	2	CH_2Ph	3-Br-苯基
371	3	CH_2Ph	2-Br-苯基	1149	3	CH_2Ph	3-Br-苯基
372	4	CH_2Ph	2-Br-苯基	1150	4	CH_2Ph	3-Br-苯基
373	1	COMe	2-Br-苯基	1151	1	COMe	3-Br-苯基
374	2	COMe	2-Br-苯基	1152	2	COMe	3-Br-苯基
375	3	COMe	2-Br-苯基	1153	3	COMe	3-Br-苯基
376	4	COMe	2-Br-苯基	1154	4	COMe	3-Br-苯基
377	1	CO_2Me	2-Br-苯基	1155	1	CO_2Me	3-Br-苯基
378	2	CO_2Me	2-Br-苯基	1156	2	CO_2Me	3-Br-苯基
379	3	CO_2Me	2-Br-苯基	1157	3	CO_2Me	3-Br-苯基
380	4	CO_2Me	2-Br-苯基	1158	4	CO_2Me	3-Br-苯基
381	1	CO_2tBu	2-Br-苯基	1159	1	CO_2tBu	3-Br-苯基
382	2	CO_2tBu	2-Br-苯基	1160	2	CO_2tBu	3-Br-苯基
383	3	CO_2tBu	2-Br-苯基	1161	3	CO_2tBu	3-Br-苯基
384	4	CO_2tBu	2-Br-苯基	1162	4	CO_2tBu	3-Br-苯基
385	1	CONHMe	2-Br-苯基	1163	1	CONHMe	3-Br-苯基
386	2	CONHMe	2-Br-苯基	1164	2	CONHMe	3-Br-苯基
387	3	CONHMe	2-Br-苯基	1165	3	CONHMe	3-Br-苯基

[2831]

388	4	CONHMe	2-Br-苯基	1166	4	CONHMe	3-Br-苯基
389	1	SO_2Me	2-Br-苯基	1167	1	SO_2Me	3-Br-苯基
390	2	SO_2Me	2-Br-苯基	1168	2	SO_2Me	3-Br-苯基
391	3	SO_2Me	2-Br-苯基	1169	3	SO_2Me	3-Br-苯基
392	4	SO_2Me	2-Br-苯基	1170	4	SO_2Me	3-Br-苯基
393	1	SO_2NH_2	2-Br-苯基	1171	1	SO_2NH_2	3-Br-苯基
394	2	SO_2NH_2	2-Br-苯基	1172	2	SO_2NH_2	3-Br-苯基
395	3	SO_2NH_2	2-Br-苯基	1173	3	SO_2NH_2	3-Br-苯基
396	4	SO_2NH_2	2-Br-苯基	1174	4	SO_2NH_2	3-Br-苯基
397	1	H	4-Br-苯基	1175	1	H	2-CF_3-苯基
398	2	H	4-Br-苯基	1176	2	H	2-CF_3-苯基
399	3	H	4-Br-苯基	1177	3	H	2-CF_3-苯基
400	4	H	4-Br-苯基	1178	4	H	2-CF_3-苯基
401	1	Me	4-Br-苯基	1179	1	Me	2-CF_3-苯基
402	2	Me	4-Br-苯基	1180	2	Me	2-CF_3-苯基
403	3	Me	4-Br-苯基	1181	3	Me	2-CF_3-苯基
404	4	Me	4-Br-苯基	1182	4	Me	2-CF_3-苯基
405	1	CH_2Ph	4-Br-苯基	1183	1	CH_2Ph	2-CF_3-苯基
406	2	CH_2Ph	4-Br-苯基	1184	2	CH_2Ph	2-CF_3-苯基
407	3	CH_2Ph	4-Br-苯基	1185	3	CH_2Ph	2-CF_3-苯基
408	4	CH_2Ph	4-Br-苯基	1186	4	CH_2Ph	2-CF_3-苯基
409	1	COMe	4-Br-苯基	1187	1	COMe	2-CF_3-苯基
410	2	COMe	4-Br-苯基	1188	2	COMe	2-CF_3-苯基
411	3	COMe	4-Br-苯基	1189	3	COMe	2-CF_3-苯基
412	4	COMe	4-Br-苯基	1190	4	COMe	2-CF_3-苯基
413	1	CO_2Me	4-Br-苯基	1191	1	CO_2Me	2-CF_3-苯基
414	2	CO_2Me	4-Br-苯基	1192	2	CO_2Me	2-CF_3-苯基

[2832]

415	3	CO_2Me	4-Br-苯基	1193	3	CO_2Me	2-CF_3-苯基
416	4	CO_2Me	4-Br-苯基	1194	4	CO_2Me	2-CF_3-苯基
417	1	CO_2tBu	4-Br-苯基	1195	1	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
418	2	CO_2tBu	4-Br-苯基	1196	2	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
419	3	CO_2tBu	4-Br-苯基	1197	3	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
420	4	CO_2tBu	4-Br-苯基	1198	4	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
421	1	CONHMe	4-Br-苯基	1199	1	CONHMe	2-CF_3-苯基
422	2	CONHMe	4-Br-苯基	1200	2	CONHMe	2-CF_3-苯基
423	3	CONHMe	4-Br-苯基	1201	3	CONHMe	2-CF_3-苯基
424	4	CONHMe	4-Br-苯基	1202	4	CONHMe	2-CF_3-苯基
425	1	SO_2Me	4-Br-苯基	1203	1	SO_2Me	2-CF_3-苯基
426	2	SO_2Me	4-Br-苯基	1204	2	SO_2Me	2-CF_3-苯基
427	3	SO_2Me	4-Br-苯基	1205	3	SO_2Me	2-CF_3-苯基
428	4	SO_2Me	4-Br-苯基	1206	4	SO_2Me	2-CF_3-苯基
429	1	SO_2NH_2	4-Br-苯基	1207	1	SO_2NH_2	2-CF_3-苯基
430	2	SO_2NH_2	4-Br-苯基	1208	2	SO_2NH_2	2-CF_3-苯基
431	3	SO_2NH_2	4-Br-苯基	1209	3	SO_2NH_2	2-CF_3-苯基
432	4	SO_2NH_2	4-Br-苯基	1210	4	SO_2NH_2	2-CF_3-苯基
433	1	H	3-CF_3-苯基	1211	1	H	4-CF_3-苯基
434	2	H	3-CF_3-苯基	1212	2	H	4-CF_3-苯基
435	3	H	3-CF_3-苯基	1213	3	H	4-CF_3-苯基
436	4	H	3-CF_3-苯基	1214	4	H	4-CF_3-苯基
437	1	Me	3-CF_3-苯基	1215	1	Me	4-CF_3-苯基
438	2	Me	3-CF_3-苯基	1216	2	Me	4-CF_3-苯基
439	3	Me	3-CF_3-苯基	1217	3	Me	4-CF_3-苯基
440	4	Me	3-CF_3-苯基	1218	4	Me	4-CF_3-苯基
441	1	CH_2Ph	3-CF_3-苯基	1219	1	CH_2Ph	4-CF_3-苯基

[2833]

442	2	CH_2Ph	3-CF_3-苯基	1220	2	CH_2Ph	4-CF_3-苯基
443	3	CH_2Ph	3-CF_3-苯基	1221	3	CH_2Ph	4-CF_3-苯基
444	4	CH_2Ph	3-CF_3-苯基	1222	4	CH_2Ph	4-CF_3-苯基
445	1	COMe	3-CF_3-苯基	1223	1	COMe	4-CF_3-苯基
446	2	COMe	3-CF_3-苯基	1224	2	COMe	4-CF_3-苯基
447	3	COMe	3-CF_3-苯基	1225	3	COMe	4-CF_3-苯基
448	4	COMe	3-CF_3-苯基	1226	4	COMe	4-CF_3-苯基
449	1	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1227	1	CO_2Me	4-CF_3-苯基
450	2	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1228	2	CO_2Me	4-CF_3-苯基
451	3	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1229	3	CO_2Me	4-CF_3-苯基
452	4	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1230	4	CO_2Me	4-CF_3-苯基
453	1	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1231	1	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
454	2	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1232	2	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
455	3	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1233	3	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
456	4	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1234	4	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
457	1	CONHMe	3-CF_3-苯基	1235	1	CONHMe	4-CF_3-苯基
458	2	CONHMe	3-CF_3-苯基	1236	2	CONHMe	4-CF_3-苯基
459	3	CONHMe	3-CF_3-苯基	1237	3	CONHMe	4-CF_3-苯基
460	4	CONHMe	3-CF_3-苯基	1238	4	CONHMe	4-CF_3-苯基
461	1	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1239	1	SO_2Me	4-CF_3-苯基
462	2	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1240	2	SO_2Me	4-CF_3-苯基
463	3	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1241	3	SO_2Me	4-CF_3-苯基
464	4	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1242	4	SO_2Me	4-CF_3-苯基
465	1	SO_2NH_2	3-CF_3-苯基	1243	1	SO_2NH_2	4-CF_3-苯基
466	2	SO_2NH_2	3-CF_3-苯基	1244	2	SO_2NH_2	4-CF_3-苯基
467	3	SO_2NH_2	3-CF_3-苯基	1245	3	SO_2NH_2	4-CF_3-苯基
468	4	SO_2NH_2	3-CF_3-苯基	1246	4	SO_2NH_2	4-CF_3-苯基

[2834]

469	1	H	2-iPr-苯基	1247	1	H	3-iPr-苯基
470	2	H	2-iPr-苯基	1248	2	H	3-iPr-苯基
471	3	H	2-iPr-苯基	1249	3	H	3-iPr-苯基
472	4	H	2-iPr-苯基	1250	4	H	3-iPr-苯基
473	1	Me	2-iPr-苯基	1251	1	Me	3-iPr-苯基
474	2	Me	2-iPr-苯基	1252	2	Me	3-iPr-苯基
475	3	Me	2-iPr-苯基	1253	3	Me	3-iPr-苯基
476	4	Me	2-iPr-苯基	1254	4	Me	3-iPr-苯基
477	1	CH_2Ph	2-iPr-苯基	1255	1	CH_2Ph	3-iPr-苯基
478	2	CH_2Ph	2-iPr-苯基	1256	2	CH_2Ph	3-iPr-苯基
479	3	CH_2Ph	2-iPr-苯基	1257	3	CH_2Ph	3-iPr-苯基
480	4	CH_2Ph	2-iPr-苯基	1258	4	CH_2Ph	3-iPr-苯基
481	1	COMe	2-iPr-苯基	1259	1	COMe	3-iPr-苯基
482	2	COMe	2-iPr-苯基	1260	2	COMe	3-iPr-苯基
483	3	COMe	2-iPr-苯基	1261	3	COMe	3-iPr-苯基
484	4	COMe	2-iPr-苯基	1262	4	COMe	3-iPr-苯基
485	1	CO_2Me	2-iPr-苯基	1263	1	CO_2Me	3-iPr-苯基
486	2	CO_2Me	2-iPr-苯基	1264	2	CO_2Me	3-iPr-苯基
487	3	CO_2Me	2-iPr-苯基	1265	3	CO_2Me	3-iPr-苯基
488	4	CO_2Me	2-iPr-苯基	1266	4	CO_2Me	3-iPr-苯基
489	1	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1267	1	CO_2tBu	3-iPr-苯基
490	2	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1268	2	CO_2tBu	3-iPr-苯基
491	3	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1269	3	CO_2tBu	3-iPr-苯基
492	4	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1270	4	CO_2tBu	3-iPr-苯基
493	1	CONHMe	2-iPr-苯基	1271	1	CONHMe	3-iPr-苯基
494	2	CONHMe	2-iPr-苯基	1272	2	CONHMe	3-iPr-苯基
495	3	CONHMe	2-iPr-苯基	1273	3	CONHMe	3-iPr-苯基

[2835]

496	4	CONHMe	2-iPr-苯基	1274	4	CONHMe	3-iPr-苯基
497	1	SO_2Me	2-iPr-苯基	1275	1	SO_2Me	3-iPr-苯基
498	2	SO_2Me	2-iPr-苯基	1276	2	SO_2Me	3-iPr-苯基
499	3	SO_2Me	2-iPr-苯基	1277	3	SO_2Me	3-iPr-苯基
500	4	SO_2Me	2-iPr-苯基	1278	4	SO_2Me	3-iPr-苯基
501	1	SO_2NH_2	2-iPr-苯基	1279	1	SO_2NH_2	3-iPr-苯基
502	2	SO_2NH_2	2-iPr-苯基	1280	2	SO_2NH_2	3-iPr-苯基
503	3	SO_2NH_2	2-iPr-苯基	1281	3	SO_2NH_2	3-iPr-苯基
504	4	SO_2NH_2	2-iPr-苯基	1282	4	SO_2NH_2	3-iPr-苯基
505	1	H	4-iPr-苯基	1283	1	H	4-NH_2-苯基
506	2	H	4-iPr-苯基	1284	2	H	4-NH_2-苯基
507	3	H	4-iPr-苯基	1285	3	H	4-NH_2-苯基
508	4	H	4-iPr-苯基	1286	4	H	4-NH_2-苯基
509	1	Me	4-iPr-苯基	1287	1	Me	4-NH_2-苯基
510	2	Me	4-iPr-苯基	1288	2	Me	4-NH_2-苯基
511	3	Me	4-iPr-苯基	1289	3	Me	4-NH_2-苯基
512	4	Me	4-iPr-苯基	1290	4	Me	4-NH_2-苯基
513	1	CH_2Ph	4-iPr-苯基	1291	1	CH_2Ph	4-NH_2-苯基
514	2	CH_2Ph	4-iPr-苯基	1292	2	CH_2Ph	4-NH_2-苯基
515	3	CH_2Ph	4-iPr-苯基	1293	3	CH_2Ph	4-NH_2-苯基
516	4	CH_2Ph	4-iPr-苯基	1294	4	CH_2Ph	4-NH_2-苯基
517	1	COMe	4-iPr-苯基	1295	1	COMe	4-NH_2-苯基
518	2	COMe	4-iPr-苯基	1296	2	COMe	4-NH_2-苯基
519	3	COMe	4-iPr-苯基	1297	3	COMe	4-NH_2-苯基
520	4	COMe	4-iPr-苯基	1298	4	COMe	4-NH_2-苯基
521	1	CO_2Me	4-iPr-苯基	1299	1	CO_2Me	4-NH_2-苯基
522	2	CO_2Me	4-iPr-苯基	1300	2	CO_2Me	4-NH_2-苯基

[2836]

523	3	CO_2Me	4-iPr-苯基	1301	3	CO_2Me	4-NH_2-苯基
524	4	CO_2Me	4-iPr-苯基	1302	4	CO_2Me	4-NH_2-苯基
525	1	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1303	1	CO_2tBu	4-NH_2-苯基
526	2	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1304	2	CO_2tBu	4-NH_2-苯基
527	3	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1305	3	CO_2tBu	4-NH_2-苯基
528	4	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1306	4	CO_2tBu	4-NH_2-苯基
529	1	CONHMe	4-iPr-苯基	1307	1	CONHMe	4-NH_2-苯基
530	2	CONHMe	4-iPr-苯基	1308	2	CONHMe	4-NH_2-苯基
531	3	CONHMe	4-iPr-苯基	1309	3	CONHMe	4-NH_2-苯基
532	4	CONHMe	4-iPr-苯基	1310	4	CONHMe	4-NH_2-苯基
533	1	SO_2Me	4-iPr-苯基	1311	1	SO_2Me	4-NH_2-苯基
534	2	SO_2Me	4-iPr-苯基	1312	2	SO_2Me	4-NH_2-苯基
535	3	SO_2Me	4-iPr-苯基	1313	3	SO_2Me	4-NH_2-苯基
536	4	SO_2Me	4-iPr-苯基	1314	4	SO_2Me	4-NH_2-苯基
537	1	SO_2NH_2	4-iPr-苯基	1315	1	SO_2NH_2	4-NH_2-苯基
538	2	SO_2NH_2	4-iPr-苯基	1316	2	SO_2NH_2	4-NH_2-苯基
539	3	SO_2NH_2	4-iPr-苯基	1317	3	SO_2NH_2	4-NH_2-苯基
540	4	SO_2NH_2	4-iPr-苯基	1318	4	SO_2NH_2	4-NH_2-苯基
541	1	H	3-NH_2-苯基	1319	1	H	2-NH_2-苯基
542	2	H	3-NH_2-苯基	1320	2	H	2-NH_2-苯基
543	3	H	3-NH_2-苯基	1321	3	H	2-NH_2-苯基
544	4	H	3-NH_2-苯基	1322	4	H	2-NH_2-苯基
545	1	Me	3-NH_2-苯基	1323	1	Me	2-NH_2-苯基
546	2	Me	3-NH_2-苯基	1324	2	Me	2-NH_2-苯基
547	3	Me	3-NH_2-苯基	1325	3	Me	2-NH_2-苯基
548	4	Me	3-NH_2-苯基	1326	4	Me	2-NH_2-苯基
549	1	CH_2Ph	3-NH_2-苯基	1327	1	CH_2Ph	2-NH_2-苯基

[2837]

550	2	CH_2Ph	3-NH_2-苯基	1328	2	CH_2Ph	2-NH_2-苯基
551	3	CH_2Ph	3-NH_2-苯基	1329	3	CH_2Ph	2-NH_2-苯基
552	4	CH_2Ph	3-NH_2-苯基	1330	4	CH_2Ph	2-NH_2-苯基
553	1	COMe	3-NH_2-苯基	1331	1	COMe	2-NH_2-苯基
554	2	COMe	3-NH_2-苯基	1332	2	COMe	2-NH_2-苯基
555	3	COMe	3-NH_2-苯基	1333	3	COMe	2-NH_2-苯基
556	4	COMe	3-NH_2-苯基	1334	4	COMe	2-NH_2-苯基
557	1	CO_2Me	3-NH_2-苯基	1335	1	CO_2Me	2-NH_2-苯基
558	2	CO_2Me	3-NH_2-苯基	1336	2	CO_2Me	2-NH_2-苯基
559	3	CO_2Me	3-NH_2-苯基	1337	3	CO_2Me	2-NH_2-苯基
560	4	CO_2Me	3-NH_2-苯基	1338	4	CO_2Me	2-NH_2-苯基
561	1	CO_2tBu	3-NH_2-苯基	1339	1	CO_2tBu	2-NH_2-苯基
562	2	CO_2tBu	3-NH_2-苯基	1340	2	CO_2tBu	2-NH_2-苯基
563	3	CO_2tBu	3-NH_2-苯基	1341	3	CO_2tBu	2-NH_2-苯基
564	4	CO_2tBu	3-NH_2-苯基	1342	4	CO_2tBu	2-NH_2-苯基
565	1	CONHMe	3-NH_2-苯基	1343	1	CONHMe	2-NH_2-苯基
566	2	CONHMe	3-NH_2-苯基	1344	2	CONHMe	2-NH_2-苯基
567	3	CONHMe	3-NH_2-苯基	1345	3	CONHMe	2-NH_2-苯基
568	4	CONHMe	3-NH_2-苯基	1346	4	CONHMe	2-NH_2-苯基
569	1	SO_2Me	3-NH_2-苯基	1347	1	SO_2Me	2-NH_2-苯基
570	2	SO_2Me	3-NH_2-苯基	1348	2	SO_2Me	2-NH_2-苯基
571	3	SO_2Me	3-NH_2-苯基	1349	3	SO_2Me	2-NH_2-苯基
572	4	SO_2Me	3-NH_2-苯基	1350	4	SO_2Me	2-NH_2-苯基
573	1	SO_2NH_2	3-NH_2-苯基	1351	1	SO_2NH_2	2-NH_2-苯基
574	2	SO_2NH_2	3-NH_2-苯基	1352	2	SO_2NH_2	2-NH_2-苯基
575	3	SO_2NH_2	3-NH_2-苯基	1353	3	SO_2NH_2	2-NH_2-苯基
576	4	SO_2NH_2	3-NH_2-苯基	1354	4	SO_2NH_2	2-NH_2-苯基

[2838]

577	1	H	2,4-二-Me-苯基	1355	1	H	2,6-二-Me-苯基
578	2	H	2,4-二-Me-苯基	1356	2	H	2,6-二-Me-苯基
579	3	H	2,4-二-Me-苯基	1357	3	H	2,6-二-Me-苯基
580	4	H	2,4-二-Me-苯基	1358	4	H	2,6-二-Me-苯基
581	1	Me	2,4-二-Me-苯基	1359	1	Me	2,6-二-Me-苯基
582	2	Me	2,4-二-Me-苯基	1360	2	Me	2,6-二-Me-苯基
583	3	Me	2,4-二-Me-苯基	1361	3	Me	2,6-二-Me-苯基
584	4	Me	2,4-二-Me-苯基	1362	4	Me	2,6-二-Me-苯基
585	1	CH_2Ph	2,4-二-Me-苯基	1363	1	CH_2Ph	2,6-二-Me-苯基
586	2	CH_2Ph	2,4-二-Me-苯基	1364	2	CH_2Ph	2,6-二-Me-苯基
587	3	CH_2Ph	2,4-二-Me-苯基	1365	3	CH_2Ph	2,6-二-Me-苯基
588	4	CH_2Ph	2,4-二-Me-苯基	1366	4	CH_2Ph	2,6-二-Me-苯基
589	1	COMe	2,4-二-Me-苯基	1367	1	COMe	2,6-二-Me-苯基
590	2	COMe	2,4-二-Me-苯基	1368	2	COMe	2,6-二-Me-苯基
591	3	COMe	2,4-二-Me-苯基	1369	3	COMe	2,6-二-Me-苯基
592	4	COMe	2,4-二-Me-苯基	1370	4	COMe	2,6-二-Me-苯基
593	1	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1371	1	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
594	2	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1372	2	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
595	3	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1373	3	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
596	4	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1374	4	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
597	1	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1375	1	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
598	2	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1376	2	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
599	3	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1377	3	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
600	4	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1378	4	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
601	1	CONHMe	2,4-二-Me-苯基	1379	1	CONHMe	2,6-二-Me-苯基
602	2	CONHMe	2,4-二-Me-苯基	1380	2	CONHMe	2,6-二-Me-苯基
603	3	CONHMe	2,4-二-Me-苯基	1381	3	CONHMe	2,6-二-Me-苯基

[2839]

604	4	CONHMe	2,4-二-Me-苯基	1382	4	CONHMe	2,6-二-Me-苯基
605	1	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1383	1	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基
606	2	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1384	2	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基
607	3	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1385	3	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基
608	4	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1386	4	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基
609	1	SO_2NH_2	2,4-二-Me-苯基	1387	1	SO_2NH_2	2,6-二-Me-苯基
610	2	SO_2NH_2	2,4-二-Me-苯基	1388	2	SO_2NH_2	2,6-二-Me-苯基
611	3	SO_2NH_2	2,4-二-Me-苯基	1389	3	SO_2NH_2	2,6-二-Me-苯基
612	4	SO_2NH_2	2,4-二-Me-苯基	1390	4	SO_2NH_2	2,6-二-Me-苯基
613	1	H	2,6-二-iPr-苯基	1391	1	H	2-Ph-苯基
614	2	H	2,6-二-iPr-苯基	1392	2	H	2-Ph-苯基
615	3	H	2,6-二-iPr-苯基	1393	3	H	2-Ph-苯基
616	4	H	2,6-二-iPr-苯基	1394	4	H	2-Ph-苯基
617	1	Me	2,6-二-iPr-苯基	1395	1	Me	2-Ph-苯基
618	2	Me	2,6-二-iPr-苯基	1396	2	Me	2-Ph-苯基
619	3	Me	2,6-二-iPr-苯基	1397	3	Me	2-Ph-苯基
620	4	Me	2,6-二-iPr-苯基	1398	4	Me	2-Ph-苯基
621	1	CH_2Ph	2,6-二-iPr-苯基	1399	1	CH_2Ph	2-Ph-苯基
622	2	CH_2Ph	2,6-二-iPr-苯基	1400	2	CH_2Ph	2-Ph-苯基
623	3	CH_2Ph	2,6-二-iPr-苯基	1401	3	CH_2Ph	2-Ph-苯基
624	3	CH_2Ph	2,6-二-iPr-苯基	1402	4	CH_2Ph	2-Ph-苯基
625	1	COMe	2,6-二-iPr-苯基	1403	1	COMe	2-Ph-苯基
626	2	COMe	2,6-二-iPr-苯基	1404	2	COMe	2-Ph-苯基
627	3	COMe	2,6-二-iPr-苯基	1405	3	COMe	2-Ph-苯基
628	4	COMe	2,6-二-iPr-苯基	1406	4	COMe	2-Ph-苯基
629	1	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1407	1	CO_2Me	2-Ph-苯基
630	2	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1408	2	CO_2Me	2-Ph-苯基

[2840]

631	3	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1409	3	CO_2Me	2-Ph-苯基
632	4	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1410	4	CO_2Me	2-Ph-苯基
633	1	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基	1411	1	CO_2tBu	2-Ph-苯基
634	2	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基	1412	2	CO_2tBu	2-Ph-苯基
635	3	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基	1413	3	CO_2tBu	2-Ph-苯基
636	4	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基	1414	4	CO_2tBu	2-Ph-苯基
637	1	CONHMe	2,6-二-iPr-苯基	1415	1	CONHMe	2-Ph-苯基
638	2	CONHMe	2,6-二-iPr-苯基	1416	2	CONHMe	2-Ph-苯基
639	3	CONHMe	2,6-二-iPr-苯基	1417	3	CONHMe	2-Ph-苯基
640	4	CONHMe	2,6-二-iPr-苯基	1418	4	CONHMe	2-Ph-苯基
641	1	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1419	1	SO_2Me	2-Ph-苯基
642	2	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1420	2	SO_2Me	2-Ph-苯基
643	3	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1421	3	SO_2Me	2-Ph-苯基
644	4	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1422	4	SO_2Me	2-Ph-苯基
645	1	SO_2NH_2	2,6-二-iPr-苯基	1423	1	SO_2NH_2	2-Ph-苯基
646	2	SO_2NH_2	2,6-二-iPr-苯基	1424	2	SO_2NH_2	2-Ph-苯基
647	3	SO_2NH_2	2,6-二-iPr-苯基	1425	3	SO_2NH_2	2-Ph-苯基
648	4	SO_2NH_2	2,6-二-iPr-苯基	1426	4	SO_2NH_2	2-Ph-苯基
649	1	H	3-Ph-苯基	1427	1	H	4-Ph-苯基
650	2	H	3-Ph-苯基	1428	2	H	4-Ph-苯基
651	3	H	3-Ph-苯基	1429	3	H	4-Ph-苯基
652	4	H	3-Ph-苯基	1430	4	H	4-Ph-苯基
653	1	Me	3-Ph-苯基	1431	1	Me	4-Ph-苯基
654	2	Me	3-Ph-苯基	1432	2	Me	4-Ph-苯基
655	3	Me	3-Ph-苯基	1433	3	Me	4-Ph-苯基
656	4	Me	3-Ph-苯基	1434	4	Me	4-Ph-苯基
657	1	CH_2Ph	3-Ph-苯基	1435	1	CH_2Ph	4-Ph-苯基

[2841]

658	2	CH_2Ph	3-Ph-苯基	1436	2	CH_2Ph	4-Ph-苯基
659	3	CH_2Ph	3-Ph-苯基	1437	3	CH_2Ph	4-Ph-苯基
660	4	CH_2Ph	3-Ph-苯基	1438	4	CH_2Ph	4-Ph-苯基
661	1	COMe	3-Ph-苯基	1439	1	COMe	4-Ph-苯基
662	2	COMe	3-Ph-苯基	1440	2	COMe	4-Ph-苯基
663	3	COMe	3-Ph-苯基	1441	3	COMe	4-Ph-苯基
664	4	COMe	3-Ph-苯基	1442	4	COMe	4-Ph-苯基
665	1	CO_2Me	3-Ph-苯基	1443	1	CO_2Me	4-Ph-苯基
666	2	CO_2Me	3-Ph-苯基	1444	2	CO_2Me	4-Ph-苯基
667	3	CO_2Me	3-Ph-苯基	1445	3	CO_2Me	4-Ph-苯基
668	4	CO_2Me	3-Ph-苯基	1446	4	CO_2Me	4-Ph-苯基
669	1	CO_2tBu	3-Ph-苯基	1447	1	CO_2tBu	4-Ph-苯基
670	2	CO_2tBu	3-Ph-苯基	1448	2	CO_2tBu	4-Ph-苯基
671	3	CO_2tBu	3-Ph-苯基	1449	3	CO_2tBu	4-Ph-苯基
672	4	CO_2tBu	3-Ph-苯基	1450	4	CO_2tBu	4-Ph-苯基
673	1	CONHMe	3-Ph-苯基	1451	1	CONHMe	4-Ph-苯基
674	2	CONHMe	3-Ph-苯基	1452	2	CONHMe	4-Ph-苯基
675	3	CONHMe	3-Ph-苯基	1453	3	CONHMe	4-Ph-苯基
676	4	CONHMe	3-Ph-苯基	1454	4	CONHMe	4-Ph-苯基
677	1	SO_2Me	3-Ph-苯基	1455	1	SO_2Me	4-Ph-苯基
678	2	SO_2Me	3-Ph-苯基	1456	2	SO_2Me	4-Ph-苯基
679	3	SO_2Me	3-Ph-苯基	1457	3	SO_2Me	4-Ph-苯基
680	4	SO_2Me	3-Ph-苯基	1458	4	SO_2Me	4-Ph-苯基
681	1	SO_2NH_2	3-Ph-苯基	1459	1	SO_2NH_2	4-Ph-苯基
682	2	SO_2NH_2	3-Ph-苯基	1460	2	SO_2NH_2	4-Ph-苯基
683	3	SO_2NH_2	3-Ph-苯基	1461	3	SO_2NH_2	4-Ph-苯基
684	4	SO_2NH_2	3-Ph-苯基	1462	4	SO_2NH_2	4-Ph-苯基

[2842]

685	1	H	2-吗啉代-苯基	1463	1	H	3-吗啉代-苯基
686	2	H	2-吗啉代-苯基	1464	2	H	3-吗啉代-苯基
687	3	H	2-吗啉代-苯基	1465	3	H	3-吗啉代-苯基
688	4	H	2-吗啉代-苯基	1466	4	H	3-吗啉代-苯基
689	1	Me	2-吗啉代-苯基	1467	1	Me	3-吗啉代-苯基
690	2	Me	2-吗啉代-苯基	1468	2	Me	3-吗啉代-苯基
691	3	Me	2-吗啉代-苯基	1469	3	Me	3-吗啉代-苯基
692	4	Me	2-吗啉代-苯基	1470	4	Me	3-吗啉代-苯基
693	1	CH_2Ph	2-吗啉代-苯基	1471	1	CH_2Ph	3-吗啉代-苯基
694	2	CH_2Ph	2-吗啉代-苯基	1472	2	CH_2Ph	3-吗啉代-苯基
695	3	CH_2Ph	2-吗啉代-苯基	1473	3	CH_2Ph	3-吗啉代-苯基
696	4	CH_2Ph	2-吗啉代-苯基	1474	4	CH_2Ph	3-吗啉代-苯基
697	1	COMe	2-吗啉代-苯基	1475	1	COMe	3-吗啉代-苯基
698	2	COMe	2-吗啉代-苯基	1476	2	COMe	3-吗啉代-苯基
699	3	COMe	2-吗啉代-苯基	1477	3	COMe	3-吗啉代-苯基
700	4	COMe	2-吗啉代-苯基	1478	4	COMe	3-吗啉代-苯基
701	1	CO_2Me	2-吗啉代-苯基	1479	1	CO_2Me	3-吗啉代-苯基
702	2	CO_2Me	2-吗啉代-苯基	1480	2	CO_2Me	3-吗啉代-苯基
703	3	CO_2Me	2-吗啉代-苯基	1481	3	CO_2Me	3-吗啉代-苯基
704	4	CO_2Me	2-吗啉代-苯基	1482	4	CO_2Me	3-吗啉代-苯基
705	1	CO_2tBu	2-吗啉代-苯基	1483	1	CO_2tBu	3-吗啉代-苯基
706	2	CO_2tBu	2-吗啉代-苯基	1484	2	CO_2tBu	3-吗啉代-苯基
707	3	CO_2tBu	2-吗啉代-苯基	1485	3	CO_2tBu	3-吗啉代-苯基
708	4	CO_2tBu	2-吗啉代-苯基	1486	4	CO_2tBu	3-吗啉代-苯基
709	1	CONHMe	2-吗啉代-苯基	1487	1	CONHMe	3-吗啉代-苯基
710	2	CONHMe	2-吗啉代-苯基	1488	2	CONHMe	3-吗啉代-苯基
711	3	CONHMe	2-吗啉代-苯基	1489	3	CONHMe	3-吗啉代-苯基

[2843]

712	4	CONHMe	2-吗啉代-苯基	1490	4	CONHMe	3-吗啉代-苯基
713	1	SO_2Me	2-吗啉代-苯基	1491	1	SO_2Me	3-吗啉代-苯基
714	2	SO_2Me	2-吗啉代-苯基	1492	2	SO_2Me	3-吗啉代-苯基
715	3	SO_2Me	2-吗啉代-苯基	1493	3	SO_2Me	3-吗啉代-苯基
716	4	SO_2Me	2-吗啉代-苯基	1494	4	SO_2Me	3-吗啉代-苯基
717	1	SO_2NH_2	2-吗啉代-苯基	1495	1	SO_2NH_2	3-吗啉代-苯基
718	2	SO_2NH_2	2-吗啉代-苯基	1496	2	SO_2NH_2	3-吗啉代-苯基
719	3	SO_2NH_2	2-吗啉代-苯基	1497	3	SO_2NH_2	3-吗啉代-苯基
720	4	SO_2NH_2	2-吗啉代-苯基	1498	4	SO_2NH_2	3-吗啉代-苯基
721	1	H	4-吗啉代-苯基	1499	1	Me	4-吗啉代-苯基
722	2	H	4-吗啉代-苯基	1500	2	Me	4-吗啉代-苯基
723	3	H	4-吗啉代-苯基	1501	3	Me	4-吗啉代-苯基
724	4	H	4-吗啉代-苯基	1502	4	Me	4-吗啉代-苯基
725	1	CH_2Ph	4-吗啉代-苯基	103	1	COMe	4-吗啉代-苯基
726	2	CH_2Ph	4-吗啉代-苯基	1504	2	COMe	4-吗啉代-苯基
727	3	CH_2Ph	4-吗啉代-苯基	1505	3	COMe	4-吗啉代-苯基
728	4	CH_2Ph	4-吗啉代-苯基	1506	4	COMe	4-吗啉代-苯基
729	1	CO_2Me	4-吗啉代-苯基	1507	1	CO_2tBu	4-吗啉代-苯基
730	2	CO_2Me	4-吗啉代-苯基	1508	2	CO_2tBu	4-吗啉代-苯基
731	3	CO_2Me	4-吗啉代-苯基	1509	3	CO_2tBu	4-吗啉代-苯基
732	4	CO_2Me	4-吗啉代-苯基	1510	4	CO_2tBu	4-吗啉代-苯基
733	1	CONHMe	4-吗啉代-苯基	1511	1	SO_2Me	4-吗啉代-苯基
734	2	CONHMe	4-吗啉代-苯基	1512	2	SO_2Me	4-吗啉代-苯基
735	3	CONHMe	4-吗啉代-苯基	1513	3	SO_2Me	4-吗啉代-苯基
736	4	CONHMe	4-吗啉代-苯基	1514	4	SO_2Me	4-吗啉代-苯基
737	1	SO_2NH_2	4-吗啉代-苯基	1516	1	H	亚萘-2-基
738	2	SO_2NH_2	4-吗啉代-苯基	1517	2	H	亚萘-2-基

[2844]

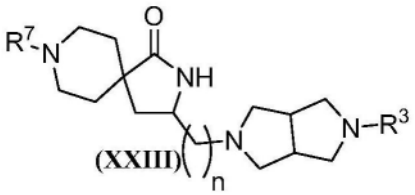
739	3	SO_2NH_2	4-吗啉代-苯基	1518	3	H	亚萘-2-基
740	1	H	亚萘-1-基	1519	4	H	亚萘-2-基
741	2	H	亚萘-1-基	1520	1	Me	亚萘-2-基
742	3	H	亚萘-1-基	1521	2	Me	亚萘-2-基
743	4	H	亚萘-1-基	1522	3	Me	亚萘-2-基
744	1	Me	亚萘-1-基	1523	4	Me	亚萘-2-基
745	2	Me	亚萘-1-基	1524	1	CH_2Ph	亚萘-2-基
746	3	Me	亚萘-1-基	1525	2	CH_2Ph	亚萘-2-基
747	4	Me	亚萘-1-基	1526	3	CH_2Ph	亚萘-2-基
748	1	CH_2Ph	亚萘-1-基	1527	4	CH_2Ph	亚萘-2-基
749	2	CH_2Ph	亚萘-1-基	1528	1	COMe	亚萘-2-基
750	3	CH_2Ph	亚萘-1-基	1529	2	COMe	亚萘-2-基
751	4	CH_2Ph	亚萘-1-基	1530	3	COMe	亚萘-2-基
752	1	COMe	亚萘-1-基	1531	4	COMe	亚萘-2-基
753	2	COMe	亚萘-1-基	1532	1	CO_2Me	亚萘-2-基
754	3	COMe	亚萘-1-基	1533	2	CO_2Me	亚萘-2-基
755	4	COMe	亚萘-1-基	1534	3	CO_2Me	亚萘-2-基
756	1	CO_2Me	亚萘-1-基	1535	4	CO_2Me	亚萘-2-基
757	2	CO_2Me	亚萘-1-基	1536	1	CO_2tBu	亚萘-2-基
758	3	CO_2Me	亚萘-1-基	1537	2	CO_2tBu	亚萘-2-基
759	4	CO_2Me	亚萘-1-基	1538	3	CO_2tBu	亚萘-2-基
760	1	CO_2tBu	亚萘-1-基	1539	4	CO_2tBu	亚萘-2-基
761	2	CO_2tBu	亚萘-1-基	1540	1	CONHMe	亚萘-2-基
762	3	CO_2tBu	亚萘-1-基	1541	2	CONHMe	亚萘-2-基
763	4	CO_2tBu	亚萘-1-基	1542	3	CONHMe	亚萘-2-基
764	1	CONHMe	亚萘-1-基	1543	4	CONHMe	亚萘-2-基
765	2	CONHMe	亚萘-1-基	1544	1	SO_2Me	亚萘-2-基

[2845]

767	3	CONHMe	亚萘-1-基	1545	2	SO_2Me	亚萘-2-基
768	4	CONHMe	亚萘-1-基	1546	3	SO_2Me	亚萘-2-基
769	1	SO_2Me	亚萘-1-基	1547	4	SO_2Me	亚萘-2-基
770	2	SO_2Me	亚萘-1-基	1548	1	SO_2NH_2	亚萘-2-基
771	3	SO_2Me	亚萘-1-基	1549	2	SO_2NH_2	亚萘-2-基
772	4	SO_2Me	亚萘-1-基	1550	3	SO_2NH_2	亚萘-2-基
773	1	SO_2NH_2	亚萘-1-基	1551	4	SO_2NH_2	亚萘-2-基
774	2	SO_2NH_2	亚萘-1-基				
775	3	SO_2NH_2	亚萘-1-基				
778	4	SO_2NH_2	亚萘-1-基				

[2846] 示例性实施方案包括具有式(XXIII)的化合物

[2847]



[2848] 或其可药用盐形式,如在下文表17中所定义。

[2849] 表17:

[2850]

条目	n	R^7	R^3	条目	n	R^7	R^3
1	1	H	苯基	779	1	H	4-OH-苯基
2	2	H	苯基	780	2	H	4-OH-苯基
3	3	H	苯基	781	3	H	4-OH-苯基
4	4	H	苯基	782	4	H	4-OH-苯基
5	1	Me	苯基	783	1	Me	4-OH-苯基
6	2	Me	苯基	784	2	Me	4-OH-苯基
7	3	Me	苯基	785	3	Me	4-OH-苯基
8	4	Me	苯基	786	4	Me	4-OH-苯基
9	1	CH_2Ph	苯基	787	1	CH_2Ph	4-OH-苯基
10	2	CH_2Ph	苯基	788	2	CH_2Ph	4-OH-苯基
11	3	CH_2Ph	苯基	789	3	CH_2Ph	4-OH-苯基

[2851]

12	4	CH_2Ph	苯基	790	4	CH_2Ph	4-OH-苯基
13	1	COMe	苯基	791	1	COMe	4-OH-苯基
14	2	COMe	苯基	792	2	COMe	4-OH-苯基
15	3	COMe	苯基	793	3	COMe	4-OH-苯基
16	4	COMe	苯基	794	4	COMe	4-OH-苯基
17	1	CO_2Me	苯基	795	1	CO_2Me	4-OH-苯基
18	2	CO_2Me	苯基	796	2	CO_2Me	4-OH-苯基
19	3	CO_2Me	苯基	797	3	CO_2Me	4-OH-苯基
20	4	CO_2Me	苯基	798	4	CO_2Me	4-OH-苯基
21	1	CO_2tBu	苯基	799	1	CO_2tBu	4-OH-苯基
22	2	CO_2tBu	苯基	800	2	CO_2tBu	4-OH-苯基
23	3	CO_2tBu	苯基	801	3	CO_2tBu	4-OH-苯基
24	4	CO_2tBu	苯基	802	4	CO_2tBu	4-OH-苯基
25	1	CONHMe	苯基	803	1	CONHMe	4-OH-苯基
26	2	CONHMe	苯基	804	2	CONHMe	4-OH-苯基
27	3	CONHMe	苯基	805	3	CONHMe	4-OH-苯基
28	4	CONHMe	苯基	806	4	CONHMe	4-OH-苯基
29	1	SO_2Me	苯基	807	1	SO_2Me	4-OH-苯基
30	2	SO_2Me	苯基	808	2	SO_2Me	4-OH-苯基
31	3	SO_2Me	苯基	809	3	SO_2Me	4-OH-苯基
32	4	SO_2Me	苯基	810	4	SO_2Me	4-OH-苯基
33	1	SO_2NH_2	苯基	811	1	SO_2NH_2	4-OH-苯基
34	2	SO_2NH_2	苯基	812	2	SO_2NH_2	4-OH-苯基
35	3	SO_2NH_2	苯基	813	3	SO_2NH_2	4-OH-苯基
36	4	SO_2NH_2	苯基	814	4	SO_2NH_2	4-OH-苯基
37	1	H	3-OH-苯基	815	1	H	2-OH-苯基
38	2	H	3-OH-苯基	816	2	H	2-OH-苯基

[2852]

39	3	H	3-OH-苯基	817	3	H	2-OH-苯基
40	4	H	3-OH-苯基	818	4	H	2-OH-苯基
41	1	Me	3-OH-苯基	819	1	Me	2-OH-苯基
42	2	Me	3-OH-苯基	820	2	Me	2-OH-苯基
43	3	Me	3-OH-苯基	821	3	Me	2-OH-苯基
44	4	Me	3-OH-苯基	822	4	Me	2-OH-苯基
45	1	CH_2Ph	3-OH-苯基	823	1	CH_2Ph	2-OH-苯基
46	2	CH_2Ph	3-OH-苯基	824	2	CH_2Ph	2-OH-苯基
47	3	CH_2Ph	3-OH-苯基	825	3	CH_2Ph	2-OH-苯基
48	4	CH_2Ph	3-OH-苯基	826	4	CH_2Ph	2-OH-苯基
49	1	COMe	3-OH-苯基	827	1	COMe	2-OH-苯基
50	2	COMe	3-OH-苯基	828	2	COMe	2-OH-苯基
51	3	COMe	3-OH-苯基	829	3	COMe	2-OH-苯基
52	4	COMe	3-OH-苯基	830	4	COMe	2-OH-苯基
53	1	CO_2Me	3-OH-苯基	831	1	CO_2Me	2-OH-苯基
54	2	CO_2Me	3-OH-苯基	832	2	CO_2Me	2-OH-苯基
55	3	CO_2Me	3-OH-苯基	833	3	CO_2Me	2-OH-苯基
56	4	CO_2Me	3-OH-苯基	834	4	CO_2Me	2-OH-苯基
57	1	CO_2tBu	3-OH-苯基	835	1	CO_2tBu	2-OH-苯基
58	2	CO_2tBu	3-OH-苯基	836	2	CO_2tBu	2-OH-苯基
59	3	CO_2tBu	3-OH-苯基	837	3	CO_2tBu	2-OH-苯基
60	4	CO_2tBu	3-OH-苯基	838	4	CO_2tBu	2-OH-苯基
61	1	CONHMe	3-OH-苯基	839	1	CONHMe	2-OH-苯基
62	2	CONHMe	3-OH-苯基	840	2	CONHMe	2-OH-苯基
63	3	CONHMe	3-OH-苯基	841	3	CONHMe	2-OH-苯基
64	4	CONHMe	3-OH-苯基	842	4	CONHMe	2-OH-苯基
65	1	SO_2Me	3-OH-苯基	843	1	SO_2Me	2-OH-苯基

[2853]

66	2	SO_2Me	3-OH-苯基	844	2	SO_2Me	2-OH-苯基
67	3	SO_2Me	3-OH-苯基	845	3	SO_2Me	2-OH-苯基
68	4	SO_2Me	3-OH-苯基	846	4	SO_2Me	2-OH-苯基
69	1	SO_2NH_2	3-OH-苯基	847	1	SO_2NH_2	2-OH-苯基
70	2	SO_2NH_2	3-OH-苯基	848	2	SO_2NH_2	2-OH-苯基
71	3	SO_2NH_2	3-OH-苯基	849	3	SO_2NH_2	2-OH-苯基
72	4	SO_2NH_2	3-OH-苯基	850	4	SO_2NH_2	2-OH-苯基
73	1	H	4-NO_2-苯基	851	1	H	4-OMe-苯基
74	2	H	4-NO_2-苯基	852	2	H	4-OMe-苯基
75	3	H	4-NO_2-苯基	853	3	H	4-OMe-苯基
76	4	H	4-NO_2-苯基	854	4	H	4-OMe-苯基
77	1	Me	4-NO_2-苯基	855	1	Me	4-OMe-苯基
78	2	Me	4-NO_2-苯基	856	2	Me	4-OMe-苯基
79	3	Me	4-NO_2-苯基	857	3	Me	4-OMe-苯基
80	4	Me	4-NO_2-苯基	858	4	Me	4-OMe-苯基
81	1	CH_2Ph	4-NO_2-苯基	859	1	CH_2Ph	4-OMe-苯基
82	2	CH_2Ph	4-NO_2-苯基	860	2	CH_2Ph	4-OMe-苯基
83	3	CH_2Ph	4-NO_2-苯基	861	3	CH_2Ph	4-OMe-苯基
84	4	CH_2Ph	4-NO_2-苯基	862	4	CH_2Ph	4-OMe-苯基
85	1	COMe	4-NO_2-苯基	863	1	COMe	4-OMe-苯基
86	2	COMe	4-NO_2-苯基	864	2	COMe	4-OMe-苯基
87	3	COMe	4-NO_2-苯基	865	3	COMe	4-OMe-苯基
88	4	COMe	4-NO_2-苯基	866	4	COMe	4-OMe-苯基
89	1	CO_2Me	4-NO_2-苯基	867	1	CO_2Me	4-OMe-苯基
90	2	CO_2Me	4-NO_2-苯基	868	2	CO_2Me	4-OMe-苯基
91	3	CO_2Me	4-NO_2-苯基	869	3	CO_2Me	4-OMe-苯基
92	4	CO_2Me	4-NO_2-苯基	870	4	CO_2Me	4-OMe-苯基

[2854]

93	1	CO_2tBu	4-NO_2-苯基	871	1	CO_2tBu	4-OMe-苯基
94	2	CO_2tBu	4-NO_2-苯基	872	2	CO_2tBu	4-OMe-苯基
95	3	CO_2tBu	4-NO_2-苯基	873	3	CO_2tBu	4-OMe-苯基
96	4	CO_2tBu	4-NO_2-苯基	874	4	CO_2tBu	4-OMe-苯基
97	1	CONHMe	4-NO_2-苯基	875	1	CONHMe	4-OMe-苯基
98	2	CONHMe	4-NO_2-苯基	876	2	CONHMe	4-OMe-苯基
99	3	CONHMe	4-NO_2-苯基	877	3	CONHMe	4-OMe-苯基
100	4	CONHMe	4-NO_2-苯基	878	4	CONHMe	4-OMe-苯基
101	1	SO_2Me	4-NO_2-苯基	879	1	SO_2Me	4-OMe-苯基
102	2	SO_2Me	4-NO_2-苯基	880	2	SO_2Me	4-OMe-苯基
103	3	SO_2Me	4-NO_2-苯基	881	3	SO_2Me	4-OMe-苯基
104	4	SO_2Me	4-NO_2-苯基	882	4	SO_2Me	4-OMe-苯基
105	1	SO_2NH_2	4-NO_2-苯基	883	1	SO_2NH_2	4-OMe-苯基
106	2	SO_2NH_2	4-NO_2-苯基	884	2	SO_2NH_2	4-OMe-苯基
107	3	SO_2NH_2	4-NO_2-苯基	885	3	SO_2NH_2	4-OMe-苯基
108	4	SO_2NH_2	4-NO_2-苯基	886	4	SO_2NH_2	4-OMe-苯基
109	1	H	3-OMe-苯基	887	1	H	2-OMe-苯基
110	2	H	3-OMe-苯基	888	2	H	2-OMe-苯基
111	3	H	3-OMe-苯基	889	3	H	2-OMe-苯基
112	4	H	3-OMe-苯基	890	4	H	2-OMe-苯基
113	1	Me	3-OMe-苯基	891	1	Me	2-OMe-苯基
114	2	Me	3-OMe-苯基	892	2	Me	2-OMe-苯基
115	3	Me	3-OMe-苯基	893	3	Me	2-OMe-苯基
116	4	Me	3-OMe-苯基	894	4	Me	2-OMe-苯基
117	1	CH_2Ph	3-OMe-苯基	895	1	CH_2Ph	2-OMe-苯基
118	2	CH_2Ph	3-OMe-苯基	896	2	CH_2Ph	2-OMe-苯基
119	3	CH_2Ph	3-OMe-苯基	897	3	CH_2Ph	2-OMe-苯基

[2855]

120	4	CH_2Ph	3-OMe-苯基	898	4	CH_2Ph	2-OMe-苯基
121	1	COMe	3-OMe-苯基	899	1	COMe	2-OMe-苯基
122	2	COMe	3-OMe-苯基	900	2	COMe	2-OMe-苯基
123	3	COMe	3-OMe-苯基	901	3	COMe	2-OMe-苯基
124	4	COMe	3-OMe-苯基	902	4	COMe	2-OMe-苯基
125	1	CO_2Me	3-OMe-苯基	903	1	CO_2Me	2-OMe-苯基
126	2	CO_2Me	3-OMe-苯基	904	2	CO_2Me	2-OMe-苯基
127	3	CO_2Me	3-OMe-苯基	905	3	CO_2Me	2-OMe-苯基
128	4	CO_2Me	3-OMe-苯基	906	4	CO_2Me	2-OMe-苯基
129	1	CO_2tBu	3-OMe-苯基	907	1	CO_2tBu	2-OMe-苯基
130	2	CO_2tBu	3-OMe-苯基	908	2	CO_2tBu	2-OMe-苯基
131	3	CO_2tBu	3-OMe-苯基	909	3	CO_2tBu	2-OMe-苯基
132	4	CO_2tBu	3-OMe-苯基	910	4	CO_2tBu	2-OMe-苯基
133	1	CONHMe	3-OMe-苯基	911	1	CONHMe	2-OMe-苯基
134	2	CONHMe	3-OMe-苯基	912	2	CONHMe	2-OMe-苯基
135	3	CONHMe	3-OMe-苯基	913	3	CONHMe	2-OMe-苯基
136	4	CONHMe	3-OMe-苯基	914	4	CONHMe	2-OMe-苯基
137	1	SO_2Me	3-OMe-苯基	915	1	SO_2Me	2-OMe-苯基
138	2	SO_2Me	3-OMe-苯基	916	2	SO_2Me	2-OMe-苯基
139	3	SO_2Me	3-OMe-苯基	917	3	SO_2Me	2-OMe-苯基
140	4	SO_2Me	3-OMe-苯基	918	4	SO_2Me	2-OMe-苯基
141	1	SO_2NH_2	3-OMe-苯基	919	1	SO_2NH_2	2-OMe-苯基
142	2	SO_2NH_2	3-OMe-苯基	920	2	SO_2NH_2	2-OMe-苯基
143	3	SO_2NH_2	3-OMe-苯基	921	3	SO_2NH_2	2-OMe-苯基
144	4	SO_2NH_2	3-OMe-苯基	922	4	SO_2NH_2	2-OMe-苯基
145	1	H	4-CN-苯基	923	1	H	3-CN-苯基
146	2	H	4-CN-苯基	924	2	H	3-CN-苯基

[2856]

147	3	H	4-CN-苯基	925	3	H	3-CN-苯基
148	4	H	4-CN-苯基	926	4	H	3-CN-苯基
149	1	Me	4-CN-苯基	927	1	Me	3-CN-苯基
150	2	Me	4-CN-苯基	928	2	Me	3-CN-苯基
151	3	Me	4-CN-苯基	929	3	Me	3-CN-苯基
152	4	Me	4-CN-苯基	930	4	Me	3-CN-苯基
153	1	CH_2Ph	4-CN-苯基	931	1	CH_2Ph	3-CN-苯基
154	2	CH_2Ph	4-CN-苯基	932	2	CH_2Ph	3-CN-苯基
155	3	CH_2Ph	4-CN-苯基	933	3	CH_2Ph	3-CN-苯基
156	4	CH_2Ph	4-CN-苯基	934	4	CH_2Ph	3-CN-苯基
157	1	COMe	4-CN-苯基	935	1	COMe	3-CN-苯基
158	2	COMe	4-CN-苯基	936	2	COMe	3-CN-苯基
159	3	COMe	4-CN-苯基	937	3	COMe	3-CN-苯基
160	4	COMe	4-CN-苯基	938	4	COMe	3-CN-苯基
161	1	CO_2Me	4-CN-苯基	939	1	CO_2Me	3-CN-苯基
162	2	CO_2Me	4-CN-苯基	940	2	CO_2Me	3-CN-苯基
163	3	CO_2Me	4-CN-苯基	941	3	CO_2Me	3-CN-苯基
164	4	CO_2Me	4-CN-苯基	942	4	CO_2Me	3-CN-苯基
165	1	CO_2tBu	4-CN-苯基	943	1	CO_2tBu	3-CN-苯基
166	2	CO_2tBu	4-CN-苯基	944	2	CO_2tBu	3-CN-苯基
167	3	CO_2tBu	4-CN-苯基	945	3	CO_2tBu	3-CN-苯基
168	4	CO_2tBu	4-CN-苯基	946	4	CO_2tBu	3-CN-苯基
169	1	CONHMe	4-CN-苯基	947	1	CONHMe	3-CN-苯基
170	2	CONHMe	4-CN-苯基	948	2	CONHMe	3-CN-苯基
171	3	CONHMe	4-CN-苯基	949	3	CONHMe	3-CN-苯基
172	4	CONHMe	4-CN-苯基	950	4	CONHMe	3-CN-苯基
173	1	SO_2Me	4-CN-苯基	951	1	SO_2Me	3-CN-苯基

[2857]

174	2	SO_2Me	4-CN-苯基	952	2	SO_2Me	3-CN-苯基
175	3	SO_2Me	4-CN-苯基	953	3	SO_2Me	3-CN-苯基
176	4	SO_2Me	4-CN-苯基	954	4	SO_2Me	3-CN-苯基
177	1	SO_2NH_2	4-CN-苯基	955	1	SO_2NH_2	3-CN-苯基
178	2	SO_2NH_2	4-CN-苯基	956	2	SO_2NH_2	3-CN-苯基
179	3	SO_2NH_2	4-CN-苯基	957	3	SO_2NH_2	3-CN-苯基
180	4	SO_2NH_2	4-CN-苯基	958	4	SO_2NH_2	3-CN-苯基
181	1	H	2-CN-苯基	959	1	H	2-Me-苯基
182	2	H	2-CN-苯基	960	2	H	2-Me-苯基
183	3	H	2-CN-苯基	961	3	H	2-Me-苯基
184	4	H	2-CN-苯基	962	4	H	2-Me-苯基
185	1	Me	2-CN-苯基	963	1	Me	2-Me-苯基
186	2	Me	2-CN-苯基	964	2	Me	2-Me-苯基
187	3	Me	2-CN-苯基	965	3	Me	2-Me-苯基
188	4	Me	2-CN-苯基	966	4	Me	2-Me-苯基
189	1	CH_2Ph	2-CN-苯基	967	1	CH_2Ph	2-Me-苯基
190	2	CH_2Ph	2-CN-苯基	968	2	CH_2Ph	2-Me-苯基
191	3	CH_2Ph	2-CN-苯基	969	3	CH_2Ph	2-Me-苯基
192	4	CH_2Ph	2-CN-苯基	970	4	CH_2Ph	2-Me-苯基
193	1	COMe	2-CN-苯基	971	1	COMe	2-Me-苯基
194	2	COMe	2-CN-苯基	972	2	COMe	2-Me-苯基
195	3	COMe	2-CN-苯基	973	3	COMe	2-Me-苯基
196	4	COMe	2-CN-苯基	974	4	COMe	2-Me-苯基
197	1	CO_2Me	2-CN-苯基	975	1	CO_2Me	2-Me-苯基
198	2	CO_2Me	2-CN-苯基	976	2	CO_2Me	2-Me-苯基
199	3	CO_2Me	2-CN-苯基	977	3	CO_2Me	2-Me-苯基
200	4	CO_2Me	2-CN-苯基	978	4	CO_2Me	2-CN-苯基

[2858]

201	1	CO_2tBu	2-CN-苯基	979	1	CO_2tBu	2-Me-苯基
202	2	CO_2tBu	2-CN-苯基	980	2	CO_2tBu	2-Me-苯基
203	3	CO_2tBu	2-CN-苯基	981	3	CO_2tBu	2-Me-苯基
204	4	CO_2tBu	2-CN-苯基	982	4	CO_2tBu	2-Me-苯基
205	1	CONHMe	2-CN-苯基	983	1	CONHMe	2-Me-苯基
206	2	CONHMe	2-CN-苯基	984	2	CONHMe	2-Me-苯基
207	3	CONHMe	2-CN-苯基	985	3	CONHMe	2-Me-苯基
208	4	CONHMe	2-CN-苯基	986	4	CONHMe	2-Me-苯基
209	1	SO_2Me	2-CN-苯基	987	1	SO_2Me	2-Me-苯基
210	2	SO_2Me	2-CN-苯基	988	2	SO_2Me	2-Me-苯基
211	3	SO_2Me	2-CN-苯基	989	3	SO_2Me	2-Me-苯基
212	4	SO_2Me	2-CN-苯基	990	4	SO_2Me	2-Me-苯基
213	1	SO_2NH_2	2-CN-苯基	991	1	SO_2NH_2	2-Me-苯基
214	2	SO_2NH_2	2-CN-苯基	992	2	SO_2NH_2	2-Me-苯基
215	3	SO_2NH_2	2-CN-苯基	993	3	SO_2NH_2	2-Me-苯基
216	4	SO_2NH_2	2-CN-苯基	994	4	SO_2NH_2	2-Me-苯基
217	1	H	3-Me-苯基	995	1	H	4-Me-苯基
218	2	H	3-Me-苯基	996	2	H	4-Me-苯基
219	3	H	3-Me-苯基	997	3	H	4-Me-苯基
220	4	H	3-Me-苯基	998	4	H	4-Me-苯基
221	1	Me	3-Me-苯基	999	1	Me	4-Me-苯基
222	2	Me	3-Me-苯基	1000	2	Me	4-Me-苯基
223	3	Me	3-Me-苯基	1001	3	Me	4-Me-苯基
224	4	Me	3-Me-苯基	1002	4	Me	4-Me-苯基
225	1	CH_2Ph	3-Me-苯基	1003	1	CH_2Ph	4-Me-苯基
226	2	CH_2Ph	3-Me-苯基	1004	2	CH_2Ph	4-Me-苯基
227	3	CH_2Ph	3-Me-苯基	1005	3	CH_2Ph	4-Me-苯基

[2859]

228	4	CH_2Ph	3-Me-苯基	1006	4	CH_2Ph	4-Me-苯基
229	1	COMe	3-Me-苯基	1007	1	COMe	4-Me-苯基
230	2	COMe	3-Me-苯基	1008	2	COMe	4-Me-苯基
231	3	COMe	3-Me-苯基	1009	3	COMe	4-Me-苯基
232	4	COMe	3-Me-苯基	1010	4	COMe	4-Me-苯基
233	1	CO_2Me	3-Me-苯基	1011	1	CO_2Me	4-Me-苯基
234	2	CO_2Me	3-Me-苯基	1012	2	CO_2Me	4-Me-苯基
235	3	CO_2Me	3-Me-苯基	1013	3	CO_2Me	4-Me-苯基
236	4	CO_2Me	3-Me-苯基	1014	4	CO_2Me	4-Me-苯基
237	1	CO_2tBu	3-Me-苯基	1015	1	CO_2tBu	4-Me-苯基
238	2	CO_2tBu	3-Me-苯基	1016	2	CO_2tBu	4-Me-苯基
239	3	CO_2tBu	3-Me-苯基	1017	3	CO_2tBu	4-Me-苯基
240	4	CO_2tBu	3-Me-苯基	1018	4	CO_2tBu	4-Me-苯基
241	1	CONHMe	3-Me-苯基	1019	1	CONHMe	4-Me-苯基
242	2	CONHMe	3-Me-苯基	1020	2	CONHMe	4-Me-苯基
243	3	CONHMe	3-Me-苯基	1021	3	CONHMe	4-Me-苯基
244	4	CONHMe	3-Me-苯基	1022	4	CONHMe	4-Me-苯基
245	1	SO_2Me	3-Me-苯基	1023	1	SO_2Me	4-Me-苯基
246	2	SO_2Me	3-Me-苯基	1024	2	SO_2Me	4-Me-苯基
247	3	SO_2Me	3-Me-苯基	1025	3	SO_2Me	4-Me-苯基
248	4	SO_2Me	3-Me-苯基	1026	4	SO_2Me	4-Me-苯基
249	1	SO_2NH_2	3-Me-苯基	1027	1	SO_2NH_2	4-Me-苯基
250	2	SO_2NH_2	3-Me-苯基	1028	2	SO_2NH_2	4-Me-苯基
251	3	SO_2NH_2	3-Me-苯基	1029	3	SO_2NH_2	4-Me-苯基
252	4	SO_2NH_2	3-Me-苯基	1030	4	SO_2NH_2	4-Me-苯基
253	1	H	2-F-苯基	1031	1	H	3-F-苯基
254	2	H	2-F-苯基	1032	2	H	3-F-苯基

[2860]

255	3	H	2-F-苯基	1033	3	H	3-F-苯基
256	4	H	2-F-苯基	1034	4	H	3-F-苯基
257	1	Me	2-F-苯基	1035	1	Me	3-F-苯基
258	2	Me	2-F-苯基	1036	2	Me	3-F-苯基
259	3	Me	2-F-苯基	1037	3	Me	3-F-苯基
260	4	Me	2-F-苯基	1038	4	Me	3-F-苯基
261	1	CH_2Ph	2-F-苯基	1039	1	CH_2Ph	3-F-苯基
262	2	CH_2Ph	2-F-苯基	1040	2	CH_2Ph	3-F-苯基
263	3	CH_2Ph	2-F-苯基	1041	3	CH_2Ph	3-F-苯基
264	4	CH_2Ph	2-F-苯基	1042	4	CH_2Ph	3-F-苯基
265	1	COMe	2-F-苯基	1043	1	COMe	3-F-苯基
266	2	COMe	2-F-苯基	1044	2	COMe	3-F-苯基
267	3	COMe	2-F-苯基	1045	3	COMe	3-F-苯基
268	4	COMe	2-F-苯基	1046	4	COMe	3-F-苯基
269	1	CO_2Me	2-F-苯基	1047	1	CO_2Me	3-F-苯基
270	2	CO_2Me	2-F-苯基	1048	2	CO_2Me	3-F-苯基
271	3	CO_2Me	2-F-苯基	1049	3	CO_2Me	3-F-苯基
272	4	CO_2Me	2-F-苯基	1050	4	CO_2Me	3-F-苯基
273	1	CO_2tBu	2-F-苯基	1051	1	CO_2tBu	3-F-苯基
274	2	CO_2tBu	2-F-苯基	1052	2	CO_2tBu	3-F-苯基
275	3	CO_2tBu	2-F-苯基	1053	3	CO_2tBu	3-F-苯基
276	4	CO_2tBu	2-F-苯基	1054	4	CO_2tBu	3-F-苯基
277	1	CONHMe	2-F-苯基	1055	1	CONHMe	3-F-苯基
278	2	CONHMe	2-F-苯基	1056	2	CONHMe	3-F-苯基
279	3	CONHMe	2-F-苯基	1057	3	CONHMe	3-F-苯基
280	4	CONHMe	2-F-苯基	1058	4	CONHMe	3-F-苯基
281	1	SO_2Me	2-F-苯基	1059	1	SO_2Me	3-F-苯基

[2861]

282	2	SO_2Me	2-F-苯基	1060	2	SO_2Me	3-F-苯基
283	3	SO_2Me	2-F-苯基	1061	3	SO_2Me	3-F-苯基
284	4	SO_2Me	2-F-苯基	1062	4	SO_2Me	3-F-苯基
285	1	SO_2NH_2	2-F-苯基	1063	1	SO_2NH_2	3-F-苯基
286	2	SO_2NH_2	2-F-苯基	1064	2	SO_2NH_2	3-F-苯基
287	3	SO_2NH_2	2-F-苯基	1065	3	SO_2NH_2	3-F-苯基
288	4	SO_2NH_2	2-F-苯基	1066	4	SO_2NH_2	3-F-苯基
289	1	H	4-F-苯基	1067	1	H	2-Cl-苯基
290	2	H	4-F-苯基	1068	2	H	2-Cl-苯基
291	3	H	4-F-苯基	1069	3	H	2-Cl-苯基
292	4	H	4-F-苯基	1070	4	H	2-Cl-苯基
293	1	Me	4-F-苯基	1071	1	Me	2-Cl-苯基
294	2	Me	4-F-苯基	1072	2	Me	2-Cl-苯基
295	3	Me	4-F-苯基	1073	3	Me	2-Cl-苯基
296	4	Me	4-F-苯基	1074	4	Me	2-Cl-苯基
297	1	CH_2Ph	4-F-苯基	1075	1	CH_2Ph	2-Cl-苯基
298	2	CH_2Ph	4-F-苯基	1076	2	CH_2Ph	2-Cl-苯基
299	3	CH_2Ph	4-F-苯基	1077	3	CH_2Ph	2-Cl-苯基
300	4	CH_2Ph	4-F-苯基	1078	4	CH_2Ph	2-Cl-苯基
301	1	COMe	4-F-苯基	1079	1	COMe	2-Cl-苯基
302	2	COMe	4-F-苯基	1080	2	COMe	2-Cl-苯基
303	3	COMe	4-F-苯基	1081	3	COMe	2-Cl-苯基
304	4	COMe	4-F-苯基	1082	4	COMe	2-Cl-苯基
305	1	CO_2Me	4-F-苯基	1083	1	CO_2Me	2-Cl-苯基
306	2	CO_2Me	4-F-苯基	1084	2	CO_2Me	2-Cl-苯基
307	3	CO_2Me	4-F-苯基	1085	3	CO_2Me	2-Cl-苯基
308	4	CO_2Me	4-F-苯基	1086	4	CO_2Me	2-Cl-苯基

[2862]

309	1	CO_2tBu	4-F-苯基	1087	1	CO_2tBu	2-Cl-苯基
310	2	CO_2tBu	4-F-苯基	1088	2	CO_2tBu	2-Cl-苯基
311	3	CO_2tBu	4-F-苯基	1089	3	CO_2tBu	2-Cl-苯基
312	4	CO_2tBu	4-F-苯基	1090	4	CO_2tBu	2-Cl-苯基
313	1	CONHMe	4-F-苯基	1091	1	CONHMe	2-Cl-苯基
314	2	CONHMe	4-F-苯基	1092	2	CONHMe	2-Cl-苯基
315	3	CONHMe	4-F-苯基	1093	3	CONHMe	2-Cl-苯基
316	4	CONHMe	4-F-苯基	1094	4	CONHMe	2-Cl-苯基
317	1	SO_2Me	4-F-苯基	1095	1	SO_2Me	2-Cl-苯基
318	2	SO_2Me	4-F-苯基	1096	2	SO_2Me	2-Cl-苯基
319	3	SO_2Me	4-F-苯基	1097	3	SO_2Me	2-Cl-苯基
320	4	SO_2Me	4-F-苯基	1098	4	SO_2Me	2-Cl-苯基
321	1	SO_2NH_2	4-F-苯基	1099	1	SO_2NH_2	2-Cl-苯基
322	2	SO_2NH_2	4-F-苯基	1100	2	SO_2NH_2	2-Cl-苯基
323	3	SO_2NH_2	4-F-苯基	1101	3	SO_2NH_2	2-Cl-苯基
324	4	SO_2NH_2	4-F-苯基	1102	4	SO_2NH_2	2-Cl-苯基
325	1	H	3-Cl-苯基	1103	1	H	4-Cl-苯基
326	2	H	3-Cl-苯基	1104	2	H	4-Cl-苯基
327	3	H	3-Cl-苯基	1105	3	H	4-Cl-苯基
328	4	H	3-Cl-苯基	1106	4	H	4-Cl-苯基
329	1	Me	3-Cl-苯基	1107	1	Me	4-Cl-苯基
330	2	Me	3-Cl-苯基	1108	2	Me	4-Cl-苯基
331	3	Me	3-Cl-苯基	1109	3	Me	4-Cl-苯基
332	4	Me	3-Cl-苯基	1110	4	Me	4-Cl-苯基
333	1	CH_2Ph	3-Cl-苯基	1111	1	CH_2Ph	4-Cl-苯基
334	2	CH_2Ph	3-Cl-苯基	1112	2	CH_2Ph	4-Cl-苯基
335	3	CH_2Ph	3-Cl-苯基	1113	3	CH_2Ph	4-Cl-苯基

[2863]

336	4	CH_2Ph	3-Cl-苯基	1114	4	CH_2Ph	4-Cl-苯基
337	1	COMe	3-Cl-苯基	1115	1	COMe	4-Cl-苯基
338	2	COMe	3-Cl-苯基	1116	2	COMe	4-Cl-苯基
339	3	COMe	3-Cl-苯基	1117	3	COMe	4-Cl-苯基
340	4	COMe	3-Cl-苯基	1118	4	COMe	4-Cl-苯基
341	1	CO_2Me	3-Cl-苯基	1119	1	CO_2Me	4-Cl-苯基
342	2	CO_2Me	3-Cl-苯基	1120	2	CO_2Me	4-Cl-苯基
343	3	CO_2Me	3-Cl-苯基	1121	3	CO_2Me	4-Cl-苯基
344	4	CO_2Me	3-Cl-苯基	1122	4	CO_2Me	4-Cl-苯基
345	1	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1123	1	CO_2tBu	4-Cl-苯基
346	2	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1124	2	CO_2tBu	4-Cl-苯基
347	3	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1125	3	CO_2tBu	4-Cl-苯基
348	4	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1126	4	CO_2tBu	4-Cl-苯基
349	1	CONHMe	3-Cl-苯基	1127	1	CONHMe	4-Cl-苯基
350	2	CONHMe	3-Cl-苯基	1128	2	CONHMe	4-Cl-苯基
351	3	CONHMe	3-Cl-苯基	1129	3	CONHMe	4-Cl-苯基
352	4	CONHMe	3-Cl-苯基	1130	4	CONHMe	4-Cl-苯基
353	1	SO_2Me	3-Cl-苯基	1131	1	SO_2Me	4-Cl-苯基
354	2	SO_2Me	3-Cl-苯基	1132	2	SO_2Me	4-Cl-苯基
355	3	SO_2Me	3-Cl-苯基	1133	3	SO_2Me	4-Cl-苯基
356	4	SO_2Me	3-Cl-苯基	1134	4	SO_2Me	4-Cl-苯基
357	1	SO_2NH_2	3-Cl-苯基	1135	1	SO_2NH_2	4-Cl-苯基
358	2	SO_2NH_2	3-Cl-苯基	1136	2	SO_2NH_2	4-Cl-苯基
359	3	SO_2NH_2	3-Cl-苯基	1137	3	SO_2NH_2	4-Cl-苯基
360	4	SO_2NH_2	3-Cl-苯基	1138	4	SO_2NH_2	4-Cl-苯基
361	1	H	2-Br-苯基	1139	1	H	3-Br-苯基
362	2	H	2-Br-苯基	1140	2	H	3-Br-苯基

[2864]

363	3	H	2-Br-苯基	1141	3	H	3-Br-苯基
364	4	H	2-Br-苯基	1142	4	H	3-Br-苯基
365	1	Me	2-Br-苯基	1143	1	Me	3-Br-苯基
366	2	Me	2-Br-苯基	1144	2	Me	3-Br-苯基
367	3	Me	2-Br-苯基	1145	3	Me	3-Br-苯基
368	4	Me	2-Br-苯基	1146	4	Me	3-Br-苯基
369	1	CH_2Ph	2-Br-苯基	1147	1	CH_2Ph	3-Br-苯基
370	2	CH_2Ph	2-Br-苯基	1148	2	CH_2Ph	3-Br-苯基
371	3	CH_2Ph	2-Br-苯基	1149	3	CH_2Ph	3-Br-苯基
372	4	CH_2Ph	2-Br-苯基	1150	4	CH_2Ph	3-Br-苯基
373	1	COMe	2-Br-苯基	1151	1	COMe	3-Br-苯基
374	2	COMe	2-Br-苯基	1152	2	COMe	3-Br-苯基
375	3	COMe	2-Br-苯基	1153	3	COMe	3-Br-苯基
376	4	COMe	2-Br-苯基	1154	4	COMe	3-Br-苯基
377	1	CO_2Me	2-Br-苯基	1155	1	CO_2Me	3-Br-苯基
378	2	CO_2Me	2-Br-苯基	1156	2	CO_2Me	3-Br-苯基
379	3	CO_2Me	2-Br-苯基	1157	3	CO_2Me	3-Br-苯基
380	4	CO_2Me	2-Br-苯基	1158	4	CO_2Me	3-Br-苯基
381	1	CO_2tBu	2-Br-苯基	1159	1	CO_2tBu	3-Br-苯基
382	2	CO_2tBu	2-Br-苯基	1160	2	CO_2tBu	3-Br-苯基
383	3	CO_2tBu	2-Br-苯基	1161	3	CO_2tBu	3-Br-苯基
384	4	CO_2tBu	2-Br-苯基	1162	4	CO_2tBu	3-Br-苯基
385	1	CONHMe	2-Br-苯基	1163	1	CONHMe	3-Br-苯基
386	2	CONHMe	2-Br-苯基	1164	2	CONHMe	3-Br-苯基
387	3	CONHMe	2-Br-苯基	1165	3	CONHMe	3-Br-苯基
388	4	CONHMe	2-Br-苯基	1166	4	CONHMe	3-Br-苯基
389	1	SO_2Me	2-Br-苯基	1167	1	SO_2Me	3-Br-苯基

[2865]

390	2	SO_2Me	2-Br-苯基	1168	2	SO_2Me	3-Br-苯基
391	3	SO_2Me	2-Br-苯基	1169	3	SO_2Me	3-Br-苯基
392	4	SO_2Me	2-Br-苯基	1170	4	SO_2Me	3-Br-苯基
393	1	SO_2NH_2	2-Br-苯基	1171	1	SO_2NH_2	3-Br-苯基
394	2	SO_2NH_2	2-Br-苯基	1172	2	SO_2NH_2	3-Br-苯基
395	3	SO_2NH_2	2-Br-苯基	1173	3	SO_2NH_2	3-Br-苯基
396	4	SO_2NH_2	2-Br-苯基	1174	4	SO_2NH_2	3-Br-苯基
397	1	H	4-Br-苯基	1175	1	H	2-CF_3-苯基
398	2	H	4-Br-苯基	1176	2	H	2-CF_3-苯基
399	3	H	4-Br-苯基	1177	3	H	2-CF_3-苯基
400	4	H	4-Br-苯基	1178	4	H	2-CF_3-苯基
401	1	Me	4-Br-苯基	1179	1	Me	2-CF_3-苯基
402	2	Me	4-Br-苯基	1180	2	Me	2-CF_3-苯基
403	3	Me	4-Br-苯基	1181	3	Me	2-CF_3-苯基
404	4	Me	4-Br-苯基	1182	4	Me	2-CF_3-苯基
405	1	CH_2Ph	4-Br-苯基	1183	1	CH_2Ph	2-CF_3-苯基
406	2	CH_2Ph	4-Br-苯基	1184	2	CH_2Ph	2-CF_3-苯基
407	3	CH_2Ph	4-Br-苯基	1185	3	CH_2Ph	2-CF_3-苯基
408	4	CH_2Ph	4-Br-苯基	1186	4	CH_2Ph	2-CF_3-苯基
409	1	COMe	4-Br-苯基	1187	1	COMe	2-CF_3-苯基
410	2	COMe	4-Br-苯基	1188	2	COMe	2-CF_3-苯基
411	3	COMe	4-Br-苯基	1189	3	COMe	2-CF_3-苯基
412	4	COMe	4-Br-苯基	1190	4	COMe	2-CF_3-苯基
413	1	CO_2Me	4-Br-苯基	1191	1	CO_2Me	2-CF_3-苯基
414	2	CO_2Me	4-Br-苯基	1192	2	CO_2Me	2-CF_3-苯基
415	3	CO_2Me	4-Br-苯基	1193	3	CO_2Me	2-CF_3-苯基
416	4	CO_2Me	4-Br-苯基	1194	4	CO_2Me	2-CF_3-苯基

[2866]

417	1	CO_2tBu	4-Br-苯基	1195	1	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
418	2	CO_2tBu	4-Br-苯基	1196	2	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
419	3	CO_2tBu	4-Br-苯基	1197	3	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
420	4	CO_2tBu	4-Br-苯基	1198	4	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
421	1	CONHMe	4-Br-苯基	1199	1	CONHMe	2-CF_3-苯基
422	2	CONHMe	4-Br-苯基	1200	2	CONHMe	2-CF_3-苯基
423	3	CONHMe	4-Br-苯基	1201	3	CONHMe	2-CF_3-苯基
424	4	CONHMe	4-Br-苯基	1202	4	CONHMe	2-CF_3-苯基
425	1	SO_2Me	4-Br-苯基	1203	1	SO_2Me	2-CF_3-苯基
426	2	SO_2Me	4-Br-苯基	1204	2	SO_2Me	2-CF_3-苯基
427	3	SO_2Me	4-Br-苯基	1205	3	SO_2Me	2-CF_3-苯基
428	4	SO_2Me	4-Br-苯基	1206	4	SO_2Me	2-CF_3-苯基
429	1	SO_2NH_2	4-Br-苯基	1207	1	SO_2NH_2	2-CF_3-苯基
430	2	SO_2NH_2	4-Br-苯基	1208	2	SO_2NH_2	2-CF_3-苯基
431	3	SO_2NH_2	4-Br-苯基	1209	3	SO_2NH_2	2-CF_3-苯基
432	4	SO_2NH_2	4-Br-苯基	1210	4	SO_2NH_2	2-CF_3-苯基
433	1	H	3-CF_3-苯基	1211	1	H	4-CF_3-苯基
434	2	H	3-CF_3-苯基	1212	2	H	4-CF_3-苯基
435	3	H	3-CF_3-苯基	1213	3	H	4-CF_3-苯基
436	4	H	3-CF_3-苯基	1214	4	H	4-CF_3-苯基
437	1	Me	3-CF_3-苯基	1215	1	Me	4-CF_3-苯基
438	2	Me	3-CF_3-苯基	1216	2	Me	4-CF_3-苯基
439	3	Me	3-CF_3-苯基	1217	3	Me	4-CF_3-苯基
440	4	Me	3-CF_3-苯基	1218	4	Me	4-CF_3-苯基
441	1	CH_2Ph	3-CF_3-苯基	1219	1	CH_2Ph	4-CF_3-苯基
442	2	CH_2Ph	3-CF_3-苯基	1220	2	CH_2Ph	4-CF_3-苯基
443	3	CH_2Ph	3-CF_3-苯基	1221	3	CH_2Ph	4-CF_3-苯基

[2867]

444	4	CH_2Ph	3-CF_3-苯基	1222	4	CH_2Ph	4-CF_3-苯基
445	1	COMe	3-CF_3-苯基	1223	1	COMe	4-CF_3-苯基
446	2	COMe	3-CF_3-苯基	1224	2	COMe	4-CF_3-苯基
447	3	COMe	3-CF_3-苯基	1225	3	COMe	4-CF_3-苯基
448	4	COMe	3-CF_3-苯基	1226	4	COMe	4-CF_3-苯基
449	1	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1227	1	CO_2Me	4-CF_3-苯基
450	2	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1228	2	CO_2Me	4-CF_3-苯基
451	3	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1229	3	CO_2Me	4-CF_3-苯基
452	4	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1230	4	CO_2Me	4-CF_3-苯基
453	1	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1231	1	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
454	2	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1232	2	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
455	3	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1233	3	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
456	4	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1234	4	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
457	1	CONHMe	3-CF_3-苯基	1235	1	CONHMe	4-CF_3-苯基
458	2	CONHMe	3-CF_3-苯基	1236	2	CONHMe	4-CF_3-苯基
459	3	CONHMe	3-CF_3-苯基	1237	3	CONHMe	4-CF_3-苯基
460	4	CONHMe	3-CF_3-苯基	1238	4	CONHMe	4-CF_3-苯基
461	1	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1239	1	SO_2Me	4-CF_3-苯基
462	2	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1240	2	SO_2Me	4-CF_3-苯基
463	3	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1241	3	SO_2Me	4-CF_3-苯基
464	4	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1242	4	SO_2Me	4-CF_3-苯基
465	1	SO_2NH_2	3-CF_3-苯基	1243	1	SO_2NH_2	4-CF_3-苯基
466	2	SO_2NH_2	3-CF_3-苯基	1244	2	SO_2NH_2	4-CF_3-苯基
467	3	SO_2NH_2	3-CF_3-苯基	1245	3	SO_2NH_2	4-CF_3-苯基
468	4	SO_2NH_2	3-CF_3-苯基	1246	4	SO_2NH_2	4-CF_3-苯基
469	1	H	2-iPr-苯基	1247	1	H	3-iPr-苯基
470	2	H	2-iPr-苯基	1248	2	H	3-iPr-苯基

[2868]

471	3	H	2-iPr-苯基	1249	3	H	3-iPr-苯基
472	4	H	2-iPr-苯基	1250	4	H	3-iPr-苯基
473	1	Me	2-iPr-苯基	1251	1	Me	3-iPr-苯基
474	2	Me	2-iPr-苯基	1252	2	Me	3-iPr-苯基
475	3	Me	2-iPr-苯基	1253	3	Me	3-iPr-苯基
476	4	Me	2-iPr-苯基	1254	4	Me	3-iPr-苯基
477	1	CH_2Ph	2-iPr-苯基	1255	1	CH_2Ph	3-iPr-苯基
478	2	CH_2Ph	2-iPr-苯基	1256	2	CH_2Ph	3-iPr-苯基
479	3	CH_2Ph	2-iPr-苯基	1257	3	CH_2Ph	3-iPr-苯基
480	4	CH_2Ph	2-iPr-苯基	1258	4	CH_2Ph	3-iPr-苯基
481	1	COMe	2-iPr-苯基	1259	1	COMe	3-iPr-苯基
482	2	COMe	2-iPr-苯基	1260	2	COMe	3-iPr-苯基
483	3	COMe	2-iPr-苯基	1261	3	COMe	3-iPr-苯基
484	4	COMe	2-iPr-苯基	1262	4	COMe	3-iPr-苯基
485	1	CO_2Me	2-iPr-苯基	1263	1	CO_2Me	3-iPr-苯基
486	2	CO_2Me	2-iPr-苯基	1264	2	CO_2Me	3-iPr-苯基
487	3	CO_2Me	2-iPr-苯基	1265	3	CO_2Me	3-iPr-苯基
488	4	CO_2Me	2-iPr-苯基	1266	4	CO_2Me	3-iPr-苯基
489	1	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1267	1	CO_2tBu	3-iPr-苯基
490	2	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1268	2	CO_2tBu	3-iPr-苯基
491	3	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1269	3	CO_2tBu	3-iPr-苯基
492	4	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1270	4	CO_2tBu	3-iPr-苯基
493	1	CONHMe	2-iPr-苯基	1271	1	CONHMe	3-iPr-苯基
494	2	CONHMe	2-iPr-苯基	1272	2	CONHMe	3-iPr-苯基
495	3	CONHMe	2-iPr-苯基	1273	3	CONHMe	3-iPr-苯基
496	4	CONHMe	2-iPr-苯基	1274	4	CONHMe	3-iPr-苯基
497	1	SO_2Me	2-iPr-苯基	1275	1	SO_2Me	3-iPr-苯基

[2869]

498	2	SO_2Me	2-iPr-苯基	1276	2	SO_2Me	3-iPr-苯基
499	3	SO_2Me	2-iPr-苯基	1277	3	SO_2Me	3-iPr-苯基
500	4	SO_2Me	2-iPr-苯基	1278	4	SO_2Me	3-iPr-苯基
501	1	SO_2NH_2	2-iPr-苯基	1279	1	SO_2NH_2	3-iPr-苯基
502	2	SO_2NH_2	2-iPr-苯基	1280	2	SO_2NH_2	3-iPr-苯基
503	3	SO_2NH_2	2-iPr-苯基	1281	3	SO_2NH_2	3-iPr-苯基
504	4	SO_2NH_2	2-iPr-苯基	1282	4	SO_2NH_2	3-iPr-苯基
505	1	H	4-iPr-苯基	1283	1	H	4-NH_2-苯基
506	2	H	4-iPr-苯基	1284	2	H	4-NH_2-苯基
507	3	H	4-iPr-苯基	1285	3	H	4-NH_2-苯基
508	4	H	4-iPr-苯基	1286	4	H	4-NH_2-苯基
509	1	Me	4-iPr-苯基	1287	1	Me	4-NH_2-苯基
510	2	Me	4-iPr-苯基	1288	2	Me	4-NH_2-苯基
511	3	Me	4-iPr-苯基	1289	3	Me	4-NH_2-苯基
512	4	Me	4-iPr-苯基	1290	4	Me	4-NH_2-苯基
513	1	CH_2Ph	4-iPr-苯基	1291	1	CH_2Ph	4-NH_2-苯基
514	2	CH_2Ph	4-iPr-苯基	1292	2	CH_2Ph	4-NH_2-苯基
515	3	CH_2Ph	4-iPr-苯基	1293	3	CH_2Ph	4-NH_2-苯基
516	4	CH_2Ph	4-iPr-苯基	1294	4	CH_2Ph	4-NH_2-苯基
517	1	COMe	4-iPr-苯基	1295	1	COMe	4-NH_2-苯基
518	2	COMe	4-iPr-苯基	1296	2	COMe	4-NH_2-苯基
519	3	COMe	4-iPr-苯基	1297	3	COMe	4-NH_2-苯基
520	4	COMe	4-iPr-苯基	1298	4	COMe	4-NH_2-苯基
521	1	CO_2Me	4-iPr-苯基	1299	1	CO_2Me	4-NH_2-苯基
522	2	CO_2Me	4-iPr-苯基	1300	2	CO_2Me	4-NH_2-苯基
523	3	CO_2Me	4-iPr-苯基	1301	3	CO_2Me	4-NH_2-苯基
524	4	CO_2Me	4-iPr-苯基	1302	4	CO_2Me	4-NH_2-苯基

[2870]

525	1	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1303	1	CO_2tBu	4-NH_2-苯基
526	2	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1304	2	CO_2tBu	4-NH_2-苯基
527	3	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1305	3	CO_2tBu	4-NH_2-苯基
528	4	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1306	4	CO_2tBu	4-NH_2-苯基
529	1	CONHMe	4-iPr-苯基	1307	1	CONHMe	4-NH_2-苯基
530	2	CONHMe	4-iPr-苯基	1308	2	CONHMe	4-NH_2-苯基
531	3	CONHMe	4-iPr-苯基	1309	3	CONHMe	4-NH_2-苯基
532	4	CONHMe	4-iPr-苯基	1310	4	CONHMe	4-NH_2-苯基
533	1	SO_2Me	4-iPr-苯基	1311	1	SO_2Me	4-NH_2-苯基
534	2	SO_2Me	4-iPr-苯基	1312	2	SO_2Me	4-NH_2-苯基
535	3	SO_2Me	4-iPr-苯基	1313	3	SO_2Me	4-NH_2-苯基
536	4	SO_2Me	4-iPr-苯基	1314	4	SO_2Me	4-NH_2-苯基
537	1	SO_2NH_2	4-iPr-苯基	1315	1	SO_2NH_2	4-NH_2-苯基
538	2	SO_2NH_2	4-iPr-苯基	1316	2	SO_2NH_2	4-NH_2-苯基
539	3	SO_2NH_2	4-iPr-苯基	1317	3	SO_2NH_2	4-NH_2-苯基
540	4	SO_2NH_2	4-iPr-苯基	1318	4	SO_2NH_2	4-NH_2-苯基
541	1	H	3-NH_2-苯基	1319	1	H	2-NH_2-苯基
542	2	H	3-NH_2-苯基	1320	2	H	2-NH_2-苯基
543	3	H	3-NH_2-苯基	1321	3	H	2-NH_2-苯基
544	4	H	3-NH_2-苯基	1322	4	H	2-NH_2-苯基
545	1	Me	3-NH_2-苯基	1323	1	Me	2-NH_2-苯基
546	2	Me	3-NH_2-苯基	1324	2	Me	2-NH_2-苯基
547	3	Me	3-NH_2-苯基	1325	3	Me	2-NH_2-苯基
548	4	Me	3-NH_2-苯基	1326	4	Me	2-NH_2-苯基
549	1	CH_2Ph	3-NH_2-苯基	1327	1	CH_2Ph	2-NH_2-苯基
550	2	CH_2Ph	3-NH_2-苯基	1328	2	CH_2Ph	2-NH_2-苯基
551	3	CH_2Ph	3-NH_2-苯基	1329	3	CH_2Ph	2-NH_2-苯基

[2871]

552	4	CH_2Ph	3-NH_2-苯基	1330	4	CH_2Ph	2-NH_2-苯基
553	1	COMe	3-NH_2-苯基	1331	1	COMe	2-NH_2-苯基
554	2	COMe	3-NH_2-苯基	1332	2	COMe	2-NH_2-苯基
555	3	COMe	3-NH_2-苯基	1333	3	COMe	2-NH_2-苯基
556	4	COMe	3-NH_2-苯基	1334	4	COMe	2-NH_2-苯基
557	1	CO_2Me	3-NH_2-苯基	1335	1	CO_2Me	2-NH_2-苯基
558	2	CO_2Me	3-NH_2-苯基	1336	2	CO_2Me	2-NH_2-苯基
559	3	CO_2Me	3-NH_2-苯基	1337	3	CO_2Me	2-NH_2-苯基
560	4	CO_2Me	3-NH_2-苯基	1338	4	CO_2Me	2-NH_2-苯基
561	1	CO_2tBu	3-NH_2-苯基	1339	1	CO_2tBu	2-NH_2-苯基
562	2	CO_2tBu	3-NH_2-苯基	1340	2	CO_2tBu	2-NH_2-苯基
563	3	CO_2tBu	3-NH_2-苯基	1341	3	CO_2tBu	2-NH_2-苯基
564	4	CO_2tBu	3-NH_2-苯基	1342	4	CO_2tBu	2-NH_2-苯基
565	1	CONHMe	3-NH_2-苯基	1343	1	CONHMe	2-NH_2-苯基
566	2	CONHMe	3-NH_2-苯基	1344	2	CONHMe	2-NH_2-苯基
567	3	CONHMe	3-NH_2-苯基	1345	3	CONHMe	2-NH_2-苯基
568	4	CONHMe	3-NH_2-苯基	1346	4	CONHMe	2-NH_2-苯基
569	1	SO_2Me	3-NH_2-苯基	1347	1	SO_2Me	2-NH_2-苯基
570	2	SO_2Me	3-NH_2-苯基	1348	2	SO_2Me	2-NH_2-苯基
571	3	SO_2Me	3-NH_2-苯基	1349	3	SO_2Me	2-NH_2-苯基
572	4	SO_2Me	3-NH_2-苯基	1350	4	SO_2Me	2-NH_2-苯基
573	1	SO_2NH_2	3-NH_2-苯基	1351	1	SO_2NH_2	2-NH_2-苯基
574	2	SO_2NH_2	3-NH_2-苯基	1352	2	SO_2NH_2	2-NH_2-苯基
575	3	SO_2NH_2	3-NH_2-苯基	1353	3	SO_2NH_2	2-NH_2-苯基
576	4	SO_2NH_2	3-NH_2-苯基	1354	4	SO_2NH_2	2-NH_2-苯基
577	1	H	2,4-二-Me-苯基	1355	1	H	2,6-二-Me-苯基
578	2	H	2,4-二-Me-苯基	1356	2	H	2,6-二-Me-苯基

[2872]

579	3	H	2,4-二-Me-苯基	1357	3	H	2,6-二-Me-苯基
580	4	H	2,4-二-Me-苯基	1358	4	H	2,6-二-Me-苯基
581	1	Me	2,4-二-Me-苯基	1359	1	Me	2,6-二-Me-苯基
582	2	Me	2,4-二-Me-苯基	1360	2	Me	2,6-二-Me-苯基
583	3	Me	2,4-二-Me-苯基	1361	3	Me	2,6-二-Me-苯基
584	4	Me	2,4-二-Me-苯基	1362	4	Me	2,6-二-Me-苯基
585	1	CH_2Ph	2,4-二-Me-苯基	1363	1	CH_2Ph	2,6-二-Me-苯基
586	2	CH_2Ph	2,4-二-Me-苯基	1364	2	CH_2Ph	2,6-二-Me-苯基
587	3	CH_2Ph	2,4-二-Me-苯基	1365	3	CH_2Ph	2,6-二-Me-苯基
588	4	CH_2Ph	2,4-二-Me-苯基	1366	4	CH_2Ph	2,6-二-Me-苯基
589	1	COMe	2,4-二-Me-苯基	1367	1	COMe	2,6-二-Me-苯基
590	2	COMe	2,4-二-Me-苯基	1368	2	COMe	2,6-二-Me-苯基
591	3	COMe	2,4-二-Me-苯基	1369	3	COMe	2,6-二-Me-苯基
592	4	COMe	2,4-二-Me-苯基	1370	4	COMe	2,6-二-Me-苯基
593	1	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1371	1	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
594	2	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1372	2	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
595	3	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1373	3	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
596	4	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1374	4	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
597	1	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1375	1	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
598	2	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1376	2	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
599	3	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1377	3	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
600	4	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1378	4	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
601	1	CONHMe	2,4-二-Me-苯基	1379	1	CONHMe	2,6-二-Me-苯基
602	2	CONHMe	2,4-二-Me-苯基	1380	2	CONHMe	2,6-二-Me-苯基
603	3	CONHMe	2,4-二-Me-苯基	1381	3	CONHMe	2,6-二-Me-苯基
604	4	CONHMe	2,4-二-Me-苯基	1382	4	CONHMe	2,6-二-Me-苯基
605	1	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1383	1	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基

[2873]

606	2	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1384	2	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基
607	3	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1385	3	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基
608	4	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1386	4	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基
609	1	SO_2NH_2	2,4-二-Me-苯基	1387	1	SO_2NH_2	2,6-二-Me-苯基
610	2	SO_2NH_2	2,4-二-Me-苯基	1388	2	SO_2NH_2	2,6-二-Me-苯基
611	3	SO_2NH_2	2,4-二-Me-苯基	1389	3	SO_2NH_2	2,6-二-Me-苯基
612	4	SO_2NH_2	2,4-二-Me-苯基	1390	4	SO_2NH_2	2,6-二-Me-苯基
613	1	H	2,6-二-iPr-苯基	1391	1	H	2-Ph-苯基
614	2	H	2,6-二-iPr-苯基	1392	2	H	2-Ph-苯基
615	3	H	2,6-二-iPr-苯基	1393	3	H	2-Ph-苯基
616	4	H	2,6-二-iPr-苯基	1394	4	H	2-Ph-苯基
617	1	Me	2,6-二-iPr-苯基	1395	1	Me	2-Ph-苯基
618	2	Me	2,6-二-iPr-苯基	1396	2	Me	2-Ph-苯基
619	3	Me	2,6-二-iPr-苯基	1397	3	Me	2-Ph-苯基
620	4	Me	2,6-二-iPr-苯基	1398	4	Me	2-Ph-苯基
621	1	CH_2Ph	2,6-二-iPr-苯基	1399	1	CH_2Ph	2-Ph-苯基
622	2	CH_2Ph	2,6-二-iPr-苯基	1400	2	CH_2Ph	2-Ph-苯基
623	3	CH_2Ph	2,6-二-iPr-苯基	1401	3	CH_2Ph	2-Ph-苯基
624	3	CH_2Ph	2,6-二-iPr-苯基	1402	4	CH_2Ph	2-Ph-苯基
625	1	COMe	2,6-二-iPr-苯基	1403	1	COMe	2-Ph-苯基
626	2	COMe	2,6-二-iPr-苯基	1404	2	COMe	2-Ph-苯基
627	3	COMe	2,6-二-iPr-苯基	1405	3	COMe	2-Ph-苯基
628	4	COMe	2,6-二-iPr-苯基	1406	4	COMe	2-Ph-苯基
629	1	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1407	1	CO_2Me	2-Ph-苯基
630	2	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1408	2	CO_2Me	2-Ph-苯基
631	3	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1409	3	CO_2Me	2-Ph-苯基
632	4	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1410	4	CO_2Me	2-Ph-苯基

[2874]

633	1	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基	1411	1	CO_2tBu	2-Ph-苯基
634	2	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基	1412	2	CO_2tBu	2-Ph-苯基
635	3	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基	1413	3	CO_2tBu	2-Ph-苯基
636	4	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基	1414	4	CO_2tBu	2-Ph-苯基
637	1	CONHMe	2,6-二-iPr-苯基	1415	1	CONHMe	2-Ph-苯基
638	2	CONHMe	2,6-二-iPr-苯基	1416	2	CONHMe	2-Ph-苯基
639	3	CONHMe	2,6-二-iPr-苯基	1417	3	CONHMe	2-Ph-苯基
640	4	CONHMe	2,6-二-iPr-苯基	1418	4	CONHMe	2-Ph-苯基
641	1	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1419	1	SO_2Me	2-Ph-苯基
642	2	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1420	2	SO_2Me	2-Ph-苯基
643	3	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1421	3	SO_2Me	2-Ph-苯基
644	4	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1422	4	SO_2Me	2-Ph-苯基
645	1	SO_2NH_2	2,6-二-iPr-苯基	1423	1	SO_2NH_2	2-Ph-苯基
646	2	SO_2NH_2	2,6-二-iPr-苯基	1424	2	SO_2NH_2	2-Ph-苯基
647	3	SO_2NH_2	2,6-二-iPr-苯基	1425	3	SO_2NH_2	2-Ph-苯基
648	4	SO_2NH_2	2,6-二-iPr-苯基	1426	4	SO_2NH_2	2-Ph-苯基
649	1	H	3-Ph-苯基	1427	1	H	4-Ph-苯基
650	2	H	3-Ph-苯基	1428	2	H	4-Ph-苯基
651	3	H	3-Ph-苯基	1429	3	H	4-Ph-苯基
652	4	H	3-Ph-苯基	1430	4	H	4-Ph-苯基
653	1	Me	3-Ph-苯基	1431	1	Me	4-Ph-苯基
654	2	Me	3-Ph-苯基	1432	2	Me	4-Ph-苯基
655	3	Me	3-Ph-苯基	1433	3	Me	4-Ph-苯基
656	4	Me	3-Ph-苯基	1434	4	Me	4-Ph-苯基
657	1	CH_2Ph	3-Ph-苯基	1435	1	CH_2Ph	4-Ph-苯基
658	2	CH_2Ph	3-Ph-苯基	1436	2	CH_2Ph	4-Ph-苯基
659	3	CH_2Ph	3-Ph-苯基	1437	3	CH_2Ph	4-Ph-苯基

[2875]

660	4	CH_2Ph	3-Ph-苯基	1438	4	CH_2Ph	4-Ph-苯基
661	1	COMe	3-Ph-苯基	1439	1	COMe	4-Ph-苯基
662	2	COMe	3-Ph-苯基	1440	2	COMe	4-Ph-苯基
663	3	COMe	3-Ph-苯基	1441	3	COMe	4-Ph-苯基
664	4	COMe	3-Ph-苯基	1442	4	COMe	4-Ph-苯基
665	1	CO_2Me	3-Ph-苯基	1443	1	CO_2Me	4-Ph-苯基
666	2	CO_2Me	3-Ph-苯基	1444	2	CO_2Me	4-Ph-苯基
667	3	CO_2Me	3-Ph-苯基	1445	3	CO_2Me	4-Ph-苯基
668	4	CO_2Me	3-Ph-苯基	1446	4	CO_2Me	4-Ph-苯基
669	1	CO_2tBu	3-Ph-苯基	1447	1	CO_2tBu	4-Ph-苯基
670	2	CO_2tBu	3-Ph-苯基	1448	2	CO_2tBu	4-Ph-苯基
671	3	CO_2tBu	3-Ph-苯基	1449	3	CO_2tBu	4-Ph-苯基
672	4	CO_2tBu	3-Ph-苯基	1450	4	CO_2tBu	4-Ph-苯基
673	1	CONHMe	3-Ph-苯基	1451	1	CONHMe	4-Ph-苯基
674	2	CONHMe	3-Ph-苯基	1452	2	CONHMe	4-Ph-苯基
675	3	CONHMe	3-Ph-苯基	1453	3	CONHMe	4-Ph-苯基
676	4	CONHMe	3-Ph-苯基	1454	4	CONHMe	4-Ph-苯基
677	1	SO_2Me	3-Ph-苯基	1455	1	SO_2Me	4-Ph-苯基
678	2	SO_2Me	3-Ph-苯基	1456	2	SO_2Me	4-Ph-苯基
679	3	SO_2Me	3-Ph-苯基	1457	3	SO_2Me	4-Ph-苯基
680	4	SO_2Me	3-Ph-苯基	1458	4	SO_2Me	4-Ph-苯基
681	1	SO_2NH_2	3-Ph-苯基	1459	1	SO_2NH_2	4-Ph-苯基
682	2	SO_2NH_2	3-Ph-苯基	1460	2	SO_2NH_2	4-Ph-苯基
683	3	SO_2NH_2	3-Ph-苯基	1461	3	SO_2NH_2	4-Ph-苯基
684	4	SO_2NH_2	3-Ph-苯基	1462	4	SO_2NH_2	4-Ph-苯基
685	1	H	2-吗啉代-苯基	1463	1	H	3-吗啉代-苯基
686	2	H	2-吗啉代-苯基	1464	2	H	3-吗啉代-苯基

[2876]

687	3	H	2-吗啉代-苯基	1465	3	H	3-吗啉代-苯基
688	4	H	2-吗啉代-苯基	1466	4	H	3-吗啉代-苯基
689	1	Me	2-吗啉代-苯基	1467	1	Me	3-吗啉代-苯基
690	2	Me	2-吗啉代-苯基	1468	2	Me	3-吗啉代-苯基
691	3	Me	2-吗啉代-苯基	1469	3	Me	3-吗啉代-苯基
692	4	Me	2-吗啉代-苯基	1470	4	Me	3-吗啉代-苯基
693	1	CH_2Ph	2-吗啉代-苯基	1471	1	CH_2Ph	3-吗啉代-苯基
694	2	CH_2Ph	2-吗啉代-苯基	1472	2	CH_2Ph	3-吗啉代-苯基
695	3	CH_2Ph	2-吗啉代-苯基	1473	3	CH_2Ph	3-吗啉代-苯基
696	4	CH_2Ph	2-吗啉代-苯基	1474	4	CH_2Ph	3-吗啉代-苯基
697	1	COMe	2-吗啉代-苯基	1475	1	COMe	3-吗啉代-苯基
698	2	COMe	2-吗啉代-苯基	1476	2	COMe	3-吗啉代-苯基
699	3	COMe	2-吗啉代-苯基	1477	3	COMe	3-吗啉代-苯基
700	4	COMe	2-吗啉代-苯基	1478	4	COMe	3-吗啉代-苯基
701	1	CO_2Me	2-吗啉代-苯基	1479	1	CO_2Me	3-吗啉代-苯基
702	2	CO_2Me	2-吗啉代-苯基	1480	2	CO_2Me	3-吗啉代-苯基
703	3	CO_2Me	2-吗啉代-苯基	1481	3	CO_2Me	3-吗啉代-苯基
704	4	CO_2Me	2-吗啉代-苯基	1482	4	CO_2Me	3-吗啉代-苯基
705	1	CO_2tBu	2-吗啉代-苯基	1483	1	CO_2tBu	3-吗啉代-苯基
706	2	CO_2tBu	2-吗啉代-苯基	1484	2	CO_2tBu	3-吗啉代-苯基
707	3	CO_2tBu	2-吗啉代-苯基	1485	3	CO_2tBu	3-吗啉代-苯基
708	4	CO_2tBu	2-吗啉代-苯基	1486	4	CO_2tBu	3-吗啉代-苯基
709	1	CONHMe	2-吗啉代-苯基	1487	1	CONHMe	3-吗啉代-苯基
710	2	CONHMe	2-吗啉代-苯基	1488	2	CONHMe	3-吗啉代-苯基
711	3	CONHMe	2-吗啉代-苯基	1489	3	CONHMe	3-吗啉代-苯基
712	4	CONHMe	2-吗啉代-苯基	1490	4	CONHMe	3-吗啉代-苯基
713	1	SO_2Me	2-吗啉代-苯基	1491	1	SO_2Me	3-吗啉代-苯基

[2877]

714	2	SO_2Me	2-吗啉代-苯基	1492	2	SO_2Me	3-吗啉代-苯基
715	3	SO_2Me	2-吗啉代-苯基	1493	3	SO_2Me	3-吗啉代-苯基
716	4	SO_2Me	2-吗啉代-苯基	1494	4	SO_2Me	3-吗啉代-苯基
717	1	SO_2NH_2	2-吗啉代-苯基	1495	1	SO_2NH_2	3-吗啉代-苯基
718	2	SO_2NH_2	2-吗啉代-苯基	1496	2	SO_2NH_2	3-吗啉代-苯基
719	3	SO_2NH_2	2-吗啉代-苯基	1497	3	SO_2NH_2	3-吗啉代-苯基
720	4	SO_2NH_2	2-吗啉代-苯基	1498	4	**SO_2NH_2**	3-吗啉代-苯基
721	1	H	4-吗啉代-苯基	1499	1	Me	4-吗啉代-苯基
722	2	H	4-吗啉代-苯基	1500	2	Me	4-吗啉代-苯基
723	3	H	4-吗啉代-苯基	1501	3	Me	4-吗啉代-苯基
724	4	H	4-吗啉代-苯基	1502	4	Me	4-吗啉代-苯基
725	1	CH_2Ph	4-吗啉代-苯基	103	1	COMe	4-吗啉代-苯基
726	2	CH_2Ph	4-吗啉代-苯基	1504	2	COMe	4-吗啉代-苯基
727	3	CH_2Ph	4-吗啉代-苯基	1505	3	COMe	4-吗啉代-苯基
728	4	CH_2Ph	4-吗啉代-苯基	1506	4	COMe	4-吗啉代-苯基
729	1	CO_2Me	4-吗啉代-苯基	1507	1	CO_2tBu	4-吗啉代-苯基
730	2	CO_2Me	4-吗啉代-苯基	1508	2	CO_2tBu	4-吗啉代-苯基
731	3	CO_2Me	4-吗啉代-苯基	1509	3	CO_2tBu	4-吗啉代-苯基
732	4	CO_2Me	4-吗啉代-苯基	1510	4	CO_2tBu	4-吗啉代-苯基
733	1	CONHMe	4-吗啉代-苯基	1511	1	SO_2Me	4-吗啉代-苯基
734	2	CONHMe	4-吗啉代-苯基	1512	2	SO_2Me	4-吗啉代-苯基
735	3	CONHMe	4-吗啉代-苯基	1513	3	SO_2Me	4-吗啉代-苯基
736	4	CONHMe	4-吗啉代-苯基	1514	4	SO_2Me	4-吗啉代-苯基
737	1	SO_2NH_2	4-吗啉代-苯基	1516	1	H	亚萘-2-基
738	2	SO_2NH_2	4-吗啉代-苯基	1517	2	H	亚萘-2-基
739	3	SO_2NH_2	4-吗啉代-苯基	1518	3	H	亚萘-2-基
740	1	H	亚萘-1-基	1519	4	H	亚萘-2-基

[2878]

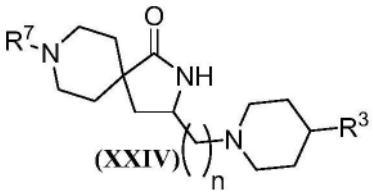
741	2	H	亚萘-1-基	1520	1	Me	亚萘-2-基
742	3	H	亚萘-1-基	1521	2	Me	亚萘-2-基
743	4	H	亚萘-1-基	1522	3	Me	亚萘-2-基
744	1	Me	亚萘-1-基	1523	4	Me	亚萘-2-基
745	2	Me	亚萘-1-基	1524	1	CH_2Ph	亚萘-2-基
746	3	Me	亚萘-1-基	1525	2	CH_2Ph	亚萘-2-基
747	4	Me	亚萘-1-基	1526	3	CH_2Ph	亚萘-2-基
748	1	CH_2Ph	亚萘-1-基	1527	4	CH_2Ph	亚萘-2-基
749	2	CH_2Ph	亚萘-1-基	1528	1	COMe	亚萘-2-基
750	3	CH_2Ph	亚萘-1-基	1529	2	COMe	亚萘-2-基
751	4	CH_2Ph	亚萘-1-基	1530	3	COMe	亚萘-2-基
752	1	COMe	亚萘-1-基	1531	4	COMe	亚萘-2-基
753	2	COMe	亚萘-1-基	1532	1	CO_2Me	亚萘-2-基
754	3	COMe	亚萘-1-基	1533	2	CO_2Me	亚萘-2-基
755	4	COMe	亚萘-1-基	1534	3	CO_2Me	亚萘-2-基
756	1	CO_2Me	亚萘-1-基	1535	4	CO_2Me	亚萘-2-基
757	2	CO_2Me	亚萘-1-基	1536	1	CO_2tBu	亚萘-2-基
758	3	CO_2Me	亚萘-1-基	1537	2	CO_2tBu	亚萘-2-基
759	4	CO_2Me	亚萘-1-基	1538	3	CO_2tBu	亚萘-2-基
760	1	CO_2tBu	亚萘-1-基	1539	4	CO_2tBu	亚萘-2-基
761	2	CO_2tBu	亚萘-1-基	1540	1	CONHMe	亚萘-2-基
762	3	CO_2tBu	亚萘-1-基	1541	2	CONHMe	亚萘-2-基
763	4	CO_2tBu	亚萘-1-基	1542	3	CONHMe	亚萘-2-基
764	1	CONHMe	亚萘-1-基	1543	4	CONHMe	亚萘-2-基
765	2	CONHMe	亚萘-1-基	1544	1	SO_2Me	亚萘-2-基
767	3	CONHMe	亚萘-1-基	1545	2	SO_2Me	亚萘-2-基
768	4	CONHMe	亚萘-1-基	1546	3	SO_2Me	亚萘-2-基

[2879]

769	1	SO_2Me	亚萘-1-基	1547	4	SO_2Me	亚萘-2-基
770	2	SO_2Me	亚萘-1-基	1548	1	SO_2NH_2	亚萘-2-基
771	3	SO_2Me	亚萘-1-基	1549	2	SO_2NH_2	亚萘-2-基
772	4	SO_2Me	亚萘-1-基	1550	3	SO_2NH_2	亚萘-2-基
773	1	SO_2NH_2	亚萘-1-基	1551	4	SO_2NH_2	亚萘-2-基
774	2	SO_2NH_2	亚萘-1-基				
775	3	SO_2NH_2	亚萘-1-基				
778	4	SO_2NH_2	亚萘-1-基				

[2880] 示例性实施方案包括具有式(XXIV)的化合物

[2881]



[2882] 或其可药用盐形式,如在下文表18中所定义。

[2883] 表18:

[2884]

条目	n	R^7	R^3	条目	n	R^7	R^3
1	1	H	苯基	779	1	H	4-OH-苯基
2	2	H	苯基	780	2	H	4-OH-苯基
3	3	H	苯基	781	3	H	4-OH-苯基
4	4	H	苯基	782	4	H	4-OH-苯基
5	1	Me	苯基	783	1	Me	4-OH-苯基
6	2	Me	苯基	784	2	Me	4-OH-苯基
7	3	Me	苯基	785	3	Me	4-OH-苯基
8	4	Me	苯基	786	4	Me	4-OH-苯基
9	1	CH_2Ph	苯基	787	1	CH_2Ph	4-OH-苯基
10	2	CH_2Ph	苯基	788	2	CH_2Ph	4-OH-苯基
11	3	CH_2Ph	苯基	789	3	CH_2Ph	4-OH-苯基
12	4	CH_2Ph	苯基	790	4	CH_2Ph	4-OH-苯基
13	1	COMe	苯基	791	1	COMe	4-OH-苯基

[2885]

14	2	COMe	苯基	792	2	COMe	4-OH-苯基
15	3	COMe	苯基	793	3	COMe	4-OH-苯基
16	4	COMe	苯基	794	4	COMe	4-OH-苯基
17	1	CO_2Me	苯基	795	1	CO_2Me	4-OH-苯基
18	2	CO_2Me	苯基	796	2	CO_2Me	4-OH-苯基
19	3	CO_2Me	苯基	797	3	CO_2Me	4-OH-苯基
20	4	CO_2Me	苯基	798	4	CO_2Me	4-OH-苯基
21	1	CO_2tBu	苯基	799	1	CO_2tBu	4-OH-苯基
22	2	CO_2tBu	苯基	800	2	CO_2tBu	4-OH-苯基
23	3	CO_2tBu	苯基	801	3	CO_2tBu	4-OH-苯基
24	4	CO_2tBu	苯基	802	4	CO_2tBu	4-OH-苯基
25	1	CONHMe	苯基	803	1	CONHMe	4-OH-苯基
26	2	CONHMe	苯基	804	2	CONHMe	4-OH-苯基
27	3	CONHMe	苯基	805	3	CONHMe	4-OH-苯基
28	4	CONHMe	苯基	806	4	CONHMe	4-OH-苯基
29	1	SO_2Me	苯基	807	1	SO_2Me	4-OH-苯基
30	2	SO_2Me	苯基	808	2	SO_2Me	4-OH-苯基
31	3	SO_2Me	苯基	809	3	SO_2Me	4-OH-苯基
32	4	SO_2Me	苯基	810	4	SO_2Me	4-OH-苯基
33	1	SO_2NH_2	苯基	811	1	SO_2NH_2	4-OH-苯基
34	2	SO_2NH_2	苯基	812	2	SO_2NH_2	4-OH-苯基
35	3	SO_2NH_2	苯基	813	3	SO_2NH_2	4-OH-苯基
36	4	SO_2NH_2	苯基	814	4	SO_2NH_2	4-OH-苯基
37	1	H	3-OH-苯基	815	1	H	2-OH-苯基
38	2	H	3-OH-苯基	816	2	H	2-OH-苯基
39	3	H	3-OH-苯基	817	3	H	2-OH-苯基
40	4	H	3-OH-苯基	818	4	H	2-OH-苯基

[2886]

41	1	Me	3-OH-苯基	819	1	Me	2-OH-苯基
42	2	Me	3-OH-苯基	820	2	Me	2-OH-苯基
43	3	Me	3-OH-苯基	821	3	Me	2-OH-苯基
44	4	Me	3-OH-苯基	822	4	Me	2-OH-苯基
45	1	CH_2Ph	3-OH-苯基	823	1	CH_2Ph	2-OH-苯基
46	2	CH_2Ph	3-OH-苯基	824	2	CH_2Ph	2-OH-苯基
47	3	CH_2Ph	3-OH-苯基	825	3	CH_2Ph	2-OH-苯基
48	4	CH_2Ph	3-OH-苯基	826	4	CH_2Ph	2-OH-苯基
49	1	COMe	3-OH-苯基	827	1	COMe	2-OH-苯基
50	2	COMe	3-OH-苯基	828	2	COMe	2-OH-苯基
51	3	COMe	3-OH-苯基	829	3	COMe	2-OH-苯基
52	4	COMe	3-OH-苯基	830	4	COMe	2-OH-苯基
53	1	CO_2Me	3-OH-苯基	831	1	CO_2Me	2-OH-苯基
54	2	CO_2Me	3-OH-苯基	832	2	CO_2Me	2-OH-苯基
55	3	CO_2Me	3-OH-苯基	833	3	CO_2Me	2-OH-苯基
56	4	CO_2Me	3-OH-苯基	834	4	CO_2Me	2-OH-苯基
57	1	CO_2tBu	3-OH-苯基	835	1	CO_2tBu	2-OH-苯基
58	2	CO_2tBu	3-OH-苯基	836	2	CO_2tBu	2-OH-苯基
59	3	CO_2tBu	3-OH-苯基	837	3	CO_2tBu	2-OH-苯基
60	4	CO_2tBu	3-OH-苯基	838	4	CO_2tBu	2-OH-苯基
61	1	CONHMe	3-OH-苯基	839	1	CONHMe	2-OH-苯基
62	2	CONHMe	3-OH-苯基	840	2	CONHMe	2-OH-苯基
63	3	CONHMe	3-OH-苯基	841	3	CONHMe	2-OH-苯基
64	4	CONHMe	3-OH-苯基	842	4	CONHMe	2-OH-苯基
65	1	SO_2Me	3-OH-苯基	843	1	SO_2Me	2-OH-苯基
66	2	SO_2Me	3-OH-苯基	844	2	SO_2Me	2-OH-苯基
67	3	SO_2Me	3-OH-苯基	845	3	SO_2Me	2-OH-苯基

[2887]

68	4	SO_2Me	3-OH-苯基	846	4	SO_2Me	2-OH-苯基
69	1	SO_2NH_2	3-OH-苯基	847	1	SO_2NH_2	2-OH-苯基
70	2	SO_2NH_2	3-OH-苯基	848	2	SO_2NH_2	2-OH-苯基
71	3	SO_2NH_2	3-OH-苯基	849	3	SO_2NH_2	2-OH-苯基
72	4	SO_2NH_2	3-OH-苯基	850	4	SO_2NH_2	2-OH-苯基
73	1	H	4-NO_2-苯基	851	1	H	4-OMe-苯基
74	2	H	4-NO_2-苯基	852	2	H	4-OMe-苯基
75	3	H	4-NO_2-苯基	853	3	H	4-OMe-苯基
76	4	H	4-NO_2-苯基	854	4	H	4-OMe-苯基
77	1	Me	4-NO_2-苯基	855	1	Me	4-OMe-苯基
78	2	Me	4-NO_2-苯基	856	2	Me	4-OMe-苯基
79	3	Me	4-NO_2-苯基	857	3	Me	4-OMe-苯基
80	4	Me	4-NO_2-苯基	858	4	Me	4-OMe-苯基
81	1	CH_2Ph	4-NO_2-苯基	859	1	CH_2Ph	4-OMe-苯基
82	2	CH_2Ph	4-NO_2-苯基	860	2	CH_2Ph	4-OMe-苯基
83	3	CH_2Ph	4-NO_2-苯基	861	3	CH_2Ph	4-OMe-苯基
84	4	CH_2Ph	4-NO_2-苯基	862	4	CH_2Ph	4-OMe-苯基
85	1	COMe	4-NO_2-苯基	863	1	COMe	4-OMe-苯基
86	2	COMe	4-NO_2-苯基	864	2	COMe	4-OMe-苯基
87	3	COMe	4-NO_2-苯基	865	3	COMe	4-OMe-苯基
88	4	COMe	4-NO_2-苯基	866	4	COMe	4-OMe-苯基
89	1	CO_2Me	4-NO_2-苯基	867	1	CO_2Me	4-OMe-苯基
90	2	CO_2Me	4-NO_2-苯基	868	2	CO_2Me	4-OMe-苯基
91	3	CO_2Me	4-NO_2-苯基	869	3	CO_2Me	4-OMe-苯基
92	4	CO_2Me	4-NO_2-苯基	870	4	CO_2Me	4-OMe-苯基
93	1	CO_2tBu	4-NO_2-苯基	871	1	CO_2tBu	4-OMe-苯基
94	2	CO_2tBu	4-NO_2-苯基	872	2	CO_2tBu	4-OMe-苯基

[2888]

95	3	CO_2tBu	4-NO_2-苯基	873	3	CO_2tBu	4-OMe-苯基
96	4	CO_2tBu	4-NO_2-苯基	874	4	CO_2tBu	4-OMe-苯基
97	1	CONHMe	4-NO_2-苯基	875	1	CONHMe	4-OMe-苯基
98	2	CONHMe	4-NO_2-苯基	876	2	CONHMe	4-OMe-苯基
99	3	CONHMe	4-NO_2-苯基	877	3	CONHMe	4-OMe-苯基
100	4	CONHMe	4-NO_2-苯基	878	4	CONHMe	4-OMe-苯基
101	1	SO_2Me	4-NO_2-苯基	879	1	SO_2Me	4-OMe-苯基
102	2	SO_2Me	4-NO_2-苯基	880	2	SO_2Me	4-OMe-苯基
103	3	SO_2Me	4-NO_2-苯基	881	3	SO_2Me	4-OMe-苯基
104	4	SO_2Me	4-NO_2-苯基	882	4	SO_2Me	4-OMe-苯基
105	1	SO_2NH_2	4-NO_2-苯基	883	1	SO_2NH_2	4-OMe-苯基
106	2	SO_2NH_2	4-NO_2-苯基	884	2	SO_2NH_2	4-OMe-苯基
107	3	SO_2NH_2	4-NO_2-苯基	885	3	SO_2NH_2	4-OMe-苯基
108	4	SO_2NH_2	4-NO_2-苯基	886	4	SO_2NH_2	4-OMe-苯基
109	1	H	3-OMe-苯基	887	1	H	2-OMe-苯基
110	2	H	3-OMe-苯基	888	2	H	2-OMe-苯基
111	3	H	3-OMe-苯基	889	3	H	2-OMe-苯基
112	4	H	3-OMe-苯基	890	4	H	2-OMe-苯基
113	1	Me	3-OMe-苯基	891	1	Me	2-OMe-苯基
114	2	Me	3-OMe-苯基	892	2	Me	2-OMe-苯基
115	3	Me	3-OMe-苯基	893	3	Me	2-OMe-苯基
116	4	Me	3-OMe-苯基	894	4	Me	2-OMe-苯基
117	1	CH_2Ph	3-OMe-苯基	895	1	CH_2Ph	2-OMe-苯基
118	2	CH_2Ph	3-OMe-苯基	896	2	CH_2Ph	2-OMe-苯基
119	3	CH_2Ph	3-OMe-苯基	897	3	CH_2Ph	2-OMe-苯基
120	4	CH_2Ph	3-OMe-苯基	898	4	CH_2Ph	2-OMe-苯基
121	1	COMe	3-OMe-苯基	899	1	COMe	2-OMe-苯基

[2889]

122	2	COMe	3-OMe-苯基	900	2	COMe	2-OMe-苯基
123	3	COMe	3-OMe-苯基	901	3	COMe	2-OMe-苯基
124	4	COMe	3-OMe-苯基	902	4	COMe	2-OMe-苯基
125	1	CO_2Me	3-OMe-苯基	903	1	CO_2Me	2-OMe-苯基
126	2	CO_2Me	3-OMe-苯基	904	2	CO_2Me	2-OMe-苯基
127	3	CO_2Me	3-OMe-苯基	905	3	CO_2Me	2-OMe-苯基
128	4	CO_2Me	3-OMe-苯基	906	4	CO_2Me	2-OMe-苯基
129	1	CO_2tBu	3-OMe-苯基	907	1	CO_2tBu	2-OMe-苯基
130	2	CO_2tBu	3-OMe-苯基	908	2	CO_2tBu	2-OMe-苯基
131	3	CO_2tBu	3-OMe-苯基	909	3	CO_2tBu	2-OMe-苯基
132	4	CO_2tBu	3-OMe-苯基	910	4	CO_2tBu	2-OMe-苯基
133	1	CONHMe	3-OMe-苯基	911	1	CONHMe	2-OMe-苯基
134	2	CONHMe	3-OMe-苯基	912	2	CONHMe	2-OMe-苯基
135	3	CONHMe	3-OMe-苯基	913	3	CONHMe	2-OMe-苯基
136	4	CONHMe	3-OMe-苯基	914	4	CONHMe	2-OMe-苯基
137	1	SO_2Me	3-OMe-苯基	915	1	SO_2Me	2-OMe-苯基
138	2	SO_2Me	3-OMe-苯基	916	2	SO_2Me	2-OMe-苯基
139	3	SO_2Me	3-OMe-苯基	917	3	SO_2Me	2-OMe-苯基
140	4	SO_2Me	3-OMe-苯基	918	4	SO_2Me	2-OMe-苯基
141	1	SO_2NH_2	3-OMe-苯基	919	1	SO_2NH_2	2-OMe-苯基
142	2	SO_2NH_2	3-OMe-苯基	920	2	SO_2NH_2	2-OMe-苯基
143	3	SO_2NH_2	3-OMe-苯基	921	3	SO_2NH_2	2-OMe-苯基
144	4	SO_2NH_2	3-OMe-苯基	922	4	SO_2NH_2	2-OMe-苯基
145	1	H	4-CN-苯基	923	1	H	3-CN-苯基
146	2	H	4-CN-苯基	924	2	H	3-CN-苯基
147	3	H	4-CN-苯基	925	3	H	3-CN-苯基
148	4	H	4-CN-苯基	926	4	H	3-CN-苯基

[2890]

149	1	Me	4-CN-苯基	927	1	Me	3-CN-苯基
150	2	Me	4-CN-苯基	928	2	Me	3-CN-苯基
151	3	Me	4-CN-苯基	929	3	Me	3-CN-苯基
152	4	Me	4-CN-苯基	930	4	Me	3-CN-苯基
153	1	CH_2Ph	4-CN-苯基	931	1	CH_2Ph	3-CN-苯基
154	2	CH_2Ph	4-CN-苯基	932	2	CH_2Ph	3-CN-苯基
155	3	CH_2Ph	4-CN-苯基	933	3	CH_2Ph	3-CN-苯基
156	4	CH_2Ph	4-CN-苯基	934	4	CH_2Ph	3-CN-苯基
157	1	COMe	4-CN-苯基	935	1	COMe	3-CN-苯基
158	2	COMe	4-CN-苯基	936	2	COMe	3-CN-苯基
159	3	COMe	4-CN-苯基	937	3	COMe	3-CN-苯基
160	4	COMe	4-CN-苯基	938	4	COMe	3-CN-苯基
161	1	CO_2Me	4-CN-苯基	939	1	CO_2Me	3-CN-苯基
162	2	CO_2Me	4-CN-苯基	940	2	CO_2Me	3-CN-苯基
163	3	CO_2Me	4-CN-苯基	941	3	CO_2Me	3-CN-苯基
164	4	CO_2Me	4-CN-苯基	942	4	CO_2Me	3-CN-苯基
165	1	CO_2tBu	4-CN-苯基	943	1	CO_2tBu	3-CN-苯基
166	2	CO_2tBu	4-CN-苯基	944	2	CO_2tBu	3-CN-苯基
167	3	CO_2tBu	4-CN-苯基	945	3	CO_2tBu	3-CN-苯基
168	4	CO_2tBu	4-CN-苯基	946	4	CO_2tBu	3-CN-苯基
169	1	CONHMe	4-CN-苯基	947	1	CONHMe	3-CN-苯基
170	2	CONHMe	4-CN-苯基	948	2	CONHMe	3-CN-苯基
171	3	CONHMe	4-CN-苯基	949	3	CONHMe	3-CN-苯基
172	4	CONHMe	4-CN-苯基	950	4	CONHMe	3-CN-苯基
173	1	SO_2Me	4-CN-苯基	951	1	SO_2Me	3-CN-苯基
174	2	SO_2Me	4-CN-苯基	952	2	SO_2Me	3-CN-苯基
175	3	SO_2Me	4-CN-苯基	953	3	SO_2Me	3-CN-苯基

[2891]

176	4	SO_2Me	4-CN-苯基	954	4	SO_2Me	3-CN-苯基
177	1	SO_2NH_2	4-CN-苯基	955	1	SO_2NH_2	3-CN-苯基
178	2	SO_2NH_2	4-CN-苯基	956	2	SO_2NH_2	3-CN-苯基
179	3	SO_2NH_2	4-CN-苯基	957	3	SO_2NH_2	3-CN-苯基
180	4	SO_2NH_2	4-CN-苯基	958	4	SO_2NH_2	3-CN-苯基
181	1	H	2-CN-苯基	959	1	H	2-Me-苯基
182	2	H	2-CN-苯基	960	2	H	2-Me-苯基
183	3	H	2-CN-苯基	961	3	H	2-Me-苯基
184	4	H	2-CN-苯基	962	4	H	2-Me-苯基
185	1	Me	2-CN-苯基	963	1	Me	2-Me-苯基
186	2	Me	2-CN-苯基	964	2	Me	2-Me-苯基
187	3	Me	2-CN-苯基	965	3	Me	2-Me-苯基
188	4	Me	2-CN-苯基	966	4	Me	2-Me-苯基
189	1	CH_2Ph	2-CN-苯基	967	1	CH_2Ph	2-Me-苯基
190	2	CH_2Ph	2-CN-苯基	968	2	CH_2Ph	2-Me-苯基
191	3	CH_2Ph	2-CN-苯基	969	3	CH_2Ph	2-Me-苯基
192	4	CH_2Ph	2-CN-苯基	970	4	CH_2Ph	2-Me-苯基
193	1	COMe	2-CN-苯基	971	1	COMe	2-Me-苯基
194	2	COMe	2-CN-苯基	972	2	COMe	2-Me-苯基
195	3	COMe	2-CN-苯基	973	3	COMe	2-Me-苯基
196	4	COMe	2-CN-苯基	974	4	COMe	2-Me-苯基
197	1	CO_2Me	2-CN-苯基	975	1	CO_2Me	2-Me-苯基
198	2	CO_2Me	2-CN-苯基	976	2	CO_2Me	2-Me-苯基
199	3	CO_2Me	2-CN-苯基	977	3	CO_2Me	2-Me-苯基
200	4	CO_2Me	2-CN-苯基	978	4	CO_2Me	2-CN-苯基
201	1	CO_2tBu	2-CN-苯基	979	1	CO_2tBu	2-Me-苯基
202	2	CO_2tBu	2-CN-苯基	980	2	CO_2tBu	2-Me-苯基

[2892]

203	3	CO_2tBu	2-CN-苯基	981	3	CO_2tBu	2-Me-苯基
204	4	CO_2tBu	2-CN-苯基	982	4	CO_2tBu	2-Me-苯基
205	1	CONHMe	2-CN-苯基	983	1	CONHMe	2-Me-苯基
206	2	CONHMe	2-CN-苯基	984	2	CONHMe	2-Me-苯基
207	3	CONHMe	2-CN-苯基	985	3	CONHMe	2-Me-苯基
208	4	CONHMe	2-CN-苯基	986	4	CONHMe	2-Me-苯基
209	1	SO_2Me	2-CN-苯基	987	1	SO_2Me	2-Me-苯基
210	2	SO_2Me	2-CN-苯基	988	2	SO_2Me	2-Me-苯基
211	3	SO_2Me	2-CN-苯基	989	3	SO_2Me	2-Me-苯基
212	4	SO_2Me	2-CN-苯基	990	4	SO_2Me	2-Me-苯基
213	1	SO_2NH_2	2-CN-苯基	991	1	SO_2NH_2	2-Me-苯基
214	2	SO_2NH_2	2-CN-苯基	992	2	SO_2NH_2	2-Me-苯基
215	3	SO_2NH_2	2-CN-苯基	993	3	SO_2NH_2	2-Me-苯基
216	4	SO_2NH_2	2-CN-苯基	994	4	SO_2NH_2	2-Me-苯基
217	1	H	3-Me-苯基	995	1	H	4-Me-苯基
218	2	H	3-Me-苯基	996	2	H	4-Me-苯基
219	3	H	3-Me-苯基	997	3	H	4-Me-苯基
220	4	H	3-Me-苯基	998	4	H	4-Me-苯基
221	1	Me	3-Me-苯基	999	1	Me	4-Me-苯基
222	2	Me	3-Me-苯基	1000	2	Me	4-Me-苯基
223	3	Me	3-Me-苯基	1001	3	Me	4-Me-苯基
224	4	Me	3-Me-苯基	1002	4	Me	4-Me-苯基
225	1	CH_2Ph	3-Me-苯基	1003	1	CH_2Ph	4-Me-苯基
226	2	CH_2Ph	3-Me-苯基	1004	2	CH_2Ph	4-Me-苯基
227	3	CH_2Ph	3-Me-苯基	1005	3	CH_2Ph	4-Me-苯基
228	4	CH_2Ph	3-Me-苯基	1006	4	CH_2Ph	4-Me-苯基
229	1	COMe	3-Me-苯基	1007	1	COMe	4-Me-苯基

[2893]

230	2	COMe	3-Me-苯基	1008	2	COMe	4-Me-苯基
231	3	COMe	3-Me-苯基	1009	3	COMe	4-Me-苯基
232	4	COMe	3-Me-苯基	1010	4	COMe	4-Me-苯基
233	1	CO_2Me	3-Me-苯基	1011	1	CO_2Me	4-Me-苯基
234	2	CO_2Me	3-Me-苯基	1012	2	CO_2Me	4-Me-苯基
235	3	CO_2Me	3-Me-苯基	1013	3	CO_2Me	4-Me-苯基
236	4	CO_2Me	3-Me-苯基	1014	4	CO_2Me	4-Me-苯基
237	1	CO_2tBu	3-Me-苯基	1015	1	CO_2tBu	4-Me-苯基
238	2	CO_2tBu	3-Me-苯基	1016	2	CO_2tBu	4-Me-苯基
239	3	CO_2tBu	3-Me-苯基	1017	3	CO_2tBu	4-Me-苯基
240	4	CO_2tBu	3-Me-苯基	1018	4	CO_2tBu	4-Me-苯基
241	1	CONHMe	3-Me-苯基	1019	1	CONHMe	4-Me-苯基
242	2	CONHMe	3-Me-苯基	1020	2	CONHMe	4-Me-苯基
243	3	CONHMe	3-Me-苯基	1021	3	CONHMe	4-Me-苯基
244	4	CONHMe	3-Me-苯基	1022	4	CONHMe	4-Me-苯基
245	1	SO_2Me	3-Me-苯基	1023	1	SO_2Me	4-Me-苯基
246	2	SO_2Me	3-Me-苯基	1024	2	SO_2Me	4-Me-苯基
247	3	SO_2Me	3-Me-苯基	1025	3	SO_2Me	4-Me-苯基
248	4	SO_2Me	3-Me-苯基	1026	4	SO_2Me	4-Me-苯基
249	1	SO_2NH_2	3-Me-苯基	1027	1	SO_2NH_2	4-Me-苯基
250	2	SO_2NH_2	3-Me-苯基	1028	2	SO_2NH_2	4-Me-苯基
251	3	SO_2NH_2	3-Me-苯基	1029	3	SO_2NH_2	4-Me-苯基
252	4	SO_2NH_2	3-Me-苯基	1030	4	SO_2NH_2	4-Me-苯基
253	1	H	2-F-苯基	1031	1	H	3-F-苯基
254	2	H	2-F-苯基	1032	2	H	3-F-苯基
255	3	H	2-F-苯基	1033	3	H	3-F-苯基
256	4	H	2-F-苯基	1034	4	H	3-F-苯基

[2894]

257	1	Me	2-F-苯基	1035	1	Me	3-F-苯基
258	2	Me	2-F-苯基	1036	2	Me	3-F-苯基
259	3	Me	2-F-苯基	1037	3	Me	3-F-苯基
260	4	Me	2-F-苯基	1038	4	Me	3-F-苯基
261	1	CH_2Ph	2-F-苯基	1039	1	CH_2Ph	3-F-苯基
262	2	CH_2Ph	2-F-苯基	1040	2	CH_2Ph	3-F-苯基
263	3	CH_2Ph	2-F-苯基	1041	3	CH_2Ph	3-F-苯基
264	4	CH_2Ph	2-F-苯基	1042	4	CH_2Ph	3-F-苯基
265	1	COMe	2-F-苯基	1043	1	COMe	3-F-苯基
266	2	COMe	2-F-苯基	1044	2	COMe	3-F-苯基
267	3	COMe	2-F-苯基	1045	3	COMe	3-F-苯基
268	4	COMe	2-F-苯基	1046	4	COMe	3-F-苯基
269	1	CO_2Me	2-F-苯基	1047	1	CO_2Me	3-F-苯基
270	2	CO_2Me	2-F-苯基	1048	2	CO_2Me	3-F-苯基
271	3	CO_2Me	2-F-苯基	1049	3	CO_2Me	3-F-苯基
272	4	CO_2Me	2-F-苯基	1050	4	CO_2Me	3-F-苯基
273	1	CO_2tBu	2-F-苯基	1051	1	CO_2tBu	3-F-苯基
274	2	CO_2tBu	2-F-苯基	1052	2	CO_2tBu	3-F-苯基
275	3	CO_2tBu	2-F-苯基	1053	3	CO_2tBu	3-F-苯基
276	4	CO_2tBu	2-F-苯基	1054	4	CO_2tBu	3-F-苯基
277	1	CONHMe	2-F-苯基	1055	1	CONHMe	3-F-苯基
278	2	CONHMe	2-F-苯基	1056	2	CONHMe	3-F-苯基
279	3	CONHMe	2-F-苯基	1057	3	CONHMe	3-F-苯基
280	4	CONHMe	2-F-苯基	1058	4	CONHMe	3-F-苯基
281	1	SO_2Me	2-F-苯基	1059	1	SO_2Me	3-F-苯基
282	2	SO_2Me	2-F-苯基	1060	2	SO_2Me	3-F-苯基
283	3	SO_2Me	2-F-苯基	1061	3	SO_2Me	3-F-苯基

[2895]

284	4	SO_2Me	2-F-苯基	1062	4	SO_2Me	3-F-苯基
285	1	SO_2NH_2	2-F-苯基	1063	1	SO_2NH_2	3-F-苯基
286	2	SO_2NH_2	2-F-苯基	1064	2	SO_2NH_2	3-F-苯基
287	3	SO_2NH_2	2-F-苯基	1065	3	SO_2NH_2	3-F-苯基
288	4	SO_2NH_2	2-F-苯基	1066	4	SO_2NH_2	3-F-苯基
289	1	H	4-F-苯基	1067	1	H	2-Cl-苯基
290	2	H	4-F-苯基	1068	2	H	2-Cl-苯基
291	3	H	4-F-苯基	1069	3	H	2-Cl-苯基
292	4	H	4-F-苯基	1070	4	H	2-Cl-苯基
293	1	Me	4-F-苯基	1071	1	Me	2-Cl-苯基
294	2	Me	4-F-苯基	1072	2	Me	2-Cl-苯基
295	3	Me	4-F-苯基	1073	3	Me	2-Cl-苯基
296	4	Me	4-F-苯基	1074	4	Me	2-Cl-苯基
297	1	CH_2Ph	4-F-苯基	1075	1	CH_2Ph	2-Cl-苯基
298	2	CH_2Ph	4-F-苯基	1076	2	CH_2Ph	2-Cl-苯基
299	3	CH_2Ph	4-F-苯基	1077	3	CH_2Ph	2-Cl-苯基
300	4	CH_2Ph	4-F-苯基	1078	4	CH_2Ph	2-Cl-苯基
301	1	COMe	4-F-苯基	1079	1	COMe	2-Cl-苯基
302	2	COMe	4-F-苯基	1080	2	COMe	2-Cl-苯基
303	3	COMe	4-F-苯基	1081	3	COMe	2-Cl-苯基
304	4	COMe	4-F-苯基	1082	4	COMe	2-Cl-苯基
305	1	CO_2Me	4-F-苯基	1083	1	CO_2Me	2-Cl-苯基
306	2	CO_2Me	4-F-苯基	1084	2	CO_2Me	2-Cl-苯基
307	3	CO_2Me	4-F-苯基	1085	3	CO_2Me	2-Cl-苯基
308	4	CO_2Me	4-F-苯基	1086	4	CO_2Me	2-Cl-苯基
309	1	CO_2tBu	4-F-苯基	1087	1	CO_2tBu	2-Cl-苯基
310	2	CO_2tBu	4-F-苯基	1088	2	CO_2tBu	2-Cl-苯基

[2896]

311	3	CO_2tBu	4-F-苯基	1089	3	CO_2tBu	2-Cl-苯基
312	4	CO_2tBu	4-F-苯基	1090	4	CO_2tBu	2-Cl-苯基
313	1	CONHMe	4-F-苯基	1091	1	CONHMe	2-Cl-苯基
314	2	CONHMe	4-F-苯基	1092	2	CONHMe	2-Cl-苯基
315	3	CONHMe	4-F-苯基	1093	3	CONHMe	2-Cl-苯基
316	4	CONHMe	4-F-苯基	1094	4	CONHMe	2-Cl-苯基
317	1	SO_2Me	4-F-苯基	1095	1	SO_2Me	2-Cl-苯基
318	2	SO_2Me	4-F-苯基	1096	2	SO_2Me	2-Cl-苯基
319	3	SO_2Me	4-F-苯基	1097	3	SO_2Me	2-Cl-苯基
320	4	SO_2Me	4-F-苯基	1098	4	SO_2Me	2-Cl-苯基
321	1	SO_2NH_2	4-F-苯基	1099	1	SO_2NH_2	2-Cl-苯基
322	2	SO_2NH_2	4-F-苯基	1100	2	SO_2NH_2	2-Cl-苯基
323	3	SO_2NH_2	4-F-苯基	1101	3	SO_2NH_2	2-Cl-苯基
324	4	SO_2NH_2	4-F-苯基	1102	4	SO_2NH_2	2-Cl-苯基
325	1	H	3-Cl-苯基	1103	1	H	4-Cl-苯基
326	2	H	3-Cl-苯基	1104	2	H	4-Cl-苯基
327	3	H	3-Cl-苯基	1105	3	H	4-Cl-苯基
328	4	H	3-Cl-苯基	1106	4	H	4-Cl-苯基
329	1	Me	3-Cl-苯基	1107	1	Me	4-Cl-苯基
330	2	Me	3-Cl-苯基	1108	2	Me	4-Cl-苯基
331	3	Me	3-Cl-苯基	1109	3	Me	4-Cl-苯基
332	4	Me	3-Cl-苯基	1110	4	Me	4-Cl-苯基
333	1	CH_2Ph	3-Cl-苯基	1111	1	CH_2Ph	4-Cl-苯基
334	2	CH_2Ph	3-Cl-苯基	1112	2	CH_2Ph	4-Cl-苯基
335	3	CH_2Ph	3-Cl-苯基	1113	3	CH_2Ph	4-Cl-苯基
336	4	CH_2Ph	3-Cl-苯基	1114	4	CH_2Ph	4-Cl-苯基
337	1	COMe	3-Cl-苯基	1115	1	COMe	4-Cl-苯基

[2897]

338	2	COMe	3-Cl-苯基	1116	2	COMe	4-Cl-苯基
339	3	COMe	3-Cl-苯基	1117	3	COMe	4-Cl-苯基
340	4	COMe	3-Cl-苯基	1118	4	COMe	4-Cl-苯基
341	1	CO_2Me	3-Cl-苯基	1119	1	CO_2Me	4-Cl-苯基
342	2	CO_2Me	3-Cl-苯基	1120	2	CO_2Me	4-Cl-苯基
343	3	CO_2Me	3-Cl-苯基	1121	3	CO_2Me	4-Cl-苯基
344	4	CO_2Me	3-Cl-苯基	1122	4	CO_2Me	4-Cl-苯基
345	1	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1123	1	CO_2tBu	4-Cl-苯基
346	2	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1124	2	CO_2tBu	4-Cl-苯基
347	3	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1125	3	CO_2tBu	4-Cl-苯基
348	4	CO_2tBu	3-Cl-苯基	1126	4	CO_2tBu	4-Cl-苯基
349	1	CONHMe	3-Cl-苯基	1127	1	CONHMe	4-Cl-苯基
350	2	CONHMe	3-Cl-苯基	1128	2	CONHMe	4-Cl-苯基
351	3	CONHMe	3-Cl-苯基	1129	3	CONHMe	4-Cl-苯基
352	4	CONHMe	3-Cl-苯基	1130	4	CONHMe	4-Cl-苯基
353	1	SO_2Me	3-Cl-苯基	1131	1	SO_2Me	4-Cl-苯基
354	2	SO_2Me	3-Cl-苯基	1132	2	SO_2Me	4-Cl-苯基
355	3	SO_2Me	3-Cl-苯基	1133	3	SO_2Me	4-Cl-苯基
356	4	SO_2Me	3-Cl-苯基	1134	4	SO_2Me	4-Cl-苯基
357	1	SO_2NH_2	3-Cl-苯基	1135	1	SO_2NH_2	4-Cl-苯基
358	2	SO_2NH_2	3-Cl-苯基	1136	2	SO_2NH_2	4-Cl-苯基
359	3	SO_2NH_2	3-Cl-苯基	1137	3	SO_2NH_2	4-Cl-苯基
360	4	SO_2NH_2	3-Cl-苯基	1138	4	SO_2NH_2	4-Cl-苯基
361	1	H	2-Br-苯基	1139	1	H	3-Br-苯基
362	2	H	2-Br-苯基	1140	2	H	3-Br-苯基
363	3	H	2-Br-苯基	1141	3	H	3-Br-苯基
364	4	H	2-Br-苯基	1142	4	H	3-Br-苯基

[2898]

365	1	Me	2-Br-苯基	1143	1	Me	3-Br-苯基
366	2	Me	2-Br-苯基	1144	2	Me	3-Br-苯基
367	3	Me	2-Br-苯基	1145	3	Me	3-Br-苯基
368	4	Me	2-Br-苯基	1146	4	Me	3-Br-苯基
369	1	CH_2Ph	2-Br-苯基	1147	1	CH_2Ph	3-Br-苯基
370	2	CH_2Ph	2-Br-苯基	1148	2	CH_2Ph	3-Br-苯基
371	3	CH_2Ph	2-Br-苯基	1149	3	CH_2Ph	3-Br-苯基
372	4	CH_2Ph	2-Br-苯基	1150	4	CH_2Ph	3-Br-苯基
373	1	COMe	2-Br-苯基	1151	1	COMe	3-Br-苯基
374	2	COMe	2-Br-苯基	1152	2	COMe	3-Br-苯基
375	3	COMe	2-Br-苯基	1153	3	COMe	3-Br-苯基
376	4	COMe	2-Br-苯基	1154	4	COMe	3-Br-苯基
377	1	CO_2Me	2-Br-苯基	1155	1	CO_2Me	3-Br-苯基
378	2	CO_2Me	2-Br-苯基	1156	2	CO_2Me	3-Br-苯基
379	3	CO_2Me	2-Br-苯基	1157	3	CO_2Me	3-Br-苯基
380	4	CO_2Me	2-Br-苯基	1158	4	CO_2Me	3-Br-苯基
381	1	CO_2tBu	2-Br-苯基	1159	1	CO_2tBu	3-Br-苯基
382	2	CO_2tBu	2-Br-苯基	1160	2	CO_2tBu	3-Br-苯基
383	3	CO_2tBu	2-Br-苯基	1161	3	CO_2tBu	3-Br-苯基
384	4	CO_2tBu	2-Br-苯基	1162	4	CO_2tBu	3-Br-苯基
385	1	CONHMe	2-Br-苯基	1163	1	CONHMe	3-Br-苯基
386	2	CONHMe	2-Br-苯基	1164	2	CONHMe	3-Br-苯基
387	3	CONHMe	2-Br-苯基	1165	3	CONHMe	3-Br-苯基
388	4	CONHMe	2-Br-苯基	1166	4	CONHMe	3-Br-苯基
389	1	SO_2Me	2-Br-苯基	1167	1	SO_2Me	3-Br-苯基
390	2	SO_2Me	2-Br-苯基	1168	2	SO_2Me	3-Br-苯基
391	3	SO_2Me	2-Br-苯基	1169	3	SO_2Me	3-Br-苯基

[2899]

392	4	SO_2Me	2-Br-苯基	1170	4	SO_2Me	3-Br-苯基
393	1	SO_2NH_2	2-Br-苯基	1171	1	SO_2NH_2	3-Br-苯基
394	2	SO_2NH_2	2-Br-苯基	1172	2	SO_2NH_2	3-Br-苯基
395	3	SO_2NH_2	2-Br-苯基	1173	3	SO_2NH_2	3-Br-苯基
396	4	SO_2NH_2	2-Br-苯基	1174	4	SO_2NH_2	3-Br-苯基
397	1	H	4-Br-苯基	1175	1	H	2-CF_3-苯基
398	2	H	4-Br-苯基	1176	2	H	2-CF_3-苯基
399	3	H	4-Br-苯基	1177	3	H	2-CF_3-苯基
400	4	H	4-Br-苯基	1178	4	H	2-CF_3-苯基
401	1	Me	4-Br-苯基	1179	1	Me	2-CF_3-苯基
402	2	Me	4-Br-苯基	1180	2	Me	2-CF_3-苯基
403	3	Me	4-Br-苯基	1181	3	Me	2-CF_3-苯基
404	4	Me	4-Br-苯基	1182	4	Me	2-CF_3-苯基
405	1	CH_2Ph	4-Br-苯基	1183	1	CH_2Ph	2-CF_3-苯基
406	2	CH_2Ph	4-Br-苯基	1184	2	CH_2Ph	2-CF_3-苯基
407	3	CH_2Ph	4-Br-苯基	1185	3	CH_2Ph	2-CF_3-苯基
408	4	CH_2Ph	4-Br-苯基	1186	4	CH_2Ph	2-CF_3-苯基
409	1	COMe	4-Br-苯基	1187	1	COMe	2-CF_3-苯基
410	2	COMe	4-Br-苯基	1188	2	COMe	2-CF_3-苯基
411	3	COMe	4-Br-苯基	1189	3	COMe	2-CF_3-苯基
412	4	COMe	4-Br-苯基	1190	4	COMe	2-CF_3-苯基
413	1	CO_2Me	4-Br-苯基	1191	1	CO_2Me	2-CF_3-苯基
414	2	CO_2Me	4-Br-苯基	1192	2	CO_2Me	2-CF_3-苯基
415	3	CO_2Me	4-Br-苯基	1193	3	CO_2Me	2-CF_3-苯基
416	4	CO_2Me	4-Br-苯基	1194	4	CO_2Me	2-CF_3-苯基
417	1	CO_2tBu	4-Br-苯基	1195	1	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
418	2	CO_2tBu	4-Br-苯基	1196	2	CO_2tBu	2-CF_3-苯基

[2900]

419	3	CO_2tBu	4-Br-苯基	1197	3	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
420	4	CO_2tBu	4-Br-苯基	1198	4	CO_2tBu	2-CF_3-苯基
421	1	CONHMe	4-Br-苯基	1199	1	CONHMe	2-CF_3-苯基
422	2	CONHMe	4-Br-苯基	1200	2	CONHMe	2-CF_3-苯基
423	3	CONHMe	4-Br-苯基	1201	3	CONHMe	2-CF_3-苯基
424	4	CONHMe	4-Br-苯基	1202	4	CONHMe	2-CF_3-苯基
425	1	SO_2Me	4-Br-苯基	1203	1	SO_2Me	2-CF_3-苯基
426	2	SO_2Me	4-Br-苯基	1204	2	SO_2Me	2-CF_3-苯基
427	3	SO_2Me	4-Br-苯基	1205	3	SO_2Me	2-CF_3-苯基
428	4	SO_2Me	4-Br-苯基	1206	4	SO_2Me	2-CF_3-苯基
429	1	SO_2NH_2	4-Br-苯基	1207	1	SO_2NH_2	2-CF_3-苯基
430	2	SO_2NH_2	4-Br-苯基	1208	2	SO_2NH_2	2-CF_3-苯基
431	3	SO_2NH_2	4-Br-苯基	1209	3	SO_2NH_2	2-CF_3-苯基
432	4	SO_2NH_2	4-Br-苯基	1210	4	SO_2NH_2	2-CF_3-苯基
433	1	H	3-CF_3-苯基	1211	1	H	4-CF_3-苯基
434	2	H	3-CF_3-苯基	1212	2	H	4-CF_3-苯基
435	3	H	3-CF_3-苯基	1213	3	H	4-CF_3-苯基
436	4	H	3-CF_3-苯基	1214	4	H	4-CF_3-苯基
437	1	Me	3-CF_3-苯基	1215	1	Me	4-CF_3-苯基
438	2	Me	3-CF_3-苯基	1216	2	Me	4-CF_3-苯基
439	3	Me	3-CF_3-苯基	1217	3	Me	4-CF_3-苯基
440	4	Me	3-CF_3-苯基	1218	4	Me	4-CF_3-苯基
441	1	CH_2Ph	3-CF_3-苯基	1219	1	CH_2Ph	4-CF_3-苯基
442	2	CH_2Ph	3-CF_3-苯基	1220	2	CH_2Ph	4-CF_3-苯基
443	3	CH_2Ph	3-CF_3-苯基	1221	3	CH_2Ph	4-CF_3-苯基
444	4	CH_2Ph	3-CF_3-苯基	1222	4	CH_2Ph	4-CF_3-苯基
445	1	COMe	3-CF_3-苯基	1223	1	COMe	4-CF_3-苯基

[2901]

446	2	COMe	3-CF_3-苯基	1224	2	COMe	4-CF_3-苯基
447	3	COMe	3-CF_3-苯基	1225	3	COMe	4-CF_3-苯基
448	4	COMe	3-CF_3-苯基	1226	4	COMe	4-CF_3-苯基
449	1	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1227	1	CO_2Me	4-CF_3-苯基
450	2	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1228	2	CO_2Me	4-CF_3-苯基
451	3	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1229	3	CO_2Me	4-CF_3-苯基
452	4	CO_2Me	3-CF_3-苯基	1230	4	CO_2Me	4-CF_3-苯基
453	1	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1231	1	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
454	2	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1232	2	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
455	3	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1233	3	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
456	4	CO_2tBu	3-CF_3-苯基	1234	4	CO_2tBu	4-CF_3-苯基
457	1	CONHMe	3-CF_3-苯基	1235	1	CONHMe	4-CF_3-苯基
458	2	CONHMe	3-CF_3-苯基	1236	2	CONHMe	4-CF_3-苯基
459	3	CONHMe	3-CF_3-苯基	1237	3	CONHMe	4-CF_3-苯基
460	4	CONHMe	3-CF_3-苯基	1238	4	CONHMe	4-CF_3-苯基
461	1	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1239	1	SO_2Me	4-CF_3-苯基
462	2	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1240	2	SO_2Me	4-CF_3-苯基
463	3	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1241	3	SO_2Me	4-CF_3-苯基
464	4	SO_2Me	3-CF_3-苯基	1242	4	SO_2Me	4-CF_3-苯基
465	1	SO_2NH_2	3-CF_3-苯基	1243	1	SO_2NH_2	4-CF_3-苯基
466	2	SO_2NH_2	3-CF_3-苯基	1244	2	SO_2NH_2	4-CF_3-苯基
467	3	SO_2NH_2	3-CF_3-苯基	1245	3	SO_2NH_2	4-CF_3-苯基
468	4	SO_2NH_2	3-CF_3-苯基	1246	4	SO_2NH_2	4-CF_3-苯基
469	1	H	2-iPr-苯基	1247	1	H	3-iPr-苯基
470	2	H	2-iPr-苯基	1248	2	H	3-iPr-苯基
471	3	H	2-iPr-苯基	1249	3	H	3-iPr-苯基
472	4	H	2-iPr-苯基	1250	4	H	3-iPr-苯基

[2902]

473	1	Me	2-iPr-苯基	1251	1	Me	3-iPr-苯基
474	2	Me	2-iPr-苯基	1252	2	Me	3-iPr-苯基
475	3	Me	2-iPr-苯基	1253	3	Me	3-iPr-苯基
476	4	Me	2-iPr-苯基	1254	4	Me	3-iPr-苯基
477	1	CH_2Ph	2-iPr-苯基	1255	1	CH_2Ph	3-iPr-苯基
478	2	CH_2Ph	2-iPr-苯基	1256	2	CH_2Ph	3-iPr-苯基
479	3	CH_2Ph	2-iPr-苯基	1257	3	CH_2Ph	3-iPr-苯基
480	4	CH_2Ph	2-iPr-苯基	1258	4	CH_2Ph	3-iPr-苯基
481	1	COMe	2-iPr-苯基	1259	1	COMe	3-iPr-苯基
482	2	COMe	2-iPr-苯基	1260	2	COMe	3-iPr-苯基
483	3	COMe	2-iPr-苯基	1261	3	COMe	3-iPr-苯基
484	4	COMe	2-iPr-苯基	1262	4	COMe	3-iPr-苯基
485	1	CO_2Me	2-iPr-苯基	1263	1	CO_2Me	3-iPr-苯基
486	2	CO_2Me	2-iPr-苯基	1264	2	CO_2Me	3-iPr-苯基
487	3	CO_2Me	2-iPr-苯基	1265	3	CO_2Me	3-iPr-苯基
488	4	CO_2Me	2-iPr-苯基	1266	4	CO_2Me	3-iPr-苯基
489	1	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1267	1	CO_2tBu	3-iPr-苯基
490	2	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1268	2	CO_2tBu	3-iPr-苯基
491	3	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1269	3	CO_2tBu	3-iPr-苯基
492	4	CO_2tBu	2-iPr-苯基	1270	4	CO_2tBu	3-iPr-苯基
493	1	CONHMe	2-iPr-苯基	1271	1	CONHMe	3-iPr-苯基
494	2	CONHMe	2-iPr-苯基	1272	2	CONHMe	3-iPr-苯基
495	3	CONHMe	2-iPr-苯基	1273	3	CONHMe	3-iPr-苯基
496	4	CONHMe	2-iPr-苯基	1274	4	CONHMe	3-iPr-苯基
497	1	SO_2Me	2-iPr-苯基	1275	1	SO_2Me	3-iPr-苯基
498	2	SO_2Me	2-iPr-苯基	1276	2	SO_2Me	3-iPr-苯基
499	3	SO_2Me	2-iPr-苯基	1277	3	SO_2Me	3-iPr-苯基

[2903]

500	4	SO_2Me	2-iPr-苯基	1278	4	SO_2Me	3-iPr-苯基
501	1	SO_2NH_2	2-iPr-苯基	1279	1	SO_2NH_2	3-iPr-苯基
502	2	SO_2NH_2	2-iPr-苯基	1280	2	SO_2NH_2	3-iPr-苯基
503	3	SO_2NH_2	2-iPr-苯基	1281	3	SO_2NH_2	3-iPr-苯基
504	4	SO_2NH_2	2-iPr-苯基	1282	4	SO_2NH_2	3-iPr-苯基
505	1	H	4-iPr-苯基	1283	1	H	4-NH_2-苯基
506	2	H	4-iPr-苯基	1284	2	H	4-NH_2-苯基
507	3	H	4-iPr-苯基	1285	3	H	4-NH_2-苯基
508	4	H	4-iPr-苯基	1286	4	H	4-NH_2-苯基
509	1	Me	4-iPr-苯基	1287	1	Me	4-NH_2-苯基
510	2	Me	4-iPr-苯基	1288	2	Me	4-NH_2-苯基
511	3	Me	4-iPr-苯基	1289	3	Me	4-NH_2-苯基
512	4	Me	4-iPr-苯基	1290	4	Me	4-NH_2-苯基
513	1	CH_2Ph	4-iPr-苯基	1291	1	CH_2Ph	4-NH_2-苯基
514	2	CH_2Ph	4-iPr-苯基	1292	2	CH_2Ph	4-NH_2-苯基
515	3	CH_2Ph	4-iPr-苯基	1293	3	CH_2Ph	4-NH_2-苯基
516	4	CH_2Ph	4-iPr-苯基	1294	4	CH_2Ph	4-NH_2-苯基
517	1	COMe	4-iPr-苯基	1295	1	COMe	4-NH_2-苯基
518	2	COMe	4-iPr-苯基	1296	2	COMe	4-NH_2-苯基
519	3	COMe	4-iPr-苯基	1297	3	COMe	4-NH_2-苯基
520	4	COMe	4-iPr-苯基	1298	4	COMe	4-NH_2-苯基
521	1	CO_2Me	4-iPr-苯基	1299	1	CO_2Me	4-NH_2-苯基
522	2	CO_2Me	4-iPr-苯基	1300	2	CO_2Me	4-NH_2-苯基
523	3	CO_2Me	4-iPr-苯基	1301	3	CO_2Me	4-NH_2-苯基
524	4	CO_2Me	4-iPr-苯基	1302	4	CO_2Me	4-NH_2-苯基
525	1	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1303	1	CO_2tBu	4-NH_2-苯基
526	2	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1304	2	CO_2tBu	4-NH_2-苯基

[2904]

527	3	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1305	3	CO_2tBu	4-NH_2-苯基
528	4	CO_2tBu	4-iPr-苯基	1306	4	CO_2tBu	4-NH_2-苯基
529	1	CONHMe	4-iPr-苯基	1307	1	CONHMe	4-NH_2-苯基
530	2	CONHMe	4-iPr-苯基	1308	2	CONHMe	4-NH_2-苯基
531	3	CONHMe	4-iPr-苯基	1309	3	CONHMe	4-NH_2-苯基
532	4	CONHMe	4-iPr-苯基	1310	4	CONHMe	4-NH_2-苯基
533	1	SO_2Me	4-iPr-苯基	1311	1	SO_2Me	4-NH_2-苯基
534	2	SO_2Me	4-iPr-苯基	1312	2	SO_2Me	4-NH_2-苯基
535	3	SO_2Me	4-iPr-苯基	1313	3	SO_2Me	4-NH_2-苯基
536	4	SO_2Me	4-iPr-苯基	1314	4	SO_2Me	4-NH_2-苯基
537	1	SO_2NH_2	4-iPr-苯基	1315	1	SO_2NH_2	4-NH_2-苯基
538	2	SO_2NH_2	4-iPr-苯基	1316	2	SO_2NH_2	4-NH_2-苯基
539	3	SO_2NH_2	4-iPr-苯基	1317	3	SO_2NH_2	4-NH_2-苯基
540	4	SO_2NH_2	4-iPr-苯基	1318	4	SO_2NH_2	4-NH_2-苯基
541	1	H	3-NH_2-苯基	1319	1	H	2-NH_2-苯基
542	2	H	3-NH_2-苯基	1320	2	H	2-NH_2-苯基
543	3	H	3-NH_2-苯基	1321	3	H	2-NH_2-苯基
544	4	H	3-NH_2-苯基	1322	4	H	2-NH_2-苯基
545	1	Me	3-NH_2-苯基	1323	1	Me	2-NH_2-苯基
546	2	Me	3-NH_2-苯基	1324	2	Me	2-NH_2-苯基
547	3	Me	3-NH_2-苯基	1325	3	Me	2-NH_2-苯基
548	4	Me	3-NH_2-苯基	1326	4	Me	2-NH_2-苯基
549	1	CH_2Ph	3-NH_2-苯基	1327	1	CH_2Ph	2-NH_2-苯基
550	2	CH_2Ph	3-NH_2-苯基	1328	2	CH_2Ph	2-NH_2-苯基
551	3	CH_2Ph	3-NH_2-苯基	1329	3	CH_2Ph	2-NH_2-苯基
552	4	CH_2Ph	3-NH_2-苯基	1330	4	CH_2Ph	2-NH_2-苯基
553	1	COMe	3-NH_2-苯基	1331	1	COMe	2-NH_2-苯基

[2905]

554	2	COMe	3-NH_2-苯基	1332	2	COMe	2-NH_2-苯基
555	3	COMe	3-NH_2-苯基	1333	3	COMe	2-NH_2-苯基
556	4	COMe	3-NH_2-苯基	1334	4	COMe	2-NH_2-苯基
557	1	CO_2Me	3-NH_2-苯基	1335	1	CO_2Me	2-NH_2-苯基
558	2	CO_2Me	3-NH_2-苯基	1336	2	CO_2Me	2-NH_2-苯基
559	3	CO_2Me	3-NH_2-苯基	1337	3	CO_2Me	2-NH_2-苯基
560	4	CO_2Me	3-NH_2-苯基	1338	4	CO_2Me	2-NH_2-苯基
561	1	CO_2tBu	3-NH_2-苯基	1339	1	CO_2tBu	2-NH_2-苯基
562	2	CO_2tBu	3-NH_2-苯基	1340	2	CO_2tBu	2-NH_2-苯基
563	3	CO_2tBu	3-NH_2-苯基	1341	3	CO_2tBu	2-NH_2-苯基
564	4	CO_2tBu	3-NH_2-苯基	1342	4	CO_2tBu	2-NH_2-苯基
565	1	CONHMe	3-NH_2-苯基	1343	1	CONHMe	2-NH_2-苯基
566	2	CONHMe	3-NH_2-苯基	1344	2	CONHMe	2-NH_2-苯基
567	3	CONHMe	3-NH_2-苯基	1345	3	CONHMe	2-NH_2-苯基
568	4	CONHMe	3-NH_2-苯基	1346	4	CONHMe	2-NH_2-苯基
569	1	SO_2Me	3-NH_2-苯基	1347	1	SO_2Me	2-NH_2-苯基
570	2	SO_2Me	3-NH_2-苯基	1348	2	SO_2Me	2-NH_2-苯基
571	3	SO_2Me	3-NH_2-苯基	1349	3	SO_2Me	2-NH_2-苯基
572	4	SO_2Me	3-NH_2-苯基	1350	4	SO_2Me	2-NH_2-苯基
573	1	SO_2NH_2	3-NH_2-苯基	1351	1	SO_2NH_2	2-NH_2-苯基
574	2	SO_2NH_2	3-NH_2-苯基	1352	2	SO_2NH_2	2-NH_2-苯基
575	3	SO_2NH_2	3-NH_2-苯基	1353	3	SO_2NH_2	2-NH_2-苯基
576	4	SO_2NH_2	3-NH_2-苯基	1354	4	SO_2NH_2	2-NH_2-苯基
577	1	H	2,4-二-Me-苯基	1355	1	H	2,6-二-Me-苯基
578	2	H	2,4-二-Me-苯基	1356	2	H	2,6-二-Me-苯基
579	3	H	2,4-二-Me-苯基	1357	3	H	2,6-二-Me-苯基
580	4	H	2,4-二-Me-苯基	1358	4	H	2,6-二-Me-苯基

[2906]

581	1	Me	2,4-二-Me-苯基	1359	1	Me	2,6-二-Me-苯基
582	2	Me	2,4-二-Me-苯基	1360	2	Me	2,6-二-Me-苯基
583	3	Me	2,4-二-Me-苯基	1361	3	Me	2,6-二-Me-苯基
584	4	Me	2,4-二-Me-苯基	1362	4	Me	2,6-二-Me-苯基
585	1	CH_2Ph	2,4-二-Me-苯基	1363	1	CH_2Ph	2,6-二-Me-苯基
586	2	CH_2Ph	2,4-二-Me-苯基	1364	2	CH_2Ph	2,6-二-Me-苯基
587	3	CH_2Ph	2,4-二-Me-苯基	1365	3	CH_2Ph	2,6-二-Me-苯基
588	4	CH_2Ph	2,4-二-Me-苯基	1366	4	CH_2Ph	2,6-二-Me-苯基
589	1	COMe	2,4-二-Me-苯基	1367	1	COMe	2,6-二-Me-苯基
590	2	COMe	2,4-二-Me-苯基	1368	2	COMe	2,6-二-Me-苯基
591	3	COMe	2,4-二-Me-苯基	1369	3	COMe	2,6-二-Me-苯基
592	4	COMe	2,4-二-Me-苯基	1370	4	COMe	2,6-二-Me-苯基
593	1	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1371	1	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
594	2	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1372	2	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
595	3	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1373	3	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
596	4	CO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1374	4	CO_2Me	2,6-二-Me-苯基
597	1	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1375	1	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
598	2	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1376	2	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
599	3	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1377	3	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
600	4	CO_2tBu	2,4-二-Me-苯基	1378	4	CO_2tBu	2,6-二-Me-苯基
601	1	CONHMe	2,4-二-Me-苯基	1379	1	CONHMe	2,6-二-Me-苯基
602	2	CONHMe	2,4-二-Me-苯基	1380	2	CONHMe	2,6-二-Me-苯基
603	3	CONHMe	2,4-二-Me-苯基	1381	3	CONHMe	2,6-二-Me-苯基
604	4	CONHMe	2,4-二-Me-苯基	1382	4	CONHMe	2,6-二-Me-苯基
605	1	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1383	1	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基
606	2	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1384	2	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基
607	3	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1385	3	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基

[2907]

608	4	SO_2Me	2,4-二-Me-苯基	1386	4	SO_2Me	2,6-二-Me-苯基
609	1	SO_2NH_2	2,4-二-Me-苯基	1387	1	SO_2NH_2	2,6-二-Me-苯基
610	2	SO_2NH_2	2,4-二-Me-苯基	1388	2	SO_2NH_2	2,6-二-Me-苯基
611	3	SO_2NH_2	2,4-二-Me-苯基	1389	3	SO_2NH_2	2,6-二-Me-苯基
612	4	SO_2NH_2	2,4-二-Me-苯基	1390	4	SO_2NH_2	2,6-二-Me-苯基
613	1	H	2,6-二-iPr-苯基	1391	1	H	2-Ph-苯基
614	2	H	2,6-二-iPr-苯基	1392	2	H	2-Ph-苯基
615	3	H	2,6-二-iPr-苯基	1393	3	H	2-Ph-苯基
616	4	H	2,6-二-iPr-苯基	1394	4	H	2-Ph-苯基
617	1	Me	2,6-二-iPr-苯基	1395	1	Me	2-Ph-苯基
618	2	Me	2,6-二-iPr-苯基	1396	2	Me	2-Ph-苯基
619	3	Me	2,6-二-iPr-苯基	1397	3	Me	2-Ph-苯基
620	4	Me	2,6-二-iPr-苯基	1398	4	Me	2-Ph-苯基
621	1	CH_2Ph	2,6-二-iPr-苯基	1399	1	CH_2Ph	2-Ph-苯基
622	2	CH_2Ph	2,6-二-iPr-苯基	1400	2	CH_2Ph	2-Ph-苯基
623	3	CH_2Ph	2,6-二-iPr-苯基	1401	3	CH_2Ph	2-Ph-苯基
624	3	CH_2Ph	2,6-二-iPr-苯基	1402	4	CH_2Ph	2-Ph-苯基
625	1	COMe	2,6-二-iPr-苯基	1403	1	COMe	2-Ph-苯基
626	2	COMe	2,6-二-iPr-苯基	1404	2	COMe	2-Ph-苯基
627	3	COMe	2,6-二-iPr-苯基	1405	3	COMe	2-Ph-苯基
628	4	COMe	2,6-二-iPr-苯基	1406	4	COMe	2-Ph-苯基
629	1	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1407	1	CO_2Me	2-Ph-苯基
630	2	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1408	2	CO_2Me	2-Ph-苯基
631	3	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1409	3	CO_2Me	2-Ph-苯基
632	4	CO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1410	4	CO_2Me	2-Ph-苯基
633	1	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基	1411	1	CO_2tBu	2-Ph-苯基
634	2	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基	1412	2	CO_2tBu	2-Ph-苯基

[2908]

635	3	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基	1413	3	CO_2tBu	2-Ph-苯基
636	4	CO_2tBu	2,6-二-iPr-苯基	1414	4	CO_2tBu	2-Ph-苯基
637	1	CONHMe	2,6-二-iPr-苯基	1415	1	CONHMe	2-Ph-苯基
638	2	CONHMe	2,6-二-iPr-苯基	1416	2	CONHMe	2-Ph-苯基
639	3	CONHMe	2,6-二-iPr-苯基	1417	3	CONHMe	2-Ph-苯基
640	4	CONHMe	2,6-二-iPr-苯基	1418	4	CONHMe	2-Ph-苯基
641	1	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1419	1	SO_2Me	2-Ph-苯基
642	2	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1420	2	SO_2Me	2-Ph-苯基
643	3	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1421	3	SO_2Me	2-Ph-苯基
644	4	SO_2Me	2,6-二-iPr-苯基	1422	4	SO_2Me	2-Ph-苯基
645	1	SO_2NH_2	2,6-二-iPr-苯基	1423	1	SO_2NH_2	2-Ph-苯基
646	2	SO_2NH_2	2,6-二-iPr-苯基	1424	2	SO_2NH_2	2-Ph-苯基
647	3	SO_2NH_2	2,6-二-iPr-苯基	1425	3	SO_2NH_2	2-Ph-苯基
648	4	SO_2NH_2	2,6-二-iPr-苯基	1426	4	SO_2NH_2	2-Ph-苯基
649	1	H	3-Ph-苯基	1427	1	H	4-Ph-苯基
650	2	H	3-Ph-苯基	1428	2	H	4-Ph-苯基
651	3	H	3-Ph-苯基	1429	3	H	4-Ph-苯基
652	4	H	3-Ph-苯基	1430	4	H	4-Ph-苯基
653	1	Me	3-Ph-苯基	1431	1	Me	4-Ph-苯基
654	2	Me	3-Ph-苯基	1432	2	Me	4-Ph-苯基
655	3	Me	3-Ph-苯基	1433	3	Me	4-Ph-苯基
656	4	Me	3-Ph-苯基	1434	4	Me	4-Ph-苯基
657	1	CH_2Ph	3-Ph-苯基	1435	1	CH_2Ph	4-Ph-苯基
658	2	CH_2Ph	3-Ph-苯基	1436	2	CH_2Ph	4-Ph-苯基
659	3	CH_2Ph	3-Ph-苯基	1437	3	CH_2Ph	4-Ph-苯基
660	4	CH_2Ph	3-Ph-苯基	1438	4	CH_2Ph	4-Ph-苯基
661	1	COMe	3-Ph-苯基	1439	1	COMe	4-Ph-苯基

[2909]

662	2	COMe	3-Ph-苯基	1440	2	COMe	4-Ph-苯基
663	3	COMe	3-Ph-苯基	1441	3	COMe	4-Ph-苯基
664	4	COMe	3-Ph-苯基	1442	4	COMe	4-Ph-苯基
665	1	CO_2Me	3-Ph-苯基	1443	1	CO_2Me	4-Ph-苯基
666	2	CO_2Me	3-Ph-苯基	1444	2	CO_2Me	4-Ph-苯基
667	3	CO_2Me	3-Ph-苯基	1445	3	CO_2Me	4-Ph-苯基
668	4	CO_2Me	3-Ph-苯基	1446	4	CO_2Me	4-Ph-苯基
669	1	CO_2tBu	3-Ph-苯基	1447	1	CO_2tBu	4-Ph-苯基
670	2	CO_2tBu	3-Ph-苯基	1448	2	CO_2tBu	4-Ph-苯基
671	3	CO_2tBu	3-Ph-苯基	1449	3	CO_2tBu	4-Ph-苯基
672	4	CO_2tBu	3-Ph-苯基	1450	4	CO_2tBu	4-Ph-苯基
673	1	CONHMe	3-Ph-苯基	1451	1	CONHMe	4-Ph-苯基
674	2	CONHMe	3-Ph-苯基	1452	2	CONHMe	4-Ph-苯基
675	3	CONHMe	3-Ph-苯基	1453	3	CONHMe	4-Ph-苯基
676	4	CONHMe	3-Ph-苯基	1454	4	CONHMe	4-Ph-苯基
677	1	SO_2Me	3-Ph-苯基	1455	1	SO_2Me	4-Ph-苯基
678	2	SO_2Me	3-Ph-苯基	1456	2	SO_2Me	4-Ph-苯基
679	3	SO_2Me	3-Ph-苯基	1457	3	SO_2Me	4-Ph-苯基
680	4	SO_2Me	3-Ph-苯基	1458	4	SO_2Me	4-Ph-苯基
681	1	SO_2NH_2	3-Ph-苯基	1459	1	SO_2NH_2	4-Ph-苯基
682	2	SO_2NH_2	3-Ph-苯基	1460	2	SO_2NH_2	4-Ph-苯基
683	3	SO_2NH_2	3-Ph-苯基	1461	3	SO_2NH_2	4-Ph-苯基
684	4	SO_2NH_2	3-Ph-苯基	1462	4	SO_2NH_2	4-Ph-苯基
685	1	H	2-吗啉代-苯基	1463	1	H	3-吗啉代-苯基
686	2	H	2-吗啉代-苯基	1464	2	H	3-吗啉代-苯基
687	3	H	2-吗啉代-苯基	1465	3	H	3-吗啉代-苯基
688	4	H	2-吗啉代-苯基	1466	4	H	3-吗啉代-苯基

[2910]

689	1	Me	2-吗啉代-苯基	1467	1	Me	3-吗啉代-苯基
690	2	Me	2-吗啉代-苯基	1468	2	Me	3-吗啉代-苯基
691	3	Me	2-吗啉代-苯基	1469	3	Me	3-吗啉代-苯基
692	4	Me	2-吗啉代-苯基	1470	4	Me	3-吗啉代-苯基
693	1	CH_2Ph	2-吗啉代-苯基	1471	1	CH_2Ph	3-吗啉代-苯基
694	2	CH_2Ph	2-吗啉代-苯基	1472	2	CH_2Ph	3-吗啉代-苯基
695	3	CH_2Ph	2-吗啉代-苯基	1473	3	CH_2Ph	3-吗啉代-苯基
696	4	CH_2Ph	2-吗啉代-苯基	1474	4	CH_2Ph	3-吗啉代-苯基
697	1	COMe	2-吗啉代-苯基	1475	1	COMe	3-吗啉代-苯基
698	2	COMe	2-吗啉代-苯基	1476	2	COMe	3-吗啉代-苯基
699	3	COMe	2-吗啉代-苯基	1477	3	COMe	3-吗啉代-苯基
700	4	COMe	2-吗啉代-苯基	1478	4	COMe	3-吗啉代-苯基
701	1	CO_2Me	2-吗啉代-苯基	1479	1	CO_2Me	3-吗啉代-苯基
702	2	CO_2Me	2-吗啉代-苯基	1480	2	CO_2Me	3-吗啉代-苯基
703	3	CO_2Me	2-吗啉代-苯基	1481	3	CO_2Me	3-吗啉代-苯基
704	4	CO_2Me	2-吗啉代-苯基	1482	4	CO_2Me	3-吗啉代-苯基
705	1	CO_2tBu	2-吗啉代-苯基	1483	1	CO_2tBu	3-吗啉代-苯基
706	2	CO_2tBu	2-吗啉代-苯基	1484	2	CO_2tBu	3-吗啉代-苯基
707	3	CO_2tBu	2-吗啉代-苯基	1485	3	CO_2tBu	3-吗啉代-苯基
708	4	CO_2tBu	2-吗啉代-苯基	1486	4	CO_2tBu	3-吗啉代-苯基
709	1	CONHMe	2-吗啉代-苯基	1487	1	CONHMe	3-吗啉代-苯基
710	2	CONHMe	2-吗啉代-苯基	1488	2	CONHMe	3-吗啉代-苯基
711	3	CONHMe	2-吗啉代-苯基	1489	3	CONHMe	3-吗啉代-苯基
712	4	CONHMe	2-吗啉代-苯基	1490	4	CONHMe	3-吗啉代-苯基
713	1	SO_2Me	2-吗啉代-苯基	1491	1	SO_2Me	3-吗啉代-苯基
714	2	SO_2Me	2-吗啉代-苯基	1492	2	SO_2Me	3-吗啉代-苯基
715	3	SO_2Me	2-吗啉代-苯基	1493	3	SO_2Me	3-吗啉代-苯基

[2911]

716	4	SO_2Me	2-吗啉代-苯基	1494	4	SO_2Me	3-吗啉代-苯基
717	1	SO_2NH_2	2-吗啉代-苯基	1495	1	SO_2NH_2	3-吗啉代-苯基
718	2	SO_2NH_2	2-吗啉代-苯基	1496	2	SO_2NH_2	3-吗啉代-苯基
719	3	SO_2NH_2	2-吗啉代-苯基	1497	3	SO_2NH_2	3-吗啉代-苯基
720	4	SO_2NH_2	2-吗啉代-苯基	1498	4	**SO_2NH_2**	3-吗啉代-苯基
721	1	H	4-吗啉代-苯基	1499	1	Me	4-吗啉代-苯基
722	2	H	4-吗啉代-苯基	1500	2	Me	4-吗啉代-苯基
723	3	H	4-吗啉代-苯基	1501	3	Me	4-吗啉代-苯基
724	4	H	4-吗啉代-苯基	1502	4	Me	4-吗啉代-苯基
725	1	CH_2Ph	4-吗啉代-苯基	103	1	COMe	4-吗啉代-苯基
726	2	CH_2Ph	4-吗啉代-苯基	1504	2	COMe	4-吗啉代-苯基
727	3	CH_2Ph	4-吗啉代-苯基	1505	3	COMe	4-吗啉代-苯基
728	4	CH_2Ph	4-吗啉代-苯基	1506	4	COMe	4-吗啉代-苯基
729	1	CO_2Me	4-吗啉代-苯基	1507	1	CO_2tBu	4-吗啉代-苯基
730	2	CO_2Me	4-吗啉代-苯基	1508	2	CO_2tBu	4-吗啉代-苯基
731	3	CO_2Me	4-吗啉代-苯基	1509	3	CO_2tBu	4-吗啉代-苯基
732	4	CO_2Me	4-吗啉代-苯基	1510	4	CO_2tBu	4-吗啉代-苯基
733	1	CONHMe	4-吗啉代-苯基	1511	1	SO_2Me	4-吗啉代-苯基
734	2	CONHMe	4-吗啉代-苯基	1512	2	SO_2Me	4-吗啉代-苯基
735	3	CONHMe	4-吗啉代-苯基	1513	3	SO_2Me	4-吗啉代-苯基
736	4	CONHMe	4-吗啉代-苯基	1514	4	SO_2Me	4-吗啉代-苯基
737	1	SO_2NH_2	4-吗啉代-苯基	1516	1	H	亚萘-2-基
738	2	SO_2NH_2	4-吗啉代-苯基	1517	2	H	亚萘-2-基
739	3	SO_2NH_2	4-吗啉代-苯基	1518	3	H	亚萘-2-基
740	1	H	亚萘-1-基	1519	4	H	亚萘-2-基
741	2	H	亚萘-1-基	1520	1	Me	亚萘-2-基
742	3	H	亚萘-1-基	1521	2	Me	亚萘-2-基

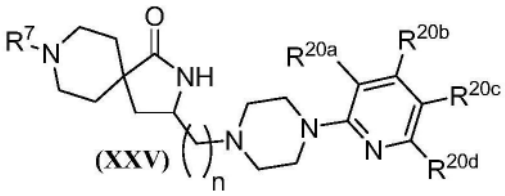
[2912]

743	4	H	亚萘-1-基	1522	3	Me	亚萘-2-基
744	1	Me	亚萘-1-基	1523	4	Me	亚萘-2-基
745	2	Me	亚萘-1-基	1524	1	CH_2Ph	亚萘-2-基
746	3	Me	亚萘-1-基	1525	2	CH_2Ph	亚萘-2-基
747	4	Me	亚萘-1-基	1526	3	CH_2Ph	亚萘-2-基
748	1	CH_2Ph	亚萘-1-基	1527	4	CH_2Ph	亚萘-2-基
749	2	CH_2Ph	亚萘-1-基	1528	1	COMe	亚萘-2-基
750	3	CH_2Ph	亚萘-1-基	1529	2	COMe	亚萘-2-基
751	4	CH_2Ph	亚萘-1-基	1530	3	COMe	亚萘-2-基
752	1	COMe	亚萘-1-基	1531	4	COMe	亚萘-2-基
753	2	COMe	亚萘-1-基	1532	1	CO_2Me	亚萘-2-基
754	3	COMe	亚萘-1-基	1533	2	CO_2Me	亚萘-2-基
755	4	COMe	亚萘-1-基	1534	3	CO_2Me	亚萘-2-基
756	1	CO_2Me	亚萘-1-基	1535	4	CO_2Me	亚萘-2-基
757	2	CO_2Me	亚萘-1-基	1536	1	CO_2tBu	亚萘-2-基
758	3	CO_2Me	亚萘-1-基	1537	2	CO_2tBu	亚萘-2-基
759	4	CO_2Me	亚萘-1-基	1538	3	CO_2tBu	亚萘-2-基
760	1	CO_2tBu	亚萘-1-基	1539	4	CO_2tBu	亚萘-2-基
761	2	CO_2tBu	亚萘-1-基	1540	1	CONHMe	亚萘-2-基
762	3	CO_2tBu	亚萘-1-基	1541	2	CONHMe	亚萘-2-基
763	4	CO_2tBu	亚萘-1-基	1542	3	CONHMe	亚萘-2-基
764	1	CONHMe	亚萘-1-基	1543	4	CONHMe	亚萘-2-基
765	2	CONHMe	亚萘-1-基	1544	1	SO_2Me	亚萘-2-基
767	3	CONHMe	亚萘-1-基	1545	2	SO_2Me	亚萘-2-基
768	4	CONHMe	亚萘-1-基	1546	3	SO_2Me	亚萘-2-基
769	1	SO_2Me	亚萘-1-基	1547	4	SO_2Me	亚萘-2-基
770	2	SO_2Me	亚萘-1-基	1548	1	SO_2NH_2	亚萘-2-基

[2913]

771	3	SO_2Me	亚萘-1-基	1549	2	SO_2NH_2	亚萘-2-基
772	4	SO_2Me	亚萘-1-基	1550	3	SO_2NH_2	亚萘-2-基
773	1	SO_2NH_2	亚萘-1-基	1551	4	SO_2NH_2	亚萘-2-基
774	2	SO_2NH_2	亚萘-1-基				
775	3	SO_2NH_2	亚萘-1-基				
778	4	SO_2NH_2	亚萘-1-基				

[2914] 示例性实施方案包括具有式(XXV)的化合物

[2915] 

[2916] 或其可药用盐形式,如在下文表19中所定义。

[2917] 表19:

[2918]

条目	n	R^7	R^{20a}	R^{20b}	R^{20c}	R^{20d}
1	1	H	H	H	H	H
2	2	H	H	H	H	H
3	3	H	H	H	H	H
4	4	H	H	H	H	H
5	1	Me	H	H	H	H
6	2	Me	H	H	H	H
7	3	Me	H	H	H	H
8	4	Me	H	H	H	H
9	1	CH_2Ph	H	H	H	H
10	2	CH_2Ph	H	H	H	H
11	3	CH_2Ph	H	H	H	H
12	4	CH_2Ph	H	H	H	H
13	1	COMe	H	H	H	H
14	2	COMe	H	H	H	H
15	3	COMe	H	H	H	H
16	4	COMe	H	H	H	H

[2919]

17	1	CO_2Me	H	H	H	H
18	2	CO_2Me	H	H	H	H
19	3	CO_2Me	H	H	H	H
20	4	CO_2Me	H	H	H	H
21	1	CO_2tBu	H	H	H	H
22	2	CO_2tBu	H	H	H	H
23	3	CO_2tBu	H	H	H	H
24	4	CO_2tBu	H	H	H	H
25	1	CONHMe	H	H	H	H
26	2	CONHMe	H	H	H	H
27	3	CONHMe	H	H	H	H
28	4	CONHMe	H	H	H	H
29	1	SO_2Me	H	H	H	H
30	2	SO_2Me	H	H	H	H
31	3	SO_2Me	H	H	H	H
32	4	SO_2Me	H	H	H	H
33	1	SO_2NH_2	H	H	H	H
34	2	SO_2NH_2	H	H	H	H
35	3	SO_2NH_2	H	H	H	H
36	4	SO_2NH_2	H	H	H	H
37	1	H	H	H	OH	H
38	2	H	H	H	OH	H
39	3	H	H	H	OH	H
40	4	H	H	H	OH	H
41	1	Me	H	H	OH	H
42	2	Me	H	H	OH	H
43	3	Me	H	H	OH	H
44	4	Me	H	H	OH	H
45	1	CH_2Ph	H	H	OH	H
46	2	CH_2Ph	H	H	OH	H

[2920]

47	3	CH_2Ph	H	H	OH	H
48	4	CH_2Ph	H	H	OH	H
49	1	COMe	H	H	OH	H
50	2	COMe	H	H	OH	H
51	3	COMe	H	H	OH	H
52	4	COMe	H	H	OH	H
53	1	CO_2Me	H	H	OH	H
54	2	CO_2Me	H	H	OH	H
55	3	CO_2Me	H	H	OH	H
56	4	CO_2Me	H	H	OH	H
57	1	CO_2tBu	H	H	OH	H
58	2	CO_2tBu	H	H	OH	H
59	3	CO_2tBu	H	H	OH	H
60	4	CO_2tBu	H	H	OH	H
61	1	CONHMe	H	H	OH	H
62	2	CONHMe	H	H	OH	H
63	3	CONHMe	H	H	OH	H
64	4	CONHMe	H	H	OH	H
65	1	SO_2Me	H	H	OH	H
66	2	SO_2Me	H	H	OH	H
67	3	SO_2Me	H	H	OH	H
68	4	SO_2Me	H	H	OH	H
69	1	SO_2NH_2	H	H	OH	H
70	2	SO_2NH_2	H	H	OH	H
71	3	SO_2NH_2	H	H	OH	H
72	4	SO_2NH_2	H	H	OH	H
73	1	H	H	H	OMe	H
74	2	H	H	H	OMe	H
75	3	H	H	H	OMe	H
76	4	H	H	H	OMe	H

[2921]

77	1	Me	H	H	OMe	H
78	2	Me	H	H	OMe	H
79	3	Me	H	H	OMe	H
80	4	Me	H	H	OMe	H
81	1	CH_2Ph	H	H	OMe	H
82	2	CH_2Ph	H	H	OMe	H
83	3	CH_2Ph	H	H	OMe	H
84	4	CH_2Ph	H	H	OMe	H
85	1	COMe	H	H	OMe	H
86	2	COMe	H	H	OMe	H
87	3	COMe	H	H	OMe	H
88	4	COMe	H	H	OMe	H
89	1	CO_2Me	H	H	OMe	H
90	2	CO_2Me	H	H	OMe	H
91	3	CO_2Me	H	H	OMe	H
92	4	CO_2Me	H	H	OMe	H
93	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
94	2	CO_2tBu	H	H	OMe	H
95	3	CO_2tBu	H	H	OMe	H
96	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
97	1	CONHMe	H	H	OMe	H
98	2	CONHMe	H	H	OMe	H
99	3	CONHMe	H	H	OMe	H
100	4	CONHMe	H	H	OMe	H
101	1	SO_2Me	H	H	OMe	H
102	2	SO_2Me	H	H	OMe	H
103	3	SO_2Me	H	H	OMe	H
104	4	SO_2Me	H	H	OMe	H
105	1	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
106	2	SO_2NH_2	H	H	OMe	H

[2922]

107	3	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
108	4	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
109	1	H	H	H	Me	H
110	2	H	H	H	Me	H
111	3	H	H	H	Me	H
112	4	H	H	H	Me	H
113	1	Me	H	H	Me	H
114	2	Me	H	H	Me	H
115	3	Me	H	H	Me	H
116	4	Me	H	H	Me	H
117	1	CH_2Ph	H	H	Me	H
118	2	CH_2Ph	H	H	Me	H
119	3	CH_2Ph	H	H	Me	H
120	4	CH_2Ph	H	H	Me	H
121	1	COMe	H	H	Me	H
122	2	COMe	H	H	Me	H
123	3	COMe	H	H	Me	H
124	4	COMe	H	H	Me	H
125	1	CO_2Me	H	H	Me	H
126	2	CO_2Me	H	H	Me	H
127	3	CO_2Me	H	H	Me	H
128	4	CO_2Me	H	H	Me	H
129	1	CO_2tBu	H	H	Me	H
130	2	CO_2tBu	H	H	Me	H
131	3	CO_2tBu	H	H	Me	H
132	4	CO_2tBu	H	H	Me	H
133	1	CONHMe	H	H	Me	H
134	2	CONHMe	H	H	Me	H
135	3	CONHMe	H	H	Me	H
136	4	CONHMe	H	H	Me	H

[2923]

137	1	SO_2Me	H	H	Me	H
138	2	SO_2Me	H	H	Me	H
139	3	SO_2Me	H	H	Me	H
140	4	SO_2Me	H	H	Me	H
141	1	SO_2NH_2	H	H	Me	H
142	2	SO_2NH_2	H	H	Me	H
143	3	SO_2NH_2	H	H	Me	H
144	4	SO_2NH_2	H	H	Me	H
145	1	H	H	H	CF_3	H
146	2	H	H	H	CF_3	H
147	3	H	H	H	CF_3	H
148	4	H	H	H	CF_3	H
149	1	Me	H	H	CF_3	H
150	2	Me	H	H	CF_3	H
151	3	Me	H	H	CF_3	H
152	4	Me	H	H	CF_3	H
153	1	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
154	2	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
155	3	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
156	4	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
157	1	COMe	H	H	CF_3	H
158	2	COMe	H	H	CF_3	H
159	3	COMe	H	H	CF_3	H
160	4	COMe	H	H	CF_3	H
161	1	CO_2Me	H	H	CF_3	H
162	2	CO_2Me	H	H	CF_3	H
163	3	CO_2Me	H	H	CF_3	H
164	4	CO_2Me	H	H	CF_3	H
165	1	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
166	2	CO_2tBu	H	H	CF_3	H

[2924]

167	3	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
168	4	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
169	1	CONHMe	H	H	CF_3	H
170	2	CONHMe	H	H	CF_3	H
171	3	CONHMe	H	H	CF_3	H
172	4	CONHMe	H	H	CF_3	H
173	1	SO_2Me	H	H	CF_3	H
174	2	SO_2Me	H	H	CF_3	H
175	3	SO_2Me	H	H	CF_3	H
176	4	SO_2Me	H	H	CF_3	H
177	1	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
178	2	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
179	3	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
180	4	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
181	1	H	H	H	F	H
182	2	H	H	H	F	H
183	3	H	H	H	F	H
184	4	H	H	H	F	H
185	1	Me	H	H	F	H
186	2	Me	H	H	F	H
187	3	Me	H	H	F	H
188	4	Me	H	H	F	H
189	1	CH_2Ph	H	H	F	H
190	2	CH_2Ph	H	H	F	H
191	3	CH_2Ph	H	H	F	H
192	4	CH_2Ph	H	H	F	H
193	1	COMe	H	H	F	H
194	2	COMe	H	H	F	H
195	3	COMe	H	H	F	H
196	4	COMe	H	H	F	H

[2925]

197	1	CO_2Me	H	H	F	H
198	2	CO_2Me	H	H	F	H
199	3	CO_2Me	H	H	F	H
200	4	CO_2Me	H	H	F	H
201	1	CO_2tBu	H	H	F	H
202	2	CO_2tBu	H	H	F	H
203	3	CO_2tBu	H	H	F	H
204	4	CO_2tBu	H	H	F	H
205	1	CONHMe	H	H	F	H
206	2	CONHMe	H	H	F	H
207	3	CONHMe	H	H	F	H
208	4	CONHMe	H	H	F	H
209	1	SO_2Me	H	H	F	H
210	2	SO_2Me	H	H	F	H
211	3	SO_2Me	H	H	F	H
212	4	SO_2Me	H	H	F	H
213	1	SO_2NH_2	H	H	F	H
214	2	SO_2NH_2	H	H	F	H
215	3	SO_2NH_2	H	H	F	H
216	4	SO_2NH_2	H	H	F	H
217	1	H	H	H	Cl	H
218	2	H	H	H	Cl	H
219	3	H	H	H	Cl	H
220	4	H	H	H	Cl	H
221	1	Me	H	H	Cl	H
222	2	Me	H	H	Cl	H
223	3	Me	H	H	Cl	H
224	4	Me	H	H	Cl	H
225	1	CH_2Ph	H	H	Cl	H
226	2	CH_2Ph	H	H	Cl	H

[2926]

227	3	CH_2Ph	H	H	Cl	H
228	4	CH_2Ph	H	H	Cl	H
229	1	COMe	H	H	Cl	H
230	2	COMe	H	H	Cl	H
231	3	COMe	H	H	Cl	H
232	4	COMe	H	H	Cl	H
233	1	CO_2Me	H	H	Cl	H
234	2	CO_2Me	H	H	Cl	H
235	3	CO_2Me	H	H	Cl	H
236	4	CO_2Me	H	H	Cl	H
237	1	CO_2tBu	H	H	Cl	H
238	2	CO_2tBu	H	H	Cl	H
239	3	CO_2tBu	H	H	Cl	H
240	4	CO_2tBu	H	H	Cl	H
241	1	CONHMe	H	H	Cl	H
242	2	CONHMe	H	H	Cl	H
243	3	CONHMe	H	H	Cl	H
244	4	CONHMe	H	H	Cl	H
245	1	SO_2Me	H	H	Cl	H
246	2	SO_2Me	H	H	Cl	H
247	3	SO_2Me	H	H	Cl	H
248	4	SO_2Me	H	H	Cl	H
249	1	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
250	2	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
251	3	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
252	4	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
253	1	H	H	H	CN	H
254	2	H	H	H	CN	H
255	3	H	H	H	CN	H
256	4	H	H	H	CN	H

[2927]

257	1	Me	H	H	CN	H
258	2	Me	H	H	CN	H
259	3	Me	H	H	CN	H
260	4	Me	H	H	CN	H
261	1	CH_2Ph	H	H	CN	H
262	2	CH_2Ph	H	H	CN	H
263	3	CH_2Ph	H	H	CN	H
264	4	CH_2Ph	H	H	CN	H
265	1	COMe	H	H	CN	H
266	2	COMe	H	H	CN	H
267	3	COMe	H	H	CN	H
268	4	COMe	H	H	CN	H
269	1	CO_2Me	H	H	CN	H
270	2	CO_2Me	H	H	CN	H
271	3	CO_2Me	H	H	CN	H
272	4	CO_2Me	H	H	CN	H
273	1	CO_2tBu	H	H	CN	H
274	2	CO_2tBu	H	H	CN	H
275	3	CO_2tBu	H	H	CN	H
276	4	CO_2tBu	H	H	CN	H
277	1	CONHMe	H	H	CN	H
278	2	CONHMe	H	H	CN	H
279	3	CONHMe	H	H	CN	H
280	4	CONHMe	H	H	CN	H
281	1	SO_2Me	H	H	CN	H
282	2	SO_2Me	H	H	CN	H
283	3	SO_2Me	H	H	CN	H
284	4	SO_2Me	H	H	CN	H
285	1	SO_2NH_2	H	H	CN	H
286	2	SO_2NH_2	H	H	CN	H

[2928]

287	3	SO_2NH_2	H	H	CN	H
288	4	SO_2NH_2	H	H	CN	H
289	1	H	H	OH	H	H
290	2	H	H	OH	H	H
291	3	H	H	OH	H	H
292	4	H	H	OH	H	H
293	1	Me	H	OH	H	H
294	2	Me	H	OH	H	H
295	3	Me	H	OH	H	H
296	4	Me	H	OH	H	H
297	1	CH_2Ph	H	OH	H	H
298	2	CH_2Ph	H	OH	H	H
299	3	CH_2Ph	H	OH	H	H
300	4	CH_2Ph	H	OH	H	H
301	1	COMe	H	OH	H	H
302	2	COMe	H	OH	H	H
303	3	COMe	H	OH	H	H
304	4	COMe	H	OH	H	H
305	1	CO_2Me	H	OH	H	H
306	2	CO_2Me	H	OH	H	H
307	3	CO_2Me	H	OH	H	H
308	4	CO_2Me	H	OH	H	H
309	1	CO_2tBu	H	OH	H	H
310	2	CO_2tBu	H	OH	H	H
311	3	CO_2tBu	H	OH	H	H
312	4	CO_2tBu	H	OH	H	H
313	1	CONHMe	H	OH	H	H
314	2	CONHMe	H	OH	H	H
315	3	CONHMe	H	OH	H	H
316	4	CONHMe	H	OH	H	H

[2929]

317	1	SO_2Me	H	OH	H	H
318	2	SO_2Me	H	OH	H	H
319	3	SO_2Me	H	OH	H	H
320	4	SO_2Me	H	OH	H	H
321	1	SO_2NH_2	H	OH	H	H
322	2	SO_2NH_2	H	OH	H	H
323	3	SO_2NH_2	H	OH	H	H
324	4	SO_2NH_2	H	OH	H	H
325	1	H	H	OMe	H	H
326	2	H	H	OMe	H	H
327	3	H	H	OMe	H	H
328	4	H	H	OMe	H	H
329	1	Me	H	OMe	H	H
330	2	Me	H	OMe	H	H
331	3	Me	H	OMe	H	H
332	4	Me	H	OMe	H	H
333	1	CH_2Ph	H	OMe	H	H
334	2	CH_2Ph	H	OMe	H	H
335	3	CH_2Ph	H	OMe	H	H
336	4	CH_2Ph	H	OMe	H	H
337	1	COMe	H	OMe	H	H
338	2	COMe	H	OMe	H	H
339	3	COMe	H	OMe	H	H
340	4	COMe	H	OMe	H	H
341	1	CO_2Me	H	OMe	H	H
342	2	CO_2Me	H	OMe	H	H
343	3	CO_2Me	H	OMe	H	H
344	4	CO_2Me	H	OMe	H	H
345	1	CO_2tBu	H	OMe	H	H
346	2	CO_2tBu	H	OMe	H	H

[2930]

347	3	CO_2tBu	H	OMe	H	H
348	4	CO_2tBu	H	OMe	H	H
349	1	CONHMe	H	OMe	H	H
350	2	CONHMe	H	OMe	H	H
351	3	CONHMe	H	OMe	H	H
352	4	CONHMe	H	OMe	H	H
353	1	SO_2Me	H	OMe	H	H
354	2	SO_2Me	H	OMe	H	H
355	3	SO_2Me	H	OMe	H	H
356	4	SO_2Me	H	OMe	H	H
357	1	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
358	2	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
359	3	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
360	4	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
361	1	H	H	Me	H	H
362	2	H	H	Me	H	H
363	3	H	H	Me	H	H
364	4	H	H	Me	H	H
365	1	Me	H	Me	H	H
366	2	Me	H	Me	H	H
367	3	Me	H	Me	H	H
368	4	Me	H	Me	H	H
369	1	CH_2Ph	H	Me	H	H
370	2	CH_2Ph	H	Me	H	H
371	3	CH_2Ph	H	Me	H	H
372	4	CH_2Ph	H	Me	H	H
373	1	COMe	H	Me	H	H
374	2	COMe	H	Me	H	H
375	3	COMe	H	Me	H	H
376	4	COMe	H	Me	H	H

[2931]

377	1	CO_2Me	H	Me	H	H
378	2	CO_2Me	H	Me	H	H
379	3	CO_2Me	H	Me	H	H
380	4	CO_2Me	H	Me	H	H
381	1	CO_2tBu	H	Me	H	H
382	2	CO_2tBu	H	Me	H	H
383	3	CO_2tBu	H	Me	H	H
384	4	CO_2tBu	H	Me	H	H
385	1	CONHMe	H	Me	H	H
386	2	CONHMe	H	Me	H	H
387	3	CONHMe	H	Me	H	H
388	4	CONHMe	H	Me	H	H
389	1	SO_2Me	H	Me	H	H
390	2	SO_2Me	H	Me	H	H
391	3	SO_2Me	H	Me	H	H
392	4	SO_2Me	H	Me	H	H
393	1	SO_2NH_2	H	Me	H	H
394	2	SO_2NH_2	H	Me	H	H
395	3	SO_2NH_2	H	Me	H	H
396	4	SO_2NH_2	H	Me	H	H
397	1	H	H	CF_3	H	H
398	2	H	H	CF_3	H	H
399	3	H	H	CF_3	H	H
400	4	H	H	CF_3	H	H
401	1	Me	H	CF_3	H	H
402	2	Me	H	CF_3	H	H
403	3	Me	H	CF_3	H	H
404	4	Me	H	CF_3	H	H
405	1	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
406	2	CH_2Ph	H	CF_3	H	H

[2932]

407	3	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
408	4	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
409	1	COMe	H	CF_3	H	H
410	2	COMe	H	CF_3	H	H
411	3	COMe	H	CF_3	H	H
412	4	COMe	H	CF_3	H	H
413	1	CO_2Me	H	CF_3	H	H
414	2	CO_2Me	H	CF_3	H	H
415	3	CO_2Me	H	CF_3	H	H
416	4	CO_2Me	H	CF_3	H	H
417	1	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
418	2	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
419	3	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
420	4	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
421	1	CONHMe	H	CF_3	H	H
422	2	CONHMe	H	CF_3	H	H
423	3	CONHMe	H	CF_3	H	H
424	4	CONHMe	H	CF_3	H	H
425	1	SO_2Me	H	CF_3	H	H
426	2	SO_2Me	H	CF_3	H	H
427	3	SO_2Me	H	CF_3	H	H
428	4	SO_2Me	H	CF_3	H	H
429	1	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
430	2	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
431	3	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
432	4	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
433	1	H	H	F	H	H
434	2	H	H	F	H	H
435	3	H	H	F	H	H
436	3	H	H	F	H	H

[2933]

437	1	Me	H	F	H	H
438	2	Me	H	F	H	H
439	3	Me	H	F	H	H
440	4	Me	H	F	H	H
441	1	CH_2Ph	H	F	H	H
442	2	CH_2Ph	H	F	H	H
443	3	CH_2Ph	H	F	H	H
444	4	CH_2Ph	H	F	H	H
445	1	COMe	H	F	H	H
446	2	COMe	H	F	H	H
447	3	COMe	H	F	H	H
448	4	COMe	H	F	H	H
449	1	CO_2Me	H	F	H	H
450	2	CO_2Me	H	F	H	H
451	3	CO_2Me	H	F	H	H
452	4	CO_2Me	H	F	H	H
453	1	CO_2tBu	H	F	H	H
454	2	CO_2tBu	H	F	H	H
455	3	CO_2tBu	H	F	H	H
456	4	CO_2tBu	H	F	H	H
457	1	CONHMe	H	F	H	H
458	2	CONHMe	H	F	H	H
459	3	CONHMe	H	F	H	H
460	4	CONHMe	H	F	H	H
461	1	SO_2Me	H	F	H	H
462	2	SO_2Me	H	F	H	H
463	3	SO_2Me	H	F	H	H
464	4	SO_2Me	H	F	H	H
465	1	SO_2NH_2	H	F	H	H
466	2	SO_2NH_2	H	F	H	H

[2934]

467	3	SO_2NH_2	H	F	H	H
468	4	SO_2NH_2	H	F	H	H
469	1	H	H	Cl	H	H
470	2	H	H	Cl	H	H
471	3	H	H	Cl	H	H
472	4	H	H	Cl	H	H
473	1	Me	H	Cl	H	H
474	2	Me	H	Cl	H	H
475	3	Me	H	Cl	H	H
476	4	Me	H	Cl	H	H
477	1	CH_2Ph	H	Cl	H	H
478	2	CH_2Ph	H	Cl	H	H
479	3	CH_2Ph	H	Cl	H	H
480	4	CH_2Ph	H	Cl	H	H
481	1	COMe	H	Cl	H	H
482	2	COMe	H	Cl	H	H
483	3	COMe	H	Cl	H	H
484	4	COMe	H	Cl	H	H
485	1	CO_2Me	H	Cl	H	H
486	2	CO_2Me	H	Cl	H	H
487	3	CO_2Me	H	Cl	H	H
488	4	CO_2Me	H	Cl	H	H
489	1	CO_2tBu	H	Cl	H	H
490	2	CO_2tBu	H	Cl	H	H
491	3	CO_2tBu	H	Cl	H	H
492	4	CO_2tBu	H	Cl	H	H
493	1	CONHMe	H	Cl	H	H
494	2	CONHMe	H	Cl	H	H
495	3	CONHMe	H	Cl	H	H
496	4	CONHMe	H	Cl	H	H

[2935]

497	1	SO_2Me	H	Cl	H	H
498	2	SO_2Me	H	Cl	H	H
499	3	SO_2Me	H	Cl	H	H
500	4	SO_2Me	H	Cl	H	H
501	1	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
502	2	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
503	3	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
504	4	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
505	1	H	H	CN	H	H
506	2	H	H	CN	H	H
507	3	H	H	CN	H	H
508	4	H	H	CN	H	H
509	1	Me	H	CN	H	H
510	2	Me	H	CN	H	H
511	3	Me	H	CN	H	H
512	4	Me	H	CN	H	H
513	1	CH_2Ph	H	CN	H	H
514	2	CH_2Ph	H	CN	H	H
515	3	CH_2Ph	H	CN	H	H
516	4	CH_2Ph	H	CN	H	H
517	1	COMe	H	CN	H	H
518	2	COMe	H	CN	H	H
519	3	COMe	H	CN	H	H
520	4	COMe	H	CN	H	H
521	1	CO_2Me	H	CN	H	H
522	2	CO_2Me	H	CN	H	H
523	3	CO_2Me	H	CN	H	H
524	4	CO_2Me	H	CN	H	H
525	1	CO_2tBu	H	CN	H	H
526	2	CO_2tBu	H	CN	H	H

[2936]

527	3	CO_2tBu	H	CN	H	H
528	4	CO_2tBu	H	CN	H	H
529	1	CONHMe	H	CN	H	H
530	2	CONHMe	H	CN	H	H
531	3	CONHMe	H	CN	H	H
532	4	CONHMe	H	CN	H	H
533	1	SO_2Me	H	CN	H	H
534	2	SO_2Me	H	CN	H	H
535	3	SO_2Me	H	CN	H	H
536	4	SO_2Me	H	CN	H	H
537	1	SO_2NH_2	H	CN	H	H
538	2	SO_2NH_2	H	CN	H	H
539	3	SO_2NH_2	H	CN	H	H
540	4	SO_2NH_2	H	CN	H	H
541	1	H	OH	H	H	H
542	2	H	OH	H	H	H
543	3	H	OH	H	H	H
544	4	H	OH	H	H	H
545	1	Me	OH	H	H	H
546	2	Me	OH	H	H	H
547	3	Me	OH	H	H	H
548	4	Me	OH	H	H	H
549	1	CH_2Ph	OH	H	H	H
550	2	CH_2Ph	OH	H	H	H
551	3	CH_2Ph	OH	H	H	H
552	4	CH_2Ph	OH	H	H	H
553	1	COMe	OH	H	H	H
554	2	COMe	OH	H	H	H
555	3	COMe	OH	H	H	H
556	4	COMe	OH	H	H	H

[2937]

557	1	CO_2Me	OH	H	H	H
558	2	CO_2Me	OH	H	H	H
559	3	CO_2Me	OH	H	H	H
560	4	CO_2Me	OH	H	H	H
561	1	CO_2tBu	OH	H	H	H
562	2	CO_2tBu	OH	H	H	H
563	3	CO_2tBu	OH	H	H	H
564	4	CO_2tBu	OH	H	H	H
565	1	CONHMe	OH	H	H	H
566	2	CONHMe	OH	H	H	H
567	3	CONHMe	OH	H	H	H
568	4	CONHMe	OH	H	H	H
569	1	SO_2Me	OH	H	H	H
570	2	SO_2Me	OH	H	H	H
571	3	SO_2Me	OH	H	H	H
572	4	SO_2Me	OH	H	H	H
573	1	SO_2NH_2	OH	H	H	H
574	2	SO_2NH_2	OH	H	H	H
575	3	SO_2NH_2	OH	H	H	H
576	4	SO_2NH_2	OH	H	H	H
577	1	H	OMe	H	H	H
578	2	H	OMe	H	H	H
579	3	H	OMe	H	H	H
580	4	H	OMe	H	H	H
581	1	Me	OMe	H	H	H
582	2	Me	OMe	H	H	H
583	3	Me	OMe	H	H	H
584	4	Me	OMe	H	H	H
585	1	CH_2Ph	OMe	H	H	H
586	2	CH_2Ph	OMe	H	H	H

[2938]

587	3	CH_2Ph	OMe	H	H	H
588	4	CH_2Ph	OMe	H	H	H
589	1	COMe	OMe	H	H	H
590	2	COMe	OMe	H	H	H
591	3	COMe	OMe	H	H	H
592	4	COMe	OMe	H	H	H
593	1	CO_2Me	OMe	H	H	H
594	2	CO_2Me	OMe	H	H	H
595	3	CO_2Me	OMe	H	H	H
596	4	CO_2Me	OMe	H	H	H
597	1	CO_2tBu	OMe	H	H	H
598	2	CO_2tBu	OMe	H	H	H
599	3	CO_2tBu	OMe	H	H	H
600	4	CO_2tBu	OMe	H	H	H
601	1	CONHMe	OMe	H	H	H
602	2	CONHMe	OMe	H	H	H
603	3	CONHMe	OMe	H	H	H
604	4	CONHMe	OMe	H	H	H
605	1	SO_2Me	OMe	H	H	H
606	2	SO_2Me	OMe	H	H	H
607	3	SO_2Me	OMe	H	H	H
608	4	SO_2Me	OMe	H	H	H
609	1	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
610	2	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
611	3	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
612	4	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
613	1	H	Me	H	H	H
614	2	H	Me	H	H	H
615	3	H	Me	H	H	H
616	4	H	Me	H	H	H

[2939]

617	1	Me	Me	H	H	H
618	2	Me	Me	H	H	H
619	3	Me	Me	H	H	H
620	4	Me	Me	H	H	H
621	1	CH_2Ph	Me	H	H	H
622	2	CH_2Ph	Me	H	H	H
623	3	CH_2Ph	Me	H	H	H
624	4	CH_2Ph	Me	H	H	H
625	1	COMe	Me	H	H	H
626	2	COMe	Me	H	H	H
627	3	COMe	Me	H	H	H
628	4	COMe	Me	H	H	H
629	1	CO_2Me	Me	H	H	H
630	2	CO_2Me	Me	H	H	H
631	3	CO_2Me	Me	H	H	H
632	4	CO_2Me	Me	H	H	H
633	1	CO_2tBu	Me	H	H	H
634	2	CO_2tBu	Me	H	H	H
635	3	CO_2tBu	Me	H	H	H
636	4	CO_2tBu	Me	H	H	H
637	1	CONHMe	Me	H	H	H
638	2	CONHMe	Me	H	H	H
639	3	CONHMe	Me	H	H	H
640	4	CONHMe	Me	H	H	H
641	1	SO_2Me	Me	H	H	H
642	2	SO_2Me	Me	H	H	H
643	3	SO_2Me	Me	H	H	H
644	4	SO_2Me	Me	H	H	H
645	1	SO_2NH_2	Me	H	H	H
646	2	SO_2NH_2	Me	H	H	H

[2940]

647	3	SO_2NH_2	Me	H	H	H
648	4	SO_2NH_2	Me	H	H	H
649	1	H	CF_3	H	H	H
650	2	H	CF_3	H	H	H
651	3	H	CF_3	H	H	H
652	4	H	CF_3	H	H	H
653	1	Me	CF_3	H	H	H
654	2	Me	CF_3	H	H	H
655	3	Me	CF_3	H	H	H
656	4	Me	CF_3	H	H	H
657	1	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
658	2	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
659	3	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
660	4	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
661	1	COMe	CF_3	H	H	H
662	2	COMe	CF_3	H	H	H
663	3	COMe	CF_3	H	H	H
664	4	COMe	CF_3	H	H	H
665	1	CO_2Me	CF_3	H	H	H
666	2	CO_2Me	CF_3	H	H	H
667	3	CO_2Me	CF_3	H	H	H
668	4	CO_2Me	CF_3	H	H	H
669	1	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
670	2	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
671	3	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
672	4	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
673	1	CONHMe	CF_3	H	H	H
674	2	CONHMe	CF_3	H	H	H
675	3	CONHMe	CF_3	H	H	H
676	4	CONHMe	CF_3	H	H	H

[2941]

677	1	SO_2Me	CF_3	H	H	H
678	2	SO_2Me	CF_3	H	H	H
679	3	SO_2Me	CF_3	H	H	H
680	4	SO_2Me	CF_3	H	H	H
681	1	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
682	2	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
683	3	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
684	4	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
685	1	H	F	H	H	H
686	2	H	F	H	H	H
687	3	H	F	H	H	H
688	3	H	F	H	H	H
689	1	Me	F	H	H	H
690	2	Me	F	H	H	H
691	3	Me	F	H	H	H
692	4	Me	F	H	H	H
693	1	CH_2Ph	F	H	H	H
694	2	CH_2Ph	F	H	H	H
695	3	CH_2Ph	F	H	H	H
696	4	CH_2Ph	F	H	H	H
697	1	COMe	F	H	H	H
698	2	COMe	F	H	H	H
699	3	COMe	F	H	H	H
700	4	COMe	F	H	H	H
701	1	CO_2Me	F	H	H	H
702	2	CO_2Me	F	H	H	H
703	3	CO_2Me	F	H	H	H
704	4	CO_2Me	F	H	H	H
705	1	CO_2tBu	F	H	H	H
706	2	CO_2tBu	F	H	H	H

[2942]

707	3	CO_2tBu	F	H	H	H
708	4	CO_2tBu	F	H	H	H
709	1	CONHMe	F	H	H	H
710	2	CONHMe	F	H	H	H
711	3	CONHMe	F	H	H	H
712	4	CONHMe	F	H	H	H
713	1	SO_2Me	F	H	H	H
714	2	SO_2Me	F	H	H	H
715	3	SO_2Me	F	H	H	H
716	4	SO_2Me	F	H	H	H
717	1	SO_2NH_2	F	H	H	H
718	2	SO_2NH_2	F	H	H	H
719	3	SO_2NH_2	F	H	H	H
720	4	SO_2NH_2	F	H	H	H
721	1	H	Cl	H	H	H
722	2	H	Cl	H	H	H
723	3	H	Cl	H	H	H
724	4	H	Cl	H	H	H
725	1	Me	Cl	H	H	H
726	2	Me	Cl	H	H	H
727	3	Me	Cl	H	H	H
728	4	Me	Cl	H	H	H
729	1	CH_2Ph	Cl	H	H	H
730	2	CH_2Ph	Cl	H	H	H
731	3	CH_2Ph	Cl	H	H	H
732	4	CH_2Ph	Cl	H	H	H
733	1	COMe	Cl	H	H	H
734	2	COMe	Cl	H	H	H
735	3	COMe	Cl	H	H	H
736	4	COMe	Cl	H	H	H

[2943]

737	1	CO_2Me	Cl	H	H	H
738	2	CO_2Me	Cl	H	H	H
739	3	CO_2Me	Cl	H	H	H
740	4	CO_2Me	Cl	H	H	H
741	1	CO_2tBu	Cl	H	H	H
742	2	CO_2tBu	Cl	H	H	H
743	3	CO_2tBu	Cl	H	H	H
744	4	CO_2tBu	Cl	H	H	H
745	1	CONHMe	Cl	H	H	H
746	2	CONHMe	Cl	H	H	H
747	3	CONHMe	Cl	H	H	H
748	4	CONHMe	Cl	H	H	H
749	1	SO_2Me	Cl	H	H	H
750	2	SO_2Me	Cl	H	H	H
751	3	SO_2Me	Cl	H	H	H
752	4	SO_2Me	Cl	H	H	H
753	1	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
754	2	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
755	3	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
756	4	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
757	1	H	CN	H	H	H
758	2	H	CN	H	H	H
759	3	H	CN	H	H	H
760	4	H	CN	H	H	H
761	1	Me	CN	H	H	H
762	2	Me	CN	H	H	H
763	3	Me	CN	H	H	H
764	4	Me	CN	H	H	H
765	1	CH_2Ph	CN	H	H	H
766	2	CH_2Ph	CN	H	H	H

[2944]

767	3	CH_2Ph	CN	H	H	H
768	4	CH_2Ph	CN	H	H	H
769	1	COMe	CN	H	H	H
770	2	COMe	CN	H	H	H
771	3	COMe	CN	H	H	H
772	4	COMe	CN	H	H	H
773	1	CO_2Me	CN	H	H	H
774	2	CO_2Me	CN	H	H	H
775	3	CO_2Me	CN	H	H	H
776	4	CO_2Me	CN	H	H	H
777	1	CO_2tBu	CN	H	H	H
778	2	CO_2tBu	CN	H	H	H
779	3	CO_2tBu	CN	H	H	H
780	4	CO_2tBu	CN	H	H	H
781	1	CONHMe	CN	H	H	H
782	2	CONHMe	CN	H	H	H
783	3	CONHMe	CN	H	H	H
784	4	CONHMe	CN	H	H	H
785	1	SO_2Me	CN	H	H	H
786	2	SO_2Me	CN	H	H	H
787	3	SO_2Me	CN	H	H	H
788	4	SO_2Me	CN	H	H	H
789	1	SO_2NH_2	CN	H	H	H
790	2	SO_2NH_2	CN	H	H	H
791	3	SO_2NH_2	CN	H	H	H
792	4	SO_2NH_2	CN	H	H	H
793	1	H	H	H	H	OH
794	2	H	H	H	H	OH
795	3	H	H	H	H	OH
796	4	H	H	H	H	OH

[2945]

797	1	Me	H	H	H	OH
798	2	Me	H	H	H	OH
799	3	Me	H	H	H	OH
800	4	Me	H	H	H	OH
801	1	CH_2Ph	H	H	H	OH
802	2	CH_2Ph	H	H	H	OH
803	3	CH_2Ph	H	H	H	OH
804	4	CH_2Ph	H	H	H	OH
805	1	COMe	H	H	H	OH
806	2	COMe	H	H	H	OH
807	3	COMe	H	H	H	OH
808	4	COMe	H	H	H	OH
809	1	CO_2Me	H	H	H	OH
810	2	CO_2Me	H	H	H	OH
811	3	CO_2Me	H	H	H	OH
812	4	CO_2Me	H	H	H	OH
813	1	CO_2tBu	H	H	H	OH
814	2	CO_2tBu	H	H	H	OH
815	3	CO_2tBu	H	H	H	OH
816	4	CO_2tBu	H	H	H	OH
817	1	CONHMe	H	H	H	OH
818	2	CONHMe	H	H	H	OH
819	3	CONHMe	H	H	H	OH
820	4	CONHMe	H	H	H	OH
821	1	SO_2Me	H	H	H	OH
822	2	SO_2Me	H	H	H	OH
823	3	SO_2Me	H	H	H	OH
824	4	SO_2Me	H	H	H	OH
825	1	SO_2NH_2	H	H	H	OH
826	2	SO_2NH_2	H	H	H	OH

[2946]

827	3	SO_2NH_2	H	H	H	OH
828	4	SO_2NH_2	H	H	H	OH
829	1	H	H	H	H	OMe
830	2	H	H	H	H	OMe
831	3	H	H	H	H	OMe
832	4	H	H	H	H	OMe
833	1	Me	H	H	H	OMe
834	2	Me	H	H	H	OMe
835	3	Me	H	H	H	OMe
836	4	Me	H	H	H	OMe
837	1	CH_2Ph	H	H	H	OMe
838	2	CH_2Ph	H	H	H	OMe
839	3	CH_2Ph	H	H	H	OMe
840	4	CH_2Ph	H	H	H	OMe
841	1	COMe	H	H	H	OMe
842	2	COMe	H	H	H	OMe
843	3	COMe	H	H	H	OMe
844	4	COMe	H	H	H	OMe
845	1	CO_2Me	H	H	H	OMe
846	2	CO_2Me	H	H	H	OMe
847	3	CO_2Me	H	H	H	OMe
848	4	CO_2Me	H	H	H	OMe
849	1	CO_2tBu	H	H	H	OMe
850	2	CO_2tBu	H	H	H	OMe
851	3	CO_2tBu	H	H	H	OMe
852	4	CO_2tBu	H	H	H	OMe
853	1	CONHMe	H	H	H	OMe
854	2	CONHMe	H	H	H	OMe
855	3	CONHMe	H	H	H	OMe
856	4	CONHMe	H	H	H	OMe

[2947]

857	1	SO_2Me	H	H	H	OMe
858	2	SO_2Me	H	H	H	OMe
859	3	SO_2Me	H	H	H	OMe
860	4	SO_2Me	H	H	H	OMe
861	1	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
862	2	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
863	3	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
864	4	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
865	1	H	H	H	H	Me
866	2	H	H	H	H	Me
867	3	H	H	H	H	Me
868	4	H	H	H	H	Me
869	1	Me	H	H	H	Me
870	2	Me	H	H	H	Me
871	3	Me	H	H	H	Me
872	4	Me	H	H	H	Me
873	1	CH_2Ph	H	H	H	Me
874	2	CH_2Ph	H	H	H	Me
875	3	CH_2Ph	H	H	H	Me
876	4	CH_2Ph	H	H	H	Me
877	1	COMe	H	H	H	Me
878	2	COMe	H	H	H	Me
879	3	COMe	H	H	H	Me
880	4	COMe	H	H	H	Me
881	1	CO_2Me	H	H	H	Me
882	2	CO_2Me	H	H	H	Me
883	3	CO_2Me	H	H	H	Me
884	4	CO_2Me	H	H	H	Me
885	1	CO_2tBu	H	H	H	Me
886	2	CO_2tBu	H	H	H	Me

887	3	CO_2tBu	H	H	H	Me
888	4	CO_2tBu	H	H	H	Me
889	1	CONHMe	H	H	H	Me
890	2	CONHMe	H	H	H	Me
891	3	CONHMe	H	H	H	Me
892	4	CONHMe	H	H	H	Me
893	1	SO_2Me	H	H	H	Me
894	2	SO_2Me	H	H	H	Me
895	3	SO_2Me	H	H	H	Me
896	4	SO_2Me	H	H	H	Me
897	1	SO_2NH_2	H	H	H	Me
898	2	SO_2NH_2	H	H	H	Me
899	3	SO_2NH_2	H	H	H	Me
900	4	SO_2NH_2	H	H	H	Me
901	1	H	H	H	H	CF_3
902	2	H	H	H	H	CF_3
903	3	H	H	H	H	CF_3
904	4	H	H	H	H	CF_3
905	1	Me	H	H	H	CF_3
906	2	Me	H	H	H	CF_3
907	3	Me	H	H	H	CF_3
908	4	Me	H	H	H	CF_3
909	1	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
910	2	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
911	3	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
912	4	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
913	1	COMe	H	H	H	CF_3
914	2	COMe	H	H	H	CF_3
915	3	COMe	H	H	H	CF_3
916	4	COMe	H	H	H	CF_3

[2948]

[2949]

917	1	CO_2Me	H	H	H	CF_3
918	2	CO_2Me	H	H	H	CF_3
919	3	CO_2Me	H	H	H	CF_3
920	4	CO_2Me	H	H	H	CF_3
921	1	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
922	2	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
923	3	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
924	4	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
925	1	CONHMe	H	H	H	CF_3
926	2	CONHMe	H	H	H	CF_3
927	3	CONHMe	H	H	H	CF_3
928	4	CONHMe	H	H	H	CF_3
929	1	SO_2Me	H	H	H	CF_3
930	2	SO_2Me	H	H	H	CF_3
931	3	SO_2Me	H	H	H	CF_3
932	4	SO_2Me	H	H	H	CF_3
933	1	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
934	2	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
935	3	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
936	4	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
937	1	H	H	H	H	F
938	2	H	H	H	H	F
939	3	H	H	H	H	F
940	3	H	H	H	H	F
941	1	Me	H	H	H	F
942	2	Me	H	H	H	F
943	3	Me	H	H	H	F
944	4	Me	H	H	H	F
945	1	CH_2Ph	H	H	H	F
946	2	CH_2Ph	H	H	H	F

947	3	CH_2Ph	H	H	H	F
948	4	CH_2Ph	H	H	H	F
949	1	COMe	H	H	H	F
950	2	COMe	H	H	H	F
951	3	COMe	H	H	H	F
952	4	COMe	H	H	H	F
953	1	CO_2Me	H	H	H	F
954	2	CO_2Me	H	H	H	F
955	3	CO_2Me	H	H	H	F
956	4	CO_2Me	H	H	H	F
957	1	CO_2tBu	H	H	H	F
958	2	CO_2tBu	H	H	H	F
959	3	CO_2tBu	H	H	H	F
960	4	CO_2tBu	H	H	H	F
961	1	CONHMe	H	H	H	F
962	2	CONHMe	H	H	H	F
963	3	CONHMe	H	H	H	F
964	4	CONHMe	H	H	H	F
965	1	SO_2Me	H	H	H	F
966	2	SO_2Me	H	H	H	F
967	3	SO_2Me	H	H	H	F
968	4	SO_2Me	H	H	H	F
969	1	SO_2NH_2	H	H	H	F
970	2	SO_2NH_2	H	H	H	F
971	3	SO_2NH_2	H	H	H	F
972	4	SO_2NH_2	H	H	H	F
973	1	H	H	H	H	Cl
974	2	H	H	H	H	Cl
975	3	H	H	H	H	Cl
976	4	H	H	H	H	Cl

[2950]

[2951]

977	1	Me	H	H	H	Cl
978	2	Me	H	H	H	Cl
979	3	Me	H	H	H	Cl
980	4	Me	H	H	H	Cl
981	1	CH_2Ph	H	H	H	Cl
982	2	CH_2Ph	H	H	H	Cl
983	3	CH_2Ph	H	H	H	Cl
984	4	CH_2Ph	H	H	H	Cl
985	1	COMe	H	H	H	Cl
986	2	COMe	H	H	H	Cl
987	3	COMe	H	H	H	Cl
988	4	COMe	H	H	H	Cl
989	1	CO_2Me	H	H	H	Cl
990	2	CO_2Me	H	H	H	Cl
991	3	CO_2Me	H	H	H	Cl
992	4	CO_2Me	H	H	H	Cl
993	1	CO_2tBu	H	H	H	Cl
994	2	CO_2tBu	H	H	H	Cl
995	3	CO_2tBu	H	H	H	Cl
996	4	CO_2tBu	H	H	H	Cl
997	1	CONHMe	H	H	H	Cl
998	2	CONHMe	H	H	H	Cl
999	3	CONHMe	H	H	H	Cl
1000	4	CONHMe	H	H	H	Cl
1001	1	SO_2Me	H	H	H	Cl
1002	2	SO_2Me	H	H	H	Cl
1003	3	SO_2Me	H	H	H	Cl
1004	4	SO_2Me	H	H	H	Cl
1005	1	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1006	2	SO_2NH_2	H	H	H	Cl

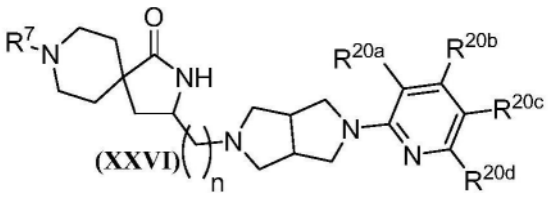
[2952]

1007	3	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1008	4	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1009	1	H	H	H	H	CN
1010	2	H	H	H	H	CN
1011	3	H	H	H	H	CN
1012	4	H	H	H	H	CN
1013	1	Me	H	H	H	CN
1014	2	Me	H	H	H	CN
1015	3	Me	H	H	H	CN
1016	4	Me	H	H	H	CN
1017	1	CH_2Ph	H	H	H	CN
1018	2	CH_2Ph	H	H	H	CN
1019	3	CH_2Ph	H	H	H	CN
1020	4	CH_2Ph	H	H	H	CN
1021	1	COMe	H	H	H	CN
1022	2	COMe	H	H	H	CN
1023	3	COMe	H	H	H	CN
1024	4	COMe	H	H	H	CN
1025	1	CO_2Me	H	H	H	CN
1026	2	CO_2Me	H	H	H	CN
1027	3	CO_2Me	H	H	H	CN
1028	4	CO_2Me	H	H	H	CN
1029	1	CO_2tBu	H	H	H	CN
1030	2	CO_2tBu	H	H	H	CN
1031	3	CO_2tBu	H	H	H	CN
1032	4	CO_2tBu	H	H	H	CN
1033	1	CONHMe	H	H	H	CN
1034	2	CONHMe	H	H	H	CN
1035	3	CONHMe	H	H	H	CN
1036	4	CONHMe	H	H	H	CN

[2953]

1037	1	SO_2Me	H	H	H	CN
1038	2	SO_2Me	H	H	H	CN
1039	3	SO_2Me	H	H	H	CN
1040	4	SO_2Me	H	H	H	CN
1041	1	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1042	2	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1043	3	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1044	4	SO_2NH_2	H	H	H	CN

[2954] 示例性实施方案包括具有式(XXVI)的化合物

[2955] 

[2956] 或其可药用盐形式,如在下文表20中所定义。

[2957] 表20:

[2958]

条目	n	R^7	R^{20a}	R^{20b}	R^{20c}	R^{20d}
1	1	H	H	H	H	H
2	2	H	H	H	H	H
3	3	H	H	H	H	H
4	4	H	H	H	H	H
5	1	Me	H	H	H	H
6	2	Me	H	H	H	H
7	3	Me	H	H	H	H
8	4	Me	H	H	H	H
9	1	CH_2Ph	H	H	H	H
10	2	CH_2Ph	H	H	H	H
11	3	CH_2Ph	H	H	H	H
12	4	CH_2Ph	H	H	H	H
13	1	COMe	H	H	H	H
14	2	COMe	H	H	H	H
15	3	COMe	H	H	H	H

[2959]

16	4	COMe	H	H	H	H
17	1	CO_2Me	H	H	H	H
18	2	CO_2Me	H	H	H	H
19	3	CO_2Me	H	H	H	H
20	4	CO_2Me	H	H	H	H
21	1	CO_2tBu	H	H	H	H
22	2	CO_2tBu	H	H	H	H
23	3	CO_2tBu	H	H	H	H
24	4	CO_2tBu	H	H	H	H
25	1	CONHMe	H	H	H	H
26	2	CONHMe	H	H	H	H
27	3	CONHMe	H	H	H	H
28	4	CONHMe	H	H	H	H
29	1	SO_2Me	H	H	H	H
30	2	SO_2Me	H	H	H	H
31	3	SO_2Me	H	H	H	H
32	4	SO_2Me	H	H	H	H
33	1	SO_2NH_2	H	H	H	H
34	2	SO_2NH_2	H	H	H	H
35	3	SO_2NH_2	H	H	H	H
36	4	SO_2NH_2	H	H	H	H
37	1	H	H	H	OH	H
38	2	H	H	H	OH	H
39	3	H	H	H	OH	H
40	4	H	H	H	OH	H
41	1	Me	H	H	OH	H
42	2	Me	H	H	OH	H
43	3	Me	H	H	OH	H
44	4	Me	H	H	OH	H
45	1	CH_2Ph	H	H	OH	H

[2960]

46	2	CH_2Ph	H	H	OH	H
47	3	CH_2Ph	H	H	OH	H
48	4	CH_2Ph	H	H	OH	H
49	1	COMe	H	H	OH	H
50	2	COMe	H	H	OH	H
51	3	COMe	H	H	OH	H
52	4	COMe	H	H	OH	H
53	1	CO_2Me	H	H	OH	H
54	2	CO_2Me	H	H	OH	H
55	3	CO_2Me	H	H	OH	H
56	4	CO_2Me	H	H	OH	H
57	1	CO_2tBu	H	H	OH	H
58	2	CO_2tBu	H	H	OH	H
59	3	CO_2tBu	H	H	OH	H
60	4	CO_2tBu	H	H	OH	H
61	1	CONHMe	H	H	OH	H
62	2	CONHMe	H	H	OH	H
63	3	CONHMe	H	H	OH	H
64	4	CONHMe	H	H	OH	H
65	1	SO_2Me	H	H	OH	H
66	2	SO_2Me	H	H	OH	H
67	3	SO_2Me	H	H	OH	H
68	4	SO_2Me	H	H	OH	H
69	1	SO_2NH_2	H	H	OH	H
70	2	SO_2NH_2	H	H	OH	H
71	3	SO_2NH_2	H	H	OH	H
72	4	SO_2NH_2	H	H	OH	H
73	1	H	H	H	OMe	H
74	2	H	H	H	OMe	H
75	3	H	H	H	OMe	H

[2961]

76	4	H	H	H	OMe	H
77	1	Me	H	H	OMe	H
78	2	Me	H	H	OMe	H
79	3	Me	H	H	OMe	H
80	4	Me	H	H	OMe	H
81	1	CH_2Ph	H	H	OMe	H
82	2	CH_2Ph	H	H	OMe	H
83	3	CH_2Ph	H	H	OMe	H
84	4	CH_2Ph	H	H	OMe	H
85	1	COMe	H	H	OMe	H
86	2	COMe	H	H	OMe	H
87	3	COMe	H	H	OMe	H
88	4	COMe	H	H	OMe	H
89	1	CO_2Me	H	H	OMe	H
90	2	CO_2Me	H	H	OMe	H
91	3	CO_2Me	H	H	OMe	H
92	4	CO_2Me	H	H	OMe	H
93	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
94	2	CO_2tBu	H	H	OMe	H
95	3	CO_2tBu	H	H	OMe	H
96	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
97	1	CONHMe	H	H	OMe	H
98	2	CONHMe	H	H	OMe	H
99	3	CONHMe	H	H	OMe	H
100	4	CONHMe	H	H	OMe	H
101	1	SO_2Me	H	H	OMe	H
102	2	SO_2Me	H	H	OMe	H
103	3	SO_2Me	H	H	OMe	H
104	4	SO_2Me	H	H	OMe	H
105	1	SO_2NH_2	H	H	OMe	H

[2962]

106	2	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
107	3	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
108	4	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
109	1	H	H	H	Me	H
110	2	H	H	H	Me	H
111	3	H	H	H	Me	H
112	4	H	H	H	Me	H
113	1	Me	H	H	Me	H
114	2	Me	H	H	Me	H
115	3	Me	H	H	Me	H
116	4	Me	H	H	Me	H
117	1	CH_2Ph	H	H	Me	H
118	2	CH_2Ph	H	H	Me	H
119	3	CH_2Ph	H	H	Me	H
120	4	CH_2Ph	H	H	Me	H
121	1	COMe	H	H	Me	H
122	2	COMe	H	H	Me	H
123	3	COMe	H	H	Me	H
124	4	COMe	H	H	Me	H
125	1	CO_2Me	H	H	Me	H
126	2	CO_2Me	H	H	Me	H
127	3	CO_2Me	H	H	Me	H
128	4	CO_2Me	H	H	Me	H
129	1	CO_2tBu	H	H	Me	H
130	2	CO_2tBu	H	H	Me	H
131	3	CO_2tBu	H	H	Me	H
132	4	CO_2tBu	H	H	Me	H
133	1	CONHMe	H	H	Me	H
134	2	CONHMe	H	H	Me	H
135	3	CONHMe	H	H	Me	H

[2963]

136	4	CONHMe	H	H	Me	H
137	1	SO_2Me	H	H	Me	H
138	2	SO_2Me	H	H	Me	H
139	3	SO_2Me	H	H	Me	H
140	4	SO_2Me	H	H	Me	H
141	1	SO_2NH_2	H	H	Me	H
142	2	SO_2NH_2	H	H	Me	H
143	3	SO_2NH_2	H	H	Me	H
144	4	SO_2NH_2	H	H	Me	H
145	1	H	H	H	CF_3	H
146	2	H	H	H	CF_3	H
147	3	H	H	H	CF_3	H
148	4	H	H	H	CF_3	H
149	1	Me	H	H	CF_3	H
150	2	Me	H	H	CF_3	H
151	3	Me	H	H	CF_3	H
152	4	Me	H	H	CF_3	H
153	1	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
154	2	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
155	3	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
156	4	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
157	1	COMe	H	H	CF_3	H
158	2	COMe	H	H	CF_3	H
159	3	COMe	H	H	CF_3	H
160	4	COMe	H	H	CF_3	H
161	1	CO_2Me	H	H	CF_3	H
162	2	CO_2Me	H	H	CF_3	H
163	3	CO_2Me	H	H	CF_3	H
164	4	CO_2Me	H	H	CF_3	H
165	1	CO_2tBu	H	H	CF_3	H

[2964]

166	2	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
167	3	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
168	4	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
169	1	CONHMe	H	H	CF_3	H
170	2	CONHMe	H	H	CF_3	H
171	3	CONHMe	H	H	CF_3	H
172	4	CONHMe	H	H	CF_3	H
173	1	SO_2Me	H	H	CF_3	H
174	2	SO_2Me	H	H	CF_3	H
175	3	SO_2Me	H	H	CF_3	H
176	4	SO_2Me	H	H	CF_3	H
177	1	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
178	2	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
179	3	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
180	4	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
181	1	H	H	H	F	H
182	2	H	H	H	F	H
183	3	H	H	H	F	H
184	4	H	H	H	F	H
185	1	Me	H	H	F	H
186	2	Me	H	H	F	H
187	3	Me	H	H	F	H
188	4	Me	H	H	F	H
189	1	CH_2Ph	H	H	F	H
190	2	CH_2Ph	H	H	F	H
191	3	CH_2Ph	H	H	F	H
192	4	CH_2Ph	H	H	F	H
193	1	COMe	H	H	F	H
194	2	COMe	H	H	F	H
195	3	COMe	H	H	F	H

[2965]

196	4	COMe	H	H	F	H
197	1	CO_2Me	H	H	F	H
198	2	CO_2Me	H	H	F	H
199	3	CO_2Me	H	H	F	H
200	4	CO_2Me	H	H	F	H
201	1	CO_2tBu	H	H	F	H
202	2	CO_2tBu	H	H	F	H
203	3	CO_2tBu	H	H	F	H
204	4	CO_2tBu	H	H	F	H
205	1	CONHMe	H	H	F	H
206	2	CONHMe	H	H	F	H
207	3	CONHMe	H	H	F	H
208	4	CONHMe	H	H	F	H
209	1	SO_2Me	H	H	F	H
210	2	SO_2Me	H	H	F	H
211	3	SO_2Me	H	H	F	H
212	4	SO_2Me	H	H	F	H
213	1	SO_2NH_2	H	H	F	H
214	2	SO_2NH_2	H	H	F	H
215	3	SO_2NH_2	H	H	F	H
216	4	SO_2NH_2	H	H	F	H
217	1	H	H	H	Cl	H
218	2	H	H	H	Cl	H
219	3	H	H	H	Cl	H
220	4	H	H	H	Cl	H
221	1	Me	H	H	Cl	H
222	2	Me	H	H	Cl	H
223	3	Me	H	H	Cl	H
224	4	Me	H	H	Cl	H
225	1	CH_2Ph	H	H	Cl	H

[2966]

226	2	CH_2Ph	H	H	Cl	H
227	3	CH_2Ph	H	H	Cl	H
228	4	CH_2Ph	H	H	Cl	H
229	1	COMe	H	H	Cl	H
230	2	COMe	H	H	Cl	H
231	3	COMe	H	H	Cl	H
232	4	COMe	H	H	Cl	H
233	1	CO_2Me	H	H	Cl	H
234	2	CO_2Me	H	H	Cl	H
235	3	CO_2Me	H	H	Cl	H
236	4	CO_2Me	H	H	Cl	H
237	1	CO_2tBu	H	H	Cl	H
238	2	CO_2tBu	H	H	Cl	H
239	3	CO_2tBu	H	H	Cl	H
240	4	CO_2tBu	H	H	Cl	H
241	1	CONHMe	H	H	Cl	H
242	2	CONHMe	H	H	Cl	H
243	3	CONHMe	H	H	Cl	H
244	4	CONHMe	H	H	Cl	H
245	1	SO_2Me	H	H	Cl	H
246	2	SO_2Me	H	H	Cl	H
247	3	SO_2Me	H	H	Cl	H
248	4	SO_2Me	H	H	Cl	H
249	1	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
250	2	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
251	3	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
252	4	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
253	1	H	H	H	CN	H
254	2	H	H	H	CN	H
255	3	H	H	H	CN	H

[2967]

256	4	H	H	H	CN	H
257	1	Me	H	H	CN	H
258	2	Me	H	H	CN	H
259	3	Me	H	H	CN	H
260	4	Me	H	H	CN	H
261	1	CH_2Ph	H	H	CN	H
262	2	CH_2Ph	H	H	CN	H
263	3	CH_2Ph	H	H	CN	H
264	4	CH_2Ph	H	H	CN	H
265	1	COMe	H	H	CN	H
266	2	COMe	H	H	CN	H
267	3	COMe	H	H	CN	H
268	4	COMe	H	H	CN	H
269	1	CO_2Me	H	H	CN	H
270	2	CO_2Me	H	H	CN	H
271	3	CO_2Me	H	H	CN	H
272	4	CO_2Me	H	H	CN	H
273	1	CO_2tBu	H	H	CN	H
274	2	CO_2tBu	H	H	CN	H
275	3	CO_2tBu	H	H	CN	H
276	4	CO_2tBu	H	H	CN	H
277	1	CONHMe	H	H	CN	H
278	2	CONHMe	H	H	CN	H
279	3	CONHMe	H	H	CN	H
280	4	CONHMe	H	H	CN	H
281	1	SO_2Me	H	H	CN	H
282	2	SO_2Me	H	H	CN	H
283	3	SO_2Me	H	H	CN	H
284	4	SO_2Me	H	H	CN	H
285	1	SO_2NH_2	H	H	CN	H

[2968]

286	2	SO_2NH_2	H	H	CN	H
287	3	SO_2NH_2	H	H	CN	H
288	4	SO_2NH_2	H	H	CN	H
289	1	H	H	OH	H	H
290	2	H	H	OH	H	H
291	3	H	H	OH	H	H
292	4	H	H	OH	H	H
293	1	Me	H	OH	H	H
294	2	Me	H	OH	H	H
295	3	Me	H	OH	H	H
296	4	Me	H	OH	H	H
297	1	CH_2Ph	H	OH	H	H
298	2	CH_2Ph	H	OH	H	H
299	3	CH_2Ph	H	OH	H	H
300	4	CH_2Ph	H	OH	H	H
301	1	COMe	H	OH	H	H
302	2	COMe	H	OH	H	H
303	3	COMe	H	OH	H	H
304	4	COMe	H	OH	H	H
305	1	CO_2Me	H	OH	H	H
306	2	CO_2Me	H	OH	H	H
307	3	CO_2Me	H	OH	H	H
308	4	CO_2Me	H	OH	H	H
309	1	CO_2tBu	H	OH	H	H
310	2	CO_2tBu	H	OH	H	H
311	3	CO_2tBu	H	OH	H	H
312	4	CO_2tBu	H	OH	H	H
313	1	CONHMe	H	OH	H	H
314	2	CONHMe	H	OH	H	H
315	3	CONHMe	H	OH	H	H

[2969]

316	4	CONHMe	H	OH	H	H
317	1	SO_2Me	H	OH	H	H
318	2	SO_2Me	H	OH	H	H
319	3	SO_2Me	H	OH	H	H
320	4	SO_2Me	H	OH	H	H
321	1	SO_2NH_2	H	OH	H	H
322	2	SO_2NH_2	H	OH	H	H
323	3	SO_2NH_2	H	OH	H	H
324	4	SO_2NH_2	H	OH	H	H
325	1	H	H	OMe	H	H
326	2	H	H	OMe	H	H
327	3	H	H	OMe	H	H
328	4	H	H	OMe	H	H
329	1	Me	H	OMe	H	H
330	2	Me	H	OMe	H	H
331	3	Me	H	OMe	H	H
332	4	Me	H	OMe	H	H
333	1	CH_2Ph	H	OMe	H	H
334	2	CH_2Ph	H	OMe	H	H
335	3	CH_2Ph	H	OMe	H	H
336	4	CH_2Ph	H	OMe	H	H
337	1	COMe	H	OMe	H	H
338	2	COMe	H	OMe	H	H
339	3	COMe	H	OMe	H	H
340	4	COMe	H	OMe	H	H
341	1	CO_2Me	H	OMe	H	H
342	2	CO_2Me	H	OMe	H	H
343	3	CO_2Me	H	OMe	H	H
344	4	CO_2Me	H	OMe	H	H
345	1	CO_2tBu	H	OMe	H	H

346	2	CO_2tBu	H	OMe	H	H
347	3	CO_2tBu	H	OMe	H	H
348	4	CO_2tBu	H	OMe	H	H
349	1	CONHMe	H	OMe	H	H
350	2	CONHMe	H	OMe	H	H
351	3	CONHMe	H	OMe	H	H
352	4	CONHMe	H	OMe	H	H
353	1	SO_2Me	H	OMe	H	H
354	2	SO_2Me	H	OMe	H	H
355	3	SO_2Me	H	OMe	H	H
356	4	SO_2Me	H	OMe	H	H
357	1	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
358	2	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
359	3	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
360	4	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
361	1	H	H	Me	H	H
362	2	H	H	Me	H	H
363	3	H	H	Me	H	H
364	4	H	H	Me	H	H
365	1	Me	H	Me	H	H
366	2	Me	H	Me	H	H
367	3	Me	H	Me	H	H
368	4	Me	H	Me	H	H
369	1	CH_2Ph	H	Me	H	H
370	2	CH_2Ph	H	Me	H	H
371	3	CH_2Ph	H	Me	H	H
372	4	CH_2Ph	H	Me	H	H
373	1	COMe	H	Me	H	H
374	2	COMe	H	Me	H	H
375	3	COMe	H	Me	H	H

[2970]

[2971]

376	4	COMe	H	Me	H	H
377	1	CO_2Me	H	Me	H	H
378	2	CO_2Me	H	Me	H	H
379	3	CO_2Me	H	Me	H	H
380	4	CO_2Me	H	Me	H	H
381	1	CO_2tBu	H	Me	H	H
382	2	CO_2tBu	H	Me	H	H
383	3	CO_2tBu	H	Me	H	H
384	4	CO_2tBu	H	Me	H	H
385	1	CONHMe	H	Me	H	H
386	2	CONHMe	H	Me	H	H
387	3	CONHMe	H	Me	H	H
388	4	CONHMe	H	Me	H	H
389	1	SO_2Me	H	Me	H	H
390	2	SO_2Me	H	Me	H	H
391	3	SO_2Me	H	Me	H	H
392	4	SO_2Me	H	Me	H	H
393	1	SO_2NH_2	H	Me	H	H
394	2	SO_2NH_2	H	Me	H	H
395	3	SO_2NH_2	H	Me	H	H
396	4	SO_2NH_2	H	Me	H	H
397	1	H	H	CF_3	H	H
398	2	H	H	CF_3	H	H
399	3	H	H	CF_3	H	H
400	4	H	H	CF_3	H	H
401	1	Me	H	CF_3	H	H
402	2	Me	H	CF_3	H	H
403	3	Me	H	CF_3	H	H
404	4	Me	H	CF_3	H	H
405	1	CH_2Ph	H	CF_3	H	H

[2972]

406	2	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
407	3	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
408	4	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
409	1	COMe	H	CF_3	H	H
410	2	COMe	H	CF_3	H	H
411	3	COMe	H	CF_3	H	H
412	4	COMe	H	CF_3	H	H
413	1	CO_2Me	H	CF_3	H	H
414	2	CO_2Me	H	CF_3	H	H
415	3	CO_2Me	H	CF_3	H	H
416	4	CO_2Me	H	CF_3	H	H
417	1	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
418	2	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
419	3	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
420	4	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
421	1	CONHMe	H	CF_3	H	H
422	2	CONHMe	H	CF_3	H	H
423	3	CONHMe	H	CF_3	H	H
424	4	CONHMe	H	CF_3	H	H
425	1	SO_2Me	H	CF_3	H	H
426	2	SO_2Me	H	CF_3	H	H
427	3	SO_2Me	H	CF_3	H	H
428	4	SO_2Me	H	CF_3	H	H
429	1	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
430	2	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
431	3	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
432	4	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
433	1	H	H	F	H	H
434	2	H	H	F	H	H
435	3	H	H	F	H	H

[2973]

436	3	H	H	F	H	H
437	1	Me	H	F	H	H
438	2	Me	H	F	H	H
439	3	Me	H	F	H	H
440	4	Me	H	F	H	H
441	1	CH_2Ph	H	F	H	H
442	2	CH_2Ph	H	F	H	H
443	3	CH_2Ph	H	F	H	H
444	4	CH_2Ph	H	F	H	H
445	1	COMe	H	F	H	H
446	2	COMe	H	F	H	H
447	3	COMe	H	F	H	H
448	4	COMe	H	F	H	H
449	1	CO_2Me	H	F	H	H
450	2	CO_2Me	H	F	H	H
451	3	CO_2Me	H	F	H	H
452	4	CO_2Me	H	F	H	H
453	1	CO_2tBu	H	F	H	H
454	2	CO_2tBu	H	F	H	H
455	3	CO_2tBu	H	F	H	H
456	4	CO_2tBu	H	F	H	H
457	1	CONHMe	H	F	H	H
458	2	CONHMe	H	F	H	H
459	3	CONHMe	H	F	H	H
460	4	CONHMe	H	F	H	H
461	1	SO_2Me	H	F	H	H
462	2	SO_2Me	H	F	H	H
463	3	SO_2Me	H	F	H	H
464	4	SO_2Me	H	F	H	H
465	1	SO_2NH_2	H	F	H	H

[2974]

466	2	SO_2NH_2	H	F	H	H
467	3	SO_2NH_2	H	F	H	H
468	4	SO_2NH_2	H	F	H	H
469	1	H	H	Cl	H	H
470	2	H	H	Cl	H	H
471	3	H	H	Cl	H	H
472	4	H	H	Cl	H	H
473	1	Me	H	Cl	H	H
474	2	Me	H	Cl	H	H
475	3	Me	H	Cl	H	H
476	4	Me	H	Cl	H	H
477	1	CH_2Ph	H	Cl	H	H
478	2	CH_2Ph	H	Cl	H	H
479	3	CH_2Ph	H	Cl	H	H
480	4	CH_2Ph	H	Cl	H	H
481	1	COMe	H	Cl	H	H
482	2	COMe	H	Cl	H	H
483	3	COMe	H	Cl	H	H
484	4	COMe	H	Cl	H	H
485	1	CO_2Me	H	Cl	H	H
486	2	CO_2Me	H	Cl	H	H
487	3	CO_2Me	H	Cl	H	H
488	4	CO_2Me	H	Cl	H	H
489	1	CO_2tBu	H	Cl	H	H
490	2	CO_2tBu	H	Cl	H	H
491	3	CO_2tBu	H	Cl	H	H
492	4	CO_2tBu	H	Cl	H	H
493	1	CONHMe	H	Cl	H	H
494	2	CONHMe	H	Cl	H	H
495	3	CONHMe	H	Cl	H	H

[2975]

496	4	CONHMe	H	Cl	H	H
497	1	SO_2Me	H	Cl	H	H
498	2	SO_2Me	H	Cl	H	H
499	3	SO_2Me	H	Cl	H	H
500	4	SO_2Me	H	Cl	H	H
501	1	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
502	2	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
503	3	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
504	4	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
505	1	H	H	CN	H	H
506	2	H	H	CN	H	H
507	3	H	H	CN	H	H
508	4	H	H	CN	H	H
509	1	Me	H	CN	H	H
510	2	Me	H	CN	H	H
511	3	Me	H	CN	H	H
512	4	Me	H	CN	H	H
513	1	CH_2Ph	H	CN	H	H
514	2	CH_2Ph	H	CN	H	H
515	3	CH_2Ph	H	CN	H	H
516	4	CH_2Ph	H	CN	H	H
517	1	COMe	H	CN	H	H
518	2	COMe	H	CN	H	H
519	3	COMe	H	CN	H	H
520	4	COMe	H	CN	H	H
521	1	CO_2Me	H	CN	H	H
522	2	CO_2Me	H	CN	H	H
523	3	CO_2Me	H	CN	H	H
524	4	CO_2Me	H	CN	H	H
525	1	CO_2tBu	H	CN	H	H

526	2	CO_2tBu	H	CN	H	H
527	3	CO_2tBu	H	CN	H	H
528	4	CO_2tBu	H	CN	H	H
529	1	CONHMe	H	CN	H	H
530	2	CONHMe	H	CN	H	H
531	3	CONHMe	H	CN	H	H
532	4	CONHMe	H	CN	H	H
533	1	SO_2Me	H	CN	H	H
534	2	SO_2Me	H	CN	H	H
535	3	SO_2Me	H	CN	H	H
536	4	SO_2Me	H	CN	H	H
537	1	SO_2NH_2	H	CN	H	H
538	2	SO_2NH_2	H	CN	H	H
539	3	SO_2NH_2	H	CN	H	H
540	4	SO_2NH_2	H	CN	H	H
541	1	H	OH	H	H	H
542	2	H	OH	H	H	H
543	3	H	OH	H	H	H
544	4	H	OH	H	H	H
545	1	Me	OH	H	H	H
546	2	Me	OH	H	H	H
547	3	Me	OH	H	H	H
548	4	Me	OH	H	H	H
549	1	CH_2Ph	OH	H	H	H
550	2	CH_2Ph	OH	H	H	H
551	3	CH_2Ph	OH	H	H	H
552	4	CH_2Ph	OH	H	H	H
553	1	COMe	OH	H	H	H
554	2	COMe	OH	H	H	H
555	3	COMe	OH	H	H	H

[2976]

[2977]

556	4	COMe	OH	H	H	H
557	1	CO_2Me	OH	H	H	H
558	2	CO_2Me	OH	H	H	H
559	3	CO_2Me	OH	H	H	H
560	4	CO_2Me	OH	H	H	H
561	1	CO_2tBu	OH	H	H	H
562	2	CO_2tBu	OH	H	H	H
563	3	CO_2tBu	OH	H	H	H
564	4	CO_2tBu	OH	H	H	H
565	1	CONHMe	OH	H	H	H
566	2	CONHMe	OH	H	H	H
567	3	CONHMe	OH	H	H	H
568	4	CONHMe	OH	H	H	H
569	1	SO_2Me	OH	H	H	H
570	2	SO_2Me	OH	H	H	H
571	3	SO_2Me	OH	H	H	H
572	4	SO_2Me	OH	H	H	H
573	1	SO_2NH_2	OH	H	H	H
574	2	SO_2NH_2	OH	H	H	H
575	3	SO_2NH_2	OH	H	H	H
576	4	SO_2NH_2	OH	H	H	H
577	1	H	OMe	H	H	H
578	2	H	OMe	H	H	H
579	3	H	OMe	H	H	H
580	4	H	OMe	H	H	H
581	1	Me	OMe	H	H	H
582	2	Me	OMe	H	H	H
583	3	Me	OMe	H	H	H
584	4	Me	OMe	H	H	H
585	1	CH_2Ph	OMe	H	H	H

[2978]

586	2	CH_2Ph	OMe	H	H	H
587	3	CH_2Ph	OMe	H	H	H
588	4	CH_2Ph	OMe	H	H	H
589	1	COMe	OMe	H	H	H
590	2	COMe	OMe	H	H	H
591	3	COMe	OMe	H	H	H
592	4	COMe	OMe	H	H	H
593	1	CO_2Me	OMe	H	H	H
594	2	CO_2Me	OMe	H	H	H
595	3	CO_2Me	OMe	H	H	H
596	4	CO_2Me	OMe	H	H	H
597	1	CO_2tBu	OMe	H	H	H
598	2	CO_2tBu	OMe	H	H	H
599	3	CO_2tBu	OMe	H	H	H
600	4	CO_2tBu	OMe	H	H	H
601	1	CONHMe	OMe	H	H	H
602	2	CONHMe	OMe	H	H	H
603	3	CONHMe	OMe	H	H	H
604	4	CONHMe	OMe	H	H	H
605	1	SO_2Me	OMe	H	H	H
606	2	SO_2Me	OMe	H	H	H
607	3	SO_2Me	OMe	H	H	H
608	4	SO_2Me	OMe	H	H	H
609	1	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
610	2	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
611	3	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
612	4	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
613	1	H	Me	H	H	H
614	2	H	Me	H	H	H
615	3	H	Me	H	H	H

[2979]

616	4	H	Me	H	H	H
617	1	Me	Me	H	H	H
618	2	Me	Me	H	H	H
619	3	Me	Me	H	H	H
620	4	Me	Me	H	H	H
621	1	CH_2Ph	Me	H	H	H
622	2	CH_2Ph	Me	H	H	H
623	3	CH_2Ph	Me	H	H	H
624	4	CH_2Ph	Me	H	H	H
625	1	COMe	Me	H	H	H
626	2	COMe	Me	H	H	H
627	3	COMe	Me	H	H	H
628	4	COMe	Me	H	H	H
629	1	CO_2Me	Me	H	H	H
630	2	CO_2Me	Me	H	H	H
631	3	CO_2Me	Me	H	H	H
632	4	CO_2Me	Me	H	H	H
633	1	CO_2tBu	Me	H	H	H
634	2	CO_2tBu	Me	H	H	H
635	3	CO_2tBu	Me	H	H	H
636	4	CO_2tBu	Me	H	H	H
637	1	CONHMe	Me	H	H	H
638	2	CONHMe	Me	H	H	H
639	3	CONHMe	Me	H	H	H
640	4	CONHMe	Me	H	H	H
641	1	SO_2Me	Me	H	H	H
642	2	SO_2Me	Me	H	H	H
643	3	SO_2Me	Me	H	H	H
644	4	SO_2Me	Me	H	H	H
645	1	SO_2NH_2	Me	H	H	H

[2980]

646	2	SO_2NH_2	Me	H	H	H
647	3	SO_2NH_2	Me	H	H	H
648	4	SO_2NH_2	Me	H	H	H
649	1	H	CF_3	H	H	H
650	2	H	CF_3	H	H	H
651	3	H	CF_3	H	H	H
652	4	H	CF_3	H	H	H
653	1	Me	CF_3	H	H	H
654	2	Me	CF_3	H	H	H
655	3	Me	CF_3	H	H	H
656	4	Me	CF_3	H	H	H
657	1	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
658	2	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
659	3	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
660	4	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
661	1	COMe	CF_3	H	H	H
662	2	COMe	CF_3	H	H	H
663	3	COMe	CF_3	H	H	H
664	4	COMe	CF_3	H	H	H
665	1	CO_2Me	CF_3	H	H	H
666	2	CO_2Me	CF_3	H	H	H
667	3	CO_2Me	CF_3	H	H	H
668	4	CO_2Me	CF_3	H	H	H
669	1	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
670	2	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
671	3	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
672	4	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
673	1	CONHMe	CF_3	H	H	H
674	2	CONHMe	CF_3	H	H	H
675	3	CONHMe	CF_3	H	H	H

[2981]

676	4	CONHMe	CF_3	H	H	H
677	1	SO_2Me	CF_3	H	H	H
678	2	SO_2Me	CF_3	H	H	H
679	3	SO_2Me	CF_3	H	H	H
680	4	SO_2Me	CF_3	H	H	H
681	1	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
682	2	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
683	3	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
684	4	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
685	1	H	F	H	H	H
686	2	H	F	H	H	H
687	3	H	F	H	H	H
688	3	H	F	H	H	H
689	1	Me	F	H	H	H
690	2	Me	F	H	H	H
691	3	Me	F	H	H	H
692	4	Me	F	H	H	H
693	1	CH_2Ph	F	H	H	H
694	2	CH_2Ph	F	H	H	H
695	3	CH_2Ph	F	H	H	H
696	4	CH_2Ph	F	H	H	H
697	1	COMe	F	H	H	H
698	2	COMe	F	H	H	H
699	3	COMe	F	H	H	H
700	4	COMe	F	H	H	H
701	1	CO_2Me	F	H	H	H
702	2	CO_2Me	F	H	H	H
703	3	CO_2Me	F	H	H	H
704	4	CO_2Me	F	H	H	H
705	1	CO_2tBu	F	H	H	H

[2982]

706	2	CO_2tBu	F	H	H	H
707	3	CO_2tBu	F	H	H	H
708	4	CO_2tBu	F	H	H	H
709	1	CONHMe	F	H	H	H
710	2	CONHMe	F	H	H	H
711	3	CONHMe	F	H	H	H
712	4	CONHMe	F	H	H	H
713	1	SO_2Me	F	H	H	H
714	2	SO_2Me	F	H	H	H
715	3	SO_2Me	F	H	H	H
716	4	SO_2Me	F	H	H	H
717	1	SO_2NH_2	F	H	H	H
718	2	SO_2NH_2	F	H	H	H
719	3	SO_2NH_2	F	H	H	H
720	4	SO_2NH_2	F	H	H	H
721	1	H	Cl	H	H	H
722	2	H	Cl	H	H	H
723	3	H	Cl	H	H	H
724	4	H	Cl	H	H	H
725	1	Me	Cl	H	H	H
726	2	Me	Cl	H	H	H
727	3	Me	Cl	H	H	H
728	4	Me	Cl	H	H	H
729	1	CH_2Ph	Cl	H	H	H
730	2	CH_2Ph	Cl	H	H	H
731	3	CH_2Ph	Cl	H	H	H
732	4	CH_2Ph	Cl	H	H	H
733	1	COMe	Cl	H	H	H
734	2	COMe	Cl	H	H	H
735	3	COMe	Cl	H	H	H

[2983]

736	4	COMe	Cl	H	H	H
737	1	CO_2Me	Cl	H	H	H
738	2	CO_2Me	Cl	H	H	H
739	3	CO_2Me	Cl	H	H	H
740	4	CO_2Me	Cl	H	H	H
741	1	CO_2tBu	Cl	H	H	H
742	2	CO_2tBu	Cl	H	H	H
743	3	CO_2tBu	Cl	H	H	H
744	4	CO_2tBu	Cl	H	H	H
745	1	CONHMe	Cl	H	H	H
746	2	CONHMe	Cl	H	H	H
747	3	CONHMe	Cl	H	H	H
748	4	CONHMe	Cl	H	H	H
749	1	SO_2Me	Cl	H	H	H
750	2	SO_2Me	Cl	H	H	H
751	3	SO_2Me	Cl	H	H	H
752	4	SO_2Me	Cl	H	H	H
753	1	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
754	2	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
755	3	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
756	4	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
757	1	H	CN	H	H	H
758	2	H	CN	H	H	H
759	3	H	CN	H	H	H
760	4	H	CN	H	H	H
761	1	Me	CN	H	H	H
762	2	Me	CN	H	H	H
763	3	Me	CN	H	H	H
764	4	Me	CN	H	H	H
765	1	CH_2Ph	CN	H	H	H

[2984]

766	2	CH_2Ph	CN	H	H	H
767	3	CH_2Ph	CN	H	H	H
768	4	CH_2Ph	CN	H	H	H
769	1	COMe	CN	H	H	H
770	2	COMe	CN	H	H	H
771	3	COMe	CN	H	H	H
772	4	COMe	CN	H	H	H
773	1	CO_2Me	CN	H	H	H
774	2	CO_2Me	CN	H	H	H
775	3	CO_2Me	CN	H	H	H
776	4	CO_2Me	CN	H	H	H
777	1	CO_2tBu	CN	H	H	H
778	2	CO_2tBu	CN	H	H	H
779	3	CO_2tBu	CN	H	H	H
780	4	CO_2tBu	CN	H	H	H
781	1	CONHMe	CN	H	H	H
782	2	CONHMe	CN	H	H	H
783	3	CONHMe	CN	H	H	H
784	4	CONHMe	CN	H	H	H
785	1	SO_2Me	CN	H	H	H
786	2	SO_2Me	CN	H	H	H
787	3	SO_2Me	CN	H	H	H
788	4	SO_2Me	CN	H	H	H
789	1	SO_2NH_2	CN	H	H	H
790	2	SO_2NH_2	CN	H	H	H
791	3	SO_2NH_2	CN	H	H	H
792	4	SO_2NH_2	CN	H	H	H
793	1	H	H	H	H	OH
794	2	H	H	H	H	OH
795	3	H	H	H	H	OH

[2985]

796	4	H	H	H	H	OH
797	1	Me	H	H	H	OH
798	2	Me	H	H	H	OH
799	3	Me	H	H	H	OH
800	4	Me	H	H	H	OH
801	1	CH_2Ph	H	H	H	OH
802	2	CH_2Ph	H	H	H	OH
803	3	CH_2Ph	H	H	H	OH
804	4	CH_2Ph	H	H	H	OH
805	1	COMe	H	H	H	OH
806	2	COMe	H	H	H	OH
807	3	COMe	H	H	H	OH
808	4	COMe	H	H	H	OH
809	1	CO_2Me	H	H	H	OH
810	2	CO_2Me	H	H	H	OH
811	3	CO_2Me	H	H	H	OH
812	4	CO_2Me	H	H	H	OH
813	1	CO_2tBu	H	H	H	OH
814	2	CO_2tBu	H	H	H	OH
815	3	CO_2tBu	H	H	H	OH
816	4	CO_2tBu	H	H	H	OH
817	1	CONHMe	H	H	H	OH
818	2	CONHMe	H	H	H	OH
819	3	CONHMe	H	H	H	OH
820	4	CONHMe	H	H	H	OH
821	1	SO_2Me	H	H	H	OH
822	2	SO_2Me	H	H	H	OH
823	3	SO_2Me	H	H	H	OH
824	4	SO_2Me	H	H	H	OH
825	1	SO_2NH_2	H	H	H	OH

[2986]

826	2	SO_2NH_2	H	H	H	OH
827	3	SO_2NH_2	H	H	H	OH
828	4	SO_2NH_2	H	H	H	OH
829	1	H	H	H	H	OMe
830	2	H	H	H	H	OMe
831	3	H	H	H	H	OMe
832	4	H	H	H	H	OMe
833	1	Me	H	H	H	OMe
834	2	Me	H	H	H	OMe
835	3	Me	H	H	H	OMe
836	4	Me	H	H	H	OMe
837	1	CH_2Ph	H	H	H	OMe
838	2	CH_2Ph	H	H	H	OMe
839	3	CH_2Ph	H	H	H	OMe
840	4	CH_2Ph	H	H	H	OMe
841	1	COMe	H	H	H	OMe
842	2	COMe	H	H	H	OMe
843	3	COMe	H	H	H	OMe
844	4	COMe	H	H	H	OMe
845	1	CO_2Me	H	H	H	OMe
846	2	CO_2Me	H	H	H	OMe
847	3	CO_2Me	H	H	H	OMe
848	4	CO_2Me	H	H	H	OMe
849	1	CO_2tBu	H	H	H	OMe
850	2	CO_2tBu	H	H	H	OMe
851	3	CO_2tBu	H	H	H	OMe
852	4	CO_2tBu	H	H	H	OMe
853	1	CONHMe	H	H	H	OMe
854	2	CONHMe	H	H	H	OMe
855	3	CONHMe	H	H	H	OMe

[2987]

856	4	CONHMe	H	H	H	OMe
857	1	SO_2Me	H	H	H	OMe
858	2	SO_2Me	H	H	H	OMe
859	3	SO_2Me	H	H	H	OMe
860	4	SO_2Me	H	H	H	OMe
861	1	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
862	2	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
863	3	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
864	4	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
865	1	H	H	H	H	Me
866	2	H	H	H	H	Me
867	3	H	H	H	H	Me
868	4	H	H	H	H	Me
869	1	Me	H	H	H	Me
870	2	Me	H	H	H	Me
871	3	Me	H	H	H	Me
872	4	Me	H	H	H	Me
873	1	CH_2Ph	H	H	H	Me
874	2	CH_2Ph	H	H	H	Me
875	3	CH_2Ph	H	H	H	Me
876	4	CH_2Ph	H	H	H	Me
877	1	COMe	H	H	H	Me
878	2	COMe	H	H	H	Me
879	3	COMe	H	H	H	Me
880	4	COMe	H	H	H	Me
881	1	CO_2Me	H	H	H	Me
882	2	CO_2Me	H	H	H	Me
883	3	CO_2Me	H	H	H	Me
884	4	CO_2Me	H	H	H	Me
885	1	CO_2tBu	H	H	H	Me

886	2	CO_2tBu	H	H	H	Me
887	3	CO_2tBu	H	H	H	Me
888	4	CO_2tBu	H	H	H	Me
889	1	CONHMe	H	H	H	Me
890	2	CONHMe	H	H	H	Me
891	3	CONHMe	H	H	H	Me
892	4	CONHMe	H	H	H	Me
893	1	SO_2Me	H	H	H	Me
894	2	SO_2Me	H	H	H	Me
895	3	SO_2Me	H	H	H	Me
896	4	SO_2Me	H	H	H	Me
897	1	SO_2NH_2	H	H	H	Me
898	2	SO_2NH_2	H	H	H	Me
899	3	SO_2NH_2	H	H	H	Me
900	4	SO_2NH_2	H	H	H	Me
901	1	H	H	H	H	CF_3
902	2	H	H	H	H	CF_3
903	3	H	H	H	H	CF_3
904	4	H	H	H	H	CF_3
905	1	Me	H	H	H	CF_3
906	2	Me	H	H	H	CF_3
907	3	Me	H	H	H	CF_3
908	4	Me	H	H	H	CF_3
909	1	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
910	2	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
911	3	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
912	4	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
913	1	COMe	H	H	H	CF_3
914	2	COMe	H	H	H	CF_3
915	3	COMe	H	H	H	CF_3

[2988]

[2989]

916	4	COMe	H	H	H	CF_3
917	1	CO_2Me	H	H	H	CF_3
918	2	CO_2Me	H	H	H	CF_3
919	3	CO_2Me	H	H	H	CF_3
920	4	CO_2Me	H	H	H	CF_3
921	1	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
922	2	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
923	3	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
924	4	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
925	1	CONHMe	H	H	H	CF_3
926	2	CONHMe	H	H	H	CF_3
927	3	CONHMe	H	H	H	CF_3
928	4	CONHMe	H	H	H	CF_3
929	1	SO_2Me	H	H	H	CF_3
930	2	SO_2Me	H	H	H	CF_3
931	3	SO_2Me	H	H	H	CF_3
932	4	SO_2Me	H	H	H	CF_3
933	1	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
934	2	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
935	3	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
936	4	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
937	1	H	H	H	H	F
938	2	H	H	H	H	F
939	3	H	H	H	H	F
940	3	H	H	H	H	F
941	1	Me	H	H	H	F
942	2	Me	H	H	H	F
943	3	Me	H	H	H	F
944	4	Me	H	H	H	F
945	1	CH_2Ph	H	H	H	F

[2990]

946	2	CH_2Ph	H	H	H	F
947	3	CH_2Ph	H	H	H	F
948	4	CH_2Ph	H	H	H	F
949	1	COMe	H	H	H	F
950	2	COMe	H	H	H	F
951	3	COMe	H	H	H	F
952	4	COMe	H	H	H	F
953	1	CO_2Me	H	H	H	F
954	2	CO_2Me	H	H	H	F
955	3	CO_2Me	H	H	H	F
956	4	CO_2Me	H	H	H	F
957	1	CO_2tBu	H	H	H	F
958	2	CO_2tBu	H	H	H	F
959	3	CO_2tBu	H	H	H	F
960	4	CO_2tBu	H	H	H	F
961	1	CONHMe	H	H	H	F
962	2	CONHMe	H	H	H	F
963	3	CONHMe	H	H	H	F
964	4	CONHMe	H	H	H	F
965	1	SO_2Me	H	H	H	F
966	2	SO_2Me	H	H	H	F
967	3	SO_2Me	H	H	H	F
968	4	SO_2Me	H	H	H	F
969	1	SO_2NH_2	H	H	H	F
970	2	SO_2NH_2	H	H	H	F
971	3	SO_2NH_2	H	H	H	F
972	4	SO_2NH_2	H	H	H	F
973	1	H	H	H	H	Cl
974	2	H	H	H	H	Cl
975	3	H	H	H	H	Cl

[2991]

976	4	H	H	H	H	Cl
977	1	Me	H	H	H	Cl
978	2	Me	H	H	H	Cl
979	3	Me	H	H	H	Cl
980	4	Me	H	H	H	Cl
981	1	CH_2Ph	H	H	H	Cl
982	2	CH_2Ph	H	H	H	Cl
983	3	CH_2Ph	H	H	H	Cl
984	4	CH_2Ph	H	H	H	Cl
985	1	COMe	H	H	H	Cl
986	2	COMe	H	H	H	Cl
987	3	COMe	H	H	H	Cl
988	4	COMe	H	H	H	Cl
989	1	CO_2Me	H	H	H	Cl
990	2	CO_2Me	H	H	H	Cl
991	3	CO_2Me	H	H	H	Cl
992	4	CO_2Me	H	H	H	Cl
993	1	CO_2tBu	H	H	H	Cl
994	2	CO_2tBu	H	H	H	Cl
995	3	CO_2tBu	H	H	H	Cl
996	4	CO_2tBu	H	H	H	Cl
997	1	CONHMe	H	H	H	Cl
998	2	CONHMe	H	H	H	Cl
999	3	CONHMe	H	H	H	Cl
1000	4	CONHMe	H	H	H	Cl
1001	1	SO_2Me	H	H	H	Cl
1002	2	SO_2Me	H	H	H	Cl
1003	3	SO_2Me	H	H	H	Cl
1004	4	SO_2Me	H	H	H	Cl
1005	1	SO_2NH_2	H	H	H	Cl

[2992]

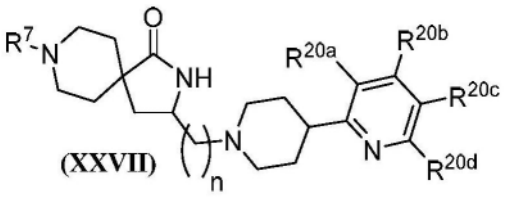
1006	2	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1007	3	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1008	4	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1009	1	H	H	H	H	CN
1010	2	H	H	H	H	CN
1011	3	H	H	H	H	CN
1012	4	H	H	H	H	CN
1013	1	Me	H	H	H	CN
1014	2	Me	H	H	H	CN
1015	3	Me	H	H	H	CN
1016	4	Me	H	H	H	CN
1017	1	CH_2Ph	H	H	H	CN
1018	2	CH_2Ph	H	H	H	CN
1019	3	CH_2Ph	H	H	H	CN
1020	4	CH_2Ph	H	H	H	CN
1021	1	COMe	H	H	H	CN
1022	2	COMe	H	H	H	CN
1023	3	COMe	H	H	H	CN
1024	4	COMe	H	H	H	CN
1025	1	CO_2Me	H	H	H	CN
1026	2	CO_2Me	H	H	H	CN
1027	3	CO_2Me	H	H	H	CN
1028	4	CO_2Me	H	H	H	CN
1029	1	CO_2tBu	H	H	H	CN
1030	2	CO_2tBu	H	H	H	CN
1031	3	CO_2tBu	H	H	H	CN
1032	4	CO_2tBu	H	H	H	CN
1033	1	CONHMe	H	H	H	CN
1034	2	CONHMe	H	H	H	CN
1035	3	CONHMe	H	H	H	CN

[2993]

1036	4	CONHMe	H	H	H	CN
1037	1	SO_2Me	H	H	H	CN
1038	2	SO_2Me	H	H	H	CN
1039	3	SO_2Me	H	H	H	CN
1040	4	SO_2Me	H	H	H	CN
1041	1	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1042	2	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1043	3	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1044	4	SO_2NH_2	H	H	H	CN

[2994] 示例性实施方案包括具有式(XXVII)的化合物

[2995]



(XXVII)

[2996] 或其可药用盐形式,如在下文表21中所定义。

[2997] 表21:

[2998]

条目	n	R^7	R^{20a}	R^{20b}	R^{20c}	R^{20d}
1	1	H	H	H	H	H
2	2	H	H	H	H	H
3	3	H	H	H	H	H
4	4	H	H	H	H	H
5	1	Me	H	H	H	H
6	2	Me	H	H	H	H
7	3	Me	H	H	H	H
8	4	Me	H	H	H	H
9	1	CH_2Ph	H	H	H	H
10	2	CH_2Ph	H	H	H	H
11	3	CH_2Ph	H	H	H	H
12	4	CH_2Ph	H	H	H	H
13	1	COMe	H	H	H	H
14	2	COMe	H	H	H	H

[2999]

15	3	COMe	H	H	H	H
16	4	COMe	H	H	H	H
17	1	CO_2Me	H	H	H	H
18	2	CO_2Me	H	H	H	H
19	3	CO_2Me	H	H	H	H
20	4	CO_2Me	H	H	H	H
21	1	CO_2tBu	H	H	H	H
22	2	CO_2tBu	H	H	H	H
23	3	CO_2tBu	H	H	H	H
24	4	CO_2tBu	H	H	H	H
25	1	CONHMe	H	H	H	H
26	2	CONHMe	H	H	H	H
27	3	CONHMe	H	H	H	H
28	4	CONHMe	H	H	H	H
29	1	SO_2Me	H	H	H	H
30	2	SO_2Me	H	H	H	H
31	3	SO_2Me	H	H	H	H
32	4	SO_2Me	H	H	H	H
33	1	SO_2NH_2	H	H	H	H
34	2	SO_2NH_2	H	H	H	H
35	3	SO_2NH_2	H	H	H	H
36	4	SO_2NH_2	H	H	H	H
37	1	H	H	H	OH	H
38	2	H	H	H	OH	H
39	3	H	H	H	OH	H
40	4	H	H	H	OH	H
41	1	Me	H	H	OH	H
42	2	Me	H	H	OH	H
43	3	Me	H	H	OH	H
44	4	Me	H	H	OH	H

[3000]

45	1	CH_2Ph	H	H	OH	H
46	2	CH_2Ph	H	H	OH	H
47	3	CH_2Ph	H	H	OH	H
48	4	CH_2Ph	H	H	OH	H
49	1	COMe	H	H	OH	H
50	2	COMe	H	H	OH	H
51	3	COMe	H	H	OH	H
52	4	COMe	H	H	OH	H
53	1	CO_2Me	H	H	OH	H
54	2	CO_2Me	H	H	OH	H
55	3	CO_2Me	H	H	OH	H
56	4	CO_2Me	H	H	OH	H
57	1	CO_2tBu	H	H	OH	H
58	2	CO_2tBu	H	H	OH	H
59	3	CO_2tBu	H	H	OH	H
60	4	CO_2tBu	H	H	OH	H
61	1	CONHMe	H	H	OH	H
62	2	CONHMe	H	H	OH	H
63	3	CONHMe	H	H	OH	H
64	4	CONHMe	H	H	OH	H
65	1	SO_2Me	H	H	OH	H
66	2	SO_2Me	H	H	OH	H
67	3	SO_2Me	H	H	OH	H
68	4	SO_2Me	H	H	OH	H
69	1	SO_2NH_2	H	H	OH	H
70	2	SO_2NH_2	H	H	OH	H
71	3	SO_2NH_2	H	H	OH	H
72	4	SO_2NH_2	H	H	OH	H
73	1	H	H	H	OMe	H
74	2	H	H	H	OMe	H

[3001]

75	3	H	H	H	OMe	H
76	4	H	H	H	OMe	H
77	1	Me	H	H	OMe	H
78	2	Me	H	H	OMe	H
79	3	Me	H	H	OMe	H
80	4	Me	H	H	OMe	H
81	1	CH_2Ph	H	H	OMe	H
82	2	CH_2Ph	H	H	OMe	H
83	3	CH_2Ph	H	H	OMe	H
84	4	CH_2Ph	H	H	OMe	H
85	1	COMe	H	H	OMe	H
86	2	COMe	H	H	OMe	H
87	3	COMe	H	H	OMe	H
88	4	COMe	H	H	OMe	H
89	1	CO_2Me	H	H	OMe	H
90	2	CO_2Me	H	H	OMe	H
91	3	CO_2Me	H	H	OMe	H
92	4	CO_2Me	H	H	OMe	H
93	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
94	2	CO_2tBu	H	H	OMe	H
95	3	CO_2tBu	H	H	OMe	H
96	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
97	1	CONHMe	H	H	OMe	H
98	2	CONHMe	H	H	OMe	H
99	3	CONHMe	H	H	OMe	H
100	4	CONHMe	H	H	OMe	H
101	1	SO_2Me	H	H	OMe	H
102	2	SO_2Me	H	H	OMe	H
103	3	SO_2Me	H	H	OMe	H
104	4	SO_2Me	H	H	OMe	H

[3002]

105	1	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
106	2	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
107	3	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
108	4	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
109	1	H	H	H	Me	H
110	2	H	H	H	Me	H
111	3	H	H	H	Me	H
112	4	H	H	H	Me	H
113	1	Me	H	H	Me	H
114	2	Me	H	H	Me	H
115	3	Me	H	H	Me	H
116	4	Me	H	H	Me	H
117	1	CH_2Ph	H	H	Me	H
118	2	CH_2Ph	H	H	Me	H
119	3	CH_2Ph	H	H	Me	H
120	4	CH_2Ph	H	H	Me	H
121	1	COMe	H	H	Me	H
122	2	COMe	H	H	Me	H
123	3	COMe	H	H	Me	H
124	4	COMe	H	H	Me	H
125	1	CO_2Me	H	H	Me	H
126	2	CO_2Me	H	H	Me	H
127	3	CO_2Me	H	H	Me	H
128	4	CO_2Me	H	H	Me	H
129	1	CO_2tBu	H	H	Me	H
130	2	CO_2tBu	H	H	Me	H
131	3	CO_2tBu	H	H	Me	H
132	4	CO_2tBu	H	H	Me	H
133	1	CONHMe	H	H	Me	H
134	2	CONHMe	H	H	Me	H

[3003]

135	3	CONHMe	H	H	Me	H
136	4	CONHMe	H	H	Me	H
137	1	SO_2Me	H	H	Me	H
138	2	SO_2Me	H	H	Me	H
139	3	SO_2Me	H	H	Me	H
140	4	SO_2Me	H	H	Me	H
141	1	SO_2NH_2	H	H	Me	H
142	2	SO_2NH_2	H	H	Me	H
143	3	SO_2NH_2	H	H	Me	H
144	4	SO_2NH_2	H	H	Me	H
145	1	H	H	H	CF_3	H
146	2	H	H	H	CF_3	H
147	3	H	H	H	CF_3	H
148	4	H	H	H	CF_3	H
149	1	Me	H	H	CF_3	H
150	2	Me	H	H	CF_3	H
151	3	Me	H	H	CF_3	H
152	4	Me	H	H	CF_3	H
153	1	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
154	2	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
155	3	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
156	4	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
157	1	COMe	H	H	CF_3	H
158	2	COMe	H	H	CF_3	H
159	3	COMe	H	H	CF_3	H
160	4	COMe	H	H	CF_3	H
161	1	CO_2Me	H	H	CF_3	H
162	2	CO_2Me	H	H	CF_3	H
163	3	CO_2Me	H	H	CF_3	H
164	4	CO_2Me	H	H	CF_3	H

[3004]

165	1	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
166	2	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
167	3	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
168	4	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
169	1	CONHMe	H	H	CF_3	H
170	2	CONHMe	H	H	CF_3	H
171	3	CONHMe	H	H	CF_3	H
172	4	CONHMe	H	H	CF_3	H
173	1	SO_2Me	H	H	CF_3	H
174	2	SO_2Me	H	H	CF_3	H
175	3	SO_2Me	H	H	CF_3	H
176	4	SO_2Me	H	H	CF_3	H
177	1	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
178	2	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
179	3	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
180	4	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
181	1	H	H	H	F	H
182	2	H	H	H	F	H
183	3	H	H	H	F	H
184	4	H	H	H	F	H
185	1	Me	H	H	F	H
186	2	Me	H	H	F	H
187	3	Me	H	H	F	H
188	4	Me	H	H	F	H
189	1	CH_2Ph	H	H	F	H
190	2	CH_2Ph	H	H	F	H
191	3	CH_2Ph	H	H	F	H
192	4	CH_2Ph	H	H	F	H
193	1	COMe	H	H	F	H
194	2	COMe	H	H	F	H

[3005]

195	3	COMe	H	H	F	H
196	4	COMe	H	H	F	H
197	1	CO_2Me	H	H	F	H
198	2	CO_2Me	H	H	F	H
199	3	CO_2Me	H	H	F	H
200	4	CO_2Me	H	H	F	H
201	1	CO_2tBu	H	H	F	H
202	2	CO_2tBu	H	H	F	H
203	3	CO_2tBu	H	H	F	H
204	4	CO_2tBu	H	H	F	H
205	1	CONHMe	H	H	F	H
206	2	CONHMe	H	H	F	H
207	3	CONHMe	H	H	F	H
208	4	CONHMe	H	H	F	H
209	1	SO_2Me	H	H	F	H
210	2	SO_2Me	H	H	F	H
211	3	SO_2Me	H	H	F	H
212	4	SO_2Me	H	H	F	H
213	1	SO_2NH_2	H	H	F	H
214	2	SO_2NH_2	H	H	F	H
215	3	SO_2NH_2	H	H	F	H
216	4	SO_2NH_2	H	H	F	H
217	1	H	H	H	Cl	H
218	2	H	H	H	Cl	H
219	3	H	H	H	Cl	H
220	4	H	H	H	Cl	H
221	1	Me	H	H	Cl	H
222	2	Me	H	H	Cl	H
223	3	Me	H	H	Cl	H
224	4	Me	H	H	Cl	H

[3006]

225	1	CH_2Ph	H	H	Cl	H
226	2	CH_2Ph	H	H	Cl	H
227	3	CH_2Ph	H	H	Cl	H
228	4	CH_2Ph	H	H	Cl	H
229	1	COMe	H	H	Cl	H
230	2	COMe	H	H	Cl	H
231	3	COMe	H	H	Cl	H
232	4	COMe	H	H	Cl	H
233	1	CO_2Me	H	H	Cl	H
234	2	CO_2Me	H	H	Cl	H
235	3	CO_2Me	H	H	Cl	H
236	4	CO_2Me	H	H	Cl	H
237	1	CO_2tBu	H	H	Cl	H
238	2	CO_2tBu	H	H	Cl	H
239	3	CO_2tBu	H	H	Cl	H
240	4	CO_2tBu	H	H	Cl	H
241	1	CONHMe	H	H	Cl	H
242	2	CONHMe	H	H	Cl	H
243	3	CONHMe	H	H	Cl	H
244	4	CONHMe	H	H	Cl	H
245	1	SO_2Me	H	H	Cl	H
246	2	SO_2Me	H	H	Cl	H
247	3	SO_2Me	H	H	Cl	H
248	4	SO_2Me	H	H	Cl	H
249	1	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
250	2	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
251	3	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
252	4	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
253	1	H	H	H	CN	H
254	2	H	H	H	CN	H

[3007]

255	3	H	H	H	CN	H
256	4	H	H	H	CN	H
257	1	Me	H	H	CN	H
258	2	Me	H	H	CN	H
259	3	Me	H	H	CN	H
260	4	Me	H	H	CN	H
261	1	CH_2Ph	H	H	CN	H
262	2	CH_2Ph	H	H	CN	H
263	3	CH_2Ph	H	H	CN	H
264	4	CH_2Ph	H	H	CN	H
265	1	COMe	H	H	CN	H
266	2	COMe	H	H	CN	H
267	3	COMe	H	H	CN	H
268	4	COMe	H	H	CN	H
269	1	CO_2Me	H	H	CN	H
270	2	CO_2Me	H	H	CN	H
271	3	CO_2Me	H	H	CN	H
272	4	CO_2Me	H	H	CN	H
273	1	CO_2tBu	H	H	CN	H
274	2	CO_2tBu	H	H	CN	H
275	3	CO_2tBu	H	H	CN	H
276	4	CO_2tBu	H	H	CN	H
277	1	CONHMe	H	H	CN	H
278	2	CONHMe	H	H	CN	H
279	3	CONHMe	H	H	CN	H
280	4	CONHMe	H	H	CN	H
281	1	SO_2Me	H	H	CN	H
282	2	SO_2Me	H	H	CN	H
283	3	SO_2Me	H	H	CN	H
284	4	SO_2Me	H	H	CN	H

[3008]

285	1	SO_2NH_2	H	H	CN	H
286	2	SO_2NH_2	H	H	CN	H
287	3	SO_2NH_2	H	H	CN	H
288	4	SO_2NH_2	H	H	CN	H
289	1	H	H	OH	H	H
290	2	H	H	OH	H	H
291	3	H	H	OH	H	H
292	4	H	H	OH	H	H
293	1	Me	H	OH	H	H
294	2	Me	H	OH	H	H
295	3	Me	H	OH	H	H
296	4	Me	H	OH	H	H
297	1	CH_2Ph	H	OH	H	H
298	2	CH_2Ph	H	OH	H	H
299	3	CH_2Ph	H	OH	H	H
300	4	CH_2Ph	H	OH	H	H
301	1	COMe	H	OH	H	H
302	2	COMe	H	OH	H	H
303	3	COMe	H	OH	H	H
304	4	COMe	H	OH	H	H
305	1	CO_2Me	H	OH	H	H
306	2	CO_2Me	H	OH	H	H
307	3	CO_2Me	H	OH	H	H
308	4	CO_2Me	H	OH	H	H
309	1	CO_2tBu	H	OH	H	H
310	2	CO_2tBu	H	OH	H	H
311	3	CO_2tBu	H	OH	H	H
312	4	CO_2tBu	H	OH	H	H
313	1	CONHMe	H	OH	H	H
314	2	CONHMe	H	OH	H	H

[3009]

315	3	CONHMe	H	OH	H	H
316	4	CONHMe	H	OH	H	H
317	1	SO_2Me	H	OH	H	H
318	2	SO_2Me	H	OH	H	H
319	3	SO_2Me	H	OH	H	H
320	4	SO_2Me	H	OH	H	H
321	1	SO_2NH_2	H	OH	H	H
322	2	SO_2NH_2	H	OH	H	H
323	3	SO_2NH_2	H	OH	H	H
324	4	SO_2NH_2	H	OH	H	H
325	1	H	H	OMe	H	H
326	2	H	H	OMe	H	H
327	3	H	H	OMe	H	H
328	4	H	H	OMe	H	H
329	1	Me	H	OMe	H	H
330	2	Me	H	OMe	H	H
331	3	Me	H	OMe	H	H
332	4	Me	H	OMe	H	H
333	1	CH_2Ph	H	OMe	H	H
334	2	CH_2Ph	H	OMe	H	H
335	3	CH_2Ph	H	OMe	H	H
336	4	CH_2Ph	H	OMe	H	H
337	1	COMe	H	OMe	H	H
338	2	COMe	H	OMe	H	H
339	3	COMe	H	OMe	H	H
340	4	COMe	H	OMe	H	H
341	1	CO_2Me	H	OMe	H	H
342	2	CO_2Me	H	OMe	H	H
343	3	CO_2Me	H	OMe	H	H
344	4	CO_2Me	H	OMe	H	H

[3010]

345	1	CO_2tBu	H	OMe	H	H
346	2	CO_2tBu	H	OMe	H	H
347	3	CO_2tBu	H	OMe	H	H
348	4	CO_2tBu	H	OMe	H	H
349	1	CONHMe	H	OMe	H	H
350	2	CONHMe	H	OMe	H	H
351	3	CONHMe	H	OMe	H	H
352	4	CONHMe	H	OMe	H	H
353	1	SO_2Me	H	OMe	H	H
354	2	SO_2Me	H	OMe	H	H
355	3	SO_2Me	H	OMe	H	H
356	4	SO_2Me	H	OMe	H	H
357	1	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
358	2	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
359	3	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
360	4	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
361	1	H	H	Me	H	H
362	2	H	H	Me	H	H
363	3	H	H	Me	H	H
364	4	H	H	Me	H	H
365	1	Me	H	Me	H	H
366	2	Me	H	Me	H	H
367	3	Me	H	Me	H	H
368	4	Me	H	Me	H	H
369	1	CH_2Ph	H	Me	H	H
370	2	CH_2Ph	H	Me	H	H
371	3	CH_2Ph	H	Me	H	H
372	4	CH_2Ph	H	Me	H	H
373	1	COMe	H	Me	H	H
374	2	COMe	H	Me	H	H

[3011]

375	3	COMe	H	Me	H	H
376	4	COMe	H	Me	H	H
377	1	CO_2Me	H	Me	H	H
378	2	CO_2Me	H	Me	H	H
379	3	CO_2Me	H	Me	H	H
380	4	CO_2Me	H	Me	H	H
381	1	CO_2tBu	H	Me	H	H
382	2	CO_2tBu	H	Me	H	H
383	3	CO_2tBu	H	Me	H	H
384	4	CO_2tBu	H	Me	H	H
385	1	CONHMe	H	Me	H	H
386	2	CONHMe	H	Me	H	H
387	3	CONHMe	H	Me	H	H
388	4	CONHMe	H	Me	H	H
389	1	SO_2Me	H	Me	H	H
390	2	SO_2Me	H	Me	H	H
391	3	SO_2Me	H	Me	H	H
392	4	SO_2Me	H	Me	H	H
393	1	SO_2NH_2	H	Me	H	H
394	2	SO_2NH_2	H	Me	H	H
395	3	SO_2NH_2	H	Me	H	H
396	4	SO_2NH_2	H	Me	H	H
397	1	H	H	CF_3	H	H
398	2	H	H	CF_3	H	H
399	3	H	H	CF_3	H	H
400	4	H	H	CF_3	H	H
401	1	Me	H	CF_3	H	H
402	2	Me	H	CF_3	H	H
403	3	Me	H	CF_3	H	H
404	4	Me	H	CF_3	H	H

[3012]

405	1	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
406	2	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
407	3	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
408	4	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
409	1	COMe	H	CF_3	H	H
410	2	COMe	H	CF_3	H	H
411	3	COMe	H	CF_3	H	H
412	4	COMe	H	CF_3	H	H
413	1	CO_2Me	H	CF_3	H	H
414	2	CO_2Me	H	CF_3	H	H
415	3	CO_2Me	H	CF_3	H	H
416	4	CO_2Me	H	CF_3	H	H
417	1	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
418	2	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
419	3	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
420	4	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
421	1	CONHMe	H	CF_3	H	H
422	2	CONHMe	H	CF_3	H	H
423	3	CONHMe	H	CF_3	H	H
424	4	CONHMe	H	CF_3	H	H
425	1	SO_2Me	H	CF_3	H	H
426	2	SO_2Me	H	CF_3	H	H
427	3	SO_2Me	H	CF_3	H	H
428	4	SO_2Me	H	CF_3	H	H
429	1	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
430	2	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
431	3	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
432	4	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
433	1	H	H	F	H	H
434	2	H	H	F	H	H

[3013]

435	3	H	H	F	H	H
436	3	H	H	F	H	H
437	1	Me	H	F	H	H
438	2	Me	H	F	H	H
439	3	Me	H	F	H	H
440	4	Me	H	F	H	H
441	1	CH_2Ph	H	F	H	H
442	2	CH_2Ph	H	F	H	H
443	3	CH_2Ph	H	F	H	H
444	4	CH_2Ph	H	F	H	H
445	1	COMe	H	F	H	H
446	2	COMe	H	F	H	H
447	3	COMe	H	F	H	H
448	4	COMe	H	F	H	H
449	1	CO_2Me	H	F	H	H
450	2	CO_2Me	H	F	H	H
451	3	CO_2Me	H	F	H	H
452	4	CO_2Me	H	F	H	H
453	1	CO_2tBu	H	F	H	H
454	2	CO_2tBu	H	F	H	H
455	3	CO_2tBu	H	F	H	H
456	4	CO_2tBu	H	F	H	H
457	1	CONHMe	H	F	H	H
458	2	CONHMe	H	F	H	H
459	3	CONHMe	H	F	H	H
460	4	CONHMe	H	F	H	H
461	1	SO_2Me	H	F	H	H
462	2	SO_2Me	H	F	H	H
463	3	SO_2Me	H	F	H	H
464	4	SO_2Me	H	F	H	H

[3014]

465	1	SO_2NH_2	H	F	H	H
466	2	SO_2NH_2	H	F	H	H
467	3	SO_2NH_2	H	F	H	H
468	4	SO_2NH_2	H	F	H	H
469	1	H	H	Cl	H	H
470	2	H	H	Cl	H	H
471	3	H	H	Cl	H	H
472	4	H	H	Cl	H	H
473	1	Me	H	Cl	H	H
474	2	Me	H	Cl	H	H
475	3	Me	H	Cl	H	H
476	4	Me	H	Cl	H	H
477	1	CH_2Ph	H	Cl	H	H
478	2	CH_2Ph	H	Cl	H	H
479	3	CH_2Ph	H	Cl	H	H
480	4	CH_2Ph	H	Cl	H	H
481	1	COMe	H	Cl	H	H
482	2	COMe	H	Cl	H	H
483	3	COMe	H	Cl	H	H
484	4	COMe	H	Cl	H	H
485	1	CO_2Me	H	Cl	H	H
486	2	CO_2Me	H	Cl	H	H
487	3	CO_2Me	H	Cl	H	H
488	4	CO_2Me	H	Cl	H	H
489	1	CO_2tBu	H	Cl	H	H
490	2	CO_2tBu	H	Cl	H	H
491	3	CO_2tBu	H	Cl	H	H
492	4	CO_2tBu	H	Cl	H	H
493	1	CONHMe	H	Cl	H	H
494	2	CONHMe	H	Cl	H	H

[3015]

495	3	CONHMe	H	Cl	H	H
496	4	CONHMe	H	Cl	H	H
497	1	SO_2Me	H	Cl	H	H
498	2	SO_2Me	H	Cl	H	H
499	3	SO_2Me	H	Cl	H	H
500	4	SO_2Me	H	Cl	H	H
501	1	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
502	2	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
503	3	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
504	4	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
505	1	H	H	CN	H	H
506	2	H	H	CN	H	H
507	3	H	H	CN	H	H
508	4	H	H	CN	H	H
509	1	Me	H	CN	H	H
510	2	Me	H	CN	H	H
511	3	Me	H	CN	H	H
512	4	Me	H	CN	H	H
513	1	CH_2Ph	H	CN	H	H
514	2	CH_2Ph	H	CN	H	H
515	3	CH_2Ph	H	CN	H	H
516	4	CH_2Ph	H	CN	H	H
517	1	COMe	H	CN	H	H
518	2	COMe	H	CN	H	H
519	3	COMe	H	CN	H	H
520	4	COMe	H	CN	H	H
521	1	CO_2Me	H	CN	H	H
522	2	CO_2Me	H	CN	H	H
523	3	CO_2Me	H	CN	H	H
524	4	CO_2Me	H	CN	H	H

[3016]

525	1	CO_2tBu	H	CN	H	H
526	2	CO_2tBu	H	CN	H	H
527	3	CO_2tBu	H	CN	H	H
528	4	CO_2tBu	H	CN	H	H
529	1	CONHMe	H	CN	H	H
530	2	CONHMe	H	CN	H	H
531	3	CONHMe	H	CN	H	H
532	4	CONHMe	H	CN	H	H
533	1	SO_2Me	H	CN	H	H
534	2	SO_2Me	H	CN	H	H
535	3	SO_2Me	H	CN	H	H
536	4	SO_2Me	H	CN	H	H
537	1	SO_2NH_2	H	CN	H	H
538	2	SO_2NH_2	H	CN	H	H
539	3	SO_2NH_2	H	CN	H	H
540	4	SO_2NH_2	H	CN	H	H
541	1	H	OH	H	H	H
542	2	H	OH	H	H	H
543	3	H	OH	H	H	H
544	4	H	OH	H	H	H
545	1	Me	OH	H	H	H
546	2	Me	OH	H	H	H
547	3	Me	OH	H	H	H
548	4	Me	OH	H	H	H
549	1	CH_2Ph	OH	H	H	H
550	2	CH_2Ph	OH	H	H	H
551	3	CH_2Ph	OH	H	H	H
552	4	CH_2Ph	OH	H	H	H
553	1	COMe	OH	H	H	H
554	2	COMe	OH	H	H	H

[3017]

555	3	COMe	OH	H	H	H
556	4	COMe	OH	H	H	H
557	1	CO_2Me	OH	H	H	H
558	2	CO_2Me	OH	H	H	H
559	3	CO_2Me	OH	H	H	H
560	4	CO_2Me	OH	H	H	H
561	1	CO_2tBu	OH	H	H	H
562	2	CO_2tBu	OH	H	H	H
563	3	CO_2tBu	OH	H	H	H
564	4	CO_2tBu	OH	H	H	H
565	1	CONHMe	OH	H	H	H
566	2	CONHMe	OH	H	H	H
567	3	CONHMe	OH	H	H	H
568	4	CONHMe	OH	H	H	H
569	1	SO_2Me	OH	H	H	H
570	2	SO_2Me	OH	H	H	H
571	3	SO_2Me	OH	H	H	H
572	4	SO_2Me	OH	H	H	H
573	1	SO_2NH_2	OH	H	H	H
574	2	SO_2NH_2	OH	H	H	H
575	3	SO_2NH_2	OH	H	H	H
576	4	SO_2NH_2	OH	H	H	H
577	1	H	OMe	H	H	H
578	2	H	OMe	H	H	H
579	3	H	OMe	H	H	H
580	4	H	OMe	H	H	H
581	1	Me	OMe	H	H	H
582	2	Me	OMe	H	H	H
583	3	Me	OMe	H	H	H
584	4	Me	OMe	H	H	H

[3018]

585	1	CH_2Ph	OMe	H	H	H
586	2	CH_2Ph	OMe	H	H	H
587	3	CH_2Ph	OMe	H	H	H
588	4	CH_2Ph	OMe	H	H	H
589	1	COMe	OMe	H	H	H
590	2	COMe	OMe	H	H	H
591	3	COMe	OMe	H	H	H
592	4	COMe	OMe	H	H	H
593	1	CO_2Me	OMe	H	H	H
594	2	CO_2Me	OMe	H	H	H
595	3	CO_2Me	OMe	H	H	H
596	4	CO_2Me	OMe	H	H	H
597	1	CO_2tBu	OMe	H	H	H
598	2	CO_2tBu	OMe	H	H	H
599	3	CO_2tBu	OMe	H	H	H
600	4	CO_2tBu	OMe	H	H	H
601	1	CONHMe	OMe	H	H	H
602	2	CONHMe	OMe	H	H	H
603	3	CONHMe	OMe	H	H	H
604	4	CONHMe	OMe	H	H	H
605	1	SO_2Me	OMe	H	H	H
606	2	SO_2Me	OMe	H	H	H
607	3	SO_2Me	OMe	H	H	H
608	4	SO_2Me	OMe	H	H	H
609	1	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
610	2	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
611	3	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
612	4	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
613	1	H	Me	H	H	H
614	2	H	Me	H	H	H

[3019]

615	3	H	Me	H	H	H
616	4	H	Me	H	H	H
617	1	Me	Me	H	H	H
618	2	Me	Me	H	H	H
619	3	Me	Me	H	H	H
620	4	Me	Me	H	H	H
621	1	CH_2Ph	Me	H	H	H
622	2	CH_2Ph	Me	H	H	H
623	3	CH_2Ph	Me	H	H	H
624	4	CH_2Ph	Me	H	H	H
625	1	COMe	Me	H	H	H
626	2	COMe	Me	H	H	H
627	3	COMe	Me	H	H	H
628	4	COMe	Me	H	H	H
629	1	CO_2Me	Me	H	H	H
630	2	CO_2Me	Me	H	H	H
631	3	CO_2Me	Me	H	H	H
632	4	CO_2Me	Me	H	H	H
633	1	CO_2tBu	Me	H	H	H
634	2	CO_2tBu	Me	H	H	H
635	3	CO_2tBu	Me	H	H	H
636	4	CO_2tBu	Me	H	H	H
637	1	CONHMe	Me	H	H	H
638	2	CONHMe	Me	H	H	H
639	3	CONHMe	Me	H	H	H
640	4	CONHMe	Me	H	H	H
641	1	SO_2Me	Me	H	H	H
642	2	SO_2Me	Me	H	H	H
643	3	SO_2Me	Me	H	H	H
644	4	SO_2Me	Me	H	H	H

[3020]

645	1	SO_2NH_2	Me	H	H	H
646	2	SO_2NH_2	Me	H	H	H
647	3	SO_2NH_2	Me	H	H	H
648	4	SO_2NH_2	Me	H	H	H
649	1	H	CF_3	H	H	H
650	2	H	CF_3	H	H	H
651	3	H	CF_3	H	H	H
652	4	H	CF_3	H	H	H
653	1	Me	CF_3	H	H	H
654	2	Me	CF_3	H	H	H
655	3	Me	CF_3	H	H	H
656	4	Me	CF_3	H	H	H
657	1	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
658	2	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
659	3	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
660	4	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
661	1	COMe	CF_3	H	H	H
662	2	COMe	CF_3	H	H	H
663	3	COMe	CF_3	H	H	H
664	4	COMe	CF_3	H	H	H
665	1	CO_2Me	CF_3	H	H	H
666	2	CO_2Me	CF_3	H	H	H
667	3	CO_2Me	CF_3	H	H	H
668	4	CO_2Me	CF_3	H	H	H
669	1	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
670	2	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
671	3	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
672	4	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
673	1	CONHMe	CF_3	H	H	H
674	2	CONHMe	CF_3	H	H	H

[3021]

675	3	CONHMe	CF_3	H	H	H
676	4	CONHMe	CF_3	H	H	H
677	1	SO_2Me	CF_3	H	H	H
678	2	SO_2Me	CF_3	H	H	H
679	3	SO_2Me	CF_3	H	H	H
680	4	SO_2Me	CF_3	H	H	H
681	1	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
682	2	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
683	3	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
684	4	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
685	1	H	F	H	H	H
686	2	H	F	H	H	H
687	3	H	F	H	H	H
688	3	H	F	H	H	H
689	1	Me	F	H	H	H
690	2	Me	F	H	H	H
691	3	Me	F	H	H	H
692	4	Me	F	H	H	H
693	1	CH_2Ph	F	H	H	H
694	2	CH_2Ph	F	H	H	H
695	3	CH_2Ph	F	H	H	H
696	4	CH_2Ph	F	H	H	H
697	1	COMe	F	H	H	H
698	2	COMe	F	H	H	H
699	3	COMe	F	H	H	H
700	4	COMe	F	H	H	H
701	1	CO_2Me	F	H	H	H
702	2	CO_2Me	F	H	H	H
703	3	CO_2Me	F	H	H	H
704	4	CO_2Me	F	H	H	H

[3022]

705	1	CO_2tBu	F	H	H	H
706	2	CO_2tBu	F	H	H	H
707	3	CO_2tBu	F	H	H	H
708	4	CO_2tBu	F	H	H	H
709	1	CONHMe	F	H	H	H
710	2	CONHMe	F	H	H	H
711	3	CONHMe	F	H	H	H
712	4	CONHMe	F	H	H	H
713	1	SO_2Me	F	H	H	H
714	2	SO_2Me	F	H	H	H
715	3	SO_2Me	F	H	H	H
716	4	SO_2Me	F	H	H	H
717	1	SO_2NH_2	F	H	H	H
718	2	SO_2NH_2	F	H	H	H
719	3	SO_2NH_2	F	H	H	H
720	4	SO_2NH_2	F	H	H	H
721	1	H	Cl	H	H	H
722	2	H	Cl	H	H	H
723	3	H	Cl	H	H	H
724	4	H	Cl	H	H	H
725	1	Me	Cl	H	H	H
726	2	Me	Cl	H	H	H
727	3	Me	Cl	H	H	H
728	4	Me	Cl	H	H	H
729	1	CH_2Ph	Cl	H	H	H
730	2	CH_2Ph	Cl	H	H	H
731	3	CH_2Ph	Cl	H	H	H
732	4	CH_2Ph	Cl	H	H	H
733	1	COMe	Cl	H	H	H
734	2	COMe	Cl	H	H	H

[3023]

735	3	COMe	Cl	H	H	H
736	4	COMe	Cl	H	H	H
737	1	CO_2Me	Cl	H	H	H
738	2	CO_2Me	Cl	H	H	H
739	3	CO_2Me	Cl	H	H	H
740	4	CO_2Me	Cl	H	H	H
741	1	CO_2tBu	Cl	H	H	H
742	2	CO_2tBu	Cl	H	H	H
743	3	CO_2tBu	Cl	H	H	H
744	4	CO_2tBu	Cl	H	H	H
745	1	CONHMe	Cl	H	H	H
746	2	CONHMe	Cl	H	H	H
747	3	CONHMe	Cl	H	H	H
748	4	CONHMe	Cl	H	H	H
749	1	SO_2Me	Cl	H	H	H
750	2	SO_2Me	Cl	H	H	H
751	3	SO_2Me	Cl	H	H	H
752	4	SO_2Me	Cl	H	H	H
753	1	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
754	2	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
755	3	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
756	4	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
757	1	H	CN	H	H	H
758	2	H	CN	H	H	H
759	3	H	CN	H	H	H
760	4	H	CN	H	H	H
761	1	Me	CN	H	H	H
762	2	Me	CN	H	H	H
763	3	Me	CN	H	H	H
764	4	Me	CN	H	H	H

[3024]

765	1	CH_2Ph	CN	H	H	H
766	2	CH_2Ph	CN	H	H	H
767	3	CH_2Ph	CN	H	H	H
768	4	CH_2Ph	CN	H	H	H
769	1	COMe	CN	H	H	H
770	2	COMe	CN	H	H	H
771	3	COMe	CN	H	H	H
772	4	COMe	CN	H	H	H
773	1	CO_2Me	CN	H	H	H
774	2	CO_2Me	CN	H	H	H
775	3	CO_2Me	CN	H	H	H
776	4	CO_2Me	CN	H	H	H
777	1	CO_2tBu	CN	H	H	H
778	2	CO_2tBu	CN	H	H	H
779	3	CO_2tBu	CN	H	H	H
780	4	CO_2tBu	CN	H	H	H
781	1	CONHMe	CN	H	H	H
782	2	CONHMe	CN	H	H	H
783	3	CONHMe	CN	H	H	H
784	4	CONHMe	CN	H	H	H
785	1	SO_2Me	CN	H	H	H
786	2	SO_2Me	CN	H	H	H
787	3	SO_2Me	CN	H	H	H
788	4	SO_2Me	CN	H	H	H
789	1	SO_2NH_2	CN	H	H	H
790	2	SO_2NH_2	CN	H	H	H
791	3	SO_2NH_2	CN	H	H	H
792	4	SO_2NH_2	CN	H	H	H
793	1	H	H	H	H	OH
794	2	H	H	H	H	OH

[3025]

795	3	H	H	H	H	OH
796	4	H	H	H	H	OH
797	1	Me	H	H	H	OH
798	2	Me	H	H	H	OH
799	3	Me	H	H	H	OH
800	4	Me	H	H	H	OH
801	1	CH_2Ph	H	H	H	OH
802	2	CH_2Ph	H	H	H	OH
803	3	CH_2Ph	H	H	H	OH
804	4	CH_2Ph	H	H	H	OH
805	1	COMe	H	H	H	OH
806	2	COMe	H	H	H	OH
807	3	COMe	H	H	H	OH
808	4	COMe	H	H	H	OH
809	1	CO_2Me	H	H	H	OH
810	2	CO_2Me	H	H	H	OH
811	3	CO_2Me	H	H	H	OH
812	4	CO_2Me	H	H	H	OH
813	1	CO_2tBu	H	H	H	OH
814	2	CO_2tBu	H	H	H	OH
815	3	CO_2tBu	H	H	H	OH
816	4	CO_2tBu	H	H	H	OH
817	1	CONHMe	H	H	H	OH
818	2	CONHMe	H	H	H	OH
819	3	CONHMe	H	H	H	OH
820	4	CONHMe	H	H	H	OH
821	1	SO_2Me	H	H	H	OH
822	2	SO_2Me	H	H	H	OH
823	3	SO_2Me	H	H	H	OH
824	4	SO_2Me	H	H	H	OH

[3026]

825	1	SO_2NH_2	H	H	H	OH
826	2	SO_2NH_2	H	H	H	OH
827	3	SO_2NH_2	H	H	H	OH
828	4	SO_2NH_2	H	H	H	OH
829	1	H	H	H	H	OMe
830	2	H	H	H	H	OMe
831	3	H	H	H	H	OMe
832	4	H	H	H	H	OMe
833	1	Me	H	H	H	OMe
834	2	Me	H	H	H	OMe
835	3	Me	H	H	H	OMe
836	4	Me	H	H	H	OMe
837	1	CH_2Ph	H	H	H	OMe
838	2	CH_2Ph	H	H	H	OMe
839	3	CH_2Ph	H	H	H	OMe
840	4	CH_2Ph	H	H	H	OMe
841	1	COMe	H	H	H	OMe
842	2	COMe	H	H	H	OMe
843	3	COMe	H	H	H	OMe
844	4	COMe	H	H	H	OMe
845	1	CO_2Me	H	H	H	OMe
846	2	CO_2Me	H	H	H	OMe
847	3	CO_2Me	H	H	H	OMe
848	4	CO_2Me	H	H	H	OMe
849	1	CO_2tBu	H	H	H	OMe
850	2	CO_2tBu	H	H	H	OMe
851	3	CO_2tBu	H	H	H	OMe
852	4	CO_2tBu	H	H	H	OMe
853	1	CONHMe	H	H	H	OMe
854	2	CONHMe	H	H	H	OMe

[3027]

855	3	CONHMe	H	H	H	OMe
856	4	CONHMe	H	H	H	OMe
857	1	SO_2Me	H	H	H	OMe
858	2	SO_2Me	H	H	H	OMe
859	3	SO_2Me	H	H	H	OMe
860	4	SO_2Me	H	H	H	OMe
861	1	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
862	2	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
863	3	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
864	4	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
865	1	H	H	H	H	Me
866	2	H	H	H	H	Me
867	3	H	H	H	H	Me
868	4	H	H	H	H	Me
869	1	Me	H	H	H	Me
870	2	Me	H	H	H	Me
871	3	Me	H	H	H	Me
872	4	Me	H	H	H	Me
873	1	CH_2Ph	H	H	H	Me
874	2	CH_2Ph	H	H	H	Me
875	3	CH_2Ph	H	H	H	Me
876	4	CH_2Ph	H	H	H	Me
877	1	COMe	H	H	H	Me
878	2	COMe	H	H	H	Me
879	3	COMe	H	H	H	Me
880	4	COMe	H	H	H	Me
881	1	CO_2Me	H	H	H	Me
882	2	CO_2Me	H	H	H	Me
883	3	CO_2Me	H	H	H	Me
884	4	CO_2Me	H	H	H	Me

[3028]

885	1	CO_2tBu	H	H	H	Me
886	2	CO_2tBu	H	H	H	Me
887	3	CO_2tBu	H	H	H	Me
888	4	CO_2tBu	H	H	H	Me
889	1	CONHMe	H	H	H	Me
890	2	CONHMe	H	H	H	Me
891	3	CONHMe	H	H	H	Me
892	4	CONHMe	H	H	H	Me
893	1	SO_2Me	H	H	H	Me
894	2	SO_2Me	H	H	H	Me
895	3	SO_2Me	H	H	H	Me
896	4	SO_2Me	H	H	H	Me
897	1	SO_2NH_2	H	H	H	Me
898	2	SO_2NH_2	H	H	H	Me
899	3	SO_2NH_2	H	H	H	Me
900	4	SO_2NH_2	H	H	H	Me
901	1	H	H	H	H	CF_3
902	2	H	H	H	H	CF_3
903	3	H	H	H	H	CF_3
904	4	H	H	H	H	CF_3
905	1	Me	H	H	H	CF_3
906	2	Me	H	H	H	CF_3
907	3	Me	H	H	H	CF_3
908	4	Me	H	H	H	CF_3
909	1	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
910	2	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
911	3	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
912	4	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
913	1	COMe	H	H	H	CF_3
914	2	COMe	H	H	H	CF_3

[3029]

915	3	COMe	H	H	H	CF_3
916	4	COMe	H	H	H	CF_3
917	1	CO_2Me	H	H	H	CF_3
918	2	CO_2Me	H	H	H	CF_3
919	3	CO_2Me	H	H	H	CF_3
920	4	CO_2Me	H	H	H	CF_3
921	1	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
922	2	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
923	3	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
924	4	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
925	1	CONHMe	H	H	H	CF_3
926	2	CONHMe	H	H	H	CF_3
927	3	CONHMe	H	H	H	CF_3
928	4	CONHMe	H	H	H	CF_3
929	1	SO_2Me	H	H	H	CF_3
930	2	SO_2Me	H	H	H	CF_3
931	3	SO_2Me	H	H	H	CF_3
932	4	SO_2Me	H	H	H	CF_3
933	1	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
934	2	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
935	3	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
936	4	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
937	1	H	H	H	H	F
938	2	H	H	H	H	F
939	3	H	H	H	H	F
940	3	H	H	H	H	F
941	1	Me	H	H	H	F
942	2	Me	H	H	H	F
943	3	Me	H	H	H	F
944	4	Me	H	H	H	F

[3030]

945	1	CH_2Ph	H	H	H	F
946	2	CH_2Ph	H	H	H	F
947	3	CH_2Ph	H	H	H	F
948	4	CH_2Ph	H	H	H	F
949	1	COMe	H	H	H	F
950	2	COMe	H	H	H	F
951	3	COMe	H	H	H	F
952	4	COMe	H	H	H	F
953	1	CO_2Me	H	H	H	F
954	2	CO_2Me	H	H	H	F
955	3	CO_2Me	H	H	H	F
956	4	CO_2Me	H	H	H	F
957	1	CO_2tBu	H	H	H	F
958	2	CO_2tBu	H	H	H	F
959	3	CO_2tBu	H	H	H	F
960	4	CO_2tBu	H	H	H	F
961	1	CONHMe	H	H	H	F
962	2	CONHMe	H	H	H	F
963	3	CONHMe	H	H	H	F
964	4	CONHMe	H	H	H	F
965	1	SO_2Me	H	H	H	F
966	2	SO_2Me	H	H	H	F
967	3	SO_2Me	H	H	H	F
968	4	SO_2Me	H	H	H	F
969	1	SO_2NH_2	H	H	H	F
970	2	SO_2NH_2	H	H	H	F
971	3	SO_2NH_2	H	H	H	F
972	4	SO_2NH_2	H	H	H	F
973	1	H	H	H	H	Cl
974	2	H	H	H	H	Cl

[3031]

975	3	H	H	H	H	Cl
976	4	H	H	H	H	Cl
977	1	Me	H	H	H	Cl
978	2	Me	H	H	H	Cl
979	3	Me	H	H	H	Cl
980	4	Me	H	H	H	Cl
981	1	CH_2Ph	H	H	H	Cl
982	2	CH_2Ph	H	H	H	Cl
983	3	CH_2Ph	H	H	H	Cl
984	4	CH_2Ph	H	H	H	Cl
985	1	COMe	H	H	H	Cl
986	2	COMe	H	H	H	Cl
987	3	COMe	H	H	H	Cl
988	4	COMe	H	H	H	Cl
989	1	CO_2Me	H	H	H	Cl
990	2	CO_2Me	H	H	H	Cl
991	3	CO_2Me	H	H	H	Cl
992	4	CO_2Me	H	H	H	Cl
993	1	CO_2tBu	H	H	H	Cl
994	2	CO_2tBu	H	H	H	Cl
995	3	CO_2tBu	H	H	H	Cl
996	4	CO_2tBu	H	H	H	Cl
997	1	CONHMe	H	H	H	Cl
998	2	CONHMe	H	H	H	Cl
999	3	CONHMe	H	H	H	Cl
1000	4	CONHMe	H	H	H	Cl
1001	1	SO_2Me	H	H	H	Cl
1002	2	SO_2Me	H	H	H	Cl
1003	3	SO_2Me	H	H	H	Cl
1004	4	SO_2Me	H	H	H	Cl

[3032]

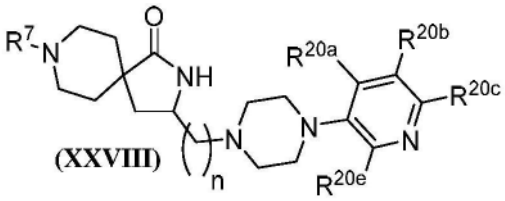
1005	1	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1006	2	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1007	3	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1008	4	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1009	1	H	H	H	H	CN
1010	2	H	H	H	H	CN
1011	3	H	H	H	H	CN
1012	4	H	H	H	H	CN
1013	1	Me	H	H	H	CN
1014	2	Me	H	H	H	CN
1015	3	Me	H	H	H	CN
1016	4	Me	H	H	H	CN
1017	1	CH_2Ph	H	H	H	CN
1018	2	CH_2Ph	H	H	H	CN
1019	3	CH_2Ph	H	H	H	CN
1020	4	CH_2Ph	H	H	H	CN
1021	1	COMe	H	H	H	CN
1022	2	COMe	H	H	H	CN
1023	3	COMe	H	H	H	CN
1024	4	COMe	H	H	H	CN
1025	1	CO_2Me	H	H	H	CN
1026	2	CO_2Me	H	H	H	CN
1027	3	CO_2Me	H	H	H	CN
1028	4	CO_2Me	H	H	H	CN
1029	1	CO_2tBu	H	H	H	CN
1030	2	CO_2tBu	H	H	H	CN
1031	3	CO_2tBu	H	H	H	CN
1032	4	CO_2tBu	H	H	H	CN
1033	1	CONHMe	H	H	H	CN
1034	2	CONHMe	H	H	H	CN

[3033]

1035	3	CONHMe	H	H	H	CN
1036	4	CONHMe	H	H	H	CN
1037	1	SO_2Me	H	H	H	CN
1038	2	SO_2Me	H	H	H	CN
1039	3	SO_2Me	H	H	H	CN
1040	4	SO_2Me	H	H	H	CN
1041	1	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1042	2	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1043	3	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1044	4	SO_2NH_2	H	H	H	CN

[3034] 示例性实施方案包括具有式(XXVIII)的化合物

[3035]



(XXVIII)

[3036] 或其可药用盐形式,如在下文表22中所定义。

[3037] 表22:

[3038]

条目	n	R^7	R^{20a}	R^{20b}	R^{20c}	R^{20e}
1	1	H	H	H	H	H
2	2	H	H	H	H	H
3	3	H	H	H	H	H
4	4	H	H	H	H	H
5	1	Me	H	H	H	H
6	2	Me	H	H	H	H
7	3	Me	H	H	H	H
8	4	Me	H	H	H	H
9	1	CH_2Ph	H	H	H	H
10	2	CH_2Ph	H	H	H	H
11	3	CH_2Ph	H	H	H	H
12	4	CH_2Ph	H	H	H	H
13	1	COMe	H	H	H	H

[3039]

14	2	COMe	H	H	H	H
15	3	COMe	H	H	H	H
16	4	COMe	H	H	H	H
17	1	CO_2Me	H	H	H	H
18	2	CO_2Me	H	H	H	H
19	3	CO_2Me	H	H	H	H
20	4	CO_2Me	H	H	H	H
21	1	CO_2tBu	H	H	H	H
22	2	CO_2tBu	H	H	H	H
23	3	CO_2tBu	H	H	H	H
24	4	CO_2tBu	H	H	H	H
25	1	CONHMe	H	H	H	H
26	2	CONHMe	H	H	H	H
27	3	CONHMe	H	H	H	H
28	4	CONHMe	H	H	H	H
29	1	SO_2Me	H	H	H	H
30	2	SO_2Me	H	H	H	H
31	3	SO_2Me	H	H	H	H
32	4	SO_2Me	H	H	H	H
33	1	SO_2NH_2	H	H	H	H
34	2	SO_2NH_2	H	H	H	H
35	3	SO_2NH_2	H	H	H	H
36	4	SO_2NH_2	H	H	H	H
37	1	H	H	H	OH	H
38	2	H	H	H	OH	H
39	3	H	H	H	OH	H
40	4	H	H	H	OH	H
41	1	Me	H	H	OH	H
42	2	Me	H	H	OH	H
43	3	Me	H	H	OH	H

[3040]

44	4	Me	H	H	OH	H
45	1	CH_2Ph	H	H	OH	H
46	2	CH_2Ph	H	H	OH	H
47	3	CH_2Ph	H	H	OH	H
48	4	CH_2Ph	H	H	OH	H
49	1	COMe	H	H	OH	H
50	2	COMe	H	H	OH	H
51	3	COMe	H	H	OH	H
52	4	COMe	H	H	OH	H
53	1	CO_2Me	H	H	OH	H
54	2	CO_2Me	H	H	OH	H
55	3	CO_2Me	H	H	OH	H
56	4	CO_2Me	H	H	OH	H
57	1	CO_2tBu	H	H	OH	H
58	2	CO_2tBu	H	H	OH	H
59	3	CO_2tBu	H	H	OH	H
60	4	CO_2tBu	H	H	OH	H
61	1	CONHMe	H	H	OH	H
62	2	CONHMe	H	H	OH	H
63	3	CONHMe	H	H	OH	H
64	4	CONHMe	H	H	OH	H
65	1	SO_2Me	H	H	OH	H
66	2	SO_2Me	H	H	OH	H
67	3	SO_2Me	H	H	OH	H
68	4	SO_2Me	H	H	OH	H
69	1	SO_2NH_2	H	H	OH	H
70	2	SO_2NH_2	H	H	OH	H
71	3	SO_2NH_2	H	H	OH	H
72	4	SO_2NH_2	H	H	OH	H
73	1	H	H	H	OMe	H

[3041]

74	2	H	H	H	OMe	H
75	3	H	H	H	OMe	H
76	4	H	H	H	OMe	H
77	1	Me	H	H	OMe	H
78	2	Me	H	H	OMe	H
79	3	Me	H	H	OMe	H
80	4	Me	H	H	OMe	H
81	1	CH_2Ph	H	H	OMe	H
82	2	CH_2Ph	H	H	OMe	H
83	3	CH_2Ph	H	H	OMe	H
84	4	CH_2Ph	H	H	OMe	H
85	1	COMe	H	H	OMe	H
86	2	COMe	H	H	OMe	H
87	3	COMe	H	H	OMe	H
88	4	COMe	H	H	OMe	H
89	1	CO_2Me	H	H	OMe	H
90	2	CO_2Me	H	H	OMe	H
91	3	CO_2Me	H	H	OMe	H
92	4	CO_2Me	H	H	OMe	H
93	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
94	2	CO_2tBu	H	H	OMe	H
95	3	CO_2tBu	H	H	OMe	H
96	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
97	1	CONHMe	H	H	OMe	H
98	2	CONHMe	H	H	OMe	H
99	3	CONHMe	H	H	OMe	H
100	4	CONHMe	H	H	OMe	H
101	1	SO_2Me	H	H	OMe	H
102	2	SO_2Me	H	H	OMe	H
103	3	SO_2Me	H	H	OMe	H

[3042]

104	4	SO_2Me	H	H	OMe	H
105	1	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
106	2	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
107	3	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
108	4	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
109	1	H	H	H	Me	H
110	2	H	H	H	Me	H
111	3	H	H	H	Me	H
112	4	H	H	H	Me	H
113	1	Me	H	H	Me	H
114	2	Me	H	H	Me	H
115	3	Me	H	H	Me	H
116	4	Me	H	H	Me	H
117	1	CH_2Ph	H	H	Me	H
118	2	CH_2Ph	H	H	Me	H
119	3	CH_2Ph	H	H	Me	H
120	4	CH_2Ph	H	H	Me	H
121	1	COMe	H	H	Me	H
122	2	COMe	H	H	Me	H
123	3	COMe	H	H	Me	H
124	4	COMe	H	H	Me	H
125	1	CO_2Me	H	H	Me	H
126	2	CO_2Me	H	H	Me	H
127	3	CO_2Me	H	H	Me	H
128	4	CO_2Me	H	H	Me	H
129	1	CO_2tBu	H	H	Me	H
130	2	CO_2tBu	H	H	Me	H
131	3	CO_2tBu	H	H	Me	H
132	4	CO_2tBu	H	H	Me	H
133	1	CONHMe	H	H	Me	H

[3043]

134	2	CONHMe	H	H	Me	H
135	3	CONHMe	H	H	Me	H
136	4	CONHMe	H	H	Me	H
137	1	SO_2Me	H	H	Me	H
138	2	SO_2Me	H	H	Me	H
139	3	SO_2Me	H	H	Me	H
140	4	SO_2Me	H	H	Me	H
141	1	SO_2NH_2	H	H	Me	H
142	2	SO_2NH_2	H	H	Me	H
143	3	SO_2NH_2	H	H	Me	H
144	4	SO_2NH_2	H	H	Me	H
145	1	H	H	H	CF_3	H
146	2	H	H	H	CF_3	H
147	3	H	H	H	CF_3	H
148	4	H	H	H	CF_3	H
149	1	Me	H	H	CF_3	H
150	2	Me	H	H	CF_3	H
151	3	Me	H	H	CF_3	H
152	4	Me	H	H	CF_3	H
153	1	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
154	2	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
155	3	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
156	4	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
157	1	COMe	H	H	CF_3	H
158	2	COMe	H	H	CF_3	H
159	3	COMe	H	H	CF_3	H
160	4	COMe	H	H	CF_3	H
161	1	CO_2Me	H	H	CF_3	H
162	2	CO_2Me	H	H	CF_3	H
163	3	CO_2Me	H	H	CF_3	H

[3044]

164	4	CO_2Me	H	H	CF_3	H
165	1	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
166	2	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
167	3	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
168	4	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
169	1	CONHMe	H	H	CF_3	H
170	2	CONHMe	H	H	CF_3	H
171	3	CONHMe	H	H	CF_3	H
172	4	CONHMe	H	H	CF_3	H
173	1	SO_2Me	H	H	CF_3	H
174	2	SO_2Me	H	H	CF_3	H
175	3	SO_2Me	H	H	CF_3	H
176	4	SO_2Me	H	H	CF_3	H
177	1	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
178	2	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
179	3	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
180	4	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
181	1	H	H	H	F	H
182	2	H	H	H	F	H
183	3	H	H	H	F	H
184	4	H	H	H	F	H
185	1	Me	H	H	F	H
186	2	Me	H	H	F	H
187	3	Me	H	H	F	H
188	4	Me	H	H	F	H
189	1	CH_2Ph	H	H	F	H
190	2	CH_2Ph	H	H	F	H
191	3	CH_2Ph	H	H	F	H
192	4	CH_2Ph	H	H	F	H
193	1	COMe	H	H	F	H

[3045]

194	2	COMe	H	H	F	H
195	3	COMe	H	H	F	H
196	4	COMe	H	H	F	H
197	1	CO_2Me	H	H	F	H
198	2	CO_2Me	H	H	F	H
199	3	CO_2Me	H	H	F	H
200	4	CO_2Me	H	H	F	H
201	1	CO_2tBu	H	H	F	H
202	2	CO_2tBu	H	H	F	H
203	3	CO_2tBu	H	H	F	H
204	4	CO_2tBu	H	H	F	H
205	1	CONHMe	H	H	F	H
206	2	CONHMe	H	H	F	H
207	3	CONHMe	H	H	F	H
208	4	CONHMe	H	H	F	H
209	1	SO_2Me	H	H	F	H
210	2	SO_2Me	H	H	F	H
211	3	SO_2Me	H	H	F	H
212	4	SO_2Me	H	H	F	H
213	1	SO_2NH_2	H	H	F	H
214	2	SO_2NH_2	H	H	F	H
215	3	SO_2NH_2	H	H	F	H
216	4	SO_2NH_2	H	H	F	H
217	1	H	H	H	Cl	H
218	2	H	H	H	Cl	H
219	3	H	H	H	Cl	H
220	4	H	H	H	Cl	H
221	1	Me	H	H	Cl	H
222	2	Me	H	H	Cl	H
223	3	Me	H	H	Cl	H

[3046]

224	4	Me	H	H	Cl	H
225	1	CH_2Ph	H	H	Cl	H
226	2	CH_2Ph	H	H	Cl	H
227	3	CH_2Ph	H	H	Cl	H
228	4	CH_2Ph	H	H	Cl	H
229	1	COMe	H	H	Cl	H
230	2	COMe	H	H	Cl	H
231	3	COMe	H	H	Cl	H
232	4	COMe	H	H	Cl	H
233	1	CO_2Me	H	H	Cl	H
234	2	CO_2Me	H	H	Cl	H
235	3	CO_2Me	H	H	Cl	H
236	4	CO_2Me	H	H	Cl	H
237	1	CO_2tBu	H	H	Cl	H
238	2	CO_2tBu	H	H	Cl	H
239	3	CO_2tBu	H	H	Cl	H
240	4	CO_2tBu	H	H	Cl	H
241	1	CONHMe	H	H	Cl	H
242	2	CONHMe	H	H	Cl	H
243	3	CONHMe	H	H	Cl	H
244	4	CONHMe	H	H	Cl	H
245	1	SO_2Me	H	H	Cl	H
246	2	SO_2Me	H	H	Cl	H
247	3	SO_2Me	H	H	Cl	H
248	4	SO_2Me	H	H	Cl	H
249	1	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
250	2	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
251	3	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
252	4	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
253	1	H	H	H	CN	H

[3047]

254	2	H	H	H	CN	H
255	3	H	H	H	CN	H
256	4	H	H	H	CN	H
257	1	Me	H	H	CN	H
258	2	Me	H	H	CN	H
259	3	Me	H	H	CN	H
260	4	Me	H	H	CN	H
261	1	CH_2Ph	H	H	CN	H
262	2	CH_2Ph	H	H	CN	H
263	3	CH_2Ph	H	H	CN	H
264	4	CH_2Ph	H	H	CN	H
265	1	COMe	H	H	CN	H
266	2	COMe	H	H	CN	H
267	3	COMe	H	H	CN	H
268	4	COMe	H	H	CN	H
269	1	CO_2Me	H	H	CN	H
270	2	CO_2Me	H	H	CN	H
271	3	CO_2Me	H	H	CN	H
272	4	CO_2Me	H	H	CN	H
273	1	CO_2tBu	H	H	CN	H
274	2	CO_2tBu	H	H	CN	H
275	3	CO_2tBu	H	H	CN	H
276	4	CO_2tBu	H	H	CN	H
277	1	CONHMe	H	H	CN	H
278	2	CONHMe	H	H	CN	H
279	3	CONHMe	H	H	CN	H
280	4	CONHMe	H	H	CN	H
281	1	SO_2Me	H	H	CN	H
282	2	SO_2Me	H	H	CN	H
283	3	SO_2Me	H	H	CN	H

[3048]

284	4	SO_2Me	H	H	CN	H
285	1	SO_2NH_2	H	H	CN	H
286	2	SO_2NH_2	H	H	CN	H
287	3	SO_2NH_2	H	H	CN	H
288	4	SO_2NH_2	H	H	CN	H
289	1	H	H	OH	H	H
290	2	H	H	OH	H	H
291	3	H	H	OH	H	H
292	4	H	H	OH	H	H
293	1	Me	H	OH	H	H
294	2	Me	H	OH	H	H
295	3	Me	H	OH	H	H
296	4	Me	H	OH	H	H
297	1	CH_2Ph	H	OH	H	H
298	2	CH_2Ph	H	OH	H	H
299	3	CH_2Ph	H	OH	H	H
300	4	CH_2Ph	H	OH	H	H
301	1	COMe	H	OH	H	H
302	2	COMe	H	OH	H	H
303	3	COMe	H	OH	H	H
304	4	COMe	H	OH	H	H
305	1	CO_2Me	H	OH	H	H
306	2	CO_2Me	H	OH	H	H
307	3	CO_2Me	H	OH	H	H
308	4	CO_2Me	H	OH	H	H
309	1	CO_2tBu	H	OH	H	H
310	2	CO_2tBu	H	OH	H	H
311	3	CO_2tBu	H	OH	H	H
312	4	CO_2tBu	H	OH	H	H
313	1	CONHMe	H	OH	H	H

[3049]

314	2	CONHMe	H	OH	H	H
315	3	CONHMe	H	OH	H	H
316	4	CONHMe	H	OH	H	H
317	1	SO_2Me	H	OH	H	H
318	2	SO_2Me	H	OH	H	H
319	3	SO_2Me	H	OH	H	H
320	4	SO_2Me	H	OH	H	H
321	1	SO_2NH_2	H	OH	H	H
322	2	SO_2NH_2	H	OH	H	H
323	3	SO_2NH_2	H	OH	H	H
324	4	SO_2NH_2	H	OH	H	H
325	1	H	H	OMe	H	H
326	2	H	H	OMe	H	H
327	3	H	H	OMe	H	H
328	4	H	H	OMe	H	H
329	1	Me	H	OMe	H	H
330	2	Me	H	OMe	H	H
331	3	Me	H	OMe	H	H
332	4	Me	H	OMe	H	H
333	1	CH_2Ph	H	OMe	H	H
334	2	CH_2Ph	H	OMe	H	H
335	3	CH_2Ph	H	OMe	H	H
336	4	CH_2Ph	H	OMe	H	H
337	1	COMe	H	OMe	H	H
338	2	COMe	H	OMe	H	H
339	3	COMe	H	OMe	H	H
340	4	COMe	H	OMe	H	H
341	1	CO_2Me	H	OMe	H	H
342	2	CO_2Me	H	OMe	H	H
343	3	CO_2Me	H	OMe	H	H

[3050]

344	4	CO_2Me	H	OMe	H	H
345	1	CO_2tBu	H	OMe	H	H
346	2	CO_2tBu	H	OMe	H	H
347	3	CO_2tBu	H	OMe	H	H
348	4	CO_2tBu	H	OMe	H	H
349	1	CONHMe	H	OMe	H	H
350	2	CONHMe	H	OMe	H	H
351	3	CONHMe	H	OMe	H	H
352	4	CONHMe	H	OMe	H	H
353	1	SO_2Me	H	OMe	H	H
354	2	SO_2Me	H	OMe	H	H
355	3	SO_2Me	H	OMe	H	H
356	4	SO_2Me	H	OMe	H	H
357	1	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
358	2	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
359	3	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
360	4	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
361	1	H	H	Me	H	H
362	2	H	H	Me	H	H
363	3	H	H	Me	H	H
364	4	H	H	Me	H	H
365	1	Me	H	Me	H	H
366	2	Me	H	Me	H	H
367	3	Me	H	Me	H	H
368	4	Me	H	Me	H	H
369	1	CH_2Ph	H	Me	H	H
370	2	CH_2Ph	H	Me	H	H
371	3	CH_2Ph	H	Me	H	H
372	4	CH_2Ph	H	Me	H	H
373	1	COMe	H	Me	H	H

[3051]

374	2	COMe	H	Me	H	H
375	3	COMe	H	Me	H	H
376	4	COMe	H	Me	H	H
377	1	CO_2Me	H	Me	H	H
378	2	CO_2Me	H	Me	H	H
379	3	CO_2Me	H	Me	H	H
380	4	CO_2Me	H	Me	H	H
381	1	CO_2tBu	H	Me	H	H
382	2	CO_2tBu	H	Me	H	H
383	3	CO_2tBu	H	Me	H	H
384	4	CO_2tBu	H	Me	H	H
385	1	CONHMe	H	Me	H	H
386	2	CONHMe	H	Me	H	H
387	3	CONHMe	H	Me	H	H
388	4	CONHMe	H	Me	H	H
389	1	SO_2Me	H	Me	H	H
390	2	SO_2Me	H	Me	H	H
391	3	SO_2Me	H	Me	H	H
392	4	SO_2Me	H	Me	H	H
393	1	SO_2NH_2	H	Me	H	H
394	2	SO_2NH_2	H	Me	H	H
395	3	SO_2NH_2	H	Me	H	H
396	4	SO_2NH_2	H	Me	H	H
397	1	H	H	CF_3	H	H
398	2	H	H	CF_3	H	H
399	3	H	H	CF_3	H	H
400	4	H	H	CF_3	H	H
401	1	Me	H	CF_3	H	H
402	2	Me	H	CF_3	H	H
403	3	Me	H	CF_3	H	H

[3052]

404	4	Me	H	CF_3	H	H
405	1	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
406	2	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
407	3	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
408	4	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
409	1	COMe	H	CF_3	H	H
410	2	COMe	H	CF_3	H	H
411	3	COMe	H	CF_3	H	H
412	4	COMe	H	CF_3	H	H
413	1	CO_2Me	H	CF_3	H	H
414	2	CO_2Me	H	CF_3	H	H
415	3	CO_2Me	H	CF_3	H	H
416	4	CO_2Me	H	CF_3	H	H
417	1	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
418	2	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
419	3	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
420	4	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
421	1	CONHMe	H	CF_3	H	H
422	2	CONHMe	H	CF_3	H	H
423	3	CONHMe	H	CF_3	H	H
424	4	CONHMe	H	CF_3	H	H
425	1	SO_2Me	H	CF_3	H	H
426	2	SO_2Me	H	CF_3	H	H
427	3	SO_2Me	H	CF_3	H	H
428	4	SO_2Me	H	CF_3	H	H
429	1	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
430	2	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
431	3	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
432	4	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
433	1	H	H	F	H	H

[3053]

434	2	H	H	F	H	H
435	3	H	H	F	H	H
436	3	H	H	F	H	H
437	1	Me	H	F	H	H
438	2	Me	H	F	H	H
439	3	Me	H	F	H	H
440	4	Me	H	F	H	H
441	1	CH_2Ph	H	F	H	H
442	2	CH_2Ph	H	F	H	H
443	3	CH_2Ph	H	F	H	H
444	4	CH_2Ph	H	F	H	H
445	1	COMe	H	F	H	H
446	2	COMe	H	F	H	H
447	3	COMe	H	F	H	H
448	4	COMe	H	F	H	H
449	1	CO_2Me	H	F	H	H
450	2	CO_2Me	H	F	H	H
451	3	CO_2Me	H	F	H	H
452	4	CO_2Me	H	F	H	H
453	1	CO_2tBu	H	F	H	H
454	2	CO_2tBu	H	F	H	H
455	3	CO_2tBu	H	F	H	H
456	4	CO_2tBu	H	F	H	H
457	1	CONHMe	H	F	H	H
458	2	CONHMe	H	F	H	H
459	3	CONHMe	H	F	H	H
460	4	CONHMe	H	F	H	H
461	1	SO_2Me	H	F	H	H
462	2	SO_2Me	H	F	H	H
463	3	SO_2Me	H	F	H	H

[3054]

464	4	SO_2Me	H	F	H	H
465	1	SO_2NH_2	H	F	H	H
466	2	SO_2NH_2	H	F	H	H
467	3	SO_2NH_2	H	F	H	H
468	4	SO_2NH_2	H	F	H	H
469	1	H	H	Cl	H	H
470	2	H	H	Cl	H	H
471	3	H	H	Cl	H	H
472	4	H	H	Cl	H	H
473	1	Me	H	Cl	H	H
474	2	Me	H	Cl	H	H
475	3	Me	H	Cl	H	H
476	4	Me	H	Cl	H	H
477	1	CH_2Ph	H	Cl	H	H
478	2	CH_2Ph	H	Cl	H	H
479	3	CH_2Ph	H	Cl	H	H
480	4	CH_2Ph	H	Cl	H	H
481	1	COMe	H	Cl	H	H
482	2	COMe	H	Cl	H	H
483	3	COMe	H	Cl	H	H
484	4	COMe	H	Cl	H	H
485	1	CO_2Me	H	Cl	H	H
486	2	CO_2Me	H	Cl	H	H
487	3	CO_2Me	H	Cl	H	H
488	4	CO_2Me	H	Cl	H	H
489	1	CO_2tBu	H	Cl	H	H
490	2	CO_2tBu	H	Cl	H	H
491	3	CO_2tBu	H	Cl	H	H
492	4	CO_2tBu	H	Cl	H	H
493	1	CONHMe	H	Cl	H	H

[3055]

494	2	CONHMe	H	Cl	H	H
495	3	CONHMe	H	Cl	H	H
496	4	CONHMe	H	Cl	H	H
497	1	SO_2Me	H	Cl	H	H
498	2	SO_2Me	H	Cl	H	H
499	3	SO_2Me	H	Cl	H	H
500	4	SO_2Me	H	Cl	H	H
501	1	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
502	2	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
503	3	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
504	4	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
505	1	H	H	CN	H	H
506	2	H	H	CN	H	H
507	3	H	H	CN	H	H
508	4	H	H	CN	H	H
509	1	Me	H	CN	H	H
510	2	Me	H	CN	H	H
511	3	Me	H	CN	H	H
512	4	Me	H	CN	H	H
513	1	CH_2Ph	H	CN	H	H
514	2	CH_2Ph	H	CN	H	H
515	3	CH_2Ph	H	CN	H	H
516	4	CH_2Ph	H	CN	H	H
517	1	COMe	H	CN	H	H
518	2	COMe	H	CN	H	H
519	3	COMe	H	CN	H	H
520	4	COMe	H	CN	H	H
521	1	CO_2Me	H	CN	H	H
522	2	CO_2Me	H	CN	H	H
523	3	CO_2Me	H	CN	H	H

[3056]

524	4	CO_2Me	H	CN	H	H
525	1	CO_2tBu	H	CN	H	H
526	2	CO_2tBu	H	CN	H	H
527	3	CO_2tBu	H	CN	H	H
528	4	CO_2tBu	H	CN	H	H
529	1	CONHMe	H	CN	H	H
530	2	CONHMe	H	CN	H	H
531	3	CONHMe	H	CN	H	H
532	4	CONHMe	H	CN	H	H
533	1	SO_2Me	H	CN	H	H
534	2	SO_2Me	H	CN	H	H
535	3	SO_2Me	H	CN	H	H
536	4	SO_2Me	H	CN	H	H
537	1	SO_2NH_2	H	CN	H	H
538	2	SO_2NH_2	H	CN	H	H
539	3	SO_2NH_2	H	CN	H	H
540	4	SO_2NH_2	H	CN	H	H
541	1	H	OH	H	H	H
542	2	H	OH	H	H	H
543	3	H	OH	H	H	H
544	4	H	OH	H	H	H
545	1	Me	OH	H	H	H
546	2	Me	OH	H	H	H
547	3	Me	OH	H	H	H
548	4	Me	OH	H	H	H
549	1	CH_2Ph	OH	H	H	H
550	2	CH_2Ph	OH	H	H	H
551	3	CH_2Ph	OH	H	H	H
552	4	CH_2Ph	OH	H	H	H
553	1	COMe	OH	H	H	H

[3057]

554	2	COMe	OH	H	H	H
555	3	COMe	OH	H	H	H
556	4	COMe	OH	H	H	H
557	1	CO_2Me	OH	H	H	H
558	2	CO_2Me	OH	H	H	H
559	3	CO_2Me	OH	H	H	H
560	4	CO_2Me	OH	H	H	H
561	1	CO_2tBu	OH	H	H	H
562	2	CO_2tBu	OH	H	H	H
563	3	CO_2tBu	OH	H	H	H
564	4	CO_2tBu	OH	H	H	H
565	1	CONHMe	OH	H	H	H
566	2	CONHMe	OH	H	H	H
567	3	CONHMe	OH	H	H	H
568	4	CONHMe	OH	H	H	H
569	1	SO_2Me	OH	H	H	H
570	2	SO_2Me	OH	H	H	H
571	3	SO_2Me	OH	H	H	H
572	4	SO_2Me	OH	H	H	H
573	1	SO_2NH_2	OH	H	H	H
574	2	SO_2NH_2	OH	H	H	H
575	3	SO_2NH_2	OH	H	H	H
576	4	SO_2NH_2	OH	H	H	H
577	1	H	OMe	H	H	H
578	2	H	OMe	H	H	H
579	3	H	OMe	H	H	H
580	4	H	OMe	H	H	H
581	1	Me	OMe	H	H	H
582	2	Me	OMe	H	H	H
583	3	Me	OMe	H	H	H

[3058]

584	4	Me	OMe	H	H	H
585	1	CH_2Ph	OMe	H	H	H
586	2	CH_2Ph	OMe	H	H	H
587	3	CH_2Ph	OMe	H	H	H
588	4	CH_2Ph	OMe	H	H	H
589	1	COMe	OMe	H	H	H
590	2	COMe	OMe	H	H	H
591	3	COMe	OMe	H	H	H
592	4	COMe	OMe	H	H	H
593	1	CO_2Me	OMe	H	H	H
594	2	CO_2Me	OMe	H	H	H
595	3	CO_2Me	OMe	H	H	H
596	4	CO_2Me	OMe	H	H	H
597	1	CO_2tBu	OMe	H	H	H
598	2	CO_2tBu	OMe	H	H	H
599	3	CO_2tBu	OMe	H	H	H
600	4	CO_2tBu	OMe	H	H	H
601	1	CONHMe	OMe	H	H	H
602	2	CONHMe	OMe	H	H	H
603	3	CONHMe	OMe	H	H	H
604	4	CONHMe	OMe	H	H	H
605	1	SO_2Me	OMe	H	H	H
606	2	SO_2Me	OMe	H	H	H
607	3	SO_2Me	OMe	H	H	H
608	4	SO_2Me	OMe	H	H	H
609	1	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
610	2	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
611	3	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
612	4	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
613	1	H	Me	H	H	H

[3059]

614	2	H	Me	H	H	H
615	3	H	Me	H	H	H
616	4	H	Me	H	H	H
617	1	Me	Me	H	H	H
618	2	Me	Me	H	H	H
619	3	Me	Me	H	H	H
620	4	Me	Me	H	H	H
621	1	CH_2Ph	Me	H	H	H
622	2	CH_2Ph	Me	H	H	H
623	3	CH_2Ph	Me	H	H	H
624	4	CH_2Ph	Me	H	H	H
625	1	COMe	Me	H	H	H
626	2	COMe	Me	H	H	H
627	3	COMe	Me	H	H	H
628	4	COMe	Me	H	H	H
629	1	CO_2Me	Me	H	H	H
630	2	CO_2Me	Me	H	H	H
631	3	CO_2Me	Me	H	H	H
632	4	CO_2Me	Me	H	H	H
633	1	CO_2tBu	Me	H	H	H
634	2	CO_2tBu	Me	H	H	H
635	3	CO_2tBu	Me	H	H	H
636	4	CO_2tBu	Me	H	H	H
637	1	CONHMe	Me	H	H	H
638	2	CONHMe	Me	H	H	H
639	3	CONHMe	Me	H	H	H
640	4	CONHMe	Me	H	H	H
641	1	SO_2Me	Me	H	H	H
642	2	SO_2Me	Me	H	H	H
643	3	SO_2Me	Me	H	H	H

[3060]

644	4	SO_2Me	Me	H	H	H
645	1	SO_2NH_2	Me	H	H	H
646	2	SO_2NH_2	Me	H	H	H
647	3	SO_2NH_2	Me	H	H	H
648	4	SO_2NH_2	Me	H	H	H
649	1	H	CF_3	H	H	H
650	2	H	CF_3	H	H	H
651	3	H	CF_3	H	H	H
652	4	H	CF_3	H	H	H
653	1	Me	CF_3	H	H	H
654	2	Me	CF_3	H	H	H
655	3	Me	CF_3	H	H	H
656	4	Me	CF_3	H	H	H
657	1	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
658	2	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
659	3	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
660	4	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
661	1	COMe	CF_3	H	H	H
662	2	COMe	CF_3	H	H	H
663	3	COMe	CF_3	H	H	H
664	4	COMe	CF_3	H	H	H
665	1	CO_2Me	CF_3	H	H	H
666	2	CO_2Me	CF_3	H	H	H
667	3	CO_2Me	CF_3	H	H	H
668	4	CO_2Me	CF_3	H	H	H
669	1	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
670	2	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
671	3	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
672	4	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
673	1	CONHMe	CF_3	H	H	H

[3061]

674	2	CONHMe	CF_3	H	H	H
675	3	CONHMe	CF_3	H	H	H
676	4	CONHMe	CF_3	H	H	H
677	1	SO_2Me	CF_3	H	H	H
678	2	SO_2Me	CF_3	H	H	H
679	3	SO_2Me	CF_3	H	H	H
680	4	SO_2Me	CF_3	H	H	H
681	1	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
682	2	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
683	3	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
684	4	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
685	1	H	F	H	H	H
686	2	H	F	H	H	H
687	3	H	F	H	H	H
688	3	H	F	H	H	H
689	1	Me	F	H	H	H
690	2	Me	F	H	H	H
691	3	Me	F	H	H	H
692	4	Me	F	H	H	H
693	1	CH_2Ph	F	H	H	H
694	2	CH_2Ph	F	H	H	H
695	3	CH_2Ph	F	H	H	H
696	4	CH_2Ph	F	H	H	H
697	1	COMe	F	H	H	H
698	2	COMe	F	H	H	H
699	3	COMe	F	H	H	H
700	4	COMe	F	H	H	H
701	1	CO_2Me	F	H	H	H
702	2	CO_2Me	F	H	H	H
703	3	CO_2Me	F	H	H	H

[3062]

704	4	CO_2Me	F	H	H	H
705	1	CO_2tBu	F	H	H	H
706	2	CO_2tBu	F	H	H	H
707	3	CO_2tBu	F	H	H	H
708	4	CO_2tBu	F	H	H	H
709	1	CONHMe	F	H	H	H
710	2	CONHMe	F	H	H	H
711	3	CONHMe	F	H	H	H
712	4	CONHMe	F	H	H	H
713	1	SO_2Me	F	H	H	H
714	2	SO_2Me	F	H	H	H
715	3	SO_2Me	F	H	H	H
716	4	SO_2Me	F	H	H	H
717	1	SO_2NH_2	F	H	H	H
718	2	SO_2NH_2	F	H	H	H
719	3	SO_2NH_2	F	H	H	H
720	4	SO_2NH_2	F	H	H	H
721	1	H	Cl	H	H	H
722	2	H	Cl	H	H	H
723	3	H	Cl	H	H	H
724	4	H	Cl	H	H	H
725	1	Me	Cl	H	H	H
726	2	Me	Cl	H	H	H
727	3	Me	Cl	H	H	H
728	4	Me	Cl	H	H	H
729	1	CH_2Ph	Cl	H	H	H
730	2	CH_2Ph	Cl	H	H	H
731	3	CH_2Ph	Cl	H	H	H
732	4	CH_2Ph	Cl	H	H	H
733	1	COMe	Cl	H	H	H

[3063]

734	2	COMe	Cl	H	H	H
735	3	COMe	Cl	H	H	H
736	4	COMe	Cl	H	H	H
737	1	CO_2Me	Cl	H	H	H
738	2	CO_2Me	Cl	H	H	H
739	3	CO_2Me	Cl	H	H	H
740	4	CO_2Me	Cl	H	H	H
741	1	CO_2tBu	Cl	H	H	H
742	2	CO_2tBu	Cl	H	H	H
743	3	CO_2tBu	Cl	H	H	H
744	4	CO_2tBu	Cl	H	H	H
745	1	CONHMe	Cl	H	H	H
746	2	CONHMe	Cl	H	H	H
747	3	CONHMe	Cl	H	H	H
748	4	CONHMe	Cl	H	H	H
749	1	SO_2Me	Cl	H	H	H
750	2	SO_2Me	Cl	H	H	H
751	3	SO_2Me	Cl	H	H	H
752	4	SO_2Me	Cl	H	H	H
753	1	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
754	2	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
755	3	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
756	4	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
757	1	H	CN	H	H	H
758	2	H	CN	H	H	H
759	3	H	CN	H	H	H
760	4	H	CN	H	H	H
761	1	Me	CN	H	H	H
762	2	Me	CN	H	H	H
763	3	Me	CN	H	H	H

[3064]

764	4	Me	CN	H	H	H
765	1	CH_2Ph	CN	H	H	H
766	2	CH_2Ph	CN	H	H	H
767	3	CH_2Ph	CN	H	H	H
768	4	CH_2Ph	CN	H	H	H
769	1	COMe	CN	H	H	H
770	2	COMe	CN	H	H	H
771	3	COMe	CN	H	H	H
772	4	COMe	CN	H	H	H
773	1	CO_2Me	CN	H	H	H
774	2	CO_2Me	CN	H	H	H
775	3	CO_2Me	CN	H	H	H
776	4	CO_2Me	CN	H	H	H
777	1	CO_2tBu	CN	H	H	H
778	2	CO_2tBu	CN	H	H	H
779	3	CO_2tBu	CN	H	H	H
780	4	CO_2tBu	CN	H	H	H
781	1	CONHMe	CN	H	H	H
782	2	CONHMe	CN	H	H	H
783	3	CONHMe	CN	H	H	H
784	4	CONHMe	CN	H	H	H
785	1	SO_2Me	CN	H	H	H
786	2	SO_2Me	CN	H	H	H
787	3	SO_2Me	CN	H	H	H
788	4	SO_2Me	CN	H	H	H
789	1	SO_2NH_2	CN	H	H	H
790	2	SO_2NH_2	CN	H	H	H
791	3	SO_2NH_2	CN	H	H	H
792	4	SO_2NH_2	CN	H	H	H
793	1	H	H	H	H	OH

[3065]

794	2	H	H	H	H	OH
795	3	H	H	H	H	OH
796	4	H	H	H	H	OH
797	1	Me	H	H	H	OH
798	2	Me	H	H	H	OH
799	3	Me	H	H	H	OH
800	4	Me	H	H	H	OH
801	1	CH_2Ph	H	H	H	OH
802	2	CH_2Ph	H	H	H	OH
803	3	CH_2Ph	H	H	H	OH
804	4	CH_2Ph	H	H	H	OH
805	1	COMe	H	H	H	OH
806	2	COMe	H	H	H	OH
807	3	COMe	H	H	H	OH
808	4	COMe	H	H	H	OH
809	1	CO_2Me	H	H	H	OH
810	2	CO_2Me	H	H	H	OH
811	3	CO_2Me	H	H	H	OH
812	4	CO_2Me	H	H	H	OH
813	1	CO_2tBu	H	H	H	OH
814	2	CO_2tBu	H	H	H	OH
815	3	CO_2tBu	H	H	H	OH
816	4	CO_2tBu	H	H	H	OH
817	1	CONHMe	H	H	H	OH
818	2	CONHMe	H	H	H	OH
819	3	CONHMe	H	H	H	OH
820	4	CONHMe	H	H	H	OH
821	1	SO_2Me	H	H	H	OH
822	2	SO_2Me	H	H	H	OH
823	3	SO_2Me	H	H	H	OH

[3066]

824	4	SO_2Me	H	H	H	OH
825	1	SO_2NH_2	H	H	H	OH
826	2	SO_2NH_2	H	H	H	OH
827	3	SO_2NH_2	H	H	H	OH
828	4	SO_2NH_2	H	H	H	OH
829	1	H	H	H	H	OMe
830	2	H	H	H	H	OMe
831	3	H	H	H	H	OMe
832	4	H	H	H	H	OMe
833	1	Me	H	H	H	OMe
834	2	Me	H	H	H	OMe
835	3	Me	H	H	H	OMe
836	4	Me	H	H	H	OMe
837	1	CH_2Ph	H	H	H	OMe
838	2	CH_2Ph	H	H	H	OMe
839	3	CH_2Ph	H	H	H	OMe
840	4	CH_2Ph	H	H	H	OMe
841	1	COMe	H	H	H	OMe
842	2	COMe	H	H	H	OMe
843	3	COMe	H	H	H	OMe
844	4	COMe	H	H	H	OMe
845	1	CO_2Me	H	H	H	OMe
846	2	CO_2Me	H	H	H	OMe
847	3	CO_2Me	H	H	H	OMe
848	4	CO_2Me	H	H	H	OMe
849	1	CO_2tBu	H	H	H	OMe
850	2	CO_2tBu	H	H	H	OMe
851	3	CO_2tBu	H	H	H	OMe
852	4	CO_2tBu	H	H	H	OMe
853	1	CONHMe	H	H	H	OMe

[3067]

854	2	CONHMe	H	H	H	OMe
855	3	CONHMe	H	H	H	OMe
856	4	CONHMe	H	H	H	OMe
857	1	SO_2Me	H	H	H	OMe
858	2	SO_2Me	H	H	H	OMe
859	3	SO_2Me	H	H	H	OMe
860	4	SO_2Me	H	H	H	OMe
861	1	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
862	2	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
863	3	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
864	4	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
865	1	H	H	H	H	Me
866	2	H	H	H	H	Me
867	3	H	H	H	H	Me
868	4	H	H	H	H	Me
869	1	Me	H	H	H	Me
870	2	Me	H	H	H	Me
871	3	Me	H	H	H	Me
872	4	Me	H	H	H	Me
873	1	CH_2Ph	H	H	H	Me
874	2	CH_2Ph	H	H	H	Me
875	3	CH_2Ph	H	H	H	Me
876	4	CH_2Ph	H	H	H	Me
877	1	COMe	H	H	H	Me
878	2	COMe	H	H	H	Me
879	3	COMe	H	H	H	Me
880	4	COMe	H	H	H	Me
881	1	CO_2Me	H	H	H	Me
882	2	CO_2Me	H	H	H	Me
883	3	CO_2Me	H	H	H	Me

[3068]

884	4	CO_2Me	H	H	H	Me
885	1	CO_2tBu	H	H	H	Me
886	2	CO_2tBu	H	H	H	Me
887	3	CO_2tBu	H	H	H	Me
888	4	CO_2tBu	H	H	H	Me
889	1	CONHMe	H	H	H	Me
890	2	CONHMe	H	H	H	Me
891	3	CONHMe	H	H	H	Me
892	4	CONHMe	H	H	H	Me
893	1	SO_2Me	H	H	H	Me
894	2	SO_2Me	H	H	H	Me
895	3	SO_2Me	H	H	H	Me
896	4	SO_2Me	H	H	H	Me
897	1	SO_2NH_2	H	H	H	Me
898	2	SO_2NH_2	H	H	H	Me
899	3	SO_2NH_2	H	H	H	Me
900	4	SO_2NH_2	H	H	H	Me
901	1	H	H	H	H	CF_3
902	2	H	H	H	H	CF_3
903	3	H	H	H	H	CF_3
904	4	H	H	H	H	CF_3
905	1	Me	H	H	H	CF_3
906	2	Me	H	H	H	CF_3
907	3	Me	H	H	H	CF_3
908	4	Me	H	H	H	CF_3
909	1	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
910	2	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
911	3	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
912	4	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
913	1	COMe	H	H	H	CF_3

[3069]

914	2	COMe	H	H	H	CF_3
915	3	COMe	H	H	H	CF_3
916	4	COMe	H	H	H	CF_3
917	1	CO_2Me	H	H	H	CF_3
918	2	CO_2Me	H	H	H	CF_3
919	3	CO_2Me	H	H	H	CF_3
920	4	CO_2Me	H	H	H	CF_3
921	1	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
922	2	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
923	3	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
924	4	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
925	1	CONHMe	H	H	H	CF_3
926	2	CONHMe	H	H	H	CF_3
927	3	CONHMe	H	H	H	CF_3
928	4	CONHMe	H	H	H	CF_3
929	1	SO_2Me	H	H	H	CF_3
930	2	SO_2Me	H	H	H	CF_3
931	3	SO_2Me	H	H	H	CF_3
932	4	SO_2Me	H	H	H	CF_3
933	1	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
934	2	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
935	3	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
936	4	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
937	1	H	H	H	H	F
938	2	H	H	H	H	F
939	3	H	H	H	H	F
940	3	H	H	H	H	F
941	1	Me	H	H	H	F
942	2	Me	H	H	H	F
943	3	Me	H	H	H	F

[3070]

944	4	Me	H	H	H	F
945	1	CH_2Ph	H	H	H	F
946	2	CH_2Ph	H	H	H	F
947	3	CH_2Ph	H	H	H	F
948	4	CH_2Ph	H	H	H	F
949	1	COMe	H	H	H	F
950	2	COMe	H	H	H	F
951	3	COMe	H	H	H	F
952	4	COMe	H	H	H	F
953	1	CO_2Me	H	H	H	F
954	2	CO_2Me	H	H	H	F
955	3	CO_2Me	H	H	H	F
956	4	CO_2Me	H	H	H	F
957	1	CO_2tBu	H	H	H	F
958	2	CO_2tBu	H	H	H	F
959	3	CO_2tBu	H	H	H	F
960	4	CO_2tBu	H	H	H	F
961	1	CONHMe	H	H	H	F
962	2	CONHMe	H	H	H	F
963	3	CONHMe	H	H	H	F
964	4	CONHMe	H	H	H	F
965	1	SO_2Me	H	H	H	F
966	2	SO_2Me	H	H	H	F
967	3	SO_2Me	H	H	H	F
968	4	SO_2Me	H	H	H	F
969	1	SO_2NH_2	H	H	H	F
970	2	SO_2NH_2	H	H	H	F
971	3	SO_2NH_2	H	H	H	F
972	4	SO_2NH_2	H	H	H	F
973	1	H	H	H	H	Cl

[3071]

974	2	H	H	H	H	Cl
975	3	H	H	H	H	Cl
976	4	H	H	H	H	Cl
977	1	Me	H	H	H	Cl
978	2	Me	H	H	H	Cl
979	3	Me	H	H	H	Cl
980	4	Me	H	H	H	Cl
981	1	CH_2Ph	H	H	H	Cl
982	2	CH_2Ph	H	H	H	Cl
983	3	CH_2Ph	H	H	H	Cl
984	4	CH_2Ph	H	H	H	Cl
985	1	COMe	H	H	H	Cl
986	2	COMe	H	H	H	Cl
987	3	COMe	H	H	H	Cl
988	4	COMe	H	H	H	Cl
989	1	CO_2Me	H	H	H	Cl
990	2	CO_2Me	H	H	H	Cl
991	3	CO_2Me	H	H	H	Cl
992	4	CO_2Me	H	H	H	Cl
993	1	CO_2tBu	H	H	H	Cl
994	2	CO_2tBu	H	H	H	Cl
995	3	CO_2tBu	H	H	H	Cl
996	4	CO_2tBu	H	H	H	Cl
997	1	CONHMe	H	H	H	Cl
998	2	CONHMe	H	H	H	Cl
999	3	CONHMe	H	H	H	Cl
1000	4	CONHMe	H	H	H	Cl
1001	1	SO_2Me	H	H	H	Cl
1002	2	SO_2Me	H	H	H	Cl
1003	3	SO_2Me	H	H	H	Cl

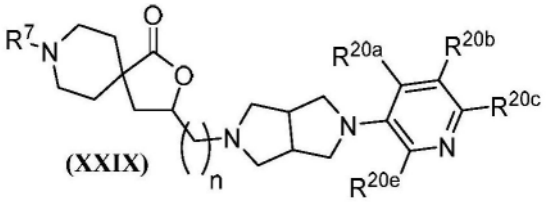
[3072]

1004	4	SO_2Me	H	H	H	Cl
1005	1	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1006	2	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1007	3	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1008	4	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1009	1	H	H	H	H	CN
1010	2	H	H	H	H	CN
1011	3	H	H	H	H	CN
1012	4	H	H	H	H	CN
1013	1	Me	H	H	H	CN
1014	2	Me	H	H	H	CN
1015	3	Me	H	H	H	CN
1016	4	Me	H	H	H	CN
1017	1	CH_2Ph	H	H	H	CN
1018	2	CH_2Ph	H	H	H	CN
1019	3	CH_2Ph	H	H	H	CN
1020	4	CH_2Ph	H	H	H	CN
1021	1	COMe	H	H	H	CN
1022	2	COMe	H	H	H	CN
1023	3	COMe	H	H	H	CN
1024	4	COMe	H	H	H	CN
1025	1	CO_2Me	H	H	H	CN
1026	2	CO_2Me	H	H	H	CN
1027	3	CO_2Me	H	H	H	CN
1028	4	CO_2Me	H	H	H	CN
1029	1	CO_2tBu	H	H	H	CN
1030	2	CO_2tBu	H	H	H	CN
1031	3	CO_2tBu	H	H	H	CN
1032	4	CO_2tBu	H	H	H	CN
1033	1	CONHMe	H	H	H	CN

[3073]

1034	2	CONHMe	H	H	H	CN
1035	3	CONHMe	H	H	H	CN
1036	4	CONHMe	H	H	H	CN
1037	1	SO_2Me	H	H	H	CN
1038	2	SO_2Me	H	H	H	CN
1039	3	SO_2Me	H	H	H	CN
1040	4	SO_2Me	H	H	H	CN
1041	1	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1042	2	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1043	3	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1044	4	SO_2NH_2	H	H	H	CN

[3074] 示例性实施方案包括具有式(XXIX)的化合物

[3075] 

(XXIX)

[3076] 或其可药用盐形式,如在下文表23中所定义。

[3077] 表23:

[3078]

条目	n	R^7	R^{20a}	R^{20b}	R^{20c}	R^{20e}
1	1	H	H	H	H	H
2	2	H	H	H	H	H
3	3	H	H	H	H	H
4	4	H	H	H	H	H
5	1	Me	H	H	H	H
6	2	Me	H	H	H	H
7	3	Me	H	H	H	H
8	4	Me	H	H	H	H
9	1	CH_2Ph	H	H	H	H
10	2	CH_2Ph	H	H	H	H
11	3	CH_2Ph	H	H	H	H
12	4	CH_2Ph	H	H	H	H

[3079]

13	1	COMe	H	H	H	H
14	2	COMe	H	H	H	H
15	3	COMe	H	H	H	H
16	4	COMe	H	H	H	H
17	1	CO_2Me	H	H	H	H
18	2	CO_2Me	H	H	H	H
19	3	CO_2Me	H	H	H	H
20	4	CO_2Me	H	H	H	H
21	1	CO_2tBu	H	H	H	H
22	2	CO_2tBu	H	H	H	H
23	3	CO_2tBu	H	H	H	H
24	4	CO_2tBu	H	H	H	H
25	1	CONHMe	H	H	H	H
26	2	CONHMe	H	H	H	H
27	3	CONHMe	H	H	H	H
28	4	CONHMe	H	H	H	H
29	1	SO_2Me	H	H	H	H
30	2	SO_2Me	H	H	H	H
31	3	SO_2Me	H	H	H	H
32	4	SO_2Me	H	H	H	H
33	1	SO_2NH_2	H	H	H	H
34	2	SO_2NH_2	H	H	H	H
35	3	SO_2NH_2	H	H	H	H
36	4	SO_2NH_2	H	H	H	H
37	1	H	H	H	OH	H
38	2	H	H	H	OH	H
39	3	H	H	H	OH	H
40	4	H	H	H	OH	H
41	1	Me	H	H	OH	H
42	2	Me	H	H	OH	H

[3080]

43	3	Me	H	H	OH	H
44	4	Me	H	H	OH	H
45	1	CH_2Ph	H	H	OH	H
46	2	CH_2Ph	H	H	OH	H
47	3	CH_2Ph	H	H	OH	H
48	4	CH_2Ph	H	H	OH	H
49	1	COMe	H	H	OH	H
50	2	COMe	H	H	OH	H
51	3	COMe	H	H	OH	H
52	4	COMe	H	H	OH	H
53	1	CO_2Me	H	H	OH	H
54	2	CO_2Me	H	H	OH	H
55	3	CO_2Me	H	H	OH	H
56	4	CO_2Me	H	H	OH	H
57	1	CO_2tBu	H	H	OH	H
58	2	CO_2tBu	H	H	OH	H
59	3	CO_2tBu	H	H	OH	H
60	4	CO_2tBu	H	H	OH	H
61	1	CONHMe	H	H	OH	H
62	2	CONHMe	H	H	OH	H
63	3	CONHMe	H	H	OH	H
64	4	CONHMe	H	H	OH	H
65	1	SO_2Me	H	H	OH	H
66	2	SO_2Me	H	H	OH	H
67	3	SO_2Me	H	H	OH	H
68	4	SO_2Me	H	H	OH	H
69	1	SO_2NH_2	H	H	OH	H
70	2	SO_2NH_2	H	H	OH	H
71	3	SO_2NH_2	H	H	OH	H
72	4	SO_2NH_2	H	H	OH	H

[3081]

73	1	H	H	H	OMe	H
74	2	H	H	H	OMe	H
75	3	H	H	H	OMe	H
76	4	H	H	H	OMe	H
77	1	Me	H	H	OMe	H
78	2	Me	H	H	OMe	H
79	3	Me	H	H	OMe	H
80	4	Me	H	H	OMe	H
81	1	CH_2Ph	H	H	OMe	H
82	2	CH_2Ph	H	H	OMe	H
83	3	CH_2Ph	H	H	OMe	H
84	4	CH_2Ph	H	H	OMe	H
85	1	COMe	H	H	OMe	H
86	2	COMe	H	H	OMe	H
87	3	COMe	H	H	OMe	H
88	4	COMe	H	H	OMe	H
89	1	CO_2Me	H	H	OMe	H
90	2	CO_2Me	H	H	OMe	H
91	3	CO_2Me	H	H	OMe	H
92	4	CO_2Me	H	H	OMe	H
93	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
94	2	CO_2tBu	H	H	OMe	H
95	3	CO_2tBu	H	H	OMe	H
96	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
97	1	CONHMe	H	H	OMe	H
98	2	CONHMe	H	H	OMe	H
99	3	CONHMe	H	H	OMe	H
100	4	CONHMe	H	H	OMe	H
101	1	SO_2Me	H	H	OMe	H
102	2	SO_2Me	H	H	OMe	H

[3082]

103	3	SO_2Me	H	H	OMe	H
104	4	SO_2Me	H	H	OMe	H
105	1	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
106	2	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
107	3	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
108	4	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
109	1	H	H	H	Me	H
110	2	H	H	H	Me	H
111	3	H	H	H	Me	H
112	4	H	H	H	Me	H
113	1	Me	H	H	Me	H
114	2	Me	H	H	Me	H
115	3	Me	H	H	Me	H
116	4	Me	H	H	Me	H
117	1	CH_2Ph	H	H	Me	H
118	2	CH_2Ph	H	H	Me	H
119	3	CH_2Ph	H	H	Me	H
120	4	CH_2Ph	H	H	Me	H
121	1	COMe	H	H	Me	H
122	2	COMe	H	H	Me	H
123	3	COMe	H	H	Me	H
124	4	COMe	H	H	Me	H
125	1	CO_2Me	H	H	Me	H
126	2	CO_2Me	H	H	Me	H
127	3	CO_2Me	H	H	Me	H
128	4	CO_2Me	H	H	Me	H
129	1	CO_2tBu	H	H	Me	H
130	2	CO_2tBu	H	H	Me	H
131	3	CO_2tBu	H	H	Me	H
132	4	CO_2tBu	H	H	Me	H

[3083]

133	1	CONHMe	H	H	Me	H
134	2	CONHMe	H	H	Me	H
135	3	CONHMe	H	H	Me	H
136	4	CONHMe	H	H	Me	H
137	1	SO_2Me	H	H	Me	H
138	2	SO_2Me	H	H	Me	H
139	3	SO_2Me	H	H	Me	H
140	4	SO_2Me	H	H	Me	H
141	1	SO_2NH_2	H	H	Me	H
142	2	SO_2NH_2	H	H	Me	H
143	3	SO_2NH_2	H	H	Me	H
144	4	SO_2NH_2	H	H	Me	H
145	1	H	H	H	CF_3	H
146	2	H	H	H	CF_3	H
147	3	H	H	H	CF_3	H
148	4	H	H	H	CF_3	H
149	1	Me	H	H	CF_3	H
150	2	Me	H	H	CF_3	H
151	3	Me	H	H	CF_3	H
152	4	Me	H	H	CF_3	H
153	1	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
154	2	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
155	3	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
156	4	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
157	1	COMe	H	H	CF_3	H
158	2	COMe	H	H	CF_3	H
159	3	COMe	H	H	CF_3	H
160	4	COMe	H	H	CF_3	H
161	1	CO_2Me	H	H	CF_3	H
162	2	CO_2Me	H	H	CF_3	H

[3084]

163	3	CO_2Me	H	H	CF_3	H
164	4	CO_2Me	H	H	CF_3	H
165	1	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
166	2	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
167	3	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
168	4	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
169	1	CONHMe	H	H	CF_3	H
170	2	CONHMe	H	H	CF_3	H
171	3	CONHMe	H	H	CF_3	H
172	4	CONHMe	H	H	CF_3	H
173	1	SO_2Me	H	H	CF_3	H
174	2	SO_2Me	H	H	CF_3	H
175	3	SO_2Me	H	H	CF_3	H
176	4	SO_2Me	H	H	CF_3	H
177	1	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
178	2	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
179	3	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
180	4	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
181	1	H	H	H	F	H
182	2	H	H	H	F	H
183	3	H	H	H	F	H
184	4	H	H	H	F	H
185	1	Me	H	H	F	H
186	2	Me	H	H	F	H
187	3	Me	H	H	F	H
188	4	Me	H	H	F	H
189	1	CH_2Ph	H	H	F	H
190	2	CH_2Ph	H	H	F	H
191	3	CH_2Ph	H	H	F	H
192	4	CH_2Ph	H	H	F	H

[3085]

193	1	COMe	H	H	F	H
194	2	COMe	H	H	F	H
195	3	COMe	H	H	F	H
196	4	COMe	H	H	F	H
197	1	CO_2Me	H	H	F	H
198	2	CO_2Me	H	H	F	H
199	3	CO_2Me	H	H	F	H
200	4	CO_2Me	H	H	F	H
201	1	CO_2tBu	H	H	F	H
202	2	CO_2tBu	H	H	F	H
203	3	CO_2tBu	H	H	F	H
204	4	CO_2tBu	H	H	F	H
205	1	CONHMe	H	H	F	H
206	2	CONHMe	H	H	F	H
207	3	CONHMe	H	H	F	H
208	4	CONHMe	H	H	F	H
209	1	SO_2Me	H	H	F	H
210	2	SO_2Me	H	H	F	H
211	3	SO_2Me	H	H	F	H
212	4	SO_2Me	H	H	F	H
213	1	SO_2NH_2	H	H	F	H
214	2	SO_2NH_2	H	H	F	H
215	3	SO_2NH_2	H	H	F	H
216	4	SO_2NH_2	H	H	F	H
217	1	H	H	H	Cl	H
218	2	H	H	H	Cl	H
219	3	H	H	H	Cl	H
220	4	H	H	H	Cl	H
221	1	Me	H	H	Cl	H
222	2	Me	H	H	Cl	H

[3086]

223	3	Me	H	H	Cl	H
224	4	Me	H	H	Cl	H
225	1	CH_2Ph	H	H	Cl	H
226	2	CH_2Ph	H	H	Cl	H
227	3	CH_2Ph	H	H	Cl	H
228	4	CH_2Ph	H	H	Cl	H
229	1	COMe	H	H	Cl	H
230	2	COMe	H	H	Cl	H
231	3	COMe	H	H	Cl	H
232	4	COMe	H	H	Cl	H
233	1	CO_2Me	H	H	Cl	H
234	2	CO_2Me	H	H	Cl	H
235	3	CO_2Me	H	H	Cl	H
236	4	CO_2Me	H	H	Cl	H
237	1	CO_2tBu	H	H	Cl	H
238	2	CO_2tBu	H	H	Cl	H
239	3	CO_2tBu	H	H	Cl	H
240	4	CO_2tBu	H	H	Cl	H
241	1	CONHMe	H	H	Cl	H
242	2	CONHMe	H	H	Cl	H
243	3	CONHMe	H	H	Cl	H
244	4	CONHMe	H	H	Cl	H
245	1	SO_2Me	H	H	Cl	H
246	2	SO_2Me	H	H	Cl	H
247	3	SO_2Me	H	H	Cl	H
248	4	SO_2Me	H	H	Cl	H
249	1	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
250	2	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
251	3	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
252	4	SO_2NH_2	H	H	Cl	H

[3087]

253	1	H	H	H	CN	H
254	2	H	H	H	CN	H
255	3	H	H	H	CN	H
256	4	H	H	H	CN	H
257	1	Me	H	H	CN	H
258	2	Me	H	H	CN	H
259	3	Me	H	H	CN	H
260	4	Me	H	H	CN	H
261	1	CH_2Ph	H	H	CN	H
262	2	CH_2Ph	H	H	CN	H
263	3	CH_2Ph	H	H	CN	H
264	4	CH_2Ph	H	H	CN	H
265	1	COMe	H	H	CN	H
266	2	COMe	H	H	CN	H
267	3	COMe	H	H	CN	H
268	4	COMe	H	H	CN	H
269	1	CO_2Me	H	H	CN	H
270	2	CO_2Me	H	H	CN	H
271	3	CO_2Me	H	H	CN	H
272	4	CO_2Me	H	H	CN	H
273	1	CO_2tBu	H	H	CN	H
274	2	CO_2tBu	H	H	CN	H
275	3	CO_2tBu	H	H	CN	H
276	4	CO_2tBu	H	H	CN	H
277	1	CONHMe	H	H	CN	H
278	2	CONHMe	H	H	CN	H
279	3	CONHMe	H	H	CN	H
280	4	CONHMe	H	H	CN	H
281	1	SO_2Me	H	H	CN	H
282	2	SO_2Me	H	H	CN	H

[3088]

283	3	SO_2Me	H	H	CN	H
284	4	SO_2Me	H	H	CN	H
285	1	SO_2NH_2	H	H	CN	H
286	2	SO_2NH_2	H	H	CN	H
287	3	SO_2NH_2	H	H	CN	H
288	4	SO_2NH_2	H	H	CN	H
289	1	H	H	OH	H	H
290	2	H	H	OH	H	H
291	3	H	H	OH	H	H
292	4	H	H	OH	H	H
293	1	Me	H	OH	H	H
294	2	Me	H	OH	H	H
295	3	Me	H	OH	H	H
296	4	Me	H	OH	H	H
297	1	CH_2Ph	H	OH	H	H
298	2	CH_2Ph	H	OH	H	H
299	3	CH_2Ph	H	OH	H	H
300	4	CH_2Ph	H	OH	H	H
301	1	COMe	H	OH	H	H
302	2	COMe	H	OH	H	H
303	3	COMe	H	OH	H	H
304	4	COMe	H	OH	H	H
305	1	CO_2Me	H	OH	H	H
306	2	CO_2Me	H	OH	H	H
307	3	CO_2Me	H	OH	H	H
308	4	CO_2Me	H	OH	H	H
309	1	CO_2tBu	H	OH	H	H
310	2	CO_2tBu	H	OH	H	H
311	3	CO_2tBu	H	OH	H	H
312	4	CO_2tBu	H	OH	H	H

[3089]

313	1	CONHMe	H	OH	H	H
314	2	CONHMe	H	OH	H	H
315	3	CONHMe	H	OH	H	H
316	4	CONHMe	H	OH	H	H
317	1	SO_2Me	H	OH	H	H
318	2	SO_2Me	H	OH	H	H
319	3	SO_2Me	H	OH	H	H
320	4	SO_2Me	H	OH	H	H
321	1	SO_2NH_2	H	OH	H	H
322	2	SO_2NH_2	H	OH	H	H
323	3	SO_2NH_2	H	OH	H	H
324	4	SO_2NH_2	H	OH	H	H
325	1	H	H	OMe	H	H
326	2	H	H	OMe	H	H
327	3	H	H	OMe	H	H
328	4	H	H	OMe	H	H
329	1	Me	H	OMe	H	H
330	2	Me	H	OMe	H	H
331	3	Me	H	OMe	H	H
332	4	Me	H	OMe	H	H
333	1	CH_2Ph	H	OMe	H	H
334	2	CH_2Ph	H	OMe	H	H
335	3	CH_2Ph	H	OMe	H	H
336	4	CH_2Ph	H	OMe	H	H
337	1	COMe	H	OMe	H	H
338	2	COMe	H	OMe	H	H
339	3	COMe	H	OMe	H	H
340	4	COMe	H	OMe	H	H
341	1	CO_2Me	H	OMe	H	H
342	2	CO_2Me	H	OMe	H	H

[3090]

343	3	CO_2Me	H	OMe	H	H
344	4	CO_2Me	H	OMe	H	H
345	1	CO_2tBu	H	OMe	H	H
346	2	CO_2tBu	H	OMe	H	H
347	3	CO_2tBu	H	OMe	H	H
348	4	CO_2tBu	H	OMe	H	H
349	1	CONHMe	H	OMe	H	H
350	2	CONHMe	H	OMe	H	H
351	3	CONHMe	H	OMe	H	H
352	4	CONHMe	H	OMe	H	H
353	1	SO_2Me	H	OMe	H	H
354	2	SO_2Me	H	OMe	H	H
355	3	SO_2Me	H	OMe	H	H
356	4	SO_2Me	H	OMe	H	H
357	1	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
358	2	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
359	3	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
360	4	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
361	1	H	H	Me	H	H
362	2	H	H	Me	H	H
363	3	H	H	Me	H	H
364	4	H	H	Me	H	H
365	1	Me	H	Me	H	H
366	2	Me	H	Me	H	H
367	3	Me	H	Me	H	H
368	4	Me	H	Me	H	H
369	1	CH_2Ph	H	Me	H	H
370	2	CH_2Ph	H	Me	H	H
371	3	CH_2Ph	H	Me	H	H
372	4	CH_2Ph	H	Me	H	H

[3091]

373	1	COMe	H	Me	H	H
374	2	COMe	H	Me	H	H
375	3	COMe	H	Me	H	H
376	4	COMe	H	Me	H	H
377	1	CO_2Me	H	Me	H	H
378	2	CO_2Me	H	Me	H	H
379	3	CO_2Me	H	Me	H	H
380	4	CO_2Me	H	Me	H	H
381	1	CO_2tBu	H	Me	H	H
382	2	CO_2tBu	H	Me	H	H
383	3	CO_2tBu	H	Me	H	H
384	4	CO_2tBu	H	Me	H	H
385	1	CONHMe	H	Me	H	H
386	2	CONHMe	H	Me	H	H
387	3	CONHMe	H	Me	H	H
388	4	CONHMe	H	Me	H	H
389	1	SO_2Me	H	Me	H	H
390	2	SO_2Me	H	Me	H	H
391	3	SO_2Me	H	Me	H	H
392	4	SO_2Me	H	Me	H	H
393	1	SO_2NH_2	H	Me	H	H
394	2	SO_2NH_2	H	Me	H	H
395	3	SO_2NH_2	H	Me	H	H
396	4	SO_2NH_2	H	Me	H	H
397	1	H	H	CF_3	H	H
398	2	H	H	CF_3	H	H
399	3	H	H	CF_3	H	H
400	4	H	H	CF_3	H	H
401	1	Me	H	CF_3	H	H
402	2	Me	H	CF_3	H	H

[3092]

403	3	Me	H	CF_3	H	H
404	4	Me	H	CF_3	H	H
405	1	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
406	2	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
407	3	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
408	4	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
409	1	COMe	H	CF_3	H	H
410	2	COMe	H	CF_3	H	H
411	3	COMe	H	CF_3	H	H
412	4	COMe	H	CF_3	H	H
413	1	CO_2Me	H	CF_3	H	H
414	2	CO_2Me	H	CF_3	H	H
415	3	CO_2Me	H	CF_3	H	H
416	4	CO_2Me	H	CF_3	H	H
417	1	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
418	2	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
419	3	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
420	4	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
421	1	CONHMe	H	CF_3	H	H
422	2	CONHMe	H	CF_3	H	H
423	3	CONHMe	H	CF_3	H	H
424	4	CONHMe	H	CF_3	H	H
425	1	SO_2Me	H	CF_3	H	H
426	2	SO_2Me	H	CF_3	H	H
427	3	SO_2Me	H	CF_3	H	H
428	4	SO_2Me	H	CF_3	H	H
429	1	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
430	2	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
431	3	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
432	4	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H

[3093]

433	1	H	H	F	H	H
434	2	H	H	F	H	H
435	3	H	H	F	H	H
436	3	H	H	F	H	H
437	1	Me	H	F	H	H
438	2	Me	H	F	H	H
439	3	Me	H	F	H	H
440	4	Me	H	F	H	H
441	1	CH_2Ph	H	F	H	H
442	2	CH_2Ph	H	F	H	H
443	3	CH_2Ph	H	F	H	H
444	4	CH_2Ph	H	F	H	H
445	1	COMe	H	F	H	H
446	2	COMe	H	F	H	H
447	3	COMe	H	F	H	H
448	4	COMe	H	F	H	H
449	1	CO_2Me	H	F	H	H
450	2	CO_2Me	H	F	H	H
451	3	CO_2Me	H	F	H	H
452	4	CO_2Me	H	F	H	H
453	1	CO_2tBu	H	F	H	H
454	2	CO_2tBu	H	F	H	H
455	3	CO_2tBu	H	F	H	H
456	4	CO_2tBu	H	F	H	H
457	1	CONHMe	H	F	H	H
458	2	CONHMe	H	F	H	H
459	3	CONHMe	H	F	H	H
460	4	CONHMe	H	F	H	H
461	1	SO_2Me	H	F	H	H
462	2	SO_2Me	H	F	H	H

[3094]

463	3	SO_2Me	H	F	H	H
464	4	SO_2Me	H	F	H	H
465	1	SO_2NH_2	H	F	H	H
466	2	SO_2NH_2	H	F	H	H
467	3	SO_2NH_2	H	F	H	H
468	4	SO_2NH_2	H	F	H	H
469	1	H	H	Cl	H	H
470	2	H	H	Cl	H	H
471	3	H	H	Cl	H	H
472	4	H	H	Cl	H	H
473	1	Me	H	Cl	H	H
474	2	Me	H	Cl	H	H
475	3	Me	H	Cl	H	H
476	4	Me	H	Cl	H	H
477	1	CH_2Ph	H	Cl	H	H
478	2	CH_2Ph	H	Cl	H	H
479	3	CH_2Ph	H	Cl	H	H
480	4	CH_2Ph	H	Cl	H	H
481	1	COMe	H	Cl	H	H
482	2	COMe	H	Cl	H	H
483	3	COMe	H	Cl	H	H
484	4	COMe	H	Cl	H	H
485	1	CO_2Me	H	Cl	H	H
486	2	CO_2Me	H	Cl	H	H
487	3	CO_2Me	H	Cl	H	H
488	4	CO_2Me	H	Cl	H	H
489	1	CO_2tBu	H	Cl	H	H
490	2	CO_2tBu	H	Cl	H	H
491	3	CO_2tBu	H	Cl	H	H
492	4	CO_2tBu	H	Cl	H	H

[3095]

493	1	CONHMe	H	Cl	H	H
494	2	CONHMe	H	Cl	H	H
495	3	CONHMe	H	Cl	H	H
496	4	CONHMe	H	Cl	H	H
497	1	SO_2Me	H	Cl	H	H
498	2	SO_2Me	H	Cl	H	H
499	3	SO_2Me	H	Cl	H	H
500	4	SO_2Me	H	Cl	H	H
501	1	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
502	2	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
503	3	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
504	4	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
505	1	H	H	CN	H	H
506	2	H	H	CN	H	H
507	3	H	H	CN	H	H
508	4	H	H	CN	H	H
509	1	Me	H	CN	H	H
510	2	Me	H	CN	H	H
511	3	Me	H	CN	H	H
512	4	Me	H	CN	H	H
513	1	CH_2Ph	H	CN	H	H
514	2	CH_2Ph	H	CN	H	H
515	3	CH_2Ph	H	CN	H	H
516	4	CH_2Ph	H	CN	H	H
517	1	COMe	H	CN	H	H
518	2	COMe	H	CN	H	H
519	3	COMe	H	CN	H	H
520	4	COMe	H	CN	H	H
521	1	CO_2Me	H	CN	H	H
522	2	CO_2Me	H	CN	H	H

[3096]

523	3	CO_2Me	H	CN	H	H
524	4	CO_2Me	H	CN	H	H
525	1	CO_2tBu	H	CN	H	H
526	2	CO_2tBu	H	CN	H	H
527	3	CO_2tBu	H	CN	H	H
528	4	CO_2tBu	H	CN	H	H
529	1	CONHMe	H	CN	H	H
530	2	CONHMe	H	CN	H	H
531	3	CONHMe	H	CN	H	H
532	4	CONHMe	H	CN	H	H
533	1	SO_2Me	H	CN	H	H
534	2	SO_2Me	H	CN	H	H
535	3	SO_2Me	H	CN	H	H
536	4	SO_2Me	H	CN	H	H
537	1	SO_2NH_2	H	CN	H	H
538	2	SO_2NH_2	H	CN	H	H
539	3	SO_2NH_2	H	CN	H	H
540	4	SO_2NH_2	H	CN	H	H
541	1	H	OH	H	H	H
542	2	H	OH	H	H	H
543	3	H	OH	H	H	H
544	4	H	OH	H	H	H
545	1	Me	OH	H	H	H
546	2	Me	OH	H	H	H
547	3	Me	OH	H	H	H
548	4	Me	OH	H	H	H
549	1	CH_2Ph	OH	H	H	H
550	2	CH_2Ph	OH	H	H	H
551	3	CH_2Ph	OH	H	H	H
552	4	CH_2Ph	OH	H	H	H

[3097]

553	1	COMe	OH	H	H	H
554	2	COMe	OH	H	H	H
555	3	COMe	OH	H	H	H
556	4	COMe	OH	H	H	H
557	1	CO_2Me	OH	H	H	H
558	2	CO_2Me	OH	H	H	H
559	3	CO_2Me	OH	H	H	H
560	4	CO_2Me	OH	H	H	H
561	1	CO_2tBu	OH	H	H	H
562	2	CO_2tBu	OH	H	H	H
563	3	CO_2tBu	OH	H	H	H
564	4	CO_2tBu	OH	H	H	H
565	1	CONHMe	OH	H	H	H
566	2	CONHMe	OH	H	H	H
567	3	CONHMe	OH	H	H	H
568	4	CONHMe	OH	H	H	H
569	1	SO_2Me	OH	H	H	H
570	2	SO_2Me	OH	H	H	H
571	3	SO_2Me	OH	H	H	H
572	4	SO_2Me	OH	H	H	H
573	1	SO_2NH_2	OH	H	H	H
574	2	SO_2NH_2	OH	H	H	H
575	3	SO_2NH_2	OH	H	H	H
576	4	SO_2NH_2	OH	H	H	H
577	1	H	OMe	H	H	H
578	2	H	OMe	H	H	H
579	3	H	OMe	H	H	H
580	4	H	OMe	H	H	H
581	1	Me	OMe	H	H	H
582	2	Me	OMe	H	H	H

[3098]

583	3	Me	OMe	H	H	H
584	4	Me	OMe	H	H	H
585	1	CH_2Ph	OMe	H	H	H
586	2	CH_2Ph	OMe	H	H	H
587	3	CH_2Ph	OMe	H	H	H
588	4	CH_2Ph	OMe	H	H	H
589	1	COMe	OMe	H	H	H
590	2	COMe	OMe	H	H	H
591	3	COMe	OMe	H	H	H
592	4	COMe	OMe	H	H	H
593	1	CO_2Me	OMe	H	H	H
594	2	CO_2Me	OMe	H	H	H
595	3	CO_2Me	OMe	H	H	H
596	4	CO_2Me	OMe	H	H	H
597	1	CO_2tBu	OMe	H	H	H
598	2	CO_2tBu	OMe	H	H	H
599	3	CO_2tBu	OMe	H	H	H
600	4	CO_2tBu	OMe	H	H	H
601	1	CONHMe	OMe	H	H	H
602	2	CONHMe	OMe	H	H	H
603	3	CONHMe	OMe	H	H	H
604	4	CONHMe	OMe	H	H	H
605	1	SO_2Me	OMe	H	H	H
606	2	SO_2Me	OMe	H	H	H
607	3	SO_2Me	OMe	H	H	H
608	4	SO_2Me	OMe	H	H	H
609	1	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
610	2	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
611	3	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
612	4	SO_2NH_2	OMe	H	H	H

[3099]

613	1	H	Me	H	H	H
614	2	H	Me	H	H	H
615	3	H	Me	H	H	H
616	4	H	Me	H	H	H
617	1	Me	Me	H	H	H
618	2	Me	Me	H	H	H
619	3	Me	Me	H	H	H
620	4	Me	Me	H	H	H
621	1	CH_2Ph	Me	H	H	H
622	2	CH_2Ph	Me	H	H	H
623	3	CH_2Ph	Me	H	H	H
624	4	CH_2Ph	Me	H	H	H
625	1	COMe	Me	H	H	H
626	2	COMe	Me	H	H	H
627	3	COMe	Me	H	H	H
628	4	COMe	Me	H	H	H
629	1	CO_2Me	Me	H	H	H
630	2	CO_2Me	Me	H	H	H
631	3	CO_2Me	Me	H	H	H
632	4	CO_2Me	Me	H	H	H
633	1	CO_2tBu	Me	H	H	H
634	2	CO_2tBu	Me	H	H	H
635	3	CO_2tBu	Me	H	H	H
636	4	CO_2tBu	Me	H	H	H
637	1	CONHMe	Me	H	H	H
638	2	CONHMe	Me	H	H	H
639	3	CONHMe	Me	H	H	H
640	4	CONHMe	Me	H	H	H
641	1	SO_2Me	Me	H	H	H
642	2	SO_2Me	Me	H	H	H

[3100]

643	3	SO_2Me	Me	H	H	H
644	4	SO_2Me	Me	H	H	H
645	1	SO_2NH_2	Me	H	H	H
646	2	SO_2NH_2	Me	H	H	H
647	3	SO_2NH_2	Me	H	H	H
648	4	SO_2NH_2	Me	H	H	H
649	1	H	CF_3	H	H	H
650	2	H	CF_3	H	H	H
651	3	H	CF_3	H	H	H
652	4	H	CF_3	H	H	H
653	1	Me	CF_3	H	H	H
654	2	Me	CF_3	H	H	H
655	3	Me	CF_3	H	H	H
656	4	Me	CF_3	H	H	H
657	1	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
658	2	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
659	3	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
660	4	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
661	1	COMe	CF_3	H	H	H
662	2	COMe	CF_3	H	H	H
663	3	COMe	CF_3	H	H	H
664	4	COMe	CF_3	H	H	H
665	1	CO_2Me	CF_3	H	H	H
666	2	CO_2Me	CF_3	H	H	H
667	3	CO_2Me	CF_3	H	H	H
668	4	CO_2Me	CF_3	H	H	H
669	1	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
670	2	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
671	3	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
672	4	CO_2tBu	CF_3	H	H	H

[3101]

673	1	CONHMe	CF_3	H	H	H
674	2	CONHMe	CF_3	H	H	H
675	3	CONHMe	CF_3	H	H	H
676	4	CONHMe	CF_3	H	H	H
677	1	SO_2Me	CF_3	H	H	H
678	2	SO_2Me	CF_3	H	H	H
679	3	SO_2Me	CF_3	H	H	H
680	4	SO_2Me	CF_3	H	H	H
681	1	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
682	2	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
683	3	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
684	4	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
685	1	H	F	H	H	H
686	2	H	F	H	H	H
687	3	H	F	H	H	H
688	3	H	F	H	H	H
689	1	Me	F	H	H	H
690	2	Me	F	H	H	H
691	3	Me	F	H	H	H
692	4	Me	F	H	H	H
693	1	CH_2Ph	F	H	H	H
694	2	CH_2Ph	F	H	H	H
695	3	CH_2Ph	F	H	H	H
696	4	CH_2Ph	F	H	H	H
697	1	COMe	F	H	H	H
698	2	COMe	F	H	H	H
699	3	COMe	F	H	H	H
700	4	COMe	F	H	H	H
701	1	CO_2Me	F	H	H	H
702	2	CO_2Me	F	H	H	H

[3102]

703	3	CO_2Me	F	H	H	H
704	4	CO_2Me	F	H	H	H
705	1	CO_2tBu	F	H	H	H
706	2	CO_2tBu	F	H	H	H
707	3	CO_2tBu	F	H	H	H
708	4	CO_2tBu	F	H	H	H
709	1	CONHMe	F	H	H	H
710	2	CONHMe	F	H	H	H
711	3	CONHMe	F	H	H	H
712	4	CONHMe	F	H	H	H
713	1	SO_2Me	F	H	H	H
714	2	SO_2Me	F	H	H	H
715	3	SO_2Me	F	H	H	H
716	4	SO_2Me	F	H	H	H
717	1	SO_2NH_2	F	H	H	H
718	2	SO_2NH_2	F	H	H	H
719	3	SO_2NH_2	F	H	H	H
720	4	SO_2NH_2	F	H	H	H
721	1	H	Cl	H	H	H
722	2	H	Cl	H	H	H
723	3	H	Cl	H	H	H
724	4	H	Cl	H	H	H
725	1	Me	Cl	H	H	H
726	2	Me	Cl	H	H	H
727	3	Me	Cl	H	H	H
728	4	Me	Cl	H	H	H
729	1	CH_2Ph	Cl	H	H	H
730	2	CH_2Ph	Cl	H	H	H
731	3	CH_2Ph	Cl	H	H	H
732	4	CH_2Ph	Cl	H	H	H

[3103]

733	1	COMe	Cl	H	H	H
734	2	COMe	Cl	H	H	H
735	3	COMe	Cl	H	H	H
736	4	COMe	Cl	H	H	H
737	1	CO_2Me	Cl	H	H	H
738	2	CO_2Me	Cl	H	H	H
739	3	CO_2Me	Cl	H	H	H
740	4	CO_2Me	Cl	H	H	H
741	1	CO_2tBu	Cl	H	H	H
742	2	CO_2tBu	Cl	H	H	H
743	3	CO_2tBu	Cl	H	H	H
744	4	CO_2tBu	Cl	H	H	H
745	1	CONHMe	Cl	H	H	H
746	2	CONHMe	Cl	H	H	H
747	3	CONHMe	Cl	H	H	H
748	4	CONHMe	Cl	H	H	H
749	1	SO_2Me	Cl	H	H	H
750	2	SO_2Me	Cl	H	H	H
751	3	SO_2Me	Cl	H	H	H
752	4	SO_2Me	Cl	H	H	H
753	1	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
754	2	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
755	3	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
756	4	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
757	1	H	CN	H	H	H
758	2	H	CN	H	H	H
759	3	H	CN	H	H	H
760	4	H	CN	H	H	H
761	1	Me	CN	H	H	H
762	2	Me	CN	H	H	H

[3104]

763	3	Me	CN	H	H	H
764	4	Me	CN	H	H	H
765	1	CH_2Ph	CN	H	H	H
766	2	CH_2Ph	CN	H	H	H
767	3	CH_2Ph	CN	H	H	H
768	4	CH_2Ph	CN	H	H	H
769	1	COMe	CN	H	H	H
770	2	COMe	CN	H	H	H
771	3	COMe	CN	H	H	H
772	4	COMe	CN	H	H	H
773	1	CO_2Me	CN	H	H	H
774	2	CO_2Me	CN	H	H	H
775	3	CO_2Me	CN	H	H	H
776	4	CO_2Me	CN	H	H	H
777	1	CO_2tBu	CN	H	H	H
778	2	CO_2tBu	CN	H	H	H
779	3	CO_2tBu	CN	H	H	H
780	4	CO_2tBu	CN	H	H	H
781	1	CONHMe	CN	H	H	H
782	2	CONHMe	CN	H	H	H
783	3	CONHMe	CN	H	H	H
784	4	CONHMe	CN	H	H	H
785	1	SO_2Me	CN	H	H	H
786	2	SO_2Me	CN	H	H	H
787	3	SO_2Me	CN	H	H	H
788	4	SO_2Me	CN	H	H	H
789	1	SO_2NH_2	CN	H	H	H
790	2	SO_2NH_2	CN	H	H	H
791	3	SO_2NH_2	CN	H	H	H
792	4	SO_2NH_2	CN	H	H	H

[3105]

793	1	H	H	H	H	OH
794	2	H	H	H	H	OH
795	3	H	H	H	H	OH
796	4	H	H	H	H	OH
797	1	Me	H	H	H	OH
798	2	Me	H	H	H	OH
799	3	Me	H	H	H	OH
800	4	Me	H	H	H	OH
801	1	CH_2Ph	H	H	H	OH
802	2	CH_2Ph	H	H	H	OH
803	3	CH_2Ph	H	H	H	OH
804	4	CH_2Ph	H	H	H	OH
805	1	COMe	H	H	H	OH
806	2	COMe	H	H	H	OH
807	3	COMe	H	H	H	OH
808	4	COMe	H	H	H	OH
809	1	CO_2Me	H	H	H	OH
810	2	CO_2Me	H	H	H	OH
811	3	CO_2Me	H	H	H	OH
812	4	CO_2Me	H	H	H	OH
813	1	CO_2tBu	H	H	H	OH
814	2	CO_2tBu	H	H	H	OH
815	3	CO_2tBu	H	H	H	OH
816	4	CO_2tBu	H	H	H	OH
817	1	CONHMe	H	H	H	OH
818	2	CONHMe	H	H	H	OH
819	3	CONHMe	H	H	H	OH
820	4	CONHMe	H	H	H	OH
821	1	SO_2Me	H	H	H	OH
822	2	SO_2Me	H	H	H	OH

[3106]

823	3	SO_2Me	H	H	H	OH
824	4	SO_2Me	H	H	H	OH
825	1	SO_2NH_2	H	H	H	OH
826	2	SO_2NH_2	H	H	H	OH
827	3	SO_2NH_2	H	H	H	OH
828	4	SO_2NH_2	H	H	H	OH
829	1	H	H	H	H	OMe
830	2	H	H	H	H	OMe
831	3	H	H	H	H	OMe
832	4	H	H	H	H	OMe
833	1	Me	H	H	H	OMe
834	2	Me	H	H	H	OMe
835	3	Me	H	H	H	OMe
836	4	Me	H	H	H	OMe
837	1	CH_2Ph	H	H	H	OMe
838	2	CH_2Ph	H	H	H	OMe
839	3	CH_2Ph	H	H	H	OMe
840	4	CH_2Ph	H	H	H	OMe
841	1	COMe	H	H	H	OMe
842	2	COMe	H	H	H	OMe
843	3	COMe	H	H	H	OMe
844	4	COMe	H	H	H	OMe
845	1	CO_2Me	H	H	H	OMe
846	2	CO_2Me	H	H	H	OMe
847	3	CO_2Me	H	H	H	OMe
848	4	CO_2Me	H	H	H	OMe
849	1	CO_2tBu	H	H	H	OMe
850	2	CO_2tBu	H	H	H	OMe
851	3	CO_2tBu	H	H	H	OMe
852	4	CO_2tBu	H	H	H	OMe

[3107]

853	1	CONHMe	H	H	H	OMe
854	2	CONHMe	H	H	H	OMe
855	3	CONHMe	H	H	H	OMe
856	4	CONHMe	H	H	H	OMe
857	1	SO_2Me	H	H	H	OMe
858	2	SO_2Me	H	H	H	OMe
859	3	SO_2Me	H	H	H	OMe
860	4	SO_2Me	H	H	H	OMe
861	1	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
862	2	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
863	3	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
864	4	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
865	1	H	H	H	H	Me
866	2	H	H	H	H	Me
867	3	H	H	H	H	Me
868	4	H	H	H	H	Me
869	1	Me	H	H	H	Me
870	2	Me	H	H	H	Me
871	3	Me	H	H	H	Me
872	4	Me	H	H	H	Me
873	1	CH_2Ph	H	H	H	Me
874	2	CH_2Ph	H	H	H	Me
875	3	CH_2Ph	H	H	H	Me
876	4	CH_2Ph	H	H	H	Me
877	1	COMe	H	H	H	Me
878	2	COMe	H	H	H	Me
879	3	COMe	H	H	H	Me
880	4	COMe	H	H	H	Me
881	1	CO_2Me	H	H	H	Me
882	2	CO_2Me	H	H	H	Me

[3108]

883	3	CO_2Me	H	H	H	Me
884	4	CO_2Me	H	H	H	Me
885	1	CO_2tBu	H	H	H	Me
886	2	CO_2tBu	H	H	H	Me
887	3	CO_2tBu	H	H	H	Me
888	4	CO_2tBu	H	H	H	Me
889	1	CONHMe	H	H	H	Me
890	2	CONHMe	H	H	H	Me
891	3	CONHMe	H	H	H	Me
892	4	CONHMe	H	H	H	Me
893	1	SO_2Me	H	H	H	Me
894	2	SO_2Me	H	H	H	Me
895	3	SO_2Me	H	H	H	Me
896	4	SO_2Me	H	H	H	Me
897	1	SO_2NH_2	H	H	H	Me
898	2	SO_2NH_2	H	H	H	Me
899	3	SO_2NH_2	H	H	H	Me
900	4	SO_2NH_2	H	H	H	Me
901	1	H	H	H	H	CF_3
902	2	H	H	H	H	CF_3
903	3	H	H	H	H	CF_3
904	4	H	H	H	H	CF_3
905	1	Me	H	H	H	CF_3
906	2	Me	H	H	H	CF_3
907	3	Me	H	H	H	CF_3
908	4	Me	H	H	H	CF_3
909	1	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
910	2	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
911	3	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
912	4	CH_2Ph	H	H	H	CF_3

[3109]

913	1	COMe	H	H	H	CF_3
914	2	COMe	H	H	H	CF_3
915	3	COMe	H	H	H	CF_3
916	4	COMe	H	H	H	CF_3
917	1	CO_2Me	H	H	H	CF_3
918	2	CO_2Me	H	H	H	CF_3
919	3	CO_2Me	H	H	H	CF_3
920	4	CO_2Me	H	H	H	CF_3
921	1	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
922	2	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
923	3	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
924	4	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
925	1	CONHMe	H	H	H	CF_3
926	2	CONHMe	H	H	H	CF_3
927	3	CONHMe	H	H	H	CF_3
928	4	CONHMe	H	H	H	CF_3
929	1	SO_2Me	H	H	H	CF_3
930	2	SO_2Me	H	H	H	CF_3
931	3	SO_2Me	H	H	H	CF_3
932	4	SO_2Me	H	H	H	CF_3
933	1	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
934	2	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
935	3	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
936	4	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
937	1	H	H	H	H	F
938	2	H	H	H	H	F
939	3	H	H	H	H	F
940	3	H	H	H	H	F
941	1	Me	H	H	H	F
942	2	Me	H	H	H	F

[3110]

943	3	Me	H	H	H	F
944	4	Me	H	H	H	F
945	1	CH_2Ph	H	H	H	F
946	2	CH_2Ph	H	H	H	F
947	3	CH_2Ph	H	H	H	F
948	4	CH_2Ph	H	H	H	F
949	1	COMe	H	H	H	F
950	2	COMe	H	H	H	F
951	3	COMe	H	H	H	F
952	4	COMe	H	H	H	F
953	1	CO_2Me	H	H	H	F
954	2	CO_2Me	H	H	H	F
955	3	CO_2Me	H	H	H	F
956	4	CO_2Me	H	H	H	F
957	1	CO_2tBu	H	H	H	F
958	2	CO_2tBu	H	H	H	F
959	3	CO_2tBu	H	H	H	F
960	4	CO_2tBu	H	H	H	F
961	1	CONHMe	H	H	H	F
962	2	CONHMe	H	H	H	F
963	3	CONHMe	H	H	H	F
964	4	CONHMe	H	H	H	F
965	1	SO_2Me	H	H	H	F
966	2	SO_2Me	H	H	H	F
967	3	SO_2Me	H	H	H	F
968	4	SO_2Me	H	H	H	F
969	1	SO_2NH_2	H	H	H	F
970	2	SO_2NH_2	H	H	H	F
971	3	SO_2NH_2	H	H	H	F
972	4	SO_2NH_2	H	H	H	F

[3111]

973	1	H	H	H	H	Cl
974	2	H	H	H	H	Cl
975	3	H	H	H	H	Cl
976	4	H	H	H	H	Cl
977	1	Me	H	H	H	Cl
978	2	Me	H	H	H	Cl
979	3	Me	H	H	H	Cl
980	4	Me	H	H	H	Cl
981	1	CH_2Ph	H	H	H	Cl
982	2	CH_2Ph	H	H	H	Cl
983	3	CH_2Ph	H	H	H	Cl
984	4	CH_2Ph	H	H	H	Cl
985	1	COMe	H	H	H	Cl
986	2	COMe	H	H	H	Cl
987	3	COMe	H	H	H	Cl
988	4	COMe	H	H	H	Cl
989	1	CO_2Me	H	H	H	Cl
990	2	CO_2Me	H	H	H	Cl
991	3	CO_2Me	H	H	H	Cl
992	4	CO_2Me	H	H	H	Cl
993	1	CO_2tBu	H	H	H	Cl
994	2	CO_2tBu	H	H	H	Cl
995	3	CO_2tBu	H	H	H	Cl
996	4	CO_2tBu	H	H	H	Cl
997	1	CONHMe	H	H	H	Cl
998	2	CONHMe	H	H	H	Cl
999	3	CONHMe	H	H	H	Cl
1000	4	CONHMe	H	H	H	Cl
1001	1	SO_2Me	H	H	H	Cl
1002	2	SO_2Me	H	H	H	Cl

[3112]

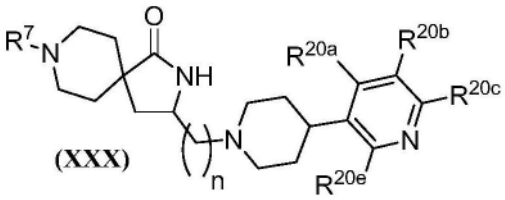
1003	3	SO_2Me	H	H	H	Cl
1004	4	SO_2Me	H	H	H	Cl
1005	1	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1006	2	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1007	3	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1008	4	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1009	1	H	H	H	H	CN
1010	2	H	H	H	H	CN
1011	3	H	H	H	H	CN
1012	4	H	H	H	H	CN
1013	1	Me	H	H	H	CN
1014	2	Me	H	H	H	CN
1015	3	Me	H	H	H	CN
1016	4	Me	H	H	H	CN
1017	1	CH_2Ph	H	H	H	CN
1018	2	CH_2Ph	H	H	H	CN
1019	3	CH_2Ph	H	H	H	CN
1020	4	CH_2Ph	H	H	H	CN
1021	1	COMe	H	H	H	CN
1022	2	COMe	H	H	H	CN
1023	3	COMe	H	H	H	CN
1024	4	COMe	H	H	H	CN
1025	1	CO_2Me	H	H	H	CN
1026	2	CO_2Me	H	H	H	CN
1027	3	CO_2Me	H	H	H	CN
1028	4	CO_2Me	H	H	H	CN
1029	1	CO_2tBu	H	H	H	CN
1030	2	CO_2tBu	H	H	H	CN
1031	3	CO_2tBu	H	H	H	CN
1032	4	CO_2tBu	H	H	H	CN

[3113]

1033	1	CONHMe	H	H	H	CN
1034	2	CONHMe	H	H	H	CN
1035	3	CONHMe	H	H	H	CN
1036	4	CONHMe	H	H	H	CN
1037	1	SO_2Me	H	H	H	CN
1038	2	SO_2Me	H	H	H	CN
1039	3	SO_2Me	H	H	H	CN
1040	4	SO_2Me	H	H	H	CN
1041	1	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1042	2	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1043	3	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1044	4	SO_2NH_2	H	H	H	CN

[3114] 示例性实施方案包括具有式(XXX)的化合物

[3115]



(XXX)

[3116] 或其可药用盐形式,如在下文表24中所定义。

[3117] 表24:

[3118]

条目	n	R^7	R^{20a}	R^{20b}	R^{20c}	R^{20e}
1	1	H	H	H	H	H
2	2	H	H	H	H	H
3	3	H	H	H	H	H
4	4	H	H	H	H	H
5	1	Me	H	H	H	H
6	2	Me	H	H	H	H
7	3	Me	H	H	H	H
8	4	Me	H	H	H	H
9	1	CH_2Ph	H	H	H	H
10	2	CH_2Ph	H	H	H	H
11	3	CH_2Ph	H	H	H	H

[3119]

12	4	CH_2Ph	H	H	H	H
13	1	COMe	H	H	H	H
14	2	COMe	H	H	H	H
15	3	COMe	H	H	H	H
16	4	COMe	H	H	H	H
17	1	CO_2Me	H	H	H	H
18	2	CO_2Me	H	H	H	H
19	3	CO_2Me	H	H	H	H
20	4	CO_2Me	H	H	H	H
21	1	CO_2tBu	H	H	H	H
22	2	CO_2tBu	H	H	H	H
23	3	CO_2tBu	H	H	H	H
24	4	CO_2tBu	H	H	H	H
25	1	CONHMe	H	H	H	H
26	2	CONHMe	H	H	H	H
27	3	CONHMe	H	H	H	H
28	4	CONHMe	H	H	H	H
29	1	SO_2Me	H	H	H	H
30	2	SO_2Me	H	H	H	H
31	3	SO_2Me	H	H	H	H
32	4	SO_2Me	H	H	H	H
33	1	SO_2NH_2	H	H	H	H
34	2	SO_2NH_2	H	H	H	H
35	3	SO_2NH_2	H	H	H	H
36	4	SO_2NH_2	H	H	H	H
37	1	H	H	H	OH	H
38	2	H	H	H	OH	H
39	3	H	H	H	OH	H
40	4	H	H	H	OH	H
41	1	Me	H	H	OH	H

[3120]

42	2	Me	H	H	OH	H
43	3	Me	H	H	OH	H
44	4	Me	H	H	OH	H
45	1	CH_2Ph	H	H	OH	H
46	2	CH_2Ph	H	H	OH	H
47	3	CH_2Ph	H	H	OH	H
48	4	CH_2Ph	H	H	OH	H
49	1	COMe	H	H	OH	H
50	2	COMe	H	H	OH	H
51	3	COMe	H	H	OH	H
52	4	COMe	H	H	OH	H
53	1	CO_2Me	H	H	OH	H
54	2	CO_2Me	H	H	OH	H
55	3	CO_2Me	H	H	OH	H
56	4	CO_2Me	H	H	OH	H
57	1	CO_2tBu	H	H	OH	H
58	2	CO_2tBu	H	H	OH	H
59	3	CO_2tBu	H	H	OH	H
60	4	CO_2tBu	H	H	OH	H
61	1	CONHMe	H	H	OH	H
62	2	CONHMe	H	H	OH	H
63	3	CONHMe	H	H	OH	H
64	4	CONHMe	H	H	OH	H
65	1	SO_2Me	H	H	OH	H
66	2	SO_2Me	H	H	OH	H
67	3	SO_2Me	H	H	OH	H
68	4	SO_2Me	H	H	OH	H
69	1	SO_2NH_2	H	H	OH	H
70	2	SO_2NH_2	H	H	OH	H
71	3	SO_2NH_2	H	H	OH	H

[3121]

72	4	SO_2NH_2	H	H	OH	H
73	1	H	H	H	OMe	H
74	2	H	H	H	OMe	H
75	3	H	H	H	OMe	H
76	4	H	H	H	OMe	H
77	1	Me	H	H	OMe	H
78	2	Me	H	H	OMe	H
79	3	Me	H	H	OMe	H
80	4	Me	H	H	OMe	H
81	1	CH_2Ph	H	H	OMe	H
82	2	CH_2Ph	H	H	OMe	H
83	3	CH_2Ph	H	H	OMe	H
84	4	CH_2Ph	H	H	OMe	H
85	1	COMe	H	H	OMe	H
86	2	COMe	H	H	OMe	H
87	3	COMe	H	H	OMe	H
88	4	COMe	H	H	OMe	H
89	1	CO_2Me	H	H	OMe	H
90	2	CO_2Me	H	H	OMe	H
91	3	CO_2Me	H	H	OMe	H
92	4	CO_2Me	H	H	OMe	H
93	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
94	2	CO_2tBu	H	H	OMe	H
95	3	CO_2tBu	H	H	OMe	H
96	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
97	1	CONHMe	H	H	OMe	H
98	2	CONHMe	H	H	OMe	H
99	3	CONHMe	H	H	OMe	H
100	4	CONHMe	H	H	OMe	H
101	1	SO_2Me	H	H	OMe	H

[3122]

102	2	SO_2Me	H	H	OMe	H
103	3	SO_2Me	H	H	OMe	H
104	4	SO_2Me	H	H	OMe	H
105	1	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
106	2	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
107	3	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
108	4	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
109	1	H	H	H	Me	H
110	2	H	H	H	Me	H
111	3	H	H	H	Me	H
112	4	H	H	H	Me	H
113	1	Me	H	H	Me	H
114	2	Me	H	H	Me	H
115	3	Me	H	H	Me	H
116	4	Me	H	H	Me	H
117	1	CH_2Ph	H	H	Me	H
118	2	CH_2Ph	H	H	Me	H
119	3	CH_2Ph	H	H	Me	H
120	4	CH_2Ph	H	H	Me	H
121	1	COMe	H	H	Me	H
122	2	COMe	H	H	Me	H
123	3	COMe	H	H	Me	H
124	4	COMe	H	H	Me	H
125	1	CO_2Me	H	H	Me	H
126	2	CO_2Me	H	H	Me	H
127	3	CO_2Me	H	H	Me	H
128	4	CO_2Me	H	H	Me	H
129	1	CO_2tBu	H	H	Me	H
130	2	CO_2tBu	H	H	Me	H
131	3	CO_2tBu	H	H	Me	H

[3123]

132	4	CO_2tBu	H	H	Me	H
133	1	CONHMe	H	H	Me	H
134	2	CONHMe	H	H	Me	H
135	3	CONHMe	H	H	Me	H
136	4	CONHMe	H	H	Me	H
137	1	SO_2Me	H	H	Me	H
138	2	SO_2Me	H	H	Me	H
139	3	SO_2Me	H	H	Me	H
140	4	SO_2Me	H	H	Me	H
141	1	SO_2NH_2	H	H	Me	H
142	2	SO_2NH_2	H	H	Me	H
143	3	SO_2NH_2	H	H	Me	H
144	4	SO_2NH_2	H	H	Me	H
145	1	H	H	H	CF_3	H
146	2	H	H	H	CF_3	H
147	3	H	H	H	CF_3	H
148	4	H	H	H	CF_3	H
149	1	Me	H	H	CF_3	H
150	2	Me	H	H	CF_3	H
151	3	Me	H	H	CF_3	H
152	4	Me	H	H	CF_3	H
153	1	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
154	2	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
155	3	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
156	4	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
157	1	COMe	H	H	CF_3	H
158	2	COMe	H	H	CF_3	H
159	3	COMe	H	H	CF_3	H
160	4	COMe	H	H	CF_3	H
161	1	CO_2Me	H	H	CF_3	H

[3124]

162	2	CO_2Me	H	H	CF_3	H
163	3	CO_2Me	H	H	CF_3	H
164	4	CO_2Me	H	H	CF_3	H
165	1	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
166	2	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
167	3	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
168	4	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
169	1	CONHMe	H	H	CF_3	H
170	2	CONHMe	H	H	CF_3	H
171	3	CONHMe	H	H	CF_3	H
172	4	CONHMe	H	H	CF_3	H
173	1	SO_2Me	H	H	CF_3	H
174	2	SO_2Me	H	H	CF_3	H
175	3	SO_2Me	H	H	CF_3	H
176	4	SO_2Me	H	H	CF_3	H
177	1	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
178	2	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
179	3	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
180	4	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
181	1	H	H	H	F	H
182	2	H	H	H	F	H
183	3	H	H	H	F	H
184	4	H	H	H	F	H
185	1	Me	H	H	F	H
186	2	Me	H	H	F	H
187	3	Me	H	H	F	H
188	4	Me	H	H	F	H
189	1	CH_2Ph	H	H	F	H
190	2	CH_2Ph	H	H	F	H
191	3	CH_2Ph	H	H	F	H

[3125]

192	4	CH_2Ph	H	H	F	H
193	1	COMe	H	H	F	H
194	2	COMe	H	H	F	H
195	3	COMe	H	H	F	H
196	4	COMe	H	H	F	H
197	1	CO_2Me	H	H	F	H
198	2	CO_2Me	H	H	F	H
199	3	CO_2Me	H	H	F	H
200	4	CO_2Me	H	H	F	H
201	1	CO_2tBu	H	H	F	H
202	2	CO_2tBu	H	H	F	H
203	3	CO_2tBu	H	H	F	H
204	4	CO_2tBu	H	H	F	H
205	1	CONHMe	H	H	F	H
206	2	CONHMe	H	H	F	H
207	3	CONHMe	H	H	F	H
208	4	CONHMe	H	H	F	H
209	1	SO_2Me	H	H	F	H
210	2	SO_2Me	H	H	F	H
211	3	SO_2Me	H	H	F	H
212	4	SO_2Me	H	H	F	H
213	1	SO_2NH_2	H	H	F	H
214	2	SO_2NH_2	H	H	F	H
215	3	SO_2NH_2	H	H	F	H
216	4	SO_2NH_2	H	H	F	H
217	1	H	H	H	Cl	H
218	2	H	H	H	Cl	H
219	3	H	H	H	Cl	H
220	4	H	H	H	Cl	H
221	1	Me	H	H	Cl	H

[3126]

222	2	Me	H	H	Cl	H
223	3	Me	H	H	Cl	H
224	4	Me	H	H	Cl	H
225	1	CH_2Ph	H	H	Cl	H
226	2	CH_2Ph	H	H	Cl	H
227	3	CH_2Ph	H	H	Cl	H
228	4	CH_2Ph	H	H	Cl	H
229	1	COMe	H	H	Cl	H
230	2	COMe	H	H	Cl	H
231	3	COMe	H	H	Cl	H
232	4	COMe	H	H	Cl	H
233	1	CO_2Me	H	H	Cl	H
234	2	CO_2Me	H	H	Cl	H
235	3	CO_2Me	H	H	Cl	H
236	4	CO_2Me	H	H	Cl	H
237	1	CO_2tBu	H	H	Cl	H
238	2	CO_2tBu	H	H	Cl	H
239	3	CO_2tBu	H	H	Cl	H
240	4	CO_2tBu	H	H	Cl	H
241	1	CONHMe	H	H	Cl	H
242	2	CONHMe	H	H	Cl	H
243	3	CONHMe	H	H	Cl	H
244	4	CONHMe	H	H	Cl	H
245	1	SO_2Me	H	H	Cl	H
246	2	SO_2Me	H	H	Cl	H
247	3	SO_2Me	H	H	Cl	H
248	4	SO_2Me	H	H	Cl	H
249	1	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
250	2	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
251	3	SO_2NH_2	H	H	Cl	H

[3127]

252	4	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
253	1	H	H	H	CN	H
254	2	H	H	H	CN	H
255	3	H	H	H	CN	H
256	4	H	H	H	CN	H
257	1	Me	H	H	CN	H
258	2	Me	H	H	CN	H
259	3	Me	H	H	CN	H
260	4	Me	H	H	CN	H
261	1	CH_2Ph	H	H	CN	H
262	2	CH_2Ph	H	H	CN	H
263	3	CH_2Ph	H	H	CN	H
264	4	CH_2Ph	H	H	CN	H
265	1	COMe	H	H	CN	H
266	2	COMe	H	H	CN	H
267	3	COMe	H	H	CN	H
268	4	COMe	H	H	CN	H
269	1	CO_2Me	H	H	CN	H
270	2	CO_2Me	H	H	CN	H
271	3	CO_2Me	H	H	CN	H
272	4	CO_2Me	H	H	CN	H
273	1	CO_2tBu	H	H	CN	H
274	2	CO_2tBu	H	H	CN	H
275	3	CO_2tBu	H	H	CN	H
276	4	CO_2tBu	H	H	CN	H
277	1	CONHMe	H	H	CN	H
278	2	CONHMe	H	H	CN	H
279	3	CONHMe	H	H	CN	H
280	4	CONHMe	H	H	CN	H
281	1	SO_2Me	H	H	CN	H

[3128]

282	2	SO_2Me	H	H	CN	H
283	3	SO_2Me	H	H	CN	H
284	4	SO_2Me	H	H	CN	H
285	1	SO_2NH_2	H	H	CN	H
286	2	SO_2NH_2	H	H	CN	H
287	3	SO_2NH_2	H	H	CN	H
288	4	SO_2NH_2	H	H	CN	H
289	1	H	H	OH	H	H
290	2	H	H	OH	H	H
291	3	H	H	OH	H	H
292	4	H	H	OH	H	H
293	1	Me	H	OH	H	H
294	2	Me	H	OH	H	H
295	3	Me	H	OH	H	H
296	4	Me	H	OH	H	H
297	1	CH_2Ph	H	OH	H	H
298	2	CH_2Ph	H	OH	H	H
299	3	CH_2Ph	H	OH	H	H
300	4	CH_2Ph	H	OH	H	H
301	1	COMe	H	OH	H	H
302	2	COMe	H	OH	H	H
303	3	COMe	H	OH	H	H
304	4	COMe	H	OH	H	H
305	1	CO_2Me	H	OH	H	H
306	2	CO_2Me	H	OH	H	H
307	3	CO_2Me	H	OH	H	H
308	4	CO_2Me	H	OH	H	H
309	1	CO_2tBu	H	OH	H	H
310	2	CO_2tBu	H	OH	H	H
311	3	CO_2tBu	H	OH	H	H

[3129]

312	4	CO_2tBu	H	OH	H	H
313	1	CONHMe	H	OH	H	H
314	2	CONHMe	H	OH	H	H
315	3	CONHMe	H	OH	H	H
316	4	CONHMe	H	OH	H	H
317	1	SO_2Me	H	OH	H	H
318	2	SO_2Me	H	OH	H	H
319	3	SO_2Me	H	OH	H	H
320	4	SO_2Me	H	OH	H	H
321	1	SO_2NH_2	H	OH	H	H
322	2	SO_2NH_2	H	OH	H	H
323	3	SO_2NH_2	H	OH	H	H
324	4	SO_2NH_2	H	OH	H	H
325	1	H	H	OMe	H	H
326	2	H	H	OMe	H	H
327	3	H	H	OMe	H	H
328	4	H	H	OMe	H	H
329	1	Me	H	OMe	H	H
330	2	Me	H	OMe	H	H
331	3	Me	H	OMe	H	H
332	4	Me	H	OMe	H	H
333	1	CH_2Ph	H	OMe	H	H
334	2	CH_2Ph	H	OMe	H	H
335	3	CH_2Ph	H	OMe	H	H
336	4	CH_2Ph	H	OMe	H	H
337	1	COMe	H	OMe	H	H
338	2	COMe	H	OMe	H	H
339	3	COMe	H	OMe	H	H
340	4	COMe	H	OMe	H	H
341	1	CO_2Me	H	OMe	H	H

[3130]

342	2	CO_2Me	H	OMe	H	H
343	3	CO_2Me	H	OMe	H	H
344	4	CO_2Me	H	OMe	H	H
345	1	CO_2tBu	H	OMe	H	H
346	2	CO_2tBu	H	OMe	H	H
347	3	CO_2tBu	H	OMe	H	H
348	4	CO_2tBu	H	OMe	H	H
349	1	CONHMe	H	OMe	H	H
350	2	CONHMe	H	OMe	H	H
351	3	CONHMe	H	OMe	H	H
352	4	CONHMe	H	OMe	H	H
353	1	SO_2Me	H	OMe	H	H
354	2	SO_2Me	H	OMe	H	H
355	3	SO_2Me	H	OMe	H	H
356	4	SO_2Me	H	OMe	H	H
357	1	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
358	2	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
359	3	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
360	4	SO_2NH_2	H	OMe	H	H
361	1	H	H	Me	H	H
362	2	H	H	Me	H	H
363	3	H	H	Me	H	H
364	4	H	H	Me	H	H
365	1	Me	H	Me	H	H
366	2	Me	H	Me	H	H
367	3	Me	H	Me	H	H
368	4	Me	H	Me	H	H
369	1	CH_2Ph	H	Me	H	H
370	2	CH_2Ph	H	Me	H	H
371	3	CH_2Ph	H	Me	H	H

[3131]

372	4	CH_2Ph	H	Me	H	H
373	1	COMe	H	Me	H	H
374	2	COMe	H	Me	H	H
375	3	COMe	H	Me	H	H
376	4	COMe	H	Me	H	H
377	1	CO_2Me	H	Me	H	H
378	2	CO_2Me	H	Me	H	H
379	3	CO_2Me	H	Me	H	H
380	4	CO_2Me	H	Me	H	H
381	1	CO_2tBu	H	Me	H	H
382	2	CO_2tBu	H	Me	H	H
383	3	CO_2tBu	H	Me	H	H
384	4	CO_2tBu	H	Me	H	H
385	1	CONHMe	H	Me	H	H
386	2	CONHMe	H	Me	H	H
387	3	CONHMe	H	Me	H	H
388	4	CONHMe	H	Me	H	H
389	1	SO_2Me	H	Me	H	H
390	2	SO_2Me	H	Me	H	H
391	3	SO_2Me	H	Me	H	H
392	4	SO_2Me	H	Me	H	H
393	1	SO_2NH_2	H	Me	H	H
394	2	SO_2NH_2	H	Me	H	H
395	3	SO_2NH_2	H	Me	H	H
396	4	SO_2NH_2	H	Me	H	H
397	1	H	H	CF_3	H	H
398	2	H	H	CF_3	H	H
399	3	H	H	CF_3	H	H
400	4	H	H	CF_3	H	H
401	1	Me	H	CF_3	H	H

[3132]

402	2	Me	H	CF_3	H	H
403	3	Me	H	CF_3	H	H
404	4	Me	H	CF_3	H	H
405	1	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
406	2	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
407	3	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
408	4	CH_2Ph	H	CF_3	H	H
409	1	COMe	H	CF_3	H	H
410	2	COMe	H	CF_3	H	H
411	3	COMe	H	CF_3	H	H
412	4	COMe	H	CF_3	H	H
413	1	CO_2Me	H	CF_3	H	H
414	2	CO_2Me	H	CF_3	H	H
415	3	CO_2Me	H	CF_3	H	H
416	4	CO_2Me	H	CF_3	H	H
417	1	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
418	2	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
419	3	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
420	4	CO_2tBu	H	CF_3	H	H
421	1	CONHMe	H	CF_3	H	H
422	2	CONHMe	H	CF_3	H	H
423	3	CONHMe	H	CF_3	H	H
424	4	CONHMe	H	CF_3	H	H
425	1	SO_2Me	H	CF_3	H	H
426	2	SO_2Me	H	CF_3	H	H
427	3	SO_2Me	H	CF_3	H	H
428	4	SO_2Me	H	CF_3	H	H
429	1	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
430	2	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
431	3	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H

[3133]

432	4	SO_2NH_2	H	CF_3	H	H
433	1	H	H	F	H	H
434	2	H	H	F	H	H
435	3	H	H	F	H	H
436	3	H	H	F	H	H
437	1	Me	H	F	H	H
438	2	Me	H	F	H	H
439	3	Me	H	F	H	H
440	4	Me	H	F	H	H
441	1	CH_2Ph	H	F	H	H
442	2	CH_2Ph	H	F	H	H
443	3	CH_2Ph	H	F	H	H
444	4	CH_2Ph	H	F	H	H
445	1	COMe	H	F	H	H
446	2	COMe	H	F	H	H
447	3	COMe	H	F	H	H
448	4	COMe	H	F	H	H
449	1	CO_2Me	H	F	H	H
450	2	CO_2Me	H	F	H	H
451	3	CO_2Me	H	F	H	H
452	4	CO_2Me	H	F	H	H
453	1	CO_2tBu	H	F	H	H
454	2	CO_2tBu	H	F	H	H
455	3	CO_2tBu	H	F	H	H
456	4	CO_2tBu	H	F	H	H
457	1	CONHMe	H	F	H	H
458	2	CONHMe	H	F	H	H
459	3	CONHMe	H	F	H	H
460	4	CONHMe	H	F	H	H
461	1	SO_2Me	H	F	H	H

[3134]

462	2	SO_2Me	H	F	H	H
463	3	SO_2Me	H	F	H	H
464	4	SO_2Me	H	F	H	H
465	1	SO_2NH_2	H	F	H	H
466	2	SO_2NH_2	H	F	H	H
467	3	SO_2NH_2	H	F	H	H
468	4	SO_2NH_2	H	F	H	H
469	1	H	H	Cl	H	H
470	2	H	H	Cl	H	H
471	3	H	H	Cl	H	H
472	4	H	H	Cl	H	H
473	1	Me	H	Cl	H	H
474	2	Me	H	Cl	H	H
475	3	Me	H	Cl	H	H
476	4	Me	H	Cl	H	H
477	1	CH_2Ph	H	Cl	H	H
478	2	CH_2Ph	H	Cl	H	H
479	3	CH_2Ph	H	Cl	H	H
480	4	CH_2Ph	H	Cl	H	H
481	1	COMe	H	Cl	H	H
482	2	COMe	H	Cl	H	H
483	3	COMe	H	Cl	H	H
484	4	COMe	H	Cl	H	H
485	1	CO_2Me	H	Cl	H	H
486	2	CO_2Me	H	Cl	H	H
487	3	CO_2Me	H	Cl	H	H
488	4	CO_2Me	H	Cl	H	H
489	1	CO_2tBu	H	Cl	H	H
490	2	CO_2tBu	H	Cl	H	H
491	3	CO_2tBu	H	Cl	H	H

[3135]

492	4	CO_2tBu	H	Cl	H	H
493	1	CONHMe	H	Cl	H	H
494	2	CONHMe	H	Cl	H	H
495	3	CONHMe	H	Cl	H	H
496	4	CONHMe	H	Cl	H	H
497	1	SO_2Me	H	Cl	H	H
498	2	SO_2Me	H	Cl	H	H
499	3	SO_2Me	H	Cl	H	H
500	4	SO_2Me	H	Cl	H	H
501	1	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
502	2	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
503	3	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
504	4	SO_2NH_2	H	Cl	H	H
505	1	H	H	CN	H	H
506	2	H	H	CN	H	H
507	3	H	H	CN	H	H
508	4	H	H	CN	H	H
509	1	Me	H	CN	H	H
510	2	Me	H	CN	H	H
511	3	Me	H	CN	H	H
512	4	Me	H	CN	H	H
513	1	CH_2Ph	H	CN	H	H
514	2	CH_2Ph	H	CN	H	H
515	3	CH_2Ph	H	CN	H	H
516	4	CH_2Ph	H	CN	H	H
517	1	COMe	H	CN	H	H
518	2	COMe	H	CN	H	H
519	3	COMe	H	CN	H	H
520	4	COMe	H	CN	H	H
521	1	CO_2Me	H	CN	H	H

[3136]

522	2	CO_2Me	H	CN	H	H
523	3	CO_2Me	H	CN	H	H
524	4	CO_2Me	H	CN	H	H
525	1	CO_2tBu	H	CN	H	H
526	2	CO_2tBu	H	CN	H	H
527	3	CO_2tBu	H	CN	H	H
528	4	CO_2tBu	H	CN	H	H
529	1	CONHMe	H	CN	H	H
530	2	CONHMe	H	CN	H	H
531	3	CONHMe	H	CN	H	H
532	4	CONHMe	H	CN	H	H
533	1	SO_2Me	H	CN	H	H
534	2	SO_2Me	H	CN	H	H
535	3	SO_2Me	H	CN	H	H
536	4	SO_2Me	H	CN	H	H
537	1	SO_2NH_2	H	CN	H	H
538	2	SO_2NH_2	H	CN	H	H
539	3	SO_2NH_2	H	CN	H	H
540	4	SO_2NH_2	H	CN	H	H
541	1	H	OH	H	H	H
542	2	H	OH	H	H	H
543	3	H	OH	H	H	H
544	4	H	OH	H	H	H
545	1	Me	OH	H	H	H
546	2	Me	OH	H	H	H
547	3	Me	OH	H	H	H
548	4	Me	OH	H	H	H
549	1	CH_2Ph	OH	H	H	H
550	2	CH_2Ph	OH	H	H	H
551	3	CH_2Ph	OH	H	H	H

[3137]

552	4	CH_2Ph	OH	H	H	H
553	1	COMe	OH	H	H	H
554	2	COMe	OH	H	H	H
555	3	COMe	OH	H	H	H
556	4	COMe	OH	H	H	H
557	1	CO_2Me	OH	H	H	H
558	2	CO_2Me	OH	H	H	H
559	3	CO_2Me	OH	H	H	H
560	4	CO_2Me	OH	H	H	H
561	1	CO_2tBu	OH	H	H	H
562	2	CO_2tBu	OH	H	H	H
563	3	CO_2tBu	OH	H	H	H
564	4	CO_2tBu	OH	H	H	H
565	1	CONHMe	OH	H	H	H
566	2	CONHMe	OH	H	H	H
567	3	CONHMe	OH	H	H	H
568	4	CONHMe	OH	H	H	H
569	1	SO_2Me	OH	H	H	H
570	2	SO_2Me	OH	H	H	H
571	3	SO_2Me	OH	H	H	H
572	4	SO_2Me	OH	H	H	H
573	1	SO_2NH_2	OH	H	H	H
574	2	SO_2NH_2	OH	H	H	H
575	3	SO_2NH_2	OH	H	H	H
576	4	SO_2NH_2	OH	H	H	H
577	1	H	OMe	H	H	H
578	2	H	OMe	H	H	H
579	3	H	OMe	H	H	H
580	4	H	OMe	H	H	H
581	1	Me	OMe	H	H	H

[3138]

582	2	Me	OMe	H	H	H
583	3	Me	OMe	H	H	H
584	4	Me	OMe	H	H	H
585	1	CH_2Ph	OMe	H	H	H
586	2	CH_2Ph	OMe	H	H	H
587	3	CH_2Ph	OMe	H	H	H
588	4	CH_2Ph	OMe	H	H	H
589	1	COMe	OMe	H	H	H
590	2	COMe	OMe	H	H	H
591	3	COMe	OMe	H	H	H
592	4	COMe	OMe	H	H	H
593	1	CO_2Me	OMe	H	H	H
594	2	CO_2Me	OMe	H	H	H
595	3	CO_2Me	OMe	H	H	H
596	4	CO_2Me	OMe	H	H	H
597	1	CO_2tBu	OMe	H	H	H
598	2	CO_2tBu	OMe	H	H	H
599	3	CO_2tBu	OMe	H	H	H
600	4	CO_2tBu	OMe	H	H	H
601	1	CONHMe	OMe	H	H	H
602	2	CONHMe	OMe	H	H	H
603	3	CONHMe	OMe	H	H	H
604	4	CONHMe	OMe	H	H	H
605	1	SO_2Me	OMe	H	H	H
606	2	SO_2Me	OMe	H	H	H
607	3	SO_2Me	OMe	H	H	H
608	4	SO_2Me	OMe	H	H	H
609	1	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
610	2	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
611	3	SO_2NH_2	OMe	H	H	H

[3139]

612	4	SO_2NH_2	OMe	H	H	H
613	1	H	Me	H	H	H
614	2	H	Me	H	H	H
615	3	H	Me	H	H	H
616	4	H	Me	H	H	H
617	1	Me	Me	H	H	H
618	2	Me	Me	H	H	H
619	3	Me	Me	H	H	H
620	4	Me	Me	H	H	H
621	1	CH_2Ph	Me	H	H	H
622	2	CH_2Ph	Me	H	H	H
623	3	CH_2Ph	Me	H	H	H
624	4	CH_2Ph	Me	H	H	H
625	1	COMe	Me	H	H	H
626	2	COMe	Me	H	H	H
627	3	COMe	Me	H	H	H
628	4	COMe	Me	H	H	H
629	1	CO_2Me	Me	H	H	H
630	2	CO_2Me	Me	H	H	H
631	3	CO_2Me	Me	H	H	H
632	4	CO_2Me	Me	H	H	H
633	1	CO_2tBu	Me	H	H	H
634	2	CO_2tBu	Me	H	H	H
635	3	CO_2tBu	Me	H	H	H
636	4	CO_2tBu	Me	H	H	H
637	1	CONHMe	Me	H	H	H
638	2	CONHMe	Me	H	H	H
639	3	CONHMe	Me	H	H	H
640	4	CONHMe	Me	H	H	H
641	1	SO_2Me	Me	H	H	H

[3140]

642	2	SO_2Me	Me	H	H	H
643	3	SO_2Me	Me	H	H	H
644	4	SO_2Me	Me	H	H	H
645	1	SO_2NH_2	Me	H	H	H
646	2	SO_2NH_2	Me	H	H	H
647	3	SO_2NH_2	Me	H	H	H
648	4	SO_2NH_2	Me	H	H	H
649	1	H	CF_3	H	H	H
650	2	H	CF_3	H	H	H
651	3	H	CF_3	H	H	H
652	4	H	CF_3	H	H	H
653	1	Me	CF_3	H	H	H
654	2	Me	CF_3	H	H	H
655	3	Me	CF_3	H	H	H
656	4	Me	CF_3	H	H	H
657	1	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
658	2	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
659	3	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
660	4	CH_2Ph	CF_3	H	H	H
661	1	COMe	CF_3	H	H	H
662	2	COMe	CF_3	H	H	H
663	3	COMe	CF_3	H	H	H
664	4	COMe	CF_3	H	H	H
665	1	CO_2Me	CF_3	H	H	H
666	2	CO_2Me	CF_3	H	H	H
667	3	CO_2Me	CF_3	H	H	H
668	4	CO_2Me	CF_3	H	H	H
669	1	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
670	2	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
671	3	CO_2tBu	CF_3	H	H	H

[3141]

672	4	CO_2tBu	CF_3	H	H	H
673	1	CONHMe	CF_3	H	H	H
674	2	CONHMe	CF_3	H	H	H
675	3	CONHMe	CF_3	H	H	H
676	4	CONHMe	CF_3	H	H	H
677	1	SO_2Me	CF_3	H	H	H
678	2	SO_2Me	CF_3	H	H	H
679	3	SO_2Me	CF_3	H	H	H
680	4	SO_2Me	CF_3	H	H	H
681	1	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
682	2	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
683	3	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
684	4	SO_2NH_2	CF_3	H	H	H
685	1	H	F	H	H	H
686	2	H	F	H	H	H
687	3	H	F	H	H	H
688	3	H	F	H	H	H
689	1	Me	F	H	H	H
690	2	Me	F	H	H	H
691	3	Me	F	H	H	H
692	4	Me	F	H	H	H
693	1	CH_2Ph	F	H	H	H
694	2	CH_2Ph	F	H	H	H
695	3	CH_2Ph	F	H	H	H
696	4	CH_2Ph	F	H	H	H
697	1	COMe	F	H	H	H
698	2	COMe	F	H	H	H
699	3	COMe	F	H	H	H
700	4	COMe	F	H	H	H
701	1	CO_2Me	F	H	H	H

[3142]

702	2	CO_2Me	F	H	H	H
703	3	CO_2Me	F	H	H	H
704	4	CO_2Me	F	H	H	H
705	1	CO_2tBu	F	H	H	H
706	2	CO_2tBu	F	H	H	H
707	3	CO_2tBu	F	H	H	H
708	4	CO_2tBu	F	H	H	H
709	1	CONHMe	F	H	H	H
710	2	CONHMe	F	H	H	H
711	3	CONHMe	F	H	H	H
712	4	CONHMe	F	H	H	H
713	1	SO_2Me	F	H	H	H
714	2	SO_2Me	F	H	H	H
715	3	SO_2Me	F	H	H	H
716	4	SO_2Me	F	H	H	H
717	1	SO_2NH_2	F	H	H	H
718	2	SO_2NH_2	F	H	H	H
719	3	SO_2NH_2	F	H	H	H
720	4	SO_2NH_2	F	H	H	H
721	1	H	Cl	H	H	H
722	2	H	Cl	H	H	H
723	3	H	Cl	H	H	H
724	4	H	Cl	H	H	H
725	1	Me	Cl	H	H	H
726	2	Me	Cl	H	H	H
727	3	Me	Cl	H	H	H
728	4	Me	Cl	H	H	H
729	1	CH_2Ph	Cl	H	H	H
730	2	CH_2Ph	Cl	H	H	H
731	3	CH_2Ph	Cl	H	H	H

[3143]

732	4	CH_2Ph	Cl	H	H	H
733	1	COMe	Cl	H	H	H
734	2	COMe	Cl	H	H	H
735	3	COMe	Cl	H	H	H
736	4	COMe	Cl	H	H	H
737	1	CO_2Me	Cl	H	H	H
738	2	CO_2Me	Cl	H	H	H
739	3	CO_2Me	Cl	H	H	H
740	4	CO_2Me	Cl	H	H	H
741	1	CO_2tBu	Cl	H	H	H
742	2	CO_2tBu	Cl	H	H	H
743	3	CO_2tBu	Cl	H	H	H
744	4	CO_2tBu	Cl	H	H	H
745	1	CONHMe	Cl	H	H	H
746	2	CONHMe	Cl	H	H	H
747	3	CONHMe	Cl	H	H	H
748	4	CONHMe	Cl	H	H	H
749	1	SO_2Me	Cl	H	H	H
750	2	SO_2Me	Cl	H	H	H
751	3	SO_2Me	Cl	H	H	H
752	4	SO_2Me	Cl	H	H	H
753	1	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
754	2	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
755	3	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
756	4	SO_2NH_2	Cl	H	H	H
757	1	H	CN	H	H	H
758	2	H	CN	H	H	H
759	3	H	CN	H	H	H
760	4	H	CN	H	H	H
761	1	Me	CN	H	H	H

[3144]

762	2	Me	CN	H	H	H
763	3	Me	CN	H	H	H
764	4	Me	CN	H	H	H
765	1	CH_2Ph	CN	H	H	H
766	2	CH_2Ph	CN	H	H	H
767	3	CH_2Ph	CN	H	H	H
768	4	CH_2Ph	CN	H	H	H
769	1	COMe	CN	H	H	H
770	2	COMe	CN	H	H	H
771	3	COMe	CN	H	H	H
772	4	COMe	CN	H	H	H
773	1	CO_2Me	CN	H	H	H
774	2	CO_2Me	CN	H	H	H
775	3	CO_2Me	CN	H	H	H
776	4	CO_2Me	CN	H	H	H
777	1	CO_2tBu	CN	H	H	H
778	2	CO_2tBu	CN	H	H	H
779	3	CO_2tBu	CN	H	H	H
780	4	CO_2tBu	CN	H	H	H
781	1	CONHMe	CN	H	H	H
782	2	CONHMe	CN	H	H	H
783	3	CONHMe	CN	H	H	H
784	4	CONHMe	CN	H	H	H
785	1	SO_2Me	CN	H	H	H
786	2	SO_2Me	CN	H	H	H
787	3	SO_2Me	CN	H	H	H
788	4	SO_2Me	CN	H	H	H
789	1	SO_2NH_2	CN	H	H	H
790	2	SO_2NH_2	CN	H	H	H
791	3	SO_2NH_2	CN	H	H	H

[3145]

792	4	SO_2NH_2	CN	H	H	H
793	1	H	H	H	H	OH
794	2	H	H	H	H	OH
795	3	H	H	H	H	OH
796	4	H	H	H	H	OH
797	1	Me	H	H	H	OH
798	2	Me	H	H	H	OH
799	3	Me	H	H	H	OH
800	4	Me	H	H	H	OH
801	1	CH_2Ph	H	H	H	OH
802	2	CH_2Ph	H	H	H	OH
803	3	CH_2Ph	H	H	H	OH
804	4	CH_2Ph	H	H	H	OH
805	1	COMe	H	H	H	OH
806	2	COMe	H	H	H	OH
807	3	COMe	H	H	H	OH
808	4	COMe	H	H	H	OH
809	1	CO_2Me	H	H	H	OH
810	2	CO_2Me	H	H	H	OH
811	3	CO_2Me	H	H	H	OH
812	4	CO_2Me	H	H	H	OH
813	1	CO_2tBu	H	H	H	OH
814	2	CO_2tBu	H	H	H	OH
815	3	CO_2tBu	H	H	H	OH
816	4	CO_2tBu	H	H	H	OH
817	1	CONHMe	H	H	H	OH
818	2	CONHMe	H	H	H	OH
819	3	CONHMe	H	H	H	OH
820	4	CONHMe	H	H	H	OH
821	1	SO_2Me	H	H	H	OH

[3146]

822	2	SO_2Me	H	H	H	OH
823	3	SO_2Me	H	H	H	OH
824	4	SO_2Me	H	H	H	OH
825	1	SO_2NH_2	H	H	H	OH
826	2	SO_2NH_2	H	H	H	OH
827	3	SO_2NH_2	H	H	H	OH
828	4	SO_2NH_2	H	H	H	OH
829	1	H	H	H	H	OMe
830	2	H	H	H	H	OMe
831	3	H	H	H	H	OMe
832	4	H	H	H	H	OMe
833	1	Me	H	H	H	OMe
834	2	Me	H	H	H	OMe
835	3	Me	H	H	H	OMe
836	4	Me	H	H	H	OMe
837	1	CH_2Ph	H	H	H	OMe
838	2	CH_2Ph	H	H	H	OMe
839	3	CH_2Ph	H	H	H	OMe
840	4	CH_2Ph	H	H	H	OMe
841	1	COMe	H	H	H	OMe
842	2	COMe	H	H	H	OMe
843	3	COMe	H	H	H	OMe
844	4	COMe	H	H	H	OMe
845	1	CO_2Me	H	H	H	OMe
846	2	CO_2Me	H	H	H	OMe
847	3	CO_2Me	H	H	H	OMe
848	4	CO_2Me	H	H	H	OMe
849	1	CO_2tBu	H	H	H	OMe
850	2	CO_2tBu	H	H	H	OMe
851	3	CO_2tBu	H	H	H	OMe

[3147]

852	4	CO_2tBu	H	H	H	OMe
853	1	CONHMe	H	H	H	OMe
854	2	CONHMe	H	H	H	OMe
855	3	CONHMe	H	H	H	OMe
856	4	CONHMe	H	H	H	OMe
857	1	SO_2Me	H	H	H	OMe
858	2	SO_2Me	H	H	H	OMe
859	3	SO_2Me	H	H	H	OMe
860	4	SO_2Me	H	H	H	OMe
861	1	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
862	2	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
863	3	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
864	4	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
865	1	H	H	H	H	Me
866	2	H	H	H	H	Me
867	3	H	H	H	H	Me
868	4	H	H	H	H	Me
869	1	Me	H	H	H	Me
870	2	Me	H	H	H	Me
871	3	Me	H	H	H	Me
872	4	Me	H	H	H	Me
873	1	CH_2Ph	H	H	H	Me
874	2	CH_2Ph	H	H	H	Me
875	3	CH_2Ph	H	H	H	Me
876	4	CH_2Ph	H	H	H	Me
877	1	COMe	H	H	H	Me
878	2	COMe	H	H	H	Me
879	3	COMe	H	H	H	Me
880	4	COMe	H	H	H	Me
881	1	CO_2Me	H	H	H	Me

[3148]

882	2	CO_2Me	H	H	H	Me
883	3	CO_2Me	H	H	H	Me
884	4	CO_2Me	H	H	H	Me
885	1	CO_2tBu	H	H	H	Me
886	2	CO_2tBu	H	H	H	Me
887	3	CO_2tBu	H	H	H	Me
888	4	CO_2tBu	H	H	H	Me
889	1	CONHMe	H	H	H	Me
890	2	CONHMe	H	H	H	Me
891	3	CONHMe	H	H	H	Me
892	4	CONHMe	H	H	H	Me
893	1	SO_2Me	H	H	H	Me
894	2	SO_2Me	H	H	H	Me
895	3	SO_2Me	H	H	H	Me
896	4	SO_2Me	H	H	H	Me
897	1	SO_2NH_2	H	H	H	Me
898	2	SO_2NH_2	H	H	H	Me
899	3	SO_2NH_2	H	H	H	Me
900	4	SO_2NH_2	H	H	H	Me
901	1	H	H	H	H	CF_3
902	2	H	H	H	H	CF_3
903	3	H	H	H	H	CF_3
904	4	H	H	H	H	CF_3
905	1	Me	H	H	H	CF_3
906	2	Me	H	H	H	CF_3
907	3	Me	H	H	H	CF_3
908	4	Me	H	H	H	CF_3
909	1	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
910	2	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
911	3	CH_2Ph	H	H	H	CF_3

[3149]

912	4	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
913	1	COMe	H	H	H	CF_3
914	2	COMe	H	H	H	CF_3
915	3	COMe	H	H	H	CF_3
916	4	COMe	H	H	H	CF_3
917	1	CO_2Me	H	H	H	CF_3
918	2	CO_2Me	H	H	H	CF_3
919	3	CO_2Me	H	H	H	CF_3
920	4	CO_2Me	H	H	H	CF_3
921	1	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
922	2	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
923	3	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
924	4	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
925	1	CONHMe	H	H	H	CF_3
926	2	CONHMe	H	H	H	CF_3
927	3	CONHMe	H	H	H	CF_3
928	4	CONHMe	H	H	H	CF_3
929	1	SO_2Me	H	H	H	CF_3
930	2	SO_2Me	H	H	H	CF_3
931	3	SO_2Me	H	H	H	CF_3
932	4	SO_2Me	H	H	H	CF_3
933	1	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
934	2	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
935	3	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
936	4	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
937	1	H	H	H	H	F
938	2	H	H	H	H	F
939	3	H	H	H	H	F
940	3	H	H	H	H	F
941	1	Me	H	H	H	F

[3150]

942	2	Me	H	H	H	F
943	3	Me	H	H	H	F
944	4	Me	H	H	H	F
945	1	CH_2Ph	H	H	H	F
946	2	CH_2Ph	H	H	H	F
947	3	CH_2Ph	H	H	H	F
948	4	CH_2Ph	H	H	H	F
949	1	COMe	H	H	H	F
950	2	COMe	H	H	H	F
951	3	COMe	H	H	H	F
952	4	COMe	H	H	H	F
953	1	CO_2Me	H	H	H	F
954	2	CO_2Me	H	H	H	F
955	3	CO_2Me	H	H	H	F
956	4	CO_2Me	H	H	H	F
957	1	CO_2tBu	H	H	H	F
958	2	CO_2tBu	H	H	H	F
959	3	CO_2tBu	H	H	H	F
960	4	CO_2tBu	H	H	H	F
961	1	CONHMe	H	H	H	F
962	2	CONHMe	H	H	H	F
963	3	CONHMe	H	H	H	F
964	4	CONHMe	H	H	H	F
965	1	SO_2Me	H	H	H	F
966	2	SO_2Me	H	H	H	F
967	3	SO_2Me	H	H	H	F
968	4	SO_2Me	H	H	H	F
969	1	SO_2NH_2	H	H	H	F
970	2	SO_2NH_2	H	H	H	F
971	3	SO_2NH_2	H	H	H	F

[3151]

972	4	SO_2NH_2	H	H	H	F
973	1	H	H	H	H	Cl
974	2	H	H	H	H	Cl
975	3	H	H	H	H	Cl
976	4	H	H	H	H	Cl
977	1	Me	H	H	H	Cl
978	2	Me	H	H	H	Cl
979	3	Me	H	H	H	Cl
980	4	Me	H	H	H	Cl
981	1	CH_2Ph	H	H	H	Cl
982	2	CH_2Ph	H	H	H	Cl
983	3	CH_2Ph	H	H	H	Cl
984	4	CH_2Ph	H	H	H	Cl
985	1	COMe	H	H	H	Cl
986	2	COMe	H	H	H	Cl
987	3	COMe	H	H	H	Cl
988	4	COMe	H	H	H	Cl
989	1	CO_2Me	H	H	H	Cl
990	2	CO_2Me	H	H	H	Cl
991	3	CO_2Me	H	H	H	Cl
992	4	CO_2Me	H	H	H	Cl
993	1	CO_2tBu	H	H	H	Cl
994	2	CO_2tBu	H	H	H	Cl
995	3	CO_2tBu	H	H	H	Cl
996	4	CO_2tBu	H	H	H	Cl
997	1	CONHMe	H	H	H	Cl
998	2	CONHMe	H	H	H	Cl
999	3	CONHMe	H	H	H	Cl
1000	4	CONHMe	H	H	H	Cl
1001	1	SO_2Me	H	H	H	Cl

[3152]

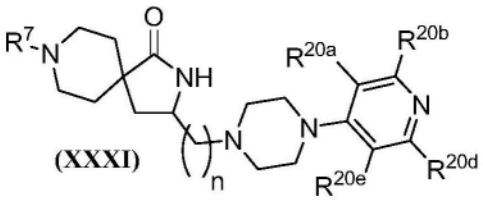
1002	2	SO_2Me	H	H	H	Cl
1003	3	SO_2Me	H	H	H	Cl
1004	4	SO_2Me	H	H	H	Cl
1005	1	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1006	2	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1007	3	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1008	4	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
1009	1	H	H	H	H	CN
1010	2	H	H	H	H	CN
1011	3	H	H	H	H	CN
1012	4	H	H	H	H	CN
1013	1	Me	H	H	H	CN
1014	2	Me	H	H	H	CN
1015	3	Me	H	H	H	CN
1016	4	Me	H	H	H	CN
1017	1	CH_2Ph	H	H	H	CN
1018	2	CH_2Ph	H	H	H	CN
1019	3	CH_2Ph	H	H	H	CN
1020	4	CH_2Ph	H	H	H	CN
1021	1	COMe	H	H	H	CN
1022	2	COMe	H	H	H	CN
1023	3	COMe	H	H	H	CN
1024	4	COMe	H	H	H	CN
1025	1	CO_2Me	H	H	H	CN
1026	2	CO_2Me	H	H	H	CN
1027	3	CO_2Me	H	H	H	CN
1028	4	CO_2Me	H	H	H	CN
1029	1	CO_2tBu	H	H	H	CN
1030	2	CO_2tBu	H	H	H	CN
1031	3	CO_2tBu	H	H	H	CN

[3153]

1032	4	CO_2tBu	H	H	H	CN
1033	1	CONHMe	H	H	H	CN
1034	2	CONHMe	H	H	H	CN
1035	3	CONHMe	H	H	H	CN
1036	4	CONHMe	H	H	H	CN
1037	1	SO_2Me	H	H	H	CN
1038	2	SO_2Me	H	H	H	CN
1039	3	SO_2Me	H	H	H	CN
1040	4	SO_2Me	H	H	H	CN
1041	1	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1042	2	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1043	3	SO_2NH_2	H	H	H	CN
1044	4	SO_2NH_2	H	H	H	CN

[3154] 示例性实施方案包括具有式(XXXI)的化合物

[3155]



(XXXI)

[3156] 或其可药用盐形式,如在下文表25中所定义。

[3157] 表25:

[3158]

条目	n	R^7	R^{20a}	R^{20b}	R^{20d}	R^{20e}
1	1	H	H	H	H	H
2	2	H	H	H	H	H
3	3	H	H	H	H	H
4	4	H	H	H	H	H
5	1	Me	H	H	H	H
6	2	Me	H	H	H	H
7	3	Me	H	H	H	H
8	4	Me	H	H	H	H
9	1	CH_2Ph	H	H	H	H

[3159]

10	2	CH_2Ph	H	H	H	H
11	3	CH_2Ph	H	H	H	H
12	4	CH_2Ph	H	H	H	H
13	1	COMe	H	H	H	H
14	2	COMe	H	H	H	H
15	3	COMe	H	H	H	H
16	4	COMe	H	H	H	H
17	1	CO_2Me	H	H	H	H
18	2	CO_2Me	H	H	H	H
19	3	CO_2Me	H	H	H	H
20	4	CO_2Me	H	H	H	H
21	1	CO_2tBu	H	H	H	H
22	2	CO_2tBu	H	H	H	H
23	3	CO_2tBu	H	H	H	H
24	4	CO_2tBu	H	H	H	H
25	1	CONHMe	H	H	H	H
26	2	CONHMe	H	H	H	H
27	3	CONHMe	H	H	H	H
28	4	CONHMe	H	H	H	H
29	1	SO_2Me	H	H	H	H
30	2	SO_2Me	H	H	H	H
31	3	SO_2Me	H	H	H	H
32	4	SO_2Me	H	H	H	H
33	1	SO_2NH_2	H	H	H	H
34	2	SO_2NH_2	H	H	H	H
35	3	SO_2NH_2	H	H	H	H
36	4	SO_2NH_2	H	H	H	H
37	1	H	H	H	OH	H
38	2	H	H	H	OH	H
39	3	H	H	H	OH	H

[3160]

40	4	H	H	H	OH	H
41	1	Me	H	H	OH	H
42	2	Me	H	H	OH	H
43	3	Me	H	H	OH	H
44	4	Me	H	H	OH	H
45	1	CH_2Ph	H	H	OH	H
46	2	CH_2Ph	H	H	OH	H
47	3	CH_2Ph	H	H	OH	H
48	4	CH_2Ph	H	H	OH	H
49	1	COMe	H	H	OH	H
50	2	COMe	H	H	OH	H
51	3	COMe	H	H	OH	H
52	4	COMe	H	H	OH	H
53	1	CO_2Me	H	H	OH	H
54	2	CO_2Me	H	H	OH	H
55	3	CO_2Me	H	H	OH	H
56	4	CO_2Me	H	H	OH	H
57	1	CO_2tBu	H	H	OH	H
58	2	CO_2tBu	H	H	OH	H
59	3	CO_2tBu	H	H	OH	H
60	4	CO_2tBu	H	H	OH	H
61	1	CONHMe	H	H	OH	H
62	2	CONHMe	H	H	OH	H
63	3	CONHMe	H	H	OH	H
64	4	CONHMe	H	H	OH	H
65	1	SO_2Me	H	H	OH	H
66	2	SO_2Me	H	H	OH	H
67	3	SO_2Me	H	H	OH	H
68	4	SO_2Me	H	H	OH	H
69	1	SO_2NH_2	H	H	OH	H

[3161]

70	2	SO_2NH_2	H	H	OH	H
71	3	SO_2NH_2	H	H	OH	H
72	4	SO_2NH_2	H	H	OH	H
73	1	H	H	H	OMe	H
74	2	H	H	H	OMe	H
75	3	H	H	H	OMe	H
76	4	H	H	H	OMe	H
77	1	Me	H	H	OMe	H
78	2	Me	H	H	OMe	H
79	3	Me	H	H	OMe	H
80	4	Me	H	H	OMe	H
81	1	CH_2Ph	H	H	OMe	H
82	2	CH_2Ph	H	H	OMe	H
83	3	CH_2Ph	H	H	OMe	H
84	4	CH_2Ph	H	H	OMe	H
85	1	COMe	H	H	OMe	H
86	2	COMe	H	H	OMe	H
87	3	COMe	H	H	OMe	H
88	4	COMe	H	H	OMe	H
89	1	CO_2Me	H	H	OMe	H
90	2	CO_2Me	H	H	OMe	H
91	3	CO_2Me	H	H	OMe	H
92	4	CO_2Me	H	H	OMe	H
93	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
94	2	CO_2tBu	H	H	OMe	H
95	3	CO_2tBu	H	H	OMe	H
96	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
97	1	CONHMe	H	H	OMe	H
98	2	CONHMe	H	H	OMe	H
99	3	CONHMe	H	H	OMe	H

[3162]

100	4	CONHMe	H	H	OMe	H
101	1	SO_2Me	H	H	OMe	H
102	2	SO_2Me	H	H	OMe	H
103	3	SO_2Me	H	H	OMe	H
104	4	SO_2Me	H	H	OMe	H
105	1	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
106	2	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
107	3	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
108	4	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
109	1	H	H	H	Me	H
110	2	H	H	H	Me	H
111	3	H	H	H	Me	H
112	4	H	H	H	Me	H
113	1	Me	H	H	Me	H
114	2	Me	H	H	Me	H
115	3	Me	H	H	Me	H
116	4	Me	H	H	Me	H
117	1	CH_2Ph	H	H	Me	H
118	2	CH_2Ph	H	H	Me	H
119	3	CH_2Ph	H	H	Me	H
120	4	CH_2Ph	H	H	Me	H
121	1	COMe	H	H	Me	H
122	2	COMe	H	H	Me	H
123	3	COMe	H	H	Me	H
124	4	COMe	H	H	Me	H
125	1	CO_2Me	H	H	Me	H
126	2	CO_2Me	H	H	Me	H
127	3	CO_2Me	H	H	Me	H
128	4	CO_2Me	H	H	Me	H
129	1	CO_2tBu	H	H	Me	H

[3163]

130	2	CO_2tBu	H	H	Me	H
131	3	CO_2tBu	H	H	Me	H
132	4	CO_2tBu	H	H	Me	H
133	1	CONHMe	H	H	Me	H
134	2	CONHMe	H	H	Me	H
135	3	CONHMe	H	H	Me	H
136	4	CONHMe	H	H	Me	H
137	1	SO_2Me	H	H	Me	H
138	2	SO_2Me	H	H	Me	H
139	3	SO_2Me	H	H	Me	H
140	4	SO_2Me	H	H	Me	H
141	1	SO_2NH_2	H	H	Me	H
142	2	SO_2NH_2	H	H	Me	H
143	3	SO_2NH_2	H	H	Me	H
144	4	SO_2NH_2	H	H	Me	H
145	1	H	H	H	CF_3	H
146	2	H	H	H	CF_3	H
147	3	H	H	H	CF_3	H
148	4	H	H	H	CF_3	H
149	1	Me	H	H	CF_3	H
150	2	Me	H	H	CF_3	H
151	3	Me	H	H	CF_3	H
152	4	Me	H	H	CF_3	H
153	1	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
154	2	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
155	3	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
156	4	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
157	1	COMe	H	H	CF_3	H
158	2	COMe	H	H	CF_3	H
159	3	COMe	H	H	CF_3	H

[3164]

160	4	COMe	H	H	CF_3	H
161	1	CO_2Me	H	H	CF_3	H
162	2	CO_2Me	H	H	CF_3	H
163	3	CO_2Me	H	H	CF_3	H
164	4	CO_2Me	H	H	CF_3	H
165	1	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
166	2	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
167	3	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
168	4	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
169	1	CONHMe	H	H	CF_3	H
170	2	CONHMe	H	H	CF_3	H
171	3	CONHMe	H	H	CF_3	H
172	4	CONHMe	H	H	CF_3	H
173	1	SO_2Me	H	H	CF_3	H
174	2	SO_2Me	H	H	CF_3	H
175	3	SO_2Me	H	H	CF_3	H
176	4	SO_2Me	H	H	CF_3	H
177	1	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
178	2	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
179	3	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
180	4	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
181	1	H	H	H	F	H
182	2	H	H	H	F	H
183	3	H	H	H	F	H
184	4	H	H	H	F	H
185	1	Me	H	H	F	H
186	2	Me	H	H	F	H
187	3	Me	H	H	F	H
188	4	Me	H	H	F	H
189	1	CH_2Ph	H	H	F	H

[3165]

190	2	CH_2Ph	H	H	F	H
191	3	CH_2Ph	H	H	F	H
192	4	CH_2Ph	H	H	F	H
193	1	COMe	H	H	F	H
194	2	COMe	H	H	F	H
195	3	COMe	H	H	F	H
196	4	COMe	H	H	F	H
197	1	CO_2Me	H	H	F	H
198	2	CO_2Me	H	H	F	H
199	3	CO_2Me	H	H	F	H
200	4	CO_2Me	H	H	F	H
201	1	CO_2tBu	H	H	F	H
202	2	CO_2tBu	H	H	F	H
203	3	CO_2tBu	H	H	F	H
204	4	CO_2tBu	H	H	F	H
205	1	CONHMe	H	H	F	H
206	2	CONHMe	H	H	F	H
207	3	CONHMe	H	H	F	H
208	4	CONHMe	H	H	F	H
209	1	SO_2Me	H	H	F	H
210	2	SO_2Me	H	H	F	H
211	3	SO_2Me	H	H	F	H
212	4	SO_2Me	H	H	F	H
213	1	SO_2NH_2	H	H	F	H
214	2	SO_2NH_2	H	H	F	H
215	3	SO_2NH_2	H	H	F	H
216	4	SO_2NH_2	H	H	F	H
217	1	H	H	H	Cl	H
218	2	H	H	H	Cl	H
219	3	H	H	H	Cl	H

[3166]

220	4	H	H	H	Cl	H
221	1	Me	H	H	Cl	H
222	2	Me	H	H	Cl	H
223	3	Me	H	H	Cl	H
224	4	Me	H	H	Cl	H
225	1	CH_2Ph	H	H	Cl	H
226	2	CH_2Ph	H	H	Cl	H
227	3	CH_2Ph	H	H	Cl	H
228	4	CH_2Ph	H	H	Cl	H
229	1	COMe	H	H	Cl	H
230	2	COMe	H	H	Cl	H
231	3	COMe	H	H	Cl	H
232	4	COMe	H	H	Cl	H
233	1	CO_2Me	H	H	Cl	H
234	2	CO_2Me	H	H	Cl	H
235	3	CO_2Me	H	H	Cl	H
236	4	CO_2Me	H	H	Cl	H
237	1	CO_2tBu	H	H	Cl	H
238	2	CO_2tBu	H	H	Cl	H
239	3	CO_2tBu	H	H	Cl	H
240	4	CO_2tBu	H	H	Cl	H
241	1	CONHMe	H	H	Cl	H
242	2	CONHMe	H	H	Cl	H
243	3	CONHMe	H	H	Cl	H
244	4	CONHMe	H	H	Cl	H
245	1	SO_2Me	H	H	Cl	H
246	2	SO_2Me	H	H	Cl	H
247	3	SO_2Me	H	H	Cl	H
248	4	SO_2Me	H	H	Cl	H
249	1	SO_2NH_2	H	H	Cl	H

[3167]

250	2	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
251	3	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
252	4	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
253	1	H	H	H	CN	H
254	2	H	H	H	CN	H
255	3	H	H	H	CN	H
256	4	H	H	H	CN	H
257	1	Me	H	H	CN	H
258	2	Me	H	H	CN	H
259	3	Me	H	H	CN	H
260	4	Me	H	H	CN	H
261	1	CH_2Ph	H	H	CN	H
262	2	CH_2Ph	H	H	CN	H
263	3	CH_2Ph	H	H	CN	H
264	4	CH_2Ph	H	H	CN	H
265	1	COMe	H	H	CN	H
266	2	COMe	H	H	CN	H
267	3	COMe	H	H	CN	H
268	4	COMe	H	H	CN	H
269	1	CO_2Me	H	H	CN	H
270	2	CO_2Me	H	H	CN	H
271	3	CO_2Me	H	H	CN	H
272	4	CO_2Me	H	H	CN	H
273	1	CO_2tBu	H	H	CN	H
274	2	CO_2tBu	H	H	CN	H
275	3	CO_2tBu	H	H	CN	H
276	4	CO_2tBu	H	H	CN	H
277	1	CONHMe	H	H	CN	H
278	2	CONHMe	H	H	CN	H
279	3	CONHMe	H	H	CN	H

[3168]

280	4	CONHMe	H	H	CN	H
281	1	SO_2Me	H	H	CN	H
282	2	SO_2Me	H	H	CN	H
283	3	SO_2Me	H	H	CN	H
284	4	SO_2Me	H	H	CN	H
285	1	SO_2NH_2	H	H	CN	H
286	2	SO_2NH_2	H	H	CN	H
287	3	SO_2NH_2	H	H	CN	H
288	4	SO_2NH_2	H	H	CN	H
289	1	H	H	H	H	OH
290	2	H	H	H	H	OH
291	3	H	H	H	H	OH
292	4	H	H	H	H	OH
293	1	Me	H	H	H	OH
294	2	Me	H	H	H	OH
295	3	Me	H	H	H	OH
296	4	Me	H	H	H	OH
297	1	CH_2Ph	H	H	H	OH
298	2	CH_2Ph	H	H	H	OH
299	3	CH_2Ph	H	H	H	OH
300	4	CH_2Ph	H	H	H	OH
301	1	COMe	H	H	H	OH
302	2	COMe	H	H	H	OH
303	3	COMe	H	H	H	OH
304	4	COMe	H	H	H	OH
305	1	CO_2Me	H	H	H	OH
306	2	CO_2Me	H	H	H	OH
307	3	CO_2Me	H	H	H	OH
308	4	CO_2Me	H	H	H	OH
309	1	CO_2tBu	H	H	H	OH

[3169]

310	2	CO_2tBu	H	H	H	OH
311	3	CO_2tBu	H	H	H	OH
312	4	CO_2tBu	H	H	H	OH
313	1	CONHMe	H	H	H	OH
314	2	CONHMe	H	H	H	OH
315	3	CONHMe	H	H	H	OH
316	4	CONHMe	H	H	H	OH
317	1	SO_2Me	H	H	H	OH
318	2	SO_2Me	H	H	H	OH
319	3	SO_2Me	H	H	H	OH
320	4	SO_2Me	H	H	H	OH
321	1	SO_2NH_2	H	H	H	OH
322	2	SO_2NH_2	H	H	H	OH
323	3	SO_2NH_2	H	H	H	OH
324	4	SO_2NH_2	H	H	H	OH
325	1	H	H	H	H	OMe
326	2	H	H	H	H	OMe
327	3	H	H	H	H	OMe
328	4	H	H	H	H	OMe
329	1	Me	H	H	H	OMe
330	2	Me	H	H	H	OMe
331	3	Me	H	H	H	OMe
332	4	Me	H	H	H	OMe
333	1	CH_2Ph	H	H	H	OMe
334	2	CH_2Ph	H	H	H	OMe
335	3	CH_2Ph	H	H	H	OMe
336	4	CH_2Ph	H	H	H	OMe
337	1	COMe	H	H	H	OMe
338	2	COMe	H	H	H	OMe
339	3	COMe	H	H	H	OMe

[3170]

340	4	COMe	H	H	H	OMe
341	1	CO_2Me	H	H	H	OMe
342	2	CO_2Me	H	H	H	OMe
343	3	CO_2Me	H	H	H	OMe
344	4	CO_2Me	H	H	H	OMe
345	1	CO_2tBu	H	H	H	OMe
346	2	CO_2tBu	H	H	H	OMe
347	3	CO_2tBu	H	H	H	OMe
348	4	CO_2tBu	H	H	H	OMe
349	1	CONHMe	H	H	H	OMe
350	2	CONHMe	H	H	H	OMe
351	3	CONHMe	H	H	H	OMe
352	4	CONHMe	H	H	H	OMe
353	1	SO_2Me	H	H	H	OMe
354	2	SO_2Me	H	H	H	OMe
355	3	SO_2Me	H	H	H	OMe
356	4	SO_2Me	H	H	H	OMe
357	1	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
358	2	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
359	3	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
360	4	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
361	1	H	H	H	H	Me
362	2	H	H	H	H	Me
363	3	H	H	H	H	Me
364	4	H	H	H	H	Me
365	1	Me	H	H	H	Me
366	2	Me	H	H	H	Me
367	3	Me	H	H	H	Me
368	4	Me	H	H	H	Me
369	1	CH_2Ph	H	H	H	Me

[3171]

370	2	CH_2Ph	H	H	H	Me
371	3	CH_2Ph	H	H	H	Me
372	4	CH_2Ph	H	H	H	Me
373	1	COMe	H	H	H	Me
374	2	COMe	H	H	H	Me
375	3	COMe	H	H	H	Me
376	4	COMe	H	H	H	Me
377	1	CO_2Me	H	H	H	Me
378	2	CO_2Me	H	H	H	Me
379	3	CO_2Me	H	H	H	Me
380	4	CO_2Me	H	H	H	Me
381	1	CO_2tBu	H	H	H	Me
382	2	CO_2tBu	H	H	H	Me
383	3	CO_2tBu	H	H	H	Me
384	4	CO_2tBu	H	H	H	Me
385	1	CONHMe	H	H	H	Me
386	2	CONHMe	H	H	H	Me
387	3	CONHMe	H	H	H	Me
388	4	CONHMe	H	H	H	Me
389	1	SO_2Me	H	H	H	Me
390	2	SO_2Me	H	H	H	Me
391	3	SO_2Me	H	H	H	Me
392	4	SO_2Me	H	H	H	Me
393	1	SO_2NH_2	H	H	H	Me
394	2	SO_2NH_2	H	H	H	Me
395	3	SO_2NH_2	H	H	H	Me
396	4	SO_2NH_2	H	H	H	Me
397	1	H	H	H	H	CF_3
398	2	H	H	H	H	CF_3
399	3	H	H	H	H	CF_3

[3172]

400	4	H	H	H	H	CF_3
401	1	Me	H	H	H	CF_3
402	2	Me	H	H	H	CF_3
403	3	Me	H	H	H	CF_3
404	4	Me	H	H	H	CF_3
405	1	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
406	2	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
407	3	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
408	4	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
409	1	COMe	H	H	H	CF_3
410	2	COMe	H	H	H	CF_3
411	3	COMe	H	H	H	CF_3
412	4	COMe	H	H	H	CF_3
413	1	CO_2Me	H	H	H	CF_3
414	2	CO_2Me	H	H	H	CF_3
415	3	CO_2Me	H	H	H	CF_3
416	4	CO_2Me	H	H	H	CF_3
417	1	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
418	2	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
419	3	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
420	4	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
421	1	CONHMe	H	H	H	CF_3
422	2	CONHMe	H	H	H	CF_3
423	3	CONHMe	H	H	H	CF_3
424	4	CONHMe	H	H	H	CF_3
425	1	SO_2Me	H	H	H	CF_3
426	2	SO_2Me	H	H	H	CF_3
427	3	SO_2Me	H	H	H	CF_3
428	4	SO_2Me	H	H	H	CF_3
429	1	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3

[3173]

430	2	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
431	3	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
432	4	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
433	1	H	H	H	H	F
434	2	H	H	H	H	F
435	3	H	H	H	H	F
436	3	H	H	H	H	F
437	1	Me	H	H	H	F
438	2	Me	H	H	H	F
439	3	Me	H	H	H	F
440	4	Me	H	H	H	F
441	1	CH_2Ph	H	H	H	F
442	2	CH_2Ph	H	H	H	F
443	3	CH_2Ph	H	H	H	F
444	4	CH_2Ph	H	H	H	F
445	1	COMe	H	H	H	F
446	2	COMe	H	H	H	F
447	3	COMe	H	H	H	F
448	4	COMe	H	H	H	F
449	1	CO_2Me	H	H	H	F
450	2	CO_2Me	H	H	H	F
451	3	CO_2Me	H	H	H	F
452	4	CO_2Me	H	H	H	F
453	1	CO_2tBu	H	H	H	F
454	2	CO_2tBu	H	H	H	F
455	3	CO_2tBu	H	H	H	F
456	4	CO_2tBu	H	H	H	F
457	1	CONHMe	H	H	H	F
458	2	CONHMe	H	H	H	F
459	3	CONHMe	H	H	H	F

[3174]

460	4	CONHMe	H	H	H	F
461	1	SO_2Me	H	H	H	F
462	2	SO_2Me	H	H	H	F
463	3	SO_2Me	H	H	H	F
464	4	SO_2Me	H	H	H	F
465	1	SO_2NH_2	H	H	H	F
466	2	SO_2NH_2	H	H	H	F
467	3	SO_2NH_2	H	H	H	F
468	4	SO_2NH_2	H	H	H	F
469	1	H	H	H	H	Cl
470	2	H	H	H	H	Cl
471	3	H	H	H	H	Cl
472	4	H	H	H	H	Cl
473	1	Me	H	H	H	Cl
474	2	Me	H	H	H	Cl
475	3	Me	H	H	H	Cl
476	4	Me	H	H	H	Cl
477	1	CH_2Ph	H	H	H	Cl
478	2	CH_2Ph	H	H	H	Cl
479	3	CH_2Ph	H	H	H	Cl
480	4	CH_2Ph	H	H	H	Cl
481	1	COMe	H	H	H	Cl
482	2	COMe	H	H	H	Cl
483	3	COMe	H	H	H	Cl
484	4	COMe	H	H	H	Cl
485	1	CO_2Me	H	H	H	Cl
486	2	CO_2Me	H	H	H	Cl
487	3	CO_2Me	H	H	H	Cl
488	4	CO_2Me	H	H	H	Cl
489	1	CO_2tBu	H	H	H	Cl

[3175]

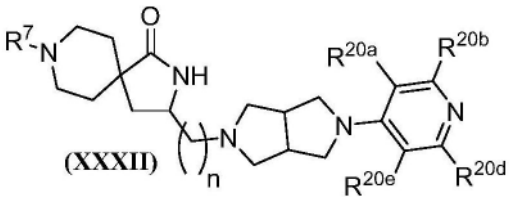
490	2	CO_2tBu	H	H	H	Cl
491	3	CO_2tBu	H	H	H	Cl
492	4	CO_2tBu	H	H	H	Cl
493	1	CONHMe	H	H	H	Cl
494	2	CONHMe	H	H	H	Cl
495	3	CONHMe	H	H	H	Cl
496	4	CONHMe	H	H	H	Cl
497	1	SO_2Me	H	H	H	Cl
498	2	SO_2Me	H	H	H	Cl
499	3	SO_2Me	H	H	H	Cl
500	4	SO_2Me	H	H	H	Cl
501	1	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
502	2	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
503	3	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
504	4	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
505	1	H	H	H	H	CN
506	2	H	H	H	H	CN
507	3	H	H	H	H	CN
508	4	H	H	H	H	CN
509	1	Me	H	H	H	CN
510	2	Me	H	H	H	CN
511	3	Me	H	H	H	CN
512	4	Me	H	H	H	CN
513	1	CH_2Ph	H	H	H	CN
514	2	CH_2Ph	H	H	H	CN
515	3	CH_2Ph	H	H	H	CN
516	4	CH_2Ph	H	H	H	CN
517	1	COMe	H	H	H	CN
518	2	COMe	H	H	H	CN
519	3	COMe	H	H	H	CN

520	4	COMe	H	H	H	CN
521	1	CO_2Me	H	H	H	CN
522	2	CO_2Me	H	H	H	CN
523	3	CO_2Me	H	H	H	CN
524	4	CO_2Me	H	H	H	CN
525	1	CO_2tBu	H	H	H	CN
526	2	CO_2tBu	H	H	H	CN
527	3	CO_2tBu	H	H	H	CN
528	4	CO_2tBu	H	H	H	CN
529	1	CONHMe	H	H	H	CN
530	2	CONHMe	H	H	H	CN
531	3	CONHMe	H	H	H	CN
532	4	CONHMe	H	H	H	CN
533	1	SO_2Me	H	H	H	CN
534	2	SO_2Me	H	H	H	CN
535	3	SO_2Me	H	H	H	CN
536	4	SO_2Me	H	H	H	CN
537	1	SO_2NH_2	H	H	H	CN
538	2	SO_2NH_2	H	H	H	CN
539	3	SO_2NH_2	H	H	H	CN
540	4	SO_2NH_2	H	H	H	CN

[3176]

[3177] 示例性实施方案包括具有式(XXXII)的化合物

[3178]



(XXXII)

[3179] 或其可药用盐形式,如在下文表26中所定义。

[3180] 表26:

[3181]

条目	n	R^7	R^{20a}	R^{20b}	R^{20d}	R^{20e}
1	1	H	H	H	H	H

[3182]

2	2	H	H	H	H	H
3	3	H	H	H	H	H
4	4	H	H	H	H	H
5	1	Me	H	H	H	H
6	2	Me	H	H	H	H
7	3	Me	H	H	H	H
8	4	Me	H	H	H	H
9	1	CH_2Ph	H	H	H	H
10	2	CH_2Ph	H	H	H	H
11	3	CH_2Ph	H	H	H	H
12	4	CH_2Ph	H	H	H	H
13	1	COMe	H	H	H	H
14	2	COMe	H	H	H	H
15	3	COMe	H	H	H	H
16	4	COMe	H	H	H	H
17	1	CO_2Me	H	H	H	H
18	2	CO_2Me	H	H	H	H
19	3	CO_2Me	H	H	H	H
20	4	CO_2Me	H	H	H	H
21	1	CO_2tBu	H	H	H	H
22	2	CO_2tBu	H	H	H	H
23	3	CO_2tBu	H	H	H	H
24	4	CO_2tBu	H	H	H	H
25	1	CONHMe	H	H	H	H
26	2	CONHMe	H	H	H	H
27	3	CONHMe	H	H	H	H
28	4	CONHMe	H	H	H	H
29	1	SO_2Me	H	H	H	H
30	2	SO_2Me	H	H	H	H
31	3	SO_2Me	H	H	H	H

[3183]

32	4	SO_2Me	H	H	H	H
33	1	SO_2NH_2	H	H	H	H
34	2	SO_2NH_2	H	H	H	H
35	3	SO_2NH_2	H	H	H	H
36	4	SO_2NH_2	H	H	H	H
37	1	H	H	H	OH	H
38	2	H	H	H	OH	H
39	3	H	H	H	OH	H
40	4	H	H	H	OH	H
41	1	Me	H	H	OH	H
42	2	Me	H	H	OH	H
43	3	Me	H	H	OH	H
44	4	Me	H	H	OH	H
45	1	CH_2Ph	H	H	OH	H
46	2	CH_2Ph	H	H	OH	H
47	3	CH_2Ph	H	H	OH	H
48	4	CH_2Ph	H	H	OH	H
49	1	COMe	H	H	OH	H
50	2	COMe	H	H	OH	H
51	3	COMe	H	H	OH	H
52	4	COMe	H	H	OH	H
53	1	CO_2Me	H	H	OH	H
54	2	CO_2Me	H	H	OH	H
55	3	CO_2Me	H	H	OH	H
56	4	CO_2Me	H	H	OH	H
57	1	CO_2tBu	H	H	OH	H
58	2	CO_2tBu	H	H	OH	H
59	3	CO_2tBu	H	H	OH	H
60	4	CO_2tBu	H	H	OH	H
61	1	CONHMe	H	H	OH	H

[3184]

62	2	CONHMe	H	H	OH	H
63	3	CONHMe	H	H	OH	H
64	4	CONHMe	H	H	OH	H
65	1	SO_2Me	H	H	OH	H
66	2	SO_2Me	H	H	OH	H
67	3	SO_2Me	H	H	OH	H
68	4	SO_2Me	H	H	OH	H
69	1	SO_2NH_2	H	H	OH	H
70	2	SO_2NH_2	H	H	OH	H
71	3	SO_2NH_2	H	H	OH	H
72	4	SO_2NH_2	H	H	OH	H
73	1	H	H	H	OMe	H
74	2	H	H	H	OMe	H
75	3	H	H	H	OMe	H
76	4	H	H	H	OMe	H
77	1	Me	H	H	OMe	H
78	2	Me	H	H	OMe	H
79	3	Me	H	H	OMe	H
80	4	Me	H	H	OMe	H
81	1	CH_2Ph	H	H	OMe	H
82	2	CH_2Ph	H	H	OMe	H
83	3	CH_2Ph	H	H	OMe	H
84	4	CH_2Ph	H	H	OMe	H
85	1	COMe	H	H	OMe	H
86	2	COMe	H	H	OMe	H
87	3	COMe	H	H	OMe	H
88	4	COMe	H	H	OMe	H
89	1	CO_2Me	H	H	OMe	H
90	2	CO_2Me	H	H	OMe	H
91	3	CO_2Me	H	H	OMe	H

[3185]

92	4	CO_2Me	H	H	OMe	H
93	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
94	2	CO_2tBu	H	H	OMe	H
95	3	CO_2tBu	H	H	OMe	H
96	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
97	1	CONHMe	H	H	OMe	H
98	2	CONHMe	H	H	OMe	H
99	3	CONHMe	H	H	OMe	H
100	4	CONHMe	H	H	OMe	H
101	1	SO_2Me	H	H	OMe	H
102	2	SO_2Me	H	H	OMe	H
103	3	SO_2Me	H	H	OMe	H
104	4	SO_2Me	H	H	OMe	H
105	1	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
106	2	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
107	3	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
108	4	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
109	1	H	H	H	Me	H
110	2	H	H	H	Me	H
111	3	H	H	H	Me	H
112	4	H	H	H	Me	H
113	1	Me	H	H	Me	H
114	2	Me	H	H	Me	H
115	3	Me	H	H	Me	H
116	4	Me	H	H	Me	H
117	1	CH_2Ph	H	H	Me	H
118	2	CH_2Ph	H	H	Me	H
119	3	CH_2Ph	H	H	Me	H
120	4	CH_2Ph	H	H	Me	H
121	1	COMe	H	H	Me	H

[3186]

122	2	COMe	H	H	Me	H
123	3	COMe	H	H	Me	H
124	4	COMe	H	H	Me	H
125	1	CO_2Me	H	H	Me	H
126	2	CO_2Me	H	H	Me	H
127	3	CO_2Me	H	H	Me	H
128	4	CO_2Me	H	H	Me	H
129	1	CO_2tBu	H	H	Me	H
130	2	CO_2tBu	H	H	Me	H
131	3	CO_2tBu	H	H	Me	H
132	4	CO_2tBu	H	H	Me	H
133	1	CONHMe	H	H	Me	H
134	2	CONHMe	H	H	Me	H
135	3	CONHMe	H	H	Me	H
136	4	CONHMe	H	H	Me	H
137	1	SO_2Me	H	H	Me	H
138	2	SO_2Me	H	H	Me	H
139	3	SO_2Me	H	H	Me	H
140	4	SO_2Me	H	H	Me	H
141	1	SO_2NH_2	H	H	Me	H
142	2	SO_2NH_2	H	H	Me	H
143	3	SO_2NH_2	H	H	Me	H
144	4	SO_2NH_2	H	H	Me	H
145	1	H	H	H	CF_3	H
146	2	H	H	H	CF_3	H
147	3	H	H	H	CF_3	H
148	4	H	H	H	CF_3	H
149	1	Me	H	H	CF_3	H
150	2	Me	H	H	CF_3	H
151	3	Me	H	H	CF_3	H

[3187]

152	4	Me	H	H	CF_3	H
153	1	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
154	2	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
155	3	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
156	4	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
157	1	COMe	H	H	CF_3	H
158	2	COMe	H	H	CF_3	H
159	3	COMe	H	H	CF_3	H
160	4	COMe	H	H	CF_3	H
161	1	CO_2Me	H	H	CF_3	H
162	2	CO_2Me	H	H	CF_3	H
163	3	CO_2Me	H	H	CF_3	H
164	4	CO_2Me	H	H	CF_3	H
165	1	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
166	2	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
167	3	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
168	4	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
169	1	CONHMe	H	H	CF_3	H
170	2	CONHMe	H	H	CF_3	H
171	3	CONHMe	H	H	CF_3	H
172	4	CONHMe	H	H	CF_3	H
173	1	SO_2Me	H	H	CF_3	H
174	2	SO_2Me	H	H	CF_3	H
175	3	SO_2Me	H	H	CF_3	H
176	4	SO_2Me	H	H	CF_3	H
177	1	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
178	2	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
179	3	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
180	4	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
181	1	H	H	H	F	H

[3188]

182	2	H	H	H	F	H
183	3	H	H	H	F	H
184	4	H	H	H	F	H
185	1	Me	H	H	F	H
186	2	Me	H	H	F	H
187	3	Me	H	H	F	H
188	4	Me	H	H	F	H
189	1	CH_2Ph	H	H	F	H
190	2	CH_2Ph	H	H	F	H
191	3	CH_2Ph	H	H	F	H
192	4	CH_2Ph	H	H	F	H
193	1	COMe	H	H	F	H
194	2	COMe	H	H	F	H
195	3	COMe	H	H	F	H
196	4	COMe	H	H	F	H
197	1	CO_2Me	H	H	F	H
198	2	CO_2Me	H	H	F	H
199	3	CO_2Me	H	H	F	H
200	4	CO_2Me	H	H	F	H
201	1	CO_2tBu	H	H	F	H
202	2	CO_2tBu	H	H	F	H
203	3	CO_2tBu	H	H	F	H
204	4	CO_2tBu	H	H	F	H
205	1	CONHMe	H	H	F	H
206	2	CONHMe	H	H	F	H
207	3	CONHMe	H	H	F	H
208	4	CONHMe	H	H	F	H
209	1	SO_2Me	H	H	F	H
210	2	SO_2Me	H	H	F	H
211	3	SO_2Me	H	H	F	H

[3189]

212	4	SO_2Me	H	H	F	H
213	1	SO_2NH_2	H	H	F	H
214	2	SO_2NH_2	H	H	F	H
215	3	SO_2NH_2	H	H	F	H
216	4	SO_2NH_2	H	H	F	H
217	1	H	H	H	Cl	H
218	2	H	H	H	Cl	H
219	3	H	H	H	Cl	H
220	4	H	H	H	Cl	H
221	1	Me	H	H	Cl	H
222	2	Me	H	H	Cl	H
223	3	Me	H	H	Cl	H
224	4	Me	H	H	Cl	H
225	1	CH_2Ph	H	H	Cl	H
226	2	CH_2Ph	H	H	Cl	H
227	3	CH_2Ph	H	H	Cl	H
228	4	CH_2Ph	H	H	Cl	H
229	1	COMe	H	H	Cl	H
230	2	COMe	H	H	Cl	H
231	3	COMe	H	H	Cl	H
232	4	COMe	H	H	Cl	H
233	1	CO_2Me	H	H	Cl	H
234	2	CO_2Me	H	H	Cl	H
235	3	CO_2Me	H	H	Cl	H
236	4	CO_2Me	H	H	Cl	H
237	1	CO_2tBu	H	H	Cl	H
238	2	CO_2tBu	H	H	Cl	H
239	3	CO_2tBu	H	H	Cl	H
240	4	CO_2tBu	H	H	Cl	H
241	1	CONHMe	H	H	Cl	H

[3190]

242	2	CONHMe	H	H	Cl	H
243	3	CONHMe	H	H	Cl	H
244	4	CONHMe	H	H	Cl	H
245	1	SO_2Me	H	H	Cl	H
246	2	SO_2Me	H	H	Cl	H
247	3	SO_2Me	H	H	Cl	H
248	4	SO_2Me	H	H	Cl	H
249	1	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
250	2	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
251	3	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
252	4	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
253	1	H	H	H	CN	H
254	2	H	H	H	CN	H
255	3	H	H	H	CN	H
256	4	H	H	H	CN	H
257	1	Me	H	H	CN	H
258	2	Me	H	H	CN	H
259	3	Me	H	H	CN	H
260	4	Me	H	H	CN	H
261	1	CH_2Ph	H	H	CN	H
262	2	CH_2Ph	H	H	CN	H
263	3	CH_2Ph	H	H	CN	H
264	4	CH_2Ph	H	H	CN	H
265	1	COMe	H	H	CN	H
266	2	COMe	H	H	CN	H
267	3	COMe	H	H	CN	H
268	4	COMe	H	H	CN	H
269	1	CO_2Me	H	H	CN	H
270	2	CO_2Me	H	H	CN	H
271	3	CO_2Me	H	H	CN	H

[3191]

272	4	CO_2Me	H	H	CN	H
273	1	CO_2tBu	H	H	CN	H
274	2	CO_2tBu	H	H	CN	H
275	3	CO_2tBu	H	H	CN	H
276	4	CO_2tBu	H	H	CN	H
277	1	CONHMe	H	H	CN	H
278	2	CONHMe	H	H	CN	H
279	3	CONHMe	H	H	CN	H
280	4	CONHMe	H	H	CN	H
281	1	SO_2Me	H	H	CN	H
282	2	SO_2Me	H	H	CN	H
283	3	SO_2Me	H	H	CN	H
284	4	SO_2Me	H	H	CN	H
285	1	SO_2NH_2	H	H	CN	H
286	2	SO_2NH_2	H	H	CN	H
287	3	SO_2NH_2	H	H	CN	H
288	4	SO_2NH_2	H	H	CN	H
289	1	H	H	H	H	OH
290	2	H	H	H	H	OH
291	3	H	H	H	H	OH
292	4	H	H	H	H	OH
293	1	Me	H	H	H	OH
294	2	Me	H	H	H	OH
295	3	Me	H	H	H	OH
296	4	Me	H	H	H	OH
297	1	CH_2Ph	H	H	H	OH
298	2	CH_2Ph	H	H	H	OH
299	3	CH_2Ph	H	H	H	OH
300	4	CH_2Ph	H	H	H	OH
301	1	COMe	H	H	H	OH

[3192]

302	2	COMe	H	H	H	OH
303	3	COMe	H	H	H	OH
304	4	COMe	H	H	H	OH
305	1	CO_2Me	H	H	H	OH
306	2	CO_2Me	H	H	H	OH
307	3	CO_2Me	H	H	H	OH
308	4	CO_2Me	H	H	H	OH
309	1	CO_2tBu	H	H	H	OH
310	2	CO_2tBu	H	H	H	OH
311	3	CO_2tBu	H	H	H	OH
312	4	CO_2tBu	H	H	H	OH
313	1	CONHMe	H	H	H	OH
314	2	CONHMe	H	H	H	OH
315	3	CONHMe	H	H	H	OH
316	4	CONHMe	H	H	H	OH
317	1	SO_2Me	H	H	H	OH
318	2	SO_2Me	H	H	H	OH
319	3	SO_2Me	H	H	H	OH
320	4	SO_2Me	H	H	H	OH
321	1	SO_2NH_2	H	H	H	OH
322	2	SO_2NH_2	H	H	H	OH
323	3	SO_2NH_2	H	H	H	OH
324	4	SO_2NH_2	H	H	H	OH
325	1	H	H	H	H	OMe
326	2	H	H	H	H	OMe
327	3	H	H	H	H	OMe
328	4	H	H	H	H	OMe
329	1	Me	H	H	H	OMe
330	2	Me	H	H	H	OMe
331	3	Me	H	H	H	OMe

[3193]

332	4	Me	H	H	H	OMe
333	1	CH_2Ph	H	H	H	OMe
334	2	CH_2Ph	H	H	H	OMe
335	3	CH_2Ph	H	H	H	OMe
336	4	CH_2Ph	H	H	H	OMe
337	1	COMe	H	H	H	OMe
338	2	COMe	H	H	H	OMe
339	3	COMe	H	H	H	OMe
340	4	COMe	H	H	H	OMe
341	1	CO_2Me	H	H	H	OMe
342	2	CO_2Me	H	H	H	OMe
343	3	CO_2Me	H	H	H	OMe
344	4	CO_2Me	H	H	H	OMe
345	1	CO_2tBu	H	H	H	OMe
346	2	CO_2tBu	H	H	H	OMe
347	3	CO_2tBu	H	H	H	OMe
348	4	CO_2tBu	H	H	H	OMe
349	1	CONHMe	H	H	H	OMe
350	2	CONHMe	H	H	H	OMe
351	3	CONHMe	H	H	H	OMe
352	4	CONHMe	H	H	H	OMe
353	1	SO_2Me	H	H	H	OMe
354	2	SO_2Me	H	H	H	OMe
355	3	SO_2Me	H	H	H	OMe
356	4	SO_2Me	H	H	H	OMe
357	1	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
358	2	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
359	3	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
360	4	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
361	1	H	H	H	H	Me

[3194]

362	2	H	H	H	H	Me
363	3	H	H	H	H	Me
364	4	H	H	H	H	Me
365	1	Me	H	H	H	Me
366	2	Me	H	H	H	Me
367	3	Me	H	H	H	Me
368	4	Me	H	H	H	Me
369	1	CH_2Ph	H	H	H	Me
370	2	CH_2Ph	H	H	H	Me
371	3	CH_2Ph	H	H	H	Me
372	4	CH_2Ph	H	H	H	Me
373	1	COMe	H	H	H	Me
374	2	COMe	H	H	H	Me
375	3	COMe	H	H	H	Me
376	4	COMe	H	H	H	Me
377	1	CO_2Me	H	H	H	Me
378	2	CO_2Me	H	H	H	Me
379	3	CO_2Me	H	H	H	Me
380	4	CO_2Me	H	H	H	Me
381	1	CO_2tBu	H	H	H	Me
382	2	CO_2tBu	H	H	H	Me
383	3	CO_2tBu	H	H	H	Me
384	4	CO_2tBu	H	H	H	Me
385	1	CONHMe	H	H	H	Me
386	2	CONHMe	H	H	H	Me
387	3	CONHMe	H	H	H	Me
388	4	CONHMe	H	H	H	Me
389	1	SO_2Me	H	H	H	Me
390	2	SO_2Me	H	H	H	Me
391	3	SO_2Me	H	H	H	Me

[3195]

392	4	SO_2Me	H	H	H	Me
393	1	SO_2NH_2	H	H	H	Me
394	2	SO_2NH_2	H	H	H	Me
395	3	SO_2NH_2	H	H	H	Me
396	4	SO_2NH_2	H	H	H	Me
397	1	H	H	H	H	CF_3
398	2	H	H	H	H	CF_3
399	3	H	H	H	H	CF_3
400	4	H	H	H	H	CF_3
401	1	Me	H	H	H	CF_3
402	2	Me	H	H	H	CF_3
403	3	Me	H	H	H	CF_3
404	4	Me	H	H	H	CF_3
405	1	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
406	2	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
407	3	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
408	4	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
409	1	COMe	H	H	H	CF_3
410	2	COMe	H	H	H	CF_3
411	3	COMe	H	H	H	CF_3
412	4	COMe	H	H	H	CF_3
413	1	CO_2Me	H	H	H	CF_3
414	2	CO_2Me	H	H	H	CF_3
415	3	CO_2Me	H	H	H	CF_3
416	4	CO_2Me	H	H	H	CF_3
417	1	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
418	2	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
419	3	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
420	4	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
421	1	CONHMe	H	H	H	CF_3

[3196]

422	2	CONHMe	H	H	H	CF_3
423	3	CONHMe	H	H	H	CF_3
424	4	CONHMe	H	H	H	CF_3
425	1	SO_2Me	H	H	H	CF_3
426	2	SO_2Me	H	H	H	CF_3
427	3	SO_2Me	H	H	H	CF_3
428	4	SO_2Me	H	H	H	CF_3
429	1	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
430	2	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
431	3	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
432	4	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
433	1	H	H	H	H	F
434	2	H	H	H	H	F
435	3	H	H	H	H	F
436	3	H	H	H	H	F
437	1	Me	H	H	H	F
438	2	Me	H	H	H	F
439	3	Me	H	H	H	F
440	4	Me	H	H	H	F
441	1	CH_2Ph	H	H	H	F
442	2	CH_2Ph	H	H	H	F
443	3	CH_2Ph	H	H	H	F
444	4	CH_2Ph	H	H	H	F
445	1	COMe	H	H	H	F
446	2	COMe	H	H	H	F
447	3	COMe	H	H	H	F
448	4	COMe	H	H	H	F
449	1	CO_2Me	H	H	H	F
450	2	CO_2Me	H	H	H	F
451	3	CO_2Me	H	H	H	F

[3197]

452	4	CO_2Me	H	H	H	F
453	1	CO_2tBu	H	H	H	F
454	2	CO_2tBu	H	H	H	F
455	3	CO_2tBu	H	H	H	F
456	4	CO_2tBu	H	H	H	F
457	1	CONHMe	H	H	H	F
458	2	CONHMe	H	H	H	F
459	3	CONHMe	H	H	H	F
460	4	CONHMe	H	H	H	F
461	1	SO_2Me	H	H	H	F
462	2	SO_2Me	H	H	H	F
463	3	SO_2Me	H	H	H	F
464	4	SO_2Me	H	H	H	F
465	1	SO_2NH_2	H	H	H	F
466	2	SO_2NH_2	H	H	H	F
467	3	SO_2NH_2	H	H	H	F
468	4	SO_2NH_2	H	H	H	F
469	1	H	H	H	H	Cl
470	2	H	H	H	H	Cl
471	3	H	H	H	H	Cl
472	4	H	H	H	H	Cl
473	1	Me	H	H	H	Cl
474	2	Me	H	H	H	Cl
475	3	Me	H	H	H	Cl
476	4	Me	H	H	H	Cl
477	1	CH_2Ph	H	H	H	Cl
478	2	CH_2Ph	H	H	H	Cl
479	3	CH_2Ph	H	H	H	Cl
480	4	CH_2Ph	H	H	H	Cl
481	1	COMe	H	H	H	Cl

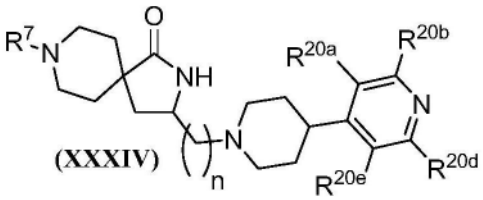
[3198]

482	2	COMe	H	H	H	Cl
483	3	COMe	H	H	H	Cl
484	4	COMe	H	H	H	Cl
485	1	CO_2Me	H	H	H	Cl
486	2	CO_2Me	H	H	H	Cl
487	3	CO_2Me	H	H	H	Cl
488	4	CO_2Me	H	H	H	Cl
489	1	CO_2tBu	H	H	H	Cl
490	2	CO_2tBu	H	H	H	Cl
491	3	CO_2tBu	H	H	H	Cl
492	4	CO_2tBu	H	H	H	Cl
493	1	CONHMe	H	H	H	Cl
494	2	CONHMe	H	H	H	Cl
495	3	CONHMe	H	H	H	Cl
496	4	CONHMe	H	H	H	Cl
497	1	SO_2Me	H	H	H	Cl
498	2	SO_2Me	H	H	H	Cl
499	3	SO_2Me	H	H	H	Cl
500	4	SO_2Me	H	H	H	Cl
501	1	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
502	2	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
503	3	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
504	4	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
505	1	H	H	H	H	CN
506	2	H	H	H	H	CN
507	3	H	H	H	H	CN
508	4	H	H	H	H	CN
509	1	Me	H	H	H	CN
510	2	Me	H	H	H	CN
511	3	Me	H	H	H	CN

[3199]

512	4	Me	H	H	H	CN
513	1	CH_2Ph	H	H	H	CN
514	2	CH_2Ph	H	H	H	CN
515	3	CH_2Ph	H	H	H	CN
516	4	CH_2Ph	H	H	H	CN
517	1	COMe	H	H	H	CN
518	2	COMe	H	H	H	CN
519	3	COMe	H	H	H	CN
520	4	COMe	H	H	H	CN
521	1	CO_2Me	H	H	H	CN
522	2	CO_2Me	H	H	H	CN
523	3	CO_2Me	H	H	H	CN
524	4	CO_2Me	H	H	H	CN
525	1	CO_2tBu	H	H	H	CN
526	2	CO_2tBu	H	H	H	CN
527	3	CO_2tBu	H	H	H	CN
528	4	CO_2tBu	H	H	H	CN
529	1	CONHMe	H	H	H	CN
530	2	CONHMe	H	H	H	CN
531	3	CONHMe	H	H	H	CN
532	4	CONHMe	H	H	H	CN
533	1	SO_2Me	H	H	H	CN
534	2	SO_2Me	H	H	H	CN
535	3	SO_2Me	H	H	H	CN
536	4	SO_2Me	H	H	H	CN
537	1	SO_2NH_2	H	H	H	CN
538	2	SO_2NH_2	H	H	H	CN
539	3	SO_2NH_2	H	H	H	CN
540	4	SO_2NH_2	H	H	H	CN

[3200] 示例性实施方案包括具有式(XXXIV)的化合物

[3201] 

(XXXIV)

[3202] 或其可药用盐形式,如在下文表27中所定义。

[3203] 表27:

[3204]

条目	n	R^7	R^{20a}	R^{20b}	R^{20d}	R^{20e}
1	1	H	H	H	H	H
2	2	H	H	H	H	H
3	3	H	H	H	H	H
4	4	H	H	H	H	H
5	1	Me	H	H	H	H
6	2	Me	H	H	H	H
7	3	Me	H	H	H	H
8	4	Me	H	H	H	H
9	1	CH_2Ph	H	H	H	H
10	2	CH_2Ph	H	H	H	H
11	3	CH_2Ph	H	H	H	H
12	4	CH_2Ph	H	H	H	H
13	1	COMe	H	H	H	H
14	2	COMe	H	H	H	H
15	3	COMe	H	H	H	H
16	4	COMe	H	H	H	H
17	1	CO_2Me	H	H	H	H
18	2	CO_2Me	H	H	H	H
19	3	CO_2Me	H	H	H	H
20	4	CO_2Me	H	H	H	H
21	1	CO_2tBu	H	H	H	H
22	2	CO_2tBu	H	H	H	H
23	3	CO_2tBu	H	H	H	H

[3205]

24	4	CO_2tBu	H	H	H	H
25	1	CONHMe	H	H	H	H
26	2	CONHMe	H	H	H	H
27	3	CONHMe	H	H	H	H
28	4	CONHMe	H	H	H	H
29	1	SO_2Me	H	H	H	H
30	2	SO_2Me	H	H	H	H
31	3	SO_2Me	H	H	H	H
32	4	SO_2Me	H	H	H	H
33	1	SO_2NH_2	H	H	H	H
34	2	SO_2NH_2	H	H	H	H
35	3	SO_2NH_2	H	H	H	H
36	4	SO_2NH_2	H	H	H	H
37	1	H	H	H	OH	H
38	2	H	H	H	OH	H
39	3	H	H	H	OH	H
40	4	H	H	H	OH	H
41	1	Me	H	H	OH	H
42	2	Me	H	H	OH	H
43	3	Me	H	H	OH	H
44	4	Me	H	H	OH	H
45	1	CH_2Ph	H	H	OH	H
46	2	CH_2Ph	H	H	OH	H
47	3	CH_2Ph	H	H	OH	H
48	4	CH_2Ph	H	H	OH	H
49	1	COMe	H	H	OH	H
50	2	COMe	H	H	OH	H
51	3	COMe	H	H	OH	H
52	4	COMe	H	H	OH	H
53	1	CO_2Me	H	H	OH	H

[3206]

54	2	CO_2Me	H	H	OH	H
55	3	CO_2Me	H	H	OH	H
56	4	CO_2Me	H	H	OH	H
57	1	CO_2tBu	H	H	OH	H
58	2	CO_2tBu	H	H	OH	H
59	3	CO_2tBu	H	H	OH	H
60	4	CO_2tBu	H	H	OH	H
61	1	CONHMe	H	H	OH	H
62	2	CONHMe	H	H	OH	H
63	3	CONHMe	H	H	OH	H
64	4	CONHMe	H	H	OH	H
65	1	SO_2Me	H	H	OH	H
66	2	SO_2Me	H	H	OH	H
67	3	SO_2Me	H	H	OH	H
68	4	SO_2Me	H	H	OH	H
69	1	SO_2NH_2	H	H	OH	H
70	2	SO_2NH_2	H	H	OH	H
71	3	SO_2NH_2	H	H	OH	H
72	4	SO_2NH_2	H	H	OH	H
73	1	H	H	H	OMe	H
74	2	H	H	H	OMe	H
75	3	H	H	H	OMe	H
76	4	H	H	H	OMe	H
77	1	Me	H	H	OMe	H
78	2	Me	H	H	OMe	H
79	3	Me	H	H	OMe	H
80	4	Me	H	H	OMe	H
81	1	CH_2Ph	H	H	OMe	H
82	2	CH_2Ph	H	H	OMe	H
83	3	CH_2Ph	H	H	OMe	H

[3207]

84	4	CH_2Ph	H	H	OMe	H
85	1	COMe	H	H	OMe	H
86	2	COMe	H	H	OMe	H
87	3	COMe	H	H	OMe	H
88	4	COMe	H	H	OMe	H
89	1	CO_2Me	H	H	OMe	H
90	2	CO_2Me	H	H	OMe	H
91	3	CO_2Me	H	H	OMe	H
92	4	CO_2Me	H	H	OMe	H
93	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
94	2	CO_2tBu	H	H	OMe	H
95	3	CO_2tBu	H	H	OMe	H
96	1	CO_2tBu	H	H	OMe	H
97	1	CONHMe	H	H	OMe	H
98	2	CONHMe	H	H	OMe	H
99	3	CONHMe	H	H	OMe	H
100	4	CONHMe	H	H	OMe	H
101	1	SO_2Me	H	H	OMe	H
102	2	SO_2Me	H	H	OMe	H
103	3	SO_2Me	H	H	OMe	H
104	4	SO_2Me	H	H	OMe	H
105	1	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
106	2	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
107	3	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
108	4	SO_2NH_2	H	H	OMe	H
109	1	H	H	H	Me	H
110	2	H	H	H	Me	H
111	3	H	H	H	Me	H
112	4	H	H	H	Me	H
113	1	Me	H	H	Me	H

[3208]

114	2	Me	H	H	Me	H
115	3	Me	H	H	Me	H
116	4	Me	H	H	Me	H
117	1	CH_2Ph	H	H	Me	H
118	2	CH_2Ph	H	H	Me	H
119	3	CH_2Ph	H	H	Me	H
120	4	CH_2Ph	H	H	Me	H
121	1	COMe	H	H	Me	H
122	2	COMe	H	H	Me	H
123	3	COMe	H	H	Me	H
124	4	COMe	H	H	Me	H
125	1	CO_2Me	H	H	Me	H
126	2	CO_2Me	H	H	Me	H
127	3	CO_2Me	H	H	Me	H
128	4	CO_2Me	H	H	Me	H
129	1	CO_2tBu	H	H	Me	H
130	2	CO_2tBu	H	H	Me	H
131	3	CO_2tBu	H	H	Me	H
132	4	CO_2tBu	H	H	Me	H
133	1	CONHMe	H	H	Me	H
134	2	CONHMe	H	H	Me	H
135	3	CONHMe	H	H	Me	H
136	4	CONHMe	H	H	Me	H
137	1	SO_2Me	H	H	Me	H
138	2	SO_2Me	H	H	Me	H
139	3	SO_2Me	H	H	Me	H
140	4	SO_2Me	H	H	Me	H
141	1	SO_2NH_2	H	H	Me	H
142	2	SO_2NH_2	H	H	Me	H
143	3	SO_2NH_2	H	H	Me	H

[3209]

144	4	SO_2NH_2	H	H	Me	H
145	1	H	H	H	CF_3	H
146	2	H	H	H	CF_3	H
147	3	H	H	H	CF_3	H
148	4	H	H	H	CF_3	H
149	1	Me	H	H	CF_3	H
150	2	Me	H	H	CF_3	H
151	3	Me	H	H	CF_3	H
152	4	Me	H	H	CF_3	H
153	1	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
154	2	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
155	3	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
156	4	CH_2Ph	H	H	CF_3	H
157	1	COMe	H	H	CF_3	H
158	2	COMe	H	H	CF_3	H
159	3	COMe	H	H	CF_3	H
160	4	COMe	H	H	CF_3	H
161	1	CO_2Me	H	H	CF_3	H
162	2	CO_2Me	H	H	CF_3	H
163	3	CO_2Me	H	H	CF_3	H
164	4	CO_2Me	H	H	CF_3	H
165	1	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
166	2	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
167	3	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
168	4	CO_2tBu	H	H	CF_3	H
169	1	CONHMe	H	H	CF_3	H
170	2	CONHMe	H	H	CF_3	H
171	3	CONHMe	H	H	CF_3	H
172	4	CONHMe	H	H	CF_3	H
173	1	SO_2Me	H	H	CF_3	H

[3210]

174	2	SO_2Me	H	H	CF_3	H
175	3	SO_2Me	H	H	CF_3	H
176	4	SO_2Me	H	H	CF_3	H
177	1	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
178	2	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
179	3	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
180	4	SO_2NH_2	H	H	CF_3	H
181	1	H	H	H	F	H
182	2	H	H	H	F	H
183	3	H	H	H	F	H
184	4	H	H	H	F	H
185	1	Me	H	H	F	H
186	2	Me	H	H	F	H
187	3	Me	H	H	F	H
188	4	Me	H	H	F	H
189	1	CH_2Ph	H	H	F	H
190	2	CH_2Ph	H	H	F	H
191	3	CH_2Ph	H	H	F	H
192	4	CH_2Ph	H	H	F	H
193	1	COMe	H	H	F	H
194	2	COMe	H	H	F	H
195	3	COMe	H	H	F	H
196	4	COMe	H	H	F	H
197	1	CO_2Me	H	H	F	H
198	2	CO_2Me	H	H	F	H
199	3	CO_2Me	H	H	F	H
200	4	CO_2Me	H	H	F	H
201	1	CO_2tBu	H	H	F	H
202	2	CO_2tBu	H	H	F	H
203	3	CO_2tBu	H	H	F	H

[3211]

204	4	CO_2tBu	H	H	F	H
205	1	CONHMe	H	H	F	H
206	2	CONHMe	H	H	F	H
207	3	CONHMe	H	H	F	H
208	4	CONHMe	H	H	F	H
209	1	SO_2Me	H	H	F	H
210	2	SO_2Me	H	H	F	H
211	3	SO_2Me	H	H	F	H
212	4	SO_2Me	H	H	F	H
213	1	SO_2NH_2	H	H	F	H
214	2	SO_2NH_2	H	H	F	H
215	3	SO_2NH_2	H	H	F	H
216	4	SO_2NH_2	H	H	F	H
217	1	H	H	H	Cl	H
218	2	H	H	H	Cl	H
219	3	H	H	H	Cl	H
220	4	H	H	H	Cl	H
221	1	Me	H	H	Cl	H
222	2	Me	H	H	Cl	H
223	3	Me	H	H	Cl	H
224	4	Me	H	H	Cl	H
225	1	CH_2Ph	H	H	Cl	H
226	2	CH_2Ph	H	H	Cl	H
227	3	CH_2Ph	H	H	Cl	H
228	4	CH_2Ph	H	H	Cl	H
229	1	COMe	H	H	Cl	H
230	2	COMe	H	H	Cl	H
231	3	COMe	H	H	Cl	H
232	4	COMe	H	H	Cl	H
233	1	CO_2Me	H	H	Cl	H

[3212]

234	2	CO_2Me	H	H	Cl	H
235	3	CO_2Me	H	H	Cl	H
236	4	CO_2Me	H	H	Cl	H
237	1	CO_2tBu	H	H	Cl	H
238	2	CO_2tBu	H	H	Cl	H
239	3	CO_2tBu	H	H	Cl	H
240	4	CO_2tBu	H	H	Cl	H
241	1	CONHMe	H	H	Cl	H
242	2	CONHMe	H	H	Cl	H
243	3	CONHMe	H	H	Cl	H
244	4	CONHMe	H	H	Cl	H
245	1	SO_2Me	H	H	Cl	H
246	2	SO_2Me	H	H	Cl	H
247	3	SO_2Me	H	H	Cl	H
248	4	SO_2Me	H	H	Cl	H
249	1	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
250	2	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
251	3	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
252	4	SO_2NH_2	H	H	Cl	H
253	1	H	H	H	CN	H
254	2	H	H	H	CN	H
255	3	H	H	H	CN	H
256	4	H	H	H	CN	H
257	1	Me	H	H	CN	H
258	2	Me	H	H	CN	H
259	3	Me	H	H	CN	H
260	4	Me	H	H	CN	H
261	1	CH_2Ph	H	H	CN	H
262	2	CH_2Ph	H	H	CN	H
263	3	CH_2Ph	H	H	CN	H

[3213]

264	4	CH_2Ph	H	H	CN	H
265	1	COMe	H	H	CN	H
266	2	COMe	H	H	CN	H
267	3	COMe	H	H	CN	H
268	4	COMe	H	H	CN	H
269	1	CO_2Me	H	H	CN	H
270	2	CO_2Me	H	H	CN	H
271	3	CO_2Me	H	H	CN	H
272	4	CO_2Me	H	H	CN	H
273	1	CO_2tBu	H	H	CN	H
274	2	CO_2tBu	H	H	CN	H
275	3	CO_2tBu	H	H	CN	H
276	4	CO_2tBu	H	H	CN	H
277	1	CONHMe	H	H	CN	H
278	2	CONHMe	H	H	CN	H
279	3	CONHMe	H	H	CN	H
280	4	CONHMe	H	H	CN	H
281	1	SO_2Me	H	H	CN	H
282	2	SO_2Me	H	H	CN	H
283	3	SO_2Me	H	H	CN	H
284	4	SO_2Me	H	H	CN	H
285	1	SO_2NH_2	H	H	CN	H
286	2	SO_2NH_2	H	H	CN	H
287	3	SO_2NH_2	H	H	CN	H
288	4	SO_2NH_2	H	H	CN	H
289	1	H	H	H	H	OH
290	2	H	H	H	H	OH
291	3	H	H	H	H	OH
292	4	H	H	H	H	OH
293	1	Me	H	H	H	OH

[3214]

294	2	Me	H	H	H	OH
295	3	Me	H	H	H	OH
296	4	Me	H	H	H	OH
297	1	CH_2Ph	H	H	H	OH
298	2	CH_2Ph	H	H	H	OH
299	3	CH_2Ph	H	H	H	OH
300	4	CH_2Ph	H	H	H	OH
301	1	COMe	H	H	H	OH
302	2	COMe	H	H	H	OH
303	3	COMe	H	H	H	OH
304	4	COMe	H	H	H	OH
305	1	CO_2Me	H	H	H	OH
306	2	CO_2Me	H	H	H	OH
307	3	CO_2Me	H	H	H	OH
308	4	CO_2Me	H	H	H	OH
309	1	CO_2tBu	H	H	H	OH
310	2	CO_2tBu	H	H	H	OH
311	3	CO_2tBu	H	H	H	OH
312	4	CO_2tBu	H	H	H	OH
313	1	CONHMe	H	H	H	OH
314	2	CONHMe	H	H	H	OH
315	3	CONHMe	H	H	H	OH
316	4	CONHMe	H	H	H	OH
317	1	SO_2Me	H	H	H	OH
318	2	SO_2Me	H	H	H	OH
319	3	SO_2Me	H	H	H	OH
320	4	SO_2Me	H	H	H	OH
321	1	SO_2NH_2	H	H	H	OH
322	2	SO_2NH_2	H	H	H	OH
323	3	SO_2NH_2	H	H	H	OH

[3215]

324	4	SO_2NH_2	H	H	H	OH
325	1	H	H	H	H	OMe
326	2	H	H	H	H	OMe
327	3	H	H	H	H	OMe
328	4	H	H	H	H	OMe
329	1	Me	H	H	H	OMe
330	2	Me	H	H	H	OMe
331	3	Me	H	H	H	OMe
332	4	Me	H	H	H	OMe
333	1	CH_2Ph	H	H	H	OMe
334	2	CH_2Ph	H	H	H	OMe
335	3	CH_2Ph	H	H	H	OMe
336	4	CH_2Ph	H	H	H	OMe
337	1	COMe	H	H	H	OMe
338	2	COMe	H	H	H	OMe
339	3	COMe	H	H	H	OMe
340	4	COMe	H	H	H	OMe
341	1	CO_2Me	H	H	H	OMe
342	2	CO_2Me	H	H	H	OMe
343	3	CO_2Me	H	H	H	OMe
344	4	CO_2Me	H	H	H	OMe
345	1	CO_2tBu	H	H	H	OMe
346	2	CO_2tBu	H	H	H	OMe
347	3	CO_2tBu	H	H	H	OMe
348	4	CO_2tBu	H	H	H	OMe
349	1	CONHMe	H	H	H	OMe
350	2	CONHMe	H	H	H	OMe
351	3	CONHMe	H	H	H	OMe
352	4	CONHMe	H	H	H	OMe
353	1	SO_2Me	H	H	H	OMe

[3216]

354	2	SO_2Me	H	H	H	OMe
355	3	SO_2Me	H	H	H	OMe
356	4	SO_2Me	H	H	H	OMe
357	1	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
358	2	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
359	3	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
360	4	SO_2NH_2	H	H	H	OMe
361	1	H	H	H	H	Me
362	2	H	H	H	H	Me
363	3	H	H	H	H	Me
364	4	H	H	H	H	Me
365	1	Me	H	H	H	Me
366	2	Me	H	H	H	Me
367	3	Me	H	H	H	Me
368	4	Me	H	H	H	Me
369	1	CH_2Ph	H	H	H	Me
370	2	CH_2Ph	H	H	H	Me
371	3	CH_2Ph	H	H	H	Me
372	4	CH_2Ph	H	H	H	Me
373	1	COMe	H	H	H	Me
374	2	COMe	H	H	H	Me
375	3	COMe	H	H	H	Me
376	4	COMe	H	H	H	Me
377	1	CO_2Me	H	H	H	Me
378	2	CO_2Me	H	H	H	Me
379	3	CO_2Me	H	H	H	Me
380	4	CO_2Me	H	H	H	Me
381	1	CO_2tBu	H	H	H	Me
382	2	CO_2tBu	H	H	H	Me
383	3	CO_2tBu	H	H	H	Me

[3217]

384	4	CO_2tBu	H	H	H	Me
385	1	CONHMe	H	H	H	Me
386	2	CONHMe	H	H	H	Me
387	3	CONHMe	H	H	H	Me
388	4	CONHMe	H	H	H	Me
389	1	SO_2Me	H	H	H	Me
390	2	SO_2Me	H	H	H	Me
391	3	SO_2Me	H	H	H	Me
392	4	SO_2Me	H	H	H	Me
393	1	SO_2NH_2	H	H	H	Me
394	2	SO_2NH_2	H	H	H	Me
395	3	SO_2NH_2	H	H	H	Me
396	4	SO_2NH_2	H	H	H	Me
397	1	H	H	H	H	CF_3
398	2	H	H	H	H	CF_3
399	3	H	H	H	H	CF_3
400	4	H	H	H	H	CF_3
401	1	Me	H	H	H	CF_3
402	2	Me	H	H	H	CF_3
403	3	Me	H	H	H	CF_3
404	4	Me	H	H	H	CF_3
405	1	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
406	2	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
407	3	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
408	4	CH_2Ph	H	H	H	CF_3
409	1	COMe	H	H	H	CF_3
410	2	COMe	H	H	H	CF_3
411	3	COMe	H	H	H	CF_3
412	4	COMe	H	H	H	CF_3
413	1	CO_2Me	H	H	H	CF_3

[3218]

414	2	CO_2Me	H	H	H	CF_3
415	3	CO_2Me	H	H	H	CF_3
416	4	CO_2Me	H	H	H	CF_3
417	1	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
418	2	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
419	3	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
420	4	CO_2tBu	H	H	H	CF_3
421	1	CONHMe	H	H	H	CF_3
422	2	CONHMe	H	H	H	CF_3
423	3	CONHMe	H	H	H	CF_3
424	4	CONHMe	H	H	H	CF_3
425	1	SO_2Me	H	H	H	CF_3
426	2	SO_2Me	H	H	H	CF_3
427	3	SO_2Me	H	H	H	CF_3
428	4	SO_2Me	H	H	H	CF_3
429	1	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
430	2	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
431	3	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
432	4	SO_2NH_2	H	H	H	CF_3
433	1	H	H	H	H	F
434	2	H	H	H	H	F
435	3	H	H	H	H	F
436	3	H	H	H	H	F
437	1	Me	H	H	H	F
438	2	Me	H	H	H	F
439	3	Me	H	H	H	F
440	4	Me	H	H	H	F
441	1	CH_2Ph	H	H	H	F
442	2	CH_2Ph	H	H	H	F
443	3	CH_2Ph	H	H	H	F

[3219]

444	4	CH_2Ph	H	H	H	F
445	1	COMe	H	H	H	F
446	2	COMe	H	H	H	F
447	3	COMe	H	H	H	F
448	4	COMe	H	H	H	F
449	1	CO_2Me	H	H	H	F
450	2	CO_2Me	H	H	H	F
451	3	CO_2Me	H	H	H	F
452	4	CO_2Me	H	H	H	F
453	1	CO_2tBu	H	H	H	F
454	2	CO_2tBu	H	H	H	F
455	3	CO_2tBu	H	H	H	F
456	4	CO_2tBu	H	H	H	F
457	1	CONHMe	H	H	H	F
458	2	CONHMe	H	H	H	F
459	3	CONHMe	H	H	H	F
460	4	CONHMe	H	H	H	F
461	1	SO_2Me	H	H	H	F
462	2	SO_2Me	H	H	H	F
463	3	SO_2Me	H	H	H	F
464	4	SO_2Me	H	H	H	F
465	1	SO_2NH_2	H	H	H	F
466	2	SO_2NH_2	H	H	H	F
467	3	SO_2NH_2	H	H	H	F
468	4	SO_2NH_2	H	H	H	F
469	1	H	H	H	H	Cl
470	2	H	H	H	H	Cl
471	3	H	H	H	H	Cl
472	4	H	H	H	H	Cl
473	1	Me	H	H	H	Cl

[3220]

474	2	Me	H	H	H	Cl
475	3	Me	H	H	H	Cl
476	4	Me	H	H	H	Cl
477	1	CH_2Ph	H	H	H	Cl
478	2	CH_2Ph	H	H	H	Cl
479	3	CH_2Ph	H	H	H	Cl
480	4	CH_2Ph	H	H	H	Cl
481	1	COMe	H	H	H	Cl
482	2	COMe	H	H	H	Cl
483	3	COMe	H	H	H	Cl
484	4	COMe	H	H	H	Cl
485	1	CO_2Me	H	H	H	Cl
486	2	CO_2Me	H	H	H	Cl
487	3	CO_2Me	H	H	H	Cl
488	4	CO_2Me	H	H	H	Cl
489	1	CO_2tBu	H	H	H	Cl
490	2	CO_2tBu	H	H	H	Cl
491	3	CO_2tBu	H	H	H	Cl
492	4	CO_2tBu	H	H	H	Cl
493	1	CONHMe	H	H	H	Cl
494	2	CONHMe	H	H	H	Cl
495	3	CONHMe	H	H	H	Cl
496	4	CONHMe	H	H	H	Cl
497	1	SO_2Me	H	H	H	Cl
498	2	SO_2Me	H	H	H	Cl
499	3	SO_2Me	H	H	H	Cl
500	4	SO_2Me	H	H	H	Cl
501	1	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
502	2	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
503	3	SO_2NH_2	H	H	H	Cl

[3221]

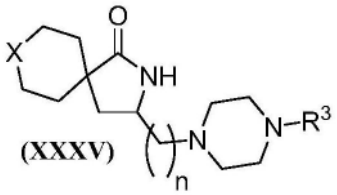
504	4	SO_2NH_2	H	H	H	Cl
505	1	H	H	H	H	CN
506	2	H	H	H	H	CN
507	3	H	H	H	H	CN
508	4	H	H	H	H	CN
509	1	Me	H	H	H	CN
510	2	Me	H	H	H	CN
511	3	Me	H	H	H	CN
512	4	Me	H	H	H	CN
513	1	CH_2Ph	H	H	H	CN
514	2	CH_2Ph	H	H	H	CN
515	3	CH_2Ph	H	H	H	CN
516	4	CH_2Ph	H	H	H	CN
517	1	COMe	H	H	H	CN
518	2	COMe	H	H	H	CN
519	3	COMe	H	H	H	CN
520	4	COMe	H	H	H	CN
521	1	CO_2Me	H	H	H	CN
522	2	CO_2Me	H	H	H	CN
523	3	CO_2Me	H	H	H	CN
524	4	CO_2Me	H	H	H	CN
525	1	CO_2tBu	H	H	H	CN
526	2	CO_2tBu	H	H	H	CN
527	3	CO_2tBu	H	H	H	CN
528	4	CO_2tBu	H	H	H	CN
529	1	CONHMe	H	H	H	CN
530	2	CONHMe	H	H	H	CN
531	3	CONHMe	H	H	H	CN
532	4	CONHMe	H	H	H	CN
533	1	SO_2Me	H	H	H	CN

[3222]

534	2	SO_2Me	H	H	H	CN
535	3	SO_2Me	H	H	H	CN
536	4	SO_2Me	H	H	H	CN
537	1	SO_2NH_2	H	H	H	CN
538	2	SO_2NH_2	H	H	H	CN
539	3	SO_2NH_2	H	H	H	CN
540	4	SO_2NH_2	H	H	H	CN

[3223] 示例性实施方案包括具有式(XXXV)的化合物

[3224]



(XXXV)

[3225] 或其可药用盐形式,如在下文表28中所定义。

[3226] 表28:

[3227]

条目	n	X	R^3	条目	n	X	R^3
1	1	O	苯基	344	1	O	4-OH-苯基
2	2	O	苯基	345	2	O	4-OH-苯基
3	3	O	苯基	346	3	O	4-OH-苯基
4	4	O	苯基	347	4	O	4-OH-苯基
5	1	S	苯基	348	1	S	4-OH-苯基
6	2	S	苯基	349	2	S	4-OH-苯基
7	3	S	苯基	350	3	S	4-OH-苯基
8	4	S	苯基	351	4	S	4-OH-苯基
9	1	SO	苯基	352	1	SO	4-OH-苯基
10	2	SO	苯基	353	2	SO	4-OH-苯基
11	3	SO	苯基	354	3	SO	4-OH-苯基
12	4	SO	苯基	355	4	SO	4-OH-苯基
13	1	SO_2	苯基	356	1	SO_2	4-OH-苯基
14	2	SO_2	苯基	357	2	SO_2	4-OH-苯基

[3228]

15	3	SO_2	苯基	358	3	SO_2	4-OH-苯基
16	4	SO_2	苯基	359	4	SO_2	4-OH-苯基
17	1	O	3-OH-苯基	360	1	O	2-OH-苯基
18	2	O	3-OH-苯基	361	2	O	2-OH-苯基
19	3	O	3-OH-苯基	362	3	O	2-OH-苯基
20	4	O	3-OH-苯基	363	4	O	2-OH-苯基
21	1	S	3-OH-苯基	364	1	S	2-OH-苯基
22	2	S	3-OH-苯基	365	2	S	2-OH-苯基
23	3	S	3-OH-苯基	366	3	S	2-OH-苯基
24	4	S	3-OH-苯基	367	4	S	2-OH-苯基
25	1	SO	3-OH-苯基	368	1	SO	2-OH-苯基
26	2	SO	3-OH-苯基	369	2	SO	2-OH-苯基
27	3	SO	3-OH-苯基	370	3	SO	2-OH-苯基
28	4	SO	3-OH-苯基	371	4	SO	2-OH-苯基
29	1	SO_2	3-OH-苯基	372	1	SO_2	2-OH-苯基
30	2	SO_2	3-OH-苯基	373	2	SO_2	2-OH-苯基
31	3	SO_2	3-OH-苯基	374	3	SO_2	2-OH-苯基
32	4	SO_2	3-OH-苯基	375	4	SO_2	2-OH-苯基
33	1	O	4-NO_2-苯基	376	1	O	4-OMe-苯基
34	2	O	4-NO_2-苯基	377	2	O	4-OMe-苯基
35	3	O	4-NO_2-苯基	378	3	O	4-OMe-苯基
36	4	O	4-NO_2-苯基	379	4	O	4-OMe-苯基
37	1	S	4-NO_2-苯基	380	1	S	4-OMe-苯基
38	2	S	4-NO_2-苯基	381	2	S	4-OMe-苯基
39	3	S	4-NO_2-苯基	382	3	S	4-OMe-苯基
40	4	S	4-NO_2-苯基	383	4	S	4-OMe-苯基
41	1	SO	4-NO_2-苯基	384	1	SO	4-OMe-苯基

[3229]

42	2	SO	4-NO_2-苯基	385	2	SO	4-OMe-苯基
43	3	SO	4-NO_2-苯基	386	3	SO	4-OMe-苯基
44	4	SO	4-NO_2-苯基	387	4	SO	4-OMe-苯基
45	1	SO_2	4-NO_2-苯基	388	1	SO_2	4-OMe-苯基
46	2	SO_2	4-NO_2-苯基	389	2	SO_2	4-OMe-苯基
47	3	SO_2	4-NO_2-苯基	390	3	SO_2	4-OMe-苯基
48	4	SO_2	4-NO_2-苯基	391	4	SO_2	4-OMe-苯基
49	1	O	3-OMe-苯基	392	1	O	2-OMe-苯基
50	2	O	3-OMe-苯基	393	2	O	2-OMe-苯基
51	3	O	3-OMe-苯基	394	3	O	2-OMe-苯基
52	4	O	3-OMe-苯基	395	4	O	2-OMe-苯基
53	1	S	3-OMe-苯基	396	1	S	2-OMe-苯基
54	2	S	3-OMe-苯基	397	2	S	2-OMe-苯基
55	3	S	3-OMe-苯基	398	3	S	2-OMe-苯基
56	4	S	3-OMe-苯基	399	4	S	2-OMe-苯基
57	1	SO	3-OMe-苯基	400	1	SO	2-OMe-苯基
58	2	SO	3-OMe-苯基	401	2	SO	2-OMe-苯基
59	3	SO	3-OMe-苯基	402	3	SO	2-OMe-苯基
60	4	SO	3-OMe-苯基	403	4	SO	2-OMe-苯基
61	1	SO_2	3-OMe-苯基	404	1	SO_2	2-OMe-苯基
62	2	SO_2	3-OMe-苯基	405	2	SO_2	2-OMe-苯基
63	3	SO_2	3-OMe-苯基	406	3	SO_2	2-OMe-苯基
64	4	SO_2	3-OMe-苯基	407	4	SO_2	2-OMe-苯基
65	1	O	4-CN-苯基	408	1	O	3-CN-苯基
66	2	O	4-CN-苯基	409	2	O	3-CN-苯基
67	3	O	4-CN-苯基	410	3	O	3-CN-苯基
68	4	O	4-CN-苯基	411	4	O	3-CN-苯基

[3230]

69	1	S	4-CN-苯基	412	1	S	3-CN-苯基
70	2	S	4-CN-苯基	413	2	S	3-CN-苯基
71	3	S	4-CN-苯基	414	3	S	3-CN-苯基
72	4	S	4-CN-苯基	415	4	S	3-CN-苯基
73	1	SO	4-CN-苯基	416	1	SO	3-CN-苯基
74	2	SO	4-CN-苯基	417	2	SO	3-CN-苯基
75	3	SO	4-CN-苯基	418	3	SO	3-CN-苯基
76	4	SO	4-CN-苯基	419	4	SO	3-CN-苯基
77	1	SO_2	4-CN-苯基	420	1	SO_2	3-CN-苯基
78	2	SO_2	4-CN-苯基	421	2	SO_2	3-CN-苯基
79	3	SO_2	4-CN-苯基	422	3	SO_2	3-CN-苯基
80	4	SO_2	4-CN-苯基	423	4	SO_2	3-CN-苯基
81	1	O	2-CN-苯基	424	1	O	2-Me-苯基
82	2	O	2-CN-苯基	425	2	O	2-Me-苯基
83	3	O	2-CN-苯基	426	3	O	2-Me-苯基
84	4	O	2-CN-苯基	427	4	O	2-Me-苯基
85	1	S	2-CN-苯基	428	1	S	2-Me-苯基
86	2	S	2-CN-苯基	429	2	S	2-Me-苯基
87	3	S	2-CN-苯基	430	3	S	2-Me-苯基
88	4	S	2-CN-苯基	431	4	S	2-Me-苯基
89	1	SO	2-CN-苯基	432	1	SO	2-Me-苯基
90	2	SO	2-CN-苯基	433	2	SO	2-Me-苯基
91	3	SO	2-CN-苯基	434	3	SO	2-Me-苯基
92	4	SO	2-CN-苯基	435	4	SO	2-Me-苯基
93	1	SO_2	2-CN-苯基	436	1	SO_2	2-Me-苯基
94	2	SO_2	2-CN-苯基	437	2	SO_2	2-Me-苯基
95	3	SO_2	2-CN-苯基	438	3	SO_2	2-Me-苯基

[3231]

96	4	SO_2	2-CN-苯基	439	4	SO_2	2-Me-苯基
97	1	O	3-Me-苯基	440	1	O	4-Me-苯基
98	2	O	3-Me-苯基	441	2	O	4-Me-苯基
99	3	O	3-Me-苯基	442	3	O	4-Me-苯基
100	4	O	3-Me-苯基	443	4	O	4-Me-苯基
101	1	S	3-Me-苯基	444	1	S	4-Me-苯基
102	2	S	3-Me-苯基	445	2	S	4-Me-苯基
103	3	S	3-Me-苯基	446	3	S	4-Me-苯基
104	4	S	3-Me-苯基	447	4	S	4-Me-苯基
105	1	SO	3-Me-苯基	448	1	SO	4-Me-苯基
106	2	SO	3-Me-苯基	449	2	SO	4-Me-苯基
107	3	SO	3-Me-苯基	450	3	SO	4-Me-苯基
108	4	SO	3-Me-苯基	451	4	SO	4-Me-苯基
109	1	SO_2	3-Me-苯基	452	1	SO_2	4-Me-苯基
110	2	SO_2	3-Me-苯基	453	2	SO_2	4-Me-苯基
111	3	SO_2	3-Me-苯基	454	3	SO_2	4-Me-苯基
112	4	SO_2	3-Me-苯基	455	4	SO_2	4-Me-苯基
113	1	O	2-F-苯基	456	1	O	3-F-苯基
114	2	O	2-F-苯基	457	2	O	3-F-苯基
115	3	O	2-F-苯基	458	3	O	3-F-苯基
116	4	O	2-F-苯基	459	4	O	3-F-苯基
117	1	S	2-F-苯基	460	1	S	3-F-苯基
118	2	S	2-F-苯基	461	2	S	3-F-苯基
119	3	S	2-F-苯基	462	3	S	3-F-苯基
120	4	S	2-F-苯基	463	4	S	3-F-苯基
121	1	SO	2-F-苯基	464	1	SO	3-F-苯基
122	2	SO	2-F-苯基	465	2	SO	3-F-苯基

[3232]

123	3	SO	2-F-苯基	466	3	SO	3-F-苯基
124	4	SO	2-F-苯基	467	4	SO	3-F-苯基
125	1	SO_2	2-F-苯基	468	1	SO_2	3-F-苯基
126	2	SO_2	2-F-苯基	469	2	SO_2	3-F-苯基
127	3	SO_2	2-F-苯基	470	3	SO_2	3-F-苯基
128	4	SO_2	2-F-苯基	471	4	SO_2	3-F-苯基
129	1	O	4-F-苯基	472	1	O	2-Cl-苯基
130	2	O	4-F-苯基	473	2	O	2-Cl-苯基
131	3	O	4-F-苯基	474	3	O	2-Cl-苯基
132	4	O	4-F-苯基	475	4	O	2-Cl-苯基
133	1	S	4-F-苯基	476	1	S	2-Cl-苯基
134	2	S	4-F-苯基	477	2	S	2-Cl-苯基
135	3	S	4-F-苯基	478	3	S	2-Cl-苯基
136	4	S	4-F-苯基	479	4	S	2-Cl-苯基
137	1	SO	4-F-苯基	480	1	SO	2-Cl-苯基
138	2	SO	4-F-苯基	481	2	SO	2-Cl-苯基
139	3	SO	4-F-苯基	482	3	SO	2-Cl-苯基
140	4	SO	4-F-苯基	483	4	SO	2-Cl-苯基
141	1	SO_2	4-F-苯基	484	1	SO_2	2-Cl-苯基
142	2	SO_2	4-F-苯基	485	2	SO_2	2-Cl-苯基
143	3	SO_2	4-F-苯基	486	3	SO_2	2-Cl-苯基
144	4	SO_2	4-F-苯基	487	4	SO_2	2-Cl-苯基
145	1	O	3-Cl-苯基	488	1	O	4-Cl-苯基
146	2	O	3-Cl-苯基	489	2	O	4-Cl-苯基
147	3	O	3-Cl-苯基	490	3	O	4-Cl-苯基
148	4	O	3-Cl-苯基	491	4	O	4-Cl-苯基
149	1	S	3-Cl-苯基	492	1	S	4-Cl-苯基

[3233]

150	2	S	3-Cl-苯基	493	2	S	4-Cl-苯基
151	3	S	3-Cl-苯基	494	3	S	4-Cl-苯基
152	4	S	3-Cl-苯基	495	4	S	4-Cl-苯基
153	1	SO	3-Cl-苯基	496	1	SO	4-Cl-苯基
154	2	SO	3-Cl-苯基	497	2	SO	4-Cl-苯基
155	3	SO	3-Cl-苯基	498	3	SO	4-Cl-苯基
156	4	SO	3-Cl-苯基	499	4	SO	4-Cl-苯基
157	1	SO_2	3-Cl-苯基	500	1	SO_2	4-Cl-苯基
158	2	SO_2	3-Cl-苯基	501	2	SO_2	4-Cl-苯基
159	3	SO_2	3-Cl-苯基	502	3	SO_2	4-Cl-苯基
160	4	SO_2	3-Cl-苯基	503	4	SO_2	4-Cl-苯基
161	1	O	2-Br-苯基	504	1	O	3-Br-苯基
162	2	O	2-Br-苯基	505	2	O	3-Br-苯基
163	3	O	2-Br-苯基	506	3	O	3-Br-苯基
164	4	O	2-Br-苯基	507	4	O	3-Br-苯基
165	1	S	2-Br-苯基	508	1	S	3-Br-苯基
166	2	S	2-Br-苯基	509	2	S	3-Br-苯基
167	3	S	2-Br-苯基	510	3	S	3-Br-苯基
168	4	S	2-Br-苯基	511	4	S	3-Br-苯基
169	1	SO	2-Br-苯基	512	1	SO	3-Br-苯基
170	2	SO	2-Br-苯基	513	2	SO	3-Br-苯基
171	3	SO	2-Br-苯基	514	3	SO	3-Br-苯基
172	4	SO	2-Br-苯基	515	4	SO	3-Br-苯基
173	1	SO_2	2-Br-苯基	516	1	SO_2	3-Br-苯基
174	2	SO_2	2-Br-苯基	517	2	SO_2	3-Br-苯基
175	3	SO_2	2-Br-苯基	518	3	SO_2	3-Br-苯基
176	4	SO_2	2-Br-苯基	519	4	SO_2	3-Br-苯基

[3234]

177	1	O	4-Br-苯基	520	1	O	2-CF_3-苯基
178	2	O	4-Br-苯基	521	2	O	2-CF_3-苯基
179	3	O	4-Br-苯基	522	3	O	2-CF_3-苯基
180	4	O	4-Br-苯基	523	4	O	2-CF_3-苯基
181	1	S	4-Br-苯基	524	1	S	2-CF_3-苯基
182	2	S	4-Br-苯基	525	2	S	2-CF_3-苯基
183	3	S	4-Br-苯基	526	3	S	2-CF_3-苯基
184	4	S	4-Br-苯基	527	4	S	2-CF_3-苯基
185	1	SO	4-Br-苯基	528	1	SO	2-CF_3-苯基
186	2	SO	4-Br-苯基	529	2	SO	2-CF_3-苯基
187	3	SO	4-Br-苯基	530	3	SO	2-CF_3-苯基
188	4	SO	4-Br-苯基	531	4	SO	2-CF_3-苯基
189	1	SO_2	4-Br-苯基	532	1	SO_2	2-CF_3-苯基
190	2	SO_2	4-Br-苯基	533	2	SO_2	2-CF_3-苯基
191	3	SO_2	4-Br-苯基	534	3	SO_2	2-CF_3-苯基
192	4	SO_2	4-Br-苯基	535	4	SO_2	2-CF_3-苯基
193	1	O	3-CF_3-苯基	536	1	O	4-CF_3-苯基
194	2	O	3-CF_3-苯基	537	2	O	4-CF_3-苯基
195	3	O	3-CF_3-苯基	538	3	O	4-CF_3-苯基
196	4	O	3-CF_3-苯基	539	4	O	4-CF_3-苯基
197	1	S	3-CF_3-苯基	540	1	S	4-CF_3-苯基
198	2	S	3-CF_3-苯基	541	2	S	4-CF_3-苯基
199	3	S	3-CF_3-苯基	542	3	S	4-CF_3-苯基
200	4	S	3-CF_3-苯基	543	4	S	4-CF_3-苯基
201	1	SO	3-CF_3-苯基	544	1	SO	4-CF_3-苯基
202	2	SO	3-CF_3-苯基	545	2	SO	4-CF_3-苯基
203	3	SO	3-CF_3-苯基	546	3	SO	4-CF_3-苯基

[3235]

204	4	SO	3-CF_3-苯基	547	4	SO	3-CF_3-苯基
205	1	SO_2	3-CF_3-苯基	548	1	SO_2	4-CF_3-苯基
206	2	SO_2	3-CF_3-苯基	549	2	SO_2	4-CF_3-苯基
207	3	SO_2	3-CF_3-苯基	550	3	SO_2	4-CF_3-苯基
208	4	SO_2	3-CF_3-苯基	551	4	SO_2	4-CF_3-苯基
209	1	O	2-iPr-苯基	552	1	O	3-iPr-苯基
210	2	O	2-iPr-苯基	553	2	O	3-iPr-苯基
211	3	O	2-iPr-苯基	554	3	O	3-iPr-苯基
212	4	O	2-iPr-苯基	555	4	O	3-iPr-苯基
213	1	S	2-iPr-苯基	556	1	S	3-iPr-苯基
214	2	S	2-iPr-苯基	557	2	S	3-iPr-苯基
215	3	S	2-iPr-苯基	558	3	S	3-iPr-苯基
216	4	S	2-iPr-苯基	559	4	S	3-iPr-苯基
217	1	SO	2-iPr-苯基	560	1	SO	3-iPr-苯基
218	2	SO	2-iPr-苯基	561	2	SO	3-iPr-苯基
219	3	SO	2-iPr-苯基	562	3	SO	3-iPr-苯基
220	4	SO	2-iPr-苯基	563	4	SO	3-iPr-苯基
221	1	SO_2	2-iPr-苯基	564	1	SO_2	3-iPr-苯基
222	2	SO_2	2-iPr-苯基	565	2	SO_2	3-iPr-苯基
223	3	SO_2	2-iPr-苯基	566	3	SO_2	3-iPr-苯基
224	4	SO_2	2-iPr-苯基	567	4	SO_2	3-iPr-苯基
225	1	O	4-iPr-苯基	568	1	O	4-NH_2-苯基
226	2	O	4-iPr-苯基	569	2	O	4-NH_2-苯基
227	3	O	4-iPr-苯基	570	3	O	4-NH_2-苯基
228	4	O	4-iPr-苯基	571	4	O	4-NH_2-苯基
229	1	S	4-iPr-苯基	572	1	S	4-NH_2-苯基
230	2	S	4-iPr-苯基	573	2	S	4-NH_2-苯基

[3236]

231	3	S	4-iPr-苯基	574	3	S	4-NH_2-苯基
232	4	S	4-iPr-苯基	575	4	S	4-NH_2-苯基
233	1	SO	4-iPr-苯基	576	1	SO	4-NH_2-苯基
234	2	SO	4-iPr-苯基	577	2	SO	4-NH_2-苯基
235	3	SO	4-iPr-苯基	578	3	SO	4-NH_2-苯基
236	4	SO	4-iPr-苯基	579	4	SO	4-NH_2-苯基
237	1	SO_2	4-iPr-苯基	580	1	SO_2	4-NH_2-苯基
238	2	SO_2	4-iPr-苯基	581	2	SO_2	4-NH_2-苯基
239	3	SO_2	4-iPr-苯基	582	3	SO_2	4-NH_2-苯基
240	4	SO_2	4-iPr-苯基	583	4	SO_2	4-NH_2-苯基
241	1	O	3-NH_2-苯基	584	1	O	2-NH_2-苯基
242	2	O	3-NH_2-苯基	585	2	O	2-NH_2-苯基
243	3	O	3-NH_2-苯基	586	3	O	2-NH_2-苯基
244	4	O	3-NH_2-苯基	587	4	O	2-NH_2-苯基
245	1	S	3-NH_2-苯基	588	1	S	2-NH_2-苯基
246	2	S	3-NH_2-苯基	589	2	S	2-NH_2-苯基
247	3	S	3-NH_2-苯基	590	3	S	2-NH_2-苯基
248	1	SO	3-NH_2-苯基	591	1	SO	2-NH_2-苯基
249	2	SO	3-NH_2-苯基	592	2	SO	2-NH_2-苯基
250	3	SO	3-NH_2-苯基	593	3	SO	2-NH_2-苯基
251	4	SO	3-NH_2-苯基	594	4	SO	2-NH_2-苯基
252	1	SO_2	3-NH_2-苯基	595	1	SO_2	2-NH_2-苯基
253	2	SO_2	3-NH_2-苯基	596	2	SO_2	2-NH_2-苯基
254	3	SO_2	3-NH_2-苯基	597	3	SO_2	2-NH_2-苯基
255	4	SO_2	3-NH_2-苯基	598	4	SO_2	2-NH_2-苯基
256	1	O	2,4-二-Me-苯基	599	1	O	2,6-二-Me-苯基
257	2	O	2,4-二-Me-苯基	600	2	O	2,6-二-Me-苯基

[3237]

258	3	O	2,4-二-Me-苯基	601	3	O	2,6-二-Me-苯基
259	4	O	2,4-二-Me-苯基	602	4	O	2,6-二-Me-苯基
260	1	S	2,4-二-Me-苯基	603	1	S	2,6-二-Me-苯基
261	2	S	2,4-二-Me-苯基	604	2	S	2,6-二-Me-苯基
262	3	S	2,4-二-Me-苯基	605	3	S	2,6-二-Me-苯基
263	4	S	2,4-二-Me-苯基	606	4	S	2,6-二-Me-苯基
264	1	SO	2,4-二-Me-苯基	607	1	SO	2,6-二-Me-苯基
265	2	SO	2,4-二-Me-苯基	608	2	SO	2,6-二-Me-苯基
266	3	SO	2,4-二-Me-苯基	609	3	SO	2,6-二-Me-苯基
267	4	SO	2,4-二-Me-苯基	610	4	SO	2,6-二-Me-苯基
268	1	SO_2	2,4-二-Me-苯基	611	1	SO_2	2,6-二-Me-苯基
269	2	SO_2	2,4-二-Me-苯基	612	2	SO_2	2,6-二-Me-苯基
270	3	SO_2	2,4-二-Me-苯基	613	3	SO_2	2,6-二-Me-苯基
271	4	SO_2	2,4-二-Me-苯基	614	4	SO_2	2,6-二-Me-苯基
272	1	O	2,6-二-iPr-苯基	615	1	O	2-Ph-苯基
273	2	O	2,6-二-iPr-苯基	616	2	O	2-Ph-苯基
274	3	O	2,6-二-iPr-苯基	617	3	O	2-Ph-苯基
275	4	O	2,6-二-iPr-苯基	618	4	O	2-Ph-苯基
276	1	S	2,6-二-iPr-苯基	619	1	S	2-Ph-苯基
277	2	S	2,6-二-iPr-苯基	620	2	S	2-Ph-苯基
278	3	S	2,6-二-iPr-苯基	621	3	S	2-Ph-苯基
279	4	S	2,6-二-iPr-苯基	622	4	S	2-Ph-苯基
280	1	SO	2,6-二-iPr-苯基	623	1	SO	2-Ph-苯基
281	2	SO	2,6-二-iPr-苯基	624	2	SO	2-Ph-苯基
282	3	SO	2,6-二-iPr-苯基	625	3	SO	2-Ph-苯基
283	4	SO	2,6-二-iPr-苯基	626	4	SO	2-Ph-苯基
284	1	SO_2	2,6-二-iPr-苯基	627	1	SO_2	2-Ph-苯基

[3238]

285	2	SO_2	2,6-二-iPr-苯基	628	2	SO_2	2-Ph-苯基
286	3	SO_2	2,6-二-iPr-苯基	629	3	SO_2	2-Ph-苯基
287	4	SO_2	2,6-二-iPr-苯基	630	4	SO_2	2-Ph-苯基
288	1	O	3-Ph-苯基	631	1	O	4-Ph-苯基
289	2	O	3-Ph-苯基	632	2	O	4-Ph-苯基
290	3	O	3-Ph-苯基	633	3	O	4-Ph-苯基
291	4	O	3-Ph-苯基	634	4	O	4-Ph-苯基
292	1	S	3-Ph-苯基	635	1	S	4-Ph-苯基
293	2	S	3-Ph-苯基	636	2	S	4-Ph-苯基
294	3	S	3-Ph-苯基	637	3	S	4-Ph-苯基
295	4	S	3-Ph-苯基	638	4	S	4-Ph-苯基
296	1	SO	3-Ph-苯基	639	1	SO	4-Ph-苯基
297	2	SO	3-Ph-苯基	640	2	SO	4-Ph-苯基
298	3	SO	3-Ph-苯基	641	3	SO	4-Ph-苯基
299	4	SO	3-Ph-苯基	642	4	SO	4-Ph-苯基
300	1	SO_2	3-Ph-苯基	643	1	SO_2	4-Ph-苯基
301	2	SO_2	3-Ph-苯基	644	2	SO_2	4-Ph-苯基
302	3	SO_2	3-Ph-苯基	645	3	SO_2	4-Ph-苯基
303	4	SO_2	3-Ph-苯基	646	4	SO_2	4-Ph-苯基
304	1	O	2-吗啉代-苯基	647	1	O	3-吗啉代-苯基
305	2	O	2-吗啉代-苯基	648	2	O	3-吗啉代-苯基
306	3	O	2-吗啉代-苯基	649	3	O	3-吗啉代-苯基
307	4	O	2-吗啉代-苯基	650	4	O	3-吗啉代-苯基
308	1	S	2-吗啉代-苯基	651	1	S	3-吗啉代-苯基
309	2	S	2-吗啉代-苯基	652	2	S	3-吗啉代-苯基
310	3	S	2-吗啉代-苯基	653	3	S	3-吗啉代-苯基
311	4	S	2-吗啉代-苯基	654	4	S	3-吗啉代-苯基

[3239]

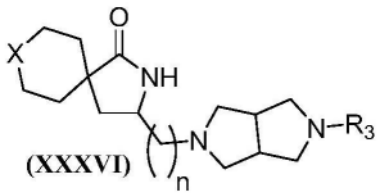
312	1	SO	2-吗啉代-苯基	655	1	SO	3-吗啉代-苯基
313	2	SO	2-吗啉代-苯基	656	2	SO	3-吗啉代-苯基
314	3	SO	2-吗啉代-苯基	657	3	SO	3-吗啉代-苯基
315	4	SO	2-吗啉代-苯基	658	4	SO	3-吗啉代-苯基
316	1	SO_2	2-吗啉代-苯基	659	1	SO_2	3-吗啉代-苯基
317	2	SO_2	2-吗啉代-苯基	660	2	SO_2	3-吗啉代-苯基
318	3	SO_2	2-吗啉代-苯基	661	3	SO_2	3-吗啉代-苯基
319	4	SO_2	2-吗啉代-苯基	662	4	SO_2	3-吗啉代-苯基
320	1	O	4-吗啉代-苯基	663	1	S	4-吗啉代-苯基
321	2	O	4-吗啉代-苯基	664	2	S	4-吗啉代-苯基
322	3	O	4-吗啉代-苯基	665	3	S	4-吗啉代-苯基
323	4	O	4-吗啉代-苯基	667	4	S	4-吗啉代-苯基
324	1	SO	4-吗啉代-苯基	668	1	SO_2	4-吗啉代-苯基
325	2	SO	4-吗啉代-苯基	669	2	SO_2	4-吗啉代-苯基
326	3	SO	4-吗啉代-苯基	670	3	SO_2	4-吗啉代-苯基
327	4	SO	4-吗啉代-苯基	671	4	SO_2	4-吗啉代-苯基
328	1	O	亚萘-1-基	672	1	O	亚萘-2-基
329	2	O	亚萘-1-基	673	2	O	亚萘-2-基
330	3	O	亚萘-1-基	674	3	O	亚萘-2-基
331	4	O	亚萘-1-基	675	4	O	亚萘-2-基
332	1	S	亚萘-1-基	676	1	S	亚萘-2-基
333	2	S	亚萘-1-基	678	2	S	亚萘-2-基
334	3	S	亚萘-1-基	679	3	S	亚萘-2-基
335	4	S	亚萘-1-基	680	4	S	亚萘-2-基
336	1	SO	亚萘-1-基	681	1	SO	亚萘-2-基
337	2	SO	亚萘-1-基	682	2	SO	亚萘-2-基
338	3	SO	亚萘-1-基	683	3	SO	亚萘-2-基

[3240]

339	4	SO	亚萘-1-基	684	4	SO	亚萘-2-基
340	1	SO_2	亚萘-1-基	685	1	SO_2	亚萘-2-基
341	2	SO_2	亚萘-1-基	686	2	SO_2	亚萘-2-基
342	3	SO_2	亚萘-1-基	687	3	SO_2	亚萘-2-基
343	4	SO_2	亚萘-1-基	688	4	SO_2	亚萘-2-基

[3241] 示例性实施方案包括具有式(XXXVI)的化合物

[3242]



(XXXVI)

[3243] 或其可药用盐形式,如在下文表29中所定义。

[3244] 表29:

[3245]

条目	n	X	R^3	条目	n	X	R^3
1	1	O	苯基	344	1	O	4-OH-苯基
2	2	O	苯基	345	2	O	4-OH-苯基
3	3	O	苯基	346	3	O	4-OH-苯基
4	4	O	苯基	347	4	O	4-OH-苯基
5	1	S	苯基	348	1	S	4-OH-苯基
6	2	S	苯基	349	2	S	4-OH-苯基
7	3	S	苯基	350	3	S	4-OH-苯基
8	4	S	苯基	351	4	S	4-OH-苯基
9	1	SO	苯基	352	1	SO	4-OH-苯基
10	2	SO	苯基	353	2	SO	4-OH-苯基
11	3	SO	苯基	354	3	SO	4-OH-苯基
12	4	SO	苯基	355	4	SO	4-OH-苯基
13	1	SO_2	苯基	356	1	SO_2	4-OH-苯基
14	2	SO_2	苯基	357	2	SO_2	4-OH-苯基
15	3	SO_2	苯基	358	3	SO_2	4-OH-苯基

[3246]

16	4	SO_2	苯基	359	4	SO_2	4-OH-苯基
17	1	O	3-OH-苯基	360	1	O	2-OH-苯基
18	2	O	3-OH-苯基	361	2	O	2-OH-苯基
19	3	O	3-OH-苯基	362	3	O	2-OH-苯基
20	4	O	3-OH-苯基	363	4	O	2-OH-苯基
21	1	S	3-OH-苯基	364	1	S	2-OH-苯基
22	2	S	3-OH-苯基	365	2	S	2-OH-苯基
23	3	S	3-OH-苯基	366	3	S	2-OH-苯基
24	4	S	3-OH-苯基	367	4	S	2-OH-苯基
25	1	SO	3-OH-苯基	368	1	SO	2-OH-苯基
26	2	SO	3-OH-苯基	369	2	SO	2-OH-苯基
27	3	SO	3-OH-苯基	370	3	SO	2-OH-苯基
28	4	SO	3-OH-苯基	371	4	SO	2-OH-苯基
29	1	SO_2	3-OH-苯基	372	1	SO_2	2-OH-苯基
30	2	SO_2	3-OH-苯基	373	2	SO_2	2-OH-苯基
31	3	SO_2	3-OH-苯基	374	3	SO_2	2-OH-苯基
32	4	SO_2	3-OH-苯基	375	4	SO_2	2-OH-苯基
33	1	O	4-NO_2-苯基	376	1	O	4-OMe-苯基
34	2	O	4-NO_2-苯基	377	2	O	4-OMe-苯基
35	3	O	4-NO_2-苯基	378	3	O	4-OMe-苯基
36	4	O	4-NO_2-苯基	379	4	O	4-OMe-苯基
37	1	S	4-NO_2-苯基	380	1	S	4-OMe-苯基
38	2	S	4-NO_2-苯基	381	2	S	4-OMe-苯基
39	3	S	4-NO_2-苯基	382	3	S	4-OMe-苯基
40	4	S	4-NO_2-苯基	383	4	S	4-OMe-苯基
41	1	SO	4-NO_2-苯基	384	1	SO	4-OMe-苯基
42	2	SO	4-NO_2-苯基	385	2	SO	4-OMe-苯基

[3247]

43	3	SO	4-NO_2-苯基	386	3	SO	4-OMe-苯基
44	4	SO	4-NO_2-苯基	387	4	SO	4-OMe-苯基
45	1	SO_2	4-NO_2-苯基	388	1	SO_2	4-OMe-苯基
46	2	SO_2	4-NO_2-苯基	389	2	SO_2	4-OMe-苯基
47	3	SO_2	4-NO_2-苯基	390	3	SO_2	4-OMe-苯基
48	4	SO_2	4-NO_2-苯基	391	4	SO_2	4-OMe-苯基
49	1	O	3-OMe-苯基	392	1	O	2-OMe-苯基
50	2	O	3-OMe-苯基	393	2	O	2-OMe-苯基
51	3	O	3-OMe-苯基	394	3	O	2-OMe-苯基
52	4	O	3-OMe-苯基	395	4	O	2-OMe-苯基
53	1	S	3-OMe-苯基	396	1	S	2-OMe-苯基
54	2	S	3-OMe-苯基	397	2	S	2-OMe-苯基
55	3	S	3-OMe-苯基	398	3	S	2-OMe-苯基
56	4	S	3-OMe-苯基	399	4	S	2-OMe-苯基
57	1	SO	3-OMe-苯基	400	1	SO	2-OMe-苯基
58	2	SO	3-OMe-苯基	401	2	SO	2-OMe-苯基
59	3	SO	3-OMe-苯基	402	3	SO	2-OMe-苯基
60	4	SO	3-OMe-苯基	403	4	SO	2-OMe-苯基
61	1	SO_2	3-OMe-苯基	404	1	SO_2	2-OMe-苯基
62	2	SO_2	3-OMe-苯基	405	2	SO_2	2-OMe-苯基
63	3	SO_2	3-OMe-苯基	406	3	SO_2	2-OMe-苯基
64	4	SO_2	3-OMe-苯基	407	4	SO_2	2-OMe-苯基
65	1	O	4-CN-苯基	408	1	O	3-CN-苯基
66	2	O	4-CN-苯基	409	2	O	3-CN-苯基
67	3	O	4-CN-苯基	410	3	O	3-CN-苯基
68	4	O	4-CN-苯基	411	4	O	3-CN-苯基
69	1	S	4-CN-苯基	412	1	S	3-CN-苯基

[3248]

70	2	S	4-CN-苯基	413	2	S	3-CN-苯基
71	3	S	4-CN-苯基	414	3	S	3-CN-苯基
72	4	S	4-CN-苯基	415	4	S	3-CN-苯基
73	1	SO	4-CN-苯基	416	1	SO	3-CN-苯基
74	2	SO	4-CN-苯基	417	2	SO	3-CN-苯基
75	3	SO	4-CN-苯基	418	3	SO	3-CN-苯基
76	4	SO	4-CN-苯基	419	4	SO	3-CN-苯基
77	1	SO_2	4-CN-苯基	420	1	SO_2	3-CN-苯基
78	2	SO_2	4-CN-苯基	421	2	SO_2	3-CN-苯基
79	3	SO_2	4-CN-苯基	422	3	SO_2	3-CN-苯基
80	4	SO_2	4-CN-苯基	423	4	SO_2	3-CN-苯基
81	1	O	2-CN-苯基	424	1	O	2-Me-苯基
82	2	O	2-CN-苯基	425	2	O	2-Me-苯基
83	3	O	2-CN-苯基	426	3	O	2-Me-苯基
84	4	O	2-CN-苯基	427	4	O	2-Me-苯基
85	1	S	2-CN-苯基	428	1	S	2-Me-苯基
86	2	S	2-CN-苯基	429	2	S	2-Me-苯基
87	3	S	2-CN-苯基	430	3	S	2-Me-苯基
88	4	S	2-CN-苯基	431	4	S	2-Me-苯基
89	1	SO	2-CN-苯基	432	1	SO	2-Me-苯基
90	2	SO	2-CN-苯基	433	2	SO	2-Me-苯基
91	3	SO	2-CN-苯基	434	3	SO	2-Me-苯基
92	4	SO	2-CN-苯基	435	4	SO	2-Me-苯基
93	1	SO_2	2-CN-苯基	436	1	SO_2	2-Me-苯基
94	2	SO_2	2-CN-苯基	437	2	SO_2	2-Me-苯基
95	3	SO_2	2-CN-苯基	438	3	SO_2	2-Me-苯基
96	4	SO_2	2-CN-苯基	439	4	SO_2	2-Me-苯基

[3249]

97	1	O	3-Me-苯基	440	1	O	4-Me-苯基
98	2	O	3-Me-苯基	441	2	O	4-Me-苯基
99	3	O	3-Me-苯基	442	3	O	4-Me-苯基
100	4	O	3-Me-苯基	443	4	O	4-Me-苯基
101	1	S	3-Me-苯基	444	1	S	4-Me-苯基
102	2	S	3-Me-苯基	445	2	S	4-Me-苯基
103	3	S	3-Me-苯基	446	3	S	4-Me-苯基
104	4	S	3-Me-苯基	447	4	S	4-Me-苯基
105	1	SO	3-Me-苯基	448	1	SO	4-Me-苯基
106	2	SO	3-Me-苯基	449	2	SO	4-Me-苯基
107	3	SO	3-Me-苯基	450	3	SO	4-Me-苯基
108	4	SO	3-Me-苯基	451	4	SO	4-Me-苯基
109	1	SO_2	3-Me-苯基	452	1	SO_2	4-Me-苯基
110	2	SO_2	3-Me-苯基	453	2	SO_2	4-Me-苯基
111	3	SO_2	3-Me-苯基	454	3	SO_2	4-Me-苯基
112	4	SO_2	3-Me-苯基	455	4	SO_2	4-Me-苯基
113	1	O	2-F-苯基	456	1	O	3-F-苯基
114	2	O	2-F-苯基	457	2	O	3-F-苯基
115	3	O	2-F-苯基	458	3	O	3-F-苯基
116	4	O	2-F-苯基	459	4	O	3-F-苯基
117	1	S	2-F-苯基	460	1	S	3-F-苯基
118	2	S	2-F-苯基	461	2	S	3-F-苯基
119	3	S	2-F-苯基	462	3	S	3-F-苯基
120	4	S	2-F-苯基	463	4	S	3-F-苯基
121	1	SO	2-F-苯基	464	1	SO	3-F-苯基
122	2	SO	2-F-苯基	465	2	SO	3-F-苯基
123	3	SO	2-F-苯基	466	3	SO	3-F-苯基

[3250]

124	4	SO	2-F-苯基	467	4	SO	3-F-苯基
125	1	SO_2	2-F-苯基	468	1	SO_2	3-F-苯基
126	2	SO_2	2-F-苯基	469	2	SO_2	3-F-苯基
127	3	SO_2	2-F-苯基	470	3	SO_2	3-F-苯基
128	4	SO_2	2-F-苯基	471	4	SO_2	3-F-苯基
129	1	O	4-F-苯基	472	1	O	2-Cl-苯基
130	2	O	4-F-苯基	473	2	O	2-Cl-苯基
131	3	O	4-F-苯基	474	3	O	2-Cl-苯基
132	4	O	4-F-苯基	475	4	O	2-Cl-苯基
133	1	S	4-F-苯基	476	1	S	2-Cl-苯基
134	2	S	4-F-苯基	477	2	S	2-Cl-苯基
135	3	S	4-F-苯基	478	3	S	2-Cl-苯基
136	4	S	4-F-苯基	479	4	S	2-Cl-苯基
137	1	SO	4-F-苯基	480	1	SO	2-Cl-苯基
138	2	SO	4-F-苯基	481	2	SO	2-Cl-苯基
139	3	SO	4-F-苯基	482	3	SO	2-Cl-苯基
140	4	SO	4-F-苯基	483	4	SO	2-Cl-苯基
141	1	SO_2	4-F-苯基	484	1	SO_2	2-Cl-苯基
142	2	SO_2	4-F-苯基	485	2	SO_2	2-Cl-苯基
143	3	SO_2	4-F-苯基	486	3	SO_2	2-Cl-苯基
144	4	SO_2	4-F-苯基	487	4	SO_2	2-Cl-苯基
145	1	O	3-Cl-苯基	488	1	O	4-Cl-苯基
146	2	O	3-Cl-苯基	489	2	O	4-Cl-苯基
147	3	O	3-Cl-苯基	490	3	O	4-Cl-苯基
148	4	O	3-Cl-苯基	491	4	O	4-Cl-苯基
149	1	S	3-Cl-苯基	492	1	S	4-Cl-苯基
150	2	S	3-Cl-苯基	493	2	S	4-Cl-苯基

[3251]

151	3	S	3-Cl-苯基	494	3	S	4-Cl-苯基
152	4	S	3-Cl-苯基	495	4	S	4-Cl-苯基
153	1	SO	3-Cl-苯基	496	1	SO	4-Cl-苯基
154	2	SO	3-Cl-苯基	497	2	SO	4-Cl-苯基
155	3	SO	3-Cl-苯基	498	3	SO	4-Cl-苯基
156	4	SO	3-Cl-苯基	499	4	SO	4-Cl-苯基
157	1	SO_2	3-Cl-苯基	500	1	SO_2	4-Cl-苯基
158	2	SO_2	3-Cl-苯基	501	2	SO_2	4-Cl-苯基
159	3	SO_2	3-Cl-苯基	502	3	SO_2	4-Cl-苯基
160	4	SO_2	3-Cl-苯基	503	4	SO_2	4-Cl-苯基
161	1	O	2-Br-苯基	504	1	O	3-Br-苯基
162	2	O	2-Br-苯基	505	2	O	3-Br-苯基
163	3	O	2-Br-苯基	506	3	O	3-Br-苯基
164	4	O	2-Br-苯基	507	4	O	3-Br-苯基
165	1	S	2-Br-苯基	508	1	S	3-Br-苯基
166	2	S	2-Br-苯基	509	2	S	3-Br-苯基
167	3	S	2-Br-苯基	510	3	S	3-Br-苯基
168	4	S	2-Br-苯基	511	4	S	3-Br-苯基
169	1	SO	2-Br-苯基	512	1	SO	3-Br-苯基
170	2	SO	2-Br-苯基	513	2	SO	3-Br-苯基
171	3	SO	2-Br-苯基	514	3	SO	3-Br-苯基
172	4	SO	2-Br-苯基	515	4	SO	3-Br-苯基
173	1	SO_2	2-Br-苯基	516	1	SO_2	3-Br-苯基
174	2	SO_2	2-Br-苯基	517	2	SO_2	3-Br-苯基
175	3	SO_2	2-Br-苯基	518	3	SO_2	3-Br-苯基
176	4	SO_2	2-Br-苯基	519	4	SO_2	3-Br-苯基
177	1	O	4-Br-苯基	520	1	O	2-CF_3-苯基

[3252]

178	2	O	4-Br-苯基	521	2	O	2-CF_3-苯基
179	3	O	4-Br-苯基	522	3	O	2-CF_3-苯基
180	4	O	4-Br-苯基	523	4	O	2-CF_3-苯基
181	1	S	4-Br-苯基	524	1	S	2-CF_3-苯基
182	2	S	4-Br-苯基	525	2	S	2-CF_3-苯基
183	3	S	4-Br-苯基	526	3	S	2-CF_3-苯基
184	4	S	4-Br-苯基	527	4	S	2-CF_3-苯基
185	1	SO	4-Br-苯基	528	1	SO	2-CF_3-苯基
186	2	SO	4-Br-苯基	529	2	SO	2-CF_3-苯基
187	3	SO	4-Br-苯基	530	3	SO	2-CF_3-苯基
188	4	SO	4-Br-苯基	531	4	SO	2-CF_3-苯基
189	1	SO_2	4-Br-苯基	532	1	SO_2	2-CF_3-苯基
190	2	SO_2	4-Br-苯基	533	2	SO_2	2-CF_3-苯基
191	3	SO_2	4-Br-苯基	534	3	SO_2	2-CF_3-苯基
192	4	SO_2	4-Br-苯基	535	4	SO_2	2-CF_3-苯基
193	1	O	3-CF_3-苯基	536	1	O	4-CF_3-苯基
194	2	O	3-CF_3-苯基	537	2	O	4-CF_3-苯基
195	3	O	3-CF_3-苯基	538	3	O	4-CF_3-苯基
196	4	O	3-CF_3-苯基	539	4	O	4-CF_3-苯基
197	1	S	3-CF_3-苯基	540	1	S	4-CF_3-苯基
198	2	S	3-CF_3-苯基	541	2	S	4-CF_3-苯基
199	3	S	3-CF_3-苯基	542	3	S	4-CF_3-苯基
200	4	S	3-CF_3-苯基	543	4	S	4-CF_3-苯基
201	1	SO	3-CF_3-苯基	544	1	SO	4-CF_3-苯基
202	2	SO	3-CF_3-苯基	545	2	SO	4-CF_3-苯基
203	3	SO	3-CF_3-苯基	546	3	SO	4-CF_3-苯基
204	4	SO	3-CF_3-苯基	547	4	SO	3-CF_3-苯基

[3253]

205	1	SO_2	3-CF_3-苯基	548	1	SO_2	4-CF_3-苯基
206	2	SO_2	3-CF_3-苯基	549	2	SO_2	4-CF_3-苯基
207	3	SO_2	3-CF_3-苯基	550	3	SO_2	4-CF_3-苯基
208	4	SO_2	3-CF_3-苯基	551	4	SO_2	4-CF_3-苯基
209	1	O	2-iPr-苯基	552	1	O	3-iPr-苯基
210	2	O	2-iPr-苯基	553	2	O	3-iPr-苯基
211	3	O	2-iPr-苯基	554	3	O	3-iPr-苯基
212	4	O	2-iPr-苯基	555	4	O	3-iPr-苯基
213	1	S	2-iPr-苯基	556	1	S	3-iPr-苯基
214	2	S	2-iPr-苯基	557	2	S	3-iPr-苯基
215	3	S	2-iPr-苯基	558	3	S	3-iPr-苯基
216	4	S	2-iPr-苯基	559	4	S	3-iPr-苯基
217	1	SO	2-iPr-苯基	560	1	SO	3-iPr-苯基
218	2	SO	2-iPr-苯基	561	2	SO	3-iPr-苯基
219	3	SO	2-iPr-苯基	562	3	SO	3-iPr-苯基
220	4	SO	2-iPr-苯基	563	4	SO	3-iPr-苯基
221	1	SO_2	2-iPr-苯基	564	1	SO_2	3-iPr-苯基
222	2	SO_2	2-iPr-苯基	565	2	SO_2	3-iPr-苯基
223	3	SO_2	2-iPr-苯基	566	3	SO_2	3-iPr-苯基
224	4	SO_2	2-iPr-苯基	567	4	SO_2	3-iPr-苯基
225	1	O	4-iPr-苯基	568	1	O	4-NH_2-苯基
226	2	O	4-iPr-苯基	569	2	O	4-NH_2-苯基
227	3	O	4-iPr-苯基	570	3	O	4-NH_2-苯基
228	4	O	4-iPr-苯基	571	4	O	4-NH_2-苯基
229	1	S	4-iPr-苯基	572	1	S	4-NH_2-苯基
230	2	S	4-iPr-苯基	573	2	S	4-NH_2-苯基
231	3	S	4-iPr-苯基	574	3	S	4-NH_2-苯基

[3254]

232	4	S	4-iPr-苯基	575	4	S	4-NH_2-苯基
233	1	SO	4-iPr-苯基	576	1	SO	4-NH_2-苯基
234	2	SO	4-iPr-苯基	577	2	SO	4-NH_2-苯基
235	3	SO	4-iPr-苯基	578	3	SO	4-NH_2-苯基
236	4	SO	4-iPr-苯基	579	4	SO	4-NH_2-苯基
237	1	SO_2	4-iPr-苯基	580	1	SO_2	4-NH_2-苯基
238	2	SO_2	4-iPr-苯基	581	2	SO_2	4-NH_2-苯基
239	3	SO_2	4-iPr-苯基	582	3	SO_2	4-NH_2-苯基
240	4	SO_2	4-iPr-苯基	583	4	SO_2	4-NH_2-苯基
241	1	O	3-NH_2-苯基	584	1	O	2-NH_2-苯基
242	2	O	3-NH_2-苯基	585	2	O	2-NH_2-苯基
243	3	O	3-NH_2-苯基	586	3	O	2-NH_2-苯基
244	4	O	3-NH_2-苯基	587	4	O	2-NH_2-苯基
245	1	S	3-NH_2-苯基	588	1	S	2-NH_2-苯基
246	2	S	3-NH_2-苯基	589	2	S	2-NH_2-苯基
247	3	S	3-NH_2-苯基	590	3	S	2-NH_2-苯基
248	1	SO	3-NH_2-苯基	591	1	SO	2-NH_2-苯基
249	2	SO	3-NH_2-苯基	592	2	SO	2-NH_2-苯基
250	3	SO	3-NH_2-苯基	593	3	SO	2-NH_2-苯基
251	4	SO	3-NH_2-苯基	594	4	SO	2-NH_2-苯基
252	1	SO_2	3-NH_2-苯基	595	1	SO_2	2-NH_2-苯基
253	2	SO_2	3-NH_2-苯基	596	2	SO_2	2-NH_2-苯基
254	3	SO_2	3-NH_2-苯基	597	3	SO_2	2-NH_2-苯基
255	4	SO_2	3-NH_2-苯基	598	4	SO_2	2-NH_2-苯基
256	1	O	2,4-二-Me-苯基	599	1	O	2,6-二-Me-苯基
257	2	O	2,4-二-Me-苯基	600	2	O	2,6-二-Me-苯基
258	3	O	2,4-二-Me-苯基	601	3	O	2,6-二-Me-苯基

259	4	O	2,4-二-Me-苯基	602	4	O	2,6-二-Me-苯基
260	1	S	2,4-二-Me-苯基	603	1	S	2,6-二-Me-苯基
261	2	S	2,4-二-Me-苯基	604	2	S	2,6-二-Me-苯基
262	3	S	2,4-二-Me-苯基	605	3	S	2,6-二-Me-苯基
263	4	S	2,4-二-Me-苯基	606	4	S	2,6-二-Me-苯基
264	1	SO	2,4-二-Me-苯基	607	1	SO	2,6-二-Me-苯基
265	2	SO	2,4-二-Me-苯基	608	2	SO	2,6-二-Me-苯基
266	3	SO	2,4-二-Me-苯基	609	3	SO	2,6-二-Me-苯基
267	4	SO	2,4-二-Me-苯基	610	4	SO	2,6-二-Me-苯基
268	1	SO_2	2,4-二-Me-苯基	611	1	SO_2	2,6-二-Me-苯基
269	2	SO_2	2,4-二-Me-苯基	612	2	SO_2	2,6-二-Me-苯基
270	3	SO_2	2,4-二-Me-苯基	613	3	SO_2	2,6-二-Me-苯基
271	4	SO_2	2,4-二-Me-苯基	614	4	SO_2	2,6-二-Me-苯基
272	1	O	2,6-二-iPr-苯基	615	1	O	2-Ph-苯基
273	2	O	2,6-二-iPr-苯基	616	2	O	2-Ph-苯基
274	3	O	2,6-二-iPr-苯基	617	3	O	2-Ph-苯基
275	4	O	2,6-二-iPr-苯基	618	4	O	2-Ph-苯基
276	1	S	2,6-二-iPr-苯基	619	1	S	2-Ph-苯基
277	2	S	2,6-二-iPr-苯基	620	2	S	2-Ph-苯基
278	3	S	2,6-二-iPr-苯基	621	3	S	2-Ph-苯基
279	4	S	2,6-二-iPr-苯基	622	4	S	2-Ph-苯基
280	1	SO	2,6-二-iPr-苯基	623	1	SO	2-Ph-苯基
281	2	SO	2,6-二-iPr-苯基	624	2	SO	2-Ph-苯基
282	3	SO	2,6-二-iPr-苯基	625	3	SO	2-Ph-苯基
283	4	SO	2,6-二-iPr-苯基	626	4	SO	2-Ph-苯基
284	1	SO_2	2,6-二-iPr-苯基	627	1	SO_2	2-Ph-苯基
285	2	SO_2	2,6-二-iPr-苯基	628	2	SO_2	2-Ph-苯基

[3255]

[3256]

286	3	SO_2	2,6-二-iPr-苯基	629	3	SO_2	2-Ph-苯基
287	4	SO_2	2,6-二-iPr-苯基	630	4	SO_2	2-Ph-苯基
288	1	O	3-Ph-苯基	631	1	O	4-Ph-苯基
289	2	O	3-Ph-苯基	632	2	O	4-Ph-苯基
290	3	O	3-Ph-苯基	633	3	O	4-Ph-苯基
291	4	O	3-Ph-苯基	634	4	O	4-Ph-苯基
292	1	S	3-Ph-苯基	635	1	S	4-Ph-苯基
293	2	S	3-Ph-苯基	636	2	S	4-Ph-苯基
294	3	S	3-Ph-苯基	637	3	S	4-Ph-苯基
295	4	S	3-Ph-苯基	638	4	S	4-Ph-苯基
296	1	SO	3-Ph-苯基	639	1	SO	4-Ph-苯基
297	2	SO	3-Ph-苯基	640	2	SO	4-Ph-苯基
298	3	SO	3-Ph-苯基	641	3	SO	4-Ph-苯基
299	4	SO	3-Ph-苯基	642	4	SO	4-Ph-苯基
300	1	SO_2	3-Ph-苯基	643	1	SO_2	4-Ph-苯基
301	2	SO_2	3-Ph-苯基	644	2	SO_2	4-Ph-苯基
302	3	SO_2	3-Ph-苯基	645	3	SO_2	4-Ph-苯基
303	4	SO_2	3-Ph-苯基	646	4	SO_2	4-Ph-苯基
304	1	O	2-吗啉代-苯基	647	1	O	3-吗啉代-苯基
305	2	O	2-吗啉代-苯基	648	2	O	3-吗啉代-苯基
306	3	O	2-吗啉代-苯基	649	3	O	3-吗啉代-苯基
307	4	O	2-吗啉代-苯基	650	4	O	3-吗啉代-苯基
308	1	S	2-吗啉代-苯基	651	1	S	3-吗啉代-苯基
309	2	S	2-吗啉代-苯基	652	2	S	3-吗啉代-苯基
310	3	S	2-吗啉代-苯基	653	3	S	3-吗啉代-苯基
311	4	S	2-吗啉代-苯基	654	4	S	3-吗啉代-苯基
312	1	SO	2-吗啉代-苯基	655	1	SO	3-吗啉代-苯基

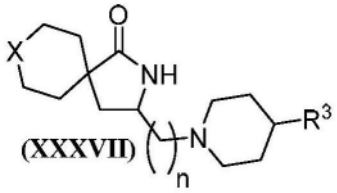
[3257]

313	2	SO	2-吗啉代-苯基	656	2	SO	3-吗啉代-苯基
314	3	SO	2-吗啉代-苯基	657	3	SO	3-吗啉代-苯基
315	4	SO	2-吗啉代-苯基	658	4	SO	3-吗啉代-苯基
316	1	SO_2	2-吗啉代-苯基	659	1	SO_2	3-吗啉代-苯基
317	2	SO_2	2-吗啉代-苯基	660	2	SO_2	3-吗啉代-苯基
318	3	SO_2	2-吗啉代-苯基	661	3	SO_2	3-吗啉代-苯基
319	4	SO_2	2-吗啉代-苯基	662	4	SO_2	3-吗啉代-苯基
320	1	O	4-吗啉代-苯基	663	1	S	4-吗啉代-苯基
321	2	O	4-吗啉代-苯基	664	2	S	4-吗啉代-苯基
322	3	O	4-吗啉代-苯基	665	3	S	4-吗啉代-苯基
323	4	O	4-吗啉代-苯基	667	4	S	4-吗啉代-苯基
324	1	SO	4-吗啉代-苯基	668	1	SO_2	4-吗啉代-苯基
325	2	SO	4-吗啉代-苯基	669	2	SO_2	4-吗啉代-苯基
326	3	SO	4-吗啉代-苯基	670	3	SO_2	4-吗啉代-苯基
327	4	SO	4-吗啉代-苯基	671	4	SO_2	4-吗啉代-苯基
328	1	O	亚萘-1-基	672	1	O	亚萘-2-基
329	2	O	亚萘-1-基	673	2	O	亚萘-2-基
330	3	O	亚萘-1-基	674	3	O	亚萘-2-基
331	4	O	亚萘-1-基	675	4	O	亚萘-2-基
332	1	S	亚萘-1-基	676	1	S	亚萘-2-基
333	2	S	亚萘-1-基	678	2	S	亚萘-2-基
334	3	S	亚萘-1-基	679	3	S	亚萘-2-基
335	4	S	亚萘-1-基	680	4	S	亚萘-2-基
336	1	SO	亚萘-1-基	681	1	SO	亚萘-2-基
337	2	SO	亚萘-1-基	682	2	SO	亚萘-2-基
338	3	SO	亚萘-1-基	683	3	SO	亚萘-2-基
339	4	SO	亚萘-1-基	684	4	SO	亚萘-2-基

[3258]

340	1	SO_2	亚萘-1-基	685	1	SO_2	亚萘-2-基
341	2	SO_2	亚萘-1-基	686	2	SO_2	亚萘-2-基
342	3	SO_2	亚萘-1-基	687	3	SO_2	亚萘-2-基
343	4	SO_2	亚萘-1-基	688	4	SO_2	亚萘-2-基

[3259] 示例性实施方案包括具有式(XXXVII)的化合物

[3260] 

(XXXVII)

[3261] 或其可药用盐形式,如在下文表30中所定义。

[3262] 表30:

[3263]

条目	n	X	R^3	条目	n	X	R^3
1	1	O	苯基	344	1	O	4-OH-苯基
2	2	O	苯基	345	2	O	4-OH-苯基
3	3	O	苯基	346	3	O	4-OH-苯基
4	4	O	苯基	347	4	O	4-OH-苯基
5	1	S	苯基	348	1	S	4-OH-苯基
6	2	S	苯基	349	2	S	4-OH-苯基
7	3	S	苯基	350	3	S	4-OH-苯基
8	4	S	苯基	351	4	S	4-OH-苯基
9	1	SO	苯基	352	1	SO	4-OH-苯基
10	2	SO	苯基	353	2	SO	4-OH-苯基
11	3	SO	苯基	354	3	SO	4-OH-苯基
12	4	SO	苯基	355	4	SO	4-OH-苯基
13	1	SO_2	苯基	356	1	SO_2	4-OH-苯基
14	2	SO_2	苯基	357	2	SO_2	4-OH-苯基
15	3	SO_2	苯基	358	3	SO_2	4-OH-苯基
16	4	SO_2	苯基	359	4	SO_2	4-OH-苯基

[3264]

17	1	O	3-OH-苯基	360	1	O	2-OH-苯基
18	2	O	3-OH-苯基	361	2	O	2-OH-苯基
19	3	O	3-OH-苯基	362	3	O	2-OH-苯基
20	4	O	3-OH-苯基	363	4	O	2-OH-苯基
21	1	S	3-OH-苯基	364	1	S	2-OH-苯基
22	2	S	3-OH-苯基	365	2	S	2-OH-苯基
23	3	S	3-OH-苯基	366	3	S	2-OH-苯基
24	4	S	3-OH-苯基	367	4	S	2-OH-苯基
25	1	SO	3-OH-苯基	368	1	SO	2-OH-苯基
26	2	SO	3-OH-苯基	369	2	SO	2-OH-苯基
27	3	SO	3-OH-苯基	370	3	SO	2-OH-苯基
28	4	SO	3-OH-苯基	371	4	SO	2-OH-苯基
29	1	SO_2	3-OH-苯基	372	1	SO_2	2-OH-苯基
30	2	SO_2	3-OH-苯基	373	2	SO_2	2-OH-苯基
31	3	SO_2	3-OH-苯基	374	3	SO_2	2-OH-苯基
32	4	SO_2	3-OH-苯基	375	4	SO_2	2-OH-苯基
33	1	O	4-NO_2-苯基	376	1	O	4-OMe-苯基
34	2	O	4-NO_2-苯基	377	2	O	4-OMe-苯基
35	3	O	4-NO_2-苯基	378	3	O	4-OMe-苯基
36	4	O	4-NO_2-苯基	379	4	O	4-OMe-苯基
37	1	S	4-NO_2-苯基	380	1	S	4-OMe-苯基
38	2	S	4-NO_2-苯基	381	2	S	4-OMe-苯基
39	3	S	4-NO_2-苯基	382	3	S	4-OMe-苯基
40	4	S	4-NO_2-苯基	383	4	S	4-OMe-苯基
41	1	SO	4-NO_2-苯基	384	1	SO	4-OMe-苯基
42	2	SO	4-NO_2-苯基	385	2	SO	4-OMe-苯基
43	3	SO	4-NO_2-苯基	386	3	SO	4-OMe-苯基

[3265]

44	4	SO	4-NO_2-苯基	387	4	SO	4-OMe-苯基
45	1	SO_2	4-NO_2-苯基	388	1	SO_2	4-OMe-苯基
46	2	SO_2	4-NO_2-苯基	389	2	SO_2	4-OMe-苯基
47	3	SO_2	4-NO_2-苯基	390	3	SO_2	4-OMe-苯基
48	4	SO_2	4-NO_2-苯基	391	4	SO_2	4-OMe-苯基
49	1	O	3-OMe-苯基	392	1	O	2-OMe-苯基
50	2	O	3-OMe-苯基	393	2	O	2-OMe-苯基
51	3	O	3-OMe-苯基	394	3	O	2-OMe-苯基
52	4	O	3-OMe-苯基	395	4	O	2-OMe-苯基
53	1	S	3-OMe-苯基	396	1	S	2-OMe-苯基
54	2	S	3-OMe-苯基	397	2	S	2-OMe-苯基
55	3	S	3-OMe-苯基	398	3	S	2-OMe-苯基
56	4	S	3-OMe-苯基	399	4	S	2-OMe-苯基
57	1	SO	3-OMe-苯基	400	1	SO	2-OMe-苯基
58	2	SO	3-OMe-苯基	401	2	SO	2-OMe-苯基
59	3	SO	3-OMe-苯基	402	3	SO	2-OMe-苯基
60	4	SO	3-OMe-苯基	403	4	SO	2-OMe-苯基
61	1	SO_2	3-OMe-苯基	404	1	SO_2	2-OMe-苯基
62	2	SO_2	3-OMe-苯基	405	2	SO_2	2-OMe-苯基
63	3	SO_2	3-OMe-苯基	406	3	SO_2	2-OMe-苯基
64	4	SO_2	3-OMe-苯基	407	4	SO_2	2-OMe-苯基
65	1	O	4-CN-苯基	408	1	O	3-CN-苯基
66	2	O	4-CN-苯基	409	2	O	3-CN-苯基
67	3	O	4-CN-苯基	410	3	O	3-CN-苯基
68	4	O	4-CN-苯基	411	4	O	3-CN-苯基
69	1	S	4-CN-苯基	412	1	S	3-CN-苯基
70	2	S	4-CN-苯基	413	2	S	3-CN-苯基

[3266]

71	3	S	4-CN-苯基	414	3	S	3-CN-苯基
72	4	S	4-CN-苯基	415	4	S	3-CN-苯基
73	1	SO	4-CN-苯基	416	1	SO	3-CN-苯基
74	2	SO	4-CN-苯基	417	2	SO	3-CN-苯基
75	3	SO	4-CN-苯基	418	3	SO	3-CN-苯基
76	4	SO	4-CN-苯基	419	4	SO	3-CN-苯基
77	1	SO_2	4-CN-苯基	420	1	SO_2	3-CN-苯基
78	2	SO_2	4-CN-苯基	421	2	SO_2	3-CN-苯基
79	3	SO_2	4-CN-苯基	422	3	SO_2	3-CN-苯基
80	4	SO_2	4-CN-苯基	423	4	SO_2	3-CN-苯基
81	1	O	2-CN-苯基	424	1	O	2-Me-苯基
82	2	O	2-CN-苯基	425	2	O	2-Me-苯基
83	3	O	2-CN-苯基	426	3	O	2-Me-苯基
84	4	O	2-CN-苯基	427	4	O	2-Me-苯基
85	1	S	2-CN-苯基	428	1	S	2-Me-苯基
86	2	S	2-CN-苯基	429	2	S	2-Me-苯基
87	3	S	2-CN-苯基	430	3	S	2-Me-苯基
88	4	S	2-CN-苯基	431	4	S	2-Me-苯基
89	1	SO	2-CN-苯基	432	1	SO	2-Me-苯基
90	2	SO	2-CN-苯基	433	2	SO	2-Me-苯基
91	3	SO	2-CN-苯基	434	3	SO	2-Me-苯基
92	4	SO	2-CN-苯基	435	4	SO	2-Me-苯基
93	1	SO_2	2-CN-苯基	436	1	SO_2	2-Me-苯基
94	2	SO_2	2-CN-苯基	437	2	SO_2	2-Me-苯基
95	3	SO_2	2-CN-苯基	438	3	SO_2	2-Me-苯基
96	4	SO_2	2-CN-苯基	439	4	SO_2	2-Me-苯基
97	1	O	3-Me-苯基	440	1	O	4-Me-苯基

[3267]

98	2	O	3-Me-苯基	441	2	O	4-Me-苯基
99	3	O	3-Me-苯基	442	3	O	4-Me-苯基
100	4	O	3-Me-苯基	443	4	O	4-Me-苯基
101	1	S	3-Me-苯基	444	1	S	4-Me-苯基
102	2	S	3-Me-苯基	445	2	S	4-Me-苯基
103	3	S	3-Me-苯基	446	3	S	4-Me-苯基
104	4	S	3-Me-苯基	447	4	S	4-Me-苯基
105	1	SO	3-Me-苯基	448	1	SO	4-Me-苯基
106	2	SO	3-Me-苯基	449	2	SO	4-Me-苯基
107	3	SO	3-Me-苯基	450	3	SO	4-Me-苯基
108	4	SO	3-Me-苯基	451	4	SO	4-Me-苯基
109	1	SO_2	3-Me-苯基	452	1	SO_2	4-Me-苯基
110	2	SO_2	3-Me-苯基	453	2	SO_2	4-Me-苯基
111	3	SO_2	3-Me-苯基	454	3	SO_2	4-Me-苯基
112	4	SO_2	3-Me-苯基	455	4	SO_2	4-Me-苯基
113	1	O	2-F-苯基	456	1	O	3-F-苯基
114	2	O	2-F-苯基	457	2	O	3-F-苯基
115	3	O	2-F-苯基	458	3	O	3-F-苯基
116	4	O	2-F-苯基	459	4	O	3-F-苯基
117	1	S	2-F-苯基	460	1	S	3-F-苯基
118	2	S	2-F-苯基	461	2	S	3-F-苯基
119	3	S	2-F-苯基	462	3	S	3-F-苯基
120	4	S	2-F-苯基	463	4	S	3-F-苯基
121	1	SO	2-F-苯基	464	1	SO	3-F-苯基
122	2	SO	2-F-苯基	465	2	SO	3-F-苯基
123	3	SO	2-F-苯基	466	3	SO	3-F-苯基
124	4	SO	2-F-苯基	467	4	SO	3-F-苯基

[3268]

125	1	SO_2	2-F-苯基	468	1	SO_2	3-F-苯基
126	2	SO_2	2-F-苯基	469	2	SO_2	3-F-苯基
127	3	SO_2	2-F-苯基	470	3	SO_2	3-F-苯基
128	4	SO_2	2-F-苯基	471	4	SO_2	3-F-苯基
129	1	O	4-F-苯基	472	1	O	2-Cl-苯基
130	2	O	4-F-苯基	473	2	O	2-Cl-苯基
131	3	O	4-F-苯基	474	3	O	2-Cl-苯基
132	4	O	4-F-苯基	475	4	O	2-Cl-苯基
133	1	S	4-F-苯基	476	1	S	2-Cl-苯基
134	2	S	4-F-苯基	477	2	S	2-Cl-苯基
135	3	S	4-F-苯基	478	3	S	2-Cl-苯基
136	4	S	4-F-苯基	479	4	S	2-Cl-苯基
137	1	SO	4-F-苯基	480	1	SO	2-Cl-苯基
138	2	SO	4-F-苯基	481	2	SO	2-Cl-苯基
139	3	SO	4-F-苯基	482	3	SO	2-Cl-苯基
140	4	SO	4-F-苯基	483	4	SO	2-Cl-苯基
141	1	SO_2	4-F-苯基	484	1	SO_2	2-Cl-苯基
142	2	SO_2	4-F-苯基	485	2	SO_2	2-Cl-苯基
143	3	SO_2	4-F-苯基	486	3	SO_2	2-Cl-苯基
144	4	SO_2	4-F-苯基	487	4	SO_2	2-Cl-苯基
145	1	O	3-Cl-苯基	488	1	O	4-Cl-苯基
146	2	O	3-Cl-苯基	489	2	O	4-Cl-苯基
147	3	O	3-Cl-苯基	490	3	O	4-Cl-苯基
148	4	O	3-Cl-苯基	491	4	O	4-Cl-苯基
149	1	S	3-Cl-苯基	492	1	S	4-Cl-苯基
150	2	S	3-Cl-苯基	493	2	S	4-Cl-苯基
151	3	S	3-Cl-苯基	494	3	S	4-Cl-苯基

[3269]

152	4	S	3-Cl-苯基	495	4	S	4-Cl-苯基
153	1	SO	3-Cl-苯基	496	1	SO	4-Cl-苯基
154	2	SO	3-Cl-苯基	497	2	SO	4-Cl-苯基
155	3	SO	3-Cl-苯基	498	3	SO	4-Cl-苯基
156	4	SO	3-Cl-苯基	499	4	SO	4-Cl-苯基
157	1	SO_2	3-Cl-苯基	500	1	SO_2	4-Cl-苯基
158	2	SO_2	3-Cl-苯基	501	2	SO_2	4-Cl-苯基
159	3	SO_2	3-Cl-苯基	502	3	SO_2	4-Cl-苯基
160	4	SO_2	3-Cl-苯基	503	4	SO_2	4-Cl-苯基
161	1	O	2-Br-苯基	504	1	O	3-Br-苯基
162	2	O	2-Br-苯基	505	2	O	3-Br-苯基
163	3	O	2-Br-苯基	506	3	O	3-Br-苯基
164	4	O	2-Br-苯基	507	4	O	3-Br-苯基
165	1	S	2-Br-苯基	508	1	S	3-Br-苯基
166	2	S	2-Br-苯基	509	2	S	3-Br-苯基
167	3	S	2-Br-苯基	510	3	S	3-Br-苯基
168	4	S	2-Br-苯基	511	4	S	3-Br-苯基
169	1	SO	2-Br-苯基	512	1	SO	3-Br-苯基
170	2	SO	2-Br-苯基	513	2	SO	3-Br-苯基
171	3	SO	2-Br-苯基	514	3	SO	3-Br-苯基
172	4	SO	2-Br-苯基	515	4	SO	3-Br-苯基
173	1	SO_2	2-Br-苯基	516	1	SO_2	3-Br-苯基
174	2	SO_2	2-Br-苯基	517	2	SO_2	3-Br-苯基
175	3	SO_2	2-Br-苯基	518	3	SO_2	3-Br-苯基
176	4	SO_2	2-Br-苯基	519	4	SO_2	3-Br-苯基
177	1	O	4-Br-苯基	520	1	O	2-CF_3-苯基
178	2	O	4-Br-苯基	521	2	O	2-CF_3-苯基

[3270]

179	3	O	4-Br-苯基	522	3	O	2-CF_3-苯基
180	4	O	4-Br-苯基	523	4	O	2-CF_3-苯基
181	1	S	4-Br-苯基	524	1	S	2-CF_3-苯基
182	2	S	4-Br-苯基	525	2	S	2-CF_3-苯基
183	3	S	4-Br-苯基	526	3	S	2-CF_3-苯基
184	4	S	4-Br-苯基	527	4	S	2-CF_3-苯基
185	1	SO	4-Br-苯基	528	1	SO	2-CF_3-苯基
186	2	SO	4-Br-苯基	529	2	SO	2-CF_3-苯基
187	3	SO	4-Br-苯基	530	3	SO	2-CF_3-苯基
188	4	SO	4-Br-苯基	531	4	SO	2-CF_3-苯基
189	1	SO_2	4-Br-苯基	532	1	SO_2	2-CF_3-苯基
190	2	SO_2	4-Br-苯基	533	2	SO_2	2-CF_3-苯基
191	3	SO_2	4-Br-苯基	534	3	SO_2	2-CF_3-苯基
192	4	SO_2	4-Br-苯基	535	4	SO_2	2-CF_3-苯基
193	1	O	3-CF_3-苯基	536	1	O	4-CF_3-苯基
194	2	O	3-CF_3-苯基	537	2	O	4-CF_3-苯基
195	3	O	3-CF_3-苯基	538	3	O	4-CF_3-苯基
196	4	O	3-CF_3-苯基	539	4	O	4-CF_3-苯基
197	1	S	3-CF_3-苯基	540	1	S	4-CF_3-苯基
198	2	S	3-CF_3-苯基	541	2	S	4-CF_3-苯基
199	3	S	3-CF_3-苯基	542	3	S	4-CF_3-苯基
200	4	S	3-CF_3-苯基	543	4	S	4-CF_3-苯基
201	1	SO	3-CF_3-苯基	544	1	SO	4-CF_3-苯基
202	2	SO	3-CF_3-苯基	545	2	SO	4-CF_3-苯基
203	3	SO	3-CF_3-苯基	546	3	SO	4-CF_3-苯基
204	4	SO	3-CF_3-苯基	547	4	SO	3-CF_3-苯基
205	1	SO_2	3-CF_3-苯基	548	1	SO_2	4-CF_3-苯基

[3271]

206	2	SO_2	3-CF_3-苯基	549	2	SO_2	4-CF_3-苯基
207	3	SO_2	3-CF_3-苯基	550	3	SO_2	4-CF_3-苯基
208	4	SO_2	3-CF_3-苯基	551	4	SO_2	4-CF_3-苯基
209	1	O	2-iPr-苯基	552	1	O	3-iPr-苯基
210	2	O	2-iPr-苯基	553	2	O	3-iPr-苯基
211	3	O	2-iPr-苯基	554	3	O	3-iPr-苯基
212	4	O	2-iPr-苯基	555	4	O	3-iPr-苯基
213	1	S	2-iPr-苯基	556	1	S	3-iPr-苯基
214	2	S	2-iPr-苯基	557	2	S	3-iPr-苯基
215	3	S	2-iPr-苯基	558	3	S	3-iPr-苯基
216	4	S	2-iPr-苯基	559	4	S	3-iPr-苯基
217	1	SO	2-iPr-苯基	560	1	SO	3-iPr-苯基
218	2	SO	2-iPr-苯基	561	2	SO	3-iPr-苯基
219	3	SO	2-iPr-苯基	562	3	SO	3-iPr-苯基
220	4	SO	2-iPr-苯基	563	4	SO	3-iPr-苯基
221	1	SO_2	2-iPr-苯基	564	1	SO_2	3-iPr-苯基
222	2	SO_2	2-iPr-苯基	565	2	SO_2	3-iPr-苯基
223	3	SO_2	2-iPr-苯基	566	3	SO_2	3-iPr-苯基
224	4	SO_2	2-iPr-苯基	567	4	SO_2	3-iPr-苯基
225	1	O	4-iPr-苯基	568	1	O	4-NH_2-苯基
226	2	O	4-iPr-苯基	569	2	O	4-NH_2-苯基
227	3	O	4-iPr-苯基	570	3	O	4-NH_2-苯基
228	4	O	4-iPr-苯基	571	4	O	4-NH_2-苯基
229	1	S	4-iPr-苯基	572	1	S	4-NH_2-苯基
230	2	S	4-iPr-苯基	573	2	S	4-NH_2-苯基
231	3	S	4-iPr-苯基	574	3	S	4-NH_2-苯基
232	4	S	4-iPr-苯基	575	4	S	4-NH_2-苯基

[3272]

233	1	SO	4-iPr-苯基	576	1	SO	4-NH_2-苯基
234	2	SO	4-iPr-苯基	577	2	SO	4-NH_2-苯基
235	3	SO	4-iPr-苯基	578	3	SO	4-NH_2-苯基
236	4	SO	4-iPr-苯基	579	4	SO	4-NH_2-苯基
237	1	SO_2	4-iPr-苯基	580	1	SO_2	4-NH_2-苯基
238	2	SO_2	4-iPr-苯基	581	2	SO_2	4-NH_2-苯基
239	3	SO_2	4-iPr-苯基	582	3	SO_2	4-NH_2-苯基
240	4	SO_2	4-iPr-苯基	583	4	SO_2	4-NH_2-苯基
241	1	O	3-NH_2-苯基	584	1	O	2-NH_2-苯基
242	2	O	3-NH_2-苯基	585	2	O	2-NH_2-苯基
243	3	O	3-NH_2-苯基	586	3	O	2-NH_2-苯基
244	4	O	3-NH_2-苯基	587	4	O	2-NH_2-苯基
245	1	S	3-NH_2-苯基	588	1	S	2-NH_2-苯基
246	2	S	3-NH_2-苯基	589	2	S	2-NH_2-苯基
247	3	S	3-NH_2-苯基	590	3	S	2-NH_2-苯基
248	1	SO	3-NH_2-苯基	591	1	SO	2-NH_2-苯基
249	2	SO	3-NH_2-苯基	592	2	SO	2-NH_2-苯基
250	3	SO	3-NH_2-苯基	593	3	SO	2-NH_2-苯基
251	4	SO	3-NH_2-苯基	594	4	SO	2-NH_2-苯基
252	1	SO_2	3-NH_2-苯基	595	1	SO_2	2-NH_2-苯基
253	2	SO_2	3-NH_2-苯基	596	2	SO_2	2-NH_2-苯基
254	3	SO_2	3-NH_2-苯基	597	3	SO_2	2-NH_2-苯基
255	4	SO_2	3-NH_2-苯基	598	4	SO_2	2-NH_2-苯基
256	1	O	2,4-二-Me-苯基	599	1	O	2,6-二-Me-苯基
257	2	O	2,4-二-Me-苯基	600	2	O	2,6-二-Me-苯基
258	3	O	2,4-二-Me-苯基	601	3	O	2,6-二-Me-苯基
259	4	O	2,4-二-Me-苯基	602	4	O	2,6-二-Me-苯基

[3273]

260	1	S	2,4-二-Me-苯基	603	1	S	2,6-二-Me-苯基
261	2	S	2,4-二-Me-苯基	604	2	S	2,6-二-Me-苯基
262	3	S	2,4-二-Me-苯基	605	3	S	2,6-二-Me-苯基
263	4	S	2,4-二-Me-苯基	606	4	S	2,6-二-Me-苯基
264	1	SO	2,4-二-Me-苯基	607	1	SO	2,6-二-Me-苯基
265	2	SO	2,4-二-Me-苯基	608	2	SO	2,6-二-Me-苯基
266	3	SO	2,4-二-Me-苯基	609	3	SO	2,6-二-Me-苯基
267	4	SO	2,4-二-Me-苯基	610	4	SO	2,6-二-Me-苯基
268	1	SO_2	2,4-二-Me-苯基	611	1	SO_2	2,6-二-Me-苯基
269	2	SO_2	2,4-二-Me-苯基	612	2	SO_2	2,6-二-Me-苯基
270	3	SO_2	2,4-二-Me-苯基	613	3	SO_2	2,6-二-Me-苯基
271	4	SO_2	2,4-二-Me-苯基	614	4	SO_2	2,6-二-Me-苯基
272	1	O	2,6-二-iPr-苯基	615	1	O	2-Ph-苯基
273	2	O	2,6-二-iPr-苯基	616	2	O	2-Ph-苯基
274	3	O	2,6-二-iPr-苯基	617	3	O	2-Ph-苯基
275	4	O	2,6-二-iPr-苯基	618	4	O	2-Ph-苯基
276	1	S	2,6-二-iPr-苯基	619	1	S	2-Ph-苯基
277	2	S	2,6-二-iPr-苯基	620	2	S	2-Ph-苯基
278	3	S	2,6-二-iPr-苯基	621	3	S	2-Ph-苯基
279	4	S	2,6-二-iPr-苯基	622	4	S	2-Ph-苯基
280	1	SO	2,6-二-iPr-苯基	623	1	SO	2-Ph-苯基
281	2	SO	2,6-二-iPr-苯基	624	2	SO	2-Ph-苯基
282	3	SO	2,6-二-iPr-苯基	625	3	SO	2-Ph-苯基
283	4	SO	2,6-二-iPr-苯基	626	4	SO	2-Ph-苯基
284	1	SO_2	2,6-二-iPr-苯基	627	1	SO_2	2-Ph-苯基
285	2	SO_2	2,6-二-iPr-苯基	628	2	SO_2	2-Ph-苯基
286	3	SO_2	2,6-二-iPr-苯基	629	3	SO_2	2-Ph-苯基

[3274]

287	4	SO_2	2,6-二-iPr-苯基	630	4	SO_2	2-Ph-苯基
288	1	O	3-Ph-苯基	631	1	O	4-Ph-苯基
289	2	O	3-Ph-苯基	632	2	O	4-Ph-苯基
290	3	O	3-Ph-苯基	633	3	O	4-Ph-苯基
291	4	O	3-Ph-苯基	634	4	O	4-Ph-苯基
292	1	S	3-Ph-苯基	635	1	S	4-Ph-苯基
293	2	S	3-Ph-苯基	636	2	S	4-Ph-苯基
294	3	S	3-Ph-苯基	637	3	S	4-Ph-苯基
295	4	S	3-Ph-苯基	638	4	S	4-Ph-苯基
296	1	SO	3-Ph-苯基	639	1	SO	4-Ph-苯基
297	2	SO	3-Ph-苯基	640	2	SO	4-Ph-苯基
298	3	SO	3-Ph-苯基	641	3	SO	4-Ph-苯基
299	4	SO	3-Ph-苯基	642	4	SO	4-Ph-苯基
300	1	SO_2	3-Ph-苯基	643	1	SO_2	4-Ph-苯基
301	2	SO_2	3-Ph-苯基	644	2	SO_2	4-Ph-苯基
302	3	SO_2	3-Ph-苯基	645	3	SO_2	4-Ph-苯基
303	4	SO_2	3-Ph-苯基	646	4	SO_2	4-Ph-苯基
304	1	O	2-吗啉代-苯基	647	1	O	3-吗啉代-苯基
305	2	O	2-吗啉代-苯基	648	2	O	3-吗啉代-苯基
306	3	O	2-吗啉代-苯基	649	3	O	3-吗啉代-苯基
307	4	O	2-吗啉代-苯基	650	4	O	3-吗啉代-苯基
308	1	S	2-吗啉代-苯基	651	1	S	3-吗啉代-苯基
309	2	S	2-吗啉代-苯基	652	2	S	3-吗啉代-苯基
310	3	S	2-吗啉代-苯基	653	3	S	3-吗啉代-苯基
311	4	S	2-吗啉代-苯基	654	4	S	3-吗啉代-苯基
312	1	SO	2-吗啉代-苯基	655	1	SO	3-吗啉代-苯基
313	2	SO	2-吗啉代-苯基	656	2	SO	3-吗啉代-苯基

314	3	SO	2-吗啉代-苯基	657	3	SO	3-吗啉代-苯基
315	4	SO	2-吗啉代-苯基	658	4	SO	3-吗啉代-苯基
316	1	SO_2	2-吗啉代-苯基	659	1	SO_2	3-吗啉代-苯基
317	2	SO_2	2-吗啉代-苯基	660	2	SO_2	3-吗啉代-苯基
318	3	SO_2	2-吗啉代-苯基	661	3	SO_2	3-吗啉代-苯基
319	4	SO_2	2-吗啉代-苯基	662	4	SO_2	3-吗啉代-苯基
320	1	O	4-吗啉代-苯基	663	1	S	4-吗啉代-苯基
321	2	O	4-吗啉代-苯基	664	2	S	4-吗啉代-苯基
322	3	O	4-吗啉代-苯基	665	3	S	4-吗啉代-苯基
323	4	O	4-吗啉代-苯基	667	4	S	4-吗啉代-苯基
324	1	SO	4-吗啉代-苯基	668	1	SO_2	4-吗啉代-苯基
325	2	SO	4-吗啉代-苯基	669	2	SO_2	4-吗啉代-苯基
326	3	SO	4-吗啉代-苯基	670	3	SO_2	4-吗啉代-苯基
327	4	SO	4-吗啉代-苯基	671	4	SO_2	4-吗啉代-苯基
328	1	O	亚萘-1-基	672	1	O	亚萘-2-基
329	2	O	亚萘-1-基	673	2	O	亚萘-2-基
330	3	O	亚萘-1-基	674	3	O	亚萘-2-基
331	4	O	亚萘-1-基	675	4	O	亚萘-2-基
332	1	S	亚萘-1-基	676	1	S	亚萘-2-基
333	2	S	亚萘-1-基	678	2	S	亚萘-2-基
334	3	S	亚萘-1-基	679	3	S	亚萘-2-基
335	4	S	亚萘-1-基	680	4	S	亚萘-2-基
336	1	SO	亚萘-1-基	681	1	SO	亚萘-2-基
337	2	SO	亚萘-1-基	682	2	SO	亚萘-2-基
338	3	SO	亚萘-1-基	683	3	SO	亚萘-2-基
339	4	SO	亚萘-1-基	684	4	SO	亚萘-2-基
340	1	SO_2	亚萘-1-基	685	1	SO_2	亚萘-2-基

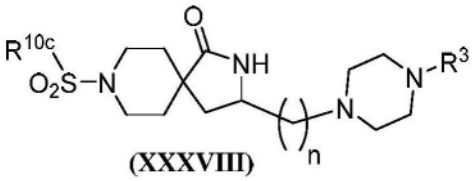
[3275]

[3276]

341	2	SO_2	亚萘-1-基	686	2	SO_2	亚萘-2-基
342	3	SO_2	亚萘-1-基	687	3	SO_2	亚萘-2-基
343	4	SO_2	亚萘-1-基	688	4	SO_2	亚萘-2-基

[3277] 示例性实施方案包括具有式(XXXVIII)的化合物

[3278]



(XXXVIII)

[3279] 或其可药用盐形式,如在下文表31中所定义

[3280] 表31:

[3281]

条目	n	R^3	R^{10c}
1	1	4-CH_3-苯基	乙基
2	1	4-CH_3-苯基	正丙基
3	1	4-CH_3-苯基	异丙基
4	1	4-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
5	1	4-CH_3-苯基	CF_3
6	1	4-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
7	1	4-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
8	1	4-CH_3-苯基	环丙基
9	1	4-CH_3-苯基	环丁基
10	1	4-CH_3-苯基	环戊基
11	1	4-CH_3-苯基	环己基
12	1	4-CH_3-苯基	3-吡啶基
13	1	4-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
14	1	4-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
15	1	4-CH_3-苯基	2-呋喃基
16	1	3-CH_3-苯基	乙基
17	1	3-CH_3-苯基	正丙基
18	1	3-CH_3-苯基	异丙基

19	1	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
20	1	3-CH_3-苯基	CF_3
21	1	3-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
22	1	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
23	1	3-CH_3-苯基	环丙基
24	1	3-CH_3-苯基	环丁基
25	1	3-CH_3-苯基	环戊基
26	1	3-CH_3-苯基	环己基
27	1	3-CH_3-苯基	3-吡啶基
28	1	3-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
29	1	3-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
30	1	3-CH_3-苯基	2-呋喃基
31	1	3-OH-苯基	乙基
32	1	3-OH-苯基	正丙基
33	1	3-OH-苯基	异丙基
34	1	3-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
35	1	3-OH-苯基	CF_3
36	1	3-OH-苯基	-CH_2CF_3
37	1	3-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
38	1	3-OH-苯基	环丙基
39	1	3-OH-苯基	环丁基
40	1	3-OH-苯基	环戊基
41	1	3-OH-苯基	环己基
42	1	3-OH-苯基	3-吡啶基
43	1	3-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
44	1	3-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
45	1	3-OH-苯基	2-呋喃基

[3282]

[3283]

46	1	4-OMe-苯基	乙基
47	1	4-OMe-苯基	正丙基
48	1	4-OMe-苯基	异丙基
49	1	4-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
50	1	4-OMe-苯基	CF_3
51	1	4-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
52	1	4-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
53	1	4-OMe-苯基	环丙基
54	1	4-OMe-苯基	环丁基
55	1	4-OMe-苯基	环戊基
56	1	4-OMe-苯基	环己基
57	1	4-OMe-苯基	3-吡啶基
58	1	4-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
59	1	4-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
60	1	4-OMe-苯基	2-呋喃基
61	1	2-OMe-苯基	乙基
62	1	2-OMe-苯基	正丙基
63	1	2-OMe-苯基	异丙基
64	1	2-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
65	1	2-OMe-苯基	CF_3
66	1	2-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
67	1	2-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
68	1	2-OMe-苯基	环丙基
69	1	2-OMe-苯基	环丁基
70	1	2-OMe-苯基	环戊基
71	1	2-OMe-苯基	环己基
72	1	2-OMe-苯基	3-吡啶基

[3284]

73	1	2-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
74	1	2-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
75	1	2-OMe-苯基	2-呋喃基
76	1	3-CN-苯基	乙基
77	1	3-CN-苯基	正丙基
78	1	3-CN-苯基	异丙基
79	1	3-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
80	1	3-CN-苯基	CF_3
81	1	3-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
82	1	3-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
83	1	3-CN-苯基	环丙基
84	1	3-CN-苯基	环丁基
85	1	3-CN-苯基	环戊基
86	1	3-CN-苯基	环己基
87	1	3-CN-苯基	3-吡啶基
88	1	3-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
89	1	3-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
90	1	3-CN-苯基	2-呋喃基
91	1	2-F-苯基	乙基
92	1	2-F-苯基	正丙基
93	1	2-F-苯基	异丙基
94	1	2-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
95	1	2-F-苯基	CF_3
96	1	2-F-苯基	$-CH_2CF_3$
97	1	2-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
98	1	2-F-苯基	环丙基
99	1	2-F-苯基	环丁基

[3285]

100	1	2-F-苯基	环戊基
101	1	2-F-苯基	环己基
102	1	2-F-苯基	3-吡啶基
103	1	2-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
104	1	2-F-苯基	1H-咪唑-4-基
105	1	2-F-苯基	2-呋喃基
106	1	4-F-苯基	乙基
107	1	4-F-苯基	正丙基
108	1	4-F-苯基	异丙基
109	1	4-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
110	1	4-F-苯基	CF_3
111	1	4-F-苯基	$-CH_2CF_3$
112	1	4-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
113	1	4-F-苯基	环丙基
114	1	4-F-苯基	环丁基
115	1	4-F-苯基	环戊基
116	1	4-F-苯基	环己基
117	1	4-F-苯基	3-吡啶基
118	1	4-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
119	1	4-F-苯基	1H-咪唑-4-基
120	1	4-F-苯基	2-呋喃基
121	1	3-Cl-苯基	乙基
122	1	3-Cl-苯基	正丙基
123	1	3-Cl-苯基	异丙基
124	1	3-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
125	1	3-Cl-苯基	CF_3
126	1	3-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$

[3286]

127	1	3-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
128	1	3-Cl-苯基	环丙基
129	1	3-Cl-苯基	环丁基
130	1	3-Cl-苯基	环戊基
131	1	3-Cl-苯基	环己基
132	1	3-Cl-苯基	3-吡啶基
133	1	3-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
134	1	3-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
135	1	3-Cl-苯基	2-呋喃基
136	1	2-Br-苯基	乙基
137	1	2-Br-苯基	正丙基
138	1	2-Br-苯基	异丙基
139	1	2-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
140	1	2-Br-苯基	CF_3
141	1	2-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
142	1	2-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
143	1	2-Br-苯基	环丙基
144	1	2-Br-苯基	环丁基
145	1	2-Br-苯基	环戊基
146	1	2-Br-苯基	环己基
147	1	2-Br-苯基	3-吡啶基
148	1	2-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
149	1	2-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
150	1	2-Br-苯基	2-呋喃基
151	1	4-Br-苯基	乙基
152	1	4-Br-苯基	正丙基
153	1	4-Br-苯基	异丙基

[3287]

154	1	4-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
155	1	4-Br-苯基	CF_3
156	1	4-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
157	1	4-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
158	1	4-Br-苯基	环丙基
159	1	4-Br-苯基	环丁基
160	1	4-Br-苯基	环戊基
161	1	4-Br-苯基	环己基
162	1	4-Br-苯基	3-吡啶基
163	1	4-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
164	1	4-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
165	1	4-Br-苯基	2-呋喃基
166	1	3-CF_3-苯基	乙基
167	1	3-CF_3-苯基	正丙基
168	1	3-CF_3-苯基	异丙基
169	1	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
170	1	3-CF_3-苯基	CF_3
171	1	3-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
172	1	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
173	1	3-CF_3-苯基	环丙基
174	1	3-CF_3-苯基	环丁基
175	1	3-CF_3-苯基	环戊基
176	1	3-CF_3-苯基	环己基
177	1	3-CF_3-苯基	3-吡啶基
178	1	3-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
179	1	3-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
180	1	3-CF_3-苯基	2-呋喃基

[3288]

181	1	2-iPr-苯基	乙基
182	1	2-iPr-苯基	正丙基
183	1	2-iPr-苯基	异丙基
184	1	2-iPr-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
185	1	2-iPr-苯基	CF_3
186	1	2-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
187	1	2-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
188	1	2-iPr-苯基	环丙基
189	1	2-iPr-苯基	环丁基
190	1	2-iPr-苯基	环戊基
191	1	2-iPr-苯基	环己基
192	1	2-iPr-苯基	3-吡啶基
193	1	2-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
194	1	2-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
195	1	2-iPr-苯基	2-呋喃基
196	1	4-iPr-苯基	乙基
197	1	4-iPr-苯基	正丙基
198	1	4-iPr-苯基	异丙基
199	1	4-iPr-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
200	1	4-iPr-苯基	CF_3
201	1	4-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
202	1	4-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
203	1	4-iPr-苯基	环丙基
204	1	4-iPr-苯基	环丁基
205	1	4-iPr-苯基	环戊基
206	1	4-iPr-苯基	环己基
207	1	4-iPr-苯基	3-吡啶基

[3289]

208	1	4-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
209	1	4-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
210	1	4-iPr-苯基	2-呋喃基
211	1	3-吗啉代-苯基	乙基
212	1	3-吗啉代-苯基	正丙基
213	1	3-吗啉代-苯基	异丙基
214	1	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
215	1	3-吗啉代-苯基	CF_3
216	1	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
217	1	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
218	1	3-吗啉代-苯基	环丙基
219	1	3-吗啉代-苯基	环丁基
220	1	3-吗啉代-苯基	环戊基
221	1	3-吗啉代-苯基	环己基
222	1	3-吗啉代-苯基	3-吡啶基
223	1	3-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
224	1	3-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
225	1	3-吗啉代-苯基	2-呋喃基
226	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	乙基
227	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	正丙基
228	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	异丙基
229	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
230	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	CF_3
231	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
232	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
233	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丙基
234	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丁基

[3290]

235	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环戊基
236	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环己基
237	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
238	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
239	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
240	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
241	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	乙基
242	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	正丙基
243	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	异丙基
244	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
245	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	CF_3
246	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
247	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
248	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丙基
249	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丁基
250	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环戊基
251	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环己基
252	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
253	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
254	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
255	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
256	1	$2-CH_3$-苯基	乙基
257	1	$2-CH_3$-苯基	正丙基
258	1	$2-CH_3$-苯基	异丙基
259	1	$2-CH_3$-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
260	1	$2-CH_3$-苯基	CF_3
261	1	$2-CH_3$-苯基	$-CH_2CF_3$

[3291]

262	1	2-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
263	1	2-CH_3-苯基	环丙基
264	1	2-CH_3-苯基	环丁基
265	1	2-CH_3-苯基	环戊基
266	1	2-CH_3-苯基	环己基
267	1	2-CH_3-苯基	3-吡啶基
268	1	2-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
269	1	2-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
270	1	2-CH_3-苯基	2-呋喃基
271	1	4-OH-苯基	乙基
272	1	4-OH-苯基	正丙基
273	1	4-OH-苯基	异丙基
274	1	4-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
275	1	4-OH-苯基	CF_3
276	1	4-OH-苯基	-CH_2CF_3
277	1	4-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
278	1	4-OH-苯基	环丙基
279	1	4-OH-苯基	环丁基
280	1	4-OH-苯基	环戊基
281	1	4-OH-苯基	环己基
282	1	4-OH-苯基	3-吡啶基
283	1	4-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
284	1	4-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
285	1	4-OH-苯基	2-呋喃基
286	1	2-OH-苯基	乙基
287	1	2-OH-苯基	正丙基
288	1	2-OH-苯基	异丙基

[3292]

289	1	2-OH-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
290	1	2-OH-苯基	CF_3
291	1	2-OH-苯基	$-CH_2CF_3$
292	1	2-OH-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
293	1	2-OH-苯基	环丙基
294	1	2-OH-苯基	环丁基
295	1	2-OH-苯基	环戊基
296	1	2-OH-苯基	环己基
297	1	2-OH-苯基	3-吡啶基
298	1	2-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
299	1	2-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
300	1	2-OH-苯基	2-呋喃基
301	1	3-OMe-苯基	乙基
302	1	3-OMe-苯基	正丙基
303	1	3-OMe-苯基	异丙基
304	1	3-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
305	1	3-OMe-苯基	CF_3
306	1	3-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
307	1	3-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
308	1	3-OMe-苯基	环丙基
309	1	3-OMe-苯基	环丁基
310	1	3-OMe-苯基	环戊基
311	1	3-OMe-苯基	环己基
312	1	3-OMe-苯基	3-吡啶基
313	1	3-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
314	1	3-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
315	1	3-OMe-苯基	2-呋喃基

[3293]

316	1	4-CN-苯基	乙基
317	1	4-CN-苯基	正丙基
318	1	4-CN-苯基	异丙基
319	1	4-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
320	1	4-CN-苯基	CF_3
321	1	4-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
322	1	4-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
323	1	4-CN-苯基	环丙基
324	1	4-CN-苯基	环丁基
325	1	4-CN-苯基	环戊基
326	1	4-CN-苯基	环己基
327	1	4-CN-苯基	3-吡啶基
328	1	4-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
329	1	4-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
330	1	4-CN-苯基	2-呋喃基
331	1	2-CN-苯基	乙基
332	1	2-CN-苯基	正丙基
333	1	2-CN-苯基	异丙基
334	1	2-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
335	1	2-CN-苯基	CF_3
336	1	2-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
337	1	2-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
338	1	2-CN-苯基	环丙基
339	1	2-CN-苯基	环丁基
340	1	2-CN-苯基	环戊基
341	1	2-CN-苯基	环己基
342	1	2-CN-苯基	3-吡啶基

[3294]

343	1	2-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
344	1	2-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
345	1	2-CN-苯基	2-呋喃基
346	1	3-F-苯基	乙基
347	1	3-F-苯基	正丙基
348	1	3-F-苯基	异丙基
349	1	3-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
350	1	3-F-苯基	CF_3
351	1	3-F-苯基	$-CH_2CF_3$
352	1	3-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
353	1	3-F-苯基	环丙基
354	1	3-F-苯基	环丁基
355	1	3-F-苯基	环戊基
356	1	3-F-苯基	环己基
357	1	3-F-苯基	3-吡啶基
358	1	3-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
359	1	3-F-苯基	1H-咪唑-4-基
360	1	3-F-苯基	2-呋喃基
361	1	2-Cl-苯基	乙基
362	1	2-Cl-苯基	正丙基
363	1	2-Cl-苯基	异丙基
364	1	2-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
365	1	2-Cl-苯基	CF_3
366	1	2-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
367	1	2-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
368	1	2-Cl-苯基	环丙基
369	1	2-Cl-苯基	环丁基

[3295]

370	1	2-Cl-苯基	环戊基
371	1	2-Cl-苯基	环己基
372	1	2-Cl-苯基	3-吡啶基
373	1	2-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
374	1	2-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
375	1	2-Cl-苯基	2-呋喃基
376	1	4-Cl-苯基	乙基
377	1	4-Cl-苯基	正丙基
378	1	4-Cl-苯基	异丙基
379	1	4-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
380	1	4-Cl-苯基	CF_3
381	1	4-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
382	1	4-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
383	1	4-Cl-苯基	环丙基
384	1	4-Cl-苯基	环丁基
385	1	4-Cl-苯基	环戊基
386	1	4-Cl-苯基	环己基
387	1	4-Cl-苯基	3-吡啶基
388	1	4-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
389	1	4-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
390	1	4-Cl-苯基	2-呋喃基
391	1	3-Br-苯基	乙基
392	1	3-Br-苯基	正丙基
393	1	3-Br-苯基	异丙基
394	1	3-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
395	1	3-Br-苯基	CF_3
396	1	3-Br-苯基	$-CH_2CF_3$

[3296]

397	1	3-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
398	1	3-Br-苯基	环丙基
399	1	3-Br-苯基	环丁基
400	1	3-Br-苯基	环戊基
401	1	3-Br-苯基	环己基
402	1	3-Br-苯基	3-吡啶基
403	1	3-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
404	1	3-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
405	1	3-Br-苯基	2-呋喃基
406	1	2-CF_3-苯基	乙基
407	1	2-CF_3-苯基	正丙基
408	1	2-CF_3-苯基	异丙基
409	1	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
410	1	2-CF_3-苯基	CF_3
411	1	2-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
412	1	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
413	1	2-CF_3-苯基	环丙基
414	1	2-CF_3-苯基	环丁基
415	1	2-CF_3-苯基	环戊基
416	1	2-CF_3-苯基	环己基
417	1	2-CF_3-苯基	3-吡啶基
418	1	2-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
419	1	2-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
420	1	2-CF_3-苯基	2-呋喃基
421	1	4-CF_3-苯基	乙基
422	1	4-CF_3-苯基	正丙基
423	1	4-CF_3-苯基	异丙基

[3297]

424	1	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
425	1	4-CF_3-苯基	CF_3
426	1	4-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
427	1	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
428	1	4-CF_3-苯基	环丙基
429	1	4-CF_3-苯基	环丁基
430	1	4-CF_3-苯基	环戊基
431	1	4-CF_3-苯基	环己基
432	1	4-CF_3-苯基	3-吡啶基
433	1	4-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
434	1	4-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
435	1	4-CF_3-苯基	2-呋喃基
436	1	3-iPr-苯基	乙基
437	1	3-iPr-苯基	正丙基
438	1	3-iPr-苯基	异丙基
439	1	3-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
440	1	3-iPr-苯基	CF_3
441	1	3-iPr-苯基	-CH_2CF_3
442	1	3-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
443	1	3-iPr-苯基	环丙基
444	1	3-iPr-苯基	环丁基
445	1	3-iPr-苯基	环戊基
446	1	3-iPr-苯基	环己基
447	1	3-iPr-苯基	3-吡啶基
448	1	3-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
449	1	3-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
450	1	3-iPr-苯基	2-呋喃基

[3298]

451	1	2-吗啉代-苯基	乙基
452	1	2-吗啉代-苯基	正丙基
453	1	2-吗啉代-苯基	异丙基
454	1	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
455	1	2-吗啉代-苯基	CF_3
456	1	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
457	1	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
458	1	2-吗啉代-苯基	环丙基
459	1	2-吗啉代-苯基	环丁基
460	1	2-吗啉代-苯基	环戊基
461	1	2-吗啉代-苯基	环己基
462	1	2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
463	1	2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
464	1	2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
465	1	2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
466	1	4-吗啉代-苯基	乙基
467	1	4-吗啉代-苯基	正丙基
468	1	4-吗啉代-苯基	异丙基
469	1	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
470	1	4-吗啉代-苯基	CF_3
471	1	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
472	1	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
473	1	4-吗啉代-苯基	环丙基
474	1	4-吗啉代-苯基	环丁基
475	1	4-吗啉代-苯基	环戊基
476	1	4-吗啉代-苯基	环己基
477	1	4-吗啉代-苯基	3-吡啶基

[3299]

478	1	4-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
479	1	4-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
480	1	4-吗啉代-苯基	2-呋喃基
481	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	乙基
482	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	正丙基
483	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	异丙基
484	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
485	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	CF_3
486	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
487	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
488	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丙基
489	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丁基
490	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环戊基
491	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环己基
492	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
493	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
494	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
495	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
496	2	4-CH_3-苯基	乙基
497	2	4-CH_3-苯基	正丙基
498	2	4-CH_3-苯基	异丙基
499	2	4-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
500	2	4-CH_3-苯基	CF_3
501	2	4-CH_3-苯基	$-CH_2CF_3$
502	2	4-CH_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
503	2	4-CH_3-苯基	环丙基
504	2	4-CH_3-苯基	环丁基

[3300]

505	2	4-CH_3-苯基	环戊基
506	2	4-CH_3-苯基	环己基
507	2	4-CH_3-苯基	3-吡啶基
508	2	4-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
509	2	4-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
510	2	4-CH_3-苯基	2-呋喃基
511	2	3-CH_3-苯基	乙基
512	2	3-CH_3-苯基	正丙基
513	2	3-CH_3-苯基	异丙基
514	2	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
515	2	3-CH_3-苯基	CF_3
516	2	3-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
517	2	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
518	2	3-CH_3-苯基	环丙基
519	2	3-CH_3-苯基	环丁基
520	2	3-CH_3-苯基	环戊基
521	2	3-CH_3-苯基	环己基
522	2	3-CH_3-苯基	3-吡啶基
523	2	3-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
524	2	3-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
525	2	3-CH_3-苯基	2-呋喃基
526	2	3-OH-苯基	乙基
527	2	3-OH-苯基	正丙基
528	2	3-OH-苯基	异丙基
529	2	3-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
530	2	3-OH-苯基	CF_3
531	2	3-OH-苯基	-CH_2CF_3

[3301]

532	2	3-OH-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
533	2	3-OH-苯基	环丙基
534	2	3-OH-苯基	环丁基
535	2	3-OH-苯基	环戊基
536	2	3-OH-苯基	环己基
537	2	3-OH-苯基	3-吡啶基
538	2	3-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
539	2	3-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
540	2	3-OH-苯基	2-呋喃基
541	2	4-OMe-苯基	乙基
542	2	4-OMe-苯基	正丙基
543	2	4-OMe-苯基	异丙基
544	2	4-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
545	2	4-OMe-苯基	CF_3
546	2	4-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
547	2	4-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
548	2	4-OMe-苯基	环丙基
549	2	4-OMe-苯基	环丁基
550	2	4-OMe-苯基	环戊基
551	2	4-OMe-苯基	环己基
552	2	4-OMe-苯基	3-吡啶基
553	2	4-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
554	2	4-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
555	2	4-OMe-苯基	2-呋喃基
556	2	2-OMe-苯基	乙基
557	2	2-OMe-苯基	正丙基
558	2	2-OMe-苯基	异丙基

[3302]

559	2	2-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
560	2	2-OMe-苯基	CF_3
561	2	2-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
562	2	2-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
563	2	2-OMe-苯基	环丙基
564	2	2-OMe-苯基	环丁基
565	2	2-OMe-苯基	环戊基
566	2	2-OMe-苯基	环己基
567	2	2-OMe-苯基	3-吡啶基
568	2	2-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
569	2	2-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
570	2	2-OMe-苯基	2-呋喃基
571	2	3-CN-苯基	乙基
572	2	3-CN-苯基	正丙基
573	2	3-CN-苯基	异丙基
574	2	3-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
575	2	3-CN-苯基	CF_3
576	2	3-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
577	2	3-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
578	2	3-CN-苯基	环丙基
579	2	3-CN-苯基	环丁基
580	2	3-CN-苯基	环戊基
581	2	3-CN-苯基	环己基
582	2	3-CN-苯基	3-吡啶基
583	2	3-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
584	2	3-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
585	2	3-CN-苯基	2-呋喃基

[3303]

586	2	2-F-苯基	乙基
587	2	2-F-苯基	正丙基
588	2	2-F-苯基	异丙基
589	2	2-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
590	2	2-F-苯基	CF_3
591	2	2-F-苯基	$-CH_2CF_3$
592	2	2-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
593	2	2-F-苯基	环丙基
594	2	2-F-苯基	环丁基
595	2	2-F-苯基	环戊基
596	2	2-F-苯基	环己基
597	2	2-F-苯基	3-吡啶基
598	2	2-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
599	2	2-F-苯基	1H-咪唑-4-基
600	2	2-F-苯基	2-呋喃基
601	2	4-F-苯基	乙基
602	2	4-F-苯基	正丙基
603	2	4-F-苯基	异丙基
604	2	4-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
605	2	4-F-苯基	CF_3
606	2	4-F-苯基	$-CH_2CF_3$
607	2	4-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
608	2	4-F-苯基	环丙基
609	2	4-F-苯基	环丁基
610	2	4-F-苯基	环戊基
611	2	4-F-苯基	环己基
612	2	4-F-苯基	3-吡啶基

[3304]

613	2	4-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
614	2	4-F-苯基	1H-咪唑-4-基
615	2	4-F-苯基	2-呋喃基
616	2	3-Cl-苯基	乙基
617	2	3-Cl-苯基	正丙基
618	2	3-Cl-苯基	异丙基
619	2	3-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
620	2	3-Cl-苯基	CF_3
621	2	3-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
622	2	3-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
623	2	3-Cl-苯基	环丙基
624	2	3-Cl-苯基	环丁基
625	2	3-Cl-苯基	环戊基
626	2	3-Cl-苯基	环己基
627	2	3-Cl-苯基	3-吡啶基
628	2	3-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
629	2	3-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
630	2	3-Cl-苯基	2-呋喃基
631	2	2-Br-苯基	乙基
632	2	2-Br-苯基	正丙基
633	2	2-Br-苯基	异丙基
634	2	2-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
635	2	2-Br-苯基	CF_3
636	2	2-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
637	2	2-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
638	2	2-Br-苯基	环丙基
639	2	2-Br-苯基	环丁基

[3305]

640	2	2-Br-苯基	环戊基
641	2	2-Br-苯基	环己基
642	2	2-Br-苯基	3-吡啶基
643	2	2-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
644	2	2-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
645	2	2-Br-苯基	2-呋喃基
646	2	4-Br-苯基	乙基
647	2	4-Br-苯基	正丙基
648	2	4-Br-苯基	异丙基
649	2	4-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
650	2	4-Br-苯基	CF_3
651	2	4-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
652	2	4-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
653	2	4-Br-苯基	环丙基
654	2	4-Br-苯基	环丁基
655	2	4-Br-苯基	环戊基
656	2	4-Br-苯基	环己基
657	2	4-Br-苯基	3-吡啶基
658	2	4-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
659	2	4-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
660	2	4-Br-苯基	2-呋喃基
661	2	3-CF_3-苯基	乙基
662	2	3-CF_3-苯基	正丙基
663	2	3-CF_3-苯基	异丙基
664	2	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
665	2	3-CF_3-苯基	CF_3
666	2	3-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$

667	2	3-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
668	2	3-CF_3-苯基	环丙基
669	2	3-CF_3-苯基	环丁基
670	2	3-CF_3-苯基	环戊基
671	2	3-CF_3-苯基	环己基
672	2	3-CF_3-苯基	3-吡啶基
673	2	3-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
674	2	3-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
675	2	3-CF_3-苯基	2-呋喃基
676	2	2-iPr-苯基	乙基
677	2	2-iPr-苯基	正丙基
678	2	2-iPr-苯基	异丙基
679	2	2-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
[3306] 680	2	2-iPr-苯基	CF_3
681	2	2-iPr-苯基	-CH_2CF_3
682	2	2-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
683	2	2-iPr-苯基	环丙基
684	2	2-iPr-苯基	环丁基
685	2	2-iPr-苯基	环戊基
686	2	2-iPr-苯基	环己基
687	2	2-iPr-苯基	3-吡啶基
688	2	2-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
689	2	2-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
690	2	2-iPr-苯基	2-呋喃基
691	2	4-iPr-苯基	乙基
692	2	4-iPr-苯基	正丙基
693	2	4-iPr-苯基	异丙基

[3307]

694	2	4-iPr-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
695	2	4-iPr-苯基	CF_3
696	2	4-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
697	2	4-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
698	2	4-iPr-苯基	环丙基
699	2	4-iPr-苯基	环丁基
700	2	4-iPr-苯基	环戊基
701	2	4-iPr-苯基	环己基
702	2	4-iPr-苯基	3-吡啶基
703	2	4-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
704	2	4-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
705	2	4-iPr-苯基	2-呋喃基
706	2	3-吗啉代-苯基	乙基
707	2	3-吗啉代-苯基	正丙基
708	2	3-吗啉代-苯基	异丙基
709	2	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
710	2	3-吗啉代-苯基	CF_3
711	2	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
712	2	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
713	2	3-吗啉代-苯基	环丙基
714	2	3-吗啉代-苯基	环丁基
715	2	3-吗啉代-苯基	环戊基
716	2	3-吗啉代-苯基	环己基
717	2	3-吗啉代-苯基	3-吡啶基
718	2	3-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
719	2	3-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
720	2	3-吗啉代-苯基	2-呋喃基

[3308]

721	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	乙基
722	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	正丙基
723	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	异丙基
724	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
725	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	CF_3
726	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
727	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
728	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丙基
729	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丁基
730	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环戊基
731	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环己基
732	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
733	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
734	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
735	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
736	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	乙基
737	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	正丙基
738	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	异丙基
739	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
740	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	CF_3
741	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
742	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
743	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丙基
744	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丁基
745	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环戊基
746	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环己基
747	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基

[3309]

748	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
749	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
750	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
751	2	2-CH_3-苯基	乙基
752	2	2-CH_3-苯基	正丙基
753	2	2-CH_3-苯基	异丙基
754	2	2-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
755	2	2-CH_3-苯基	CF_3
756	2	2-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
757	2	2-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
758	2	2-CH_3-苯基	环丙基
759	2	2-CH_3-苯基	环丁基
760	2	2-CH_3-苯基	环戊基
761	2	2-CH_3-苯基	环己基
762	2	2-CH_3-苯基	3-吡啶基
763	2	2-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
764	2	2-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
765	2	2-CH_3-苯基	2-呋喃基
766	2	4-OH-苯基	乙基
767	2	4-OH-苯基	正丙基
768	2	4-OH-苯基	异丙基
769	2	4-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
770	2	4-OH-苯基	CF_3
771	2	4-OH-苯基	-CH_2CF_3
772	2	4-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
773	2	4-OH-苯基	环丙基
774	2	4-OH-苯基	环丁基

[3310]

775	2	4-OH-苯基	环戊基
776	2	4-OH-苯基	环己基
777	2	4-OH-苯基	3-吡啶基
778	2	4-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
779	2	4-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
780	2	4-OH-苯基	2-呋喃基
781	2	2-OH-苯基	乙基
782	2	2-OH-苯基	正丙基
783	2	2-OH-苯基	异丙基
784	2	2-OH-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
785	2	2-OH-苯基	CF_3
786	2	2-OH-苯基	$-CH_2CF_3$
787	2	2-OH-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
788	2	2-OH-苯基	环丙基
789	2	2-OH-苯基	环丁基
790	2	2-OH-苯基	环戊基
791	2	2-OH-苯基	环己基
792	2	2-OH-苯基	3-吡啶基
793	2	2-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
794	2	2-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
795	2	2-OH-苯基	2-呋喃基
796	2	3-OMe-苯基	乙基
797	2	3-OMe-苯基	正丙基
798	2	3-OMe-苯基	异丙基
799	2	3-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
800	2	3-OMe-苯基	CF_3
801	2	3-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$

[3311]

802	2	3-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
803	2	3-OMe-苯基	环丙基
804	2	3-OMe-苯基	环丁基
805	2	3-OMe-苯基	环戊基
806	2	3-OMe-苯基	环己基
807	2	3-OMe-苯基	3-吡啶基
808	2	3-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
809	2	3-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
810	2	3-OMe-苯基	2-呋喃基
811	2	4-CN-苯基	乙基
812	2	4-CN-苯基	正丙基
813	2	4-CN-苯基	异丙基
814	2	4-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
815	2	4-CN-苯基	CF_3
816	2	4-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
817	2	4-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
818	2	4-CN-苯基	环丙基
819	2	4-CN-苯基	环丁基
820	2	4-CN-苯基	环戊基
821	2	4-CN-苯基	环己基
822	2	4-CN-苯基	3-吡啶基
823	2	4-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
824	2	4-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
825	2	4-CN-苯基	2-呋喃基
826	2	2-CN-苯基	乙基
827	2	2-CN-苯基	正丙基
828	2	2-CN-苯基	异丙基

[3312]

829	2	2-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
830	2	2-CN-苯基	CF_3
831	2	2-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
832	2	2-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
833	2	2-CN-苯基	环丙基
834	2	2-CN-苯基	环丁基
835	2	2-CN-苯基	环戊基
836	2	2-CN-苯基	环己基
837	2	2-CN-苯基	3-吡啶基
838	2	2-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
839	2	2-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
840	2	2-CN-苯基	2-呋喃基
841	2	3-F-苯基	乙基
842	2	3-F-苯基	正丙基
843	2	3-F-苯基	异丙基
844	2	3-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
845	2	3-F-苯基	CF_3
846	2	3-F-苯基	$-CH_2CF_3$
847	2	3-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
848	2	3-F-苯基	环丙基
849	2	3-F-苯基	环丁基
850	2	3-F-苯基	环戊基
851	2	3-F-苯基	环己基
852	2	3-F-苯基	3-吡啶基
853	2	3-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
854	2	3-F-苯基	1H-咪唑-4-基
855	2	3-F-苯基	2-呋喃基

[3313]

856	2	2-Cl-苯基	乙基
857	2	2-Cl-苯基	正丙基
858	2	2-Cl-苯基	异丙基
859	2	2-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
860	2	2-Cl-苯基	CF_3
861	2	2-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
862	2	2-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
863	2	2-Cl-苯基	环丙基
864	2	2-Cl-苯基	环丁基
865	2	2-Cl-苯基	环戊基
866	2	2-Cl-苯基	环己基
867	2	2-Cl-苯基	3-吡啶基
868	2	2-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
869	2	2-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
870	2	2-Cl-苯基	2-呋喃基
871	2	4-Cl-苯基	乙基
872	2	4-Cl-苯基	正丙基
873	2	4-Cl-苯基	异丙基
874	2	4-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
875	2	4-Cl-苯基	CF_3
876	2	4-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
877	2	4-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
878	2	4-Cl-苯基	环丙基
879	2	4-Cl-苯基	环丁基
880	2	4-Cl-苯基	环戊基
881	2	4-Cl-苯基	环己基
882	2	4-Cl-苯基	3-吡啶基

[3314]

883	2	4-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
884	2	4-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
885	2	4-Cl-苯基	2-呋喃基
886	2	3-Br-苯基	乙基
887	2	3-Br-苯基	正丙基
888	2	3-Br-苯基	异丙基
889	2	3-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
890	2	3-Br-苯基	CF_3
891	2	3-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
892	2	3-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
893	2	3-Br-苯基	环丙基
894	2	3-Br-苯基	环丁基
895	2	3-Br-苯基	环戊基
896	2	3-Br-苯基	环己基
897	2	3-Br-苯基	3-吡啶基
898	2	3-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
899	2	3-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
900	2	3-Br-苯基	2-呋喃基
901	2	2-CF_3-苯基	乙基
902	2	2-CF_3-苯基	正丙基
903	2	2-CF_3-苯基	异丙基
904	2	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
905	2	2-CF_3-苯基	CF_3
906	2	2-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
907	2	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
908	2	2-CF_3-苯基	环丙基
909	2	2-CF_3-苯基	环丁基

[3315]

910	2	2-CF_3-苯基	环戊基
911	2	2-CF_3-苯基	环己基
912	2	2-CF_3-苯基	3-吡啶基
913	2	2-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
914	2	2-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
915	2	2-CF_3-苯基	2-呋喃基
916	2	4-CF_3-苯基	乙基
917	2	4-CF_3-苯基	正丙基
918	2	4-CF_3-苯基	异丙基
919	2	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
920	2	4-CF_3-苯基	CF_3
921	2	4-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
922	2	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
923	2	4-CF_3-苯基	环丙基
924	2	4-CF_3-苯基	环丁基
925	2	4-CF_3-苯基	环戊基
926	2	4-CF_3-苯基	环己基
927	2	4-CF_3-苯基	3-吡啶基
928	2	4-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
929	2	4-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
930	2	4-CF_3-苯基	2-呋喃基
931	2	3-iPr-苯基	乙基
932	2	3-iPr-苯基	正丙基
933	2	3-iPr-苯基	异丙基
934	2	3-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
935	2	3-iPr-苯基	CF_3
936	2	3-iPr-苯基	-CH_2CF_3

[3316]

937	2	3-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
938	2	3-iPr-苯基	环丙基
939	2	3-iPr-苯基	环丁基
940	2	3-iPr-苯基	环戊基
941	2	3-iPr-苯基	环己基
942	2	3-iPr-苯基	3-吡啶基
943	2	3-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
944	2	3-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
945	2	3-iPr-苯基	2-呋喃基
946	2	2-吗啉代-苯基	乙基
947	2	2-吗啉代-苯基	正丙基
948	2	2-吗啉代-苯基	异丙基
949	2	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
950	2	2-吗啉代-苯基	CF_3
951	2	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
952	2	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
953	2	2-吗啉代-苯基	环丙基
954	2	2-吗啉代-苯基	环丁基
955	2	2-吗啉代-苯基	环戊基
956	2	2-吗啉代-苯基	环己基
957	2	2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
958	2	2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
959	2	2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
960	2	2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
961	2	4-吗啉代-苯基	乙基
962	2	4-吗啉代-苯基	正丙基
963	2	4-吗啉代-苯基	异丙基

[3317]

964	2	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
965	2	4-吗啉代-苯基	CF_3
966	2	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
967	2	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
968	2	4-吗啉代-苯基	环丙基
969	2	4-吗啉代-苯基	环丁基
970	2	4-吗啉代-苯基	环戊基
971	2	4-吗啉代-苯基	环己基
972	2	4-吗啉代-苯基	3-吡啶基
973	2	4-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
974	2	4-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
975	2	4-吗啉代-苯基	2-呋喃基
976	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	乙基
977	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	正丙基
978	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	异丙基
979	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
980	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	CF_3
981	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
982	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
983	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丙基
984	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丁基
985	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环戊基
986	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环己基
987	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
988	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
989	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
990	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基

[3318]

991	3	4-CH_3-苯基	乙基
992	3	4-CH_3-苯基	正丙基
993	3	4-CH_3-苯基	异丙基
994	3	4-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
995	3	4-CH_3-苯基	CF_3
996	3	4-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
997	3	4-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
998	3	4-CH_3-苯基	环丙基
999	3	4-CH_3-苯基	环丁基
1000	3	4-CH_3-苯基	环戊基
1001	3	4-CH_3-苯基	环己基
1002	3	4-CH_3-苯基	3-吡啶基
1003	3	4-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1004	3	4-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1005	3	4-CH_3-苯基	2-呋喃基
1006	3	3-CH_3-苯基	乙基
1007	3	3-CH_3-苯基	正丙基
1008	3	3-CH_3-苯基	异丙基
1009	3	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1010	3	3-CH_3-苯基	CF_3
1011	3	3-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
1012	3	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1013	3	3-CH_3-苯基	环丙基
1014	3	3-CH_3-苯基	环丁基
1015	3	3-CH_3-苯基	环戊基
1016	3	3-CH_3-苯基	环己基
1017	3	3-CH_3-苯基	3-吡啶基

[3319]

1018	3	3-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1019	3	3-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1020	3	3-CH_3-苯基	2-呋喃基
1021	3	3-OH-苯基	乙基
1022	3	3-OH-苯基	正丙基
1023	3	3-OH-苯基	异丙基
1024	3	3-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1025	3	3-OH-苯基	CF_3
1026	3	3-OH-苯基	-CH_2CF_3
1027	3	3-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1028	3	3-OH-苯基	环丙基
1029	3	3-OH-苯基	环丁基
1030	3	3-OH-苯基	环戊基
1031	3	3-OH-苯基	环己基
1032	3	3-OH-苯基	3-吡啶基
1033	3	3-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1034	3	3-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1035	3	3-OH-苯基	2-呋喃基
1036	3	4-OMe-苯基	乙基
1037	3	4-OMe-苯基	正丙基
1038	3	4-OMe-苯基	异丙基
1039	3	4-OMe-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1040	3	4-OMe-苯基	CF_3
1041	3	4-OMe-苯基	-CH_2CF_3
1042	3	4-OMe-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1043	3	4-OMe-苯基	环丙基
1044	3	4-OMe-苯基	环丁基

[3320]

1045	3	4-OMe-苯基	环戊基
1046	3	4-OMe-苯基	环己基
1047	3	4-OMe-苯基	3-吡啶基
1048	3	4-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1049	3	4-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1050	3	4-OMe-苯基	2-呋喃基
1051	3	2-OMe-苯基	乙基
1052	3	2-OMe-苯基	正丙基
1053	3	2-OMe-苯基	异丙基
1054	3	2-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1055	3	2-OMe-苯基	CF_3
1056	3	2-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1057	3	2-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1058	3	2-OMe-苯基	环丙基
1059	3	2-OMe-苯基	环丁基
1060	3	2-OMe-苯基	环戊基
1061	3	2-OMe-苯基	环己基
1062	3	2-OMe-苯基	3-吡啶基
1063	3	2-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1064	3	2-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1065	3	2-OMe-苯基	2-呋喃基
1066	3	3-CN-苯基	乙基
1067	3	3-CN-苯基	正丙基
1068	3	3-CN-苯基	异丙基
1069	3	3-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1070	3	3-CN-苯基	CF_3
1071	3	3-CN-苯基	$-CH_2CF_3$

[3321]

1072	3	3-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1073	3	3-CN-苯基	环丙基
1074	3	3-CN-苯基	环丁基
1075	3	3-CN-苯基	环戊基
1076	3	3-CN-苯基	环己基
1077	3	3-CN-苯基	3-吡啶基
1078	3	3-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1079	3	3-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1080	3	3-CN-苯基	2-呋喃基
1081	3	2-F-苯基	乙基
1082	3	2-F-苯基	正丙基
1083	3	2-F-苯基	异丙基
1084	3	2-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1085	3	2-F-苯基	CF_3
1086	3	2-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1087	3	2-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1088	3	2-F-苯基	环丙基
1089	3	2-F-苯基	环丁基
1090	3	2-F-苯基	环戊基
1091	3	2-F-苯基	环己基
1092	3	2-F-苯基	3-吡啶基
1093	3	2-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1094	3	2-F-苯基	1H-咪唑-4-基
1095	3	2-F-苯基	2-呋喃基
1096	3	4-F-苯基	乙基
1097	3	4-F-苯基	正丙基
1098	3	4-F-苯基	异丙基

[3322]

1099	3	4-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1100	3	4-F-苯基	CF_3
1101	3	4-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1102	3	4-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1103	3	4-F-苯基	环丙基
1104	3	4-F-苯基	环丁基
1105	3	4-F-苯基	环戊基
1106	3	4-F-苯基	环己基
1107	3	4-F-苯基	3-吡啶基
1108	3	4-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1109	3	4-F-苯基	1H-咪唑-4-基
1110	3	4-F-苯基	2-呋喃基
1111	3	3-Cl-苯基	乙基
1112	3	3-Cl-苯基	正丙基
1113	3	3-Cl-苯基	异丙基
1114	3	3-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1115	3	3-Cl-苯基	CF_3
1116	3	3-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1117	3	3-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1118	3	3-Cl-苯基	环丙基
1119	3	3-Cl-苯基	环丁基
1120	3	3-Cl-苯基	环戊基
1121	3	3-Cl-苯基	环己基
1122	3	3-Cl-苯基	3-吡啶基
1123	3	3-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1124	3	3-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1125	3	3-Cl-苯基	2-呋喃基

[3323]

1126	3	2-Br-苯基	乙基
1127	3	2-Br-苯基	正丙基
1128	3	2-Br-苯基	异丙基
1129	3	2-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1130	3	2-Br-苯基	CF_3
1131	3	2-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1132	3	2-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1133	3	2-Br-苯基	环丙基
1134	3	2-Br-苯基	环丁基
1135	3	2-Br-苯基	环戊基
1136	3	2-Br-苯基	环己基
1137	3	2-Br-苯基	3-吡啶基
1138	3	2-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1139	3	2-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1140	3	2-Br-苯基	2-呋喃基
1141	3	4-Br-苯基	乙基
1142	3	4-Br-苯基	正丙基
1143	3	4-Br-苯基	异丙基
1144	3	4-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1145	3	4-Br-苯基	CF_3
1146	3	4-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1147	3	4-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1148	3	4-Br-苯基	环丙基
1149	3	4-Br-苯基	环丁基
1150	3	4-Br-苯基	环戊基
1151	3	4-Br-苯基	环己基
1152	3	4-Br-苯基	3-吡啶基

[3324]

1153	3	4-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1154	3	4-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1155	3	4-Br-苯基	2-呋喃基
1156	3	3-CF_3-苯基	乙基
1157	3	3-CF_3-苯基	正丙基
1158	3	3-CF_3-苯基	异丙基
1159	3	3-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1160	3	3-CF_3-苯基	CF_3
1161	3	3-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
1162	3	3-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1163	3	3-CF_3-苯基	环丙基
1164	3	3-CF_3-苯基	环丁基
1165	3	3-CF_3-苯基	环戊基
1166	3	3-CF_3-苯基	环己基
1167	3	3-CF_3-苯基	3-吡啶基
1168	3	3-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1169	3	3-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1170	3	3-CF_3-苯基	2-呋喃基
1171	3	2-iPr-苯基	乙基
1172	3	2-iPr-苯基	正丙基
1173	3	2-iPr-苯基	异丙基
1174	3	2-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1175	3	2-iPr-苯基	CF_3
1176	3	2-iPr-苯基	-CH_2CF_3
1177	3	2-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1178	3	2-iPr-苯基	环丙基
1179	3	2-iPr-苯基	环丁基

[3325]

1180	3	2-iPr-苯基	环戊基
1181	3	2-iPr-苯基	环己基
1182	3	2-iPr-苯基	3-吡啶基
1183	3	2-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1184	3	2-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1185	3	2-iPr-苯基	2-呋喃基
1186	3	4-iPr-苯基	乙基
1187	3	4-iPr-苯基	正丙基
1188	3	4-iPr-苯基	异丙基
1189	3	4-iPr-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1190	3	4-iPr-苯基	CF_3
1191	3	4-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
1192	3	4-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1193	3	4-iPr-苯基	环丙基
1194	3	4-iPr-苯基	环丁基
1195	3	4-iPr-苯基	环戊基
1196	3	4-iPr-苯基	环己基
1197	3	4-iPr-苯基	3-吡啶基
1198	3	4-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1199	3	4-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1200	3	4-iPr-苯基	2-呋喃基
1201	3	3-吗啉代-苯基	乙基
1202	3	3-吗啉代-苯基	正丙基
1203	3	3-吗啉代-苯基	异丙基
1204	3	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1205	3	3-吗啉代-苯基	CF_3
1206	3	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$

[3326]

1207	3	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1208	3	3-吗啉代-苯基	环丙基
1209	3	3-吗啉代-苯基	环丁基
1210	3	3-吗啉代-苯基	环戊基
1211	3	3-吗啉代-苯基	环己基
1212	3	3-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1213	3	3-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1214	3	3-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1215	3	3-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1216	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	乙基
1217	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	正丙基
1218	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	异丙基
1219	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1220	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	CF_3
1221	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1222	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1223	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丙基
1224	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丁基
1225	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环戊基
1226	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环己基
1227	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1228	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1229	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1230	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1231	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	乙基
1232	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	正丙基
1233	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	异丙基

[3327]

1234	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1235	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	CF_3
1236	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1237	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1238	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丙基
1239	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丁基
1240	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环戊基
1241	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环己基
1242	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1243	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1244	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1245	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1246	3	2-CH_3-苯基	乙基
1247	3	2-CH_3-苯基	正丙基
1248	3	2-CH_3-苯基	异丙基
1249	3	2-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1250	3	2-CH_3-苯基	CF_3
1251	3	2-CH_3-苯基	$-CH_2CF_3$
1252	3	2-CH_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1253	3	2-CH_3-苯基	环丙基
1254	3	2-CH_3-苯基	环丁基
1255	3	2-CH_3-苯基	环戊基
1256	3	2-CH_3-苯基	环己基
1257	3	2-CH_3-苯基	3-吡啶基
1258	3	2-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1259	3	2-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1260	3	2-CH_3-苯基	2-呋喃基

[3328]

1261	3	4-OH-苯基	乙基
1262	3	4-OH-苯基	正丙基
1263	3	4-OH-苯基	异丙基
1264	3	4-OH-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1265	3	4-OH-苯基	CF_3
1266	3	4-OH-苯基	$-CH_2CF_3$
1267	3	4-OH-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1268	3	4-OH-苯基	环丙基
1269	3	4-OH-苯基	环丁基
1270	3	4-OH-苯基	环戊基
1271	3	4-OH-苯基	环己基
1272	3	4-OH-苯基	3-吡啶基
1273	3	4-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1274	3	4-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1275	3	4-OH-苯基	2-呋喃基
1276	3	2-OH-苯基	乙基
1277	3	2-OH-苯基	正丙基
1278	3	2-OH-苯基	异丙基
1279	3	2-OH-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1280	3	2-OH-苯基	CF_3
1281	3	2-OH-苯基	$-CH_2CF_3$
1282	3	2-OH-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1283	3	2-OH-苯基	环丙基
1284	3	2-OH-苯基	环丁基
1285	3	2-OH-苯基	环戊基
1286	3	2-OH-苯基	环己基
1287	3	2-OH-苯基	3-吡啶基

[3329]

1288	3	2-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1289	3	2-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1290	3	2-OH-苯基	2-呋喃基
1291	3	3-OMe-苯基	乙基
1292	3	3-OMe-苯基	正丙基
1293	3	3-OMe-苯基	异丙基
1294	3	3-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1295	3	3-OMe-苯基	CF_3
1296	3	3-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1297	3	3-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1298	3	3-OMe-苯基	环丙基
1299	3	3-OMe-苯基	环丁基
1300	3	3-OMe-苯基	环戊基
1301	3	3-OMe-苯基	环己基
1302	3	3-OMe-苯基	3-吡啶基
1303	3	3-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1304	3	3-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1305	3	3-OMe-苯基	2-呋喃基
1306	3	4-CN-苯基	乙基
1307	3	4-CN-苯基	正丙基
1308	3	4-CN-苯基	异丙基
1309	3	4-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1310	3	4-CN-苯基	CF_3
1311	3	4-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1312	3	4-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1313	3	4-CN-苯基	环丙基
1314	3	4-CN-苯基	环丁基

[3330]

1315	3	4-CN-苯基	环戊基
1316	3	4-CN-苯基	环己基
1317	3	4-CN-苯基	3-吡啶基
1318	3	4-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1319	3	4-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1320	3	4-CN-苯基	2-呋喃基
1321	3	2-CN-苯基	乙基
1322	3	2-CN-苯基	正丙基
1323	3	2-CN-苯基	异丙基
1324	3	2-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1325	3	2-CN-苯基	CF_3
1326	3	2-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1327	3	2-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1328	3	2-CN-苯基	环丙基
1329	3	2-CN-苯基	环丁基
1330	3	2-CN-苯基	环戊基
1331	3	2-CN-苯基	环己基
1332	3	2-CN-苯基	3-吡啶基
1333	3	2-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1334	3	2-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1335	3	2-CN-苯基	2-呋喃基
1336	3	3-F-苯基	乙基
1337	3	3-F-苯基	正丙基
1338	3	3-F-苯基	异丙基
1339	3	3-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1340	3	3-F-苯基	CF_3
1341	3	3-F-苯基	$-CH_2CF_3$

[3331]

1342	3	3-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1343	3	3-F-苯基	环丙基
1344	3	3-F-苯基	环丁基
1345	3	3-F-苯基	环戊基
1346	3	3-F-苯基	环己基
1347	3	3-F-苯基	3-吡啶基
1348	3	3-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1349	3	3-F-苯基	1H-咪唑-4-基
1350	3	3-F-苯基	2-呋喃基
1351	3	2-Cl-苯基	乙基
1352	3	2-Cl-苯基	正丙基
1353	3	2-Cl-苯基	异丙基
1354	3	2-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1355	3	2-Cl-苯基	CF_3
1356	3	2-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1357	3	2-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1358	3	2-Cl-苯基	环丙基
1359	3	2-Cl-苯基	环丁基
1360	3	2-Cl-苯基	环戊基
1361	3	2-Cl-苯基	环己基
1362	3	2-Cl-苯基	3-吡啶基
1363	3	2-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1364	3	2-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1365	3	2-Cl-苯基	2-呋喃基
1366	3	4-Cl-苯基	乙基
1367	3	4-Cl-苯基	正丙基
1368	3	4-Cl-苯基	异丙基

[3332]

1369	3	4-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1370	3	4-Cl-苯基	CF_3
1371	3	4-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1372	3	4-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1373	3	4-Cl-苯基	环丙基
1374	3	4-Cl-苯基	环丁基
1375	3	4-Cl-苯基	环戊基
1376	3	4-Cl-苯基	环己基
1377	3	4-Cl-苯基	3-吡啶基
1378	3	4-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1379	3	4-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1380	3	4-Cl-苯基	2-呋喃基
1381	3	3-Br-苯基	乙基
1382	3	3-Br-苯基	正丙基
1383	3	3-Br-苯基	异丙基
1384	3	3-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1385	3	3-Br-苯基	CF_3
1386	3	3-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1387	3	3-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1388	3	3-Br-苯基	环丙基
1389	3	3-Br-苯基	环丁基
1390	3	3-Br-苯基	环戊基
1391	3	3-Br-苯基	环己基
1392	3	3-Br-苯基	3-吡啶基
1393	3	3-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1394	3	3-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1395	3	3-Br-苯基	2-呋喃基

[3333]

1396	3	2-CF_3-苯基	乙基
1397	3	2-CF_3-苯基	正丙基
1398	3	2-CF_3-苯基	异丙基
1399	3	2-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1400	3	2-CF_3-苯基	CF_3
1401	3	2-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
1402	3	2-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1403	3	2-CF_3-苯基	环丙基
1404	3	2-CF_3-苯基	环丁基
1405	3	2-CF_3-苯基	环戊基
1406	3	2-CF_3-苯基	环己基
1407	3	2-CF_3-苯基	3-吡啶基
1408	3	2-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1409	3	2-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1410	3	2-CF_3-苯基	2-呋喃基
1411	3	4-CF_3-苯基	乙基
1412	3	4-CF_3-苯基	正丙基
1413	3	4-CF_3-苯基	异丙基
1414	3	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1415	3	4-CF_3-苯基	CF_3
1416	3	4-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
1417	3	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1418	3	4-CF_3-苯基	环丙基
1419	3	4-CF_3-苯基	环丁基
1420	3	4-CF_3-苯基	环戊基
1421	3	4-CF_3-苯基	环己基
1422	3	4-CF_3-苯基	3-吡啶基

[3334]

1423	3	4-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1424	3	4-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1425	3	4-CF_3-苯基	2-呋喃基
1426	3	3-iPr-苯基	乙基
1427	3	3-iPr-苯基	正丙基
1428	3	3-iPr-苯基	异丙基
1429	3	3-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1430	3	3-iPr-苯基	CF_3
1431	3	3-iPr-苯基	-CH_2CF_3
1432	3	3-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1433	3	3-iPr-苯基	环丙基
1434	3	3-iPr-苯基	环丁基
1435	3	3-iPr-苯基	环戊基
1436	3	3-iPr-苯基	环己基
1437	3	3-iPr-苯基	3-吡啶基
1438	3	3-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1439	3	3-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1440	3	3-iPr-苯基	2-呋喃基
1441	3	2-吗啉代-苯基	乙基
1442	3	2-吗啉代-苯基	正丙基
1443	3	2-吗啉代-苯基	异丙基
1444	3	2-吗啉代-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1445	3	2-吗啉代-苯基	CF_3
1446	3	2-吗啉代-苯基	-CH_2CF_3
1447	3	2-吗啉代-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1448	3	2-吗啉代-苯基	环丙基
1449	3	2-吗啉代-苯基	环丁基

[3335]

1450	3	2-吗啉代-苯基	环戊基
1451	3	2-吗啉代-苯基	环己基
1452	3	2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1453	3	2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1454	3	2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1455	3	2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1456	3	4-吗啉代-苯基	乙基
1457	3	4-吗啉代-苯基	正丙基
1458	3	4-吗啉代-苯基	异丙基
1459	3	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1460	3	4-吗啉代-苯基	CF_3
1461	3	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1462	3	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1463	3	4-吗啉代-苯基	环丙基
1464	3	4-吗啉代-苯基	环丁基
1465	3	4-吗啉代-苯基	环戊基
1466	3	4-吗啉代-苯基	环己基
1467	3	4-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1468	3	4-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1469	3	4-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1470	3	4-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1471	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	乙基
1472	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	正丙基
1473	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	异丙基
1474	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1475	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	CF_3
1476	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$

1477	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1478	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丙基
1479	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丁基
1480	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环戊基
1481	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环己基
1482	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1483	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1484	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1485	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1486	4	4-CH_3-苯基	乙基
1487	4	4-CH_3-苯基	正丙基
1488	4	4-CH_3-苯基	异丙基
1489	4	4-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1490	4	4-CH_3-苯基	CF_3
1491	4	4-CH_3-苯基	$-CH_2CF_3$
1492	4	4-CH_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1493	4	4-CH_3-苯基	环丙基
1494	4	4-CH_3-苯基	环丁基
1495	4	4-CH_3-苯基	环戊基
1496	4	4-CH_3-苯基	环己基
1497	4	4-CH_3-苯基	3-吡啶基
1498	4	4-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1499	4	4-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1500	4	4-CH_3-苯基	2-呋喃基
1501	4	3-CH_3-苯基	乙基
1502	4	3-CH_3-苯基	正丙基
1503	4	3-CH_3-苯基	异丙基

[3336]

[3337]

1504	4	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1505	4	3-CH_3-苯基	CF_3
1506	4	3-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
1507	4	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1508	4	3-CH_3-苯基	环丙基
1509	4	3-CH_3-苯基	环丁基
1510	4	3-CH_3-苯基	环戊基
1511	4	3-CH_3-苯基	环己基
1512	4	3-CH_3-苯基	3-吡啶基
1513	4	3-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1514	4	3-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1515	4	3-CH_3-苯基	2-呋喃基
1516	4	3-OH-苯基	乙基
1517	4	3-OH-苯基	正丙基
1518	4	3-OH-苯基	异丙基
1519	4	3-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1520	4	3-OH-苯基	CF_3
1521	4	3-OH-苯基	-CH_2CF_3
1522	4	3-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1523	4	3-OH-苯基	环丙基
1524	4	3-OH-苯基	环丁基
1525	4	3-OH-苯基	环戊基
1526	4	3-OH-苯基	环己基
1527	4	3-OH-苯基	3-吡啶基
1528	4	3-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1529	4	3-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1530	4	3-OH-苯基	2-呋喃基

[3338]

1531	4	4-OMe-苯基	乙基
1532	4	4-OMe-苯基	正丙基
1533	4	4-OMe-苯基	异丙基
1534	4	4-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1535	4	4-OMe-苯基	CF_3
1536	4	4-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1537	4	4-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1538	4	4-OMe-苯基	环丙基
1539	4	4-OMe-苯基	环丁基
1540	4	4-OMe-苯基	环戊基
1541	4	4-OMe-苯基	环己基
1542	4	4-OMe-苯基	3-吡啶基
1543	4	4-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1544	4	4-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1545	4	4-OMe-苯基	2-呋喃基
1546	4	2-OMe-苯基	乙基
1547	4	2-OMe-苯基	正丙基
1548	4	2-OMe-苯基	异丙基
1549	4	2-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1550	4	2-OMe-苯基	CF_3
1551	4	2-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1552	4	2-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1553	4	2-OMe-苯基	环丙基
1554	4	2-OMe-苯基	环丁基
1555	4	2-OMe-苯基	环戊基
1556	4	2-OMe-苯基	环己基
1557	4	2-OMe-苯基	3-吡啶基

[3339]

1558	4	2-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1559	4	2-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1560	4	2-OMe-苯基	2-呋喃基
1561	4	3-CN-苯基	乙基
1562	4	3-CN-苯基	正丙基
1563	4	3-CN-苯基	异丙基
1564	4	3-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1565	4	3-CN-苯基	CF_3
1566	4	3-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1567	4	3-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1568	4	3-CN-苯基	环丙基
1569	4	3-CN-苯基	环丁基
1570	4	3-CN-苯基	环戊基
1571	4	3-CN-苯基	环己基
1572	4	3-CN-苯基	3-吡啶基
1573	4	3-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1574	4	3-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1575	4	3-CN-苯基	2-呋喃基
1576	4	2-F-苯基	乙基
1577	4	2-F-苯基	正丙基
1578	4	2-F-苯基	异丙基
1579	4	2-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1580	4	2-F-苯基	CF_3
1581	4	2-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1582	4	2-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1583	4	2-F-苯基	环丙基
1584	4	2-F-苯基	环丁基

[3340]

1585	4	2-F-苯基	环戊基
1586	4	2-F-苯基	环己基
1587	4	2-F-苯基	3-吡啶基
1588	4	2-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1589	4	2-F-苯基	1H-咪唑-4-基
1590	4	2-F-苯基	2-呋喃基
1591	4	4-F-苯基	乙基
1592	4	4-F-苯基	正丙基
1593	4	4-F-苯基	异丙基
1594	4	4-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1595	4	4-F-苯基	CF_3
1596	4	4-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1597	4	4-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1598	4	4-F-苯基	环丙基
1599	4	4-F-苯基	环丁基
1600	4	4-F-苯基	环戊基
1601	4	4-F-苯基	环己基
1602	4	4-F-苯基	3-吡啶基
1603	4	4-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1604	4	4-F-苯基	1H-咪唑-4-基
1605	4	4-F-苯基	2-呋喃基
1606	4	3-Cl-苯基	乙基
1607	4	3-Cl-苯基	正丙基
1608	4	3-Cl-苯基	异丙基
1609	4	3-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1610	4	3-Cl-苯基	CF_3
1611	4	3-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$

[3341]

1612	4	3-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1613	4	3-Cl-苯基	环丙基
1614	4	3-Cl-苯基	环丁基
1615	4	3-Cl-苯基	环戊基
1616	4	3-Cl-苯基	环己基
1617	4	3-Cl-苯基	3-吡啶基
1618	4	3-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1619	4	3-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1620	4	3-Cl-苯基	2-呋喃基
1621	4	2-Br-苯基	乙基
1622	4	2-Br-苯基	正丙基
1623	4	2-Br-苯基	异丙基
1624	4	2-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1625	4	2-Br-苯基	CF_3
1626	4	2-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1627	4	2-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1628	4	2-Br-苯基	环丙基
1629	4	2-Br-苯基	环丁基
1630	4	2-Br-苯基	环戊基
1631	4	2-Br-苯基	环己基
1632	4	2-Br-苯基	3-吡啶基
1633	4	2-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1634	4	2-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1635	4	2-Br-苯基	2-呋喃基
1636	4	4-Br-苯基	乙基
1637	4	4-Br-苯基	正丙基
1638	4	4-Br-苯基	异丙基

[3342]

1639	4	4-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1640	4	4-Br-苯基	CF_3
1641	4	4-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1642	4	4-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1643	4	4-Br-苯基	环丙基
1644	4	4-Br-苯基	环丁基
1645	4	4-Br-苯基	环戊基
1646	4	4-Br-苯基	环己基
1647	4	4-Br-苯基	3-吡啶基
1648	4	4-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1649	4	4-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1650	4	4-Br-苯基	2-呋喃基
1651	4	3-CF_3-苯基	乙基
1652	4	3-CF_3-苯基	正丙基
1653	4	3-CF_3-苯基	异丙基
1654	4	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1655	4	3-CF_3-苯基	CF_3
1656	4	3-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
1657	4	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1658	4	3-CF_3-苯基	环丙基
1659	4	3-CF_3-苯基	环丁基
1660	4	3-CF_3-苯基	环戊基
1661	4	3-CF_3-苯基	环己基
1662	4	3-CF_3-苯基	3-吡啶基
1663	4	3-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1664	4	3-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1665	4	3-CF_3-苯基	2-呋喃基

[3343]

1666	4	2-iPr-苯基	乙基
1667	4	2-iPr-苯基	正丙基
1668	4	2-iPr-苯基	异丙基
1669	4	2-iPr-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1670	4	2-iPr-苯基	CF_3
1671	4	2-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
1672	4	2-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1673	4	2-iPr-苯基	环丙基
1674	4	2-iPr-苯基	环丁基
1675	4	2-iPr-苯基	环戊基
1676	4	2-iPr-苯基	环己基
1677	4	2-iPr-苯基	3-吡啶基
1678	4	2-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1679	4	2-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1680	4	2-iPr-苯基	2-呋喃基
1681	4	4-iPr-苯基	乙基
1682	4	4-iPr-苯基	正丙基
1683	4	4-iPr-苯基	异丙基
1684	4	4-iPr-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1685	4	4-iPr-苯基	CF_3
1686	4	4-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
1687	4	4-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1688	4	4-iPr-苯基	环丙基
1689	4	4-iPr-苯基	环丁基
1690	4	4-iPr-苯基	环戊基
1691	4	4-iPr-苯基	环己基
1692	4	4-iPr-苯基	3-吡啶基

[3344]

1693	4	4-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1694	4	4-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1695	4	4-iPr-苯基	2-呋喃基
1696	4	3-吗啉代-苯基	乙基
1697	4	3-吗啉代-苯基	正丙基
1698	4	3-吗啉代-苯基	异丙基
1699	4	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1700	4	3-吗啉代-苯基	CF_3
1701	4	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1702	4	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1703	4	3-吗啉代-苯基	环丙基
1704	4	3-吗啉代-苯基	环丁基
1705	4	3-吗啉代-苯基	环戊基
1706	4	3-吗啉代-苯基	环己基
1707	4	3-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1708	4	3-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1709	4	3-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1710	4	3-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1711	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	乙基
1712	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	正丙基
1713	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	异丙基
1714	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1715	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	CF_3
1716	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1717	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1718	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丙基
1719	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丁基

[3345]

1720	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环戊基
1721	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环己基
1722	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1723	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1724	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1725	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1726	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	乙基
1727	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	正丙基
1728	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	异丙基
1729	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1730	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	CF_3
1731	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1732	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1733	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丙基
1734	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丁基
1735	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环戊基
1736	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环己基
1737	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1738	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1739	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1740	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1741	4	$2-CH_3$-苯基	乙基
1742	4	$2-CH_3$-苯基	正丙基
1743	4	$2-CH_3$-苯基	异丙基
1744	4	$2-CH_3$-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1745	4	$2-CH_3$-苯基	CF_3
1746	4	$2-CH_3$-苯基	$-CH_2CF_3$

[3346]

1747	4	2-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1748	4	2-CH_3-苯基	环丙基
1749	4	2-CH_3-苯基	环丁基
1750	4	2-CH_3-苯基	环戊基
1751	4	2-CH_3-苯基	环己基
1752	4	2-CH_3-苯基	3-吡啶基
1753	4	2-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1754	4	2-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1755	4	2-CH_3-苯基	2-呋喃基
1756	4	4-OH-苯基	乙基
1757	4	4-OH-苯基	正丙基
1758	4	4-OH-苯基	异丙基
1759	4	4-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1760	4	4-OH-苯基	CF_3
1761	4	4-OH-苯基	-CH_2CF_3
1762	4	4-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1763	4	4-OH-苯基	环丙基
1764	4	4-OH-苯基	环丁基
1765	4	4-OH-苯基	环戊基
1766	4	4-OH-苯基	环己基
1767	4	4-OH-苯基	3-吡啶基
1768	4	4-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1769	4	4-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1770	4	4-OH-苯基	2-呋喃基
1771	4	2-OH-苯基	乙基
1772	4	2-OH-苯基	正丙基
1773	4	2-OH-苯基	异丙基

[3347]

1774	4	2-OH-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1775	4	2-OH-苯基	CF_3
1776	4	2-OH-苯基	$-CH_2CF_3$
1777	4	2-OH-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1778	4	2-OH-苯基	环丙基
1779	4	2-OH-苯基	环丁基
1780	4	2-OH-苯基	环戊基
1781	4	2-OH-苯基	环己基
1782	4	2-OH-苯基	3-吡啶基
1783	4	2-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1784	4	2-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1785	4	2-OH-苯基	2-呋喃基
1786	4	3-OMe-苯基	乙基
1787	4	3-OMe-苯基	正丙基
1788	4	3-OMe-苯基	异丙基
1789	4	3-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1790	4	3-OMe-苯基	CF_3
1791	4	3-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1792	4	3-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1793	4	3-OMe-苯基	环丙基
1794	4	3-OMe-苯基	环丁基
1795	4	3-OMe-苯基	环戊基
1796	4	3-OMe-苯基	环己基
1797	4	3-OMe-苯基	3-吡啶基
1798	4	3-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1799	4	3-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1800	4	3-OMe-苯基	2-呋喃基

[3348]

1801	4	4-CN-苯基	乙基
1802	4	4-CN-苯基	正丙基
1803	4	4-CN-苯基	异丙基
1804	4	4-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1805	4	4-CN-苯基	CF_3
1806	4	4-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1807	4	4-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1808	4	4-CN-苯基	环丙基
1809	4	4-CN-苯基	环丁基
1810	4	4-CN-苯基	环戊基
1811	4	4-CN-苯基	环己基
1812	4	4-CN-苯基	3-吡啶基
1813	4	4-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1814	4	4-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1815	4	4-CN-苯基	2-呋喃基
1816	4	2-CN-苯基	乙基
1817	4	2-CN-苯基	正丙基
1818	4	2-CN-苯基	异丙基
1819	4	2-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1820	4	2-CN-苯基	CF_3
1821	4	2-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1822	4	2-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1823	4	2-CN-苯基	环丙基
1824	4	2-CN-苯基	环丁基
1825	4	2-CN-苯基	环戊基
1826	4	2-CN-苯基	环己基
1827	4	2-CN-苯基	3-吡啶基

[3349]

1828	4	2-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1829	4	2-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1830	4	2-CN-苯基	2-呋喃基
1831	4	3-F-苯基	乙基
1832	4	3-F-苯基	正丙基
1833	4	3-F-苯基	异丙基
1834	4	3-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1835	4	3-F-苯基	CF_3
1836	4	3-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1837	4	3-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1838	4	3-F-苯基	环丙基
1839	4	3-F-苯基	环丁基
1840	4	3-F-苯基	环戊基
1841	4	3-F-苯基	环己基
1842	4	3-F-苯基	3-吡啶基
1843	4	3-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1844	4	3-F-苯基	1H-咪唑-4-基
1845	4	3-F-苯基	2-呋喃基
1846	4	2-Cl-苯基	乙基
1847	4	2-Cl-苯基	正丙基
1848	4	2-Cl-苯基	异丙基
1849	4	2-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1850	4	2-Cl-苯基	CF_3
1851	4	2-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1852	4	2-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1853	4	2-Cl-苯基	环丙基
1854	4	2-Cl-苯基	环丁基

[3350]

1855	4	2-Cl-苯基	环戊基
1856	4	2-Cl-苯基	环己基
1857	4	2-Cl-苯基	3-吡啶基
1858	4	2-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1859	4	2-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1860	4	2-Cl-苯基	2-呋喃基
1861	4	4-Cl-苯基	乙基
1862	4	4-Cl-苯基	正丙基
1863	4	4-Cl-苯基	异丙基
1864	4	4-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1865	4	4-Cl-苯基	CF_3
1866	4	4-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1867	4	4-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1868	4	4-Cl-苯基	环丙基
1869	4	4-Cl-苯基	环丁基
1870	4	4-Cl-苯基	环戊基
1871	4	4-Cl-苯基	环己基
1872	4	4-Cl-苯基	3-吡啶基
1873	4	4-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1874	4	4-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1875	4	4-Cl-苯基	2-呋喃基
1876	4	3-Br-苯基	乙基
1877	4	3-Br-苯基	正丙基
1878	4	3-Br-苯基	异丙基
1879	4	3-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1880	4	3-Br-苯基	CF_3
1881	4	3-Br-苯基	$-CH_2CF_3$

[3351]

1882	4	3-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1883	4	3-Br-苯基	环丙基
1884	4	3-Br-苯基	环丁基
1885	4	3-Br-苯基	环戊基
1886	4	3-Br-苯基	环己基
1887	4	3-Br-苯基	3-吡啶基
1888	4	3-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1889	4	3-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1890	4	3-Br-苯基	2-呋喃基
1891	4	2-CF_3-苯基	乙基
1892	4	2-CF_3-苯基	正丙基
1893	4	2-CF_3-苯基	异丙基
1894	4	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1895	4	2-CF_3-苯基	CF_3
1896	4	2-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
1897	4	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1898	4	2-CF_3-苯基	环丙基
1899	4	2-CF_3-苯基	环丁基
1900	4	2-CF_3-苯基	环戊基
1901	4	2-CF_3-苯基	环己基
1902	4	2-CF_3-苯基	3-吡啶基
1903	4	2-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1904	4	2-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1905	4	2-CF_3-苯基	2-呋喃基
1906	4	4-CF_3-苯基	乙基
1907	4	4-CF_3-苯基	正丙基
1908	4	4-CF_3-苯基	异丙基

[3352]

1909	4	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1910	4	4-CF_3-苯基	CF_3
1911	4	4-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
1912	4	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1913	4	4-CF_3-苯基	环丙基
1914	4	4-CF_3-苯基	环丁基
1915	4	4-CF_3-苯基	环戊基
1916	4	4-CF_3-苯基	环己基
1917	4	4-CF_3-苯基	3-吡啶基
1918	4	4-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1919	4	4-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1920	4	4-CF_3-苯基	2-呋喃基
1921	4	3-iPr-苯基	乙基
1922	4	3-iPr-苯基	正丙基
1923	4	3-iPr-苯基	异丙基
1924	4	3-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1925	4	3-iPr-苯基	CF_3
1926	4	3-iPr-苯基	-CH_2CF_3
1927	4	3-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1928	4	3-iPr-苯基	环丙基
1929	4	3-iPr-苯基	环丁基
1930	4	3-iPr-苯基	环戊基
1931	4	3-iPr-苯基	环己基
1932	4	3-iPr-苯基	3-吡啶基
1933	4	3-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1934	4	3-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1935	4	3-iPr-苯基	2-呋喃基

[3353]

1936	4	2-吗啉代-苯基	乙基
1937	4	2-吗啉代-苯基	正丙基
1938	4	2-吗啉代-苯基	异丙基
1939	4	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1940	4	2-吗啉代-苯基	CF_3
1941	4	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1942	4	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1943	4	2-吗啉代-苯基	环丙基
1944	4	2-吗啉代-苯基	环丁基
1945	4	2-吗啉代-苯基	环戊基
1946	4	2-吗啉代-苯基	环己基
1947	4	2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1948	4	2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1949	4	2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1950	4	2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1951	4	4-吗啉代-苯基	乙基
1952	4	4-吗啉代-苯基	正丙基
1953	4	4-吗啉代-苯基	异丙基
1954	4	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1955	4	4-吗啉代-苯基	CF_3
1956	4	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1957	4	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1958	4	4-吗啉代-苯基	环丙基
1959	4	4-吗啉代-苯基	环丁基
1960	4	4-吗啉代-苯基	环戊基
1961	4	4-吗啉代-苯基	环己基
1962	4	4-吗啉代-苯基	3-吡啶基

[3354]

1963	4	4-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1964	4	4-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1965	4	4-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1966	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	乙基
1967	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	正丙基
1968	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	异丙基
1969	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1970	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	CF_3
1971	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1972	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1973	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丙基
1974	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丁基
1975	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环戊基
1976	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环己基
1977	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1978	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1979	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1980	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1981	1	亚萘-1-基	乙基
1982	1	亚萘-1-基	正丙基
1983	1	亚萘-1-基	异丙基
1984	1	亚萘-1-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1985	1	亚萘-1-基	CF_3
1986	1	亚萘-1-基	$-CH_2CF_3$
1987	1	亚萘-1-基	$-CH_2CH_2CF_3$
1988	1	亚萘-1-基	环丙基
1989	1	亚萘-1-基	环丁基

[3355]

1990	1	亚萘-1-基	环戊基
1991	1	亚萘-1-基	环己基
1992	1	亚萘-1-基	3-吡啶基
1993	1	亚萘-1-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1994	1	亚萘-1-基	1H-咪唑-4-基
1995	1	亚萘-1-基	2-呋喃基
1996	1	亚萘-2-基	乙基
1997	1	亚萘-2-基	正丙基
1998	1	亚萘-2-基	异丙基
1999	1	亚萘-2-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
2000	1	亚萘-2-基	CF_3
2001	1	亚萘-2-基	$-CH_2CF_3$
2002	1	亚萘-2-基	$-CH_2CH_2CF_3$
2003	1	亚萘-2-基	环丙基
2004	1	亚萘-2-基	环丁基
2005	1	亚萘-2-基	环戊基
2006	1	亚萘-2-基	环己基
2007	1	亚萘-2-基	3-吡啶基
2008	1	亚萘-2-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
2009	1	亚萘-2-基	1H-咪唑-4-基
2010	1	亚萘-2-基	2-呋喃基
2011	2	亚萘-1-基	乙基
2012	2	亚萘-1-基	正丙基
2013	2	亚萘-1-基	异丙基
2014	2	亚萘-1-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
2015	2	亚萘-1-基	CF_3
2016	2	亚萘-1-基	$-CH_2CF_3$

[3356]

2017	2	亚萘-1-基	$-CH_2CH_2CF_3$
2018	2	亚萘-1-基	环丙基
2019	2	亚萘-1-基	环丁基
2020	2	亚萘-1-基	环戊基
2021	2	亚萘-1-基	环己基
2022	2	亚萘-1-基	3-吡啶基
2023	2	亚萘-1-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
2024	2	亚萘-1-基	1H-咪唑-4-基
2025	2	亚萘-1-基	2-呋喃基
2026	2	亚萘-2-基	乙基
2027	2	亚萘-2-基	正丙基
2028	2	亚萘-2-基	异丙基
2029	2	亚萘-2-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
2030	2	亚萘-2-基	CF_3
2031	2	亚萘-2-基	$-CH_2CF_3$
2032	2	亚萘-2-基	$-CH_2CH_2CF_3$
2033	2	亚萘-2-基	环丙基
2034	2	亚萘-2-基	环丁基
2035	2	亚萘-2-基	环戊基
2036	2	亚萘-2-基	环己基
2037	2	亚萘-2-基	3-吡啶基
2038	2	亚萘-2-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
2039	2	亚萘-2-基	1H-咪唑-4-基
2040	2	亚萘-2-基	2-呋喃基
2041	3	亚萘-1-基	乙基
2042	3	亚萘-1-基	正丙基
2043	3	亚萘-1-基	异丙基

[3357]

2044	3	亚萘-1-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
2045	3	亚萘-1-基	CF_3
2046	3	亚萘-1-基	$-CH_2CF_3$
2047	3	亚萘-1-基	$-CH_2CH_2CF_3$
2048	3	亚萘-1-基	环丙基
2049	3	亚萘-1-基	环丁基
2050	3	亚萘-1-基	环戊基
2051	3	亚萘-1-基	环己基
2052	3	亚萘-1-基	3-吡啶基
2053	3	亚萘-1-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
2054	3	亚萘-1-基	1H-咪唑-4-基
2055	3	亚萘-1-基	2-呋喃基
2056	3	亚萘-2-基	乙基
2057	3	亚萘-2-基	正丙基
2058	3	亚萘-2-基	异丙基
2059	3	亚萘-2-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
2060	3	亚萘-2-基	CF_3
2061	3	亚萘-2-基	$-CH_2CF_3$
2062	3	亚萘-2-基	$-CH_2CH_2CF_3$
2063	3	亚萘-2-基	环丙基
2064	3	亚萘-2-基	环丁基
2065	3	亚萘-2-基	环戊基
2066	3	亚萘-2-基	环己基
2067	3	亚萘-2-基	3-吡啶基
2068	3	亚萘-2-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
2069	3	亚萘-2-基	1H-咪唑-4-基
2070	3	亚萘-2-基	2-呋喃基

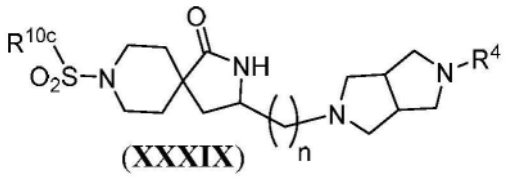
[3358]

2071	4	亚萘-1-基	乙基
2072	4	亚萘-1-基	正丙基
2073	4	亚萘-1-基	异丙基
2074	4	亚萘-1-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
2075	4	亚萘-1-基	CF_3
2076	4	亚萘-1-基	$-CH_2CF_3$
2077	4	亚萘-1-基	$-CH_2CH_2CF_3$
2078	4	亚萘-1-基	环丙基
2079	4	亚萘-1-基	环丁基
2080	4	亚萘-1-基	环戊基
2081	4	亚萘-1-基	环己基
2082	4	亚萘-1-基	3-吡啶基
2083	4	亚萘-1-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
2084	4	亚萘-1-基	1H-咪唑-4-基
2085	4	亚萘-1-基	2-呋喃基
2086	4	亚萘-2-基	乙基
2087	4	亚萘-2-基	正丙基
2088	4	亚萘-2-基	异丙基
2089	4	亚萘-2-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
2090	4	亚萘-2-基	CF_3
2091	4	亚萘-2-基	$-CH_2CF_3$
2092	4	亚萘-2-基	$-CH_2CH_2CF_3$
2093	4	亚萘-2-基	环丙基
2094	4	亚萘-2-基	环丁基
2095	4	亚萘-2-基	环戊基
2096	4	亚萘-2-基	环己基
2097	4	亚萘-2-基	3-吡啶基

[3359]

2098	4	亚萘-2-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
2099	4	亚萘-2-基	1H-咪唑-4-基
2100	4	亚萘-2-基	2-呋喃基

[3360] 示例性实施方案包括具有式(XXXIX)的化合物

[3361] 

(XXXIX)

[3362] 或其可药用盐形式,如在下文表32中所定义。

[3363] 表32:

[3364]

条目	n	R^4	R^{10c}
1	1	4-CH_3-苯基	乙基
2	1	4-CH_3-苯基	正丙基
3	1	4-CH_3-苯基	异丙基
4	1	4-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
5	1	4-CH_3-苯基	CF_3
6	1	4-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
7	1	4-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
8	1	4-CH_3-苯基	环丙基
9	1	4-CH_3-苯基	环丁基
10	1	4-CH_3-苯基	环戊基
11	1	4-CH_3-苯基	环己基
12	1	4-CH_3-苯基	3-吡啶基
13	1	4-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
14	1	4-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
15	1	4-CH_3-苯基	2-呋喃基
16	1	3-CH_3-苯基	乙基
17	1	3-CH_3-苯基	正丙基
18	1	3-CH_3-苯基	异丙基
19	1	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
20	1	3-CH_3-苯基	CF_3
21	1	3-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
22	1	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
23	1	3-CH_3-苯基	环丙基
24	1	3-CH_3-苯基	环丁基
25	1	3-CH_3-苯基	环戊基
26	1	3-CH_3-苯基	环己基
27	1	3-CH_3-苯基	3-吡啶基

[3365]

28	1	3-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
29	1	3-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
30	1	3-CH_3-苯基	2-呋喃基
31	1	3-OH-苯基	乙基
32	1	3-OH-苯基	正丙基
33	1	3-OH-苯基	异丙基
34	1	3-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
35	1	3-OH-苯基	CF_3
36	1	3-OH-苯基	-CH_2CF_3
37	1	3-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
38	1	3-OH-苯基	环丙基
39	1	3-OH-苯基	环丁基
40	1	3-OH-苯基	环戊基
41	1	3-OH-苯基	环己基
42	1	3-OH-苯基	3-吡啶基
43	1	3-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
44	1	3-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
45	1	3-OH-苯基	2-呋喃基
46	1	4-OMe-苯基	乙基
47	1	4-OMe-苯基	正丙基
48	1	4-OMe-苯基	异丙基
49	1	4-OMe-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
50	1	4-OMe-苯基	CF_3
51	1	4-OMe-苯基	-CH_2CF_3
52	1	4-OMe-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
53	1	4-OMe-苯基	环丙基
54	1	4-OMe-苯基	环丁基
55	1	4-OMe-苯基	环戊基
56	1	4-OMe-苯基	环己基
57	1	4-OMe-苯基	3-吡啶基
58	1	4-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
59	1	4-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
60	1	4-OMe-苯基	2-呋喃基
61	1	2-OMe-苯基	乙基
62	1	2-OMe-苯基	正丙基
63	1	2-OMe-苯基	异丙基
64	1	2-OMe-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
65	1	2-OMe-苯基	CF_3
66	1	2-OMe-苯基	-CH_2CF_3
67	1	2-OMe-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$

[3366]

68	1	2-OMe-苯基	环丙基
69	1	2-OMe-苯基	环丁基
70	1	2-OMe-苯基	环戊基
71	1	2-OMe-苯基	环己基
72	1	2-OMe-苯基	3-吡啶基
73	1	2-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
74	1	2-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
75	1	2-OMe-苯基	2-呋喃基
76	1	3-CN-苯基	乙基
77	1	3-CN-苯基	正丙基
78	1	3-CN-苯基	异丙基
79	1	3-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
80	1	3-CN-苯基	CF_3
81	1	3-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
82	1	3-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
83	1	3-CN-苯基	环丙基
84	1	3-CN-苯基	环丁基
85	1	3-CN-苯基	环戊基
86	1	3-CN-苯基	环己基
87	1	3-CN-苯基	3-吡啶基
88	1	3-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
89	1	3-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
90	1	3-CN-苯基	2-呋喃基
91	1	2-F-苯基	乙基
92	1	2-F-苯基	正丙基
93	1	2-F-苯基	异丙基
94	1	2-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
95	1	2-F-苯基	CF_3
96	1	2-F-苯基	$-CH_2CF_3$
97	1	2-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
98	1	2-F-苯基	环丙基
99	1	2-F-苯基	环丁基
100	1	2-F-苯基	环戊基
101	1	2-F-苯基	环己基
102	1	2-F-苯基	3-吡啶基
103	1	2-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
104	1	2-F-苯基	1H-咪唑-4-基
105	1	2-F-苯基	2-呋喃基
106	1	4-F-苯基	乙基
107	1	4-F-苯基	正丙基
108	1	4-F-苯基	异丙基

[3367]

109	1	4-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
110	1	4-F-苯基	CF_3
111	1	4-F-苯基	$-CH_2CF_3$
112	1	4-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
113	1	4-F-苯基	环丙基
114	1	4-F-苯基	环丁基
115	1	4-F-苯基	环戊基
116	1	4-F-苯基	环己基
117	1	4-F-苯基	3-吡啶基
118	1	4-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
119	1	4-F-苯基	1H-咪唑-4-基
120	1	4-F-苯基	2-呋喃基
121	1	3-Cl-苯基	乙基
122	1	3-Cl-苯基	正丙基
123	1	3-Cl-苯基	异丙基
124	1	3-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
125	1	3-Cl-苯基	CF_3
126	1	3-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
127	1	3-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
128	1	3-Cl-苯基	环丙基
129	1	3-Cl-苯基	环丁基
130	1	3-Cl-苯基	环戊基
131	1	3-Cl-苯基	环己基
132	1	3-Cl-苯基	3-吡啶基
133	1	3-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
134	1	3-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
135	1	3-Cl-苯基	2-呋喃基
136	1	2-Br-苯基	乙基
137	1	2-Br-苯基	正丙基
138	1	2-Br-苯基	异丙基
139	1	2-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
140	1	2-Br-苯基	CF_3
141	1	2-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
142	1	2-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
143	1	2-Br-苯基	环丙基
144	1	2-Br-苯基	环丁基
145	1	2-Br-苯基	环戊基
146	1	2-Br-苯基	环己基
147	1	2-Br-苯基	3-吡啶基
148	1	2-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基

[3368]

149	1	2-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
150	1	2-Br-苯基	2-呋喃基
151	1	4-Br-苯基	乙基
152	1	4-Br-苯基	正丙基
153	1	4-Br-苯基	异丙基
154	1	4-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
155	1	4-Br-苯基	CF_3
156	1	4-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
157	1	4-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
158	1	4-Br-苯基	环丙基
159	1	4-Br-苯基	环丁基
160	1	4-Br-苯基	环戊基
161	1	4-Br-苯基	环己基
162	1	4-Br-苯基	3-吡啶基
163	1	4-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
164	1	4-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
165	1	4-Br-苯基	2-呋喃基
166	1	3-CF_3-苯基	乙基
167	1	3-CF_3-苯基	正丙基
168	1	3-CF_3-苯基	异丙基
169	1	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
170	1	3-CF_3-苯基	CF_3
171	1	3-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
172	1	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
173	1	3-CF_3-苯基	环丙基
174	1	3-CF_3-苯基	环丁基
175	1	3-CF_3-苯基	环戊基
176	1	3-CF_3-苯基	环己基
177	1	3-CF_3-苯基	3-吡啶基
178	1	3-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
179	1	3-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
180	1	3-CF_3-苯基	2-呋喃基
181	1	2-iPr-苯基	乙基
182	1	2-iPr-苯基	正丙基
183	1	2-iPr-苯基	异丙基
184	1	2-iPr-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
185	1	2-iPr-苯基	CF_3
186	1	2-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
187	1	2-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
188	1	2-iPr-苯基	环丙基

189	1	2-iPr-苯基	环丁基
190	1	2-iPr-苯基	环戊基
191	1	2-iPr-苯基	环己基
192	1	2-iPr-苯基	3-吡啶基
193	1	2-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
194	1	2-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
195	1	2-iPr-苯基	2-呋喃基
196	1	4-iPr-苯基	乙基
197	1	4-iPr-苯基	正丙基
198	1	4-iPr-苯基	异丙基
199	1	4-iPr-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
200	1	4-iPr-苯基	CF_3
201	1	4-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
202	1	4-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
203	1	4-iPr-苯基	环丙基
204	1	4-iPr-苯基	环丁基
205	1	4-iPr-苯基	环戊基
206	1	4-iPr-苯基	环己基
207	1	4-iPr-苯基	3-吡啶基
208	1	4-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
209	1	4-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
210	1	4-iPr-苯基	2-呋喃基
211	1	3-吗啉代-苯基	乙基
212	1	3-吗啉代-苯基	正丙基
213	1	3-吗啉代-苯基	异丙基
214	1	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
215	1	3-吗啉代-苯基	CF_3
216	1	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
217	1	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
218	1	3-吗啉代-苯基	环丙基
219	1	3-吗啉代-苯基	环丁基
220	1	3-吗啉代-苯基	环戊基
221	1	3-吗啉代-苯基	环己基
222	1	3-吗啉代-苯基	3-吡啶基
223	1	3-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
224	1	3-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
225	1	3-吗啉代-苯基	2-呋喃基
226	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	乙基
227	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	正丙基
228	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	异丙基
229	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3369]

[3370]

230	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	CF_3
231	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
232	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
233	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丙基
234	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丁基
235	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环戊基
236	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环己基
237	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
238	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
239	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
240	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
241	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	乙基
242	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	正丙基
243	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	异丙基
244	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
245	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	CF_3
246	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
247	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
248	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丙基
249	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丁基
250	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环戊基
251	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环己基
252	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
253	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
254	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
255	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
256	1	2-CH_3-苯基	乙基
257	1	2-CH_3-苯基	正丙基
258	1	2-CH_3-苯基	异丙基
259	1	2-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
260	1	2-CH_3-苯基	CF_3
261	1	2-CH_3-苯基	$-CH_2CF_3$
262	1	2-CH_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
263	1	2-CH_3-苯基	环丙基
264	1	2-CH_3-苯基	环丁基
265	1	2-CH_3-苯基	环戊基
266	1	2-CH_3-苯基	环己基
267	1	2-CH_3-苯基	3-吡啶基
268	1	2-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
269	1	2-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基

[3371]

270	1	2-CH_3-苯基	2-呋喃基
271	1	4-OH-苯基	乙基
272	1	4-OH-苯基	正丙基
273	1	4-OH-苯基	异丙基
274	1	4-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
275	1	4-OH-苯基	CF_3
276	1	4-OH-苯基	-CH_2CF_3
277	1	4-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
278	1	4-OH-苯基	环丙基
279	1	4-OH-苯基	环丁基
280	1	4-OH-苯基	环戊基
281	1	4-OH-苯基	环己基
282	1	4-OH-苯基	3-吡啶基
283	1	4-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
284	1	4-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
285	1	4-OH-苯基	2-呋喃基
286	1	2-OH-苯基	乙基
287	1	2-OH-苯基	正丙基
288	1	2-OH-苯基	异丙基
289	1	2-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
290	1	2-OH-苯基	CF_3
291	1	2-OH-苯基	-CH_2CF_3
292	1	2-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
293	1	2-OH-苯基	环丙基
294	1	2-OH-苯基	环丁基
295	1	2-OH-苯基	环戊基
296	1	2-OH-苯基	环己基
297	1	2-OH-苯基	3-吡啶基
298	1	2-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
299	1	2-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
300	1	2-OH-苯基	2-呋喃基
301	1	3-OMe-苯基	乙基
302	1	3-OMe-苯基	正丙基
303	1	3-OMe-苯基	异丙基
304	1	3-OMe-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
305	1	3-OMe-苯基	CF_3
306	1	3-OMe-苯基	-CH_2CF_3
307	1	3-OMe-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
308	1	3-OMe-苯基	环丙基
309	1	3-OMe-苯基	环丁基

[3372]

310	1	3-OMe-苯基	环戊基
311	1	3-OMe-苯基	环己基
312	1	3-OMe-苯基	3-吡啶基
313	1	3-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
314	1	3-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
315	1	3-OMe-苯基	2-呋喃基
316	1	4-CN-苯基	乙基
317	1	4-CN-苯基	正丙基
318	1	4-CN-苯基	异丙基
319	1	4-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
320	1	4-CN-苯基	CF_3
321	1	4-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
322	1	4-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
323	1	4-CN-苯基	环丙基
324	1	4-CN-苯基	环丁基
325	1	4-CN-苯基	环戊基
326	1	4-CN-苯基	环己基
327	1	4-CN-苯基	3-吡啶基
328	1	4-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
329	1	4-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
330	1	4-CN-苯基	2-呋喃基
331	1	2-CN-苯基	乙基
332	1	2-CN-苯基	正丙基
333	1	2-CN-苯基	异丙基
334	1	2-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
335	1	2-CN-苯基	CF_3
336	1	2-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
337	1	2-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
338	1	2-CN-苯基	环丙基
339	1	2-CN-苯基	环丁基
340	1	2-CN-苯基	环戊基
341	1	2-CN-苯基	环己基
342	1	2-CN-苯基	3-吡啶基
343	1	2-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
344	1	2-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
345	1	2-CN-苯基	2-呋喃基
346	1	3-F-苯基	乙基
347	1	3-F-苯基	正丙基
348	1	3-F-苯基	异丙基
349	1	3-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3373]

350	1	3-F-苯基	CF_3
351	1	3-F-苯基	$-CH_2CF_3$
352	1	3-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
353	1	3-F-苯基	环丙基
354	1	3-F-苯基	环丁基
355	1	3-F-苯基	环戊基
356	1	3-F-苯基	环己基
357	1	3-F-苯基	3-吡啶基
358	1	3-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
359	1	3-F-苯基	1H-咪唑-4-基
360	1	3-F-苯基	2-呋喃基
361	1	2-Cl-苯基	乙基
362	1	2-Cl-苯基	正丙基
363	1	2-Cl-苯基	异丙基
364	1	2-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
365	1	2-Cl-苯基	CF_3
366	1	2-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
367	1	2-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
368	1	2-Cl-苯基	环丙基
369	1	2-Cl-苯基	环丁基
370	1	2-Cl-苯基	环戊基
371	1	2-Cl-苯基	环己基
372	1	2-Cl-苯基	3-吡啶基
373	1	2-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
374	1	2-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
375	1	2-Cl-苯基	2-呋喃基
376	1	4-Cl-苯基	乙基
377	1	4-Cl-苯基	正丙基
378	1	4-Cl-苯基	异丙基
379	1	4-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
380	1	4-Cl-苯基	CF_3
381	1	4-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
382	1	4-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
383	1	4-Cl-苯基	环丙基
384	1	4-Cl-苯基	环丁基
385	1	4-Cl-苯基	环戊基
386	1	4-Cl-苯基	环己基
387	1	4-Cl-苯基	3-吡啶基
388	1	4-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
389	1	4-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基

[3374]

390	1	4-Cl-苯基	2-呋喃基
391	1	3-Br-苯基	乙基
392	1	3-Br-苯基	正丙基
393	1	3-Br-苯基	异丙基
394	1	3-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
395	1	3-Br-苯基	CF_3
396	1	3-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
397	1	3-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
398	1	3-Br-苯基	环丙基
399	1	3-Br-苯基	环丁基
400	1	3-Br-苯基	环戊基
401	1	3-Br-苯基	环己基
402	1	3-Br-苯基	3-吡啶基
403	1	3-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
404	1	3-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
405	1	3-Br-苯基	2-呋喃基
406	1	2-CF_3-苯基	乙基
407	1	2-CF_3-苯基	正丙基
408	1	2-CF_3-苯基	异丙基
409	1	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
410	1	2-CF_3-苯基	CF_3
411	1	2-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
412	1	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
413	1	2-CF_3-苯基	环丙基
414	1	2-CF_3-苯基	环丁基
415	1	2-CF_3-苯基	环戊基
416	1	2-CF_3-苯基	环己基
417	1	2-CF_3-苯基	3-吡啶基
418	1	2-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
419	1	2-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
420	1	2-CF_3-苯基	2-呋喃基
421	1	4-CF_3-苯基	乙基
422	1	4-CF_3-苯基	正丙基
423	1	4-CF_3-苯基	异丙基
424	1	4-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
425	1	4-CF_3-苯基	CF_3
426	1	4-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
427	1	4-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
428	1	4-CF_3-苯基	环丙基
429	1	4-CF_3-苯基	环丁基

[3375]

430	1	4-CF_3-苯基	环戊基
431	1	4-CF_3-苯基	环己基
432	1	4-CF_3-苯基	3-吡啶基
433	1	4-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
434	1	4-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
435	1	4-CF_3-苯基	2-呋喃基
436	1	3-iPr-苯基	乙基
437	1	3-iPr-苯基	正丙基
438	1	3-iPr-苯基	异丙基
439	1	3-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
440	1	3-iPr-苯基	CF_3
441	1	3-iPr-苯基	-CH_2CF_3
442	1	3-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
443	1	3-iPr-苯基	环丙基
444	1	3-iPr-苯基	环丁基
445	1	3-iPr-苯基	环戊基
446	1	3-iPr-苯基	环己基
447	1	3-iPr-苯基	3-吡啶基
448	1	3-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
449	1	3-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
450	1	3-iPr-苯基	2-呋喃基
451	1	2-吗啉代-苯基	乙基
452	1	2-吗啉代-苯基	正丙基
453	1	2-吗啉代-苯基	异丙基
454	1	2-吗啉代-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
455	1	2-吗啉代-苯基	CF_3
456	1	2-吗啉代-苯基	-CH_2CF_3
457	1	2-吗啉代-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
458	1	2-吗啉代-苯基	环丙基
459	1	2-吗啉代-苯基	环丁基
460	1	2-吗啉代-苯基	环戊基
461	1	2-吗啉代-苯基	环己基
462	1	2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
463	1	2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
464	1	2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
465	1	2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
466	1	4-吗啉代-苯基	乙基
467	1	4-吗啉代-苯基	正丙基
468	1	4-吗啉代-苯基	异丙基
469	1	4-吗啉代-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$

[3376]

470	1	4-吗啉代-苯基	CF_3
471	1	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
472	1	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
473	1	4-吗啉代-苯基	环丙基
474	1	4-吗啉代-苯基	环丁基
475	1	4-吗啉代-苯基	环戊基
476	1	4-吗啉代-苯基	环己基
477	1	4-吗啉代-苯基	3-吡啶基
478	1	4-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
479	1	4-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
480	1	4-吗啉代-苯基	2-呋喃基
481	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	乙基
482	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	正丙基
483	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	异丙基
484	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
485	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	CF_3
486	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
487	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
488	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丙基
489	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丁基
490	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环戊基
491	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环己基
492	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
493	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
494	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
495	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
496	2	4-CH_3-苯基	乙基
497	2	4-CH_3-苯基	正丙基
498	2	4-CH_3-苯基	异丙基
499	2	4-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
500	2	4-CH_3-苯基	CF_3
501	2	4-CH_3-苯基	$-CH_2CF_3$
502	2	4-CH_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
503	2	4-CH_3-苯基	环丙基
504	2	4-CH_3-苯基	环丁基
505	2	4-CH_3-苯基	环戊基
506	2	4-CH_3-苯基	环己基
507	2	4-CH_3-苯基	3-吡啶基
508	2	4-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
509	2	4-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基

[3377]

510	2	4-CH_3-苯基	2-呋喃基
511	2	3-CH_3-苯基	乙基
512	2	3-CH_3-苯基	正丙基
513	2	3-CH_3-苯基	异丙基
514	2	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
515	2	3-CH_3-苯基	CF_3
516	2	3-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
517	2	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
518	2	3-CH_3-苯基	环丙基
519	2	3-CH_3-苯基	环丁基
520	2	3-CH_3-苯基	环戊基
521	2	3-CH_3-苯基	环己基
522	2	3-CH_3-苯基	3-吡啶基
523	2	3-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
524	2	3-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
525	2	3-CH_3-苯基	2-呋喃基
526	2	3-OH-苯基	乙基
527	2	3-OH-苯基	正丙基
528	2	3-OH-苯基	异丙基
529	2	3-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
530	2	3-OH-苯基	CF_3
531	2	3-OH-苯基	-CH_2CF_3
532	2	3-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
533	2	3-OH-苯基	环丙基
534	2	3-OH-苯基	环丁基
535	2	3-OH-苯基	环戊基
536	2	3-OH-苯基	环己基
537	2	3-OH-苯基	3-吡啶基
538	2	3-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
539	2	3-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
540	2	3-OH-苯基	2-呋喃基
541	2	4-OMe-苯基	乙基
542	2	4-OMe-苯基	正丙基
543	2	4-OMe-苯基	异丙基
544	2	4-OMe-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
545	2	4-OMe-苯基	CF_3
546	2	4-OMe-苯基	-CH_2CF_3
547	2	4-OMe-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
548	2	4-OMe-苯基	环丙基
549	2	4-OMe-苯基	环丁基

[3378]

550	2	4-OMe-苯基	环戊基
551	2	4-OMe-苯基	环己基
552	2	4-OMe-苯基	3-吡啶基
553	2	4-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
554	2	4-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
555	2	4-OMe-苯基	2-呋喃基
556	2	2-OMe-苯基	乙基
557	2	2-OMe-苯基	正丙基
558	2	2-OMe-苯基	异丙基
559	2	2-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
560	2	2-OMe-苯基	CF_3
561	2	2-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
562	2	2-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
563	2	2-OMe-苯基	环丙基
564	2	2-OMe-苯基	环丁基
565	2	2-OMe-苯基	环戊基
566	2	2-OMe-苯基	环己基
567	2	2-OMe-苯基	3-吡啶基
568	2	2-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
569	2	2-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
570	2	2-OMe-苯基	2-呋喃基
571	2	3-CN-苯基	乙基
572	2	3-CN-苯基	正丙基
573	2	3-CN-苯基	异丙基
574	2	3-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
575	2	3-CN-苯基	CF_3
576	2	3-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
577	2	3-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
578	2	3-CN-苯基	环丙基
579	2	3-CN-苯基	环丁基
580	2	3-CN-苯基	环戊基
581	2	3-CN-苯基	环己基
582	2	3-CN-苯基	3-吡啶基
583	2	3-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
584	2	3-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
585	2	3-CN-苯基	2-呋喃基
586	2	2-F-苯基	乙基
587	2	2-F-苯基	正丙基
588	2	2-F-苯基	异丙基
589	2	2-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3379]

590	2	2-F-苯基	CF_3
591	2	2-F-苯基	$-CH_2CF_3$
592	2	2-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
593	2	2-F-苯基	环丙基
594	2	2-F-苯基	环丁基
595	2	2-F-苯基	环戊基
596	2	2-F-苯基	环己基
597	2	2-F-苯基	3-吡啶基
598	2	2-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
599	2	2-F-苯基	1H-咪唑-4-基
600	2	2-F-苯基	2-呋喃基
601	2	4-F-苯基	乙基
602	2	4-F-苯基	正丙基
603	2	4-F-苯基	异丙基
604	2	4-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
605	2	4-F-苯基	CF_3
606	2	4-F-苯基	$-CH_2CF_3$
607	2	4-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
608	2	4-F-苯基	环丙基
609	2	4-F-苯基	环丁基
610	2	4-F-苯基	环戊基
611	2	4-F-苯基	环己基
612	2	4-F-苯基	3-吡啶基
613	2	4-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
614	2	4-F-苯基	1H-咪唑-4-基
615	2	4-F-苯基	2-呋喃基
616	2	3-Cl-苯基	乙基
617	2	3-Cl-苯基	正丙基
618	2	3-Cl-苯基	异丙基
619	2	3-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
620	2	3-Cl-苯基	CF_3
621	2	3-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
622	2	3-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
623	2	3-Cl-苯基	环丙基
624	2	3-Cl-苯基	环丁基
625	2	3-Cl-苯基	环戊基
626	2	3-Cl-苯基	环己基
627	2	3-Cl-苯基	3-吡啶基
628	2	3-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
629	2	3-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基

[3380]

630	2	3-Cl-苯基	2-呋喃基
631	2	2-Br-苯基	乙基
632	2	2-Br-苯基	正丙基
633	2	2-Br-苯基	异丙基
634	2	2-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
635	2	2-Br-苯基	CF_3
636	2	2-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
637	2	2-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
638	2	2-Br-苯基	环丙基
639	2	2-Br-苯基	环丁基
640	2	2-Br-苯基	环戊基
641	2	2-Br-苯基	环己基
642	2	2-Br-苯基	3-吡啶基
643	2	2-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
644	2	2-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
645	2	2-Br-苯基	2-呋喃基
646	2	4-Br-苯基	乙基
647	2	4-Br-苯基	正丙基
648	2	4-Br-苯基	异丙基
649	2	4-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
650	2	4-Br-苯基	CF_3
651	2	4-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
652	2	4-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
653	2	4-Br-苯基	环丙基
654	2	4-Br-苯基	环丁基
655	2	4-Br-苯基	环戊基
656	2	4-Br-苯基	环己基
657	2	4-Br-苯基	3-吡啶基
658	2	4-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
659	2	4-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
660	2	4-Br-苯基	2-呋喃基
661	2	3-CF_3-苯基	乙基
662	2	3-CF_3-苯基	正丙基
663	2	3-CF_3-苯基	异丙基
664	2	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
665	2	3-CF_3-苯基	CF_3
666	2	3-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
667	2	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
668	2	3-CF_3-苯基	环丙基
669	2	3-CF_3-苯基	环丁基

[3381]

670	2	3-CF_3-苯基	环戊基
671	2	3-CF_3-苯基	环己基
672	2	3-CF_3-苯基	3-吡啶基
673	2	3-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
674	2	3-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
675	2	3-CF_3-苯基	2-呋喃基
676	2	2-iPr-苯基	乙基
677	2	2-iPr-苯基	正丙基
678	2	2-iPr-苯基	异丙基
679	2	2-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
680	2	2-iPr-苯基	CF_3
681	2	2-iPr-苯基	-CH_2CF_3
682	2	2-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
683	2	2-iPr-苯基	环丙基
684	2	2-iPr-苯基	环丁基
685	2	2-iPr-苯基	环戊基
686	2	2-iPr-苯基	环己基
687	2	2-iPr-苯基	3-吡啶基
688	2	2-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
689	2	2-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
690	2	2-iPr-苯基	2-呋喃基
691	2	4-iPr-苯基	乙基
692	2	4-iPr-苯基	正丙基
693	2	4-iPr-苯基	异丙基
694	2	4-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
695	2	4-iPr-苯基	CF_3
696	2	4-iPr-苯基	-CH_2CF_3
697	2	4-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
698	2	4-iPr-苯基	环丙基
699	2	4-iPr-苯基	环丁基
700	2	4-iPr-苯基	环戊基
701	2	4-iPr-苯基	环己基
702	2	4-iPr-苯基	3-吡啶基
703	2	4-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
704	2	4-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
705	2	4-iPr-苯基	2-呋喃基
706	2	3-吗啉代-苯基	乙基
707	2	3-吗啉代-苯基	正丙基
708	2	3-吗啉代-苯基	异丙基
709	2	3-吗啉代-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$

[3382]

710	2	3-吗啉代-苯基	CF_3
711	2	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
712	2	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
713	2	3-吗啉代-苯基	环丙基
714	2	3-吗啉代-苯基	环丁基
715	2	3-吗啉代-苯基	环戊基
716	2	3-吗啉代-苯基	环己基
717	2	3-吗啉代-苯基	3-吡啶基
718	2	3-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
719	2	3-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
720	2	3-吗啉代-苯基	2-呋喃基
721	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	乙基
722	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	正丙基
723	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	异丙基
724	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
725	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	CF_3
726	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
727	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
728	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丙基
729	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丁基
730	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环戊基
731	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环己基
732	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
733	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
734	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
735	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
736	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	乙基
737	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	正丙基
738	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	异丙基
739	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
740	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	CF_3
741	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
742	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
743	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丙基
744	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丁基
745	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环戊基
746	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环己基
747	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
748	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
749	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基

[3383]

750	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
751	2	2-CH_3-苯基	乙基
752	2	2-CH_3-苯基	正丙基
753	2	2-CH_3-苯基	异丙基
754	2	2-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
755	2	2-CH_3-苯基	CF_3
756	2	2-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
757	2	2-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
758	2	2-CH_3-苯基	环丙基
759	2	2-CH_3-苯基	环丁基
760	2	2-CH_3-苯基	环戊基
761	2	2-CH_3-苯基	环己基
762	2	2-CH_3-苯基	3-吡啶基
763	2	2-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
764	2	2-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
765	2	2-CH_3-苯基	2-呋喃基
766	2	4-OH-苯基	乙基
767	2	4-OH-苯基	正丙基
768	2	4-OH-苯基	异丙基
769	2	4-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
770	2	4-OH-苯基	CF_3
771	2	4-OH-苯基	-CH_2CF_3
772	2	4-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
773	2	4-OH-苯基	环丙基
774	2	4-OH-苯基	环丁基
775	2	4-OH-苯基	环戊基
776	2	4-OH-苯基	环己基
777	2	4-OH-苯基	3-吡啶基
778	2	4-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
779	2	4-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
780	2	4-OH-苯基	2-呋喃基
781	2	2-OH-苯基	乙基
782	2	2-OH-苯基	正丙基
783	2	2-OH-苯基	异丙基
784	2	2-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
785	2	2-OH-苯基	CF_3
786	2	2-OH-苯基	-CH_2CF_3
787	2	2-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
788	2	2-OH-苯基	环丙基
789	2	2-OH-苯基	环丁基

[3384]

790	2	2-OH-苯基	环戊基
791	2	2-OH-苯基	环己基
792	2	2-OH-苯基	3-吡啶基
793	2	2-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
794	2	2-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
795	2	2-OH-苯基	2-呋喃基
796	2	3-OMe-苯基	乙基
797	2	3-OMe-苯基	正丙基
798	2	3-OMe-苯基	异丙基
799	2	3-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
800	2	3-OMe-苯基	CF_3
801	2	3-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
802	2	3-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
803	2	3-OMe-苯基	环丙基
804	2	3-OMe-苯基	环丁基
805	2	3-OMe-苯基	环戊基
806	2	3-OMe-苯基	环己基
807	2	3-OMe-苯基	3-吡啶基
808	2	3-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
809	2	3-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
810	2	3-OMe-苯基	2-呋喃基
811	2	4-CN-苯基	乙基
812	2	4-CN-苯基	正丙基
813	2	4-CN-苯基	异丙基
814	2	4-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
815	2	4-CN-苯基	CF_3
816	2	4-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
817	2	4-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
818	2	4-CN-苯基	环丙基
819	2	4-CN-苯基	环丁基
820	2	4-CN-苯基	环戊基
821	2	4-CN-苯基	环己基
822	2	4-CN-苯基	3-吡啶基
823	2	4-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
824	2	4-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
825	2	4-CN-苯基	2-呋喃基
826	2	2-CN-苯基	乙基
827	2	2-CN-苯基	正丙基
828	2	2-CN-苯基	异丙基
829	2	2-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3385]

830	2	2-CN-苯基	CF_3
831	2	2-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
832	2	2-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
833	2	2-CN-苯基	环丙基
834	2	2-CN-苯基	环丁基
835	2	2-CN-苯基	环戊基
836	2	2-CN-苯基	环己基
837	2	2-CN-苯基	3-吡啶基
838	2	2-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
839	2	2-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
840	2	2-CN-苯基	2-呋喃基
841	2	3-F-苯基	乙基
842	2	3-F-苯基	正丙基
843	2	3-F-苯基	异丙基
844	2	3-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
845	2	3-F-苯基	CF_3
846	2	3-F-苯基	$-CH_2CF_3$
847	2	3-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
848	2	3-F-苯基	环丙基
849	2	3-F-苯基	环丁基
850	2	3-F-苯基	环戊基
851	2	3-F-苯基	环己基
852	2	3-F-苯基	3-吡啶基
853	2	3-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
854	2	3-F-苯基	1H-咪唑-4-基
855	2	3-F-苯基	2-呋喃基
856	2	2-Cl-苯基	乙基
857	2	2-Cl-苯基	正丙基
858	2	2-Cl-苯基	异丙基
859	2	2-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
860	2	2-Cl-苯基	CF_3
861	2	2-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
862	2	2-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
863	2	2-Cl-苯基	环丙基
864	2	2-Cl-苯基	环丁基
865	2	2-Cl-苯基	环戊基
866	2	2-Cl-苯基	环己基
867	2	2-Cl-苯基	3-吡啶基
868	2	2-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
869	2	2-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基

[3386]

870	2	2-Cl-苯基	2-呋喃基
871	2	4-Cl-苯基	乙基
872	2	4-Cl-苯基	正丙基
873	2	4-Cl-苯基	异丙基
874	2	4-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
875	2	4-Cl-苯基	CF_3
876	2	4-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
877	2	4-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
878	2	4-Cl-苯基	环丙基
879	2	4-Cl-苯基	环丁基
880	2	4-Cl-苯基	环戊基
881	2	4-Cl-苯基	环己基
882	2	4-Cl-苯基	3-吡啶基
883	2	4-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
884	2	4-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
885	2	4-Cl-苯基	2-呋喃基
886	2	3-Br-苯基	乙基
887	2	3-Br-苯基	正丙基
888	2	3-Br-苯基	异丙基
889	2	3-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
890	2	3-Br-苯基	CF_3
891	2	3-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
892	2	3-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
893	2	3-Br-苯基	环丙基
894	2	3-Br-苯基	环丁基
895	2	3-Br-苯基	环戊基
896	2	3-Br-苯基	环己基
897	2	3-Br-苯基	3-吡啶基
898	2	3-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
899	2	3-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
900	2	3-Br-苯基	2-呋喃基
901	2	2-CF_3-苯基	乙基
902	2	2-CF_3-苯基	正丙基
903	2	2-CF_3-苯基	异丙基
904	2	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
905	2	2-CF_3-苯基	CF_3
906	2	2-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
907	2	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
908	2	2-CF_3-苯基	环丙基
909	2	2-CF_3-苯基	环丁基

[3387]

910	2	2-CF_3-苯基	环戊基
911	2	2-CF_3-苯基	环己基
912	2	2-CF_3-苯基	3-吡啶基
913	2	2-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
914	2	2-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
915	2	2-CF_3-苯基	2-呋喃基
916	2	4-CF_3-苯基	乙基
917	2	4-CF_3-苯基	正丙基
918	2	4-CF_3-苯基	异丙基
919	2	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
920	2	4-CF_3-苯基	CF_3
921	2	4-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
922	2	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
923	2	4-CF_3-苯基	环丙基
924	2	4-CF_3-苯基	环丁基
925	2	4-CF_3-苯基	环戊基
926	2	4-CF_3-苯基	环己基
927	2	4-CF_3-苯基	3-吡啶基
928	2	4-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
929	2	4-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
930	2	4-CF_3-苯基	2-呋喃基
931	2	3-iPr-苯基	乙基
932	2	3-iPr-苯基	正丙基
933	2	3-iPr-苯基	异丙基
934	2	3-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
935	2	3-iPr-苯基	CF_3
936	2	3-iPr-苯基	-CH_2CF_3
937	2	3-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
938	2	3-iPr-苯基	环丙基
939	2	3-iPr-苯基	环丁基
940	2	3-iPr-苯基	环戊基
941	2	3-iPr-苯基	环己基
942	2	3-iPr-苯基	3-吡啶基
943	2	3-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
944	2	3-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
945	2	3-iPr-苯基	2-呋喃基
946	2	2-吗啉代-苯基	乙基
947	2	2-吗啉代-苯基	正丙基
948	2	2-吗啉代-苯基	异丙基
949	2	2-吗啉代-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$

[3388]

950	2	2-吗啉代-苯基	CF_3
951	2	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
952	2	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
953	2	2-吗啉代-苯基	环丙基
954	2	2-吗啉代-苯基	环丁基
955	2	2-吗啉代-苯基	环戊基
956	2	2-吗啉代-苯基	环己基
957	2	2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
958	2	2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
959	2	2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
960	2	2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
961	2	4-吗啉代-苯基	乙基
962	2	4-吗啉代-苯基	正丙基
963	2	4-吗啉代-苯基	异丙基
964	2	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
965	2	4-吗啉代-苯基	CF_3
966	2	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
967	2	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
968	2	4-吗啉代-苯基	环丙基
969	2	4-吗啉代-苯基	环丁基
970	2	4-吗啉代-苯基	环戊基
971	2	4-吗啉代-苯基	环己基
972	2	4-吗啉代-苯基	3-吡啶基
973	2	4-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
974	2	4-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
975	2	4-吗啉代-苯基	2-呋喃基
976	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	乙基
977	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	正丙基
978	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	异丙基
979	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
980	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	CF_3
981	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
982	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
983	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丙基
984	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丁基
985	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环戊基
986	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环己基
987	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
988	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
989	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基

[3389]

990	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
991	3	4-CH_3-苯基	乙基
992	3	4-CH_3-苯基	正丙基
993	3	4-CH_3-苯基	异丙基
994	3	4-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
995	3	4-CH_3-苯基	CF_3
996	3	4-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
997	3	4-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
998	3	4-CH_3-苯基	环丙基
999	3	4-CH_3-苯基	环丁基
1000	3	4-CH_3-苯基	环戊基
1001	3	4-CH_3-苯基	环己基
1002	3	4-CH_3-苯基	3-吡啶基
1003	3	4-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1004	3	4-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1005	3	4-CH_3-苯基	2-呋喃基
1006	3	3-CH_3-苯基	乙基
1007	3	3-CH_3-苯基	正丙基
1008	3	3-CH_3-苯基	异丙基
1009	3	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1010	3	3-CH_3-苯基	CF_3
1011	3	3-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
1012	3	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1013	3	3-CH_3-苯基	环丙基
1014	3	3-CH_3-苯基	环丁基
1015	3	3-CH_3-苯基	环戊基
1016	3	3-CH_3-苯基	环己基
1017	3	3-CH_3-苯基	3-吡啶基
1018	3	3-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1019	3	3-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1020	3	3-CH_3-苯基	2-呋喃基
1021	3	3-OH-苯基	乙基
1022	3	3-OH-苯基	正丙基
1023	3	3-OH-苯基	异丙基
1024	3	3-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1025	3	3-OH-苯基	CF_3
1026	3	3-OH-苯基	-CH_2CF_3
1027	3	3-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1028	3	3-OH-苯基	环丙基
1029	3	3-OH-苯基	环丁基

1030	3	3-OH-苯基	环戊基
1031	3	3-OH-苯基	环己基
1032	3	3-OH-苯基	3-吡啶基
1033	3	3-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1034	3	3-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1035	3	3-OH-苯基	2-呋喃基
1036	3	4-OMe-苯基	乙基
1037	3	4-OMe-苯基	正丙基
1038	3	4-OMe-苯基	异丙基
1039	3	4-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1040	3	4-OMe-苯基	CF_3
1041	3	4-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1042	3	4-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1043	3	4-OMe-苯基	环丙基
1044	3	4-OMe-苯基	环丁基
1045	3	4-OMe-苯基	环戊基
1046	3	4-OMe-苯基	环己基
1047	3	4-OMe-苯基	3-吡啶基
1048	3	4-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1049	3	4-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1050	3	4-OMe-苯基	2-呋喃基
1051	3	2-OMe-苯基	乙基
1052	3	2-OMe-苯基	正丙基
1053	3	2-OMe-苯基	异丙基
1054	3	2-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1055	3	2-OMe-苯基	CF_3
1056	3	2-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1057	3	2-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1058	3	2-OMe-苯基	环丙基
1059	3	2-OMe-苯基	环丁基
1060	3	2-OMe-苯基	环戊基
1061	3	2-OMe-苯基	环己基
1062	3	2-OMe-苯基	3-吡啶基
1063	3	2-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1064	3	2-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1065	3	2-OMe-苯基	2-呋喃基
1066	3	3-CN-苯基	乙基
1067	3	3-CN-苯基	正丙基
1068	3	3-CN-苯基	异丙基
1069	3	3-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3390]

[3391]

1070	3	3-CN-苯基	CF_3
1071	3	3-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1072	3	3-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1073	3	3-CN-苯基	环丙基
1074	3	3-CN-苯基	环丁基
1075	3	3-CN-苯基	环戊基
1076	3	3-CN-苯基	环己基
1077	3	3-CN-苯基	3-吡啶基
1078	3	3-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1079	3	3-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1080	3	3-CN-苯基	2-呋喃基
1081	3	2-F-苯基	乙基
1082	3	2-F-苯基	正丙基
1083	3	2-F-苯基	异丙基
1084	3	2-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1085	3	2-F-苯基	CF_3
1086	3	2-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1087	3	2-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1088	3	2-F-苯基	环丙基
1089	3	2-F-苯基	环丁基
1090	3	2-F-苯基	环戊基
1091	3	2-F-苯基	环己基
1092	3	2-F-苯基	3-吡啶基
1093	3	2-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1094	3	2-F-苯基	1H-咪唑-4-基
1095	3	2-F-苯基	2-呋喃基
1096	3	4-F-苯基	乙基
1097	3	4-F-苯基	正丙基
1098	3	4-F-苯基	异丙基
1099	3	4-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1100	3	4-F-苯基	CF_3
1101	3	4-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1102	3	4-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1103	3	4-F-苯基	环丙基
1104	3	4-F-苯基	环丁基
1105	3	4-F-苯基	环戊基
1106	3	4-F-苯基	环己基
1107	3	4-F-苯基	3-吡啶基
1108	3	4-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1109	3	4-F-苯基	1H-咪唑-4-基

[3392]

1110	3	4-F-苯基	2-呋喃基
1111	3	3-Cl-苯基	乙基
1112	3	3-Cl-苯基	正丙基
1113	3	3-Cl-苯基	异丙基
1114	3	3-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1115	3	3-Cl-苯基	CF_3
1116	3	3-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1117	3	3-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1118	3	3-Cl-苯基	环丙基
1119	3	3-Cl-苯基	环丁基
1120	3	3-Cl-苯基	环戊基
1121	3	3-Cl-苯基	环己基
1122	3	3-Cl-苯基	3-吡啶基
1123	3	3-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1124	3	3-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1125	3	3-Cl-苯基	2-呋喃基
1126	3	2-Br-苯基	乙基
1127	3	2-Br-苯基	正丙基
1128	3	2-Br-苯基	异丙基
1129	3	2-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1130	3	2-Br-苯基	CF_3
1131	3	2-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1132	3	2-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1133	3	2-Br-苯基	环丙基
1134	3	2-Br-苯基	环丁基
1135	3	2-Br-苯基	环戊基
1136	3	2-Br-苯基	环己基
1137	3	2-Br-苯基	3-吡啶基
1138	3	2-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1139	3	2-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1140	3	2-Br-苯基	2-呋喃基
1141	3	4-Br-苯基	乙基
1142	3	4-Br-苯基	正丙基
1143	3	4-Br-苯基	异丙基
1144	3	4-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1145	3	4-Br-苯基	CF_3
1146	3	4-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1147	3	4-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1148	3	4-Br-苯基	环丙基
1149	3	4-Br-苯基	环丁基

[3393]

1150	3	4-Br-苯基	环戊基
1151	3	4-Br-苯基	环己基
1152	3	4-Br-苯基	3-吡啶基
1153	3	4-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1154	3	4-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1155	3	4-Br-苯基	2-呋喃基
1156	3	3-CF_3-苯基	乙基
1157	3	3-CF_3-苯基	正丙基
1158	3	3-CF_3-苯基	异丙基
1159	3	3-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1160	3	3-CF_3-苯基	CF_3
1161	3	3-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
1162	3	3-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1163	3	3-CF_3-苯基	环丙基
1164	3	3-CF_3-苯基	环丁基
1165	3	3-CF_3-苯基	环戊基
1166	3	3-CF_3-苯基	环己基
1167	3	3-CF_3-苯基	3-吡啶基
1168	3	3-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1169	3	3-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1170	3	3-CF_3-苯基	2-呋喃基
1171	3	2-iPr-苯基	乙基
1172	3	2-iPr-苯基	正丙基
1173	3	2-iPr-苯基	异丙基
1174	3	2-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1175	3	2-iPr-苯基	CF_3
1176	3	2-iPr-苯基	-CH_2CF_3
1177	3	2-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1178	3	2-iPr-苯基	环丙基
1179	3	2-iPr-苯基	环丁基
1180	3	2-iPr-苯基	环戊基
1181	3	2-iPr-苯基	环己基
1182	3	2-iPr-苯基	3-吡啶基
1183	3	2-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1184	3	2-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1185	3	2-iPr-苯基	2-呋喃基
1186	3	4-iPr-苯基	乙基
1187	3	4-iPr-苯基	正丙基
1188	3	4-iPr-苯基	异丙基
1189	3	4-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$

[3394]

1190	3	4-iPr-苯基	CF_3
1191	3	4-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
1192	3	4-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1193	3	4-iPr-苯基	环丙基
1194	3	4-iPr-苯基	环丁基
1195	3	4-iPr-苯基	环戊基
1196	3	4-iPr-苯基	环己基
1197	3	4-iPr-苯基	3-吡啶基
1198	3	4-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1199	3	4-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1200	3	4-iPr-苯基	2-呋喃基
1201	3	3-吗啉代-苯基	乙基
1202	3	3-吗啉代-苯基	正丙基
1203	3	3-吗啉代-苯基	异丙基
1204	3	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1205	3	3-吗啉代-苯基	CF_3
1206	3	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1207	3	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1208	3	3-吗啉代-苯基	环丙基
1209	3	3-吗啉代-苯基	环丁基
1210	3	3-吗啉代-苯基	环戊基
1211	3	3-吗啉代-苯基	环己基
1212	3	3-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1213	3	3-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1214	3	3-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1215	3	3-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1216	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	乙基
1217	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	正丙基
1218	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	异丙基
1219	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1220	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	CF_3
1221	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1222	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1223	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丙基
1224	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丁基
1225	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环戊基
1226	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环己基
1227	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1228	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1229	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基

[3395]

1230	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1231	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	乙基
1232	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	正丙基
1233	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	异丙基
1234	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1235	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	CF_3
1236	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1237	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1238	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丙基
1239	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丁基
1240	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环戊基
1241	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环己基
1242	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1243	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1244	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1245	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1246	3	2-CH_3-苯基	乙基
1247	3	2-CH_3-苯基	正丙基
1248	3	2-CH_3-苯基	异丙基
1249	3	2-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1250	3	2-CH_3-苯基	CF_3
1251	3	2-CH_3-苯基	$-CH_2CF_3$
1252	3	2-CH_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1253	3	2-CH_3-苯基	环丙基
1254	3	2-CH_3-苯基	环丁基
1255	3	2-CH_3-苯基	环戊基
1256	3	2-CH_3-苯基	环己基
1257	3	2-CH_3-苯基	3-吡啶基
1258	3	2-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1259	3	2-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1260	3	2-CH_3-苯基	2-呋喃基
1261	3	4-OH-苯基	乙基
1262	3	4-OH-苯基	正丙基
1263	3	4-OH-苯基	异丙基
1264	3	4-OH-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1265	3	4-OH-苯基	CF_3
1266	3	4-OH-苯基	$-CH_2CF_3$
1267	3	4-OH-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1268	3	4-OH-苯基	环丙基
1269	3	4-OH-苯基	环丁基

[3396]

1270	3	4-OH-苯基	环戊基
1271	3	4-OH-苯基	环己基
1272	3	4-OH-苯基	3-吡啶基
1273	3	4-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1274	3	4-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1275	3	4-OH-苯基	2-呋喃基
1276	3	2-OH-苯基	乙基
1277	3	2-OH-苯基	正丙基
1278	3	2-OH-苯基	异丙基
1279	3	2-OH-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1280	3	2-OH-苯基	CF_3
1281	3	2-OH-苯基	$-CH_2CF_3$
1282	3	2-OH-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1283	3	2-OH-苯基	环丙基
1284	3	2-OH-苯基	环丁基
1285	3	2-OH-苯基	环戊基
1286	3	2-OH-苯基	环己基
1287	3	2-OH-苯基	3-吡啶基
1288	3	2-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1289	3	2-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1290	3	2-OH-苯基	2-呋喃基
1291	3	3-OMe-苯基	乙基
1292	3	3-OMe-苯基	正丙基
1293	3	3-OMe-苯基	异丙基
1294	3	3-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1295	3	3-OMe-苯基	CF_3
1296	3	3-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1297	3	3-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1298	3	3-OMe-苯基	环丙基
1299	3	3-OMe-苯基	环丁基
1300	3	3-OMe-苯基	环戊基
1301	3	3-OMe-苯基	环己基
1302	3	3-OMe-苯基	3-吡啶基
1303	3	3-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1304	3	3-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1305	3	3-OMe-苯基	2-呋喃基
1306	3	4-CN-苯基	乙基
1307	3	4-CN-苯基	正丙基
1308	3	4-CN-苯基	异丙基
1309	3	4-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3397]

1310	3	4-CN-苯基	CF_3
1311	3	4-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1312	3	4-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1313	3	4-CN-苯基	环丙基
1314	3	4-CN-苯基	环丁基
1315	3	4-CN-苯基	环戊基
1316	3	4-CN-苯基	环己基
1317	3	4-CN-苯基	3-吡啶基
1318	3	4-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1319	3	4-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1320	3	4-CN-苯基	2-呋喃基
1321	3	2-CN-苯基	乙基
1322	3	2-CN-苯基	正丙基
1323	3	2-CN-苯基	异丙基
1324	3	2-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1325	3	2-CN-苯基	CF_3
1326	3	2-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1327	3	2-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1328	3	2-CN-苯基	环丙基
1329	3	2-CN-苯基	环丁基
1330	3	2-CN-苯基	环戊基
1331	3	2-CN-苯基	环己基
1332	3	2-CN-苯基	3-吡啶基
1333	3	2-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1334	3	2-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1335	3	2-CN-苯基	2-呋喃基
1336	3	3-F-苯基	乙基
1337	3	3-F-苯基	正丙基
1338	3	3-F-苯基	异丙基
1339	3	3-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1340	3	3-F-苯基	CF_3
1341	3	3-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1342	3	3-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1343	3	3-F-苯基	环丙基
1344	3	3-F-苯基	环丁基
1345	3	3-F-苯基	环戊基
1346	3	3-F-苯基	环己基
1347	3	3-F-苯基	3-吡啶基
1348	3	3-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1349	3	3-F-苯基	1H-咪唑-4-基

[3398]

1350	3	3-F-苯基	2-呋喃基
1351	3	2-Cl-苯基	乙基
1352	3	2-Cl-苯基	正丙基
1353	3	2-Cl-苯基	异丙基
1354	3	2-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1355	3	2-Cl-苯基	CF_3
1356	3	2-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1357	3	2-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1358	3	2-Cl-苯基	环丙基
1359	3	2-Cl-苯基	环丁基
1360	3	2-Cl-苯基	环戊基
1361	3	2-Cl-苯基	环己基
1362	3	2-Cl-苯基	3-吡啶基
1363	3	2-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1364	3	2-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1365	3	2-Cl-苯基	2-呋喃基
1366	3	4-Cl-苯基	乙基
1367	3	4-Cl-苯基	正丙基
1368	3	4-Cl-苯基	异丙基
1369	3	4-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1370	3	4-Cl-苯基	CF_3
1371	3	4-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1372	3	4-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1373	3	4-Cl-苯基	环丙基
1374	3	4-Cl-苯基	环丁基
1375	3	4-Cl-苯基	环戊基
1376	3	4-Cl-苯基	环己基
1377	3	4-Cl-苯基	3-吡啶基
1378	3	4-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1379	3	4-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1380	3	4-Cl-苯基	2-呋喃基
1381	3	3-Br-苯基	乙基
1382	3	3-Br-苯基	正丙基
1383	3	3-Br-苯基	异丙基
1384	3	3-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1385	3	3-Br-苯基	CF_3
1386	3	3-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1387	3	3-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1388	3	3-Br-苯基	环丙基
1389	3	3-Br-苯基	环丁基

[3399]

1390	3	3-Br-苯基	环戊基
1391	3	3-Br-苯基	环己基
1392	3	3-Br-苯基	3-吡啶基
1393	3	3-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1394	3	3-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1395	3	3-Br-苯基	2-呋喃基
1396	3	2-CF_3-苯基	乙基
1397	3	2-CF_3-苯基	正丙基
1398	3	2-CF_3-苯基	异丙基
1399	3	2-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1400	3	2-CF_3-苯基	CF_3
1401	3	2-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
1402	3	2-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1403	3	2-CF_3-苯基	环丙基
1404	3	2-CF_3-苯基	环丁基
1405	3	2-CF_3-苯基	环戊基
1406	3	2-CF_3-苯基	环己基
1407	3	2-CF_3-苯基	3-吡啶基
1408	3	2-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1409	3	2-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1410	3	2-CF_3-苯基	2-呋喃基
1411	3	4-CF_3-苯基	乙基
1412	3	4-CF_3-苯基	正丙基
1413	3	4-CF_3-苯基	异丙基
1414	3	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1415	3	4-CF_3-苯基	CF_3
1416	3	4-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
1417	3	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1418	3	4-CF_3-苯基	环丙基
1419	3	4-CF_3-苯基	环丁基
1420	3	4-CF_3-苯基	环戊基
1421	3	4-CF_3-苯基	环己基
1422	3	4-CF_3-苯基	3-吡啶基
1423	3	4-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1424	3	4-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1425	3	4-CF_3-苯基	2-呋喃基
1426	3	3-iPr-苯基	乙基
1427	3	3-iPr-苯基	正丙基
1428	3	3-iPr-苯基	异丙基
1429	3	3-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$

	1430	3	3-iPr-苯基	CF_3
	1431	3	3-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
	1432	3	3-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
	1433	3	3-iPr-苯基	环丙基
	1434	3	3-iPr-苯基	环丁基
	1435	3	3-iPr-苯基	环戊基
	1436	3	3-iPr-苯基	环己基
	1437	3	3-iPr-苯基	3-吡啶基
	1438	3	3-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	1439	3	3-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
	1440	3	3-iPr-苯基	2-呋喃基
	1441	3	2-吗啉代-苯基	乙基
	1442	3	2-吗啉代-苯基	正丙基
	1443	3	2-吗啉代-苯基	异丙基
	1444	3	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	1445	3	2-吗啉代-苯基	CF_3
	1446	3	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
	1447	3	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
	1448	3	2-吗啉代-苯基	环丙基
[3400]	1449	3	2-吗啉代-苯基	环丁基
	1450	3	2-吗啉代-苯基	环戊基
	1451	3	2-吗啉代-苯基	环己基
	1452	3	2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
	1453	3	2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	1454	3	2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
	1455	3	2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
	1456	3	4-吗啉代-苯基	乙基
	1457	3	4-吗啉代-苯基	正丙基
	1458	3	4-吗啉代-苯基	异丙基
	1459	3	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	1460	3	4-吗啉代-苯基	CF_3
	1461	3	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
	1462	3	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
	1463	3	4-吗啉代-苯基	环丙基
	1464	3	4-吗啉代-苯基	环丁基
	1465	3	4-吗啉代-苯基	环戊基
	1466	3	4-吗啉代-苯基	环己基
	1467	3	4-吗啉代-苯基	3-吡啶基
	1468	3	4-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	1469	3	4-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基

[3401]

1470	3	4-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1471	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	乙基
1472	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	正丙基
1473	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	异丙基
1474	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1475	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	CF_3
1476	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1477	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1478	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丙基
1479	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丁基
1480	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环戊基
1481	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环己基
1482	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1483	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1484	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1485	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1486	4	4-CH_3-苯基	乙基
1487	4	4-CH_3-苯基	正丙基
1488	4	4-CH_3-苯基	异丙基
1489	4	4-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1490	4	4-CH_3-苯基	CF_3
1491	4	4-CH_3-苯基	$-CH_2CF_3$
1492	4	4-CH_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1493	4	4-CH_3-苯基	环丙基
1494	4	4-CH_3-苯基	环丁基
1495	4	4-CH_3-苯基	环戊基
1496	4	4-CH_3-苯基	环己基
1497	4	4-CH_3-苯基	3-吡啶基
1498	4	4-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1499	4	4-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1500	4	4-CH_3-苯基	2-呋喃基
1501	4	3-CH_3-苯基	乙基
1502	4	3-CH_3-苯基	正丙基
1503	4	3-CH_3-苯基	异丙基
1504	4	3-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1505	4	3-CH_3-苯基	CF_3
1506	4	3-CH_3-苯基	$-CH_2CF_3$
1507	4	3-CH_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1508	4	3-CH_3-苯基	环丙基
1509	4	3-CH_3-苯基	环丁基

[3402]

1510	4	3-CH_3-苯基	环戊基
1511	4	3-CH_3-苯基	环己基
1512	4	3-CH_3-苯基	3-吡啶基
1513	4	3-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1514	4	3-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1515	4	3-CH_3-苯基	2-呋喃基
1516	4	3-OH-苯基	乙基
1517	4	3-OH-苯基	正丙基
1518	4	3-OH-苯基	异丙基
1519	4	3-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1520	4	3-OH-苯基	CF_3
1521	4	3-OH-苯基	-CH_2CF_3
1522	4	3-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1523	4	3-OH-苯基	环丙基
1524	4	3-OH-苯基	环丁基
1525	4	3-OH-苯基	环戊基
1526	4	3-OH-苯基	环己基
1527	4	3-OH-苯基	3-吡啶基
1528	4	3-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1529	4	3-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1530	4	3-OH-苯基	2-呋喃基
1531	4	4-OMe-苯基	乙基
1532	4	4-OMe-苯基	正丙基
1533	4	4-OMe-苯基	异丙基
1534	4	4-OMe-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1535	4	4-OMe-苯基	CF_3
1536	4	4-OMe-苯基	-CH_2CF_3
1537	4	4-OMe-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1538	4	4-OMe-苯基	环丙基
1539	4	4-OMe-苯基	环丁基
1540	4	4-OMe-苯基	环戊基
1541	4	4-OMe-苯基	环己基
1542	4	4-OMe-苯基	3-吡啶基
1543	4	4-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1544	4	4-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1545	4	4-OMe-苯基	2-呋喃基
1546	4	2-OMe-苯基	乙基
1547	4	2-OMe-苯基	正丙基
1548	4	2-OMe-苯基	异丙基
1549	4	2-OMe-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$

[3403]

1550	4	2-OMe-苯基	CF_3
1551	4	2-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1552	4	2-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1553	4	2-OMe-苯基	环丙基
1554	4	2-OMe-苯基	环丁基
1555	4	2-OMe-苯基	环戊基
1556	4	2-OMe-苯基	环己基
1557	4	2-OMe-苯基	3-吡啶基
1558	4	2-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1559	4	2-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1560	4	2-OMe-苯基	2-呋喃基
1561	4	3-CN-苯基	乙基
1562	4	3-CN-苯基	正丙基
1563	4	3-CN-苯基	异丙基
1564	4	3-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1565	4	3-CN-苯基	CF_3
1566	4	3-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1567	4	3-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1568	4	3-CN-苯基	环丙基
1569	4	3-CN-苯基	环丁基
1570	4	3-CN-苯基	环戊基
1571	4	3-CN-苯基	环己基
1572	4	3-CN-苯基	3-吡啶基
1573	4	3-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1574	4	3-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1575	4	3-CN-苯基	2-呋喃基
1576	4	2-F-苯基	乙基
1577	4	2-F-苯基	正丙基
1578	4	2-F-苯基	异丙基
1579	4	2-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1580	4	2-F-苯基	CF_3
1581	4	2-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1582	4	2-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1583	4	2-F-苯基	环丙基
1584	4	2-F-苯基	环丁基
1585	4	2-F-苯基	环戊基
1586	4	2-F-苯基	环己基
1587	4	2-F-苯基	3-吡啶基
1588	4	2-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1589	4	2-F-苯基	1H-咪唑-4-基

[3404]

1590	4	2-F-苯基	2-呋喃基
1591	4	4-F-苯基	乙基
1592	4	4-F-苯基	正丙基
1593	4	4-F-苯基	异丙基
1594	4	4-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1595	4	4-F-苯基	CF_3
1596	4	4-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1597	4	4-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1598	4	4-F-苯基	环丙基
1599	4	4-F-苯基	环丁基
1600	4	4-F-苯基	环戊基
1601	4	4-F-苯基	环己基
1602	4	4-F-苯基	3-吡啶基
1603	4	4-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1604	4	4-F-苯基	1H-咪唑-4-基
1605	4	4-F-苯基	2-呋喃基
1606	4	3-Cl-苯基	乙基
1607	4	3-Cl-苯基	正丙基
1608	4	3-Cl-苯基	异丙基
1609	4	3-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1610	4	3-Cl-苯基	CF_3
1611	4	3-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1612	4	3-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1613	4	3-Cl-苯基	环丙基
1614	4	3-Cl-苯基	环丁基
1615	4	3-Cl-苯基	环戊基
1616	4	3-Cl-苯基	环己基
1617	4	3-Cl-苯基	3-吡啶基
1618	4	3-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1619	4	3-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1620	4	3-Cl-苯基	2-呋喃基
1621	4	2-Br-苯基	乙基
1622	4	2-Br-苯基	正丙基
1623	4	2-Br-苯基	异丙基
1624	4	2-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1625	4	2-Br-苯基	CF_3
1626	4	2-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1627	4	2-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1628	4	2-Br-苯基	环丙基
1629	4	2-Br-苯基	环丁基

[3405]

1630	4	2-Br-苯基	环戊基
1631	4	2-Br-苯基	环己基
1632	4	2-Br-苯基	3-吡啶基
1633	4	2-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1634	4	2-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1635	4	2-Br-苯基	2-呋喃基
1636	4	4-Br-苯基	乙基
1637	4	4-Br-苯基	正丙基
1638	4	4-Br-苯基	异丙基
1639	4	4-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1640	4	4-Br-苯基	CF_3
1641	4	4-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1642	4	4-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1643	4	4-Br-苯基	环丙基
1644	4	4-Br-苯基	环丁基
1645	4	4-Br-苯基	环戊基
1646	4	4-Br-苯基	环己基
1647	4	4-Br-苯基	3-吡啶基
1648	4	4-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1649	4	4-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1650	4	4-Br-苯基	2-呋喃基
1651	4	3-CF_3-苯基	乙基
1652	4	3-CF_3-苯基	正丙基
1653	4	3-CF_3-苯基	异丙基
1654	4	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1655	4	3-CF_3-苯基	CF_3
1656	4	3-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
1657	4	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1658	4	3-CF_3-苯基	环丙基
1659	4	3-CF_3-苯基	环丁基
1660	4	3-CF_3-苯基	环戊基
1661	4	3-CF_3-苯基	环己基
1662	4	3-CF_3-苯基	3-吡啶基
1663	4	3-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1664	4	3-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1665	4	3-CF_3-苯基	2-呋喃基
1666	4	2-iPr-苯基	乙基
1667	4	2-iPr-苯基	正丙基
1668	4	2-iPr-苯基	异丙基
1669	4	2-iPr-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3406]

1670	4	2-iPr-苯基	CF_3
1671	4	2-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
1672	4	2-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1673	4	2-iPr-苯基	环丙基
1674	4	2-iPr-苯基	环丁基
1675	4	2-iPr-苯基	环戊基
1676	4	2-iPr-苯基	环己基
1677	4	2-iPr-苯基	3-吡啶基
1678	4	2-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1679	4	2-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1680	4	2-iPr-苯基	2-呋喃基
1681	4	4-iPr-苯基	乙基
1682	4	4-iPr-苯基	正丙基
1683	4	4-iPr-苯基	异丙基
1684	4	4-iPr-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1685	4	4-iPr-苯基	CF_3
1686	4	4-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
1687	4	4-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1688	4	4-iPr-苯基	环丙基
1689	4	4-iPr-苯基	环丁基
1690	4	4-iPr-苯基	环戊基
1691	4	4-iPr-苯基	环己基
1692	4	4-iPr-苯基	3-吡啶基
1693	4	4-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1694	4	4-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1695	4	4-iPr-苯基	2-呋喃基
1696	4	3-吗啉代-苯基	乙基
1697	4	3-吗啉代-苯基	正丙基
1698	4	3-吗啉代-苯基	异丙基
1699	4	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1700	4	3-吗啉代-苯基	CF_3
1701	4	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1702	4	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1703	4	3-吗啉代-苯基	环丙基
1704	4	3-吗啉代-苯基	环丁基
1705	4	3-吗啉代-苯基	环戊基
1706	4	3-吗啉代-苯基	环己基
1707	4	3-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1708	4	3-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1709	4	3-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基

[3407]

1710	4	3-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1711	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	乙基
1712	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	正丙基
1713	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	异丙基
1714	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1715	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	CF_3
1716	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1717	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1718	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丙基
1719	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丁基
1720	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环戊基
1721	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环己基
1722	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1723	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1724	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1725	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1726	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	乙基
1727	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	正丙基
1728	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	异丙基
1729	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1730	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	CF_3
1731	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1732	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1733	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丙基
1734	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丁基
1735	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环戊基
1736	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环己基
1737	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1738	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1739	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1740	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1741	4	$2-CH_3$-苯基	乙基
1742	4	$2-CH_3$-苯基	正丙基
1743	4	$2-CH_3$-苯基	异丙基
1744	4	$2-CH_3$-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1745	4	$2-CH_3$-苯基	CF_3
1746	4	$2-CH_3$-苯基	$-CH_2CF_3$
1747	4	$2-CH_3$-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1748	4	$2-CH_3$-苯基	环丙基
1749	4	$2-CH_3$-苯基	环丁基

[3408]

1750	4	2-CH_3-苯基	环戊基
1751	4	2-CH_3-苯基	环己基
1752	4	2-CH_3-苯基	3-吡啶基
1753	4	2-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1754	4	2-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1755	4	2-CH_3-苯基	2-呋喃基
1756	4	4-OH-苯基	乙基
1757	4	4-OH-苯基	正丙基
1758	4	4-OH-苯基	异丙基
1759	4	4-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1760	4	4-OH-苯基	CF_3
1761	4	4-OH-苯基	-CH_2CF_3
1762	4	4-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1763	4	4-OH-苯基	环丙基
1764	4	4-OH-苯基	环丁基
1765	4	4-OH-苯基	环戊基
1766	4	4-OH-苯基	环己基
1767	4	4-OH-苯基	3-吡啶基
1768	4	4-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1769	4	4-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1770	4	4-OH-苯基	2-呋喃基
1771	4	2-OH-苯基	乙基
1772	4	2-OH-苯基	正丙基
1773	4	2-OH-苯基	异丙基
1774	4	2-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1775	4	2-OH-苯基	CF_3
1776	4	2-OH-苯基	-CH_2CF_3
1777	4	2-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1778	4	2-OH-苯基	环丙基
1779	4	2-OH-苯基	环丁基
1780	4	2-OH-苯基	环戊基
1781	4	2-OH-苯基	环己基
1782	4	2-OH-苯基	3-吡啶基
1783	4	2-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1784	4	2-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1785	4	2-OH-苯基	2-呋喃基
1786	4	3-OMe-苯基	乙基
1787	4	3-OMe-苯基	正丙基
1788	4	3-OMe-苯基	异丙基
1789	4	3-OMe-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$

[3409]

1790	4	3-OMe-苯基	CF_3
1791	4	3-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1792	4	3-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1793	4	3-OMe-苯基	环丙基
1794	4	3-OMe-苯基	环丁基
1795	4	3-OMe-苯基	环戊基
1796	4	3-OMe-苯基	环己基
1797	4	3-OMe-苯基	3-吡啶基
1798	4	3-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1799	4	3-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1800	4	3-OMe-苯基	2-呋喃基
1801	4	4-CN-苯基	乙基
1802	4	4-CN-苯基	正丙基
1803	4	4-CN-苯基	异丙基
1804	4	4-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1805	4	4-CN-苯基	CF_3
1806	4	4-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1807	4	4-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1808	4	4-CN-苯基	环丙基
1809	4	4-CN-苯基	环丁基
1810	4	4-CN-苯基	环戊基
1811	4	4-CN-苯基	环己基
1812	4	4-CN-苯基	3-吡啶基
1813	4	4-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1814	4	4-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1815	4	4-CN-苯基	2-呋喃基
1816	4	2-CN-苯基	乙基
1817	4	2-CN-苯基	正丙基
1818	4	2-CN-苯基	异丙基
1819	4	2-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1820	4	2-CN-苯基	CF_3
1821	4	2-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1822	4	2-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1823	4	2-CN-苯基	环丙基
1824	4	2-CN-苯基	环丁基
1825	4	2-CN-苯基	环戊基
1826	4	2-CN-苯基	环己基
1827	4	2-CN-苯基	3-吡啶基
1828	4	2-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1829	4	2-CN-苯基	1H-咪唑-4-基

[3410]

1830	4	2-CN-苯基	2-呋喃基
1831	4	3-F-苯基	乙基
1832	4	3-F-苯基	正丙基
1833	4	3-F-苯基	异丙基
1834	4	3-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1835	4	3-F-苯基	CF_3
1836	4	3-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1837	4	3-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1838	4	3-F-苯基	环丙基
1839	4	3-F-苯基	环丁基
1840	4	3-F-苯基	环戊基
1841	4	3-F-苯基	环己基
1842	4	3-F-苯基	3-吡啶基
1843	4	3-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1844	4	3-F-苯基	1H-咪唑-4-基
1845	4	3-F-苯基	2-呋喃基
1846	4	2-Cl-苯基	乙基
1847	4	2-Cl-苯基	正丙基
1848	4	2-Cl-苯基	异丙基
1849	4	2-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1850	4	2-Cl-苯基	CF_3
1851	4	2-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1852	4	2-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1853	4	2-Cl-苯基	环丙基
1854	4	2-Cl-苯基	环丁基
1855	4	2-Cl-苯基	环戊基
1856	4	2-Cl-苯基	环己基
1857	4	2-Cl-苯基	3-吡啶基
1858	4	2-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1859	4	2-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1860	4	2-Cl-苯基	2-呋喃基
1861	4	4-Cl-苯基	乙基
1862	4	4-Cl-苯基	正丙基
1863	4	4-Cl-苯基	异丙基
1864	4	4-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1865	4	4-Cl-苯基	CF_3
1866	4	4-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1867	4	4-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1868	4	4-Cl-苯基	环丙基
1869	4	4-Cl-苯基	环丁基

	1870	4	4-Cl-苯基	环戊基
	1871	4	4-Cl-苯基	环己基
	1872	4	4-Cl-苯基	3-吡啶基
	1873	4	4-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	1874	4	4-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
	1875	4	4-Cl-苯基	2-呋喃基
	1876	4	3-Br-苯基	乙基
	1877	4	3-Br-苯基	正丙基
	1878	4	3-Br-苯基	异丙基
	1879	4	3-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	1880	4	3-Br-苯基	CF_3
	1881	4	3-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
	1882	4	3-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
	1883	4	3-Br-苯基	环丙基
	1884	4	3-Br-苯基	环丁基
	1885	4	3-Br-苯基	环戊基
	1886	4	3-Br-苯基	环己基
	1887	4	3-Br-苯基	3-吡啶基
	1888	4	3-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	1889	4	3-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
[3411]	1890	4	3-Br-苯基	2-呋喃基
	1891	4	2-CF_3-苯基	乙基
	1892	4	2-CF_3-苯基	正丙基
	1893	4	2-CF_3-苯基	异丙基
	1894	4	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	1895	4	2-CF_3-苯基	CF_3
	1896	4	2-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
	1897	4	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
	1898	4	2-CF_3-苯基	环丙基
	1899	4	2-CF_3-苯基	环丁基
	1900	4	2-CF_3-苯基	环戊基
	1901	4	2-CF_3-苯基	环己基
	1902	4	2-CF_3-苯基	3-吡啶基
	1903	4	2-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	1904	4	2-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
	1905	4	2-CF_3-苯基	2-呋喃基
	1906	4	4-CF_3-苯基	乙基
	1907	4	4-CF_3-苯基	正丙基
	1908	4	4-CF_3-苯基	异丙基
	1909	4	4-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3412]

1910	4	4-CF_3-苯基	CF_3
1911	4	4-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
1912	4	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1913	4	4-CF_3-苯基	环丙基
1914	4	4-CF_3-苯基	环丁基
1915	4	4-CF_3-苯基	环戊基
1916	4	4-CF_3-苯基	环己基
1917	4	4-CF_3-苯基	3-吡啶基
1918	4	4-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1919	4	4-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1920	4	4-CF_3-苯基	2-呋喃基
1921	4	3-iPr-苯基	乙基
1922	4	3-iPr-苯基	正丙基
1923	4	3-iPr-苯基	异丙基
1924	4	3-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1925	4	3-iPr-苯基	CF_3
1926	4	3-iPr-苯基	-CH_2CF_3
1927	4	3-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1928	4	3-iPr-苯基	环丙基
1929	4	3-iPr-苯基	环丁基
1930	4	3-iPr-苯基	环戊基
1931	4	3-iPr-苯基	环己基
1932	4	3-iPr-苯基	3-吡啶基
1933	4	3-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1934	4	3-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1935	4	3-iPr-苯基	2-呋喃基
1936	4	2-吗啉代-苯基	乙基
1937	4	2-吗啉代-苯基	正丙基
1938	4	2-吗啉代-苯基	异丙基
1939	4	2-吗啉代-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1940	4	2-吗啉代-苯基	CF_3
1941	4	2-吗啉代-苯基	-CH_2CF_3
1942	4	2-吗啉代-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1943	4	2-吗啉代-苯基	环丙基
1944	4	2-吗啉代-苯基	环丁基
1945	4	2-吗啉代-苯基	环戊基
1946	4	2-吗啉代-苯基	环己基
1947	4	2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1948	4	2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1949	4	2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基

	1950	4	2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
	1951	4	4-吗啉代-苯基	乙基
	1952	4	4-吗啉代-苯基	正丙基
	1953	4	4-吗啉代-苯基	异丙基
	1954	4	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	1955	4	4-吗啉代-苯基	CF_3
	1956	4	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
	1957	4	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
	1958	4	4-吗啉代-苯基	环丙基
	1959	4	4-吗啉代-苯基	环丁基
	1960	4	4-吗啉代-苯基	环戊基
	1961	4	4-吗啉代-苯基	环己基
	1962	4	4-吗啉代-苯基	3-吡啶基
	1963	4	4-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	1964	4	4-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
	1965	4	4-吗啉代-苯基	2-呋喃基
	1966	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	乙基
	1967	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	正丙基
	1968	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	异丙基
	1969	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
[3413]	1970	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	CF_3
	1971	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
	1972	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
	1973	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丙基
	1974	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丁基
	1975	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环戊基
	1976	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环己基
	1977	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
	1978	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	1979	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
	1980	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
	1981	1	亚萘-1-基	乙基
	1982	1	亚萘-1-基	正丙基
	1983	1	亚萘-1-基	异丙基
	1984	1	亚萘-1-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	1985	1	亚萘-1-基	CF_3
	1986	1	亚萘-1-基	$-CH_2CF_3$
	1987	1	亚萘-1-基	$-CH_2CH_2CF_3$
	1988	1	亚萘-1-基	环丙基
	1989	1	亚萘-1-基	环丁基
	1990	1	亚萘-1-基	环戊基

	1991	1	亚萘-1-基	环己基
	1992	1	亚萘-1-基	3-吡啶基
	1993	1	亚萘-1-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	1994	1	亚萘-1-基	1H-咪唑-4-基
	1995	1	亚萘-1-基	2-呋喃基
	1996	1	亚萘-2-基	乙基
	1997	1	亚萘-2-基	正丙基
	1998	1	亚萘-2-基	异丙基
	1999	1	亚萘-2-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	2000	1	亚萘-2-基	CF_3
	2001	1	亚萘-2-基	$-CH_2CF_3$
	2002	1	亚萘-2-基	$-CH_2CH_2CF_3$
	2003	1	亚萘-2-基	环丙基
	2004	1	亚萘-2-基	环丁基
	2005	1	亚萘-2-基	环戊基
	2006	1	亚萘-2-基	环己基
	2007	1	亚萘-2-基	3-吡啶基
	2008	1	亚萘-2-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	2009	1	亚萘-2-基	1H-咪唑-4-基
	2010	1	亚萘-2-基	2-呋喃基
[3414]	2011	2	亚萘-1-基	乙基
	2012	2	亚萘-1-基	正丙基
	2013	2	亚萘-1-基	异丙基
	2014	2	亚萘-1-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	2015	2	亚萘-1-基	CF_3
	2016	2	亚萘-1-基	$-CH_2CF_3$
	2017	2	亚萘-1-基	$-CH_2CH_2CF_3$
	2018	2	亚萘-1-基	环丙基
	2019	2	亚萘-1-基	环丁基
	2020	2	亚萘-1-基	环戊基
	2021	2	亚萘-1-基	环己基
	2022	2	亚萘-1-基	3-吡啶基
	2023	2	亚萘-1-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	2024	2	亚萘-1-基	1H-咪唑-4-基
	2025	2	亚萘-1-基	2-呋喃基
	2026	2	亚萘-2-基	乙基
	2027	2	亚萘-2-基	正丙基
	2028	2	亚萘-2-基	异丙基
	2029	2	亚萘-2-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	2030	2	亚萘-2-基	CF_3
	2031	2	亚萘-2-基	$-CH_2CF_3$

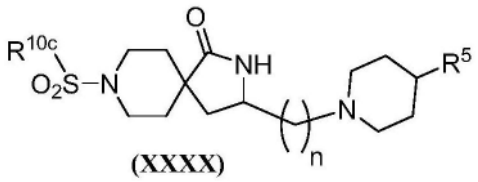
	2032	2	亚萘-2-基	$-CH_2CH_2CF_3$
	2033	2	亚萘-2-基	环丙基
	2034	2	亚萘-2-基	环丁基
	2035	2	亚萘-2-基	环戊基
	2036	2	亚萘-2-基	环己基
	2037	2	亚萘-2-基	3-吡啶基
	2038	2	亚萘-2-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	2039	2	亚萘-2-基	1H-咪唑-4-基
	2040	2	亚萘-2-基	2-呋喃基
	2041	3	亚萘-1-基	乙基
	2042	3	亚萘-1-基	正丙基
	2043	3	亚萘-1-基	异丙基
	2044	3	亚萘-1-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	2045	3	亚萘-1-基	CF_3
	2046	3	亚萘-1-基	$-CH_2CF_3$
	2047	3	亚萘-1-基	$-CH_2CH_2CF_3$
	2048	3	亚萘-1-基	环丙基
	2049	3	亚萘-1-基	环丁基
	2050	3	亚萘-1-基	环戊基
	2051	3	亚萘-1-基	环己基
[3415]	2052	3	亚萘-1-基	3-吡啶基
	2053	3	亚萘-1-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	2054	3	亚萘-1-基	1H-咪唑-4-基
	2055	3	亚萘-1-基	2-呋喃基
	2056	3	亚萘-2-基	乙基
	2057	3	亚萘-2-基	正丙基
	2058	3	亚萘-2-基	异丙基
	2059	3	亚萘-2-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	2060	3	亚萘-2-基	CF_3
	2061	3	亚萘-2-基	$-CH_2CF_3$
	2062	3	亚萘-2-基	$-CH_2CH_2CF_3$
	2063	3	亚萘-2-基	环丙基
	2064	3	亚萘-2-基	环丁基
	2065	3	亚萘-2-基	环戊基
	2066	3	亚萘-2-基	环己基
	2067	3	亚萘-2-基	3-吡啶基
	2068	3	亚萘-2-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	2069	3	亚萘-2-基	1H-咪唑-4-基
	2070	3	亚萘-2-基	2-呋喃基
	2071	4	亚萘-1-基	乙基
	2072	4	亚萘-1-基	正丙基

2073	4	亚萘-1-基	异丙基
2074	4	亚萘-1-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
2075	4	亚萘-1-基	CF_3
2076	4	亚萘-1-基	$-CH_2CF_3$
2077	4	亚萘-1-基	$-CH_2CH_2CF_3$
2078	4	亚萘-1-基	环丙基
2079	4	亚萘-1-基	环丁基
2080	4	亚萘-1-基	环戊基
2081	4	亚萘-1-基	环己基
2082	4	亚萘-1-基	3-吡啶基
2083	4	亚萘-1-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
2084	4	亚萘-1-基	1H-咪唑-4-基
2085	4	亚萘-1-基	2-呋喃基
2086	4	亚萘-2-基	乙基
2087	4	亚萘-2-基	正丙基
2088	4	亚萘-2-基	异丙基
2089	4	亚萘-2-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
2090	4	亚萘-2-基	CF_3
2091	4	亚萘-2-基	$-CH_2CF_3$
2092	4	亚萘-2-基	$-CH_2CH_2CF_3$
2093	4	亚萘-2-基	环丙基
2094	4	亚萘-2-基	环丁基
2095	4	亚萘-2-基	环戊基
2096	4	亚萘-2-基	环己基
2097	4	亚萘-2-基	3-吡啶基
2098	4	亚萘-2-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
2099	4	亚萘-2-基	1H-咪唑-4-基
2100	4	亚萘-2-基	2-呋喃基

[3416]

[3417] 示例性实施方案包括具有式(XXXX)的化合物

[3418]



(XXXX)

[3419] 或其可药用盐形式,如在下文表33中所定义。

[3420] 表33:

[3421]

条目	n	R^5	R^{10c}
1	1	4-CH_3-苯基	乙基
2	1	4-CH_3-苯基	正丙基
3	1	4-CH_3-苯基	异丙基
4	1	4-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3422]

5	1	4-CH_3-苯基	CF_3
6	1	4-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
7	1	4-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
8	1	4-CH_3-苯基	环丙基
9	1	4-CH_3-苯基	环丁基
10	1	4-CH_3-苯基	环戊基
11	1	4-CH_3-苯基	环己基
12	1	4-CH_3-苯基	3-吡啶基
13	1	4-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
14	1	4-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
15	1	4-CH_3-苯基	2-呋喃基
16	1	3-CH_3-苯基	乙基
17	1	3-CH_3-苯基	正丙基
18	1	3-CH_3-苯基	异丙基
19	1	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
20	1	3-CH_3-苯基	CF_3
21	1	3-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
22	1	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
23	1	3-CH_3-苯基	环丙基
24	1	3-CH_3-苯基	环丁基
25	1	3-CH_3-苯基	环戊基
26	1	3-CH_3-苯基	环己基
27	1	3-CH_3-苯基	3-吡啶基
28	1	3-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
29	1	3-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
30	1	3-CH_3-苯基	2-呋喃基
31	1	3-OH-苯基	乙基
32	1	3-OH-苯基	正丙基
33	1	3-OH-苯基	异丙基
34	1	3-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
35	1	3-OH-苯基	CF_3
36	1	3-OH-苯基	-CH_2CF_3
37	1	3-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
38	1	3-OH-苯基	环丙基
39	1	3-OH-苯基	环丁基
40	1	3-OH-苯基	环戊基
41	1	3-OH-苯基	环己基
42	1	3-OH-苯基	3-吡啶基
43	1	3-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
44	1	3-OH-苯基	1H-咪唑-4-基

[3423]

45	1	3-OH-苯基	2-呋喃基
46	1	4-OMe-苯基	乙基
47	1	4-OMe-苯基	正丙基
48	1	4-OMe-苯基	异丙基
49	1	4-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
50	1	4-OMe-苯基	CF_3
51	1	4-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
52	1	4-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
53	1	4-OMe-苯基	环丙基
54	1	4-OMe-苯基	环丁基
55	1	4-OMe-苯基	环戊基
56	1	4-OMe-苯基	环己基
57	1	4-OMe-苯基	3-吡啶基
58	1	4-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
59	1	4-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
60	1	4-OMe-苯基	2-呋喃基
61	1	2-OMe-苯基	乙基
62	1	2-OMe-苯基	正丙基
63	1	2-OMe-苯基	异丙基
64	1	2-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
65	1	2-OMe-苯基	CF_3
66	1	2-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
67	1	2-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
68	1	2-OMe-苯基	环丙基
69	1	2-OMe-苯基	环丁基
70	1	2-OMe-苯基	环戊基
71	1	2-OMe-苯基	环己基
72	1	2-OMe-苯基	3-吡啶基
73	1	2-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
74	1	2-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
75	1	2-OMe-苯基	2-呋喃基
76	1	3-CN-苯基	乙基
77	1	3-CN-苯基	正丙基
78	1	3-CN-苯基	异丙基
79	1	3-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
80	1	3-CN-苯基	CF_3
81	1	3-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
82	1	3-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
83	1	3-CN-苯基	环丙基
84	1	3-CN-苯基	环丁基

[3424]

85	1	3-CN-苯基	环戊基
86	1	3-CN-苯基	环己基
87	1	3-CN-苯基	3-吡啶基
88	1	3-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
89	1	3-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
90	1	3-CN-苯基	2-呋喃基
91	1	2-F-苯基	乙基
92	1	2-F-苯基	正丙基
93	1	2-F-苯基	异丙基
94	1	2-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
95	1	2-F-苯基	CF_3
96	1	2-F-苯基	$-CH_2CF_3$
97	1	2-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
98	1	2-F-苯基	环丙基
99	1	2-F-苯基	环丁基
100	1	2-F-苯基	环戊基
101	1	2-F-苯基	环己基
102	1	2-F-苯基	3-吡啶基
103	1	2-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
104	1	2-F-苯基	1H-咪唑-4-基
105	1	2-F-苯基	2-呋喃基
106	1	4-F-苯基	乙基
107	1	4-F-苯基	正丙基
108	1	4-F-苯基	异丙基
109	1	4-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
110	1	4-F-苯基	CF_3
111	1	4-F-苯基	$-CH_2CF_3$
112	1	4-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
113	1	4-F-苯基	环丙基
114	1	4-F-苯基	环丁基
115	1	4-F-苯基	环戊基
116	1	4-F-苯基	环己基
117	1	4-F-苯基	3-吡啶基
118	1	4-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
119	1	4-F-苯基	1H-咪唑-4-基
120	1	4-F-苯基	2-呋喃基
121	1	3-Cl-苯基	乙基
122	1	3-Cl-苯基	正丙基
123	1	3-Cl-苯基	异丙基
124	1	3-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3425]

125	1	3-Cl-苯基	CF_3
126	1	3-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
127	1	3-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
128	1	3-Cl-苯基	环丙基
129	1	3-Cl-苯基	环丁基
130	1	3-Cl-苯基	环戊基
131	1	3-Cl-苯基	环己基
132	1	3-Cl-苯基	3-吡啶基
133	1	3-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
134	1	3-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
135	1	3-Cl-苯基	2-呋喃基
136	1	2-Br-苯基	乙基
137	1	2-Br-苯基	正丙基
138	1	2-Br-苯基	异丙基
139	1	2-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
140	1	2-Br-苯基	CF_3
141	1	2-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
142	1	2-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
143	1	2-Br-苯基	环丙基
144	1	2-Br-苯基	环丁基
145	1	2-Br-苯基	环戊基
146	1	2-Br-苯基	环己基
147	1	2-Br-苯基	3-吡啶基
148	1	2-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
149	1	2-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
150	1	2-Br-苯基	2-呋喃基
151	1	4-Br-苯基	乙基
152	1	4-Br-苯基	正丙基
153	1	4-Br-苯基	异丙基
154	1	4-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
155	1	4-Br-苯基	CF_3
156	1	4-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
157	1	4-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
158	1	4-Br-苯基	环丙基
159	1	4-Br-苯基	环丁基
160	1	4-Br-苯基	环戊基
161	1	4-Br-苯基	环己基
162	1	4-Br-苯基	3-吡啶基
163	1	4-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
164	1	4-Br-苯基	1H-咪唑-4-基

[3426]

165	1	4-Br-苯基	2-呋喃基
166	1	3-CF_3-苯基	乙基
167	1	3-CF_3-苯基	正丙基
168	1	3-CF_3-苯基	异丙基
169	1	3-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
170	1	3-CF_3-苯基	CF_3
171	1	3-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
172	1	3-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
173	1	3-CF_3-苯基	环丙基
174	1	3-CF_3-苯基	环丁基
175	1	3-CF_3-苯基	环戊基
176	1	3-CF_3-苯基	环己基
177	1	3-CF_3-苯基	3-吡啶基
178	1	3-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
179	1	3-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
180	1	3-CF_3-苯基	2-呋喃基
181	1	2-iPr-苯基	乙基
182	1	2-iPr-苯基	正丙基
183	1	2-iPr-苯基	异丙基
184	1	2-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
185	1	2-iPr-苯基	CF_3
186	1	2-iPr-苯基	-CH_2CF_3
187	1	2-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
188	1	2-iPr-苯基	环丙基
189	1	2-iPr-苯基	环丁基
190	1	2-iPr-苯基	环戊基
191	1	2-iPr-苯基	环己基
192	1	2-iPr-苯基	3-吡啶基
193	1	2-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
194	1	2-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
195	1	2-iPr-苯基	2-呋喃基
196	1	4-iPr-苯基	乙基
197	1	4-iPr-苯基	正丙基
198	1	4-iPr-苯基	异丙基
199	1	4-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
200	1	4-iPr-苯基	CF_3
201	1	4-iPr-苯基	-CH_2CF_3
202	1	4-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
203	1	4-iPr-苯基	环丙基
204	1	4-iPr-苯基	环丁基

[3427]

205	1	4-iPr-苯基	环戊基
206	1	4-iPr-苯基	环己基
207	1	4-iPr-苯基	3-吡啶基
208	1	4-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
209	1	4-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
210	1	4-iPr-苯基	2-呋喃基
211	1	3-吗啉代-苯基	乙基
212	1	3-吗啉代-苯基	正丙基
213	1	3-吗啉代-苯基	异丙基
214	1	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
215	1	3-吗啉代-苯基	CF_3
216	1	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
217	1	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
218	1	3-吗啉代-苯基	环丙基
219	1	3-吗啉代-苯基	环丁基
220	1	3-吗啉代-苯基	环戊基
221	1	3-吗啉代-苯基	环己基
222	1	3-吗啉代-苯基	3-吡啶基
223	1	3-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
224	1	3-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
225	1	3-吗啉代-苯基	2-呋喃基
226	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	乙基
227	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	正丙基
228	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	异丙基
229	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
230	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	CF_3
231	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
232	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
233	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丙基
234	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丁基
235	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环戊基
236	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环己基
237	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
238	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
239	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
240	1	4-氰基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
241	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	乙基
242	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	正丙基
243	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	异丙基
244	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3428]

245	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	CF_3
246	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
247	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
248	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丙基
249	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丁基
250	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环戊基
251	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环己基
252	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
253	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
254	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
255	1	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
256	1	2-CH_3-苯基	乙基
257	1	2-CH_3-苯基	正丙基
258	1	2-CH_3-苯基	异丙基
259	1	2-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
260	1	2-CH_3-苯基	CF_3
261	1	2-CH_3-苯基	$-CH_2CF_3$
262	1	2-CH_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
263	1	2-CH_3-苯基	环丙基
264	1	2-CH_3-苯基	环丁基
265	1	2-CH_3-苯基	环戊基
266	1	2-CH_3-苯基	环己基
267	1	2-CH_3-苯基	3-吡啶基
268	1	2-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
269	1	2-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
270	1	2-CH_3-苯基	2-呋喃基
271	1	4-OH-苯基	乙基
272	1	4-OH-苯基	正丙基
273	1	4-OH-苯基	异丙基
274	1	4-OH-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
275	1	4-OH-苯基	CF_3
276	1	4-OH-苯基	$-CH_2CF_3$
277	1	4-OH-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
278	1	4-OH-苯基	环丙基
279	1	4-OH-苯基	环丁基
280	1	4-OH-苯基	环戊基
281	1	4-OH-苯基	环己基
282	1	4-OH-苯基	3-吡啶基
283	1	4-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
284	1	4-OH-苯基	1H-咪唑-4-基

[3429]

285	1	4-OH-苯基	2-呋喃基
286	1	2-OH-苯基	乙基
287	1	2-OH-苯基	正丙基
288	1	2-OH-苯基	异丙基
289	1	2-OH-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
290	1	2-OH-苯基	CF_3
291	1	2-OH-苯基	$-CH_2CF_3$
292	1	2-OH-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
293	1	2-OH-苯基	环丙基
294	1	2-OH-苯基	环丁基
295	1	2-OH-苯基	环戊基
296	1	2-OH-苯基	环己基
297	1	2-OH-苯基	3-吡啶基
298	1	2-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
299	1	2-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
300	1	2-OH-苯基	2-呋喃基
301	1	3-OMe-苯基	乙基
302	1	3-OMe-苯基	正丙基
303	1	3-OMe-苯基	异丙基
304	1	3-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
305	1	3-OMe-苯基	CF_3
306	1	3-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
307	1	3-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
308	1	3-OMe-苯基	环丙基
309	1	3-OMe-苯基	环丁基
310	1	3-OMe-苯基	环戊基
311	1	3-OMe-苯基	环己基
312	1	3-OMe-苯基	3-吡啶基
313	1	3-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
314	1	3-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
315	1	3-OMe-苯基	2-呋喃基
316	1	4-CN-苯基	乙基
317	1	4-CN-苯基	正丙基
318	1	4-CN-苯基	异丙基
319	1	4-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
320	1	4-CN-苯基	CF_3
321	1	4-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
322	1	4-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
323	1	4-CN-苯基	环丙基
324	1	4-CN-苯基	环丁基

[3430]

325	1	4-CN-苯基	环戊基
326	1	4-CN-苯基	环己基
327	1	4-CN-苯基	3-吡啶基
328	1	4-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
329	1	4-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
330	1	4-CN-苯基	2-呋喃基
331	1	2-CN-苯基	乙基
332	1	2-CN-苯基	正丙基
333	1	2-CN-苯基	异丙基
334	1	2-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
335	1	2-CN-苯基	CF_3
336	1	2-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
337	1	2-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
338	1	2-CN-苯基	环丙基
339	1	2-CN-苯基	环丁基
340	1	2-CN-苯基	环戊基
341	1	2-CN-苯基	环己基
342	1	2-CN-苯基	3-吡啶基
343	1	2-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
344	1	2-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
345	1	2-CN-苯基	2-呋喃基
346	1	3-F-苯基	乙基
347	1	3-F-苯基	正丙基
348	1	3-F-苯基	异丙基
349	1	3-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
350	1	3-F-苯基	CF_3
351	1	3-F-苯基	$-CH_2CF_3$
352	1	3-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
353	1	3-F-苯基	环丙基
354	1	3-F-苯基	环丁基
355	1	3-F-苯基	环戊基
356	1	3-F-苯基	环己基
357	1	3-F-苯基	3-吡啶基
358	1	3-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
359	1	3-F-苯基	1H-咪唑-4-基
360	1	3-F-苯基	2-呋喃基
361	1	2-Cl-苯基	乙基
362	1	2-Cl-苯基	正丙基
363	1	2-Cl-苯基	异丙基
364	1	2-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3431]

365	1	2-Cl-苯基	CF_3
366	1	2-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
367	1	2-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
368	1	2-Cl-苯基	环丙基
369	1	2-Cl-苯基	环丁基
370	1	2-Cl-苯基	环戊基
371	1	2-Cl-苯基	环己基
372	1	2-Cl-苯基	3-吡啶基
373	1	2-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
374	1	2-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
375	1	2-Cl-苯基	2-呋喃基
376	1	4-Cl-苯基	乙基
377	1	4-Cl-苯基	正丙基
378	1	4-Cl-苯基	异丙基
379	1	4-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
380	1	4-Cl-苯基	CF_3
381	1	4-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
382	1	4-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
383	1	4-Cl-苯基	环丙基
384	1	4-Cl-苯基	环丁基
385	1	4-Cl-苯基	环戊基
386	1	4-Cl-苯基	环己基
387	1	4-Cl-苯基	3-吡啶基
388	1	4-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
389	1	4-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
390	1	4-Cl-苯基	2-呋喃基
391	1	3-Br-苯基	乙基
392	1	3-Br-苯基	正丙基
393	1	3-Br-苯基	异丙基
394	1	3-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
395	1	3-Br-苯基	CF_3
396	1	3-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
397	1	3-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
398	1	3-Br-苯基	环丙基
399	1	3-Br-苯基	环丁基
400	1	3-Br-苯基	环戊基
401	1	3-Br-苯基	环己基
402	1	3-Br-苯基	3-吡啶基
403	1	3-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
404	1	3-Br-苯基	1H-咪唑-4-基

[3432]

405	1	3-Br-苯基	2-呋喃基
406	1	2-CF_3-苯基	乙基
407	1	2-CF_3-苯基	正丙基
408	1	2-CF_3-苯基	异丙基
409	1	2-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
410	1	2-CF_3-苯基	CF_3
411	1	2-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
412	1	2-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
413	1	2-CF_3-苯基	环丙基
414	1	2-CF_3-苯基	环丁基
415	1	2-CF_3-苯基	环戊基
416	1	2-CF_3-苯基	环己基
417	1	2-CF_3-苯基	3-吡啶基
418	1	2-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
419	1	2-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
420	1	2-CF_3-苯基	2-呋喃基
421	1	4-CF_3-苯基	乙基
422	1	4-CF_3-苯基	正丙基
423	1	4-CF_3-苯基	异丙基
424	1	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
425	1	4-CF_3-苯基	CF_3
426	1	4-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
427	1	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
428	1	4-CF_3-苯基	环丙基
429	1	4-CF_3-苯基	环丁基
430	1	4-CF_3-苯基	环戊基
431	1	4-CF_3-苯基	环己基
432	1	4-CF_3-苯基	3-吡啶基
433	1	4-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
434	1	4-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
435	1	4-CF_3-苯基	2-呋喃基
436	1	3-iPr-苯基	乙基
437	1	3-iPr-苯基	正丙基
438	1	3-iPr-苯基	异丙基
439	1	3-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
440	1	3-iPr-苯基	CF_3
441	1	3-iPr-苯基	-CH_2CF_3
442	1	3-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
443	1	3-iPr-苯基	环丙基
444	1	3-iPr-苯基	环丁基

[3433]

445	1	3-iPr-苯基	环戊基
446	1	3-iPr-苯基	环己基
447	1	3-iPr-苯基	3-吡啶基
448	1	3-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
449	1	3-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
450	1	3-iPr-苯基	2-呋喃基
451	1	2-吗啉代-苯基	乙基
452	1	2-吗啉代-苯基	正丙基
453	1	2-吗啉代-苯基	异丙基
454	1	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
455	1	2-吗啉代-苯基	CF_3
456	1	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
457	1	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
458	1	2-吗啉代-苯基	环丙基
459	1	2-吗啉代-苯基	环丁基
460	1	2-吗啉代-苯基	环戊基
461	1	2-吗啉代-苯基	环己基
462	1	2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
463	1	2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
464	1	2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
465	1	2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
466	1	4-吗啉代-苯基	乙基
467	1	4-吗啉代-苯基	正丙基
468	1	4-吗啉代-苯基	异丙基
469	1	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
470	1	4-吗啉代-苯基	CF_3
471	1	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
472	1	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
473	1	4-吗啉代-苯基	环丙基
474	1	4-吗啉代-苯基	环丁基
475	1	4-吗啉代-苯基	环戊基
476	1	4-吗啉代-苯基	环己基
477	1	4-吗啉代-苯基	3-吡啶基
478	1	4-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
479	1	4-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
480	1	4-吗啉代-苯基	2-呋喃基
481	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	乙基
482	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	正丙基
483	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	异丙基
484	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3434]

485	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	CF_3
486	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
487	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
488	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丙基
489	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丁基
490	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环戊基
491	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环己基
492	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
493	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
494	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
495	1	4-甲基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
496	2	4-CH_3-苯基	乙基
497	2	4-CH_3-苯基	正丙基
498	2	4-CH_3-苯基	异丙基
499	2	4-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
500	2	4-CH_3-苯基	CF_3
501	2	4-CH_3-苯基	$-CH_2CF_3$
502	2	4-CH_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
503	2	4-CH_3-苯基	环丙基
504	2	4-CH_3-苯基	环丁基
505	2	4-CH_3-苯基	环戊基
506	2	4-CH_3-苯基	环己基
507	2	4-CH_3-苯基	3-吡啶基
508	2	4-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
509	2	4-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
510	2	4-CH_3-苯基	2-呋喃基
511	2	3-CH_3-苯基	乙基
512	2	3-CH_3-苯基	正丙基
513	2	3-CH_3-苯基	异丙基
514	2	3-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
515	2	3-CH_3-苯基	CF_3
516	2	3-CH_3-苯基	$-CH_2CF_3$
517	2	3-CH_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
518	2	3-CH_3-苯基	环丙基
519	2	3-CH_3-苯基	环丁基
520	2	3-CH_3-苯基	环戊基
521	2	3-CH_3-苯基	环己基
522	2	3-CH_3-苯基	3-吡啶基
523	2	3-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
524	2	3-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基

[3435]

525	2	3-CH_3-苯基	2-呋喃基
526	2	3-OH-苯基	乙基
527	2	3-OH-苯基	正丙基
528	2	3-OH-苯基	异丙基
529	2	3-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
530	2	3-OH-苯基	CF_3
531	2	3-OH-苯基	-CH_2CF_3
532	2	3-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
533	2	3-OH-苯基	环丙基
534	2	3-OH-苯基	环丁基
535	2	3-OH-苯基	环戊基
536	2	3-OH-苯基	环己基
537	2	3-OH-苯基	3-吡啶基
538	2	3-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
539	2	3-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
540	2	3-OH-苯基	2-呋喃基
541	2	4-OMe-苯基	乙基
542	2	4-OMe-苯基	正丙基
543	2	4-OMe-苯基	异丙基
544	2	4-OMe-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
545	2	4-OMe-苯基	CF_3
546	2	4-OMe-苯基	-CH_2CF_3
547	2	4-OMe-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
548	2	4-OMe-苯基	环丙基
549	2	4-OMe-苯基	环丁基
550	2	4-OMe-苯基	环戊基
551	2	4-OMe-苯基	环己基
552	2	4-OMe-苯基	3-吡啶基
553	2	4-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
554	2	4-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
555	2	4-OMe-苯基	2-呋喃基
556	2	2-OMe-苯基	乙基
557	2	2-OMe-苯基	正丙基
558	2	2-OMe-苯基	异丙基
559	2	2-OMe-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
560	2	2-OMe-苯基	CF_3
561	2	2-OMe-苯基	-CH_2CF_3
562	2	2-OMe-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
563	2	2-OMe-苯基	环丙基
564	2	2-OMe-苯基	环丁基

[3436]

565	2	2-OMe-苯基	环戊基
566	2	2-OMe-苯基	环己基
567	2	2-OMe-苯基	3-吡啶基
568	2	2-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
569	2	2-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
570	2	2-OMe-苯基	2-呋喃基
571	2	3-CN-苯基	乙基
572	2	3-CN-苯基	正丙基
573	2	3-CN-苯基	异丙基
574	2	3-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
575	2	3-CN-苯基	CF_3
576	2	3-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
577	2	3-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
578	2	3-CN-苯基	环丙基
579	2	3-CN-苯基	环丁基
580	2	3-CN-苯基	环戊基
581	2	3-CN-苯基	环己基
582	2	3-CN-苯基	3-吡啶基
583	2	3-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
584	2	3-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
585	2	3-CN-苯基	2-呋喃基
586	2	2-F-苯基	乙基
587	2	2-F-苯基	正丙基
588	2	2-F-苯基	异丙基
589	2	2-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
590	2	2-F-苯基	CF_3
591	2	2-F-苯基	$-CH_2CF_3$
592	2	2-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
593	2	2-F-苯基	环丙基
594	2	2-F-苯基	环丁基
595	2	2-F-苯基	环戊基
596	2	2-F-苯基	环己基
597	2	2-F-苯基	3-吡啶基
598	2	2-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
599	2	2-F-苯基	1H-咪唑-4-基
600	2	2-F-苯基	2-呋喃基
601	2	4-F-苯基	乙基
602	2	4-F-苯基	正丙基
603	2	4-F-苯基	异丙基
604	2	4-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3437]

605	2	4-F-苯基	CF_3
606	2	4-F-苯基	$-CH_2CF_3$
607	2	4-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
608	2	4-F-苯基	环丙基
609	2	4-F-苯基	环丁基
610	2	4-F-苯基	环戊基
611	2	4-F-苯基	环己基
612	2	4-F-苯基	3-吡啶基
613	2	4-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
614	2	4-F-苯基	1H-咪唑-4-基
615	2	4-F-苯基	2-呋喃基
616	2	3-Cl-苯基	乙基
617	2	3-Cl-苯基	正丙基
618	2	3-Cl-苯基	异丙基
619	2	3-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
620	2	3-Cl-苯基	CF_3
621	2	3-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
622	2	3-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
623	2	3-Cl-苯基	环丙基
624	2	3-Cl-苯基	环丁基
625	2	3-Cl-苯基	环戊基
626	2	3-Cl-苯基	环己基
627	2	3-Cl-苯基	3-吡啶基
628	2	3-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
629	2	3-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
630	2	3-Cl-苯基	2-呋喃基
631	2	2-Br-苯基	乙基
632	2	2-Br-苯基	正丙基
633	2	2-Br-苯基	异丙基
634	2	2-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
635	2	2-Br-苯基	CF_3
636	2	2-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
637	2	2-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
638	2	2-Br-苯基	环丙基
639	2	2-Br-苯基	环丁基
640	2	2-Br-苯基	环戊基
641	2	2-Br-苯基	环己基
642	2	2-Br-苯基	3-吡啶基
643	2	2-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
644	2	2-Br-苯基	1H-咪唑-4-基

[3438]

645	2	2-Br-苯基	2-呋喃基
646	2	4-Br-苯基	乙基
647	2	4-Br-苯基	正丙基
648	2	4-Br-苯基	异丙基
649	2	4-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
650	2	4-Br-苯基	CF_3
651	2	4-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
652	2	4-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
653	2	4-Br-苯基	环丙基
654	2	4-Br-苯基	环丁基
655	2	4-Br-苯基	环戊基
656	2	4-Br-苯基	环己基
657	2	4-Br-苯基	3-吡啶基
658	2	4-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
659	2	4-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
660	2	4-Br-苯基	2-呋喃基
661	2	3-CF_3-苯基	乙基
662	2	3-CF_3-苯基	正丙基
663	2	3-CF_3-苯基	异丙基
664	2	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
665	2	3-CF_3-苯基	CF_3
666	2	3-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
667	2	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
668	2	3-CF_3-苯基	环丙基
669	2	3-CF_3-苯基	环丁基
670	2	3-CF_3-苯基	环戊基
671	2	3-CF_3-苯基	环己基
672	2	3-CF_3-苯基	3-吡啶基
673	2	3-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
674	2	3-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
675	2	3-CF_3-苯基	2-呋喃基
676	2	2-iPr-苯基	乙基
677	2	2-iPr-苯基	正丙基
678	2	2-iPr-苯基	异丙基
679	2	2-iPr-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
680	2	2-iPr-苯基	CF_3
681	2	2-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
682	2	2-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
683	2	2-iPr-苯基	环丙基
684	2	2-iPr-苯基	环丁基

[3439]

685	2	2-iPr-苯基	环戊基
686	2	2-iPr-苯基	环己基
687	2	2-iPr-苯基	3-吡啶基
688	2	2-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
689	2	2-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
690	2	2-iPr-苯基	2-呋喃基
691	2	4-iPr-苯基	乙基
692	2	4-iPr-苯基	正丙基
693	2	4-iPr-苯基	异丙基
694	2	4-iPr-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
695	2	4-iPr-苯基	CF_3
696	2	4-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
697	2	4-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
698	2	4-iPr-苯基	环丙基
699	2	4-iPr-苯基	环丁基
700	2	4-iPr-苯基	环戊基
701	2	4-iPr-苯基	环己基
702	2	4-iPr-苯基	3-吡啶基
703	2	4-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
704	2	4-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
705	2	4-iPr-苯基	2-呋喃基
706	2	3-吗啉代-苯基	乙基
707	2	3-吗啉代-苯基	正丙基
708	2	3-吗啉代-苯基	异丙基
709	2	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
710	2	3-吗啉代-苯基	CF_3
711	2	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
712	2	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
713	2	3-吗啉代-苯基	环丙基
714	2	3-吗啉代-苯基	环丁基
715	2	3-吗啉代-苯基	环戊基
716	2	3-吗啉代-苯基	环己基
717	2	3-吗啉代-苯基	3-吡啶基
718	2	3-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
719	2	3-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
720	2	3-吗啉代-苯基	2-呋喃基
721	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	乙基
722	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	正丙基
723	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	异丙基
724	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

	725	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	CF_3
	726	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
	727	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
	728	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丙基
	729	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丁基
	730	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环戊基
	731	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环己基
	732	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
	733	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	734	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
	735	2	4-氰基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
	736	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	乙基
	737	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	正丙基
	738	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	异丙基
	739	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	740	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	CF_3
	741	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
	742	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
	743	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丙基
	744	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丁基
[3440]	745	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环戊基
	746	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环己基
	747	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
	748	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	749	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
	750	2	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
	751	2	2-CH_3-苯基	乙基
	752	2	2-CH_3-苯基	正丙基
	753	2	2-CH_3-苯基	异丙基
	754	2	2-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	755	2	2-CH_3-苯基	CF_3
	756	2	2-CH_3-苯基	$-CH_2CF_3$
	757	2	2-CH_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
	758	2	2-CH_3-苯基	环丙基
	759	2	2-CH_3-苯基	环丁基
	760	2	2-CH_3-苯基	环戊基
	761	2	2-CH_3-苯基	环己基
	762	2	2-CH_3-苯基	3-吡啶基
	763	2	2-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	764	2	2-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基

[3441]

765	2	2-CH_3-苯基	2-呋喃基
766	2	4-OH-苯基	乙基
767	2	4-OH-苯基	正丙基
768	2	4-OH-苯基	异丙基
769	2	4-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
770	2	4-OH-苯基	CF_3
771	2	4-OH-苯基	-CH_2CF_3
772	2	4-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
773	2	4-OH-苯基	环丙基
774	2	4-OH-苯基	环丁基
775	2	4-OH-苯基	环戊基
776	2	4-OH-苯基	环己基
777	2	4-OH-苯基	3-吡啶基
778	2	4-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
779	2	4-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
780	2	4-OH-苯基	2-呋喃基
781	2	2-OH-苯基	乙基
782	2	2-OH-苯基	正丙基
783	2	2-OH-苯基	异丙基
784	2	2-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
785	2	2-OH-苯基	CF_3
786	2	2-OH-苯基	-CH_2CF_3
787	2	2-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
788	2	2-OH-苯基	环丙基
789	2	2-OH-苯基	环丁基
790	2	2-OH-苯基	环戊基
791	2	2-OH-苯基	环己基
792	2	2-OH-苯基	3-吡啶基
793	2	2-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
794	2	2-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
795	2	2-OH-苯基	2-呋喃基
796	2	3-OMe-苯基	乙基
797	2	3-OMe-苯基	正丙基
798	2	3-OMe-苯基	异丙基
799	2	3-OMe-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
800	2	3-OMe-苯基	CF_3
801	2	3-OMe-苯基	-CH_2CF_3
802	2	3-OMe-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
803	2	3-OMe-苯基	环丙基
804	2	3-OMe-苯基	环丁基

[3442]

805	2	3-OMe-苯基	环戊基
806	2	3-OMe-苯基	环己基
807	2	3-OMe-苯基	3-吡啶基
808	2	3-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
809	2	3-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
810	2	3-OMe-苯基	2-呋喃基
811	2	4-CN-苯基	乙基
812	2	4-CN-苯基	正丙基
813	2	4-CN-苯基	异丙基
814	2	4-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
815	2	4-CN-苯基	CF_3
816	2	4-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
817	2	4-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
818	2	4-CN-苯基	环丙基
819	2	4-CN-苯基	环丁基
820	2	4-CN-苯基	环戊基
821	2	4-CN-苯基	环己基
822	2	4-CN-苯基	3-吡啶基
823	2	4-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
824	2	4-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
825	2	4-CN-苯基	2-呋喃基
826	2	2-CN-苯基	乙基
827	2	2-CN-苯基	正丙基
828	2	2-CN-苯基	异丙基
829	2	2-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
830	2	2-CN-苯基	CF_3
831	2	2-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
832	2	2-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
833	2	2-CN-苯基	环丙基
834	2	2-CN-苯基	环丁基
835	2	2-CN-苯基	环戊基
836	2	2-CN-苯基	环己基
837	2	2-CN-苯基	3-吡啶基
838	2	2-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
839	2	2-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
840	2	2-CN-苯基	2-呋喃基
841	2	3-F-苯基	乙基
842	2	3-F-苯基	正丙基
843	2	3-F-苯基	异丙基
844	2	3-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3443]

845	2	3-F-苯基	CF_3
846	2	3-F-苯基	$-CH_2CF_3$
847	2	3-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
848	2	3-F-苯基	环丙基
849	2	3-F-苯基	环丁基
850	2	3-F-苯基	环戊基
851	2	3-F-苯基	环己基
852	2	3-F-苯基	3-吡啶基
853	2	3-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
854	2	3-F-苯基	1H-咪唑-4-基
855	2	3-F-苯基	2-呋喃基
856	2	2-Cl-苯基	乙基
857	2	2-Cl-苯基	正丙基
858	2	2-Cl-苯基	异丙基
859	2	2-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
860	2	2-Cl-苯基	CF_3
861	2	2-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
862	2	2-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
863	2	2-Cl-苯基	环丙基
864	2	2-Cl-苯基	环丁基
865	2	2-Cl-苯基	环戊基
866	2	2-Cl-苯基	环己基
867	2	2-Cl-苯基	3-吡啶基
868	2	2-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
869	2	2-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
870	2	2-Cl-苯基	2-呋喃基
871	2	4-Cl-苯基	乙基
872	2	4-Cl-苯基	正丙基
873	2	4-Cl-苯基	异丙基
874	2	4-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
875	2	4-Cl-苯基	CF_3
876	2	4-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
877	2	4-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
878	2	4-Cl-苯基	环丙基
879	2	4-Cl-苯基	环丁基
880	2	4-Cl-苯基	环戊基
881	2	4-Cl-苯基	环己基
882	2	4-Cl-苯基	3-吡啶基
883	2	4-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
884	2	4-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基

[3444]

885	2	4-Cl-苯基	2-呋喃基
886	2	3-Br-苯基	乙基
887	2	3-Br-苯基	正丙基
888	2	3-Br-苯基	异丙基
889	2	3-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
890	2	3-Br-苯基	CF_3
891	2	3-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
892	2	3-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
893	2	3-Br-苯基	环丙基
894	2	3-Br-苯基	环丁基
895	2	3-Br-苯基	环戊基
896	2	3-Br-苯基	环己基
897	2	3-Br-苯基	3-吡啶基
898	2	3-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
899	2	3-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
900	2	3-Br-苯基	2-呋喃基
901	2	2-CF_3-苯基	乙基
902	2	2-CF_3-苯基	正丙基
903	2	2-CF_3-苯基	异丙基
904	2	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
905	2	2-CF_3-苯基	CF_3
906	2	2-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
907	2	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
908	2	2-CF_3-苯基	环丙基
909	2	2-CF_3-苯基	环丁基
910	2	2-CF_3-苯基	环戊基
911	2	2-CF_3-苯基	环己基
912	2	2-CF_3-苯基	3-吡啶基
913	2	2-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
914	2	2-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
915	2	2-CF_3-苯基	2-呋喃基
916	2	4-CF_3-苯基	乙基
917	2	4-CF_3-苯基	正丙基
918	2	4-CF_3-苯基	异丙基
919	2	4-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
920	2	4-CF_3-苯基	CF_3
921	2	4-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
922	2	4-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
923	2	4-CF_3-苯基	环丙基
924	2	4-CF_3-苯基	环丁基

[3445]

925	2	4-CF_3-苯基	环戊基
926	2	4-CF_3-苯基	环己基
927	2	4-CF_3-苯基	3-吡啶基
928	2	4-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
929	2	4-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
930	2	4-CF_3-苯基	2-呋喃基
931	2	3-iPr-苯基	乙基
932	2	3-iPr-苯基	正丙基
933	2	3-iPr-苯基	异丙基
934	2	3-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
935	2	3-iPr-苯基	CF_3
936	2	3-iPr-苯基	-CH_2CF_3
937	2	3-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
938	2	3-iPr-苯基	环丙基
939	2	3-iPr-苯基	环丁基
940	2	3-iPr-苯基	环戊基
941	2	3-iPr-苯基	环己基
942	2	3-iPr-苯基	3-吡啶基
943	2	3-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
944	2	3-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
945	2	3-iPr-苯基	2-呋喃基
946	2	2-吗啉代-苯基	乙基
947	2	2-吗啉代-苯基	正丙基
948	2	2-吗啉代-苯基	异丙基
949	2	2-吗啉代-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
950	2	2-吗啉代-苯基	CF_3
951	2	2-吗啉代-苯基	-CH_2CF_3
952	2	2-吗啉代-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
953	2	2-吗啉代-苯基	环丙基
954	2	2-吗啉代-苯基	环丁基
955	2	2-吗啉代-苯基	环戊基
956	2	2-吗啉代-苯基	环己基
957	2	2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
958	2	2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
959	2	2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
960	2	2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
961	2	4-吗啉代-苯基	乙基
962	2	4-吗啉代-苯基	正丙基
963	2	4-吗啉代-苯基	异丙基
964	2	4-吗啉代-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$

[3446]

965	2	4-吗啉代-苯基	CF_3
966	2	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
967	2	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
968	2	4-吗啉代-苯基	环丙基
969	2	4-吗啉代-苯基	环丁基
970	2	4-吗啉代-苯基	环戊基
971	2	4-吗啉代-苯基	环己基
972	2	4-吗啉代-苯基	3-吡啶基
973	2	4-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
974	2	4-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
975	2	4-吗啉代-苯基	2-呋喃基
976	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	乙基
977	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	正丙基
978	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	异丙基
979	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
980	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	CF_3
981	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
982	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
983	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丙基
984	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丁基
985	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环戊基
986	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环己基
987	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
988	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
989	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
990	2	4-甲基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
991	3	4-CH_3-苯基	乙基
992	3	4-CH_3-苯基	正丙基
993	3	4-CH_3-苯基	异丙基
994	3	4-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
995	3	4-CH_3-苯基	CF_3
996	3	4-CH_3-苯基	$-CH_2CF_3$
997	3	4-CH_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
998	3	4-CH_3-苯基	环丙基
999	3	4-CH_3-苯基	环丁基
1000	3	4-CH_3-苯基	环戊基
1001	3	4-CH_3-苯基	环己基
1002	3	4-CH_3-苯基	3-吡啶基
1003	3	4-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1004	3	4-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基

[3447]

1005	3	4-CH_3-苯基	2-呋喃基
1006	3	3-CH_3-苯基	乙基
1007	3	3-CH_3-苯基	正丙基
1008	3	3-CH_3-苯基	异丙基
1009	3	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1010	3	3-CH_3-苯基	CF_3
1011	3	3-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
1012	3	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1013	3	3-CH_3-苯基	环丙基
1014	3	3-CH_3-苯基	环丁基
1015	3	3-CH_3-苯基	环戊基
1016	3	3-CH_3-苯基	环己基
1017	3	3-CH_3-苯基	3-吡啶基
1018	3	3-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1019	3	3-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1020	3	3-CH_3-苯基	2-呋喃基
1021	3	3-OH-苯基	乙基
1022	3	3-OH-苯基	正丙基
1023	3	3-OH-苯基	异丙基
1024	3	3-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1025	3	3-OH-苯基	CF_3
1026	3	3-OH-苯基	-CH_2CF_3
1027	3	3-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1028	3	3-OH-苯基	环丙基
1029	3	3-OH-苯基	环丁基
1030	3	3-OH-苯基	环戊基
1031	3	3-OH-苯基	环己基
1032	3	3-OH-苯基	3-吡啶基
1033	3	3-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1034	3	3-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1035	3	3-OH-苯基	2-呋喃基
1036	3	4-OMe-苯基	乙基
1037	3	4-OMe-苯基	正丙基
1038	3	4-OMe-苯基	异丙基
1039	3	4-OMe-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1040	3	4-OMe-苯基	CF_3
1041	3	4-OMe-苯基	-CH_2CF_3
1042	3	4-OMe-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1043	3	4-OMe-苯基	环丙基
1044	3	4-OMe-苯基	环丁基

[3448]

1045	3	4-OMe-苯基	环戊基
1046	3	4-OMe-苯基	环己基
1047	3	4-OMe-苯基	3-吡啶基
1048	3	4-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1049	3	4-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1050	3	4-OMe-苯基	2-呋喃基
1051	3	2-OMe-苯基	乙基
1052	3	2-OMe-苯基	正丙基
1053	3	2-OMe-苯基	异丙基
1054	3	2-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1055	3	2-OMe-苯基	CF_3
1056	3	2-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1057	3	2-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1058	3	2-OMe-苯基	环丙基
1059	3	2-OMe-苯基	环丁基
1060	3	2-OMe-苯基	环戊基
1061	3	2-OMe-苯基	环己基
1062	3	2-OMe-苯基	3-吡啶基
1063	3	2-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1064	3	2-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1065	3	2-OMe-苯基	2-呋喃基
1066	3	3-CN-苯基	乙基
1067	3	3-CN-苯基	正丙基
1068	3	3-CN-苯基	异丙基
1069	3	3-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1070	3	3-CN-苯基	CF_3
1071	3	3-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1072	3	3-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1073	3	3-CN-苯基	环丙基
1074	3	3-CN-苯基	环丁基
1075	3	3-CN-苯基	环戊基
1076	3	3-CN-苯基	环己基
1077	3	3-CN-苯基	3-吡啶基
1078	3	3-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1079	3	3-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1080	3	3-CN-苯基	2-呋喃基
1081	3	2-F-苯基	乙基
1082	3	2-F-苯基	正丙基
1083	3	2-F-苯基	异丙基
1084	3	2-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3449]

1085	3	2-F-苯基	CF_3
1086	3	2-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1087	3	2-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1088	3	2-F-苯基	环丙基
1089	3	2-F-苯基	环丁基
1090	3	2-F-苯基	环戊基
1091	3	2-F-苯基	环己基
1092	3	2-F-苯基	3-吡啶基
1093	3	2-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1094	3	2-F-苯基	1H-咪唑-4-基
1095	3	2-F-苯基	2-呋喃基
1096	3	4-F-苯基	乙基
1097	3	4-F-苯基	正丙基
1098	3	4-F-苯基	异丙基
1099	3	4-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1100	3	4-F-苯基	CF_3
1101	3	4-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1102	3	4-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1103	3	4-F-苯基	环丙基
1104	3	4-F-苯基	环丁基
1105	3	4-F-苯基	环戊基
1106	3	4-F-苯基	环己基
1107	3	4-F-苯基	3-吡啶基
1108	3	4-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1109	3	4-F-苯基	1H-咪唑-4-基
1110	3	4-F-苯基	2-呋喃基
1111	3	3-Cl-苯基	乙基
1112	3	3-Cl-苯基	正丙基
1113	3	3-Cl-苯基	异丙基
1114	3	3-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1115	3	3-Cl-苯基	CF_3
1116	3	3-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1117	3	3-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1118	3	3-Cl-苯基	环丙基
1119	3	3-Cl-苯基	环丁基
1120	3	3-Cl-苯基	环戊基
1121	3	3-Cl-苯基	环己基
1122	3	3-Cl-苯基	3-吡啶基
1123	3	3-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1124	3	3-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基

1125	3	3-Cl-苯基	2-呋喃基
1126	3	2-Br-苯基	乙基
1127	3	2-Br-苯基	正丙基
1128	3	2-Br-苯基	异丙基
1129	3	2-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1130	3	2-Br-苯基	CF_3
1131	3	2-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1132	3	2-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1133	3	2-Br-苯基	环丙基
1134	3	2-Br-苯基	环丁基
1135	3	2-Br-苯基	环戊基
1136	3	2-Br-苯基	环己基
1137	3	2-Br-苯基	3-吡啶基
1138	3	2-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1139	3	2-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1140	3	2-Br-苯基	2-呋喃基
1141	3	4-Br-苯基	乙基
1142	3	4-Br-苯基	正丙基
1143	3	4-Br-苯基	异丙基
1144	3	4-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1145	3	4-Br-苯基	CF_3
1146	3	4-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1147	3	4-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1148	3	4-Br-苯基	环丙基
1149	3	4-Br-苯基	环丁基
1150	3	4-Br-苯基	环戊基
1151	3	4-Br-苯基	环己基
1152	3	4-Br-苯基	3-吡啶基
1153	3	4-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1154	3	4-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1155	3	4-Br-苯基	2-呋喃基
1156	3	3-CF_3-苯基	乙基
1157	3	3-CF_3-苯基	正丙基
1158	3	3-CF_3-苯基	异丙基
1159	3	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1160	3	3-CF_3-苯基	CF_3
1161	3	3-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
1162	3	3-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1163	3	3-CF_3-苯基	环丙基
1164	3	3-CF_3-苯基	环丁基

[3450]

[3451]

1165	3	3-CF_3-苯基	环戊基
1166	3	3-CF_3-苯基	环己基
1167	3	3-CF_3-苯基	3-吡啶基
1168	3	3-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1169	3	3-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1170	3	3-CF_3-苯基	2-呋喃基
1171	3	2-iPr-苯基	乙基
1172	3	2-iPr-苯基	正丙基
1173	3	2-iPr-苯基	异丙基
1174	3	2-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1175	3	2-iPr-苯基	CF_3
1176	3	2-iPr-苯基	-CH_2CF_3
1177	3	2-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1178	3	2-iPr-苯基	环丙基
1179	3	2-iPr-苯基	环丁基
1180	3	2-iPr-苯基	环戊基
1181	3	2-iPr-苯基	环己基
1182	3	2-iPr-苯基	3-吡啶基
1183	3	2-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1184	3	2-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1185	3	2-iPr-苯基	2-呋喃基
1186	3	4-iPr-苯基	乙基
1187	3	4-iPr-苯基	正丙基
1188	3	4-iPr-苯基	异丙基
1189	3	4-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1190	3	4-iPr-苯基	CF_3
1191	3	4-iPr-苯基	-CH_2CF_3
1192	3	4-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1193	3	4-iPr-苯基	环丙基
1194	3	4-iPr-苯基	环丁基
1195	3	4-iPr-苯基	环戊基
1196	3	4-iPr-苯基	环己基
1197	3	4-iPr-苯基	3-吡啶基
1198	3	4-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1199	3	4-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1200	3	4-iPr-苯基	2-呋喃基
1201	3	3-吗啉代-苯基	乙基
1202	3	3-吗啉代-苯基	正丙基
1203	3	3-吗啉代-苯基	异丙基
1204	3	3-吗啉代-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$

[3452]

1205	3	3-吗啉代-苯基	CF_3
1206	3	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1207	3	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1208	3	3-吗啉代-苯基	环丙基
1209	3	3-吗啉代-苯基	环丁基
1210	3	3-吗啉代-苯基	环戊基
1211	3	3-吗啉代-苯基	环己基
1212	3	3-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1213	3	3-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1214	3	3-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1215	3	3-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1216	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	乙基
1217	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	正丙基
1218	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	异丙基
1219	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1220	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	CF_3
1221	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1222	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1223	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丙基
1224	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丁基
1225	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环戊基
1226	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环己基
1227	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1228	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1229	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1230	3	4-氰基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1231	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	乙基
1232	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	正丙基
1233	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	异丙基
1234	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1235	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	CF_3
1236	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1237	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1238	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丙基
1239	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丁基
1240	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环戊基
1241	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环己基
1242	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1243	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1244	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基

[3453]

1245	3	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1246	3	2-CH_3-苯基	乙基
1247	3	2-CH_3-苯基	正丙基
1248	3	2-CH_3-苯基	异丙基
1249	3	2-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1250	3	2-CH_3-苯基	CF_3
1251	3	2-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
1252	3	2-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1253	3	2-CH_3-苯基	环丙基
1254	3	2-CH_3-苯基	环丁基
1255	3	2-CH_3-苯基	环戊基
1256	3	2-CH_3-苯基	环己基
1257	3	2-CH_3-苯基	3-吡啶基
1258	3	2-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1259	3	2-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1260	3	2-CH_3-苯基	2-呋喃基
1261	3	4-OH-苯基	乙基
1262	3	4-OH-苯基	正丙基
1263	3	4-OH-苯基	异丙基
1264	3	4-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1265	3	4-OH-苯基	CF_3
1266	3	4-OH-苯基	-CH_2CF_3
1267	3	4-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1268	3	4-OH-苯基	环丙基
1269	3	4-OH-苯基	环丁基
1270	3	4-OH-苯基	环戊基
1271	3	4-OH-苯基	环己基
1272	3	4-OH-苯基	3-吡啶基
1273	3	4-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1274	3	4-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1275	3	4-OH-苯基	2-呋喃基
1276	3	2-OH-苯基	乙基
1277	3	2-OH-苯基	正丙基
1278	3	2-OH-苯基	异丙基
1279	3	2-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1280	3	2-OH-苯基	CF_3
1281	3	2-OH-苯基	-CH_2CF_3
1282	3	2-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1283	3	2-OH-苯基	环丙基
1284	3	2-OH-苯基	环丁基

[3454]

1285	3	2-OH-苯基	环戊基
1286	3	2-OH-苯基	环己基
1287	3	2-OH-苯基	3-吡啶基
1288	3	2-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1289	3	2-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1290	3	2-OH-苯基	2-呋喃基
1291	3	3-OMe-苯基	乙基
1292	3	3-OMe-苯基	正丙基
1293	3	3-OMe-苯基	异丙基
1294	3	3-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1295	3	3-OMe-苯基	CF_3
1296	3	3-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1297	3	3-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1298	3	3-OMe-苯基	环丙基
1299	3	3-OMe-苯基	环丁基
1300	3	3-OMe-苯基	环戊基
1301	3	3-OMe-苯基	环己基
1302	3	3-OMe-苯基	3-吡啶基
1303	3	3-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1304	3	3-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1305	3	3-OMe-苯基	2-呋喃基
1306	3	4-CN-苯基	乙基
1307	3	4-CN-苯基	正丙基
1308	3	4-CN-苯基	异丙基
1309	3	4-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1310	3	4-CN-苯基	CF_3
1311	3	4-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1312	3	4-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1313	3	4-CN-苯基	环丙基
1314	3	4-CN-苯基	环丁基
1315	3	4-CN-苯基	环戊基
1316	3	4-CN-苯基	环己基
1317	3	4-CN-苯基	3-吡啶基
1318	3	4-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1319	3	4-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1320	3	4-CN-苯基	2-呋喃基
1321	3	2-CN-苯基	乙基
1322	3	2-CN-苯基	正丙基
1323	3	2-CN-苯基	异丙基
1324	3	2-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3455]

1325	3	2-CN-苯基	CF_3
1326	3	2-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1327	3	2-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1328	3	2-CN-苯基	环丙基
1329	3	2-CN-苯基	环丁基
1330	3	2-CN-苯基	环戊基
1331	3	2-CN-苯基	环己基
1332	3	2-CN-苯基	3-吡啶基
1333	3	2-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1334	3	2-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1335	3	2-CN-苯基	2-呋喃基
1336	3	3-F-苯基	乙基
1337	3	3-F-苯基	正丙基
1338	3	3-F-苯基	异丙基
1339	3	3-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1340	3	3-F-苯基	CF_3
1341	3	3-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1342	3	3-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1343	3	3-F-苯基	环丙基
1344	3	3-F-苯基	环丁基
1345	3	3-F-苯基	环戊基
1346	3	3-F-苯基	环己基
1347	3	3-F-苯基	3-吡啶基
1348	3	3-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1349	3	3-F-苯基	1H-咪唑-4-基
1350	3	3-F-苯基	2-呋喃基
1351	3	2-Cl-苯基	乙基
1352	3	2-Cl-苯基	正丙基
1353	3	2-Cl-苯基	异丙基
1354	3	2-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1355	3	2-Cl-苯基	CF_3
1356	3	2-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1357	3	2-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1358	3	2-Cl-苯基	环丙基
1359	3	2-Cl-苯基	环丁基
1360	3	2-Cl-苯基	环戊基
1361	3	2-Cl-苯基	环己基
1362	3	2-Cl-苯基	3-吡啶基
1363	3	2-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1364	3	2-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基

[3456]

1365	3	2-Cl-苯基	2-呋喃基
1366	3	4-Cl-苯基	乙基
1367	3	4-Cl-苯基	正丙基
1368	3	4-Cl-苯基	异丙基
1369	3	4-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1370	3	4-Cl-苯基	CF_3
1371	3	4-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1372	3	4-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1373	3	4-Cl-苯基	环丙基
1374	3	4-Cl-苯基	环丁基
1375	3	4-Cl-苯基	环戊基
1376	3	4-Cl-苯基	环己基
1377	3	4-Cl-苯基	3-吡啶基
1378	3	4-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1379	3	4-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1380	3	4-Cl-苯基	2-呋喃基
1381	3	3-Br-苯基	乙基
1382	3	3-Br-苯基	正丙基
1383	3	3-Br-苯基	异丙基
1384	3	3-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1385	3	3-Br-苯基	CF_3
1386	3	3-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1387	3	3-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1388	3	3-Br-苯基	环丙基
1389	3	3-Br-苯基	环丁基
1390	3	3-Br-苯基	环戊基
1391	3	3-Br-苯基	环己基
1392	3	3-Br-苯基	3-吡啶基
1393	3	3-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1394	3	3-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1395	3	3-Br-苯基	2-呋喃基
1396	3	2-CF_3-苯基	乙基
1397	3	2-CF_3-苯基	正丙基
1398	3	2-CF_3-苯基	异丙基
1399	3	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1400	3	2-CF_3-苯基	CF_3
1401	3	2-CF_3-苯基	$-CH_2CF_3$
1402	3	2-CF_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1403	3	2-CF_3-苯基	环丙基
1404	3	2-CF_3-苯基	环丁基

[3457]

1405	3	2-CF_3-苯基	环戊基
1406	3	2-CF_3-苯基	环己基
1407	3	2-CF_3-苯基	3-吡啶基
1408	3	2-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1409	3	2-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1410	3	2-CF_3-苯基	2-呋喃基
1411	3	4-CF_3-苯基	乙基
1412	3	4-CF_3-苯基	正丙基
1413	3	4-CF_3-苯基	异丙基
1414	3	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1415	3	4-CF_3-苯基	CF_3
1416	3	4-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
1417	3	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1418	3	4-CF_3-苯基	环丙基
1419	3	4-CF_3-苯基	环丁基
1420	3	4-CF_3-苯基	环戊基
1421	3	4-CF_3-苯基	环己基
1422	3	4-CF_3-苯基	3-吡啶基
1423	3	4-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1424	3	4-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1425	3	4-CF_3-苯基	2-呋喃基
1426	3	3-iPr-苯基	乙基
1427	3	3-iPr-苯基	正丙基
1428	3	3-iPr-苯基	异丙基
1429	3	3-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1430	3	3-iPr-苯基	CF_3
1431	3	3-iPr-苯基	-CH_2CF_3
1432	3	3-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1433	3	3-iPr-苯基	环丙基
1434	3	3-iPr-苯基	环丁基
1435	3	3-iPr-苯基	环戊基
1436	3	3-iPr-苯基	环己基
1437	3	3-iPr-苯基	3-吡啶基
1438	3	3-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1439	3	3-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1440	3	3-iPr-苯基	2-呋喃基
1441	3	2-吗啉代-苯基	乙基
1442	3	2-吗啉代-苯基	正丙基
1443	3	2-吗啉代-苯基	异丙基
1444	3	2-吗啉代-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$

[3458]

1445	3	2-吗啉代-苯基	CF_3
1446	3	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1447	3	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1448	3	2-吗啉代-苯基	环丙基
1449	3	2-吗啉代-苯基	环丁基
1450	3	2-吗啉代-苯基	环戊基
1451	3	2-吗啉代-苯基	环己基
1452	3	2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1453	3	2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1454	3	2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1455	3	2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1456	3	4-吗啉代-苯基	乙基
1457	3	4-吗啉代-苯基	正丙基
1458	3	4-吗啉代-苯基	异丙基
1459	3	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1460	3	4-吗啉代-苯基	CF_3
1461	3	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1462	3	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1463	3	4-吗啉代-苯基	环丙基
1464	3	4-吗啉代-苯基	环丁基
1465	3	4-吗啉代-苯基	环戊基
1466	3	4-吗啉代-苯基	环己基
1467	3	4-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1468	3	4-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1469	3	4-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1470	3	4-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1471	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	乙基
1472	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	正丙基
1473	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	异丙基
1474	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1475	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	CF_3
1476	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1477	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1478	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丙基
1479	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丁基
1480	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环戊基
1481	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环己基
1482	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1483	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1484	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基

1485	3	4-甲基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1486	4	4-CH_3-苯基	乙基
1487	4	4-CH_3-苯基	正丙基
1488	4	4-CH_3-苯基	异丙基
1489	4	4-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1490	4	4-CH_3-苯基	CF_3
1491	4	4-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
1492	4	4-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1493	4	4-CH_3-苯基	环丙基
1494	4	4-CH_3-苯基	环丁基
1495	4	4-CH_3-苯基	环戊基
1496	4	4-CH_3-苯基	环己基
1497	4	4-CH_3-苯基	3-吡啶基
1498	4	4-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1499	4	4-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1500	4	4-CH_3-苯基	2-呋喃基
1501	4	3-CH_3-苯基	乙基
1502	4	3-CH_3-苯基	正丙基
1503	4	3-CH_3-苯基	异丙基
1504	4	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1505	4	3-CH_3-苯基	CF_3
1506	4	3-CH_3-苯基	-CH_2CF_3
1507	4	3-CH_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1508	4	3-CH_3-苯基	环丙基
1509	4	3-CH_3-苯基	环丁基
1510	4	3-CH_3-苯基	环戊基
1511	4	3-CH_3-苯基	环己基
1512	4	3-CH_3-苯基	3-吡啶基
1513	4	3-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1514	4	3-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1515	4	3-CH_3-苯基	2-呋喃基
1516	4	3-OH-苯基	乙基
1517	4	3-OH-苯基	正丙基
1518	4	3-OH-苯基	异丙基
1519	4	3-OH-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1520	4	3-OH-苯基	CF_3
1521	4	3-OH-苯基	-CH_2CF_3
1522	4	3-OH-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1523	4	3-OH-苯基	环丙基
1524	4	3-OH-苯基	环丁基

[3459]

[3460]

1525	4	3-OH-苯基	环戊基
1526	4	3-OH-苯基	环己基
1527	4	3-OH-苯基	3-吡啶基
1528	4	3-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1529	4	3-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1530	4	3-OH-苯基	2-呋喃基
1531	4	4-OMe-苯基	乙基
1532	4	4-OMe-苯基	正丙基
1533	4	4-OMe-苯基	异丙基
1534	4	4-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1535	4	4-OMe-苯基	CF_3
1536	4	4-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1537	4	4-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1538	4	4-OMe-苯基	环丙基
1539	4	4-OMe-苯基	环丁基
1540	4	4-OMe-苯基	环戊基
1541	4	4-OMe-苯基	环己基
1542	4	4-OMe-苯基	3-吡啶基
1543	4	4-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1544	4	4-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1545	4	4-OMe-苯基	2-呋喃基
1546	4	2-OMe-苯基	乙基
1547	4	2-OMe-苯基	正丙基
1548	4	2-OMe-苯基	异丙基
1549	4	2-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1550	4	2-OMe-苯基	CF_3
1551	4	2-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1552	4	2-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1553	4	2-OMe-苯基	环丙基
1554	4	2-OMe-苯基	环丁基
1555	4	2-OMe-苯基	环戊基
1556	4	2-OMe-苯基	环己基
1557	4	2-OMe-苯基	3-吡啶基
1558	4	2-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1559	4	2-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1560	4	2-OMe-苯基	2-呋喃基
1561	4	3-CN-苯基	乙基
1562	4	3-CN-苯基	正丙基
1563	4	3-CN-苯基	异丙基
1564	4	3-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3461]

1565	4	3-CN-苯基	CF_3
1566	4	3-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1567	4	3-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1568	4	3-CN-苯基	环丙基
1569	4	3-CN-苯基	环丁基
1570	4	3-CN-苯基	环戊基
1571	4	3-CN-苯基	环己基
1572	4	3-CN-苯基	3-吡啶基
1573	4	3-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1574	4	3-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1575	4	3-CN-苯基	2-呋喃基
1576	4	2-F-苯基	乙基
1577	4	2-F-苯基	正丙基
1578	4	2-F-苯基	异丙基
1579	4	2-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1580	4	2-F-苯基	CF_3
1581	4	2-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1582	4	2-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1583	4	2-F-苯基	环丙基
1584	4	2-F-苯基	环丁基
1585	4	2-F-苯基	环戊基
1586	4	2-F-苯基	环己基
1587	4	2-F-苯基	3-吡啶基
1588	4	2-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1589	4	2-F-苯基	1H-咪唑-4-基
1590	4	2-F-苯基	2-呋喃基
1591	4	4-F-苯基	乙基
1592	4	4-F-苯基	正丙基
1593	4	4-F-苯基	异丙基
1594	4	4-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1595	4	4-F-苯基	CF_3
1596	4	4-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1597	4	4-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1598	4	4-F-苯基	环丙基
1599	4	4-F-苯基	环丁基
1600	4	4-F-苯基	环戊基
1601	4	4-F-苯基	环己基
1602	4	4-F-苯基	3-吡啶基
1603	4	4-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1604	4	4-F-苯基	1H-咪唑-4-基

[3462]

1605	4	4-F-苯基	2-呋喃基
1606	4	3-Cl-苯基	乙基
1607	4	3-Cl-苯基	正丙基
1608	4	3-Cl-苯基	异丙基
1609	4	3-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1610	4	3-Cl-苯基	CF_3
1611	4	3-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1612	4	3-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1613	4	3-Cl-苯基	环丙基
1614	4	3-Cl-苯基	环丁基
1615	4	3-Cl-苯基	环戊基
1616	4	3-Cl-苯基	环己基
1617	4	3-Cl-苯基	3-吡啶基
1618	4	3-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1619	4	3-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1620	4	3-Cl-苯基	2-呋喃基
1621	4	2-Br-苯基	乙基
1622	4	2-Br-苯基	正丙基
1623	4	2-Br-苯基	异丙基
1624	4	2-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1625	4	2-Br-苯基	CF_3
1626	4	2-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1627	4	2-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1628	4	2-Br-苯基	环丙基
1629	4	2-Br-苯基	环丁基
1630	4	2-Br-苯基	环戊基
1631	4	2-Br-苯基	环己基
1632	4	2-Br-苯基	3-吡啶基
1633	4	2-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1634	4	2-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1635	4	2-Br-苯基	2-呋喃基
1636	4	4-Br-苯基	乙基
1637	4	4-Br-苯基	正丙基
1638	4	4-Br-苯基	异丙基
1639	4	4-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1640	4	4-Br-苯基	CF_3
1641	4	4-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1642	4	4-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1643	4	4-Br-苯基	环丙基
1644	4	4-Br-苯基	环丁基

[3463]

1645	4	4-Br-苯基	环戊基
1646	4	4-Br-苯基	环己基
1647	4	4-Br-苯基	3-吡啶基
1648	4	4-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1649	4	4-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1650	4	4-Br-苯基	2-呋喃基
1651	4	3-CF_3-苯基	乙基
1652	4	3-CF_3-苯基	正丙基
1653	4	3-CF_3-苯基	异丙基
1654	4	3-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1655	4	3-CF_3-苯基	CF_3
1656	4	3-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
1657	4	3-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1658	4	3-CF_3-苯基	环丙基
1659	4	3-CF_3-苯基	环丁基
1660	4	3-CF_3-苯基	环戊基
1661	4	3-CF_3-苯基	环己基
1662	4	3-CF_3-苯基	3-吡啶基
1663	4	3-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1664	4	3-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1665	4	3-CF_3-苯基	2-呋喃基
1666	4	2-iPr-苯基	乙基
1667	4	2-iPr-苯基	正丙基
1668	4	2-iPr-苯基	异丙基
1669	4	2-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1670	4	2-iPr-苯基	CF_3
1671	4	2-iPr-苯基	-CH_2CF_3
1672	4	2-iPr-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1673	4	2-iPr-苯基	环丙基
1674	4	2-iPr-苯基	环丁基
1675	4	2-iPr-苯基	环戊基
1676	4	2-iPr-苯基	环己基
1677	4	2-iPr-苯基	3-吡啶基
1678	4	2-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1679	4	2-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1680	4	2-iPr-苯基	2-呋喃基
1681	4	4-iPr-苯基	乙基
1682	4	4-iPr-苯基	正丙基
1683	4	4-iPr-苯基	异丙基
1684	4	4-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$

[3464]

1685	4	4-iPr-苯基	CF_3
1686	4	4-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
1687	4	4-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1688	4	4-iPr-苯基	环丙基
1689	4	4-iPr-苯基	环丁基
1690	4	4-iPr-苯基	环戊基
1691	4	4-iPr-苯基	环己基
1692	4	4-iPr-苯基	3-吡啶基
1693	4	4-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1694	4	4-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1695	4	4-iPr-苯基	2-呋喃基
1696	4	3-吗啉代-苯基	乙基
1697	4	3-吗啉代-苯基	正丙基
1698	4	3-吗啉代-苯基	异丙基
1699	4	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1700	4	3-吗啉代-苯基	CF_3
1701	4	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1702	4	3-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1703	4	3-吗啉代-苯基	环丙基
1704	4	3-吗啉代-苯基	环丁基
1705	4	3-吗啉代-苯基	环戊基
1706	4	3-吗啉代-苯基	环己基
1707	4	3-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1708	4	3-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1709	4	3-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1710	4	3-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1711	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	乙基
1712	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	正丙基
1713	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	异丙基
1714	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1715	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	CF_3
1716	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1717	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1718	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丙基
1719	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环丁基
1720	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环戊基
1721	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	环己基
1722	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1723	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1724	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基

[3465]

1725	4	4-氰基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1726	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	乙基
1727	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	正丙基
1728	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	异丙基
1729	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1730	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	CF_3
1731	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1732	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1733	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丙基
1734	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环丁基
1735	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环戊基
1736	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	环己基
1737	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1738	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1739	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1740	4	4-hydroxy-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1741	4	2-CH_3-苯基	乙基
1742	4	2-CH_3-苯基	正丙基
1743	4	2-CH_3-苯基	异丙基
1744	4	2-CH_3-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1745	4	2-CH_3-苯基	CF_3
1746	4	2-CH_3-苯基	$-CH_2CF_3$
1747	4	2-CH_3-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1748	4	2-CH_3-苯基	环丙基
1749	4	2-CH_3-苯基	环丁基
1750	4	2-CH_3-苯基	环戊基
1751	4	2-CH_3-苯基	环己基
1752	4	2-CH_3-苯基	3-吡啶基
1753	4	2-CH_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1754	4	2-CH_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1755	4	2-CH_3-苯基	2-呋喃基
1756	4	4-OH-苯基	乙基
1757	4	4-OH-苯基	正丙基
1758	4	4-OH-苯基	异丙基
1759	4	4-OH-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1760	4	4-OH-苯基	CF_3
1761	4	4-OH-苯基	$-CH_2CF_3$
1762	4	4-OH-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1763	4	4-OH-苯基	环丙基
1764	4	4-OH-苯基	环丁基

[3466]

1765	4	4-OH-苯基	环戊基
1766	4	4-OH-苯基	环己基
1767	4	4-OH-苯基	3-吡啶基
1768	4	4-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1769	4	4-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1770	4	4-OH-苯基	2-呋喃基
1771	4	2-OH-苯基	乙基
1772	4	2-OH-苯基	正丙基
1773	4	2-OH-苯基	异丙基
1774	4	2-OH-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1775	4	2-OH-苯基	CF_3
1776	4	2-OH-苯基	$-CH_2CF_3$
1777	4	2-OH-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1778	4	2-OH-苯基	环丙基
1779	4	2-OH-苯基	环丁基
1780	4	2-OH-苯基	环戊基
1781	4	2-OH-苯基	环己基
1782	4	2-OH-苯基	3-吡啶基
1783	4	2-OH-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1784	4	2-OH-苯基	1H-咪唑-4-基
1785	4	2-OH-苯基	2-呋喃基
1786	4	3-OMe-苯基	乙基
1787	4	3-OMe-苯基	正丙基
1788	4	3-OMe-苯基	异丙基
1789	4	3-OMe-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1790	4	3-OMe-苯基	CF_3
1791	4	3-OMe-苯基	$-CH_2CF_3$
1792	4	3-OMe-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1793	4	3-OMe-苯基	环丙基
1794	4	3-OMe-苯基	环丁基
1795	4	3-OMe-苯基	环戊基
1796	4	3-OMe-苯基	环己基
1797	4	3-OMe-苯基	3-吡啶基
1798	4	3-OMe-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1799	4	3-OMe-苯基	1H-咪唑-4-基
1800	4	3-OMe-苯基	2-呋喃基
1801	4	4-CN-苯基	乙基
1802	4	4-CN-苯基	正丙基
1803	4	4-CN-苯基	异丙基
1804	4	4-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$

[3467]

1805	4	4-CN-苯基	CF_3
1806	4	4-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1807	4	4-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1808	4	4-CN-苯基	环丙基
1809	4	4-CN-苯基	环丁基
1810	4	4-CN-苯基	环戊基
1811	4	4-CN-苯基	环己基
1812	4	4-CN-苯基	3-吡啶基
1813	4	4-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1814	4	4-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1815	4	4-CN-苯基	2-呋喃基
1816	4	2-CN-苯基	乙基
1817	4	2-CN-苯基	正丙基
1818	4	2-CN-苯基	异丙基
1819	4	2-CN-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1820	4	2-CN-苯基	CF_3
1821	4	2-CN-苯基	$-CH_2CF_3$
1822	4	2-CN-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1823	4	2-CN-苯基	环丙基
1824	4	2-CN-苯基	环丁基
1825	4	2-CN-苯基	环戊基
1826	4	2-CN-苯基	环己基
1827	4	2-CN-苯基	3-吡啶基
1828	4	2-CN-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1829	4	2-CN-苯基	1H-咪唑-4-基
1830	4	2-CN-苯基	2-呋喃基
1831	4	3-F-苯基	乙基
1832	4	3-F-苯基	正丙基
1833	4	3-F-苯基	异丙基
1834	4	3-F-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1835	4	3-F-苯基	CF_3
1836	4	3-F-苯基	$-CH_2CF_3$
1837	4	3-F-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1838	4	3-F-苯基	环丙基
1839	4	3-F-苯基	环丁基
1840	4	3-F-苯基	环戊基
1841	4	3-F-苯基	环己基
1842	4	3-F-苯基	3-吡啶基
1843	4	3-F-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1844	4	3-F-苯基	1H-咪唑-4-基

[3468]

1845	4	3-F-苯基	2-呋喃基
1846	4	2-Cl-苯基	乙基
1847	4	2-Cl-苯基	正丙基
1848	4	2-Cl-苯基	异丙基
1849	4	2-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1850	4	2-Cl-苯基	CF_3
1851	4	2-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1852	4	2-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1853	4	2-Cl-苯基	环丙基
1854	4	2-Cl-苯基	环丁基
1855	4	2-Cl-苯基	环戊基
1856	4	2-Cl-苯基	环己基
1857	4	2-Cl-苯基	3-吡啶基
1858	4	2-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1859	4	2-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1860	4	2-Cl-苯基	2-呋喃基
1861	4	4-Cl-苯基	乙基
1862	4	4-Cl-苯基	正丙基
1863	4	4-Cl-苯基	异丙基
1864	4	4-Cl-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1865	4	4-Cl-苯基	CF_3
1866	4	4-Cl-苯基	$-CH_2CF_3$
1867	4	4-Cl-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1868	4	4-Cl-苯基	环丙基
1869	4	4-Cl-苯基	环丁基
1870	4	4-Cl-苯基	环戊基
1871	4	4-Cl-苯基	环己基
1872	4	4-Cl-苯基	3-吡啶基
1873	4	4-Cl-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1874	4	4-Cl-苯基	1H-咪唑-4-基
1875	4	4-Cl-苯基	2-呋喃基
1876	4	3-Br-苯基	乙基
1877	4	3-Br-苯基	正丙基
1878	4	3-Br-苯基	异丙基
1879	4	3-Br-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1880	4	3-Br-苯基	CF_3
1881	4	3-Br-苯基	$-CH_2CF_3$
1882	4	3-Br-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1883	4	3-Br-苯基	环丙基
1884	4	3-Br-苯基	环丁基

1885	4	3-Br-苯基	环戊基
1886	4	3-Br-苯基	环己基
1887	4	3-Br-苯基	3-吡啶基
1888	4	3-Br-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1889	4	3-Br-苯基	1H-咪唑-4-基
1890	4	3-Br-苯基	2-呋喃基
1891	4	2-CF_3-苯基	乙基
1892	4	2-CF_3-苯基	正丙基
1893	4	2-CF_3-苯基	异丙基
1894	4	2-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1895	4	2-CF_3-苯基	CF_3
1896	4	2-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
1897	4	2-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1898	4	2-CF_3-苯基	环丙基
1899	4	2-CF_3-苯基	环丁基
1900	4	2-CF_3-苯基	环戊基
1901	4	2-CF_3-苯基	环己基
1902	4	2-CF_3-苯基	3-吡啶基
1903	4	2-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1904	4	2-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1905	4	2-CF_3-苯基	2-呋喃基
1906	4	4-CF_3-苯基	乙基
1907	4	4-CF_3-苯基	正丙基
1908	4	4-CF_3-苯基	异丙基
1909	4	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$
1910	4	4-CF_3-苯基	CF_3
1911	4	4-CF_3-苯基	-CH_2CF_3
1912	4	4-CF_3-苯基	-$CH_2CH_2CF_3$
1913	4	4-CF_3-苯基	环丙基
1914	4	4-CF_3-苯基	环丁基
1915	4	4-CF_3-苯基	环戊基
1916	4	4-CF_3-苯基	环己基
1917	4	4-CF_3-苯基	3-吡啶基
1918	4	4-CF_3-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1919	4	4-CF_3-苯基	1H-咪唑-4-基
1920	4	4-CF_3-苯基	2-呋喃基
1921	4	3-iPr-苯基	乙基
1922	4	3-iPr-苯基	正丙基
1923	4	3-iPr-苯基	异丙基
1924	4	3-iPr-苯基	-$CH_2CH(CH_3)_2$

[3469]

[3470]

1925	4	3-iPr-苯基	CF_3
1926	4	3-iPr-苯基	$-CH_2CF_3$
1927	4	3-iPr-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1928	4	3-iPr-苯基	环丙基
1929	4	3-iPr-苯基	环丁基
1930	4	3-iPr-苯基	环戊基
1931	4	3-iPr-苯基	环己基
1932	4	3-iPr-苯基	3-吡啶基
1933	4	3-iPr-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1934	4	3-iPr-苯基	1H-咪唑-4-基
1935	4	3-iPr-苯基	2-呋喃基
1936	4	2-吗啉代-苯基	乙基
1937	4	2-吗啉代-苯基	正丙基
1938	4	2-吗啉代-苯基	异丙基
1939	4	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1940	4	2-吗啉代-苯基	CF_3
1941	4	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1942	4	2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1943	4	2-吗啉代-苯基	环丙基
1944	4	2-吗啉代-苯基	环丁基
1945	4	2-吗啉代-苯基	环戊基
1946	4	2-吗啉代-苯基	环己基
1947	4	2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1948	4	2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1949	4	2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
1950	4	2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
1951	4	4-吗啉代-苯基	乙基
1952	4	4-吗啉代-苯基	正丙基
1953	4	4-吗啉代-苯基	异丙基
1954	4	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
1955	4	4-吗啉代-苯基	CF_3
1956	4	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
1957	4	4-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
1958	4	4-吗啉代-苯基	环丙基
1959	4	4-吗啉代-苯基	环丁基
1960	4	4-吗啉代-苯基	环戊基
1961	4	4-吗啉代-苯基	环己基
1962	4	4-吗啉代-苯基	3-吡啶基
1963	4	4-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
1964	4	4-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基

	1965	4	4-吗啉代-苯基	2-呋喃基
	1966	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	乙基
	1967	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	正丙基
	1968	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	异丙基
	1969	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	1970	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	CF_3
	1971	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CF_3$
	1972	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	$-CH_2CH_2CF_3$
	1973	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丙基
	1974	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环丁基
	1975	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环戊基
	1976	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	环己基
	1977	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	3-吡啶基
	1978	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	1979	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	1H-咪唑-4-基
	1980	4	4-甲基-2-吗啉代-苯基	2-呋喃基
	1981	1	亚萘-1-基	乙基
	1982	1	亚萘-1-基	正丙基
	1983	1	亚萘-1-基	异丙基
	1984	1	亚萘-1-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
[3471]	1985	1	亚萘-1-基	CF_3
	1986	1	亚萘-1-基	$-CH_2CF_3$
	1987	1	亚萘-1-基	$-CH_2CH_2CF_3$
	1988	1	亚萘-1-基	环丙基
	1989	1	亚萘-1-基	环丁基
	1990	1	亚萘-1-基	环戊基
	1991	1	亚萘-1-基	环己基
	1992	1	亚萘-1-基	3-吡啶基
	1993	1	亚萘-1-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	1994	1	亚萘-1-基	1H-咪唑-4-基
	1995	1	亚萘-1-基	2-呋喃基
	1996	1	亚萘-2-基	乙基
	1997	1	亚萘-2-基	正丙基
	1998	1	亚萘-2-基	异丙基
	1999	1	亚萘-2-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	2000	1	亚萘-2-基	CF_3
	2001	1	亚萘-2-基	$-CH_2CF_3$
	2002	1	亚萘-2-基	$-CH_2CH_2CF_3$
	2003	1	亚萘-2-基	环丙基
	2004	1	亚萘-2-基	环丁基
	2005	1	亚萘-2-基	环戊基

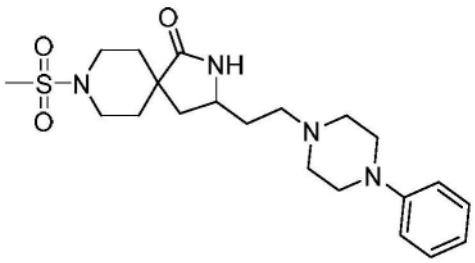
	2006	1	亚萘-2-基	环己基
	2007	1	亚萘-2-基	3-吡啶基
	2008	1	亚萘-2-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	2009	1	亚萘-2-基	1H-咪唑-4-基
	2010	1	亚萘-2-基	2-呋喃基
	2011	2	亚萘-1-基	乙基
	2012	2	亚萘-1-基	正丙基
	2013	2	亚萘-1-基	异丙基
	2014	2	亚萘-1-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	2015	2	亚萘-1-基	CF_3
	2016	2	亚萘-1-基	$-CH_2CF_3$
	2017	2	亚萘-1-基	$-CH_2CH_2CF_3$
	2018	2	亚萘-1-基	环丙基
	2019	2	亚萘-1-基	环丁基
	2020	2	亚萘-1-基	环戊基
	2021	2	亚萘-1-基	环己基
	2022	2	亚萘-1-基	3-吡啶基
	2023	2	亚萘-1-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	2024	2	亚萘-1-基	1H-咪唑-4-基
	2025	2	亚萘-1-基	2-呋喃基
[3472]	2026	2	亚萘-2-基	乙基
	2027	2	亚萘-2-基	正丙基
	2028	2	亚萘-2-基	异丙基
	2029	2	亚萘-2-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	2030	2	亚萘-2-基	CF_3
	2031	2	亚萘-2-基	$-CH_2CF_3$
	2032	2	亚萘-2-基	$-CH_2CH_2CF_3$
	2033	2	亚萘-2-基	环丙基
	2034	2	亚萘-2-基	环丁基
	2035	2	亚萘-2-基	环戊基
	2036	2	亚萘-2-基	环己基
	2037	2	亚萘-2-基	3-吡啶基
	2038	2	亚萘-2-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	2039	2	亚萘-2-基	1H-咪唑-4-基
	2040	2	亚萘-2-基	2-呋喃基
	2041	3	亚萘-1-基	乙基
	2042	3	亚萘-1-基	正丙基
	2043	3	亚萘-1-基	异丙基
	2044	3	亚萘-1-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	2045	3	亚萘-1-基	CF_3
	2046	3	亚萘-1-基	$-CH_2CF_3$

	2047	3	亚萘-1-基	$-CH_2CH_2CF_3$
	2048	3	亚萘-1-基	环丙基
	2049	3	亚萘-1-基	环丁基
	2050	3	亚萘-1-基	环戊基
	2051	3	亚萘-1-基	环己基
	2052	3	亚萘-1-基	3-吡啶基
	2053	3	亚萘-1-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	2054	3	亚萘-1-基	1H-咪唑-4-基
	2055	3	亚萘-1-基	2-呋喃基
	2056	3	亚萘-2-基	乙基
	2057	3	亚萘-2-基	正丙基
	2058	3	亚萘-2-基	异丙基
	2059	3	亚萘-2-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	2060	3	亚萘-2-基	CF_3
	2061	3	亚萘-2-基	$-CH_2CF_3$
	2062	3	亚萘-2-基	$-CH_2CH_2CF_3$
	2063	3	亚萘-2-基	环丙基
	2064	3	亚萘-2-基	环丁基
	2065	3	亚萘-2-基	环戊基
	2066	3	亚萘-2-基	环己基
[3473]	2067	3	亚萘-2-基	3-吡啶基
	2068	3	亚萘-2-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	2069	3	亚萘-2-基	1H-咪唑-4-基
	2070	3	亚萘-2-基	2-呋喃基
	2071	4	亚萘-1-基	乙基
	2072	4	亚萘-1-基	正丙基
	2073	4	亚萘-1-基	异丙基
	2074	4	亚萘-1-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
	2075	4	亚萘-1-基	CF_3
	2076	4	亚萘-1-基	$-CH_2CF_3$
	2077	4	亚萘-1-基	$-CH_2CH_2CF_3$
	2078	4	亚萘-1-基	环丙基
	2079	4	亚萘-1-基	环丁基
	2080	4	亚萘-1-基	环戊基
	2081	4	亚萘-1-基	环己基
	2082	4	亚萘-1-基	3-吡啶基
	2083	4	亚萘-1-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
	2084	4	亚萘-1-基	1H-咪唑-4-基
	2085	4	亚萘-1-基	2-呋喃基
	2086	4	亚萘-2-基	乙基
	2087	4	亚萘-2-基	正丙基

[3474]

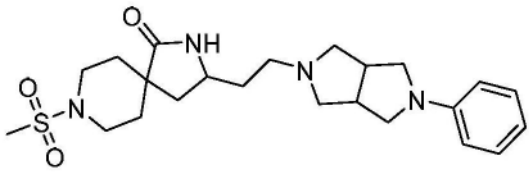
2088	4	亚萘-2-基	异丙基
2089	4	亚萘-2-基	$-CH_2CH(CH_3)_2$
2090	4	亚萘-2-基	CF_3
2091	4	亚萘-2-基	$-CH_2CF_3$
2092	4	亚萘-2-基	$-CH_2CH_2CF_3$
2093	4	亚萘-2-基	环丙基
2094	4	亚萘-2-基	环丁基
2095	4	亚萘-2-基	环戊基
2096	4	亚萘-2-基	环己基
2097	4	亚萘-2-基	3-吡啶基
2098	4	亚萘-2-基	1-甲基-1H-吡唑-4-基
2099	4	亚萘-2-基	1H-咪唑-4-基
2100	4	亚萘-2-基	2-呋喃基

[3475] 为了展示本发明的化合物在本文中命名和提及的方式,具有下式的化合物:

[3476] 

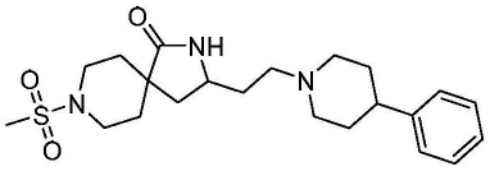
[3477] 化学名称为8-(甲基磺酰基)-3-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮。

[3478] 为了展示本发明的化合物在本文中命名和提及的方式,具有下式的化合物:

[3479] 

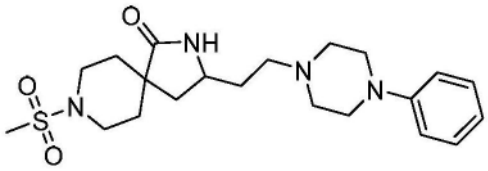
[3480] 化学名称为8-(甲基磺酰基)-3-(2-(5-苯基六氢吡咯并[3,4-c]吡咯-2(1H)-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮。

[3481] 为了展示本发明的化合物在本文中命名和提及的方式,具有下式的化合物:

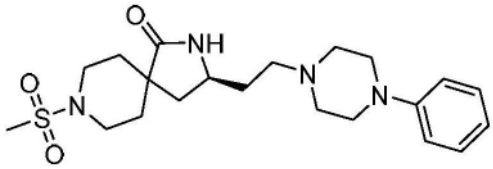
[3482] 

[3483] 化学名称为8-(甲基磺酰基)-3-(2-(4-苯基哌啶-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮。

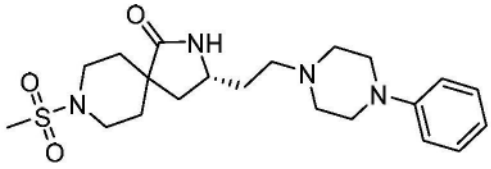
[3484] 出于本发明的目的,由外消旋式描绘的化合物,例如:

[3485] 

[3486] 将同样代表具有下式：

[3487] 

[3488] 或下式：

[3489] 

[3490] 的两种对映体中的任一种或它们的混合物，或者在存在第二手性中心的情况下，所有非对映体。

[3491] 在本文提供的所有实施方案中，合适的任选取代基的实例不旨在限制要求保护的本发明的范围。本发明的化合物可含有本文提供的任一取代基或取代基的组合。

[3492] 用于制备本发明的5-羟色胺受体7活性调节剂的方法

[3493] 本发明还涉及一种用于制备本发明的5-羟色胺受体7活性调节剂的方法。

[3494] 本教导内容的化合物可以按照本文概述的工序，通过采用本领域技术人员已知的标准合成方法和工序，由市售原料、文献中已知的化合物或易于制备的中间体制备。用于制备有机分子和官能团转化和操作的标准合成方法和工序可以从相关科学文献或本领域的标准教科书中容易地获得。应当理解，在给出典型或优选的工艺条件(即反应温度、时间、反应物的摩尔比、溶剂、压力等)的情况下，除非另有说明，否则也可以使用其他工艺条件。最佳反应条件可以随所用的特定反应物或溶剂而变化，但这些条件可以由本领域技术人员通过常规优化工序确定。有机合成领域的技术人员将认识到，为了优化本文所述化合物的形成，可以改变所提出的合成步骤的性质和顺序。

[3495] 本文所述的方法可按照本领域已知的任何合适方法监测。例如，产物形成可通过光谱手段诸如核磁共振光谱(例如，^{1}H或^{13}C)、红外光谱、分光光度法(例如，UV-可见光)、质谱法或者通过色谱法诸如高压液相色谱(HPLC)、气相色谱(GC)、凝胶渗透色谱(GPC)或薄层色谱(TLC)来监测。

[3496] 化合物的制备可涉及各种化学基团的保护和去保护。本领域技术人员可以容易地确定对保护和去保护的需求以及适当保护基团的选择。保护基团的化学性质可见于例如Greene等人，Protective Groups in Organic Synthesis，第2版(Wiley&Sons，1991)中，该文献的全部公开内容以引用方式并入本文以用于所有目的。

[3497] 本文所述的反应或方法可在合适的溶剂中进行，所述溶剂可由有机合成领域的技术人员容易地选择。合适的溶剂通常在进行反应的温度下与反应物、中间体和/或产物基本上不反应，所述温度是可在溶剂的冻结温度到溶剂的沸腾温度范围内的温度。给定的反应

可以在一种溶剂或多于一种溶剂的混合物中进行。根据具体的反应步骤,可以选择适用于特定反应步骤的溶剂。

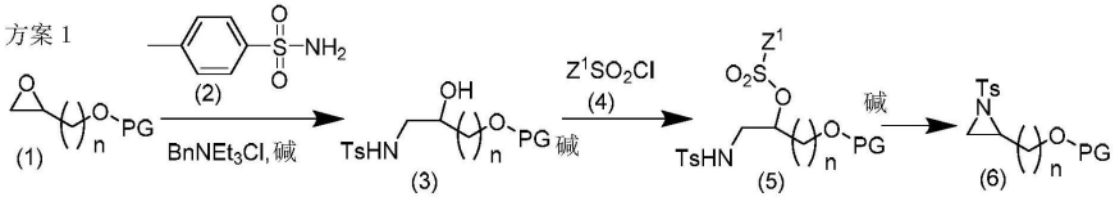
[3498] 这些教导内容的化合物可通过有机化学领域中已知的方法制备。用于制备这些教导内容的化合物的试剂可以是商购获得的,或者可通过文献中描述的标准工序进行制备。例如,本发明的化合物可按照通用合成方案中所示的方法制备:

[3499] 用于制备化合物的通用合成方案

[3500] 用于制备本发明化合物的试剂可以是商购获得的,或者可通过文献中描述的标准工序进行制备。根据本发明,属中的化合物可通过以下反应方案之一制备。因此,本发明的特征还在于如本文所述的任何合成中间体或方法。

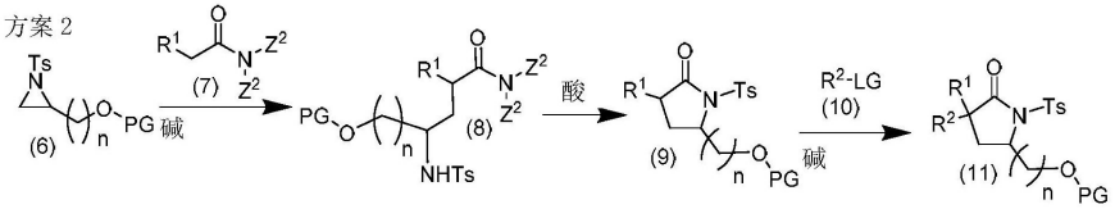
[3501] 本公开的化合物可按照方案1中概述的方法制备。

[3502] 方案 1



[3503] 在$BnNEt_3Cl$的存在下,在碱诸如碳酸钾、碳酸钠、碳酸铯、碳酸锂、氢氧化钠,氢氧化钾、氢氧化铯、氢氧化锂等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使适当取代的式(1)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中PG为选自由苄基、碳酸叔丁酯、碳酸苄酯和叔丁基二甲基甲硅烷基组成的组的保护基团)与式(2)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应,得到式(3)化合物。在碱诸如吡啶、2,6-二甲基吡啶、2,6-二叔丁基吡啶、三乙胺、二异丙基乙胺等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(3)化合物与式(4)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中Z^1选自由甲基、三氟甲基、对甲苯基和对-NO_2-苯基组成的组)反应,得到式(5)化合物。在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(5)化合物与碱诸如碳酸钾、碳酸钠、碳酸铯、碳酸锂等反应,得到式(6)化合物。

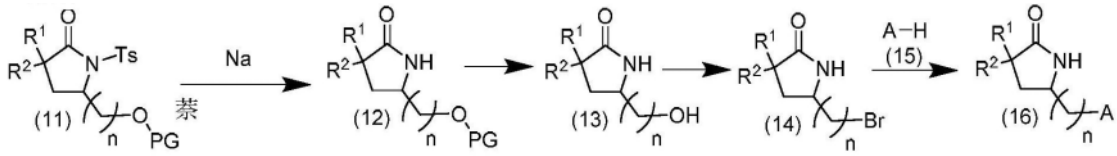
[3504] 方案 2



[3505] 在碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(6)化合物与式(7)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应,得到式(8)化合物。在溶剂诸如苯、甲苯、对二甲苯、四氢呋喃、1,4-

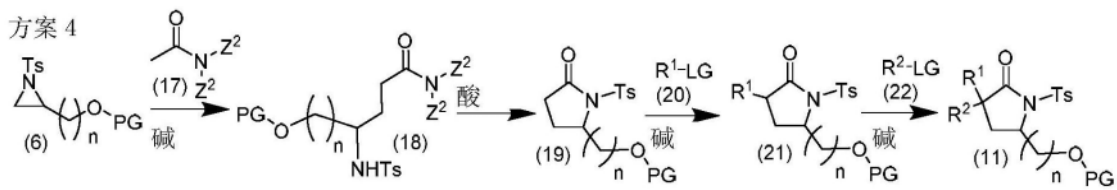
二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(8)化合物与酸诸如盐酸、氢溴酸、硫酸、对甲苯磺酸、乙酸、三氟乙酸等反应，得到式(9)化合物。在碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下，在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(9)化合物与式(10)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物，其中LG选自由溴、氯、甲磺酸酯、对甲苯磺酸酯组成的组)反应，得到式(11)化合物。

[3506] 方案3

[3507] 

[3508] 在萘的存在下，在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(11)化合物与钠反应，得到式(12)化合物。在钯催化剂诸如碳载钯、硫酸钡载钯、乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)等的存在下，在有机溶剂诸如甲醇、乙醇、乙酸乙酯、四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷、N,N-二甲基甲酰胺等中，任选地通过加热，使式(12)化合物与氢气反应，得到式(13)化合物。替代地，在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(12)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应，得到式(13)化合物。替代地，在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(12)化合物与四丁基氟化铵反应，得到式(13)化合物。在三苯基膦的存在下，在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使(13)化合物与四溴化碳反应，得到式(14)化合物。在碱诸如碳酸钠、碳酸钾、碳酸锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾、碳酸氢锂、三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下，在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(14)化合物与式(15)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应，得到式(16)化合物。

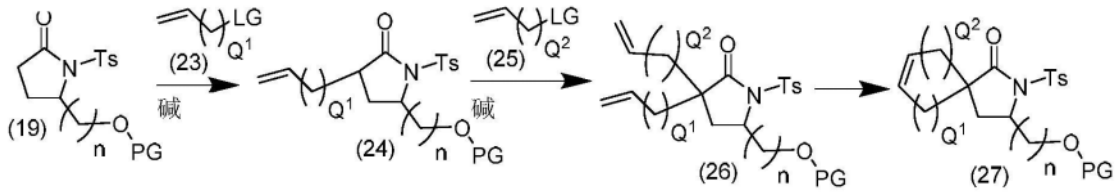
方案 4

[3509] 

[3510] 在碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下，在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中，任选地

通过加热,任选地通过微波辐射,使式(6)化合物与式(17)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应,得到式(18)化合物。在溶剂诸如苯、甲苯、对二甲苯、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(18)化合物与酸诸如盐酸、氢溴酸、硫酸、对甲苯磺酸、乙酸、三氟乙酸等反应,得到式(19)化合物。在碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(19)化合物与式(20)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中LG选自由溴、氯、甲磺酸酯、对甲苯磺酸酯组成的组)反应,得到式(21)化合物。在碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(21)化合物与式(22)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中LG选自由溴、氯、甲磺酸酯、对甲苯磺酸酯组成的组)反应,得到式(11)化合物。

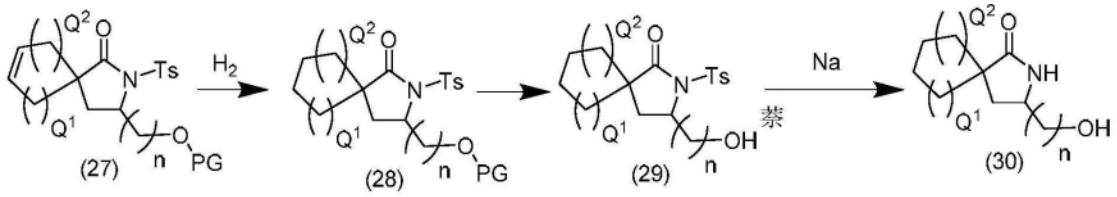
[3511] 方案5

[3512] 

[3513] 在碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(19)化合物与式(23)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中LG选自由溴、氯、甲磺酸酯、对甲苯磺酸酯组成的组,并且其中Q^1选自由1和2组成的组)反应,得到式(24)化合物。在碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(24)化合物与式(25)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中LG选自由溴、氯、甲磺酸酯、对甲苯磺酸酯组成的组,并且其中Q^2选自由1和2组成的组)反应,得到式(26)化合物。在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(26)化合物与钌催化剂诸如亚苄基-双(三环己基膦)二氯钌、(1,3-双(2,4,6-三甲基苯基)-2-亚咪唑烷基)二氯(苯基亚甲基)(三环己基膦)钌、(1,3-双-(2,4,6-三甲基苯基)-2-亚咪唑烷基)二氯(o-异丙氧基苯基亚甲基)钌、二氯(2-异丙氧基苯基亚甲基)(三环己基膦)钌(II)、[1,3-双(2-甲基苯基)-2-亚咪唑烷基]二氯(苯基亚甲基)(三环己基膦)钌(II)、二氯[1,3-双(2,4,6-三甲基苯基)-2-亚咪唑烷基](亚苄基)双(3-溴吡啶)钌(II)、二氯[1,3-双(2,4,6-三甲基苯基)-2-亚咪唑烷基](3-甲基-2-亚丁烯

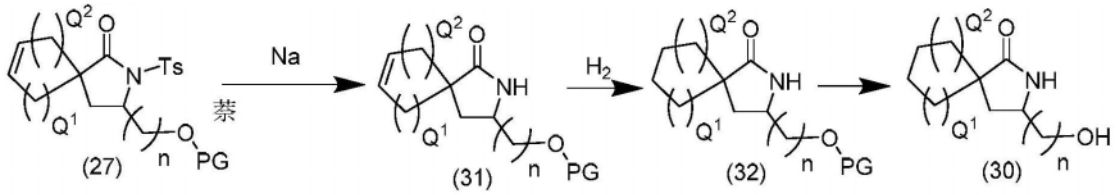
基)(三环己基膦)钌(II)、二氯[1,3-双(2-甲基苯基)-2-亚咪唑烷基](2-异丙氧基苯基亚甲基)钌(II)、[1,3-二均三甲苯基-2-亚咪唑烷基]二氯[3-(2-吡啶基)亚丙基]钌(II)、二氯[1,3-双(2,6-异丙基苯基)-2-亚咪唑烷基](2-异丙氧基苯基亚甲基)钌(II)、二氯(三环己基膦)[(三环己基正膦基)亚甲基]钌四氟硼酸盐、二氯[1,3-双(2,4,6-三甲基苯基)-2-亚咪唑烷基][(三环己基正膦基)亚甲基]钌(II)四氟硼酸盐、[2-(1-甲基乙氧基-0)苯基甲基-C](硝酸基-0,0′){rel-(2R,5R,7R)-金刚烷-2,1-二基[3-(2,4,6-三甲基苯基)-1-咪唑烷基-2-亚基]}钌、二氯[1,3-双(2,6-异丙基苯基)-2-亚咪唑烷基](亚苄基)(三环己基膦)钌(II)、[1,3-双(2-甲基苯基)-2-亚咪唑烷基]二氯(苯基亚甲基)(三环己基膦)钌(II)、二氯[1,3-双(2,4,6-三甲基苯基)-2-亚咪唑烷基][3-(2-吡啶基)亚丙基]钌(II)等反应,得到式(27)化合物。

[3514] 方案6

[3515] 

[3516] 在钯催化剂诸如碳载钯、硫酸钡载钯、乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)等的存在下,在有机溶剂诸如甲醇、乙醇、乙酸乙酯、四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,使式(27)化合物与氢气反应,得到式(28)化合物。在钯催化剂诸如碳载钯、硫酸钡载钯、乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)等的存在下,在有机溶剂诸如甲醇、乙醇、乙酸乙酯、四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,使式(28)化合物与氢气反应,得到式(29)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(28)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(29)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(28)化合物与四丁基氟化铵反应,得到式(29)化合物。在萘的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(29)化合物与钠反应,得到式(30)化合物。

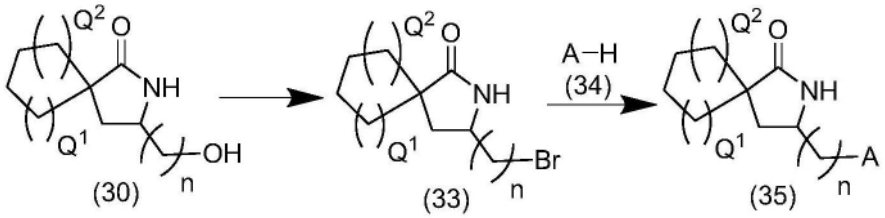
[3517] 方案7

[3518] 

[3519] 替代地,在萘的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(27)化合物与钠反应,

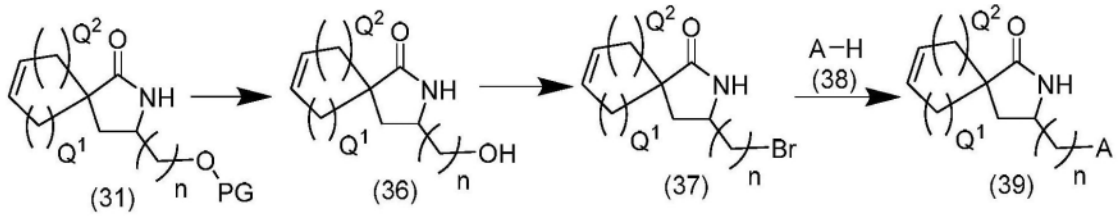
得到式(31)化合物。在钯催化剂诸如碳载钯、硫酸钡载钯、乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)等的存在下,在有机溶剂诸如甲醇、乙醇、乙酸乙酯、四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,使式(31)化合物与氢气反应,得到式(32)化合物。在钯催化剂诸如碳载钯、硫酸钡载钯、乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)等的存在下,在有机溶剂诸如甲醇、乙醇、乙酸乙酯、四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,使式(32)化合物与氢气反应,得到式(30)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(32)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(30)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(32)化合物与四丁基氟化铵反应,得到式(30)化合物。

[3520] 方案8

[3521] 

[3522] 在三苯基膦的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使(30)化合物与四溴化碳反应,得到式(33)化合物。在碱诸如碳酸钠、碳酸钾、碳酸锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾、碳酸氢锂、三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(33)化合物与式(34)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应,得到式(35)化合物。

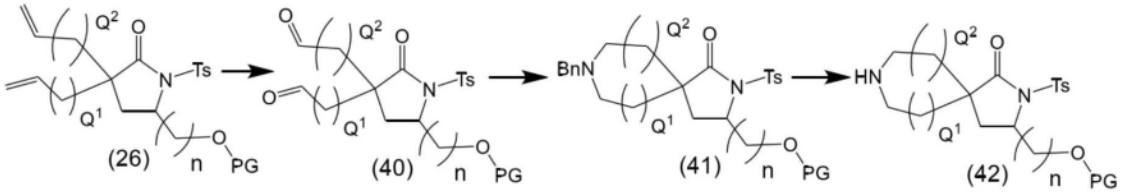
[3523] 方案9

[3524] 

[3525] 在钯催化剂诸如碳载钯、硫酸钡载钯、乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)等的存在下,在有机溶剂诸如甲醇、乙醇、乙酸乙酯、四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,使式(31)化合物与氢气反应,得到式(36)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲

基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(31)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(36)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(31)化合物与四丁基氟化铵反应,得到式(36)化合物。在三苯基膦的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使(36)化合物与四溴化碳反应,得到式(37)化合物。在碱诸如碳酸钠、碳酸钾、碳酸锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾、碳酸氢锂、三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(37)化合物与式(38)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应,得到式(39)化合物。

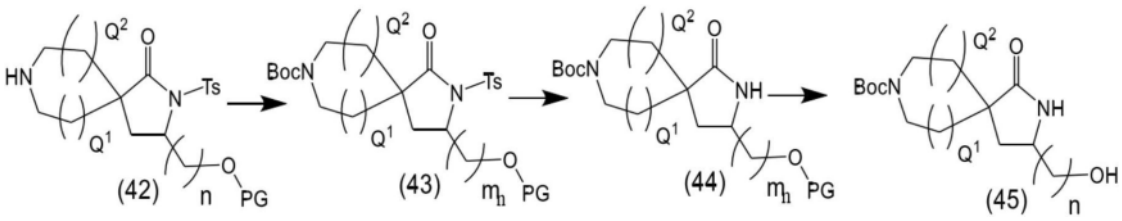
[3526] 方案10

[3527] 

[3528] 在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(26)化合物与式臭氧化合物反应。然后在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,用三苯基膦处理所得物质,得到式(40)化合物。替代地在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(26)化合物与式臭氧化合物反应。然后在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,用二甲基硫醚处理所得物质,得到式(40)化合物。替代地,在高碘酸钠的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(26)化合物与氯化钌反应,得到式(40)化合物。替代地,在铁氰化钾的存在下,任选地在碳酸钾的存在下,任选地在碱诸如氢氧化钾、氢氧化钠、氢氧化锂等的存在下,在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(26)化合物与脱水锇酸钾反应,得到式(40)化合物。替代地,在高碘酸钠的存在下,在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地在碱诸如吡啶、2,6-二甲基砒啶、2,6-二-叔丁基吡啶等的存在下,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(26)化合物与四氧化锇反应,

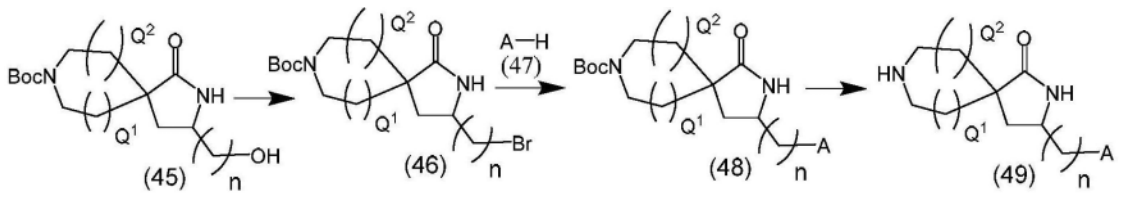
得到式(40)化合物。替代地,在N-甲基吗啉-N-氧化物的存在下,在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(26)化合物与四氧化锇反应,得到式(40)化合物。在还原剂诸如硼氢化钠、三乙酰氧基硼氢化钠、氰基硼氢化钠、硼氢化锂、三乙酰氧基硼氢化锂、氰基硼氢化锂等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(40)化合物与苄胺反应,得到式(41)化合物。在钯催化剂诸如碳载钯、硫酸钡载钯、乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)等的存在下,在有机溶剂诸如甲醇、乙醇、乙酸乙酯、四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷、N,N-二甲基甲酰胺等中,使式(41)化合物与氢气反应,得到式(42)化合物。

[3529] 方案11

[3530] 

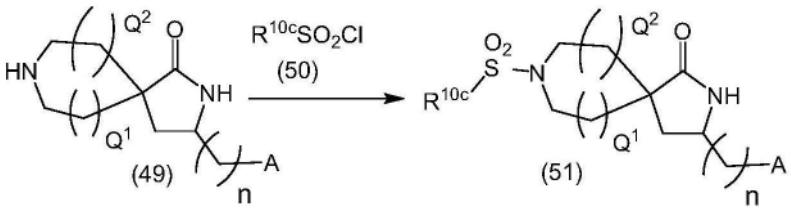
[3531] 在碱诸如吡啶、2,6-二甲基吡啶、三乙胺、二异丙基乙胺等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、甲醇、乙醇、异丙醇等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(42)化合物与二叔丁基二碳酸酯反应,得到式(43)化合物。在萘的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(43)化合物与钠反应,得到式(44)化合物。在钯催化剂诸如碳载钯、硫酸钡载钯、乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)等的存在下,在有机溶剂诸如甲醇、乙醇、乙酸乙酯、四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,使式(44)化合物与氢气反应,得到式(45)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(44)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(45)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(44)化合物与四丁基氟化铵反应,得到式(45)化合物。

[3532] 方案12

[3533] 

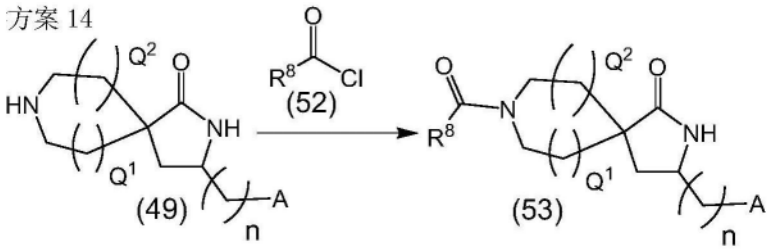
[3534] 在三苯基膦的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使(45)化合物与四溴化碳反应,得到式(46)化合物。在碱诸如碳酸钠、碳酸钾、碳酸锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾、碳酸氢锂、三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(46)化合物与式(47)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应,得到式(48)化合物。任选地在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(48)化合物与酸诸如三氟乙酸、甲酸、乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(49)化合物。

[3535] 方案13

[3536] 

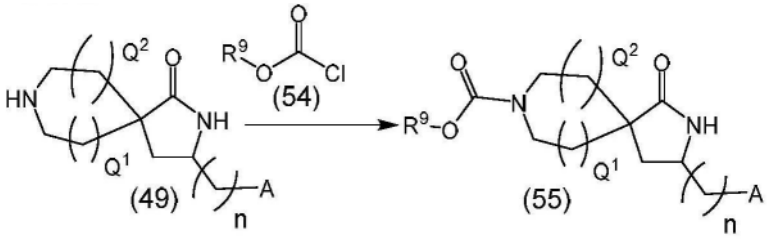
[3537] 在碱诸如三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(49)化合物与式(50)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应,得到式(51)化合物。

方案 14

[3538] 

[3539] 在碱诸如三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(49)化合物与式(52)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应,得到式(53)化合物。

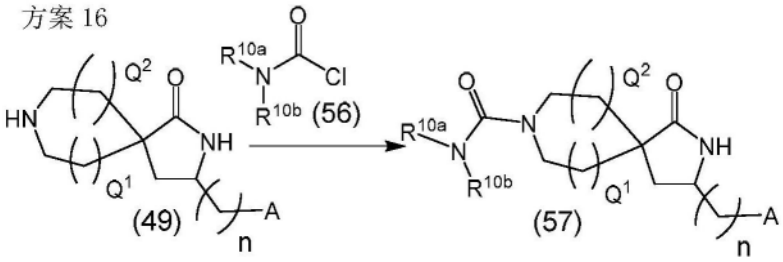
[3540] 方案15

[3541] 

[3542] 在碱诸如三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰

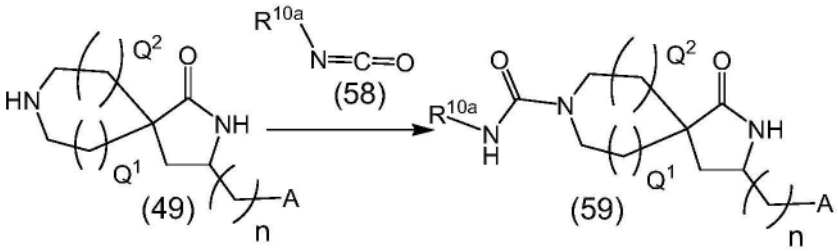
胺、乙腈等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(49)化合物与式(54)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应，得到式(55)化合物。

方案 16

[3543] 

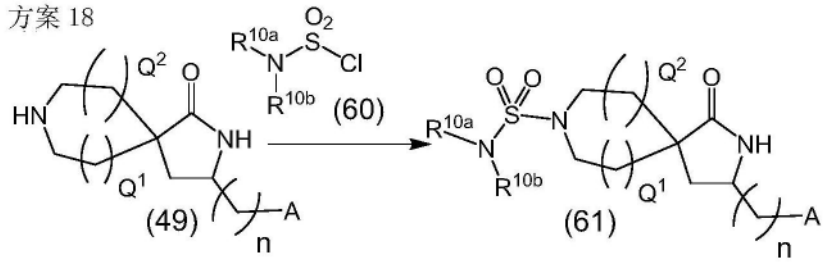
[3544] 在碱诸如三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下，在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(49)化合物与式(56)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应，得到式(57)化合物。

[3545] 方案17

[3546] 

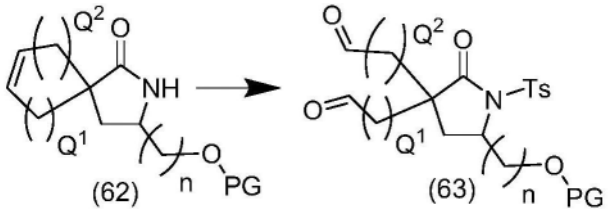
[3547] 在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(49)化合物与式(58)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应，得到式(59)化合物。

方案 18

[3548] 

[3549] 在碱诸如三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下，在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(49)化合物与式(60)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应，得到式(61)化合物。

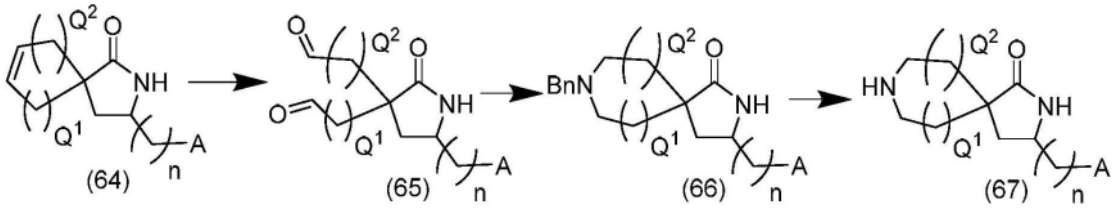
[3550] 方案19

[3551] 

[3552] 在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二

甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(62)化合物与式臭氧化合物反应。然后在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,用三苯基膦处理所得物质,得到式(63)化合物。替代地在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(62)化合物与式臭氧化合物反应。然后在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,用二甲基硫醚处理所得物质,得到式(63)化合物。替代地,在高碘酸钠的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(62)化合物与氯化钌反应,得到式(63)化合物。替代地,在铁氰化钾的存在下,任选地在碳酸钾的存在下,任选地在碱诸如氢氧化钾、氢氧化钠、氢氧化锂等的存在下,在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(62)化合物与脱水锇酸钾反应,得到式(63)化合物。替代地,在高碘酸钠的存在下,在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地在碱诸如吡啶、2,6-二甲基砒啶、2,6-二-叔丁基吡啶等的存在下,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(62)化合物与四氧化锇反应,得到式(63)化合物。替代地,在N-甲基吗啉-N-氧化物的存在下,在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(62)化合物与四氧化锇反应,得到式(63)化合物。

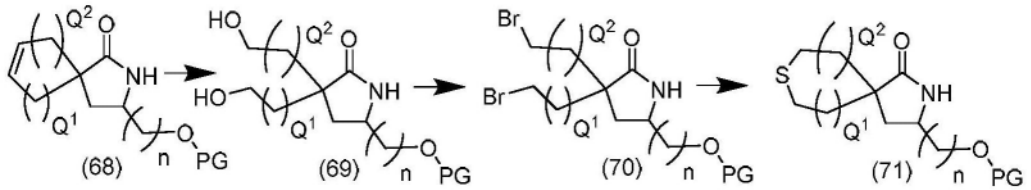
[3553] 方案20

[3554] 

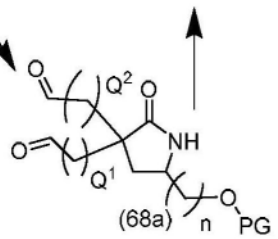
[3555] 在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(64)化合物与式臭氧化合物反应。然后在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,用三苯基膦处理所得物质,得到式(65)化合物。替代地在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(64)化合物与式臭氧化合物反应。然后在溶剂诸如二氯

甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,用二甲基硫醚处理所得物质,得到式(65)化合物。替代地,在高碘酸钠的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(64)化合物与氯化钌反应,得到式(65)化合物。替代地,在铁氰化钾的存在下,任选地在碳酸钾的存在下,任选地在碱诸如氢氧化钾、氢氧化钠、氢氧化锂等的存在下,在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(64)化合物与脱水锇酸钾反应,得到式(65)化合物。替代地,在高碘酸钠的存在下,在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地在碱诸如吡啶、2,6-二甲基砒啶、2,6-二-叔丁基吡啶等的存在下,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(64)化合物与四氧化锇反应,得到式(65)化合物。替代地,在N-甲基吗啉-N-氧化物的存在下,在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(64)化合物与四氧化锇反应,得到式(65)化合物。在还原剂诸如硼氢化钠、三乙酰氧基硼氢化钠、氰基硼氢化钠、硼氢化锂、三乙酰氧基硼氢化锂、氰基硼氢化锂等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(65)化合物与苄胺反应,得到式(66)化合物。在钯催化剂诸如碳载钯、硫酸钡载钯、乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)等的存在下,在有机溶剂诸如甲醇、乙醇、乙酸乙酯、四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷、N,N-二甲基甲酰胺等中,使式(66)化合物与氢气反应,得到式(67)化合物。

[3556] 方案21



[3557]

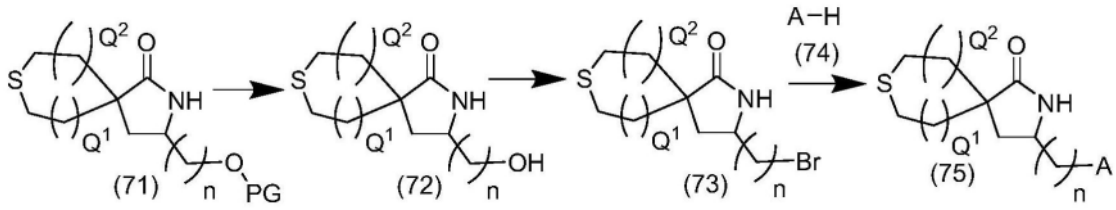


[3558] 在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(68)化合物与式臭氧化合物反应。在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙

烷、甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，用还原剂诸如硼氢化钠、三乙酰氧基硼氢化钠、氰基硼氢化钠、硼氢化锂、三乙酰氧基硼氢化锂、氰基硼氢化锂等处理所得物质，得到式(69)化合物。替代地在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(68)化合物与式臭氧化合物反应。然后在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，用二甲基硫醚处理所得物质，得到式(68a)化合物。替代地，在高碘酸钠的存在下，在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中，任选地在水的存在下，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(68)化合物与氯化钌反应，得到式(68a)化合物。替代地，在铁氰化钾的存在下，任选地在碳酸钾的存在下，任选地在碱诸如氢氧化钾、氢氧化钠、氢氧化锂等的存在下，在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下，任选地在水的存在下，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(68)化合物与脱水锇酸钾反应，得到式(68a)化合物。替代地，在高碘酸钠的存在下，在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下，任选地在碱诸如吡啶、2,6-二甲基吡啶、2,6-二-叔丁基吡啶等的存在下，任选地在水的存在下，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(68)化合物与四氧化锇反应，得到式(68a)化合物。替代地，在N-甲基吗啉-N-氧化物的存在下，在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下，任选地在水的存在下，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(68)化合物与四氧化锇反应，得到式(68a)化合物。在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(68a)化合物与还原剂诸如硼氢化钠、三乙酰氧基硼氢化钠、氰基硼氢化钠、硼氢化锂、三乙酰氧基硼氢化锂、氰基硼氢化锂等反应，得到式(69)化合物。在三苯基膦的存在下，在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使(69)化合物与四溴化碳反应，得到式(70)化合物。替代地，在三苯基膦的存在下，在碱诸如吡啶、2,6-二甲基吡啶、2,6-二叔丁基吡啶、三乙胺、二异丙基乙胺等的存在下，在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(69)化合物与溴反应，得到式(70)化合物。替代地，任选地在碱诸如吡啶、2,6-二甲基吡啶、2,6-二叔丁基吡啶、三乙胺、二异丙基乙胺等的存在下，在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(69)化合物与二溴三苯基正膦反应，得到式(70)化合物。在溶剂诸如乙醇、甲醇、异丙醇、N,N-二甲基甲酰胺、

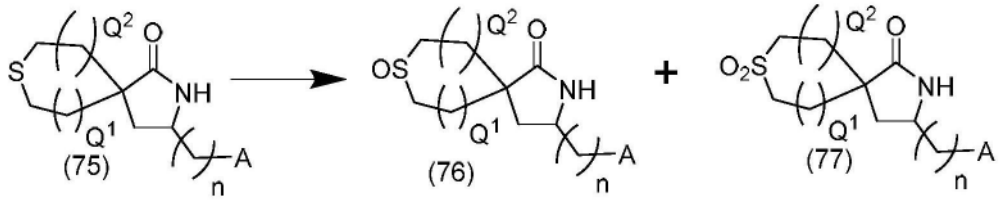
N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(70)化合物与硫化钠反应,得到式(71)化合物。

[3559] 方案22

[3560] 

[3561] 在钯催化剂诸如碳载钯、硫酸钡载钯、乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)等的存在下,在有机溶剂诸如甲醇、乙醇、乙酸乙酯、四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,使式(71)化合物与氢气反应,得到式(72)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(71)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(72)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(71)化合物与四丁基氟化铵反应,得到式(72)化合物。在三苯基膦的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使(72)化合物与四溴化碳反应,得到式(73)化合物。在碱诸如碳酸钠、碳酸钾、碳酸锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾、碳酸氢锂、三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(73)化合物与式(74)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应,得到式(75)化合物。

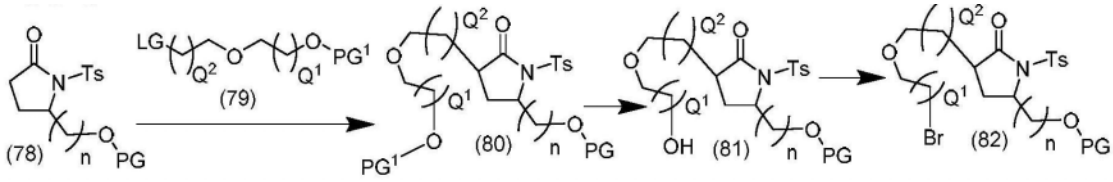
[3562] 方案23

[3563] 

[3564] 在溶剂诸如四氢呋喃、乙醚、1,4-二噁烷、丙酮、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇、水等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(75)化合物与氧化剂诸如间氯过氧苯甲酸、单过氧邻苯二甲酸、过乙酸、过丙酸、过三氟乙酸、高碘酸钾、偏高碘酸钠、过硼酸钠、过一硫酸钾(Oxone®)、过二硫酸钾、二甲基二氧杂环丙烷等反应,得到式(76)和(77)化合物。替代地,在铼催化剂诸如$ReOCl_3(PPh_3)_2$等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、氯仿、四氢呋喃、乙醚、1,4-二噁烷、丙酮、乙腈等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(75)化合物与亚砜诸如二苯基亚砜,二甲基亚砜等反应,得到式(76)和(77)化合物。替代地,在铼催化剂诸如$ReOCl_3(PPh_3)_2$等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、氯仿、四氢呋喃、乙醚、1,4-二噁烷、丙酮、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加

热,任选地通过微波辐射,使式(75)化合物与脲过氧化氢复合物反应,得到式(76)和(77)化合物。替代地,在异丙氧化钛(IV)-二乙基酒石酸钛(IV)的存在下,任选地在氨基醇诸如2-氨基-3-苯基丙-1-醇、2-氨基-4-甲基戊-1-醇、2-氨基-4-(甲硫基)丁-1-醇、2-氨基丙-1-醇等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、氯仿、四氢呋喃、乙醚、1,4-二噁烷、丙酮、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(75)化合物与过氧化氢反应,得到式(76)和(77)化合物。应当理解,本领域技术人员将容易理解,产物(76)和(77)的比例将由所添加的氧化剂的量来控制,并将相应地调节氧化剂的量以产生所需的产物比例。

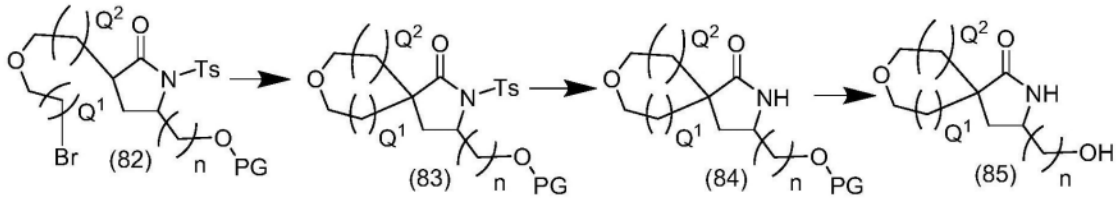
[3565] 方案24

[3566] 

[3567] 在碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使适当取代的式(78)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中PG为选自由苄基、碳酸叔丁酯、碳酸苄酯和叔丁基二甲基甲硅烷基组成的组的保护基团)与式(79)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中PG^1为选自由苄基、碳酸叔丁酯、碳酸苄酯和叔丁基二甲基甲硅烷基组成的组的保护基团,并且其中LG选自由溴、氯、甲磺酸酯、对甲苯磺酸酯组成的组)反应,得到式(80)化合物。在钯催化剂诸如碳载钯、硫酸钡载钯、乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)等的存在下,在有机溶剂诸如甲醇、乙醇、乙酸乙酯、四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,使式(80)化合物与氢气反应,得到式(81)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(80)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(81)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(80)化合物与四丁基氟化铵反应,得到式(81)化合物。在三苯基膦的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(81)化合物与四溴化碳反应,得到式(82)化合物。替代地,在三苯基膦的存在下,在碱诸如吡啶、2,6-二甲基吡啶、2,6-二叔丁基吡啶、三乙胺、二异丙基乙胺等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(81)化合物与溴反应,得到式(82)化合物。替代地,任选地在碱诸如吡啶、2,6-二甲基吡啶、2,6-二叔丁基吡啶、三乙胺、二异丙基乙胺等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二

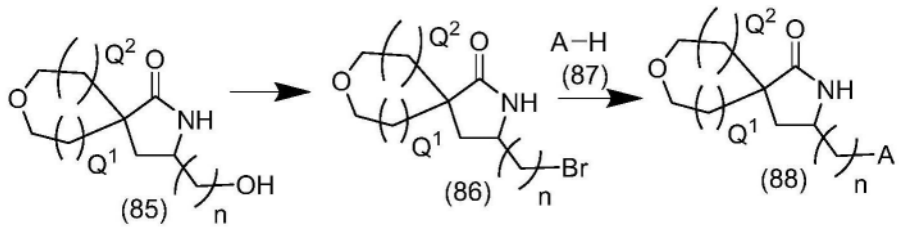
甲基亚砜等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(81)化合物与二溴三苯基正膦反应,得到式(82)化合物。

[3568] 方案25

[3569] 

[3570] 在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(82)化合物与碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等反应,得到式(83)化合物。在荼的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(83)化合物与钠反应,得到式(84)化合物。在钯催化剂诸如碳载钯、硫酸钡载钯、乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)等的存在下,在有机溶剂诸如甲醇、乙醇、乙酸乙酯、四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,使式(84)化合物与氢气反应,得到式(85)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(84)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(85)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(84)化合物与四丁基氟化铵反应,得到式(85)化合物。

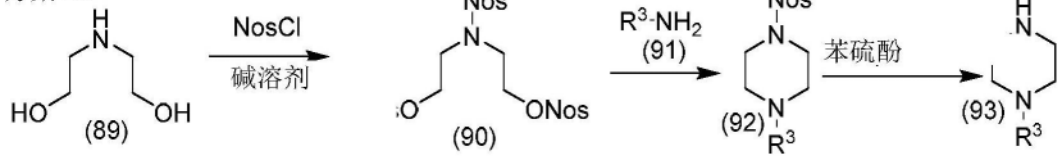
[3571] 方案26

[3572] 

[3573] 在三苯基膦的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(85)化合物与四溴化碳反应,得到式(86)化合物。替代地,在三苯基膦的存在下,在碱诸如吡啶、2,6-二甲基吡啶、2,6-二叔丁基吡啶、三乙胺、二异丙基乙胺等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(85)化合物与溴反应,得到式(86)化合物。替代地,任选地在碱诸如吡啶、2,6-二甲基吡啶、2,6-二叔丁基吡啶、三乙胺、二异丙基乙胺等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜等中,

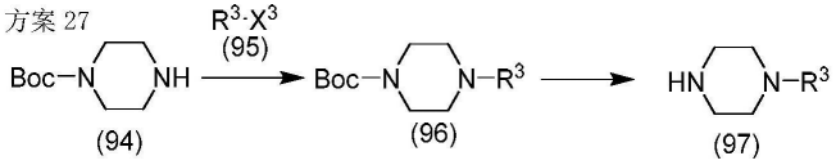
任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(85)化合物与二溴三苯基正膦反应，得到式(86)化合物。在碱诸如碳酸钠、碳酸钾、碳酸锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾、碳酸氢锂、三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下，在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(86)化合物与式(87)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应，得到式(88)化合物。

[3574] 方案 26



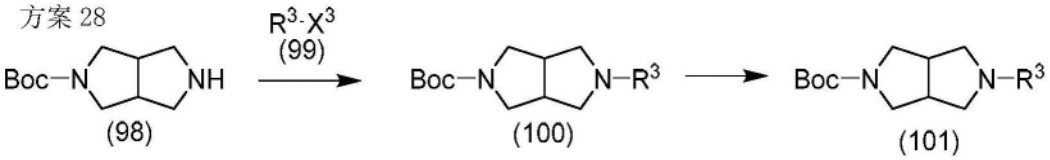
[3575] 在碱诸如三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶、2,6-二甲基吡啶等的存在下，在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷等中，使二乙醇胺(89)与4-硝基苯磺酰氯(NosCl)反应，得到式(90)化合物。然后，在碱诸如三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶、2,6-二甲基吡啶等的存在下，在溶剂诸如乙腈、甲醇、乙醇、二甲基甲酰胺中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(90)化合物与式(91)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应，得到式(92)化合物。在碱诸如碳酸氢钠、碳酸氢钾、碳酸氢锂、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢锂、氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化锂等的存在下，在溶剂诸如四氢呋喃、乙醚、1,4-二噁烷、乙腈等的存在下，任选地在二甲基亚砜的存在下，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(92)化合物与苯硫酚反应，得到式(93)的化合物。

[3576] 方案 27



[3577] 在碱诸如叔丁醇钠、叔丁醇锂、叔丁醇钾等的存在下，任选地在碱诸如三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶、2,6-二甲基吡啶等的存在下，在钯催化剂诸如乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)、三(二亚苄基丙酮)二钯(0)等，在溶剂诸如甲苯、苯、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、N,N-二甲基甲酰胺等的存在下，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(94)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)与式(95)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物，其中X^3选自由氯、溴、碘和甲烷三氟磺酸根组成的组)反应，得到式(96)的化合物。任选地在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇等中，任选地通过加热，任选地通过微波辐射，使式(96)化合物与酸诸如三氟乙酸、甲酸、乙酸、盐酸、硫酸等反应，得到式(97)化合物。

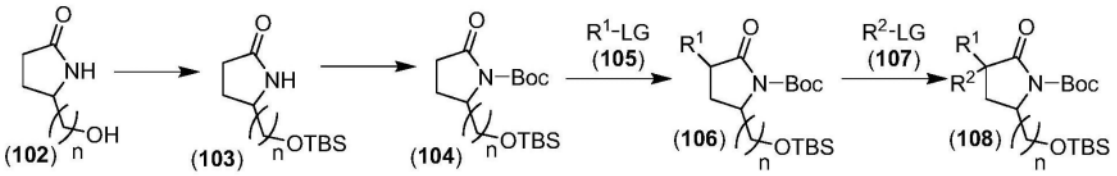
[3578] 方案 28



[3579] 在碱诸如叔丁醇钠、叔丁醇锂、叔丁醇钾等的存在下，任选地在碱诸如三乙胺、二

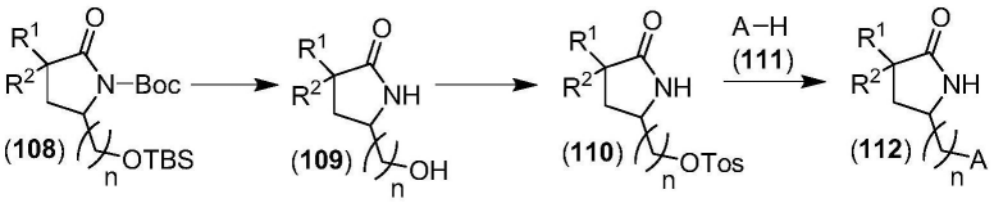
异丙基乙胺、吡啶、2,6-二甲基吡啶等的存在下,在钯催化剂诸如乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)、三(二亚苄基丙酮)二钯(0)等,在溶剂诸如甲苯、苯、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、N,N-二甲基甲酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(98)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)与式(99)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中X^3选自由氯、溴、碘和甲烷三氟磺酸根组成的组)反应,得到式(100)的化合物。任选地在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(100)化合物与酸诸如三氟乙酸、甲酸、乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(101)化合物。

[3580] 方案29

[3581] 

[3582] 在碱诸如咪唑、4-二甲基氨基吡啶、碳酸钾、碳酸钠等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(102)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)与叔丁基氯二甲基硅烷反应,得到式(103)化合物。在4-二甲基氨基吡啶的存在下,在碱诸如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(103)化合物与二叔丁基二碳酸酯反应,得到式(104)化合物。在碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(104)化合物与式(105)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中LG选自由溴、氯、甲磺酸酯、对甲苯磺酸酯组成的组)反应,得到式(106)化合物。在碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(106)化合物与式(107)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中LG选自由溴、氯、甲磺酸酯、对甲苯磺酸酯组成的组)反应,得到式(108)化合物。

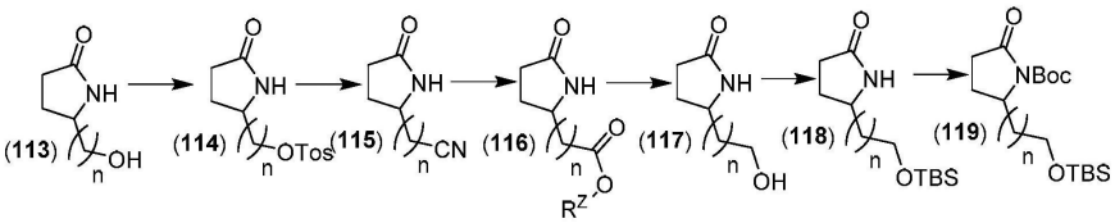
[3583] 方案30

[3584] 

[3585] 在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二

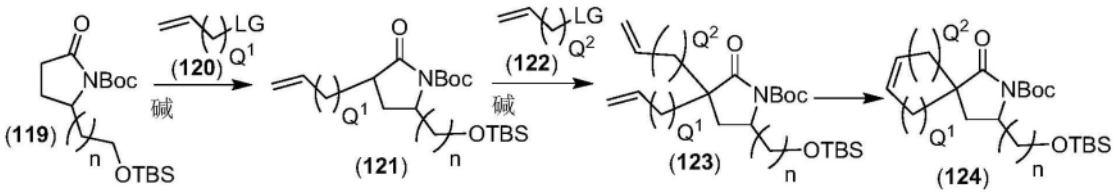
甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(108)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(109)化合物。在4-二甲基氨基吡啶的存在下,在碱诸如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(109)化合物与4-甲基苯磺酰氯反应,得到式(110)化合物。在碱诸如碳酸钠、碳酸钾、碳酸锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾、碳酸氢锂、三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(110)化合物与式(111)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应,得到式(112)化合物。

[3586] 方案31

[3587] 

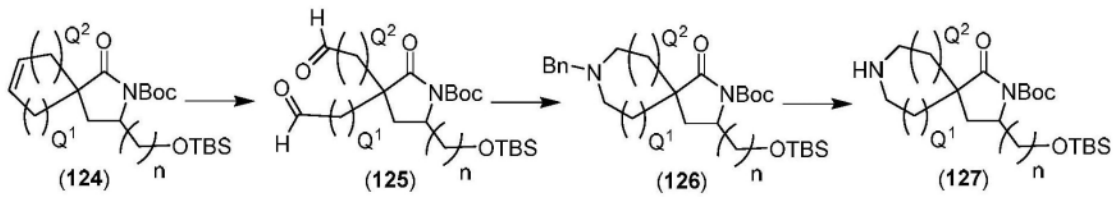
[3588] 在4-二甲基氨基吡啶的存在下,在碱诸如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(113)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)与4-甲基苯磺酰氯反应,得到式(114)化合物。在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(114)化合物与氰化物源诸如氰化钾、氰化钠、氰化锂、四丁基氰化铵等反应,得到式(115)化合物。在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(115)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(116)化合物,其中R^Z为H。替代地,可以用酸和合适的醇溶剂处理式(115)化合物,得到式(116)化合物,其为羧酸酯(例如,其中R^Z为C_{1-6}烷基):合适的条件包括使用6M HCl的甲醇溶液,得到式(116)的酯化合物,其中R^Z为甲基。在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(116)化合物与还原剂诸如硼氢化钠、三乙酰氧基硼氢化钠、氰基硼氢化钠、硼氢化锂、三乙酰氧基硼氢化锂、氰基硼氢化锂等反应,得到式(117)化合物。在碱诸如咪唑、4-二甲基氨基吡啶、碳酸钾、碳酸钠等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(117)化合物与叔丁基氯二甲基硅烷反应,得到式(118)化合物。在4-二甲基氨基吡啶的存在下,在碱诸如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(118)化合物与二叔丁基二碳酸酯反应,得到式(119)化合物。

[3589] 方案32

[3590] 

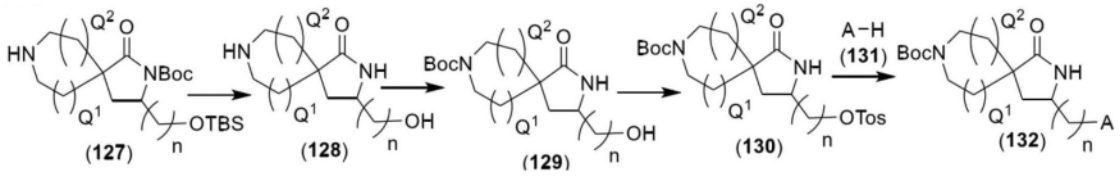
[3591] 在碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(119)化合物与式(120)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中LG选自由溴、氯、甲磺酸酯、对甲苯磺酸酯组成的组,并且其中Q^1选自由1和2组成的组)反应,得到式(121)化合物。在碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(121)化合物与式(122)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中LG选自由溴、氯、甲磺酸酯、对甲苯磺酸酯组成的组,并且其中Q^2选自由1和2组成的组)反应,得到式(123)化合物。在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、二甲基亚砜等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(123)化合物与钌催化剂诸如亚苄基-双(三环己基膦)二氯钌、(1,3-双(2,4,6-三甲基苯基)-2-亚咪唑烷基)二氯(苯基亚甲基)(三环己基膦)钌、(1,3-双-(2,4,6-三甲基苯基)-2-亚咪唑烷基)二氯(o-异丙氧基苯基亚甲基)钌、二氯(2-异丙氧基苯基亚甲基)(三环己基膦)钌(II)、[1,3-双(2-甲基苯基)-2-亚咪唑烷基]二氯(苯基亚甲基)(三环己基膦)钌(II)、二氯[1,3-双(2,4,6-三甲基苯基)-2-亚咪唑烷基](亚苄基)双(3-溴吡啶)钌(II)、二氯[1,3-双(2,4,6-三甲基苯基)-2-亚咪唑烷基](3-甲基-2-亚丁烯基)(三环己基膦)钌(II)、二氯[1,3-双(2-甲基苯基)-2-亚咪唑烷基](2-异丙氧基苯基亚甲基)钌(II)、[1,3-二均三甲苯基-2-亚咪唑烷基]二氯[3-(2-吡啶基)亚丙基]钌(II)、二氯[1,3-双(2,6-异丙基苯基)-2-亚咪唑烷基](2-异丙氧基苯基亚甲基)钌(II)、二氯(三环己基膦)[(三环己基正膦基)亚甲基]钌四氟硼酸盐、二氯[1,3-双(2,4,6-三甲基苯基)-2-亚咪唑烷基][(三环己基正膦基)亚甲基]钌(II)四氟硼酸盐、[2-(1-甲基乙氧基-O)苯基甲基-C](硝酸基-O,O′){rel-(2R,5R,7R)-金刚烷-2,1-二基[3-(2,4,6-三甲基苯基)-1-咪唑烷基-2-亚基]}钌、二氯[1,3-双(2,6-异丙基苯基)-2-亚咪唑烷基](亚苄基)(三环己基膦)钌(II)、[1,3-双(2-甲基苯基)-2-亚咪唑烷基]二氯(苯基亚甲基)(三环己基膦)钌(II)、二氯[1,3-双(2,4,6-三甲基苯基)-2-亚咪唑烷基][3-(2-吡啶基)亚丙基]钌(II)等反应,得到式(124)化合物。

[3592] 方案33

[3593] 

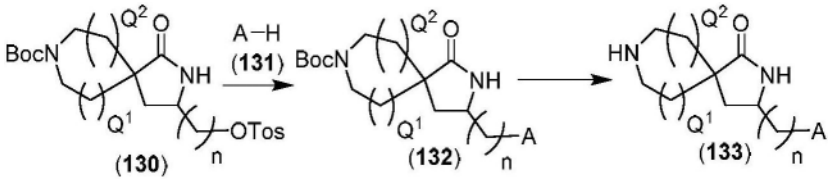
[3594] 在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(124)化合物与臭氧反应。然后在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,用三苯基膦处理所得物质,得到式(125)化合物。替代地,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(124)化合物与臭氧反应。然后在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,用二甲基硫醚处理所得物质,得到式(125)化合物。替代地,在高碘酸钠的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(124)化合物与氯化钌反应,得到式(125)化合物。替代地,在铁氰化钾的存在下,任选地在碳酸钾的存在下,任选地在碱诸如氢氧化钾、氢氧化钠、氢氧化锂等的存在下,在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(124)化合物与脱水锇酸钾反应,得到式(125)化合物。替代地,在高碘酸钠的存在下,在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地在碱诸如吡啶、2,6-二甲基砒啶、2,6-二-叔丁基吡啶等的存在下,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(124)化合物与四氧化锇反应,得到式(125)化合物。替代地,在N-甲基吗啉-N-氧化物的存在下,在溶剂诸如甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、丙酮、乙酸乙酯、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地在水的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(124)化合物与四氧化锇反应,得到式(125)化合物。在还原剂诸如硼氢化钠、三乙酰氧基硼氢化钠、氰基硼氢化钠、硼氢化锂、三乙酰氧基硼氢化锂、氰基硼氢化锂等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(125)化合物与苄胺反应,得到式(126)化合物。在钯催化剂诸如碳载钯、硫酸钡载钯、乙酸钯(II)、四(三苯基膦)钯(0)、二氯双(三苯基膦)钯(II)、碳载钯、双(乙腈)二氯化钯(II)等的存在下,在有机溶剂诸如甲醇、乙醇、乙酸乙酯、四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷、N,N-二甲基甲酰胺等中,使式(126)化合物与氢气反应,得到式(127)化合物。

[3595] 方案34

[3596] 

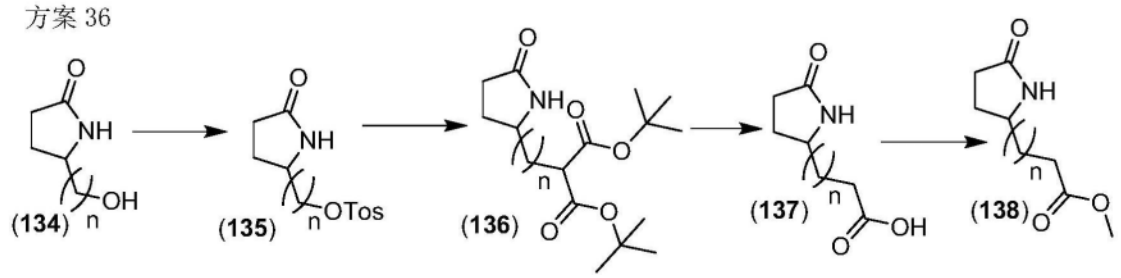
[3597] 在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(127)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(128)化合物。在4-二甲基氨基吡啶的存在下,在碱诸如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(128)化合物与二叔丁基二碳酸酯反应,得到式(129)化合物。在4-二甲基氨基吡啶的存在下,在碱诸如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(129)化合物与4-甲基苯磺酰氯反应,得到式(130)化合物。

[3598] 方案35

[3599] 

[3600] 在碱诸如碳酸钠、碳酸钾、碳酸锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾、碳酸氢锂、三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(130)化合物与式(131)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应,得到式(132)化合物。在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(132)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(133)化合物。

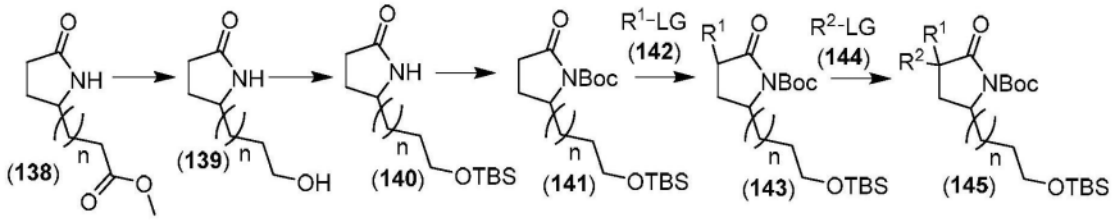
方案 36

[3601] 

[3602] 在4-二甲基氨基吡啶的存在下,在碱诸如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(134)化合物(其中n选自由1和2组成的组,已知化合物或通过已知方法制备的化合物)与4-甲基苯磺酰氯反应,得到式(135)化合物。在碱诸如叔丁醇钾、叔丁醇钠、二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(135)化合物与丙二酸二叔丁酯反应,得到式(136)化合物。在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加

热,任选地通过微波辐射,使式(136)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(137)化合物。在酸诸如盐酸、硫酸等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(137)化合物与甲醇反应,得到式(138)化合物。替代地,在偶联剂诸如1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺盐酸盐、N,N'-二环己基碳二亚胺、O-苯并三唑-N,N,N',N'-四甲基-脲鎓-六氟-磷酸盐、O-(7-氮杂苯并三唑-1-基)-N,N,N′,N′-四甲基脲鎓六氟磷酸盐、苯并三唑-1-基-氧基-三-(二甲基氨基)-鏻六氟磷酸盐、苯并三唑-1-基-氧基三吡咯烷基鏻六氟磷酸盐等的存在下,任选地在碱诸如三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶、2,6-二甲基吡啶等的存在下,任选地在4-N,N-二甲基氨基吡啶的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(137)化合物与甲醇反应,得到式(138)化合物。替代地,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(137)化合物与(重氮甲基)三甲基硅烷反应,得到式(138)化合物。

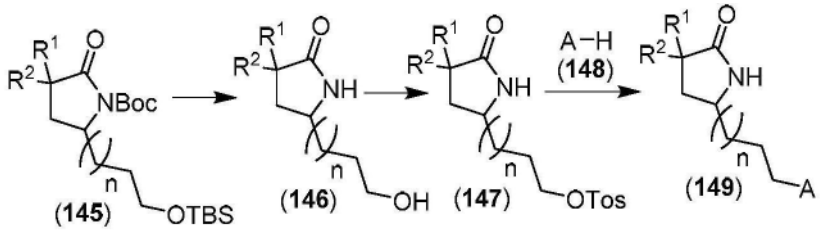
[3603] 方案37

[3604] 

[3605] 在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(138)化合物与还原剂诸如硼氢化钠、三乙酰氧基硼氢化钠、氰基硼氢化钠、硼氢化锂、三乙酰氧基硼氢化锂、氰基硼氢化锂等反应,得到式(139)化合物。在碱诸如咪唑、4-二甲基氨基吡啶、碳酸钾、碳酸钠等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(139)化合物与叔丁基氯二甲基硅烷反应,得到式(140)化合物。在4-二甲基氨基吡啶的存在下,在碱诸如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(140)化合物与二叔丁基二碳酸酯反应,得到式(141)化合物。在碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(141)化合物与式(142)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中LG选自由溴、氯、甲磺酸酯、对甲苯磺酸酯组成的组)反应,得到式(143)化合物。在碱诸如二异丙基氨基锂、二异丙基氨基钠、二异丙基氨基钾、双(三甲基硅基)氨基锂、双(三甲基硅基)氨基钠、双(三甲基硅基)氨基钾、氢化钠、氢化钾、氢化锂等的存在下,在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(143)化合物与式(144)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物,其中LG选自由溴、氯、甲磺酸酯、对甲苯

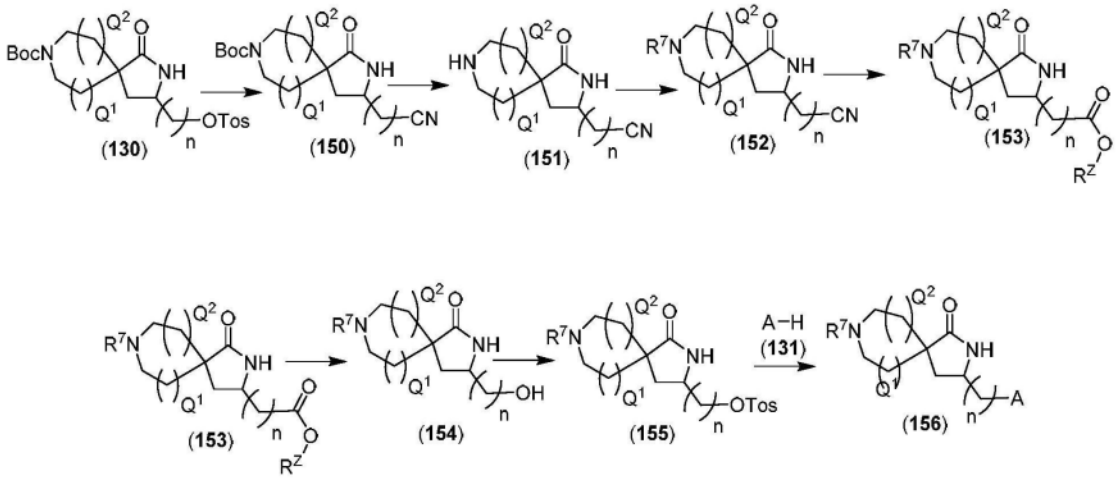
磺酸酯组成的组)反应,得到式(145)化合物。

[3606] 方案38

[3607] 

[3608] 在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(145)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(146)化合物。在4-二甲基氨基吡啶的存在下,在碱诸如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(146)化合物与4-甲基苯磺酰氯反应,得到式(147)化合物。在碱诸如碳酸钠、碳酸钾、碳酸锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾、碳酸氢锂、三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(147)化合物与式(148)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应,得到式(149)化合物。

[3609] 方案39

[3610] 

[3611] 方案34的中间体(130)也可以用于允许亚烯基连接基团进一步同系化的方法中。方案39中示出了一种示例性方法。

[3612] 在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(130)化合物与氰化物源诸如氰化钾、氰化钠、氰化锂、四丁基氰化铵等反应,得到式(150)化合物。

[3613] 在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(150)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(151)化合物。

[3614] 可以根据本领域已知的方法(例如,如方案13中所述)引入与本文所述的R^7相对应

的基团。例如,在碱诸如三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,可以使式(151)化合物与式(50)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应,得到式(152)化合物,其中R^7为SO_2R^{10c}。替代地,式(151)化合物可以在方案14和15的示例性方法中用作起始物质,分别得到式(152)化合物,其中R^7为COR^8或CO_2R^9。

[3615] 在溶剂诸如四氢呋喃、1,4-二噁烷、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(152)化合物与酸诸如三氟乙酸、盐酸、硫酸等反应,得到式(153)化合物,其中R^Z为H。替代地,可以用酸和合适的醇溶剂处理式(152)化合物,得到式(153)化合物,其为羧酸酯(例如,其中R^Z为C_{1-6}烷基):合适的条件包括使用6M HCl的甲醇溶液,得到式(153)的酯化合物,其中R^Z为甲基。

[3616] 在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、甲醇、乙醇、异丙醇、叔丁醇、1,4-二噁烷、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、苯、甲苯、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺等的存在下,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(153)化合物与还原剂诸如硼氢化钠、三乙酰氧基硼氢化钠、氰基硼氢化钠、硼氢化锂、三乙酰氧基硼氢化锂、氰基硼氢化锂等反应,得到式(154)化合物。

[3617] 在4-二甲基氨基吡啶的存在下,在碱诸如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(154)化合物与4-甲基苯磺酰氯反应,得到式(155)化合物。

[3618] 在碱诸如碳酸钠、碳酸钾、碳酸锂、碳酸氢钠、碳酸氢钾、碳酸氢锂、三乙胺、二异丙基乙胺、吡啶等的存在下,在溶剂诸如二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氢呋喃、1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷、N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、乙腈、甲醇、乙醇、异丙醇等中,任选地通过加热,任选地通过微波辐射,使式(155)化合物与式(131)化合物(已知化合物或通过已知方法制备的化合物)反应,得到式(156)化合物。

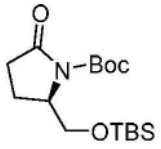
[3619] 下面提供的实施例提供了用于制备本发明的示例性化合物的代表性方法。本领域技术人员将知道如何替换本领域技术人员已知的适当试剂、原料和纯化方法,以便制备本发明的化合物。

[3620] 实施例

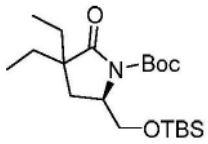
[3621] 通过以下非限制性实施例对本发明的实践进行说明。下面提供的实施例提供了用于制备本发明的示例性化合物的代表性方法。本领域技术人员将知道如何替换本领域技术人员已知的适当试剂、原料和纯化方法,以便制备本发明的化合物。

[3622] 在下面的实施例中,在Varian Mercury 300-MHz NMR上获得^{1}H-NMR光谱。用配备2996二极管阵列检测器的Alliance 2695 HPLC/MS(Waters Symmetry C18,4.6 x 75mm,3.5μm)从210-400nm测定纯度(%)和质谱数据。

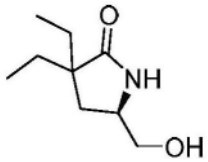
[3623] 实施例1:化合物合成

[3624] 

[3625] (R)-2-(((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)甲基)-5-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯的制备:向(R)-(-)-5-(羟甲基)-2-吡咯烷酮(1.0g,8.68mmol,1.0当量)和叔丁基二甲基甲硅烷基氯(1.44g,9.54mmol,1.1当量)在二氯甲烷(17.3mL)中的搅拌溶液中添加咪唑(0.650g,9.54mmol,1.1当量)。然后将所得混合物在23℃下搅拌2小时,然后用去离子H_2O(25mL)稀释并用二乙醚(3x25mL)萃取。将合并的有机层经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗制中间体,然后将其溶于乙腈(43mL)中。向所得溶液中添加三乙胺(1.75g,17.3mmol,2当量)、4-二甲基氨基吡啶(0.212g,1.73mmol,0.2当量)和二碳酸二叔丁酯(2.6g,16.5mmol,1.9当量)。然后将反应溶液在23℃下搅拌2小时,然后用饱和NH_4Cl水溶液(25mL)稀释,并用乙酸乙酯(3x25mL)萃取。将合并的有机层经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(乙酸乙酯/已烷,20%~30%)进一步纯化。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ4.13(m,1H),3.88(dd,J=4.0,10.3Hz,1H),3.65(dd,J=2.2,10.3Hz,1H),2.66(m,1H),2.33(m,1H),2.13-1.92(m,2H),1.49(s,9H),0.84(s,9H),0.00(d,J=5.3Hz,6H)。

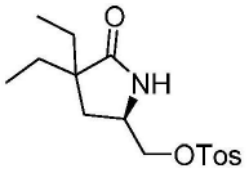
[3626] 

[3627] (R)-5-(((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)甲基)-3,3-二乙基-2-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯的制备:在N_2气氛下,向干燥的圆底烧瓶中添加(R)-2-(((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)甲基)-5-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯(2.63g,7.98mmol,1.0当量),然后溶于无水四氢呋喃(11.5mL)中。然后将所得溶液冷却至-78℃,并滴加1M双(三甲基硅基)氨基钾溶液(四氢呋喃,16.8mL,16.8mmol,2.1当量)。将所得溶液逐渐温热至-20℃,然后冷却至-78℃,然后滴加碘乙烷(3.12g,20mmol,2.5当量)。然后将反应溶液逐渐温热至0℃,并在该温度下搅拌2小时,然后温热至23℃,并再搅拌2小时。将所得溶液用饱和NH_4Cl水溶液(25mL)稀释,并用乙酸乙酯(3x25mL)萃取。将合并的有机层经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(乙酸乙酯/已烷,0%~10%)进一步纯化。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ3.94(m,1H),3.83(dd,J=5.2,10.0Hz,1H),3.67(dd,J=2.5,10.0Hz,1H),1.95(dd,J=6.3,13.4Hz,1H),1.79(dd,J=9.0,13.4Hz,1H),1.65-1.40(m,13H),0.90-0.75(m,15H),0.00(d,J=3.3Hz,6H)。

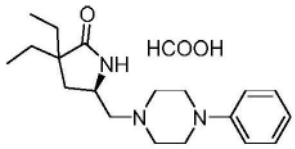
[3628] 

[3629] (R)-3,3-二乙基-5-(羟甲基)吡咯烷-2-酮的制备:通过向甲醇(12mL)中添加乙酰氯(4.8mL)来制备6M HCl的甲醇溶液。向小圆底烧瓶中添加(R)-5-(((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)甲基)-3,3-二乙基-2-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯(0.875g,2.65mmol,1.0当量)和1mL甲醇。然后滴加制备的HCl甲醇溶液(12mL),并将所得混合物在23℃下搅拌30分钟,然后用甲醇稀释并真空浓缩,得到粗产物,其无需进一步纯化即可用于下一步。^1H NMR(400MHz,

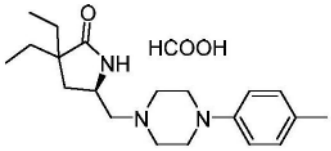
$CDCl_3$)δ7.61(b,1H),4.96(b,1H),3.69-3.48(m,2H),3.33(dd,J=8.1,11.2Hz,1H),1.84(dd,J=7.8,13.3Hz,1H),1.58-1.31(m,5H),0.80(dt,J=7.5,21.9Hz,6H)。

[3630] 

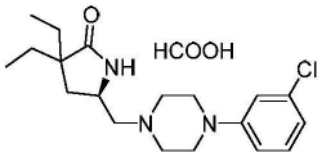
[3631] (R)-4-甲基苯磺酸(4,4-二乙基-5-氧代吡咯烷-2-基)甲酯的制备:在0℃下,随后向(R)-3,3-二乙基-5-(羟甲基)吡咯烷-2-酮(0.367g,2.14mmol,1.0当量)和三乙胺(0.240g,2.36mmol,1.1当量)在二氯甲烷(3.3mL)中的搅拌溶液中添加4-甲基苯磺酰氯(0.450g,2.36mmol,1.1当量)和4-二甲基氨基吡啶(0.053g,0.428mmol,0.2当量)。将所得混合物在0℃下搅拌10分钟,并在23℃下搅拌过夜。然后,将反应混合物用二氯甲烷(25mL)稀释,用1N HCl(1x5mL)和去离子H_2O(2x5mL)洗涤,经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(乙酸乙酯/己烷,0%~100%)进一步纯化。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.71(d,J=8.3Hz,2H),7.28(d,J=8.1Hz,2H),6.57(b,1H),3.96(dd,J=4.0,9.6Hz,1H),3.82-3.67(m,2H),2.37(s,3H),1.90(dd,J=7.9,13.5Hz,1H),1.52(dd,J=7.1,13.6Hz,1H)1.49-1.31(m,4H),0.75(dt,J=7.4,26.5Hz,6H)。

[3632] 

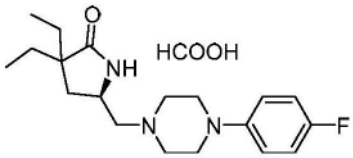
[3633] (R)-3,3-二乙基-5-((4-苯基哌嗪-1-基)甲基)吡咯烷-2-酮甲酸酯的制备:向小瓶中添加(R)-4-甲基苯磺酸(4,4-二乙基-5-氧代吡咯烷-2-基)甲酯(75mg,0.23mmol,1当量)和1-苯基哌嗪(79mg,0.48mmol,2.1当量),然后将两者溶于乙腈(2.3mL)中。然后添加K_2CO_3(80mg,0.57mmol,2.5当量),将反应混合物在80℃下搅拌3天,然后冷却至23℃。将混合物过滤,用乙腈洗涤,并将滤液真空浓缩,得到粗产物,将其通过HPLC(CH_3CN/H_2O,0.1%甲酸,0%~100%)进一步纯化。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.19(m,2H),6.85(d,J=8.3Hz,2H),6.79(t,J=7.0Hz,1H),6.42(b,1H),3.70(m,1H),3.12(m,4H),2.70(m,2H),2.50(m,2H),2.41(dd,J=3.6,12.4Hz,1H),2.29(dd,J=9.8,12.4Hz,1H),1.93(dd,J=7.6,13.5Hz,1H),1.57-1.37(m,5H),0.84(dt,J=7.4,19.6Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 316.2。

[3634] 

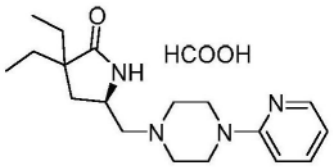
[3635] (R)-3,3-二乙基-5-((4-(对甲苯基)哌嗪-1-基)甲基)吡咯烷-2-酮甲酸酯的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-((4-苯基哌嗪-1-基)甲基)吡咯烷-2-酮甲酸酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(4-甲基苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.09(d,J=8.2Hz,2H),6.85(d,J=8.5Hz,2H),6.47(b,1H),3.78(m,1H),3.15(m,4H),2.78(m,2H),2.59(m,2H),2.49(dd,J=3.6,12.4Hz,1H),2.38(dd,J=9.9,12.4Hz,1H),2.28(s,3H),2.01(dd,J=7.6,13.1Hz,1H),1.67-1.45(m,5H),0.93(dt,J=7.4,19.6Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 330.2。

[3636] 

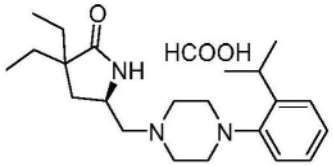
[3637] (R)-5-((4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)甲基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-((4-苯基哌嗪-1-基)甲基)吡咯烷-2-酮甲酸酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(3-氯苯基)哌嗪盐酸盐代替1-苯基哌嗪,并使用5当量K_2CO_3代替2.5当量。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.09(t,J=8.1Hz,1H),6.79(t,J=2.0Hz,1H),6.74(dd,J=1.8,7.7Hz,1H),6.70(dd,J=2.3,8.3Hz,1H),6.36(b,1H),3.69(m,1H),3.11(m,4H),2.67(m,2H),2.47(m,2H),2.39(dd,J=3.5,12.3Hz,1H),2.28(dd,J=10.0,12.4Hz,1H),1.92(dd,J=7.8,13.2Hz,1H),1.58-1.38(m,5H),0.84(dt,J=7.5,20.2Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 350.2。

[3638] 

[3639] (R)-3,3-二乙基-5-((4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)甲基)吡咯烷-2-酮甲酸酯的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-((4-苯基哌嗪-1-基)甲基)吡咯烷-2-酮甲酸酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(4-氟苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ6.97(m,2H),6.92-6.77(m,3H),3.81(m,1H),3.15(m,4H),2.82(m,2H),2.65(m,2H),2.53(dd,J=3.5,12.4Hz,1H),2.44(dd,J=9.6,12.4Hz,1H),2.03(dd,J=7.6,13.3Hz,1H),1.68-1.44(m,5H),0.92(dt,J=7.5,18.9Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 334.2。

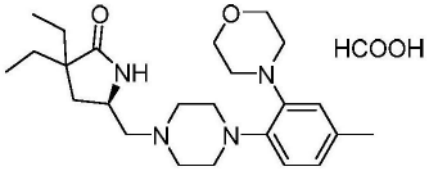
[3640] 

[3641] (R)-3,3-二乙基-5-((4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基)甲基)吡咯烷-2-酮甲酸酯的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-((4-苯基哌嗪-1-基)甲基)吡咯烷-2-酮甲酸酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(2-吡啶基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ8.19(m,1H),7.50(m,1H),6.86(b,1H)6.65(m,2H),3.81(m,1H),3.57(m,4H),2.77(m,2H),2.59(m,2H),2.51(dd,J=3.8,12.6Hz,1H),2.43(dd,J=9.4,12.5Hz,1H),2.02(dd,J=7.7,13.2Hz,1H),1.66-1.44(m,5H),0.90(dt,J=7.4,20.0Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 317.2。

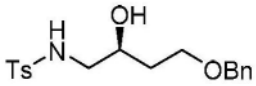
[3642] 

[3643] (R)-3,3-二乙基-5-((4-(2-异丙基苯基)哌嗪-1-基)甲基)吡咯烷-2-酮甲酸酯的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-((4-苯基哌嗪-1-基)甲基)吡咯烷-2-酮甲酸酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(2-异丙基苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR

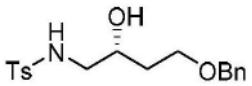
(400MHz,$CDCl_3$)δ7.18(m,1H),7.12-6.99(m,3H),6.34(b,1H),3.71(m,1H),3.40(sept,J=6.8Hz,1H),2.83(m,4H),2.71(b,2H),2.60-2.39(b,3H),2.32(m,1H),1.94(dd,J=7.5,13.2Hz,1H),1.60-1.36(m,5H),1.12(d,J=6.9Hz,6H),0.84(dt,J=7.4,18.3Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 358.2。

[3644] 

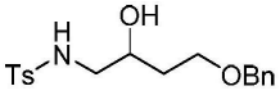
[3645] (R)-3,3-二乙基-5-((4-(4-甲基-2-吗啉代苯基)哌嗪-1-基)甲基)吡咯烷-2-酮甲酸酯的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-((4-苯基哌嗪-1-基)甲基)吡咯烷-2-酮甲酸酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(4-甲基-2-吗啉代苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ6.73(m,2H),6.63(b,1H),6.45(b,1H)3.82-3.64(m,5H),3.31-2.84(b,8H),2.68(b,2H),2.57-2.38(b,3H),2.32(m,1H),2.21(s,3H),1.94(dd,J=7.4,13.0Hz,1H),1.59-1.38(m,5H),0.84(dt,J=7.4,18.8Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 415.2。

[3646] 

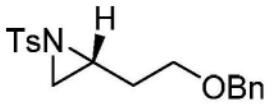
[3647] (S)-N-(4-(苄氧基)-2-羟丁基)-4-甲基苯磺酰胺的制备:向(S)-2-(2-(苄氧基)乙基)环氧乙烷(0.5g,2.8mmo,1.0当量)在1,4-二噁烷(11.25mL)中的搅拌溶液中添加对甲苯磺酰胺(0.96g,5.6mmol,2.0当量)、苄基三乙基氯化铵(0.064g,0.28mmol,0.1当量)和Cs_2CO_3(0.092g,0.28mmol,0.1当量)。然后将所得混合物在90℃下搅拌48小时。然后将反应冷却至23℃,并真空浓缩,得到粗产物,将其通过HPLC(CH_3CN/H_2O,0.1%甲酸,0%~100%)进一步纯化。将所需馏分通过柱色谱(乙酸乙酯/己烷,10%~100%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.73(d,J=8.2Hz,2H),7.44-7.22(m,7H),5.00(t,J=6.2Hz,1H),4.50(s,2H),3.93(m,1H),3.66(m,2H),3.07(m,1H),2.87(m,1H),2.43(s,3H),1.83(m,1H),1.70(m,1H)。

[3648] 

[3649] (R)-N-(4-(苄氧基)-2-羟丁基)-4-甲基苯磺酰胺的制备:根据用于(S)-N-(4-(苄氧基)-2-羟丁基)-4-甲基苯磺酰胺的方法制备标题化合物,不同之处在于用(R)-2-(2-(苄氧基)乙基)环氧乙烷代替(S)-2-(2-(苄氧基)乙基)环氧乙烷。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.64(d,J=8.2Hz,2H),7.31-7.16(m,7H),4.90(t,J=6.1Hz,1H),4.41(s,2H),3.84(m,1H),3.57(m,2H),2.98(m,1H),2.78(m,1H),2.34(s,3H),1.74(m,1H),1.60(m,1H)。

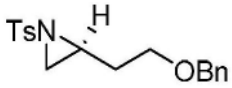
[3650] 

[3651] N-(4-(苄氧基)-2-羟丁基)-4-甲基苯磺酰胺的制备:根据用于(S)-N-(4-(苄氧基)-2-羟丁基)-4-甲基苯磺酰胺的方法制备标题化合物,不同之处在于用(外消旋)-2-(2-(苄氧基)乙基)环氧乙烷代替(S)-2-(2-(苄氧基)乙基)环氧乙烷。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.66(d,J=8.2Hz,2H),7.35-7.18(m,7H),4.92(t,J=6.1Hz,1H),4.43(s,2H),3.89(m,1H),3.60(m,2H),3.02(m,1H),2.80(m,1H),2.38(s,3H),1.77(m,1H),1.63(m,1H)。

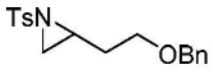
[3652] 

[3653] (R)-2-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基氮丙啶的制备:该反应在烘箱干燥的玻璃器皿中于氮气气氛下进行。在0℃下,向吡啶(1.57g,19.9mmol,5.0当量)和甲磺酰氯(2.28g,19.9mmol,5.0当量)在无水二氯甲烷(22.5mL)中的搅拌溶液中添加(S)-N-(4-(苄氧基)-2-羟丁基)-4-甲基苯磺酰胺(1.4g,3.99mmol,1.0当量)在无水二氯甲烷(22.5mL)中的溶液。将所得溶液在回流下搅拌过夜,冷却至23℃,并用盐水(50mL)洗涤。将有机层经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗制甲磺酸酯,将其通过柱色谱(乙酸乙酯/己烷,10%~50%)进一步纯化。

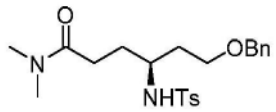
[3654] 然后将纯化的甲磺酸酯溶于乙腈(45mL)中,并添加K_2CO_3(2.22g,16.0mmol,4.0当量)。将所得混合物在45℃下搅拌过夜,然后冷却至23℃并过滤。将滤液真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(乙酸乙酯/己烷,10%~20%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.84(d,J=8.2Hz,2H),7.45-7.19(m,7H),4.39(s,2H),3.46(dt,J=3.7,9.2Hz,1H),3.35(m,1H),2.93(m,1H),2.70(d,J=7.1Hz,1H),2.45(s,3H),2.15(d,J=4.6Hz,1H),1.94(m,1H),1.58(m,1H)。

[3655] 

[3656] (S)-2-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基氮丙啶的制备:根据用于(R)-2-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基氮丙啶的方法制备标题化合物,不同之处在于用(R)-N-(4-(苄氧基)-2-羟丁基)-4-甲基苯磺酰胺代替(S)-N-(4-(苄氧基)-2-羟丁基)-4-甲基苯磺酰胺。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.84(d,J=8.3Hz,2H),7.43-7.23(m,7H),4.39(s,2H),3.46(dt,J=3.8,9.3Hz,1H),3.35(m,1H),2.93(m,1H),2.69(d,J=7.0Hz,1H),2.45(s,3H),2.15(d,J=4.5Hz,1H),1.94(m,1H),1.59(m,1H)。

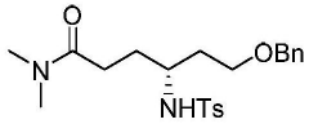
[3657] 

[3658] 2-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基氮丙啶的制备:根据用于(R)-2-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基氮丙啶的方法制备标题化合物,不同之处在于用(外消旋)-N-(4-(苄氧基)-2-羟丁基)-4-甲基苯磺酰胺代替(S)-N-(4-(苄氧基)-2-羟丁基)-4-甲基苯磺酰胺。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.84(d,J=8.3Hz,2H),7.41-7.26(m,7H),4.39(s,2H),3.46(dt,J=3.8,9.3Hz,1H),3.35(m,1H),2.93(m,1H),2.69(d,J=7.0Hz,1H),2.45(s,3H),2.15(d,J=4.6Hz,1H),1.93(m,1H),1.59(m,1H)。

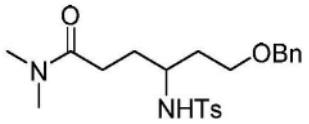
[3659] 

[3660] (S)-6-(苄氧基)-N,N-二甲基-4-((4-甲基苯基)磺酰氨基)己酰胺的制备:该反应在烘箱干燥的玻璃器皿中于氮气气氛下进行。在-78℃下,向无水N,N-二甲基乙酰胺(0.527g,6.05mmol,1.1当量)和无水四氢呋喃(18mL)的冷却溶液中滴加1M二异丙基氨基锂溶液(四氢呋喃/己烷,7.26mL,7.26mmol,1.3当量)。然后将所得溶液在-78℃下搅拌30分钟,然后温热至0℃。在0℃下,将(R)-2-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基氮丙啶(1.82g,

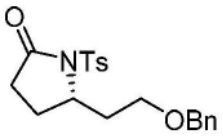
5.5mmol,1.0当量)在无水四氢呋喃(18mL)中的溶液添加到该溶液中。将反应在0℃下搅拌20分钟,然后温热至23℃并搅拌过夜。将反应用饱和NH_4Cl(40mL)淬灭,并用乙酸乙酯(3x30mL)萃取。将合并的有机层经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(乙酸乙酯/己烷,40%~100%)进一步纯化。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.72(d,J=8.2Hz,2H),7.41-7.19(m,7H),5.91(d,J=7.5Hz,1H),4.40(q,J=9.3Hz,2H),3.56(m,1H),3.40(m,2H),2.93(s,3H),2.90(s,3H),2.48-2.35(m,4H),2.21(dt,J=6.6,16.6Hz,1H),1.88-1.69(m,2H),1.68-1.55(m,2H)。

[3661] 

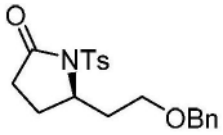
[3662] (R)-6-(苄氧基)-N,N-二甲基-4-((4-甲基苯基)磺酰氨基)己酰胺的制备:根据用于(S)-6-(苄氧基)-N,N-二甲基-4-((4-甲基苯基)磺酰氨基)己酰胺的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-2-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基氮丙啶代替(R)-2-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基氮丙啶。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.71(d,J=8.2Hz,2H),7.41-7.18(m,7H),5.91(d,J=7.5Hz,1H),4.40(q,J=8.9Hz,2H),3.54(m,1H),3.40(m,2H),2.94(s,3H),2.91(s,3H),2.47-2.35(m,4H),2.21(dt,J=6.6,16.6Hz,1H),1.87-1.68(m,2H),1.67-1.52(m,2H)。

[3663] 

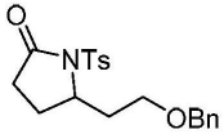
[3664] 6-(苄氧基)-N,N-二甲基-4-((4-甲基苯基)磺酰氨基)己酰胺的制备:根据用于(S)-6-(苄氧基)-N,N-二甲基-4-((4-甲基苯基)磺酰氨基)己酰胺的方法制备标题化合物,不同之处在于用(外消旋)-2-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基氮丙啶代替(R)-2-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基氮丙啶。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.72(d,J=8.2Hz,2H),7.42-7.21(m,7H),5.90(d,J=7.5Hz,1H),4.41(q,J=9.3Hz,2H),3.57(m,1H),3.40(m,2H),2.95(s,3H),2.93(s,3H),2.50-2.36(m,4H),2.23(dt,J=6.6,16.6Hz,1H),1.88-1.70(m,2H),1.69-1.57(m,2H)。

[3665] 

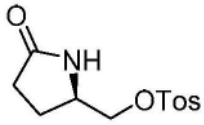
[3666] (S)-5-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮的制备:将(S)-6-(苄氧基)-N,N-二甲基-4-((4-甲基苯基)磺酰氨基)己酰胺(0.565g,1.35mmol,1.0当量)与对甲苯磺酸一水合物(0.282g,1.48mmol,1.1当量)和甲苯(5.65mL)在微波小瓶中混合。然后将混合物在微波反应器中于190℃加热2小时。然后将混合物用饱和$NaHCO_3$中和,并用乙酸乙酯(3x15mL)萃取。将合并的有机相经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(乙酸乙酯/己烷,0%~40%)进一步纯化。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.96(d,J=8.2Hz,2H),7.42-7.26(m,7H),4.59-4.42(m,3H),3.65-3.54(m,2H),2.62-2.50(m,1H),2.45(s,3H),2.42-2.27(m,2H),2.25-2.12(m,1H),2.11-1.89(m,2H)。

[3667] 

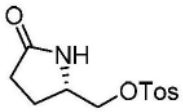
[3668] (R)-5-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(S)-5-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(R)-6-(苄氧基)-N,N-二甲基-4-((4-甲基苯基)磺酰氨基)己酰胺代替(S)-6-(苄氧基)-N,N-二甲基-4-((4-甲基苯基)磺酰氨基)己酰胺。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.95(d,J=8.4Hz,2H),7.39-7.25(m,7H),4.59-4.42(m,3H),3.67-3.53(m,2H),2.61-2.47(m,1H),2.42(s,3H),2.40-2.23(m,2H),2.22-2.09(m,1H),2.07-1.89(m,2H)。

[3669] 

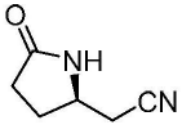
[3670] 5-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(S)-5-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(外消旋)-6-(苄氧基)-N,N-二甲基-4-((4-甲基苯基)磺酰氨基)己酰胺代替(S)-6-(苄氧基)-N,N-二甲基-4-((4-甲基苯基)磺酰氨基)己酰胺。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.96(d,J=8.3Hz,2H),7.41-7.25(m,7H),4.60-4.42(m,3H),3.64-3.54(m,2H),2.62-2.49(m,1H),2.44(s,3H),2.42-2.26(m,2H),2.24-2.11(m,1H),2.10-1.88(m,2H)。

[3671] 

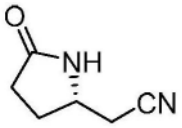
[3672] (R)-4-甲基苯磺酸(5-氧代吡咯烷-2-基)甲酯的制备:在0℃下,向(R)-(-)-5-(羟甲基)-2-吡咯烷酮(10.0g,87mmol,1.0当量)和三乙胺(9.68g,95.7mmol,1.1当量)在二氯甲烷(134mL)中的冷却混合物中添加4-甲苯磺酰氯(18.25g,95.7mmol,1.1当量),然后添加4-二甲基氨基吡啶(2.12g,17.3mmol,0.2当量)。将所得反应混合物在0℃下搅拌5分钟,然后温热至23℃并搅拌过夜。然后,将反应混合物用二氯甲烷(200mL)稀释,用1N HCl(1x200mL)和去离子H_2O(2x150mL)洗涤,经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,其无需进一步纯化即可用于下一步。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.77(d,J=8.2Hz,2H),7.35(d,J=8.2Hz,2H),6.76(b,1H),4.01(dd,J=3.6,9.7Hz,1H),3.86(m,1H),3.80(dd,J=7.4,9.6Hz,1H),2.44(s,3H),2.37-2.12(m,3H),1.77(m,1H)。

[3673] 

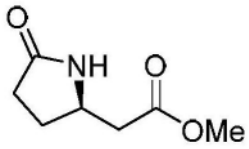
[3674] (S)-4-甲基苯磺酸(5-氧代吡咯烷-2-基)甲酯的制备:根据用于(R)-4-甲基苯磺酸(5-氧代吡咯烷-2-基)甲酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用L-焦谷氨酰胺代替(R)-(-)-5-(羟甲基)-2-吡咯烷酮。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.71(d,J=8.3Hz,2H),7.30(d,J=8.2Hz,2H),5.77(b,1H),3.99(dd,J=3.5,9.7Hz,1H),3.86(m,1H),3.79(dd,J=7.4,9.6Hz,1H),2.39(s,3H),2.29-2.11(m,3H),1.69(m,1H)。

[3675] 

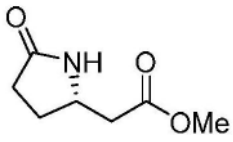
[3676] (R)-2-(5-氧代吡咯烷-2-基)乙腈的制备:向(R)-4-甲基苯磺酸(5-氧代吡咯烷-2-基)甲酯(21.25g,79mmol,1.0当量)在乙腈(335mL)中的溶液中添加氰化钾(12.86g,197mmol,2.5当量)。然后将所得反应混合物加热至回流并使其回流过夜。冷却至23℃后,将反应混合物通过硅藻土塞过滤并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(MeOH/乙酸乙酯,10%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.23(b,1H),3.93(m,1H),2.54(d,J=5.7Hz,2H),2.48-2.24(m,3H),1.88(m,1H)。

[3677] 

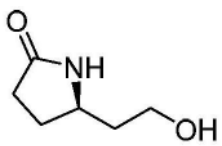
[3678] (S)-2-(5-氧代吡咯烷-2-基)乙腈的制备:根据用于(R)-2-(5-氧代吡咯烷-2-基)乙腈的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-4-甲基苯磺酸(5-氧代吡咯烷-2-基)甲酯代替(R)-4-甲基苯磺酸(5-氧代吡咯烷-2-基)甲酯。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.47(b,1H),3.92(m,1H),2.55(d,J=5.6Hz,2H),2.47-2.24(m,3H),1.86(m,1H)。

[3679] 

[3680] (R)-2-(5-氧代吡咯烷-2-基)乙酸甲酯的制备:通过向甲醇(77mL)中添加乙酰氯(33mL)来制备6M HCl的甲醇溶液。将(R)-2-(5-氧代吡咯烷-2-基)乙腈(4.73g,38mmol,1.0当量)溶于制备的6M HCl甲醇溶液(77mL)中,并在23℃下搅拌过夜。用去离子H_2O(100mL)和二氯甲烷(100mL)稀释反应混合物,并分离各层。用二氯甲烷(8x100mL)反洗水层。将合并的有机相经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,其无需进一步纯化即可用于下一步。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ6.40(b,1H),3.94(m,1H),3.64(s,3H),2.52(dd,J=4.5,16.5Hz,1H),2.43(dd,J=9.0,16.5Hz,1H),2.35-2.19(m,3H),1.68(m,1H)。

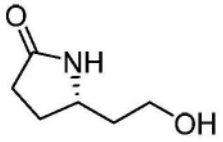
[3681] 

[3682] (S)-2-(5-氧代吡咯烷-2-基)乙酸甲酯的制备:根据用于(R)-2-(5-氧代吡咯烷-2-基)乙酸甲酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-2-(5-氧代吡咯烷-2-基)乙腈代替(R)-2-(5-氧代吡咯烷-2-基)乙腈。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ6.25(b,1H),3.94(m,1H),3.64(s,3H),2.52(dd,J=4.3,16.4Hz,1H),2.42(dd,J=9.2,16.5Hz,1H),2.32-2.23(m,3H),1.68(m,1H)。

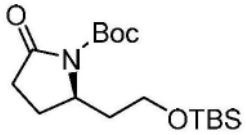
[3683] 

[3684] (R)-5-(2-羟乙基)吡咯烷-2-酮的制备:向(R)-2-(5-氧代吡咯烷-2-基)乙酸甲酯

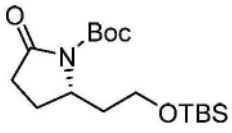
(0.525g,3.3mmol,1.0当量)在乙醇(13.4mL)中的搅拌溶液中添加$NaBH_4$(0.380g,10mmol,3.0当量),并将所得混合物在23℃下搅拌5分钟,然后回流1小时。冷却至23℃后,将反应混合物用1mL乙酸淬灭,并过滤,同时用甲醇洗涤。将滤液真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(MeOH/甲醇,10%)进一步纯化。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.36(b,1H),4.86-4.09(b,1H),3.82-3.54(m,3H),2.32-2.14(m,3H),1.74-1.53(m,3H)。

[3685] 

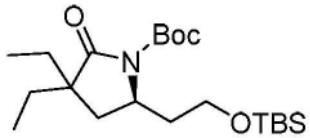
[3686] (S)-5-(2-羟乙基)吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-5-(2-羟乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-2-(5-氧代吡咯烷-2-基)乙酸甲酯代替(R)-2-(5-氧代吡咯烷-2-基)乙酸甲酯。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.04(b,1H),3.81-3.59(m,3H),3.35-2.88(b,1H),2.31-2.14(m,3H),1.75-1.57(m,3H)。

[3687] 

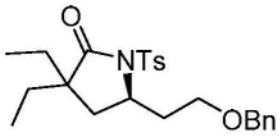
[3688] (R)-2-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-5-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯的制备:向(R)-5-(2-羟乙基)吡咯烷-2-酮(3.41g,26.4mmol,1.0当量)在二氯甲烷(50mL)中的搅拌溶液中添加叔丁基氯二甲基硅烷(4.37g,29mmol,1.1当量),然后添加咪唑(1.98g,29mmol,1.1当量)。然后将所得混合物在23℃下搅拌2小时,然后用乙醚(100mL)稀释,并用去离子H_2O(50mL)洗涤。用乙醚(2x20mL)反洗水层。将合并的有机相经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗制中间体,将其溶于乙腈(132mL)中。然后添加三乙胺(5.34g,52.8mmol,2.0当量)、二碳酸二叔丁酯(10.95g,50.2mmol,1.9当量)和4-二甲基氨基吡啶(0.645g,5.28mmol,0.2当量),并将所得溶液在23℃下搅拌2小时。将反应用乙酸乙酯(200mL)稀释,并用饱和NH_4Cl(100mL)洗涤。用乙酸乙酯(2x20mL)反洗水层,并将合并的有机相经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(乙酸乙酯/已烷,20%-30%)进一步纯化。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ4.18(m,1H),3.66(t,J=6.2Hz,2H),2.54(ddd,J=9.2,11.3,17.6Hz,1H),2.36(ddd,J=2.4,9.2,17.6Hz,1H),2.13-1.82(m,3H),1.66(m,1H),1.47(s,9H),0.83(s,9H),0.00(s,6H)。

[3689] 

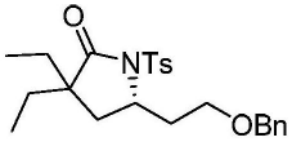
[3690] (S)-2-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-5-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯的制备:根据用于(R)-2-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-5-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-5-(2-羟乙基)吡咯烷-2-酮代替(R)-5-(2-羟乙基)吡咯烷-2-酮。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ4.18(m,1H),3.66(t,J=6.3Hz,2H),2.54(ddd,J=9.1,11.3,17.6Hz,1H),2.36(ddd,J=2.4,9.2,17.6Hz,1H),2.12-1.85(m,3H),1.66(m,1H),1.47(s,9H),0.83(s,9H),0.00(s,6H)。

[3691] 

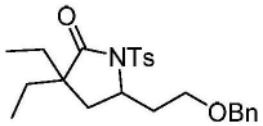
[3692] (R)-5-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-3,3-二乙基-2-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯的制备:该反应在烘箱干燥的玻璃器皿中于氮气气氛下进行。将(R)-2-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-5-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯(8.0g,23.2mmol,1.0当量)在无水四氢呋喃(35mL)中的搅拌溶液冷却至-78℃,并在保持反应温度低于-70℃的同时滴加1M双(三甲基硅基)氨基钾溶液(四氢呋喃,51mL,51mmol,2.2当量)。将所得溶液缓慢温热至-30℃,然后冷却至-78℃,这时缓慢滴加碘乙烷(8.48g,50.5mmol,2.15当量)。将所得溶液缓慢温热至-15℃,并在该温度下搅拌2小时,然后温热至23℃,并再搅拌2.5小时。将反应用饱和NH_4Cl(40mL)淬灭,并用乙酸乙酯(3x50mL)萃取。将合并的有机层经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(乙酸乙酯/已烷,0%~10%)进一步纯化。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ3.97(m,1H),3.65(t,J=5.9Hz,2H),2.23(m,1H),1.95(dd,J=8.6,13.5Hz,1H),1.66(dd,J=6.1,13.5Hz,1H),1.58-1.39(m,14H),0.90-0.74(m,15H),0.00(s,3H)。

[3693] 

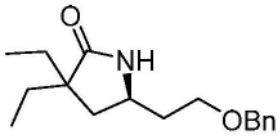
[3694] (R)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-5-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-3,3-二乙基-2-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用(R)-5-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮代替(R)-2-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-5-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.84(d,J=8.4Hz,2H),7.33-7.16(m,7H),4.44(dd,J=12.0,32.0Hz,2H),4.21(m,1H),3.54(t,J=5.5Hz,2H),2.69(m,1H),2.34(s,3H),1.95(dd,J=8.1,13.5Hz,1H),1.81-1.64(m,2H),1.41(q,J=7.5Hz,2H),1.33-1.13(m,2H),0.71(t,J=7.5Hz,3H),0.48(t,J=7.5Hz,3H)。

[3695] 

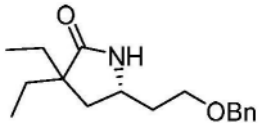
[3696] (S)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-5-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-3,3-二乙基-2-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-5-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮代替(R)-2-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-5-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.93(d,J=8.2Hz,2H),7.40-7.24(m,7H),4.53(dd,J=11.9,32.6Hz,2H),4.31(m,1H),3.63(t,J=5.8Hz,2H),2.78(m,1H),2.42(s,3H),2.04(dd,J=8.6,13.5Hz,1H),1.90-1.74(m,2H),1.50(q,J=7.7Hz,2H),1.44-1.23(m,2H),0.80(t,J=7.4Hz,3H),0.57(t,J=7.4Hz,3H)。

[3697] 

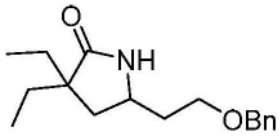
[3698] 5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-5-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-3,3-二乙基-2-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用(外消旋)-5-(2-(苄氧基)乙基)-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮代替(R)-2-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-5-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.93(d,J=8.3Hz,2H),7.41-7.24(m,7H),4.52(dd,J=12.0,32.4Hz,2H),4.30(m,1H),3.62(t,J=5.7Hz,2H),2.78(m,1H),2.41(s,3H),2.04(dd,J=8.6,13.5Hz,1H),1.89-1.72(m,2H),1.49(q,J=7.6Hz,2H),1.43-1.19(m,2H),0.80(t,J=7.4Hz,3H),0.56(t,J=7.4Hz,3H)。

[3699] 

[3700] (R)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:该反应在烘箱干燥的玻璃器皿中于氮气气氛下进行。将金属钠(800mg)和无水四氢呋喃(100mL)的混合物在23℃下搅拌45分钟。将反应混合物冷却至-78℃,然后添加(R)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮(1.48g,3.45mmol,1.0当量)在无水四氢呋喃(51mL)中的溶液。将所得混合物在-78℃下搅拌1.5小时,然后用饱和NH_4Cl(50mL)淬灭,并用乙酸乙酯(3x40mL)萃取。将合并的有机层经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(乙酸乙酯/已烷,0%~100%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.31-7.14(m,5H),6.59(b,1H),4.40(s,2H),3.60-3.37(m,3H),1.93(dd,J=7.5,13.3Hz,1H),1.75-1.58(m,2H),1.57-1.32(m,5H),0.80(dt,J=7.6,18.3Hz,6H)。

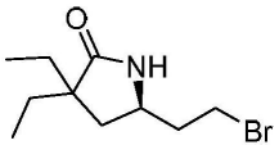
[3701] 

[3702] (S)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮代替(R)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.35-7.13(m,5H),6.06(b,1H),4.42(s,2H),3.62-3.36(m,3H),1.95(dd,J=7.5,13.3Hz,1H),1.75-1.59(m,2H),1.57-1.36(m,5H),0.80(dt,J=7.6,18.3Hz,6H)。

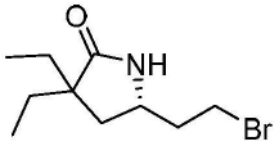
[3703] 

[3704] 5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(外消旋)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮代替(R)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基-1-甲苯磺酰基吡咯烷-2-酮。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.28-7.10(m,5H),

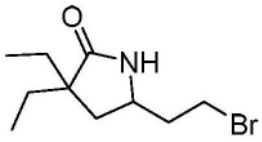
6.17(b,1H),4.36(s,2H),3.58-3.32(m,3H),1.89(dd,J=7.3,13.3Hz,1H),1.68-1.53(m,2H),1.52-1.28(m,5H),0.76(dt,J=7.4,19.8Hz,6H)。

[3705] 

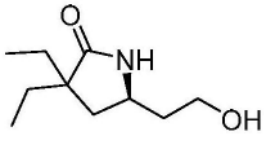
[3706] (R)-5-(2-溴乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:向圆底烧瓶中添加10%Pd/C(175mg,20重量%),然后添加(R)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮(876mg,3.19mmol,1当量)在乙醇(17mL)中的溶液。使用球囊将体系置于H_2(1个大气压)下,并在H_2气氛下在23℃下搅拌过夜。将反应物通过硅藻土塞过滤,并减压浓缩。将粗醇溶于四氢呋喃(12.8mL)中,然后依次添加三苯基膦(1.35g,5.13mmol,1.6当量)和四溴化碳(1.70g,5.13mmol,1.6当量),并将该反应在23℃下搅拌~3小时。将所得混合物过滤并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(100%己烷,然后乙酸乙酯/己烷,30%~50%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.31(b,1H),3.65(p,J=6.8Hz,1H),3.38(t,J=6.7Hz,2H),2.12-1.85(m,3H),1.62-1.32(m,5H),0.82(dt,J=7.5,17.8Hz,6H)。

[3707] 

[3708] (S)-5-(2-溴乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-5-(2-溴乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(R)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮代替(R)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.16(b,1H),3.66(p,J=6.8Hz,1H),3.38(t,J=6.8Hz,2H),2.08-1.88(m,3H),1.59-1.35(m,5H),0.82(dt,J=7.5,17.8Hz,6H)。

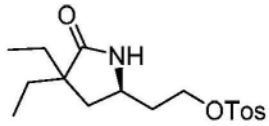
[3709] 

[3710] 5-(2-溴乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-5-(2-溴乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮代替(R)-5-(2-(苄氧基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ8.06(b,1H),3.64(p,J=6.5Hz,1H),3.40(t,J=6.8Hz,2H),2.06-1.86(m,3H),1.58-1.34(m,5H),0.81(dt,J=7.5,16.8Hz,6H)。

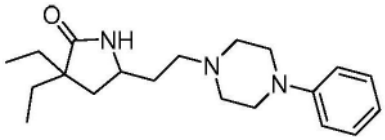
[3711] 

[3712] (R)-3,3-二乙基-5-(2-羟乙基)吡咯烷-2-酮的制备:通过向甲醇(45mL)中添加乙酰氯(18mL)来制备6M HCl的甲醇溶液。将(R)-5-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-3,3-二乙基-2-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯(3.98g,10mmol,1.0当量)溶于制备的6M HCl甲醇溶液(45mL)中,并在23℃下搅拌30分钟。将所得反应溶液用甲醇稀释,然后真空浓缩,得到粗产物,其无需进一步纯化即可用于下一步。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.28(b,1H),

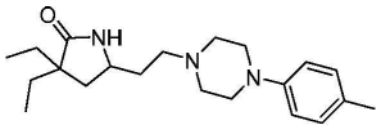
3.82(m,2H),3.68(m,1H),2.07(dd,J=7.7,13.4Hz,1H),1.70(m,2H),1.61(dd,J=7.7,13.3Hz,1H),1.57-1.39(m,4H),0.84(dt,J=7.5,18.0Hz,6H)。

[3713] 

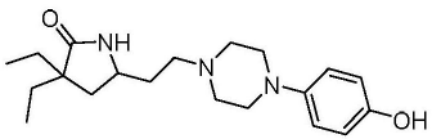
[3714] (R)-4-甲基苯磺酸2-(4,4-二乙基-5-氧代吡咯烷-2-基)乙酯的制备:在0℃下,向(R)-3,3-二乙基-5-(2-羟乙基)吡咯烷-2-酮(1.85g,10mmol,1.0当量)和三乙胺(2.02g,20mmol,2.0当量)在四氢呋喃/二氯甲烷(50mL:50mL)中的冷却溶液中添加4-甲苯磺酰氯(2.85g,15mmol,1.5当量),然后添加4-二甲基氨基吡啶(0.122g,1mmol,0.2当量)。将所得反应混合物在0℃下搅拌5分钟,然后温热至23℃并搅拌72小时。然后,将反应混合物用二氯甲烷(50mL)稀释,用1N HCl(1x50mL)和去离子H_2O(2x50mL)洗涤,经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(乙酸乙酯/已烷,20%~75%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.22(d,J=8.2Hz,2H),7.29(d,J=7.9Hz,2H),6.05(b,1H),4.04(t,J=5.8Hz,2H),3.53(p,J=6.8Hz,1H),2.38(s,3H),1.94(dd,J=7.6,13.2Hz,1H),1.75(q,J=6.0Hz,2H),1.53-1.32(m,5H),0.78(dt,J=7.5,21.5Hz,6H)。

[3715] 

[3716] 3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:向小瓶中添加5-(2-溴乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮(50mg,0.201mmol,1当量)、1-苯基哌嗪(69mg,0.422mmol,2.1当量)和四氢呋喃(3.5mL)。将反应混合物回流过夜,然后冷却至23℃。将混合物过滤,用四氢呋喃洗涤,并将滤液真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(MeOH/DCM,0%至10%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.26(m,2H),6.93(d,J=8.1Hz,2H),6.86(t,J=7.2Hz,1H),6.76(b,1H),3.58(m,1H),3.22(t,J=5.0Hz,4H),2.69(m,2H),2.60-2.40(m,4H),2.06(dd,J=7.2,13.1Hz,1H),1.78-1.43(m,7H),0.91(dt,J=7.5,13.5Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 330.2

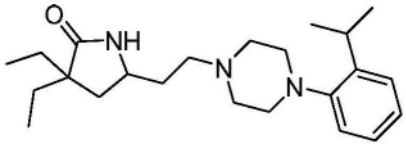
[3717] 

[3718] 3,3-二乙基-5-(2-(4-(对甲苯基)哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:根据用于3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(4-甲基苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.07(d,J=8.1Hz,2H),6.84(d,J=8.6Hz,2H),6.74(b,1H),3.58(m,1H),3.16(t,J=5.0Hz,4H),2.69(m,2H),2.56-2.40(m,4H),2.27(s,3H),2.05(dd,J=7.3,13.3Hz,1H),1.78-1.43(m,7H),0.91(dt,J=7.4,13.8Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 344.2

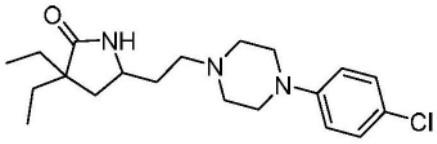
[3719] 

[3720] 3,3-二乙基-5-(2-(4-(4-羟基苯基)哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:根据

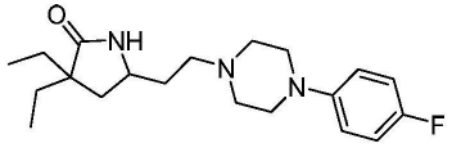
用于3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(4-羟基苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.23(b,1H),6.73(d,J=9.1Hz,2H),6.68(d,J=9.0Hz,2H),3.59(m,1H),3.04-2.87(b,4H),2.69(m,2H),2.57(m,1H),2.45(m,3H),2.06(dd,J=7.4,13.2Hz,1H),1.75-1.43(m,7H),0.91(dt,J=7.5,14.3Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 346.2

[3721] 

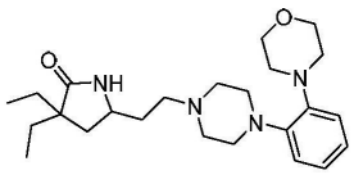
[3722] 3,3-二乙基-5-(2-(4-(2-异丙基苯基)哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:根据用于3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(2-异丙基苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.26(d,J=7.5Hz,1H),7.20-7.04(m,3H),6.79(b,1H),3.59(m,1H),3.49(sept.J=6.8Hz,1H),2.93(t,J=4.6Hz,4H),2.83-2.60(b,2H),2.60-2.42(m,4H),2.07(dd,J=7.4,13.1Hz,1H),1.78-1.45(m,7H),1.23(dd,J=2.4,6.9Hz,6H),0.92(dt,J=7.4,18.3Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 372.2

[3723] 

[3724] 5-(2-(4-(4-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(4-氯苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.19(d,J=9.0Hz,2H),6.83(d,J=9.0Hz,2H),6.73(b,1H),3.57(m,1H),3.17(t,J=5.0Hz,4H),2.68(m,2H),2.58-2.40(m,4H),2.05(dd,J=7.4,13.2Hz,1H),1.76-1.42(m,7H),0.90(dt,J=7.4,13.7Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 364.2

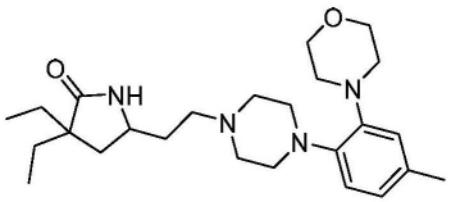
[3725] 

[3726] 3,3-二乙基-5-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:根据用于3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(4-氟苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ6.99-6.90(m,2H),6.89-6.83(m,2H),6.79(b,1H),3.56(m,1H),3.12(t,J=4.9Hz,4H),2.68(m,2H),2.58-2.39(m,4H),2.04(dd,J=7.5,13.2Hz,1H),1.74-1.42(m,7H),0.89(dt,J=7.4,13.9Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 348.2

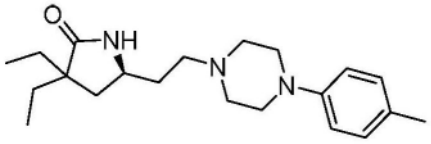
[3727] 

[3728] 3,3-二乙基-5-(2-(4-(2-吗啉代苯基)哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:根

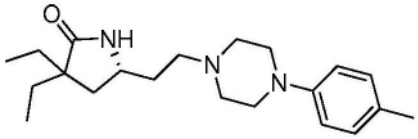
据用于3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用4-(2-(哌嗪-1-基)苯基)吗啉代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ6.91-6.84(m,2H),6.84-6.74(m,2H),6.51(b,1H),3.71(t,J=4.8Hz,4H),3.46(m,1H),3.36-2.77(b,8H),2.74-2.07(b,6H),1.94(dd,J=7.5,13.2Hz,1H),1.65-1.31(m,7H),0.79(dt,J=7.3,15.9Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 415.2

[3729] 

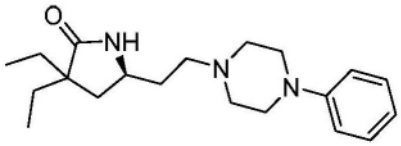
[3730] 3,3-二乙基-5-(2-(4-(4-甲基-2-吗啉代苯基)哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:根据用于3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用4-(5-甲基-2-(哌嗪-1-基)苯基)吗啉代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ6.88-6.78(m,2H),6.77-6.67(m,2H),3.84(t,J=4.6Hz,4H),3.59(m,1H),3.42-2.86(b,8H),2.80-2.32(b,6H),2.29(s,3H),2.06(dd,J=7.5,13.3Hz,1H),1.78-1.44(m,7H),0.92(dt,J=7.4,15.6Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 429.2

[3731] 

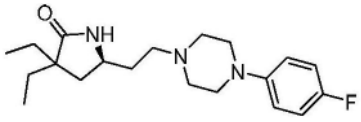
[3732] (R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-(对甲苯基)哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:根据用于3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(R)-5-(2-溴乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮代替5-(2-溴乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮,用1-(4-甲基苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.07(d,J=8.2Hz,2H),6.84(d,J=8.5Hz,2H),6.41(b,1H),3.57(m,1H),3.16(t,J=4.9Hz,4H),2.69(m,2H),2.58-2.40(m,4H),2.27(s,3H),2.05(dd,J=7.3,13.1Hz,1H),1.77-1.43(m,7H),0.91(dt,J=7.4,13.7Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 344.2

[3733] 

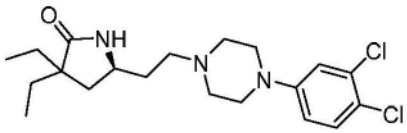
[3734] (S)-3,3-二乙基-5-(2-(4-(对甲苯基)哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:根据用于3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-5-(2-溴乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮代替5-(2-溴乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮,用1-(4-甲基苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.00(d,J=8.5Hz,2H),6.76(d,J=8.5Hz,2H),6.41(b,1H),3.50(m,1H),3.09(t,J=5.1Hz,4H),2.64(m,2H),2.54-2.32(m,4H),2.19(s,3H),1.98(dd,J=7.3,13.1Hz,1H),1.69-1.69(m,7H),0.83(dt,J=7.4,14.5Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 344.2

[3735] 

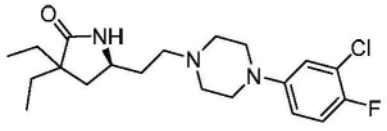
[3736] (R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:向小瓶中添加(R)-4-甲基苯磺酸2-(4,4-二乙基-5-氧代吡咯烷-2-基)乙酯(75mg,0.22mmol,1当量)和1-苯基哌嗪(76mg,0.46mmol,2.1当量),然后将两者溶于乙腈(2.2mL)中。然后添加K_2CO_3(77mg,0.55mmol,2.5当量),将反应在80℃下搅拌过夜,然后冷却至23℃。将混合物过滤,用乙腈洗涤,并将滤液真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(MeOH/DCM,0%至10%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.27(m,2H),6.94(d,J=8.1Hz,2H),6.87(t,J=7.2Hz,1H),6.65(b,1H),3.59(m,1H),3.23(t,J=5.0Hz,4H),2.71(m,2H),2.61-2.41(m,4H),2.07(dd,J=7.4,13.1Hz,1H),1.77-1.45(m,7H),0.92(dt,J=7.4,14.0Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 330.2。

[3737] 

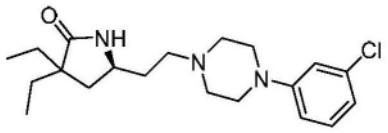
[3738] (R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(4-氟苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.00-6.91(m,2H),6.91-6.82(m,2H),6.74(b,1H),3.57(m,1H),3.13(t,J=5.0Hz,4H),2.70(m,2H),2.60-2.41(m,4H),2.05(dd,J=7.3,13.1Hz,1H),1.76-1.44(m,7H),0.90(dt,J=7.5,14.1Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z348.2

[3739] 

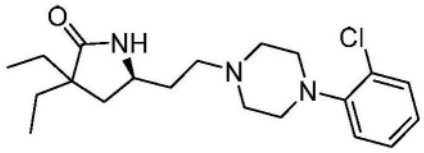
[3740] (R)-5-(2-(4-(3,4-二氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(3,4-二氯苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.26(d,J=9.0Hz,1H),6.95(d,J=2.9Hz,1H),6.79-2.67(b,2H),3.58(m,1H),3.18(t,J=5.0Hz,4H),2.67(m,2H),2.59-2.39(m,4H),2.05(dd,J=7.4,13.1Hz,1H),1.75-1.42(m,7H),0.90(dt,J=7.4,13.7Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 398.2。

[3741] 

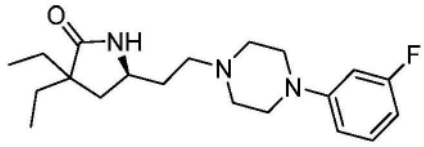
[3742] (R)-5-(2-(4-(3-氯-4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(3-氯-4-氟苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.01(t,J=8.8Hz,1H),6.91(dd,J=2.9,6.2Hz,1H),6.79-6.66(b,2H),3.57(m,1H),3.14(t,J=5.0Hz,4H),2.68(m,2H),2.60-2.40(m,4H),2.05(dd,J=7.5,13.2Hz,1H),1.75-1.43(m,7H),0.90(dt,J=7.3,13.9Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 382.2。

[3743] 

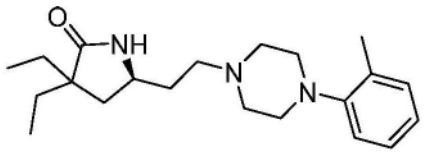
[3744] (R)-5-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(3-氯苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.16(t,J=8.1Hz,1H),6.87(t,J=2.1Hz,1H),6.83-6.75(m,2H),6.71(b,1H),3.58(m,1H),3.21(t,J=5.0Hz,4H),2.68(m,2H),2.60-2.40(m,4H),2.06(dd,J=7.2,13.1Hz,1H),1.76-1.44(m,7H),0.91(dt,J=7.4,13.8Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 364.2

[3745] 

[3746] (R)-5-(2-(4-(2-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(2-氯苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.27(dd,J=1.5,7.9Hz,1H),7.14(td,J=1.5,7.7Hz,1H),6.98(dd,J=1.5,8.0Hz,1H),6.89(td,J=1.5,7.7Hz,1H),6.63(b,1H),3.50(m,1H),3.18-2.83(b,4H),2.77-2.56(b,2H),2.55-2.31(m,4H),1.98(dd,J=7.4,13.1Hz,1H),1.69-1.36(m,7H),0.83(dt,J=7.4,16.9Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z364.2

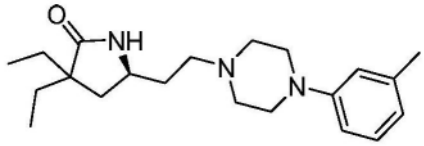
[3747] 

[3748] (R)-5-(2-(4-(3-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(3-氟苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.10(m,1H),6.64-6.54(b,2H),6.50(dt,J=2.4,12.4Hz,1H),6.45(td,J=2.3,8.2Hz,1H),3.50(m,1H),3.14(t,J=5.0Hz,4H),2.60(m,2H),2.51-2.30(m,4H),1.98(dd,J=7.3,13.2Hz,1H),1.67-1.36(m,7H),0.83(dt,J=7.3,14.0Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 348.2

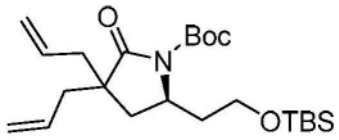
[3749] 

[3750] (R)-5-(2-(4-(2-甲基苯基)哌嗪-1-基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(2-甲基苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.17(m,2H),7.04(dd,J=1.2,8.5Hz,1H),6.99(td,J=1.2,7.4Hz,1H),6.73(b,1H),3.59(m,1H),3.03-2.89(b,4H),2.83-2.62(b,2H),2.62-2.38(m,4H),2.31(s,3H),2.07(dd,J=7.5,13.1Hz,1H),1.77-1.45(m,7H),0.92(dt,J=7.5,17.5Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z

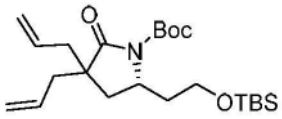
344.2

[3751] 

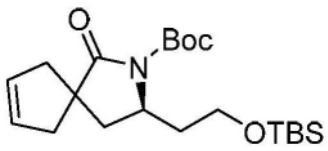
[3752] (R)-5-(2-(4-(3-甲基苯基)哌嗪-1-基)乙基)-3,3-二乙基吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(3-甲基苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.16(t,J=7.8Hz,1H),6.80-6.68(m,3H),6.63(b,1H),3.59(m,1H),3.22(t,J=5.0Hz,4H),2.71(m,2H),2.61-2.41(m,4H),2.33(s,3H),2.07(dd,J=7.4,13.2Hz,1H),1.78-1.45(m,7H),0.92(dt,J=7.4,14.0Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 344.2

[3753] 

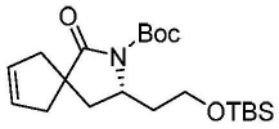
[3754] (R)-3,3-二烯丙基-5-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-2-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯的制备:该反应在烘箱干燥的玻璃器皿中于氮气气氛下进行。将(R)-2-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-5-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯(10.0g,29.0mmol,1.0当量)在无水四氢呋喃(43mL)中的搅拌溶液冷却至-78℃,并在保持反应温度低于-70℃的同时滴加1M双(三甲基硅基)氨基钾溶液(四氢呋喃,63.8mL,63.8mmol,2.2当量)。将所得溶液缓慢温热至-30℃,然后冷却至-78℃,这时缓慢滴加烯丙基碘(10.71g,63.8mmol,2.2当量)。将所得溶液缓慢温热至-20℃,然后用饱和NH_4Cl(75mL)淬灭,并用乙酸乙酯(3x75mL)萃取。将合并的有机层经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(乙酸乙酯/己烷,0%~10%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ5.77-5.58(m,2H),5.12-4.99(m,4H),3.96(m,1H),3.63(t,J=6.2Hz,2H),2.40-2.09(m,5H),2.01(dd,J=8.6,13.6Hz,1H),1.70(dd,J=6.4,13.6Hz,1H),1.57-1.42(m,10H),0.84(s,9H),0.00(s,6H)。

[3755] 

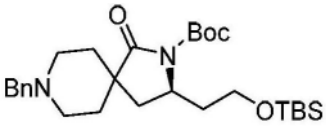
[3756] (S)-3,3-二烯丙基-5-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-2-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯的制备:根据用于(R)-3,3-二烯丙基-5-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-2-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-2-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-5-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯代替(R)-2-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-5-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ5.79-5.60(m,2H),5.13-4.98(m,4H),3.96(m,1H),3.62(t,J=6.2Hz,2H),2.40-2.10(m,5H),2.00(dd,J=8.6,13.6Hz,1H),1.69(dd,J=6.3,13.6Hz,1H),1.58-1.42(m,10H),0.83(s,9H),0.00(s,6H)。

[3757] 

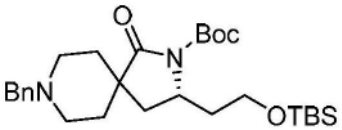
[3758] (R)-3-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-2-羧酸叔丁酯的制备:向(R)-3,3-二烯丙基-5-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-2-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯(10.03g,23.6mmol,1.0当量)在二氯甲烷(200mL)中的搅拌溶液中添加苯亚甲基-双(三环己基(膦)二氯化钌(0.388g,0.472mmol,2mol%)。将所得溶液在23℃下搅拌4小时,然后真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(乙酸乙酯/己烷,0%～20%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ5.56(m,2H),4.08(m,1H),3.66(t,J=6.1Hz,2H),2.86(m,2H),2.36(m,1H),2.29-2.14(m,2H),2.09(dd,J=8.0,13.0Hz,1H),1.98(dd,J=3.9,13.0Hz,1H),1.60(m,1H),1.48(s,9H),0.83(s,9H),0.00(s,6H)。

[3759] 

[3760] (S)-3-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-2-羧酸叔丁酯的制备:根据用于(R)-3-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-2-羧酸叔丁酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-3,3-二烯丙基-5-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-2-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯代替(R)-3,3-二烯丙基-5-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-2-氧代吡咯烷-1-羧酸叔丁酯。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ5.56(m,2H),4.08(m,1H),3.66(t,J=6.1Hz,2H),2.87(m,2H),2.36(m,1H),2.30-2.14(m,2H),2.09(dd,J=8.0,13.1Hz,1H),1.98(dd,J=3.9,13.1Hz,1H),1.60(m,1H),1.48(s,9H),0.83(s,9H),0.00(s,6H)。

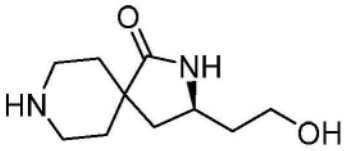
[3761] 

[3762] (R)-8-苄基-3-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-2-羧酸叔丁酯的制备:将(R)-3-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-2-羧酸叔丁酯(9.04g,将22.8mmol,1.0当量)在二氯甲烷(235mL)和甲醇(7.7mL)中的搅拌溶液冷却至-78℃,然后将O_3/O_2气流鼓泡通入该溶液中,直到颜色变成紫色(45分钟)。通过将O_2鼓泡通入溶液中10分钟来除去残留的O_3。在-78℃下,添加$NaBH(OAc)_3$(4.93g,23.2mmol,1.02当量),并将反应混合物温热至23℃并搅拌45分钟。接下来,依次添加$BnNH_2$(2.70g,25.2mmol,1.1当量)和$NaBH(OAc)_3$(9.72g,45.8mmol,2.0当量),并将反应在23℃下搅拌过夜。将所得混合物过滤并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(2M氨的MeOH/二氯甲烷溶液,0%～2%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.34-7.19(m,5H),4.03(m,1H),3.65(t,J=5.9Hz,2H)3.54(b,2H),2.94(b,2H),2.41(b,2H),2.19(m,1H),2.08-1.86(m,3H),1.79(dd,J=4.7,13.5Hz,1H),1.60-1.40(m,12H),0.84(s,9H),0.00(s,6H)。

[3763] 

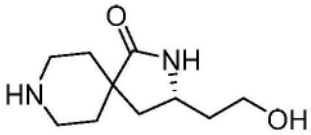
[3764] (S)-8-苄基-3-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-2-羧酸叔丁酯的制备:根据用于(R)-8-苄基-3-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)

氧基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-2-羧酸叔丁酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-3-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-2-羧酸叔丁酯代替(R)-3-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-2-羧酸叔丁酯。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.32-7.14(m,5H),4.02(m,1H),3.65(t,J=5.9Hz,2H)3.54(b,2H),2.84(b,2H),2.41(b,2H),2.19(m,1H),2.05-1.86(m,3H),1.80(dd,J=4.7,13.3Hz,1H),1.60-1.39(m,12H),0.84(s,9H),0.00(s,6H)。

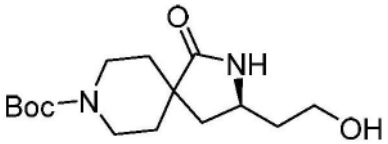
[3765] 

[3766] (R)-3-(2-羟乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:向圆底烧瓶中添加10%Pd/C(1.27g,20重量%),然后添加(R)-8-苄基-3-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-2-羧酸叔丁酯(6.32g,12.5mmol,1当量)在甲醇(83mL)中的溶液。使用球囊将反应置于H_2(1个大气压)下,在23℃下搅拌过夜。通过硅藻土塞过滤反应物,并减压浓缩滤液,得到粗制中间体。

[3767] 通过向甲醇(160mL)中添加乙酰氯(60mL)来制备6M HCl的甲醇溶液。将粗制中间体溶于制备的6M HCl甲醇溶液(160mL)中,在23℃下搅拌30分钟,然后用甲醇稀释并真空浓缩,得到粗产物,为HCl盐。通过与Amberlite IRN-78基础树脂在甲醇(~150mL)中的溶液搅拌15分钟,然后过滤并真空浓缩,得到粗产物,其无需进一步纯化即可用于下一步。^{1}H NMR(400MHz,MeOD)δ3.82-3.61(m,3H),3.02(m,2H),2.76(td,J=2.9,12.9Hz,1H),2.64(td,J=2.9,12.9Hz,1H),2.46(dd,J=7.0,13.0Hz,1H),1.93(td,J=4.4,12.7Hz,1H),1.86-1.74(m,1H),1.74-1.64(m,2H),1.60(dd,J=8.2,12.9Hz,1H),1.49(d,J=13.2Hz,1H),1.36(d,J=13.6Hz,1H)。

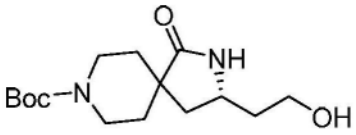
[3768] 

[3769] (S)-3-(2-羟乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:根据用于(R)-3-(2-羟乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(R)-8-苄基-3-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-2-羧酸叔丁酯代替(S)-8-苄基-3-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-2-羧酸叔丁酯。^{1}H NMR(400MHz,MeOD)δ3.82-3.60(m,3H),3.02(m,2H),2.76(td,J=2.9,12.9Hz,1H),2.64(td,J=2.9,12.9Hz,1H),2.46(dd,J=7.1,13.2Hz,1H),1.93(td,J=3.7,12.3Hz,1H),1.86-1.75(m,1H),1.75-1.64(m,2H),1.60(dd,J=8.0,12.7Hz,1H),1.49(d,J=13.1Hz,1H),1.37(d,J=13.0Hz,1H)。

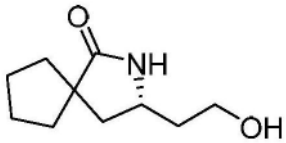
[3770] 

[3771] (R)-3-(2-羟乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯的制备:向(R)-3-(2-羟乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮(2.2g,11.0mmol,1.0当量)和三乙胺

(1.12g,11.0mmol,1.0当量)在二氯甲烷(113mL)和甲醇(3mL)中的溶液中添加二碳酸二叔丁酯(2.4g,11.0mmol,1.0当量)。将所得溶液在23℃下搅拌过夜,然后真空浓缩,得到粗产物,其无需进一步纯化即可用于下一步。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ6.93(b,1H),4.15-3.55(b,6H),3.15-2.74(m,2H),2.29(dd,J=6.7,12.5H,1H),2.00-1.82(m,1H),1.80-1.60(m,3H),1.58-1.29(m,12)。

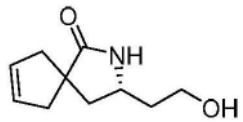
[3772] 

[3773] (S)-3-(2-羟乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯的制备:根据用于(R)-3-(2-羟乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-3-(2-羟乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮代替(R)-3-(2-羟乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ6.53(b,1H),4.06-3.56(b,6H),3.05-2.77(m,2H),2.25(dd,J=6.7,12.9H,1H),1.93-1.80(m,1H),1.74-1.56(m,3H),1.52-1.24(m,12)。

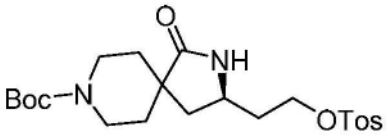
[3774] 

[3775] (S)-3-(2-羟乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-1-酮的制备:向圆底烧瓶中添加10%Pd/C(0.60g,20重量%),然后添加(S)-3-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-2-羧酸叔丁酯(0.30g,0.758mmol,1当量)在甲醇(7.5mL)中的溶液。使用球囊将反应置于H_2(1个大气压)下,在23℃下搅拌4小时。通过硅藻土塞过滤反应物,并减压浓缩滤液,得到粗制中间体。

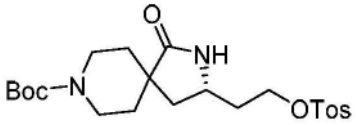
[3776] 通过向甲醇(7.5mL)中添加乙酰氯(3mL)来制备6M HCl的甲醇溶液。将粗制中间体溶于制备的6M HCl甲醇溶液(7.5mL)中,在23℃下搅拌30分钟,然后用甲醇稀释并真空浓缩,得到粗产物,其无需进一步纯化即可用于下一步。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ6.95(b,1H),3.99(b,1H),3.76(m,1H),3.64(m,2H),2.09(dd,J=6.6,12.6Hz,1H),2.01(m,1H),1.81-1.45(m,9H),1.37(m,1H)。

[3777] 

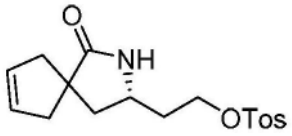
[3778] (S)-3-(2-羟乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-1-酮的制备:通过向甲醇(7.5mL)中添加乙酰氯(3mL)来制备6M HCl的甲醇溶液。将(S)-3-(2-((叔丁基二甲基甲硅烷基)氧基)乙基)-1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-2-羧酸叔丁酯(0.30g,0.758mmol,1当量)溶于制备的6M HCl甲醇溶液(7.5mL)中,并在23℃下搅拌~30分钟,然后用甲醇稀释并真空浓缩,得到粗产物,其无需进一步纯化即可用于下一步。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.04(b,1H),5.62(m,1H),5.52(m,1H),3.83-3.71(m,2H),3.70-3.57(m,2H),2.90(dp,J=2.4,16.6Hz,1H),2.58(dp,J=2.4,16.3Hz,1H),2.33(d,J=16.4Hz,1H),2.22(dd,J=6.2,12.4Hz,1H),2.14(d,J=16.2Hz,1H),1.71-1.54(m,3H)。

[3779] 

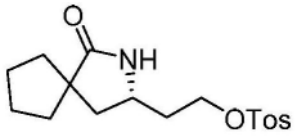
[3780] (R)-1-氧代-3-(2-(甲苯磺酰基氧基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯的制备:在0℃下,向(R)-3-(2-羟乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯(3.2g,10.7mmol,1.0当量)和三乙胺(2.16g,21.4mmol,2.0当量)在四氢呋喃/二氯甲烷(46mL:46mL)中的冷却溶液中添加4-甲苯磺酰氯(3.06g,16mmol,1.5当量),然后添加4-二甲基氨基吡啶(0.131g,1.07mmol,0.2当量)。将所得反应混合物在0℃下搅拌5分钟,然后温热至23℃并搅拌过夜。然后,将反应混合物用二氯甲烷(50mL)稀释,并用去离子H_2O(1x50mL)洗涤。用二氯甲烷(2x50mL)反洗水层。将合并的有机相经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,将其通过HPLC(CH_3CN/H_2O,0.1%甲酸,0%~100%)进一步纯化。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.81(d,J=8.3Hz,2H),7.38(d,J=8.2Hz,2H),6.11(b,1H),4.14(m,2H),4.07-3.89(b,2H),3.72(p,J=6.8Hz,1H),2.97(m,2H),2.48(s,3H),2.28(dd,J=6.9,12.8Hz,1H),1.97-1.83(m,3H),1.75(m,1H),1.56-1.30(m,12H)。

[3781] 

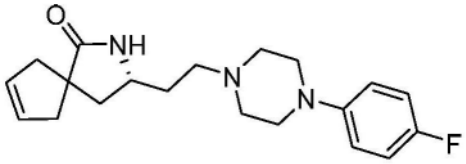
[3782] (S)-1-氧代-3-(2-(甲苯磺酰基氧基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯的制备:根据用于(R)-1-氧代-3-(2-(甲苯磺酰基氧基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-3-(2-羟乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯代替(R)-3-(2-羟乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.77(d,J=8.3Hz,2H),7.34(d,J=8.2Hz,2H),7.05(b,1H),4.11(m,2H),4.05-3.78(b,2H),3.68(p,J=6.8Hz,1H),2.92(m,2H),2.43(s,3H),2.22(dd,J=6.8,12.9Hz,1H),1.93-1.76(m,3H),1.68(m,1H),1.53-1.24(m,12H)。

[3783] 

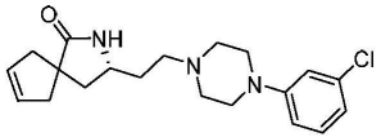
[3784] (S)-4-甲基苯磺酸2-(1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-3-基)乙酯的制备:在0℃下,向(S)-3-(2-羟乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-1-酮(0.140g,0.758mmol,1.0当量)和N-甲基咪唑(0.312g,3.8mmol,5.0当量)在二氯甲烷(2.5mL)中的冷却溶液中添加4-甲苯磺酰氯(0.217g,1.14mmol,1.5当量)在二氯甲烷(3.5mL)中的溶液。将所得反应混合物在0℃下搅拌5分钟,然后温热至23℃并搅拌过夜。然后,将反应混合物用1N HCl(1x5mL)淬灭,并用二氯甲烷(3x15mL)萃取。将合并的有机相经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(乙酸乙酯/已烷,40%~100%)进一步纯化。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.71(d,J=8.3Hz,2H),7.27(d,J=8.1Hz,2H),6.97(b,1H),5.58(m,1H),5.51(m,1H),4.04(m,2H),3.58(p,J=6.8Hz,1H),2.86(dp,J=2.3,16.5Hz,1H),2.58(dp,J=2.3,16.3Hz,1H),2.37(s,3H),2.25(d,J=16.1Hz,1H),2.19-2.04(m,2H),1.86-1.67(m,2H),1.54(dd,J=7.7,12.5Hz,1H)。

[3785] 

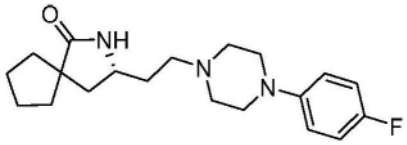
[3786] (S)-4-甲基苯磺酸2-(1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-3-基)乙酯的制备:根据用于(S)-4-甲基苯磺酸2-(1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-3-基)乙酯的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-3-(2-羟乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-1-酮代替(S)-3-(2-羟乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-1-酮。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.78(d,J=8.2Hz,2H),7.34(d,J=8.1Hz,2H),6.87(b,1H),4.10(m,2H),3.60(p,J=6.7Hz,1H),2.44(s,3H),2.12-1.97(m,2H),1.94-1.68(m,5H),1.66-1.45(m,4H),1.40(m,1H)。

[3787] 

[3788] (S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-1-酮的制备:向小瓶中添加(S)-4-甲基苯磺酸2-(1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-3-基)乙酯(50mg,0.15mmol,1当量)和1-(4-氟苯基)哌嗪(57mg,0.31mmol,2.1当量),然后将两者溶于乙腈(1.5mL)中。然后添加K_2CO_3(52mg,0.37mmol,2.5当量),将反应在80℃下搅拌过夜,然后冷却至23℃。将混合物过滤,用乙腈洗涤,并将滤液真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(MeOH/二氯甲烷,0%至10%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.00-6.82(m,5H),5.70(m,1H),5.59(m,1H),3.63(m,1H),3.13(t,J=4.9Hz,4H),3.02(dp,J=2.5,16.5Hz,1H),2.76-2.62(m,3H),2.61-2.43(m,4H),2.39(d,J=16.6Hz,1H),2.29(dd,J=6.1,12.4Hz,1H),2.20(d,J=16.4Hz,1H),1.80-1.57(m,3H)。LC/MS[M+H]=m/z 344.2

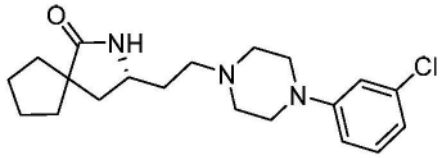
[3789] 

[3790] (S)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-1-酮的制备:根据用于(S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(3-氯苯基)哌嗪代替1-(4-氟苯基)哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.08(t,J=8.0Hz,1H),6.79(t,J=2.1Hz,1H),6.77-6.65(m,3H).5.60(m,1H),5.51(m,1H),3.56(m,1H),3.13(t,J=5.1Hz,4H),2.95(dp,J=2.4,16.6Hz,1H),2.68-2.54(m,3H),2.54-2.35(m,4H),2.31(d,J=16.0Hz,1H),2.22(dd,J=6.1,12.3Hz,1H),2.13(d,J=16.5Hz,1H),1.72-1.49(m,3H)。LC/MS[M+H]=m/z 360.2。

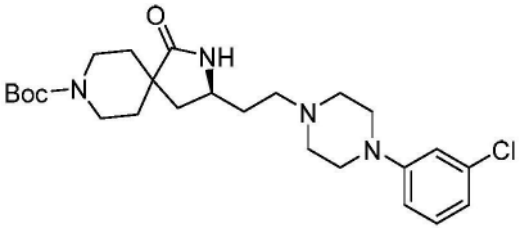
[3791] 

[3792] (S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-1-酮的制备:根据用于(S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-4-甲基苯磺酸2-(1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-3-基)乙酯代替(S)-4-甲基苯磺酸2-(1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-3-基)乙酯。^{1}H NMR(400MHz,

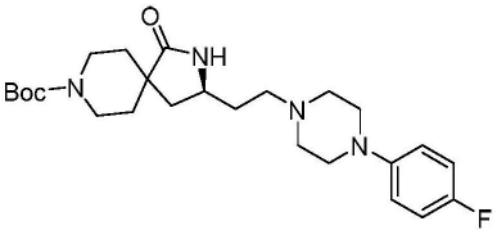
$CDCl_3$)δ7.00-6.91(m,2H),6.90-6.74(m,3H),3.59(m,1H),3.12(t,J=4.9Hz,4H),2.69(m,2H),2.60-2.44(m,4H),2.19-2.06(m,2H),1.86-1.51(m,9H),1.44(m,1H)。LC/MS[M+H]=m/z 346.2。

[3793] 

[3794] (S)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-1-酮的制备:根据用于(S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-4-甲基苯磺酸2-(1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-3-基)乙酯代替(S)-4-甲基苯磺酸2-(1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-3-基)乙酯,并用1-(3-氯苯基)哌嗪代替1-(4-氟苯基)哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.16(t,J=8.0Hz,1H),6.88(t,J=2.1Hz,1H),6.81(dd,J=1.7,7.8Hz,1H),6.78(dd,J=2.3,8.3Hz,1H),6.69(b,1H),3.60(m,1H),3.22(t,J=5.0Hz,4H),2.69(m,2H),2.61-2.39(m,4H),2.23-2.08(m,2H),1.87-1.55(m,9H),1.46(m,1H)。LC/MS[M+H]=m/z 362.2。

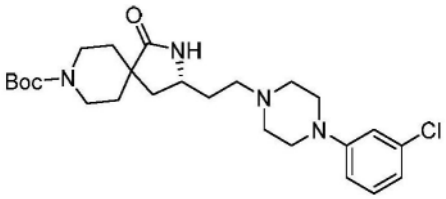
[3795] 

[3796] (R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯的制备:根据用于(S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(R)-1-氧代-3-(2-(甲苯磺酰基氧基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯代替(S)-4-甲基苯磺酸2-(1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-3-基)乙酯,并1-(3-氯苯基)哌嗪用代替1-(4-氟苯基)哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.15(t,J=7.9Hz,1H),7.06(b,1H),6.84(t,J=2.0Hz,1H),6.79(dd,J=1.6,7.6Hz,1H),6.74(dd,J=2.1,8.3Hz,1H),4.13-3.82(b,2H),3.63(p,J=7.0Hz,1H),3.20(t,J=4.8Hz,4H),3.10-2.83(m,2H),2.67(m,2H),2.60-2.40(m,4H),2.29(dd,J=6.7,12.8Hz,1H),1.96(m,1H),1.80-1.62(m,3H),1.58-1.30(m,12H)。LC/MS[M+H]=m/z 478.2。

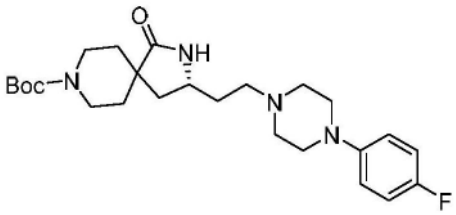
[3797] 

[3798] (R)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯的制备:根据用于(S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(R)-1-氧代-3-(2-(甲苯磺酰基氧基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯代替(S)-4-甲基苯磺酸2-(1-氧代-2-氮

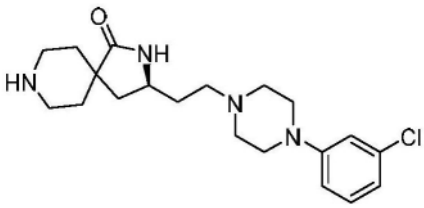
杂螺[4.4]壬-7-烯-3-基)乙酯。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.02(b,1H),6.97-6.90(m,2H),6.90-6.80(m,2H),4.23-3.78(b,2H),3.63(p,J=6.5Hz,1H),3.12(t,J=4.7Hz,4H),3.07-2.82(m,2H),2.68(m,2H),2.60-2.40(m,4H),2.28(dd,J=6.7,12.7Hz,1H),1.95(m,1H),1.80-1.61(m,3H),1.58-1.29(m,12H)。LC/MS[M+H]=m/z 461.2。

[3799] 

[3800] (S)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯的制备:根据用于(S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-1-氧代-3-(2-(甲苯磺酰基氧基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯代替(S)-4-甲基苯磺酸2-(1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-3-基)乙酯,并用1-(3-氯苯基)哌嗪代替1-(4-氟苯基)哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.14(t,J=8.0Hz,1H),7.04(b,1H),6.85(t,J=2.0Hz,1H),6.79(dd,J=1.6,7.7Hz,1H),6.76(dd,J=2.1,8.3Hz,1H),4.13-3.83(b,2H),3.63(p,J=7.0Hz,1H),3.19(t,J=4.8Hz,4H),3.09-2.80(m,2H),2.67(m,2H),2.60-2.39(m,4H),2.29(dd,J=6.6,12.8Hz,1H),1.95(m,1H),1.80-1.63(m,3H),1.57-1.30(m,12H)。LC/MS[M+H]=m/z 478.2

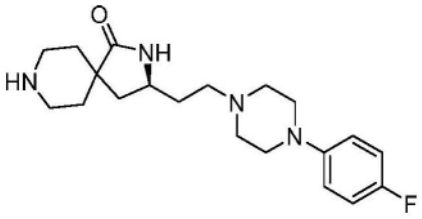
[3801] 

[3802] (S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯的制备:根据用于(S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-1-氧代-3-(2-(甲苯磺酰基氧基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯代替(S)-4-甲基苯磺酸2-(1-氧代-2-氮杂螺[4.4]壬-7-烯-3-基)乙酯。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.01(b,1H),6.97-6.89(m,2H),6.89-6.80(m,2H),4.21-3.76(b,2H),3.63(p,J=6.5Hz,1H),3.11(t,J=4.7Hz,4H),3.06-2.82(m,2H),2.69(m,2H),2.61-2.41(m,4H),2.29(dd,J=6.7,12.8Hz,1H),1.94(m,1H),1.80-1.60(m,3H),1.57-1.28(m,12H)。LC/MS[M+H]=m/z 461。

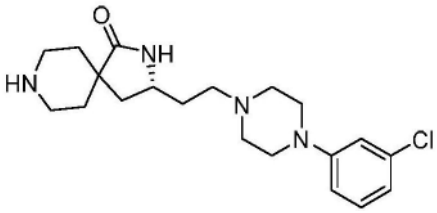
[3803] 

[3804] (R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:通过向甲醇(3mL)中添加乙酰氯(1.2mL)来制备6M HCl的甲醇溶液。将(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯(0.127g,

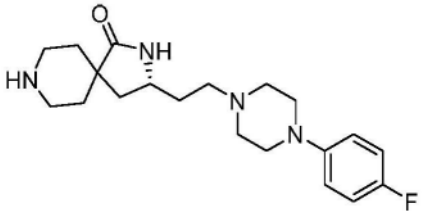
0.266mmol,1.0当量)溶于制备的6M HCl甲醇溶液(3mL)中,并在23℃下搅拌30分钟,然后用甲醇稀释并真空浓缩,得到粗产物,为HCl盐。通过与Amberlite IRN-78基础树脂在甲醇(~10mL)中的溶液搅拌15分钟,然后过滤并真空浓缩,得到粗产物,其无需进一步纯化即可用于下一步。^{1}H NMR(400MHz,MeOD)δ7.21(t,J=8.3Hz,1H),6.95(s,1H),6.88(d,J=8.5Hz,1H),6.81(d,J=7.7Hz,1H),3.68(m,1H),3.29-3.13(m,4H),3.01(m,2H),2.81-2.38(m,9H),1.93(m,1H),1.86-1.64(m,3H),1.60(dd,J=7.6,12.7Hz,1H),1.49(d,J=13.2Hz,1H),1.38(d,J=12.8Hz,1H)。LC/MS[M+H]=m/z377。

[3805] 

[3806] (R)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:根据用于(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(R)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯代替(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯。^{1}H NMR(400MHz,MeOD)δ7.08-6.92(m,4H),3.68(m,1H),3.23-3.09(m,4H),3.01(m,2H),2.81-2.38(m,9H),1.93(m,1H),1.86-1.62(m,3H),1.60(dd,J=7.6,12.5Hz,1H),1.48(d,J=13.5Hz,1H),1.37(d,J=13.5Hz,1H)。LC/MS[M+H]=m/z 361。

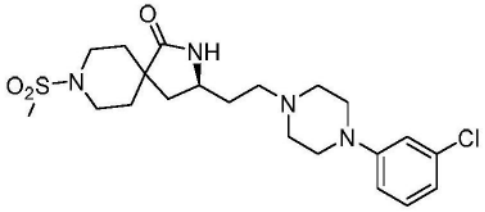
[3807] 

[3808] (S)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:根据用于(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用叔丁基(S)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮代替(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯。^{1}H NMR(400MHz,MeOD)δ7.20(t,J=8.2Hz,1H),6.94(s,1H),6.88(d,J=8.5Hz,1H),6.80(d,J=7.7Hz,1H),3.68(m,1H),3.28-3.13(m,4H),3.02(m,2H),2.80-2.36(m,9H),1.93(m,1H),1.85-1.64(m,3H),1.59(dd,J=7.6,12.7Hz,1H),1.48(d,J=13.2Hz,1H),1.37(d,J=12.8Hz,1H)。LC/MS[M+H]=m/z 377。

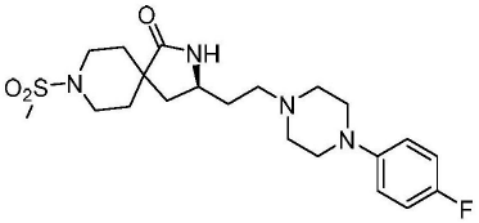
[3809] 

[3810] (S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:根据用于(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的方法

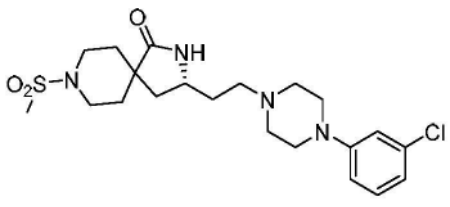
制备标题化合物,不同之处在于用(S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯代替(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯。^{1}H NMR(400MHz,MeOD)δ7.07-6.91(m,4H),3.68(m,1H),3.22-3.09(m,4H),3.02(m,2H),2.81-2.37(m,9H),1.93(m,1H),1.86-1.63(m,3H),1.59(dd,J=7.6,12.5Hz,1H),1.48(d,J=13.5Hz,1H),1.38(d,J=13.5Hz,1H)。LC/MS[M+H]=m/z 361.2。

[3811] 

[3812] (R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-8-(甲基磺酰基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:将(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮(28mg,0.074mmol,1当量)、二氯甲烷(0.85mL)和三乙胺(15.7mg,0.155mmol,2.1当量)的溶液冷却至0℃,然后将甲磺酰氯(12.7mg,0.111mmol,1.5当量)添加到该溶液中。使反应溶液升温至23℃,并搅拌15分钟。将反应用甲醇(~2mL)稀释,真空浓缩,并通过快速柱色谱(甲醇/二氯甲烷,0%~10%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.17(t,J=8.2Hz,1H),6.88(t,J=2.1Hz,1H),6.83(dd,J=1.7,7.8Hz,1H),6.81-6.72(m,2H),3.81-3.61(m,2H),3.50(m,1H),3.32-3.11(m,6H),2.82(s,3H),2.73(m,2H),2.66-2.42(m,4H),2.20(dd,J=6.5,12.7Hz,1H),2.04(m,1H),1.96(m,1H),1.79-1.50(m,5H);MS(LC/MS,M+H$^+$):456.2。

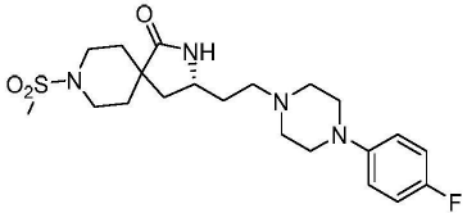
[3813] 

[3814] (R)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-8-(甲基磺酰基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:根据用于(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-8-(甲基磺酰基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(R)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮代替(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.07-6.93(m,2H),6.92-6.84(m,2H),6.80(b,1H),3.80-3.62(m,2H),3.49(m,1H),3.27(m,1H),3.22-3.08(m,5H),2.82(s,3H),2.75(m,2H),2.66-2.43(m,4H),2.20(dd,J=6.4,12.7Hz,1H),2.04(m,1H),1.96(m,1H),1.79-1.48(m,5H);MS(LC/MS,M+H$^+$):439.2。

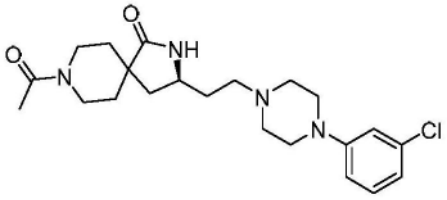
[3815] 

[3816] (S)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-8-(甲基磺酰基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:根据用于(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-8-(甲基磺酰

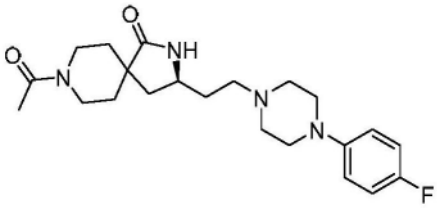
基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮代替(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.09(t,J=8.1Hz,1H),6.79(t,J=2.1Hz,1H),6.74(dd,J=1.7,7.7Hz,1H),6.72-6.65(m,2H),3.72-3.53(m,2H),3.41(m,1H),3.23-3.04(m,6H),2.73(s,3H),2.64(m,2H),2.57-2.33(m,4H),2.12(dd,J=6.4,12.8Hz,1H),1.95(m,1H),1.88(m,1H),1.70-1.42(m,5H);MS(LC/MS,M+H$^+$):456.2。

[3817] 

[3818] (S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-8-(甲基磺酰基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:根据用于(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-8-(甲基磺酰基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮代替(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ6.94-6.84(m,2H),6.83-6.76(m,2H),6.74(b,1H),3.71-3.54(m,2H),3.41(m,1H),3.17(m,1H),3.13-2.99(m,5H),2.73(s,3H),2.65(m,2H),2.57-2.34(m,4H),2.11(dd,J=6.4,12.7Hz,1H),1.95(m,1H),1.87(m,1H),1.70-1.39(m,5H);MS(LC/MS,M+H$^+$):439.2。

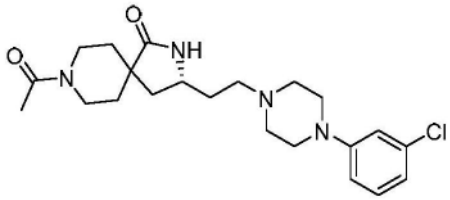
[3819] 

[3820] (R)-8-乙酰基-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:将(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮(21mg,0.056mmol,1当量)、二氯甲烷(0.725mL)和三乙胺(12mg,0.118mmol,2.1当量)冷却至0℃,然后向该溶液中添加乙酰氯(12.7mg,0.057mmol,1.01当量)。使反应溶液升温至23℃,并搅拌15分钟。将反应用甲醇(~2mL)稀释,真空浓缩,并通过快速柱色谱(甲醇/二氯甲烷,0%~10%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.09(t,J=8.1Hz,1H),6.80(t,J=2.2Hz,1H),6.77-6.65(m,3H),4.26(dt,J=4.8,13.4Hz,0.5H),4.12(dt,J=5.0,13.8Hz,0.5H),3.82(dt,J=4.5,13.5Hz,0.5H),3.69(dt,J=4.9,13.8Hz,0.5H),3.60(m,1H),3.27-3.03(m,5.5H),2.97(m,0.5H),2.63(m,2H),2.57-2.31(m,4H),2.23(m,1H),2.02(s,3H),1.98-1.80(m,1H),1.80-1.56(m,3H),1.55-1.29(m,3H);MS(LC/MS,M+H$^+$):419.2。

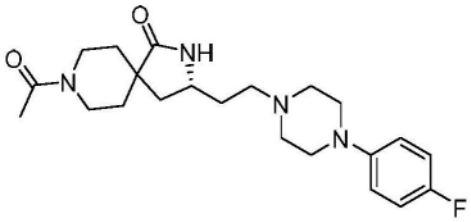
[3821] 

[3822] (R)-8-乙酰基-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-

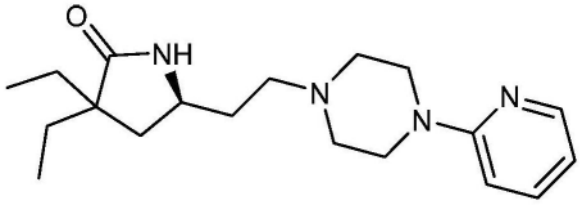
酮的制备:根据用于(R)-8-乙酰基-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(R)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮代替(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ6.93-6.84(m,2H),6.83-6.70(m,3H),4.26(dt,J=5.2,13.5Hz,0.5H),4.12(dt,J=5.0,13.5Hz,0.5H),3.82(dt,J=5.0,13.7Hz,0.5H),3.69(dt,J=5.0,13.7Hz,0.5H),3.59(m,1H),3.27-2.91(m,6H),2.65(m,2H),2.58-2.33(m,4H),2.23(m,1H),2.02(s,3H),1.99-1.82(m,1H),1.80-1.55(m,3H),1.54-1.30(m,3H);MS(LC/MS,M+H$^+$):403.2。

[3823] 

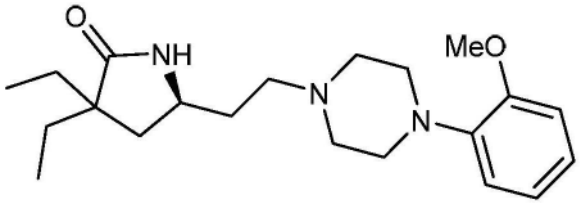
[3824] (S)-8-乙酰基-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:根据用于(R)-8-乙酰基-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮代替(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.09(t,J=8.1Hz,1H),6.80(t,J=2.2Hz,1H),6.77-6.66(m,3H),4.26(dt,J=4.8,13.4Hz,0.5H),4.12(dt,J=5.0,13.8Hz,0.5H),3.82(dt,J=4.5,13.5Hz,0.5H),3.69(dt,J=4.9,13.8Hz,0.5H),3.60(m,1H),3.25-3.08(m,5.5H),2.98(m,0.5H),2.63(m,2H),2.56-2.34(m,4H),2.23(m,1H),2.02(s,3H),1.98-1.83(m,1H),1.81-1.56(m,3H),1.54-1.30(m,3H);MS(LC/MS,M+H$^+$):419.2。

[3825] 

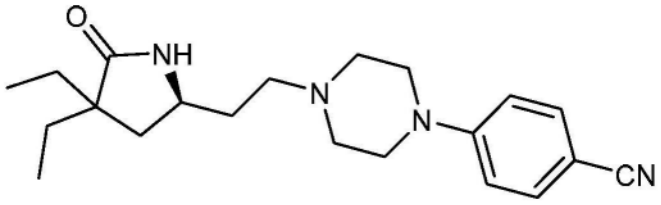
[3826] (S)-8-乙酰基-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:根据用于(R)-8-乙酰基-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用(S)-3-(2-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮代替(R)-3-(2-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ6.93-6.84(m,2H),6.83-6.73(m,3H),4.26(dt,J=5.2,13.5Hz,0.5H),4.12(dt,J=5.0,13.5Hz,0.5H),3.82(dt,J=5.0,13.7Hz,0.5H),3.69(dt,J=5.0,13.7Hz,0.5H),3.59(m,1H),3.26-2.91(m,6H),2.65(m,2H),2.57-2.32(m,4H),2.23(m,1H),2.02(s,3H),1.98-1.82(m,1H),1.81-1.55(m,3H),1.54-1.30(m,3H);MS(LC/MS,M+H$^+$):403.2。

[3827] 

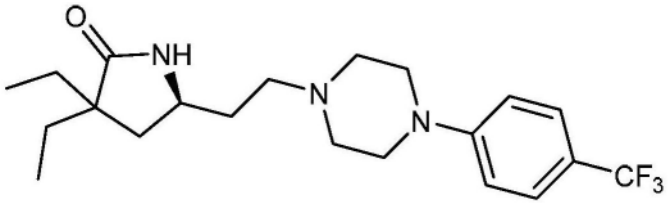
[3828] (R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-(吡啶-2-基)哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(2-吡啶基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ8.18(dd,J=2.1,4.8Hz,1H),7.47(m,1H),6.73(b,1H),6.66-6.57(m,2H),3.64-3.47(m,5H),2.63(m,2H),2.58-2.36(m,4H),2.05(dd,J=7.4,13.0Hz,1H),1.76-1.43(m,7H),0.90(dt,J=7.4,14.5Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 331.2

[3829] 

[3830] (R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-(2-甲氧基苯基)哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(2-甲氧基苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.04-6.88(m,3H),6.85(dd,J=1.1,8.0Hz,1H),6.72(b,1H),3.86(s,3H),3.58(m,1H),3.28-2.90(b,4H),2.84-2.65(b,2H),2.64-2.41(m,4H),2.05(dd,J=7.3,13.1Hz,1H),1.76-1.43(m,7H),0.91(dt,J=7.5,16.1Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 360.2

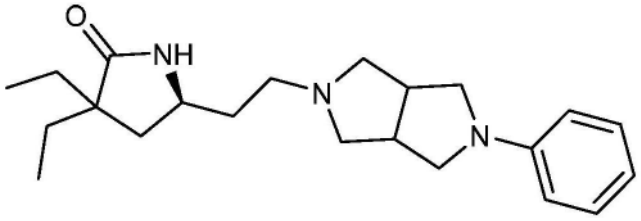
[3831] 

[3832] (R)-4-(4-(2-(4,4-二乙基-5-氧代吡咯烷-2-基)乙基)哌嗪-1-基)苄腈的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(4-氰基苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.48(d,J=9.0Hz,2H),6.85(d,J=9.0Hz,2H),6.73(b,1H),3.58(m,1H),3.34(t,J=5.1Hz,4H),2.67(m,2H),2.60-2.38(m,4H),2.06(dd,J=7.6,13.2Hz,1H),1.75-1.42(m,7H),0.90(dt,J=7.4,14.0Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 355.2

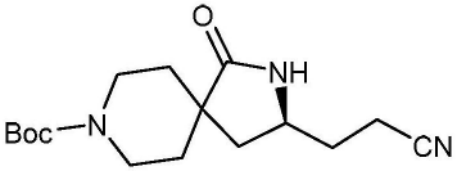
[3833] 

[3834] (R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-(4-(三氟甲基)苯基)哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(4-(三氟甲基)苯基)哌嗪代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR

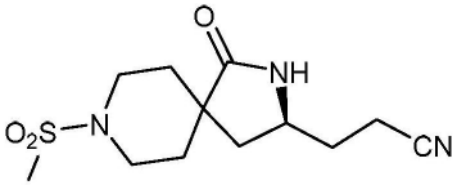
(400MHz,$CDCl_3$)δ7.36(d,J=8.6Hz,2H),6.80(d,J=8.6Hz,2H),6.58(b,1H),3.47(m,1H),3.18(t,J=5.0Hz,4H),2.57(m,2H),2.49-2.28(m,4H),1.95(dd,J=7.4,13.1Hz,1H),1.64-1.32(m,7H),0.79(dt,J=7.3,13.8Hz,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 398.2

[3835] 

[3836] (5R)-3,3-二乙基-5-(2-(5-苯基六氢吡咯并[3,4-c]吡咯-2(1H)-基)乙基)吡咯烷-2-酮的制备:根据用于(R)-3,3-二乙基-5-(2-(4-苯基哌嗪-1-基)乙基)吡咯烷-2-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用2-苯基八氢吡咯并[3,4-c]吡咯代替1-苯基哌嗪。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.11(m,2H),6.61(t,J=7.4Hz,1H),6.56(d,J=8.6Hz,2H),6.44(b,1H),3.42(m,1H),3.20-3.05(m,4H),2.91(m,1H),2.87-2.70(m,3H),2.51(m,1H),2.34-2.15(m,2H),2.07(dd,J=4.7,8.5Hz,1H),1.91(dd,J=7.4,13.1Hz,1H),1.58-1.28(m,7H),0.77(m,6H)。LC/MS[M+H]=m/z 356.2

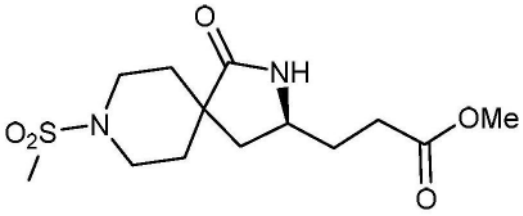
[3837] 

[3838] (S)-3-(2-氰基乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯的制备:向(R)-1-氧代-3-(2-(甲苯磺酰基氧基)乙基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯(0.2g,0.44mmol,1.0当量)在乙腈(1.9mL)中的溶液中添加氰化钾(0.72g,1.1mmol,2.5当量)。然后将所得反应混合物回流16小时。冷却至23℃后,将反应混合物通过硅藻土塞过滤并真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(MeOH/二氯甲烷,0%~10%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ8.08(b,1H),4.11-3.79(b,2H),3.72(p,J=6.6Hz,1H),3.00(t,J=11.3Hz,1H),2.91(t,J=11.3Hz,1H),2.49(td,J=1.2,7.4Hz,2H),2.32(dd,J=7.0,13.0Hz,1H),1.97-1.78(m,3H),1.72(m,1H),1.52(dd,J=7.8,12.9Hz,1H),1.48-1.29(m,11H)。

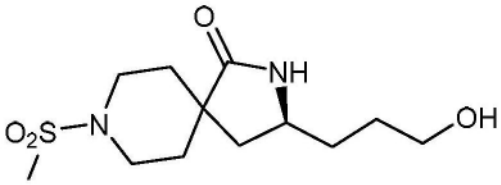
[3839] 

[3840] (S)-3-(8-(甲基磺酰基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-基)丙腈的制备:向(S)-3-(2-氰基乙基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-8-羧酸叔丁酯(0.1g,0.35mmol,1.0当量)在二氯甲烷(2.75mL)中的溶液中添加三氟乙酸(0.5mL)。将所得溶液在23℃下搅拌45分钟,然后真空浓缩。将残余物溶于MeOH(5mL)中,然后添加Amberlite IRN-78基础树脂(0.5g)。将该混合物剧烈搅拌15分钟,过滤,将滤液真空浓缩,得到粗制中间体,然后将其溶于二氯甲烷(3.75mL)中。然后将所得溶液冷却至0℃,然后依次添加三乙胺(0.72g,0.70mmol,2.0当量)和甲磺酰氯(0.6g,0.53mmol,1.5当量)。使反应溶液升温至23℃,并搅

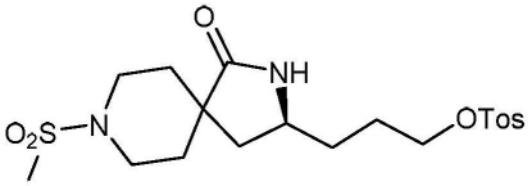
拌15分钟。将反应用MeOH(2mL)稀释,真空浓缩,再通过快速柱色谱(MeOH w/2M氨/二氯甲烷,0%-10%)纯化。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ6.56(b,1H),3.81(p,J=6.8Hz,1H),3.72(m,1H),3.53(m,1H),3.32-3.15(m,2H),2.83(s,3H),2.49(t,J=6.8Hz,2H),2.29(dd,J=6.9,12.9Hz,1H),2.09-1.82(m,4H),1.75-1.59(m,3H)。

[3841] 

[3842] (S)-3-(8-(甲基磺酰基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-基)丙酸甲酯的制备:通过向MeOH(1mL)中添加乙酰氯(0.48mL)来制备6M HCl的甲醇溶液。将(S)-3-(8-(甲基磺酰基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-基)丙腈(91mg,0.32mmol,1.0当量)溶于制备的6M HCl甲醇溶液(0.64mL)中,并在23℃下搅拌过夜。将反应混合物用MeOH(1mL)稀释,并真空浓缩。将所得残余物悬浮于饱和$NaHCO_3$水溶液中,并用二氯甲烷(4x15mL)萃取。将合并的有机相经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,其无需进一步纯化即可用于下一步。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.13(b,1H),3.75-3.57(m,5H),3.50(m,1H),3.23-3.02(m,2H),2.79(s,3H),2.40(td,J=1.7,7.2Hz,2H),2.18(dd,J=6.8,13.0Hz,1H),2.01(m,1H),1.92(m,1H),1.83(q,J=6.9Hz,2H),1.68-1.45(m,3H)。

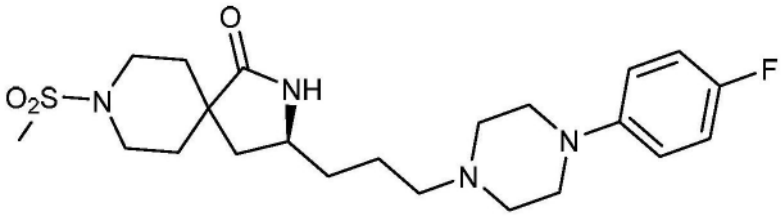
[3843] 

[3844] (S)-3-(3-羟丙基)-8-(甲基磺酰基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:该反应在烘箱干燥的玻璃器皿中于氮气气氛下进行。在0℃下,向(S)-3-(8-(甲基磺酰基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-基)丙酸甲酯(80mg,0.25mmol,1.0当量)在无水四氢呋喃(1.2mL)中的搅拌溶液中添加$LiBH_4$(2M的四氢呋喃溶液,0.25mL,0.5mmol,2.0当量),并将所得溶液在23℃下搅拌6小时。然后将反应用0.5mL乙酸淬灭,然后过滤,同时用MeOH洗涤。将滤液真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(MeOH/二氯甲烷,10%)进一步纯化。^{1}H NMR(400MHz,MeOD)δ3.74-3.55(m,5H),3.02(td,J=3.0,11.2Hz,1H),2.92(td,J=2.9,11.5Hz,1H),2.86(s,3H),2.39(dd,J=7.0,13.1Hz,1H),2.08-1.97(m,1H),1.89-1.78(m,1H),1.71-1.50(m,7H)。

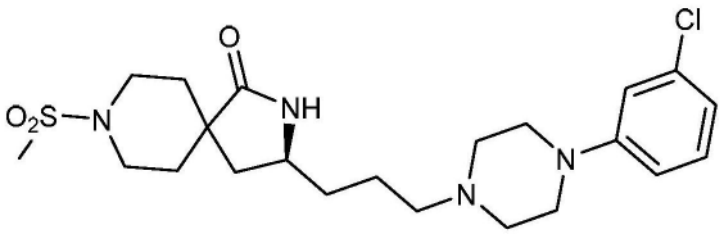
[3845] 

[3846] (S)-4-甲基苯磺酸3-(8-(甲基磺酰基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-基)丙酯的制备:在0℃下,向(S)-3-(3-羟丙基)-8-(甲基磺酰基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮(55mg,0.19mmol,1.0当量)和三乙胺(40mg,0.38mmol,2.0当量)在二氯甲烷:二甲基甲酰胺(2.0mL:0.2mL)中的冷却混合物中添加4-甲苯磺酰氯(55mg,0.28mmol,1.5当量),然后添加

4-二甲基氨基吡啶(3mg,0.02mmol,0.1当量)。将所得反应混合物在0℃下搅拌5分钟,然后温热至23℃并搅拌24小时。然后,将反应混合物用二氯甲烷(5mL)稀释,用1N HCl(1x5mL)洗涤。用二氯甲烷(2x5mL)反洗水层。将合并的有机层经Na_2SO_4干燥并真空浓缩,得到粗产物,将其通过HPLC(CH_3CN/H_2O,0.1%甲酸,0%~100%)进一步纯化。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.78(d,J=8.2Hz,2H),7.37(d,J=8.0Hz,2H),6.84(b,1H),4.04(t,J=5.9Hz,2H),3.70(m,1H),3.64-3.44(m,2H),3.21-3.00(m,2H),2.80(s,3H),2.46(s,3H),2.17(dd,J=6.8,12.8Hz,1H),2.01(m,1H),1.91(m,1H),1.81-1.66(m,2H),1.66-1.44(m,5H)。

[3847] 

[3848] (S)-3-(3-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)丙基)-8-(甲基磺酰基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:向小瓶中添加(S)-4-甲基苯磺酸3-(8-(甲基磺酰基)-1-氧代-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-基)丙酯(16mg,0.036mmol,1当量)和1-(4-氟苯基)哌嗪(13.5mg,0.75mmol,2.1当量),然后将两者溶于乙腈(0.4mL)中。然后添加K_2CO_3(13mg,0.089mmol,2.5当量),并将反应混合物在80℃下搅拌过夜,然后冷却至23℃。将混合物过滤,用乙腈洗涤,并将滤液真空浓缩,得到粗产物,将其通过柱色谱(MeOH/二氯甲烷,0%至10%)进一步纯化。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.02-6.92(m,3H),6.92-6.84(m,2H),3.72(m,1H),3.59(m,1H),3.50(m,1H),3.31-3.09(m,6H),2.81(s,3H),2.74-2.56(m,4H),2.46(t,J=6.2Hz,2H),2.18(dd,J=6.6,12.8Hz,1H),2.09-1.90(m,2H),1.74-1.43(m,7H)。LC/MS[M+H]=m/z 453.2

[3849] 

[3850] (S)-3-(3-(4-(3-氯苯基)哌嗪-1-基)丙基)-8-(甲基磺酰基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的制备:根据用于(S)-3-(3-(4-(4-氟苯基)哌嗪-1-基)丙基)-8-(甲基磺酰基)-2,8-二氮杂螺[4.5]癸-1-酮的方法制备标题化合物,不同之处在于用1-(3-氯苯基)哌嗪代替1-(4-氟苯基)哌嗪。^1H NMR(400MHz,$CDCl_3$)δ7.17(t,J=8.2Hz,1H),6.92-6.85(m,2H),6.84-6.76(m,2H),3.72(m,1H),3.60(m,1H),3.50(m,1H),3.32-3.13(m,6H),2.81(s,3H),2.71-2.55(m,4H),2.45(t,J=6.3Hz,2H),2.19(dd,J=6.7,12.8Hz,1H),2.09-1.90(m,2H),1.73-1.44(m,7H)。LC/MS[M+H]=m/z 469.2

[3851] 实施例2:示例性制剂

[3852] 本发明还涉及包含根据本发明的5-羟色胺受体7活性调节剂的组合物或制剂。一般来讲,本发明的组合物包含:有效量的根据本发明的一种或多种本公开化合物及其盐,其能够有效提供对5-羟色胺受体7活性的调节;以及一种或多种赋形剂。

[3853] 出于本发明的目的,术语"赋形剂"和"载体"在本发明的说明书中可互换使用,并

且所述术语在本文中定义为“在配制安全有效的药物组合物的实践中使用的成分”。

[3854] 配方人员应当理解,赋形剂主要用于提供安全、稳定和功能性药物,不仅作为整个递送载体的一部分,还作为实现活性成分的接受者的有效吸收的手段。赋形剂可以像惰性填充剂一样简单直接地起作用,或者如本文所用的赋形剂可以是pH稳定体系或涂层的一部分,以确保将成分安全地递送到胃中。配方人员还可以利用本发明化合物具有改善的细胞效力、药代动力学性质以及改善的口服生物利用度的事实。

[3855] 本教导内容还提供了药物组合物,其包含至少一种本文所述的化合物和一种或多种可药用载体、赋形剂或稀释剂。此类载体的实例是本领域技术人员众所周知的,并且可以根据可接受的药学方法制备,例如Remington's Pharmaceutical Sciences,第17版,Alfonoso R.Gennaro编,Mack Publishing Company,Easton,PA(1985)中所述的那些,该文献的全部公开内容以引用方式并入本文以用于所有目的。如本文所用,“可药用”是指从毒理学角度可用于药物应用并且不与活性成分不利地相互作用的物质。因此,可药用载体是与制剂中的其他成分相容并且在生物学上可接受的载体。补充的活性成分也可以掺入药物组合物中。

[3856] 本教导内容的化合物可以口服或非肠道方式,单独地或与常规药物载体组合地施用。适用的固体载体可包括也可用作调味剂、润滑剂、增溶剂、悬浮剂、填充剂、助流剂、压缩助剂、粘合剂或片剂崩解剂,或包封材料的一种或多种物质。化合物可以常规方式配制,例如以类似于用于已知5-羟色胺受体7活性调节剂的方式配制。含有本文所公开的化合物的口服制剂可包括任何常用的口服形式,包括片剂、胶囊剂、口腔剂型、糖锭、锭剂和口服液体、悬浮剂或溶液剂。在粉末中,载体可以是细分固体,其是与细分化合物的混合物。在片剂中,本文所公开的化合物可以合适的比例与具有必要压缩性质的载体混合,并压制成所需的形状和大小。粉末和片剂可含有高达99%的化合物。

[3857] 胶囊可包含一种或多种本文所公开的化合物与惰性填充剂和/或稀释剂诸如可药用淀粉(例如,玉米、马铃薯或木薯淀粉)、糖、人造甜味剂、粉末纤维素(例如,结晶和微晶纤维素)、面粉、明胶、树胶等的混合物。

[3858] 可用的片剂制剂可通过常规压制、湿法制粒或干法制粒方法制备,并使用可药用稀释剂、粘合剂、润滑剂、崩解剂、表面改性剂(包括表面活性剂)、悬浮剂或稳定剂,包括但不限于硬脂酸镁、硬脂酸、月桂基硫酸钠、滑石、糖、乳糖、糊精、淀粉、明胶、纤维素、甲基纤维素、微晶纤维素、羧甲基纤维素钠、羧甲基纤维素钙、聚乙烯吡咯烷、海藻酸、阿拉伯树胶、黄原胶、柠檬酸钠、复合硅酸盐、碳酸钙、甘氨酸、蔗糖、山梨糖醇、磷酸二钙、硫酸钙、乳糖、高岭土、甘露糖醇、氯化钠、低熔点蜡和离子交换树脂。表面改性剂包括非离子和阴离子表面改性剂。表面改性剂的代表性实例包括但不限于泊洛沙姆188、苯扎氯铵、硬脂酸钙、鲸蜡硬脂醇、聚西托醇乳化蜡、脱水山梨糖醇酯、胶体二氧化硅、磷酸盐、十二烷基硫酸钠、硅酸镁铝和三乙醇胺。本文的口服制剂可以使用标准延迟或延时释放制剂来改变化合物的吸收。该口服制剂还可包括在水或果汁中施用本文所公开的化合物,根据需要含有适当的增溶剂或乳化剂。

[3859] 液体载体可用于制备溶液剂、悬浮剂、乳剂、糖浆、酏剂和用于吸入递送。本发明的化合物可以溶解或悬浮于可药用液体载体诸如水、有机溶剂或这两者的混合物或者可药用油或脂肪中。液体载体可含有其他合适的药物添加剂,诸如增溶剂、乳化剂、缓冲剂、防腐

剂、甜味剂、调味剂、悬浮剂、增稠剂、着色剂、粘度调节剂、稳定剂和渗透调节剂。用于口服和非肠道施用的液体载体的实例包括但不限于水(尤其是含有如本文所述的添加剂,例如纤维素衍生物,如羧甲基纤维素钠溶液)、醇(包括一元醇和多元醇,例如二醇)及其衍生物,以及油(例如,分级椰子油和花生油)。对于非肠道施用,载体可以是油性酯,例如油酸乙酯和肉豆蔻酸异丙酯。无菌液体载体用于无菌液体形式的组合物中以进行非肠道施用。用于加压组合物的液体载体可以是卤代烃或其他可药用推进剂。

[3860] 液体药物组合物(其为无菌溶液剂或悬浮剂)可通过例如肌内、腹膜内或皮下注射使用。无菌溶液剂也可以静脉内施用。用于口服施用的组合物可以是液体或固体形式。

[3861] 优选地,药物组合物是片剂、胶囊剂、粉末剂、溶液剂、悬浮剂、乳剂、颗粒剂或栓剂形式的单位剂型。在这种形式中,药物组合物可以细分为含有适量化合物的单位剂量。单位剂型可以是包装的组合物,例如包装的粉末、小瓶、安瓿、预装注射器或含有液体的小袋。替代地,单位剂型可以是胶囊剂或片剂本身,或者它可以是包装形式的适当数量的任何此类组合物。这种单位剂型可含有约1mg/kg化合物至约500mg/kg化合物,并且可以单一剂量或者两个或更多个剂量给药。这些剂量可以任何可用于将化合物引导至接受者血流的方式施用,包括口服、经由植入物、非肠道(包括静脉内、腹膜内和皮下注射)、直肠、阴道和透皮。

[3862] 当用于治疗或抑制特定疾病状态或病症时,应当理解,有效剂量可根据所用具体化合物、施用方式和所治疗病症的严重程度以及与被治疗的个人有关的各种物理因素而变化。在治疗性应用中,本教导内容的化合物可以足以治愈或至少部分地改善疾病的症状或其并发症的量施用于已患有该疾病的患者。用于治疗特定个体的剂量通常必须由主治医师主观确定。涉及的变量包括患者的特定病症及其状态以及体型、年龄和反应模式。

[3863] 在一些情况下,期望使用诸如但不限于计量剂量吸入器、呼吸操作吸入器、多剂量干粉吸入器、泵、挤压致动雾化喷雾分配器、气溶胶分配器和气溶胶喷雾器的装置将化合物直接施用于患者的气道。对于通过鼻内或支气管内吸入施用,本教导内容的化合物可以配制成液体组合物、固体组合物或气溶胶组合物。举例来说,液体组合物可包含溶解、部分溶解或悬浮于一种或多种可药用溶剂中的一种或多种本教导内容的化合物,并且可通过例如泵或挤压致动雾化喷雾分配器施用。所述溶剂可以是例如等渗盐水或抑菌水。举例来说,固体组合物可以是包含与乳糖或其他可用于支气管内使用的惰性粉末相互混合的一种或多种本教导内容的化合物的粉末制剂,并且可通过例如气雾剂分配器或能够破坏或刺穿包裹固体组合物的胶囊并递送固体组合物以便吸入的装置施用。举例来说,气溶胶组合物可包含一种或多种本教导内容的化合物、推进剂、表面活性剂和共溶剂,并且可通过例如计量装置施用。推进剂可以是氯氟烃(CFC)、氢氟烷烃(HFA)或其他生理和环境可接受的推进剂。

[3864] 本文所述的化合物可以非肠道或腹膜内施用。这些化合物或其可药用盐、水合物或酯的溶液剂或悬浮剂可以在适当地与表面活性剂如羟丙基纤维素混合的水中制备。也可以在甘油、液体聚乙二醇及其于油中的混合物中制备分散剂。在通常的储存和使用条件下,这些制剂通常含有防腐剂以抑制微生物的生长。

[3865] 适于注射的药物形式可包括无菌水溶液或分散体和用于临时制备无菌可注射溶液或分散体的无菌粉末。在一些实施方案中,所述形式可以是无菌的并且其粘度允许其流过注射器。该形式优选地在制造和储存条件下是稳定的,并且可防止微生物诸如细菌和真菌的污染作用。载体可以是含有例如水、乙醇、多元醇(例如甘油、丙二醇和液体聚乙二醇)、

它们的合适混合物和植物油的溶剂或分散介质。

[3866] 本文所述的化合物可透皮施用,即通过身体表面和身体通道的内衬(包括上皮和粘膜组织)施用。这种施用可以使用本教导内容的化合物(包括其可药用盐、水合物或酯)在洗剂、乳膏、泡沫、贴剂、悬浮剂、溶液剂和栓剂(直肠和阴道)中进行。

[3867] 透皮施用可通过使用含有化合物(例如本文所公开的化合物)以及对于化合物可为惰性、对于皮肤可为无毒的载体的透皮贴剂来完成,并且可允许递送化合物以经由皮肤全身吸收到血流中。载体可采用任何数量的形式,例如乳膏和软膏、糊剂、凝胶和闭塞装置。乳膏和软膏可以是水包油型或油包水型的粘性液体或半固体乳液。由分散在石油中的吸收性粉末或含有该化合物的亲水性石油组成的糊剂也可能是合适的。可使用各种闭塞装置将化合物释放到血流中,例如覆盖含有具有或不具有载体的化合物的储库的半透膜,或含有该化合物的基质。其他闭塞装置是文献中已知的。

[3868] 本文所述的化合物可以常规栓剂的形式直肠或阴道施用。栓剂制剂可以由传统材料(包括添加或不添加蜡以改变栓剂的熔点的可可脂)和甘油制成。还可以使用水溶性栓剂基质,例如各种分子量的聚乙二醇。

[3869] 脂质制剂或纳米胶囊可用于在体外或体内将本教导内容的化合物引入宿主细胞中。脂质制剂和纳米胶囊可通过本领域已知的方法制备。

[3870] 为了增加本教导内容的化合物的有效性,期望将化合物与能够有效治疗目标疾病的其他试剂组合。例如,能够有效治疗目标疾病的其他活性化合物(即,其他活性成分或试剂)可与本教导内容的化合物一起施用。其他试剂可以与本文所公开的化合物同时或不同时施用。

[3871] 本教导内容的化合物可用于治疗或抑制哺乳动物(例如,人受试者)的病理状况或病症。因此,本教导内容提供了通过向哺乳动物提供本教导内容的化合物(包括其可药用盐)或包含与可药用载体组合或联合的一种或多种本教导内容的化合物的药物组合物来治疗或抑制病理状况或病症的方法。本发明的化合物可以单独施用或与其他治疗有效的化合物或用于治疗或抑制病理状况或病症的疗法组合施用。

[3872] 根据本发明的组合物的非限制性实例包括约0.001mg至约1000mg的一种或多种根据本发明的化合物以及一种或多种赋形剂;约0.01mg至约100mg的一种或多种根据本发明的化合物以及一种或多种赋形剂;以及约0.1mg至约10mg的一种或多种根据本发明的化合物以及一种或多种赋形剂。

[3873] 实施例3:一般生化方法

[3874] 以下方法可用于评估和选择化合物作为5-羟色胺受体7活性调节剂。

[3875] 血清素5HT7受体的放射性标记结合研究,方法1:

[3876] 根据其溶解度,将待测试的本公开化合物的溶液制备为测定缓冲液或DMSO中的1mg/ml储液。还制备了参考化合物氯丙嗪的类似储液作为阳性对照。通过连续稀释在测定缓冲液中制备本公开的化合物和氯丙嗪的十一个稀释液(5x测定浓度),得到在10pM至10μM范围内的最终对应测定浓度。

[3877] 在50mM Tris-HCl、10mM $MgCl_2$、1mM EDTA(pH 7.4,测定缓冲液)中制备储液浓度的5nM[^{3}H]LSD(麦角酸二乙酰胺)。将等分试样(50μl)的放射性配体分配到96孔板的装有100μl测定缓冲液的孔中。一式两份加入50μl等份试样的本公开测试的化合物和氯丙嗪阳

性对照参考化合物系列稀释液。

[3878] 将表达重组5HT$_7$受体的细胞的膜级分(50μL)分配到每个孔中。通过收集经PBS冲洗的单层细胞,在冷冻的低渗50mM Tris-HCl(pH 7.4)中重新悬浮和裂解,在20,000x g下离心,倾析上清液并储存于-80℃下,由在10cm平板上培养的表达5HT$_7$受体的稳定转染的细胞系制备膜;将膜制剂重新悬浮于3ml冷冻测定缓冲液中,并在用于测定之前通过26号针进行数次传代来均质化。

[3879] 将250μl反应物在室温下孵育1.5小时,然后使用96孔Filtermate收集器通过快速过滤收集到0.3%经聚乙烯亚胺处理的96孔过滤垫上进行收集。用冷冻测定缓冲液进行四次快速500μl洗涤以减少非特异性结合。将过滤垫干燥,然后将闪烁剂加入过滤器中,并在Microbeta闪烁计数器中对保留在过滤器上的放射性进行计数。

[3880] 将表示总放射性配体结合(即,特异性和非特异性结合)的原始数据(dpm)作为竞争剂(即,测试或参考化合物)的摩尔浓度的对数的函数作图。使用描述与放射性配体标记的位点的配体竞争结合的内置三参数逻辑模型,在Prism 4.0(GraphPad软件)中进行归一化(即,与不存在测试或参考化合物时所观察相比的放射性配体结合百分比)原始数据的非线性回归:

[3881] y=底部+[(顶部-底部)/(1+10x-logIC$_{50}$)]

[3882] 其中底部等于在10μM参考化合物的存在下测量的残余放射性配体结合(即,非特异性结合),并且顶部等于在不存在竞争剂时观察到的总放射性配体结合。因此,根据数据估计log IC$_{50}$(即,使放射性配体结合减少50%的配体浓度的对数),并将其用于通过应用Cheng-Prusoff近似来获得Ki:

[3883] Ki=IC$_{50}$/(1+[配体]/KD)

[3884] 其中[配体]等于测定放射性配体浓度,并且KD等于放射性配体对靶受体的亲和常数。

[3885] 使用针对血清素5HT$_7$受体的放射性标记结合研究所述的相同方法,以10μM的单一浓度筛选本公开的化合物,以确定[^{3}H]LSD结合的抑制百分比。

[3886] 血清素5-HT7受体的放射性标记结合研究,方法2:

[3887] 根据其溶解度,将待测试的本公开化合物的溶液制备为测定缓冲液或DMSO中的1mg/ml储液。还制备了参考化合物氯丙嗪的类似储液作为阳性对照。通过连续稀释在测定缓冲液中制备本公开的化合物和氯丙嗪的十一个稀释液(5x测定浓度),得到在10pM至10μM范围内的最终对应测定浓度。

[3888] 在50mM Tris-HCl、10mM MgCl$_2$、1mM EDTA(pH 7.4,测定缓冲液)中制备储液浓度的5nM[^{3}H]-5-羟色胺([^{3}H]-5HT)。将等分试样(50μl)的放射性配体分配到96孔板的装有100μl测定缓冲液的孔中。一式两份加入50μl等份试样的本公开测试的化合物和氯丙嗪阳性对照参考化合物系列稀释液。

[3889] 将表达重组5HT$_7$受体的细胞的膜级分(50μL)分配到每个孔中。通过收集经PBS冲洗的单层细胞,在冷冻的低渗50mM Tris-HCl(pH 7.4)中重新悬浮和裂解,在20,000x g下离心,倾析上清液并储存于-80℃下,由在10cm平板上培养的表达5HT$_7$受体的稳定转染的细胞系制备膜;将膜制剂重新悬浮于3ml冷冻测定缓冲液中,并在用于测定之前通过26号针进行数次传代来均质化。

[3890] 将250μl反应物在室温下孵育1.5小时,然后使用96孔Filtermate收集器通过快速过滤收集到0.3%经聚乙烯亚胺处理的96孔过滤垫上进行收集。用冷冻测定缓冲液进行四次快速500μl洗涤以减少非特异性结合。将过滤垫干燥,然后将闪烁剂加入过滤器中,并在Microbeta闪烁计数器中对保留在过滤器上的放射性进行计数。

[3891] 将表示总放射性配体结合(即,特异性和非特异性结合)的原始数据(dpm)作为竞争剂(即,测试或参考化合物)的摩尔浓度的对数的函数作图。使用描述与放射性配体标记的位点的配体竞争结合的内置三参数逻辑模型,在Prism 4.0(GraphPad软件)中进行归一化(即,与不存在测试或参考化合物时所观察相比的放射性配体结合百分比)原始数据的非线性回归:

[3892] $y=底部+[(顶部-底部)/(1+10^{x-\log IC_{50}})]$

[3893] 其中底部等于在10μM参考化合物的存在下测量的残余放射性配体结合(即,非特异性结合),并且顶部等于在不存在竞争剂时观察到的总放射性配体结合。因此,根据数据估计log IC_{50}(即,使放射性配体结合减少50%的配体浓度的对数),并将其用于通过应用Cheng-Prusoff近似来获得Ki:

[3894] $Ki=IC_{50}/(1+[配体]/KD)$

[3895] 其中[配体]等于测定放射性配体浓度,并且KD等于放射性配体对靶受体的亲和常数。

[3896] 使用针对血清素$5HT_7$受体的放射性标记结合研究所述的相同方法,以10μM的单一浓度筛选本公开的化合物,以确定[^3H]-5HT结合的抑制百分比。

[3897] 功能性血清素$5HT_7$测定,方法1:

[3898] 在含有5%透析血清的Dulbecco's改良Eagle培养基(DMEM)中,在测定前48小时,将稳定表达人$5HT_7$受体的细胞系接种到96孔聚-L-赖氨酸包被的平板中(每孔40,000个细胞)。在测定前二十小时,将培养基更换为无血清DMEM。在测定当天,洗涤DMEM并替换为30μl测定缓冲液(1X Krebs-Ringer碳酸氢盐葡萄糖缓冲液,0.75mM IBMX,pH 7.4)。在37摄氏度的加湿培养箱中进行10分钟的预孵育。然后,通过添加30μl的2X稀释的本公开化合物或氯丙嗪(最终浓度范围为0.1nM至10μM,每个浓度一式三份测定)来刺激细胞。阳性对照(100μM毛喉素)也包括在内。使cAMP的积聚持续15min,之后去除缓冲液并用细胞裂解缓冲液(CatchPoint cAMP Assay Kit,Molecular Devices)裂解细胞。接着,将裂解物转移到涂覆有山羊抗兔IgG的96孔玻璃底板上,并用兔抗cAMP(Molecular Devices)吸附。孵育5分钟后,加入辣根过氧化物酶-cAMP缀合物(Molecular Devices),在室温下进行2小时孵育。然后,在用洗涤缓冲液(Molecular Devices)洗涤三次后,加入在含有新加入的1mM H_2O_2的底物缓冲液(Molecular Devices)中重构的Stoplight Red底物(Molecular Devices),并且在室温下孵育15分钟后测量荧光(激发510-545nm,发射565-625nm)。对于每次测定,生成cAMP校准曲线,并且不含裂解物和抗体的对照包括在内。

[3899] 对于激动剂测试,将每种浓度的本公开化合物或氯丙嗪的原始数据(最大荧光、荧光单位)归一化为基础(载体刺激的)荧光(报告为与基础相比的倍数增加)并作为药物(即,测试或参考化合物)摩尔浓度的对数的函数作图。归一化数据的非线性回归在Prism 4.0(GraphPad软件)中使用描述一种受体群体激动剂刺激激活的内置三参数逻辑模型(即,S形浓度-响应)进行:

[3900] y＝底部+[(顶部-底部)/(1+10x-logEC50)]

[3901] 其中底部等于最佳拟合基础荧光,并且顶部等于由本公开化合物或氯丙嗪刺激的最佳拟合最大荧光。因此,从数据估计log EC_{50}(即,使本发明化合物或氯丙嗪所观察到的最大荧光的荧光增加50％的药物浓度的对数),并获得EC_{50}(激动剂效力)。为了获得测试化合物的相对功效的估计值(Rel.Emax),将其最佳拟合顶部与氯丙嗪进行比较并表示为与氯丙嗪的比率(参考激动剂的Rel.Emax为1.00)。

[3902] 为了确定本公开的化合物是否是拮抗剂,使用了双加成范例。首先,加入30μl本公开化合物(20μM)(10μM终浓度)并进行15分钟孵育。然后,加入30μl氯丙嗪(3X;EC_{90})(激动剂的最终浓度为EC30)并使cAMP积聚进行15分钟。然后如上所述处理样品以进行cAMP测量。将氯丙嗪诱导的cAMP积聚的测量值与添加载体而不是测试化合物后由氯丙嗪引发的信号进行比较,并表示为比率。然后通过改进的Schild分析来表征“命中”(拮抗氯丙嗪的化合物,刺激基线归一化荧光增加至少50％)。

[3903] 对于改进的Schild分析,在不存在和存在分级浓度的测试化合物的情况下生成一系列氯丙嗪浓度-响应等温线(在参考激动剂之前15分钟添加)。理论上,作为竞争性拮抗剂的化合物引起激动剂浓度-响应等温线的右旋移位,而不降低对激动剂的最大响应(即,可克服的拮抗作用)。然而,有时,诸如非竞争性拮抗、半平衡和/或受体储备等因素会导致明显不可克服的拮抗作用。为了解释这种偏差,我们应用改进的Lew-Angus方法来确定拮抗剂效力(Christopoulos等人,1999)。简而言之,将等效激动剂浓度(引起响应的激动剂浓度等于激动剂对照曲线的$EC_{25\%}$)作为测量它们的孔中存在的本公开化合物浓度的函数作图。使用以下等式在Prism 4.0中执行基线归一化数据的非线性回归:

[3904] pEC25％＝-log([B]+10-pK)-log c

[3905] 其中EC25％等于引起的响应等于最大激动剂对照曲线响应的25％的激动剂浓度,并且[B]等于拮抗剂浓度;K、c和s为拟合参数。参数s等于Schild斜率因子。如果s与一相差不大,则pK等于pKB;否则,计算pA2(pA2＝pK/s)。参数c等于$EC_{25\%}$/[B]的比率。

[3906] 5-HT_7受体的功效测定,方法2:

[3907] 在基于细胞的cAMP酶片段互补测定中,使用HitHunter cAMP测定(DiscoveRx)测量本公开化合物对5-HT_7血清素受体的功效。在生长培养基(Ultraculture培养基,2mM GlutaMax和G418 1mg/mL)中测定之前16-20小时,将稳定表达人5HT_7受体的细胞以4000个细胞/孔接种在96孔板中。制备激动剂5-甲酰胺基色胺(5-CT)的系列稀释液,终浓度范围为10μM至10nM。以3倍连续稀释制备本公开的化合物,以获得10μM至0.1nM的最终浓度范围。在5-CT的存在下测试本公开化合物在不存在5-CT时的激动剂活性和拮抗剂活性。对于cAMP测定,根据供应商提供的说明书遵循方案进行操作。简而言之,在加入EC_{70}浓度的5-CT之前,将细胞与本公开的化合物在37℃下一起孵育30分钟。再过30分钟后,加入cAMP抗体/细胞裂解液(20μL/孔)并在室温下孵育60分钟。加入cAMP XS+EA试剂(20μL/孔)并在室温下孵育2小时。在Envision Multilabel读板器上读取发光值。

[3908] 本文所引用的每一篇专利、专利申请和公布中的公开内容据此全文以引用方式并入本文。

[3909] 虽然本发明已参考具体实施方案进行了公开,但显而易见的是,在不脱离本发明的真实实质和范围的情况下,本领域的其他技术人员可以设计出本发明的其他实施方案和

变型。所附权利要求旨在理解为包括所有此类实施方案和等同变型。

[3910] 实施例4:生化实验

[3911] 方法:

[3912] ^{1}放射性标记结合(IC_{50}和K_I)

[3913] 根据其溶解度,将待测试的本公开化合物的溶液制备为测定缓冲液或DMSO中的1mg/ml储液。还制备了参考化合物氯丙嗪的类似储液作为阳性对照。通过连续稀释在测定缓冲液中制备本公开的化合物和氯丙嗪的十一个稀释液(5x测定浓度),得到在10pM至10μM范围内的最终对应测定浓度。

[3914] 在50mM Tris-HCl、10mM $MgCl_2$、1mM EDTA(pH 7.4,测定缓冲液)中制备储液浓度的5nM[^{3}H]LSD(麦角酸二乙酰胺)。将等分试样(50μl)的放射性配体分配到96孔板的装有100μl测定缓冲液的孔中。一式两份加入50μl等份试样的本公开测试的化合物和氯丙嗪阳性对照参考化合物系列稀释液。

[3915] 将表达重组$5HT_7$受体的细胞的膜级分(50μL)分配到每个孔中。通过收集经PBS冲洗的单层细胞,在冷冻的低渗50mM Tris-HCl(pH 7.4)中重新悬浮和裂解,在20,000x g下离心,倾析上清液并储存于-80℃下,由在10cm平板上培养的表达$5HT_7$受体的稳定转染的细胞系制备膜;将膜制剂重新悬浮于3ml冷冻测定缓冲液中,并在用于测定之前通过26号针进行数次传代来均质化。

[3916] 将250μl反应物在室温下孵育1.5小时,然后使用96孔Filtermate收集器通过快速过滤收集到0.3%经聚乙烯亚胺处理的96孔过滤垫上进行收集。用冷冻测定缓冲液进行四次快速500μl洗涤以减少非特异性结合。将过滤垫干燥,然后将闪烁剂加入过滤器中,并在Microbeta闪烁计数器中对保留在过滤器上的放射性进行计数。

[3917] 将表示总放射性配体结合(即,特异性和非特异性结合)的原始数据(dpm)作为竞争剂(即,测试或参考化合物)的摩尔浓度的对数的函数作图。使用描述与放射性配体标记的位点的配体竞争结合的内置三参数逻辑模型,在Prism 4.0(GraphPad软件)中进行归一化(即,与不存在测试或参考化合物时所观察相比的放射性配体结合百分比)原始数据的非线性回归:

[3918] $y=底部+[(顶部-底部)/(1+10^{x-\log IC_{50}})]$

[3919] 其中底部等于在10μM参考化合物的存在下测量的残余放射性配体结合(即,非特异性结合),并且顶部等于在不存在竞争剂时观察到的总放射性配体结合。因此,根据数据估计log IC_{50}(即,使放射性配体结合减少50%的配体浓度的对数),并将其用于通过应用Cheng-Prusoff近似来获得Ki:

[3920] $Ki=IC_{50}/(1+[配体]/KD)$

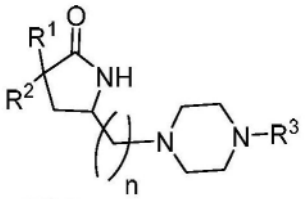
[3921] 其中[配体]等于测定放射性配体浓度,并且KD等于放射性配体对靶受体的亲和常数。

[3922] 功能数据(K_b)

[3923] 在基于细胞的cAMP酶片段互补测定中,使用HitHunter cAMP测定(DiscoveRx)测量本公开化合物对5-HT_7血清素受体的功效。在生长培养基(Ultraculture培养基,2mM GlutaMax和G418 1mg/mL)中测定之前16-20小时,将稳定表达人$5HT_7$受体的细胞以4000个细胞/孔接种在96孔板中。制备激动剂5-羟基色胺(5-HT)的系列稀释液,终浓度范围为10μM

至10nM。以3倍连续稀释制备本公开的化合物,以获得10μM至0.1nM的最终浓度范围。在5-HT的存在下测试本公开化合物在不存在5-HT时的激动剂活性和拮抗剂活性。对于cAMP测定,根据供应商提供的说明书遵循方案进行操作。简而言之,在加入EC_{70}浓度的5-HT之前,将细胞与本公开的化合物在37℃下一起孵育30分钟。再过30分钟后,加入cAMP抗体/细胞裂解液(20μL/孔)并在室温下孵育60分钟。加入cAMP XS+EA试剂(20μL/孔)并在室温下孵育2小时。在Envision Multilabel读板器上读取发光值。

[3924] 结果

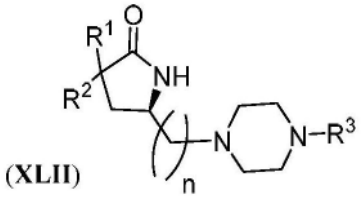
[3925] 

(XLI)

[3926] 表34:

[3927]

n	R^1	R^2	R^3	IC_{50} (nM)[1]	K_i (nM)[1]	K_b (nM)[2]	TPSA
2	乙基	乙基	4-F-苯基		8.5	8.98	35.6
2	乙基	乙基	4-Cl-苯基		13	54.6	35.6
2	乙基	乙基	2-iPr-苯基		23	163	35.6
2	乙基	乙基	2-吗啉代-苯基		24	32.3	48.1
2	乙基	乙基	4-Me-苯基		28	24.1	35.6
2	乙基	乙基	4-OH-苯基		34	50	55.8
2	乙基	乙基	苯基		68	17.8	35.6
2	乙基	乙基	4-甲基-2-吗啉代-苯基		74	59.3	48.1

[3928] 

(XLII)

[3929] 表35:

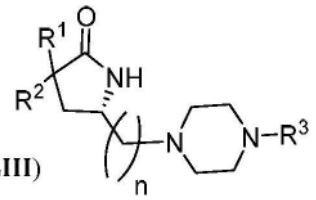
[3930]

n	R^1	R^2	R^3	IC_{50} (nM)[1]	K_i (nM)[1]	K_b (nM)[2]	TPSA
1	乙基	乙基	2-iPr-苯基		121		35.6

[3931]

1	乙基	乙基	4-甲基-2-吗啉代-苯基		132	43.8	48.1
1	乙基	乙基	4-F-苯基		243		35.6
1	乙基	乙基	4-Me-苯基		249		35.6
1	乙基	乙基	2-吡啶基		669		48.5
1	乙基	乙基	苯基		819		35.6
1	乙基	乙基	3-Cl-苯基		1087		35.6
2	乙基	乙基	4-Me-苯基		11	8.43	35.6
2	乙基	乙基	4-F-苯基	12.34		0.81	35.6
2	乙基	乙基	3,4-二-Cl-苯基	82.8		6.19	35.6
2	乙基	乙基	4-F-3-Cl-苯基	8.7		1.92	35.6
2	乙基	乙基	3-Cl-苯基	9.9		1.38	35.6
2	乙基	乙基	苯基			6.59	35.6
2	乙基	乙基	2-Cl-苯基			109	35.6
2	乙基	乙基	3-F-苯基			9.89	35.6
2	乙基	乙基	2-Me-苯基			127	35.6
2	乙基	乙基	3-Me-苯基			1.65	35.6
2	乙基	乙基	2-吡啶基			4.91	48.5
2	乙基	乙基	2-OMe-苯基			230	44.8
2	乙基	乙基	4-CN-苯基			544	59.4
2	乙基	乙基	4-CF_3-苯基			137	35.6

[3932]



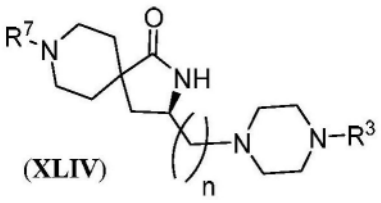
(XLIII)

[3933] 表36：

[3934]

n	R^1	R^2	R^3	IC_{50} (nM)[1]	K_i (nM)[1]	K_b (nM)[2]	TPSA
2	乙基	乙基	4-Me-苯基		79	58.1	35.6
2	$-CH_2CH=CHCH_2-$		4-F-苯基			46.2	35.6
2	$-CH_2CH=CHCH_2-$		3-Cl-苯基			36.3	35.6
2	$-CH_2CH_2CH_2CH_2-$		4-F-苯基			52.6	35.6
2	$-CH_2CH_2CH_2CH_2-$		3-Cl-苯基			48.4	35.6

[3935]



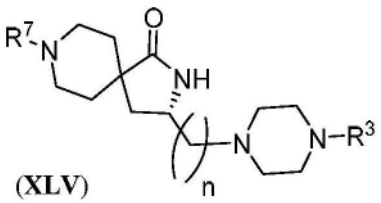
(XLIV)

[3936] 表37：

[3937]

n	R^3	R^7	IC_{50} (nM)[1]	K_i (nM)[1]	K_b (nM)[2]	TPSA
2	3-Cl-苯基	乙酰基		63	5.04	55.9
2	4-F-苯基	乙酰基		76	14.4	55.9
2	4-F-苯基	$MeSO_2$		89	30.7	81.3
2	3-Cl-苯基	$MeSO_2$		107	13.5	81.3
3	3-Cl-苯基	$MeSO_2$			321	81.3
3	4-F-苯基	$MeSO_2$			526	81.3

[3938]



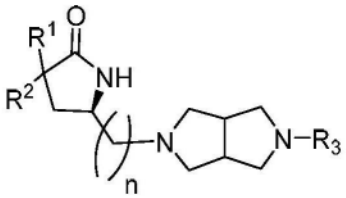
(XLV)

[3939] 表38：

[3940]

n	R^3	R^7	IC_{50} (nM)[1]	K_i (nM)[1]	K_b (nM)[2]	TPSA
2	3-Cl-苯基	$MeSO_2$		117		81.3
2	4-F-苯基	$MeSO_2$		167	74.2	81.3
2	3-Cl-苯基	乙酰基		214		55.9
2	4-F-苯基	乙酰基		325		55.9

[3941]



(XLVI)

[3942] 表39：

[3943]

n	R^1	R^2	R^3	IC_{50} (nM)[1]	K_i (nM)[1]	K_b (nM)[2]	TPSA
2	乙基	乙基	苯基			144	35.6

[3944] 根据前面的描述，本领域的技术人员可以容易地确定本发明的基本特征而不脱离本发明的实质和范围，可以做出本发明的各种变化和修改，使其适合各种使用和状况。

[3945] 在本申请中引用的美国或外国的所有参考文献、专利或申请均以引用方式并入本文，如同其全文在本文中所写的一样。在出现任何不一致之处，以本文字面公开的材料为准。