

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第5657566号  
(P5657566)

(45) 発行日 平成27年1月21日(2015. 1. 21)

(24) 登録日 平成26年12月5日(2014. 12. 5)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 233/61 (2006. 01)

C O 7 D 233/61 1 O 3

A 6 1 K 31/5377 (2006. 01)

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/4164 (2006. 01)

A 6 1 K 31/4164

A 6 1 K 31/4184 (2006. 01)

A 6 1 K 31/4184

C O 7 D 401/04 (2006. 01)

C O 7 D 401/04 C S P

請求項の数 23 (全 290 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2011-543458 (P2011-543458)  
 (86) (22) 出願日 平成21年12月23日(2009. 12. 23)  
 (65) 公表番号 特表2012-513990 (P2012-513990A)  
 (43) 公表日 平成24年6月21日(2012. 6. 21)  
 (86) 国際出願番号 PCT/PT2009/000080  
 (87) 国際公開番号 W02010/074588  
 (87) 国際公開日 平成22年7月1日(2010. 7. 1)  
 審査請求日 平成24年12月25日(2012. 12. 25)  
 (31) 優先権主張番号 61/140, 640  
 (32) 優先日 平成20年12月24日(2008. 12. 24)  
 (33) 優先権主張国 米国 (US)  
 (31) 優先権主張番号 61/159, 281  
 (32) 優先日 平成21年3月11日(2009. 3. 11)  
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(73) 特許権者 511154467  
 バイアル ポルテラ アンド シーエイ  
 エス エイ  
 B I A L - P o r t e l a & C a ,  
 S . A .  
 ポルトガル国 4 5 4 7 - 4 5 7 サン  
 マメデ ド コロナド アヴェニダ ダ  
 シデルジア ナシオナル  
 (74) 代理人 100147485  
 弁理士 杉村 憲司  
 (74) 代理人 100119530  
 弁理士 富田 和幸  
 (74) 代理人 100136858  
 弁理士 池田 浩

最終頁に続く

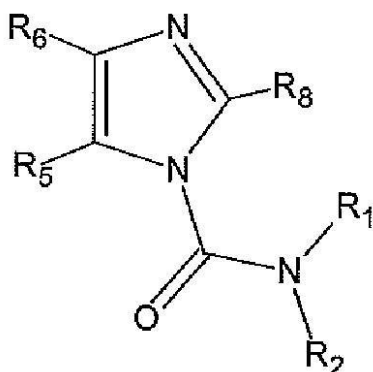
(54) 【発明の名称】 医薬品

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下式：

【化 1】



[ 式中、R1は、C<sub>1-4</sub>アルキルであり、R2は、H、C<sub>1-20</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリー  
 ル、ヘテロアリール、一部若しくは完全飽和ヘテロシクリル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、ア  
 リールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-1</sub>  
 0シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル、R1a、ハロゲン、OH、OR1a、OCOR1a、SH、SR1a、SCOR1a、  
 NH<sub>2</sub>、NHR1a、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R1a、NR1aCOR1b、NHCOR1a、NR1aR1b、COR1a、CSR1a、CN、C  
 OOH、COOR1a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR1a、CONHOR1a、SO<sub>2</sub>R1a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR1aR1bお

よびSO<sub>2</sub>NR1aR1bから選択することができ、式中のR1aおよびR1bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくはR1aおよびR1bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

ここでR2がC<sub>1-20</sub>アルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1-6</sub>ジアルキルアミノ、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、OR1c、OCOR1c、SH、SR1c、SCOR1c、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR1c、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R1c、NR1cCOR1d、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NHCOR1c、NR1cR1d、COR1c、CSR1c、CN、COOH、COOR1c、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR1c、CONHOR1c、C(NOH)NH<sub>2</sub>、CONR1cR1d、SO<sub>2</sub>R1c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR1cR1dから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR1cおよびR1dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR1cおよびR1dと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

ここでR2の置換基がC<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1-6</sub>ジアルキルアミノ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基である場合、これら部分のそれぞれをR1e、ハロゲン、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、OR1e、OCOR1e、SH、SR1e、SCOR1e、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR1e、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R1e、NR1eCOR1f、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NHCOR1e、NR1eR1f、COR1e、CSR1e、CN、COOH、COOR1e、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR1e、CONHOR1e、C(NOH)NH<sub>2</sub>、CONR1eR1f、SO<sub>2</sub>R1e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR1eR1fから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR1eおよびR1fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくはR1eおよびR1fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

ただしR1およびR2がメチルであることはなく、

または、

R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともにヘテロアリール若しくはヘテロシクリル基を形成することができ、そのそれぞれが1つ以上の酸素原子、若しくはアリール、ヘテロアリール、一部若しくは完全飽和ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R2a、ハロゲン、OH、OR2a、OCOR2a、SH、SR2a、SCOR2a、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR2a、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R2a、NR2aCOR2b、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NHCOR2a、NR2aR2b、COR2a、CSR2a、CN、COOH、COOR2a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR2a、CONHOR2a、C(NOH)NH<sub>2</sub>、CONR2aR2b、SO<sub>2</sub>R2a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR2aR2bから選択した1つ以上の基で任意に置換されてもよく、式中のR2aおよびR2bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくはR2aおよびR2bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

ここでR1およびR2と一緒に形成するヘテロアリール若しくはヘテロシクリルの置換基がアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>

10

20

30

40

50

シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキルオキシ、アリール $C_{1-4}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-4}$ アルコキシ、 $R2c$ 、 $OR2c$ 、 $OCOR2c$ 、 $SH$ 、 $SR2c$ 、 $SCOR2c$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR2c$ 、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R2c$ 、 $NR2cCOR2d$ 、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NHCOR2c$ 、 $NR2cR2d$ 、 $COR2c$ 、 $CSR2c$ 、 $CN$ 、 $COOH$ 、 $COOR2c$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHOH$ 、 $CONHR2c$ 、 $CONHOR2c$ 、 $C(NO_2)NH_2$ 、 $CONR2cR2d$ 、 $SO_2R2c$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ および $SO_2NR2cR2d$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中の $R2c$ および $R2d$ は独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくは $R2c$ および $R2d$ と一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

10

ここで $R1$ および $R2$ が一緒に形成するヘテロアリール若しくはヘテロシクリルの置換基の置換基が $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキルオキシ、アリール $C_{1-4}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-4}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-4}$ アルコキシ、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれを $C_{1-4}$ アルコキシ、 $R2e$ 、ハロゲン、 $OH$ 、 $OR2e$ 、 $OCOR2e$ 、 $SH$ 、 $SR2e$ 、 $SCOR2e$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR2e$ 、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R2e$ 、 $NR2eCOR2f$ 、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NR2eR2f$ 、 $NHCOR2e$ 、 $COR2e$ 、 $CSR2e$ 、 $CN$ 、 $COOH$ 、 $COOR2e$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHOH$ 、 $CONHR2e$ 、 $CONHOR2e$ 、 $C(NO_2)NH_2$ 、 $CONR2eR2f$ 、 $SO_2R2e$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ および $SO_2NR2eR2f$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中の $R2e$ および $R2f$ は独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくは $R2e$ および $R2f$ と一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

20

$R5$ は $H$ 、 $C_{1-2}$ アルキル、およびハロゲンから選択され、

$R6$ はアリールおよびヘテロアリールから選択され、

ここで $R6$ がヘテロアリールであるとき、この部分を1つ以上の酸素原子で任意に置換してもよく、また $R6$ がアリールまたはヘテロアリールであるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、 $R6c$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、アリール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルコキシ、 $OH$ 、 $OR6c$ 、 $OCOR6c$ 、 $SH$ 、 $SR6c$ 、 $SCOR6c$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR6c$ 、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R6c$ 、 $NR6cCOR6d$ 、 $NHCOR6c$ 、 $NR6cR6d$ 、 $COR6c$ 、 $CSR6c$ 、 $CN$ 、 $COOH$ 、 $COOR6c$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHR6c$ 、 $CONHOR6c$ 、 $CONHOH$ 、 $C(NO_2)NH_2$ 、 $CONR6cR6d$ 、 $SO_2R6c$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ および $SO_2NR6cR6d$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中の $R6c$ および $R6d$ は独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、または $R6c$ および $R6d$ と一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

30

40

ここで $R6$ の置換基がヘテロアリールまたはヘテロシクリルであるとき、これら部分のそれぞれを1つ以上の酸素原子で任意に置換してもよく、若しくは $R6$ の置換基が $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、アリール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、 $R6e$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $OH$ 、 $OR6e$ 、 $OCOR6e$ 、 $SH$ 、 $SR6e$ 、 $SCOR6e$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR6e$ 、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R6e$ 、 $NR6eCOR6f$ 、 $NHCOR6e$ 、 $NR6eR6f$ 、 $COR6e$ 、 $CS$

50

R6e、CN、COOH、COOR6e、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR6e、CONHOR6e、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONR6eR6f、SO<sub>2</sub>R6e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR6eR6fから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR6eおよびR6fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR6eおよびR6fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

R8はHであり、

ただし、R1がメチルであるとき、R2は4-クロロブチル、4-アジドブチルまたは4-イソチオシアナトブチルでなく、また

ただし、本化合物が(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)(4-(キノリン-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル)メタノンではない]を有する化合物、またはその薬学的に許容し得る塩若しくはエステル。

【請求項2】

前記R1およびR2が、一緒にこれらを結合するNとともに、任意に置換されてもよいヘテロシクリル基を形成する請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

前記R5が、Hである請求項1または請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

前記R1が、メチルであり；

前記R2が、単環式のC<sub>5-8</sub>シクロアルキルか、または単一の窒素若しくは酸素のヘテロ原子を含有する単環式6員環の飽和ヘテロシクリルから選択され、ここで該ヘテロ原子はヘテロシクリル基R2の尿素窒素への結合位置に対し4位にあり、ここで該ヘテロ原子が窒素原子であるとき、該窒素原子は任意にベンジルで置換され；

前記R5が、Hであり；

前記R6が、フェニルまたはピリジルから選択され、ここで該ピリジル基の窒素原子は酸素原子で置換されてもよく、ここで該フェニルは任意にハロゲン、メトキシ、OH、CONH<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>およびフェニルから選択した1つ以上の基で置換されてもよく；

前記R8が、Hである

請求項1または3に記載の化合物。

【請求項5】

前記R1が、メチルであり；

前記R2が、単環式のC<sub>5-8</sub>シクロアルキル、テトラヒドロピラニル及びピペリジニルから選択され、ここで該テトラヒドロピラニル基及びピペリジニル基におけるヘテロ原子は、ヘテロシクリル基R2の尿素窒素への結合位置に対し4位にあり、ここで該ピペリジニル基の窒素原子はベンジルで置換され；

前記R5が、Hであり；

前記R6が、フェニルまたはピリジルから選択され、ここで該ピリジル基の窒素原子は酸素原子で置換され、ここで該フェニルは任意にハロゲン、メトキシ、CONH<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>及びフェニルから選択した1つ以上の基で置換されてもよく；

前記R8が、Hである

請求項1または3に記載の化合物。

【請求項6】

前記R1がメチルであり、前記R2が単一の窒素のヘテロ原子を含有する単環式の飽和ヘテロシクリルであり、ここで該窒素のヘテロ原子はCONR1cR1dの基で置換される請求項1または3に記載の化合物。

【請求項7】

前記R6が、OHおよびC<sub>1-6</sub>アルキルから選択した1つ以上の基で置換したフェニルである請求項1または3に記載の化合物。

【請求項8】

前記R6が、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>で置換したフェニルである請求項1または3に記載の化合物。

10

20

30

40

50

## 【請求項 9】

前記R1がメチルであり、前記R2が単一の窒素のヘテロ原子を含有する単環式の飽和ヘテロシクリルであり、ここで該窒素のヘテロ原子はアリールおよびSO<sub>2</sub>R1cから選択した基で置換される請求項 1 または 3 に記載の化合物。

## 【請求項 10】

前記R6が、NHR6c、NR6cR6d、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHCOR6cおよびNHSO<sub>2</sub>R6cから選択した基で置換したピリジルである請求項 1 または 3 に記載の化合物。

## 【請求項 11】

前記R6が、ピラジニルまたはピリミジルである請求項 1 または 3 に記載の化合物。

## 【請求項 12】

前記R1cが、C<sub>1-6</sub>アルキルである請求項 1、3 及び 5 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 13】

前記R1cが、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルである請求項 1、3 及び 5 のいずれか一項に記載の化合物。

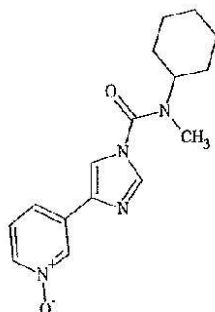
## 【請求項 14】

前記R1がメチルであり、前記R2が置換または非置換とし得るアリールC<sub>1-4</sub>アルキルで置換した単一の窒素のヘテロ原子を含有する単環式6員環の飽和ヘテロシクリルである、請求項 1 または 3 に記載の化合物。

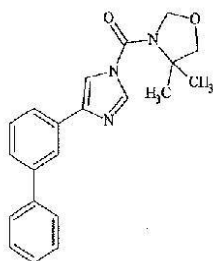
## 【請求項 15】

以下の化合物群：

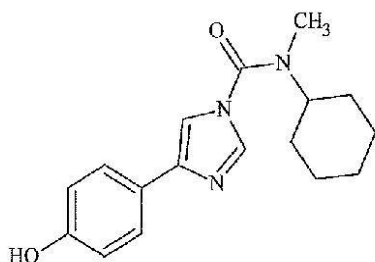
## 【化 2】



## 【化 3】



## 【化 4】



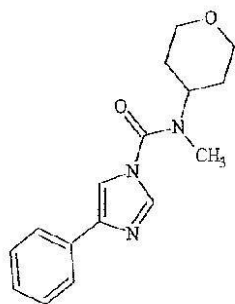
10

20

30

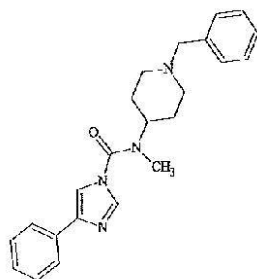
40

## 【化 5】



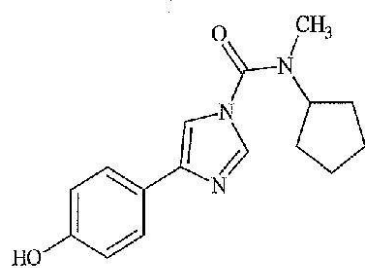
10

## 【化 6】

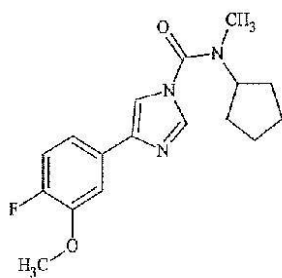


20

## 【化 7】

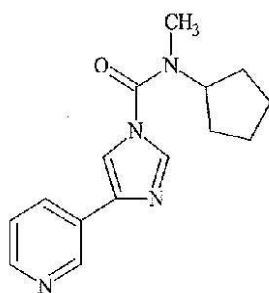


## 【化 8】



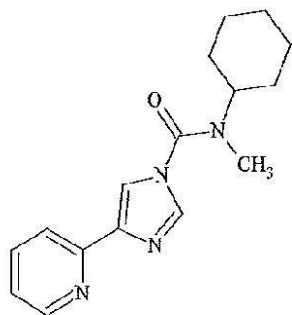
30

## 【化 9】



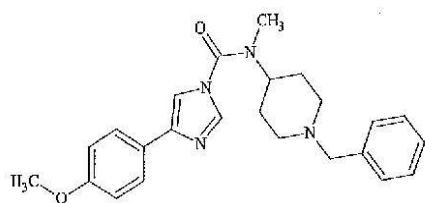
40

## 【化 1 0】

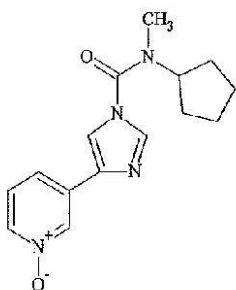


10

## 【化 1 1】

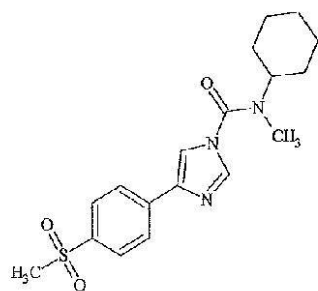


## 【化 1 2】



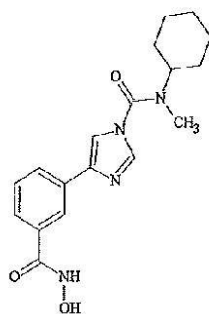
20

## 【化 1 3】



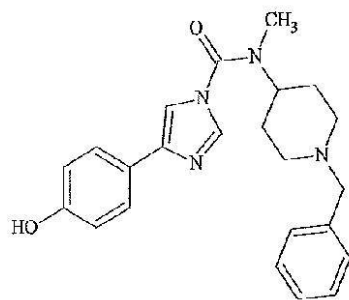
30

## 【化 1 4】



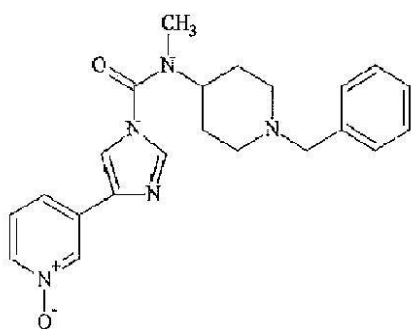
40

## 【化 1 5】



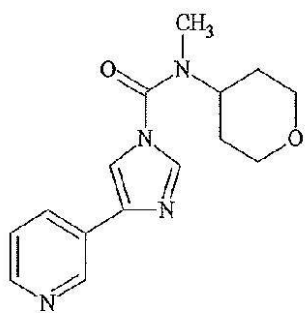
10

## 【化 1 6】



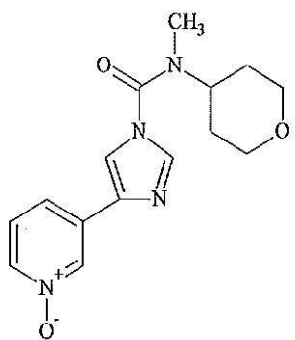
20

## 【化 1 7】



30

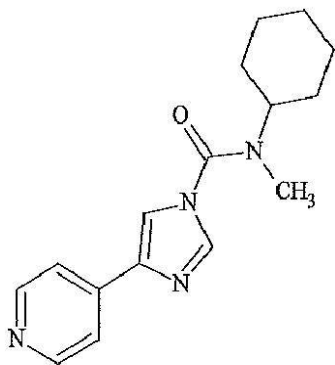
## 【化 1 8】



40

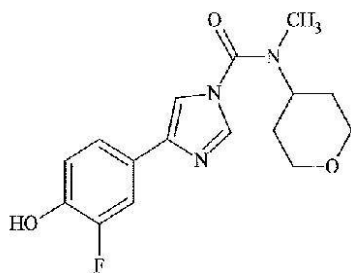


## 【化 19】



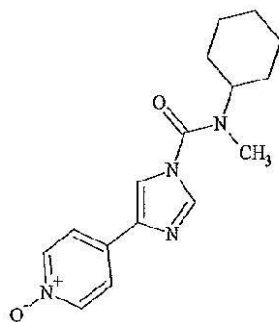
10

## 【化 20】



20

## 【化 21】



30

のうちの 1 つから選択される請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 16】

前記R1が、メチルおよびエチルから選択される請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 17】

前記R2が、それぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルから選択される請求項 16 に記載の化合物。

## 【請求項 18】

請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の化合物を、1 つ以上の薬学的に許容し得る賦形剤とともに備える医薬組成物。

40

## 【請求項 19】

1 つ以上の追加の薬学的に活性な成分をさらに含む請求項 18 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 20】

治療に用いるための請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 21】

発症若しくは兆候がFAAH酵素の基質に関連付けられる疾患の治療若しくは予防のための薬剤の調製における、請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の化合物の使用であって、i) 前記R1がメチルであるとき、R2は4-クロロブチル、4-アジドブチルまたは4-イソチオシ

50

アナトブチルでなく、および i i ) 該化合物が(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)(4-(キノリン-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル)メタノンではない、使用。

【請求項 2 2】

前記疾患が内因性カンナビノイドシステムに関連する疾患である、請求項 2 1 に記載の使用。

【請求項 2 3】

前記疾患が、食欲調節、肥満、代謝異常、悪液質、拒食症、痛み、炎症、神経毒性、神経外傷、発作、多発性硬化症、脊髄損傷、パーキンソン病、レボドパ誘導運動障害、ハンチントン病、ジル・ドゥ・ラ・トゥレット症候、遅発性ジスキネジー、筋失調症、筋萎縮性側索硬化症、アルツハイマー病、てんかん、統合失調症、不安神経症、うつ病、不眠症、吐き気、嘔吐、アルコール障害、薬物中毒、高血圧、循環性ショック、心筋再かん流傷害、アテローム性動脈硬化症、ぜんそく、緑内障、網膜症、がん、炎症性大腸炎、急性慢性肝疾患、関節炎、並びに骨粗しょう症から選択される、請求項 2 2 に記載の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、化合物およびその使用方法に関するものであり、特に、脂肪酸アミドヒドロラーゼ (FAAH) 酵素によって分解される、神経伝達物質であるアナンダミドなどの基質と関連のある疾患の治療または予防に用いる化合物およびその治療上の使用方法に関するものである。

【背景技術】

【0002】

FAAH酵素は、アナンダミド (N-アラキドノイルエタノールアミド)、N-オレオイルエタノールアミン、N-パルミトイルエタノールアミンおよびオレアミドなどの脂肪酸を分解する。アナンダミドは、N-アラキドノイルエタノールアミンまたはAEAの別名でも知られ、動物や人間の組織において、特に脳にて発見される内因性カンナビノイドの神経伝達物質である。また、アナンダミドは、バニロイド受容体に結合することも見出されている。アナンダミドは、脂肪酸アミドヒドロラーゼ (FAAH) 酵素によってエタノールアミンとアラキドン酸へ分解される。従って、FAAHの阻害剤は、アナンダミドのレベルの上昇をもたらす。

【0003】

アナンダミドは、内因性カンナビノイドシステムにおける神経伝達物質であり、カンナビノイド受容体を刺激する。CB1やCB2などのカンナビノイド受容体は、Gタンパク質共役受容体である。CB1は主に中枢神経系において発見されるのに対し、CB2は主に末梢組織において発見される。内因性カンナビノイドシステムは、中枢および末梢神経系における、並びに末梢組織における生理的機能の増加に関連している。内因性カンナビノイドシステムの活動を調節すると、多種多様な病気または病的状態に対する潜在的な治療効果をもたらすことが示されてきた。従って、内因性カンナビノイドシステム、および、特にFAAH酵素が、多くの病気の潜在的治療法を発展させるための治療標的となった。内因性カンナビノイドシステムは、食欲調節、肥満、代謝異常、悪液質、拒食症、痛み、炎症、神経毒性、神経外傷、発作、多発性硬化症、脊髄損傷、パーキンソン病、レボドパ誘導運動障害、ハンチントン病、ジル・ドゥ・ラ・トゥレット症候、遅発性ジスキネジー、筋失調症、筋萎縮性側索硬化症、アルツハイマー病、てんかん、統合失調症、不安神経症、うつ病、不眠症、吐き気、嘔吐、アルコール障害、例えばアヘン剤、ニコチン、コカイン、アルコールおよび精神刺激薬などの薬物中毒、高血圧、循環性ショック、心筋再かん流傷害、アテローム性動脈硬化症、ぜんそく、緑内障、網膜症、がん、炎症性大腸炎、例えば肝炎や肝硬変などの急性慢性肝疾患、関節炎、並びに骨粗しょう症に関連している。内因性カンナビノイドシステムおよびそれと関連のある病気について、Pacher et al. (2006) Pharmacol. Rev. 58:389-462 にて詳細に説明されている。

【0004】

アナンダミドのような内因性のFAAHの基質のレベルを調節し、ひいては内因性カンナビノイドシステムを調節するため、FAAH酵素の阻害剤が開発されてきた。これにより、内因性カンナビノイドシステムに関連する疾患および病気が、少なくとも部分的に治療され、または予防される。

【0005】

FAAHの基質は、パニロイド受容体などのその他の受容体に結合し、および/またはその他のシグナル伝達経路に関与するため、FAAHの阻害剤により、パニロイドシステムなどのその他の伝達経路またはシステムに関連する疾患および病気を、少なくとも部分的に治療され、または予防される。

【0006】

10

仏国特許第2915198号および仏国特許第2915199号には、FAAHの阻害剤である化合物が開示されている。また、米国特許第7,208,504号および仏国特許第2915197号には、仏国特許第2915198号および仏国特許第2915199号にて開示されているものと異ならない範囲の化合物が開示されている。これらの化合物は、それぞれホルモン感受性リパーゼ(HSL)およびモノアシルグリセロールリパーゼ(MAGL)を阻害するのに適しているとして開示されている。しかしながら、これらの化合物は、FAAHを阻害するのに適しているとして開示されてはいない。国際公開第2009/117444号には、FAAHおよびMAGLの両方の阻害剤である化合物が開示されている。

【先行技術文献】

【特許文献】

20

【0007】

【特許文献1】 仏国特許第2915198号

【特許文献2】 仏国特許第2915199号

【特許文献3】 米国特許第7,208,504号

【特許文献4】 仏国特許第2915197号

【特許文献5】 国際公開第2009/117444号

【非特許文献1】 Pacher et al. (2006) Pharmacol. Rev. 58:389-462

【発明の概要】

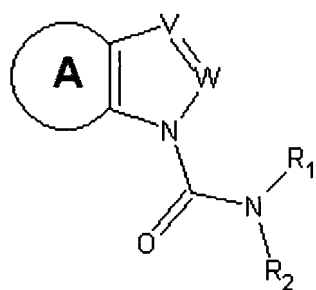
【課題を解決するための手段】

【0008】

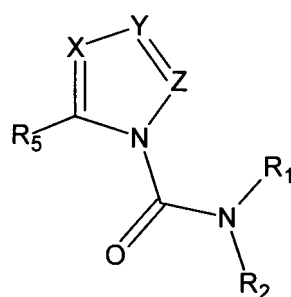
30

本発明の第一の態様では、式Iまたは式II:

【化1】



式I



式II

40

[式中、R1およびR2は、それぞれ独立してH、C<sub>1-20</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、一部若しくは完全飽和ヘテロシクリル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル、R1a、ハロゲン、OH、OR1a、OCOR1a、SH、SR1a、SCOR1a、NH<sub>2</sub>、NHR1a、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R1a、NR1aCOR1b、NHCOR1a、NR1aR1b、COR1a、CSR1a、CN、COOH、COOR1a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR1a、CONHOR1a、SO<sub>2</sub>R1a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR1aR1bおよびSO<sub>2</sub>NR1aR1bから選択することができ、式中のR1aおよびR1bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリル

50

ルから選択されるか、若しくはR1aおよびR1bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【 0 0 0 9 】

ここでR1若しくはR2がC<sub>1-20</sub>アルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、若しくはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR1c、ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1-6</sub>ジアルキルアミノ、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、OR1c、OCOR1c、SH、SR1c、SCOR1c、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR1c、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R1c、NR1cCOR1d、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NHCOR1c、NR1cR1d、COR1c、CSR1c、CN、COOH、COOR1c、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR1c、CONHOR1c、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONR1cR1d、SO<sub>2</sub>R1c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR1cR1dから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR1cおよびR1dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくはR1cおよびR1dと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【 0 0 1 0 】

ここでR1若しくはR2の置換基がC<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1-6</sub>ジアルキルアミノ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、若しくはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR1e、ハロゲン、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、OR1e、OCOR1e、SH、SR1e、SCOR1e、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR1e、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R1e、NR1eCOR1f、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NHCOR1e、NR1eR1f、COR1e、CSR1e、CN、COOH、COOR1e、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR1e、CONHOR1e、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONR1eR1f、SO<sub>2</sub>R1e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR1eR1fから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR1eおよびR1fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくはR1eおよびR1fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【 0 0 1 1 】

ただし、R1およびR2の両方ともHであることはなく、若しくは両方とも非置換メチルであることはなく、

【 0 0 1 2 】

または、

【 0 0 1 3 】

R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともにヘテロアリール若しくはヘテロシクリル基を形成することができ、そのそれぞれを1つ以上の酸素原子、若しくはアリール、ヘテロアリール、一部若しくは完全飽和ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R2a、ハロゲン、OH、OR2a、OCOR2a、SH、SR2a、SCOR2a、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR2a、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R2a、NR2aCOR2b、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NHCOR2a、NR2aR2b、COR2a、CSR2a、CN、COOH、COOR2a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR2a、CONHOR2a、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONR2aR2b、SO<sub>2</sub>R2a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR2aR2bから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR2aおよびR2bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若し

くは、R2aおよびR2bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【 0 0 1 4 】

ここでR1およびR2と一緒に形成するヘテロアリール若しくはヘテロシクリルの置換基がアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、若しくはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキルオキシ、アリール $C_{1-4}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-4}$ アルコキシ、R2c、OR2c、OCOR2c、SH、SR2c、SCOR2c、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、NHR2c、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R2c$ 、NR2cCOR2d、NHC(NH) $NH_2$ 、NHCOR2c、NR2cR2d、COR2c、CSR2c、CN、COOH、COOR2c、CONH $_2$ 、CONHOH、CONHR2c、CONHOR2c、C(NOH) $NH_2$ 、CONR2cR2d、 $SO_2R2c$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ および $SO_2NR2cR2d$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR2cおよびR2dは独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくはR2cおよびR2dと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【 0 0 1 5 】

ここでR1およびR2と一緒に形成するヘテロアリール若しくはヘテロシクリルの置換基の置換基が $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキルオキシ、アリール $C_{1-4}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-4}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-4}$ アルコキシ、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれを $C_{1-4}$ アルコキシ、R2e、ハロゲン、OH、OR2e、OCOR2e、SH、SR2e、SCOR2e、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、NHR2e、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R2e$ 、NR2eCOR2f、NHC(NH) $NH_2$ 、NR2eR2f、NHCOR2e、COR2e、CSR2e、CN、COOH、COOR2e、CONH $_2$ 、CONHOH、CONHR2e、CONHOR2e、C(NOH) $NH_2$ 、CONR2eR2f、 $SO_2R2e$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ および $SO_2NR2eR2f$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR2eおよびR2fは独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくはR2eおよびR2fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【 0 0 1 6 】

環Aはアリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリル部分から選択され、そのそれぞれをハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、Ra、 $C_{1-10}$ アルキル、OH、ORa、OCORa、SH、SRa、SCORa、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、NHRa、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2Ra$ 、NRaCORb、NHCORa、NHC(NH) $NH_2$ 、NRaRb、CORa、CSRa、CN、COOH、COORa、CONH $_2$ 、CONHRA、CONHOH、CONHORA、C(NOH) $NH_2$ 、CONRaRb、 $SO_2Ra$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ および $SO_2NRaRb$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のRaおよびRbは独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはRaおよびRbと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【 0 0 1 7 】

ここで環Aが $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $C_{1-10}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基で置換されるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、Rc、 $C_{1-10}$ アルキル、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、OH、ORc、OCORc、SH、SRc、SCORc、

NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHRc、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>Rc、NRcCORd、NHCORc、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NRcRd、CORc、CSRc、CN、COOH、COORc、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHRc、CONHORc、C(NOH)NH<sub>2</sub>、CONRcRd、SO<sub>2</sub>Rc、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NRcRdから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のRcおよびRdは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはRcおよびRdと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

#### 【0018】

VはN、CHまたはC-R3とすることができ、ここでR3はハロゲン、C<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R3a、OH、OR3a、SH、SR3a、OCOR3a、SCOR3a、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR3a、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R3a、NR3aCOR3b、NHCOR3a、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR3aR3b、COR3a、CSR3a、CN、COOH、COOR3a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR3a、CONHOR3a、C(NOH)NH<sub>2</sub>、CONR3aR3b、SO<sub>2</sub>R3a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>またはSO<sub>2</sub>NR3aR3bであり、式中のR3aおよびR3bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、またはR3aおよびR3bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

#### 【0019】

ここでR3がC<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R3c、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、OR3c、OCOR3c、SH、SR3c、SCOR3c、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR3c、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R3c、NR3cCOR3d、NHCOR3c、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR3cR3d、COR3c、CSR3c、CN、COOH、COOR3c、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR3c、CONHOR3c、C(NOH)NH<sub>2</sub>、CONR3cR3d、SO<sub>2</sub>R3c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR3cR3dから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR3cおよびR3dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR3cおよびR3dと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

#### 【0020】

ここでR3の置換基がC<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、R3e、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、OR3e、OCOR3e、SH、SR3e、SCOR3e、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR3e、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R3e、NR3eCOR3f、NHCOR3e、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR3eR3f、COR3e、CSR3e、CN、COOH、COOR3e、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR3e、CONHOR3e、C(NOH)NH<sub>2</sub>、CONR3eR3f、SO<sub>2</sub>R3e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR3eR3fから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR3eおよびR3fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR3eおよびR3fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

#### 【0021】

WはN、CHまたはC-R4とすることができ、ここでR4はハロゲン、C<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、R4a、OH、OR4a、SH、SR4a、OCOR4a、SCOR4a、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR4a、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R4a、NR4aCOR4b、NHCOR4a、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR4aR4b、COR4a、CSR4a、CN、COOH、COOR4a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR4a、CONHOR4a、C(NOH)NH<sub>2</sub>、CONR4aR4b、SO<sub>2</sub>R4a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>またはSO<sub>2</sub>NR4aR4bであり、式中のR4aおよびR4bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、または、R4aおよびR4bと一緒にこれ

10

20

30

40

50

らを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【 0 0 2 2 】

ここでR4がC<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R4c、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、OR4c、OCOR4c、SH、SR4c、SCOR4c、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR4c、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R4c、NR4cCOR4d、NHCOR4c、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR4cR4d、COR4c、CSR4c、CN、COOH、COOR4c、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR4c、CONHOR4c、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONR4cR4d、SO<sub>2</sub>R4c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR4cR4dから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR4cおよびR4dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR4cおよびR4dと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

10

【 0 0 2 3 】

ここでR4の置換基がC<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR4e、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、OR4e、OCOR4e、SH、SR4e、SCOR4e、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR4e、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R4e、NR4eCOR4f、NHCOR4e、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR4eR4f、COR4e、CSR4e、CN、COOH、COOR4e、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR4e、CONHOR4e、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONR4eR4f、SO<sub>2</sub>R4e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR4eR4fから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR4eおよびR4fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、またはR4eおよびR4fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

20

【 0 0 2 4 】

R5と一緒にこれを結合する環炭素とともにカルボニル基を形成することができ、それに応じてそれが結合する式 I I の環中の二重結合が再配置および/または飽和され、

または、R5はH、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R5a、ハロゲン、OH、OR5a、SH、SR5a、OCOR5a、SCOR5a、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR5a、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R5a、NR5aCOR5b、NHCOR5a、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR5a、CONHOR5a、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONR5aR5b、SO<sub>2</sub>R5a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR5aR5bから選択され、式中のR5aおよびR5bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR5aおよびR5bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

30

【 0 0 2 5 】

ここでR5がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R5c、C<sub>1-6</sub>アルキル、OH、OR5c、OCOR5c、SH、SR5c、SCOR5c、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR5c、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R5c、NR5cCOR5d、NHCOR5c、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR5cR5d、COR5c、CSR5c、CN、COOH、COOR5c、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR5c、CONHOR5c、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONR5cR5d、SO<sub>2</sub>R5c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR5cR5dから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR5cおよびR5dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR5cおよびR5dと一緒にこれらを結合するヘテロ原

40

50

子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【 0 0 2 6 】

ここでR5の置換基がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR5e、C<sub>1-6</sub>アルキル、OH、OR5e、OCOR5e、SH、SR5e、SCOR5e、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR5e、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R5e、NR5eCOR5f、NHCOR5e、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR5eR5f、COR5e、CSR5e、CN、COOH、COOR5e、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR5e、CONHOR5e、C(NOH)NH<sub>2</sub>、CONR5eR5f、SO<sub>2</sub>R5e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR5eR5fから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR5eおよびR5fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR5eおよびR5fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

10

【 0 0 2 7 】

XはO(式I IのXに結合した環の二重結合がそれに応じて単結合に置き換えられる)、N、CHまたはC-R6とすることができ、ここでR6はC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R6a、ハロゲン、OH、OR6a、SH、SR6a、OCOR6a、SCOR6a、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR6a、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R6a、NR6aCOR6b、NHCOR6a、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR6aR6b、COR6a、CSR6a、CN、COOH、COOR6a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR6a、CONHOR6a、C(NOH)NH<sub>2</sub>、CONR6aR6b、SO<sub>2</sub>R6a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR6aR6bから選択され、式中のR6eおよびR6fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR6eおよびR6fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

20

【 0 0 2 8 】

ここでR6がヘテロアリールまたはヘテロシクリルであるとき、これら部分のそれぞれを1つ以上の酸素原子で任意に置換してもよく、R6がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、R6c、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルキニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、OH、OR6c、OCOR6c、SH、SR6c、SCOR6c、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR6c、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R6c、NR6cCOR6d、NHCOR6c、NR6cR6d、COR6c、CSR6c、CN、COOH、COOR6c、CONH<sub>2</sub>、CONHR6c、CONHOR6c、CONHOH、C(NOH)NH<sub>2</sub>、CONR6cR6d、SO<sub>2</sub>R6c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR6cR6dから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR6cおよびR6dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR6cおよびR6dと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

30

【 0 0 2 9 】

ここでR6の置換基がヘテロアリールまたはヘテロシクリルであるとき、これら部分のそれぞれを1つ以上の酸素原子で任意に置換してもよく、R6の置換基がC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルキニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、R6e、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、OH、OR6e、OCOR6e、SH、SR6e、SCOR6e、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR6e、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R6e、NR6eCOR6f、NHCOR6e、NR6eR6f、COR6e、CSR6e、CN、COOH、COOR6e、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR6e、CONHOR6e、C(NOH)NH<sub>2</sub>、CONR6eR6f、SO<sub>2</sub>R6e、

40

50



SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR6eR6fから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR6eおよびR6fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR6eおよびR6fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0030】

YはN、CHまたはC-R7とすることができ、ここでR7はC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R7a、ハロゲン、OH、OR7a、SH、SR7a、OCOR7a、SCOR7a、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR7a、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R7a、NR7aCOR7b、NHCOR7a、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR7aR7b、COR7a、CSR7a、CN、COOH、COOR7a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR7a、CONHOR7a、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONR7aR7b、SO<sub>2</sub>R7a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR7aR7bから選択され、式中のR7aおよびR7bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR7aおよびR7bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0031】

ここでR7がヘテロアリールまたはヘテロシクリルであるとき、これら部分のそれぞれを1つ以上の酸素原子で任意に置換してもよく、R7がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、R7c、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルキニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、OH、OR7c、OCOR7c、SH、SR7c、SCOR7c、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR7c、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R7c、NR7cCOR7d、NHCOR7c、NR7cR7d、COR7c、CSR7c、CN、COOH、COOR7c、CONH<sub>2</sub>、CONHR7c、CONHOR7c、CONHOH、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONR7cR7d、SO<sub>2</sub>R7c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR7cR7dから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR7cおよびR7dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR7cおよびR7dと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0032】

ここでR7の置換基がヘテロアリールまたはヘテロシクリルであるとき、これら部分のそれぞれを1つ以上の酸素原子で任意に置換してもよく、R7の置換基がC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルキニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、R7e、C<sub>1-6</sub>アルキル、OH、OR7e、OCOR7e、SH、SR7e、SCOR7e、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR7e、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R7e、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR7eCOR7f、NHCOR7e、NR7eR7f、COR7e、CSR7e、CN、COOH、COOR7e、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR7e、CONHOR7e、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONR7eR7f、SO<sub>2</sub>R7e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR7eR7fから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR7eおよびR7fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR7eおよびR7fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0033】

ZはN、CHまたはC-R8とすることができ、ここでR8はC<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、

10

20

30

40

50

ヘテロシクリルオキシ、R8a、ハロゲン、OH、OR8a、SH、SR8a、OCOR8a、SCOR8a、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR8a、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R8a、NR8aCOR8b、NHCOR8a、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR8aR8b、COR8a、CSR8a、CN、COOH、COOR8a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR8a、CONHOR8a、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONR8aR8b、SO<sub>2</sub>R8a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR8aR8bから選択され、式中のR8aおよびR8bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR8aおよびR8bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0034】

ここでR8がC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、R8c、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、OH、OR8c、OCOR8c、SH、SR8c、SCOR8c、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR8c、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R8c、NR8cCOR8d、NHCOR8c、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR8cR8d、COR8c、CSR8c、CN、COOH、COOR8c、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR8c、CONHOR8c、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONR8cR8d、SO<sub>2</sub>R8c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR8cR8dから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR8cおよびR8dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR8cおよびR8dと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0035】

ここでR8の置換基がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、R8e、C<sub>1-6</sub>アルキル、OH、OR8e、OCOR8e、SH、SR8e、SCOR8e、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR8e、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R8e、NR8eCOR8f、NHCOR8e、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NR8eR8f、COR8e、CSR8e、CN、COOH、COOR8e、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR8e、CONHOR8e、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONR8eR8f、SO<sub>2</sub>R8e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>およびSO<sub>2</sub>NR8eR8fから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR8eおよびR8fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR8eおよびR8fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0036】

ここでX、YおよびZで示される原子または基の多くとも2つはNとすることができ、

【0037】

ここでWがNであるとき、CONR1R2基をWに結合してもよく、それに応じて式I中の二重結合が再配置され、

【0038】

ただし、R1およびR2と一緒に式Iを有する化合物にピペリジニルを形成する場合、かかるピペリジニルはメチル、ジメチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、メトキシカルボニル、トリフルオロメチル、クロロ、プロモまたはベンジルでは置換されず、

【0039】

ただし、R1とR2と一緒に式Iを有する化合物に6,7-ジメトキシ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、6-メトキシ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、7-メトキシ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、7-アミノ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、7-ニトロ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-1-イル、3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル、ピロリジ

10

20

30

40

50

ン-1-イル、3,6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル、8-アザ-スピロ[4.5]デシ-8-イル、1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル、オクタヒドロイソインドール-2-イル、1,2,6-トリアザ-スピロ[2.5]オクテ-1-エン-6-イルまたはアゼパン-1-イルを形成せず、

【0040】

ただし、R1またはR2が非置換メチルであるとき、他方のR1またはR2は4-クロロブチル、4-アジドブチルまたは4-イソチオシアナトブチルでなく、

【0041】

ただし、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともにピペリジニル、ピペラジニル、置換ピペリジニルまたは置換ピペラジニルを形成するとき、式Iを有する化合物中の環Aはピリジン、ピリミジン、置換ピリジンまたは置換ピリミジンを形成せず、また

10

【0042】

ただし、本化合物が(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)(4-(キノリン-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル)メタノンではない]を有する化合物、

【0043】

またはその薬学的に許容し得る塩若しくはエステルを提供する。

【発明を実施するための形態】

【0044】

本発明の化合物は、脂肪酸アミドヒドロラーゼ(FAAH)酵素の活性を調節することが見出された。特に本化合物は、この酵素に対する阻害特性を有し、10  $\mu$ M以下の濃度で、体外でFAAHの阻害性を示す。さらに、これらの化合物の多くは、100 nM以下の濃度で、体外でFAAHの強い阻害性を示し、また、体内では中枢神経系組織および末梢組織において阻害性を示す。また、本発明の化合物は、例えばモノアシルグリセロールヒドロラーゼなどの他のセリンヒドロラーゼに対しては比較的低い阻害性を示すことから、FAAHに対して比較的特異的であることも見出された。また、それらは、比較的代謝安定性があり、FAAHに対して比較的高い親和性を示す。このことにより、それらは、FAAHに対して比較的長時間の効果的な阻害性を提供することが期待されることを意味する。

20

【0045】

さらに、本発明の化合物の中には、末梢組織よりも中枢神経系組織においてより著しくFAAHを阻害するような選択性を有することが見出されたものがある。また、本発明の化合物の中には、中枢神経系組織よりも末梢組織においてより著しくFAAHを阻害するような選択性を有することが見出されたものもある。

30

【0046】

本発明の特定の化合物は、被験体の肺への投与に特に適していることが見出された。本化合物は、被験体の血流に入ることなく、肺においてFAAHを効果的に阻害できることが見出された。このように本化合物は、FAAHに対し、全身的作用というよりもむしろ局所的な阻害効果を有する。

【0047】

本明細書で用いる「C<sub>x-y</sub>アルキル」という用語は、X~Y個の炭素原子を含有する直鎖または分枝の飽和炭化水素基を指す。例えば、C<sub>1-6</sub>アルキルとは、1~6個の炭素原子を含有する直鎖または分枝の飽和炭化水素基を指す。C<sub>1-6</sub>アルキル基の例として、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、イソペンチル、ネオペンチルおよびヘキシルが挙げられる。好ましくは、かかる炭化水素基は直鎖である。C<sub>1-10</sub>アルキル基は、好ましくはC<sub>1-6</sub>アルキルである。また、「C<sub>x-y</sub>アルキル」という用語は、X~Y個の炭素原子を含有する直鎖または分枝の飽和炭化水素基であって、C<sub>x-y</sub>アルキレン基となるように、末端のメチル基がさらに置換されるものも指す。

40

【0048】

本明細書で用いる「C<sub>x-y</sub>アルキニル」という用語は、X~Y個の炭素原子および少なくとも1個の炭素-炭素三重結合を含有する直鎖または分枝の飽和炭化水素基を指す。例えば、C<sub>1-6</sub>アルキニルとは、1~6個の炭素原子を含有する直鎖または分枝の飽和炭化水素基

50

を指す。 $C_{1-6}$ アルキニル基の例として、エチニル、メチルブチニル（例えば3-メチル-1-ブチニル）、1,3-ブタジニルおよび1,3,5-ヘキサトリニルが挙げられる。

【0049】

本明細書で用いる「アリアル」という用語は、少なくとも1つの環が芳香族である $C_{6-12}$ の単環式または二環式の炭化水素環を指す。かかる基の例として、フェニル、ナフタレニルおよびテトラヒドロナフタレニルが挙げられる。

【0050】

本明細書で用いる「ヘテロアリアル」という用語は、酸素、窒素および硫黄から選択した1～4個のヘテロ原子を含有する、5-6員の単環式芳香族の、または8-10員の二環式縮合芳香族の環を指す。かかる単環式芳香族環の例として、チエニル、フリル、フラザニル、ピロリル、トリアゾリル、テトラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、オキサジアゾリル、イソチアゾリル、イソキサゾリル、チアジアゾリル、ピラニル、ピラゾリル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリジル、トリアジニル、テトラジニル等が挙げられる。かかる二環式芳香族環の例として、キノリニル、イソキノリニル、キナゾリニル、キノキサリニル、プテリジニル、シンノリニル、フタラジニル、ナフチリジニル、インドリル、イソインドリル、アザインドリル、インドリジニル、インダゾリル、プリニル、ピロロピリジニル、フロピリジニル、ベンゾフラニル、イソベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾキサゾリル、ベンゾイソキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾキサジアゾリル、ベンゾチアジアゾリルおよびイミダゾピリジルが挙げられる。

【0051】

「1つ以上の酸素原子で置換されるヘテロアリアル」という用語は、1つ以上の酸素原子が結合するヘテロアリアル環を指す。これは、ヘテロアリアル環に1つ以上の酸素原子が環原子として含有することを意味するのではないが、いくつかの実施形態においては、そうであるかもしれない。好ましくは、1つ以上の酸素原子は、ヘテロアリアル環の窒素ヘテロ原子に結合している。酸素原子で置換されるヘテロアリアルは、N-オキシドを含んでもよい。かかる1つ以上の酸素原子で置換されるヘテロアリアルの例として、ピリジル窒素が酸化された1-オキシドピリジルが挙げられる。

【0052】

「ヘテロシクリル」という用語は、酸素、窒素および硫黄から選択した1～4個のヘテロ原子を含有し、飽和であり、または部分的に不飽和である、3-8員（好ましくは4-8であり、より好ましくは4-7である）の単環、または8-12員の縮合した二環を指す。かかる単環の例として、オキサジリジニル、オキシラニル、ジオキシラニル、アジリジニル、ピロリジニル、アゼチジニル、ピラゾリジニル、オキサゾリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、チアゾリジニル、ヒダントイニル、パレロラクタミル、オキシラニル、オキセタニル、ジオキソラニル、ジオキサニル、オキサチオラニル、オキサチアニル、ジチアニル、ジヒドロフラニル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロピリジニル、テトラヒドロピリミジニル、テトラヒドロチオフェニル、テトラヒドロチオピラニル、ジアゼパニル、アゼパニルなどが挙げられる。かかる二環の例として、インドリニル、イソインドリニル、ベンゾピラニル、キヌクリジニル、2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピン、4-(ベンゾ[d][1,3]ジオキソール-5-イルメチル)ピペラジン-1-イル、テトラヒドロイソキノリニルなどが挙げられる。

【0053】

「1つ以上の原子で置換されるヘテロシクリル」という用語は、1つ以上の酸素原子が結合するヘテロシクリル環を指す。これは、ヘテロシクリル環に1つ以上の酸素原子が環原子として含有することを意味するのではないが、いくつかの実施形態においては、そうであるかもしれない。好ましくは、1つ以上の酸素原子は、ヘテロシクリル環の、窒素や硫黄などのヘテロ原子に結合している。かかる1つ以上の酸素原子で置換されるヘテロシクリルの例として、1,1-ジオキシド-1,3-チアゾリジニルが挙げられる。

## 【0054】

二環に関する文脈における「二環」および「縮合した」という用語は、2つの原子間の結合にわたって結合した（例えばナフタレン）、架橋を形成する原子の配列にわたって結合した（例えばキヌクリジン）、またはスピロ化合物を形成する単一の原子に結合した（たとえば1,4-ジオキサ-8-アザ-スピロ[4.5]デカンおよびN,3,3-ジメチル-1,5-ジオキサスピロール[5.5]ウンデカン-9-イル）、2つの環を指す。

## 【0055】

本明細書で用いる「 $C_{x-y}$ シクロアルキル」という用語は、単環式、二環式または三環式とすることができる、 $x \sim y$ 個の炭素原子を含む飽和炭化水素環を指す。例えば、 $C_{3-10}$ シクロアルキルは、3～10個の炭素原子を含む単環式、二環式または三環式の飽和炭化水素環を指す。 $C_{3-10}$ シクロアルキル基の例として、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチルおよびアダマンチルが挙げられる。

10

## 【0056】

本明細書で用いる「アリール $C_{x-y}$ アルキル」という用語は、上述にて定義した $C_{x-y}$ アルキルに結合した、上述にて定義したアリール基を指す。例えば、アリール $C_{1-6}$ アルキルは、1～6個の炭素原子を含有する直鎖または分枝の飽和炭化水素基に結合したアリール基を指す。アリール $C_{1-6}$ アルキル基の例として、ベンジル、フェニルエチル、フェニルプロピル、フェニルブチル、フェニルペンチルおよびフェニルヘキシルが挙げられる。

## 【0057】

本明細書で用いる「ヘテロアリール $C_{x-y}$ アルキル」、「ヘテロシクリル $C_{x-y}$ アルキル」、「 $C_{x-y}$ シクロアルキル $C_{x-y}$ アルキル」という用語は、上述にて定義した $C_{x-y}$ アルキルに結合した、上述にて定義したヘテロアリール、ヘテロシクリルまたは $C_{x-y}$ シクロアルキル基を指す。

20

## 【0058】

本明細書で用いる「 $C_{x-y}$ アルコキシ」という用語は、 $-O-C_{x-y}$ アルキル基を指し、ここで $C_{x-y}$ アルキルは上述にて定義した通りである。かかる基の例として、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペントキシおよびヘキソキシが挙げられる。

## 【0059】

本明細書で用いる「アリールオキシ」という用語は、 $-O-$ アリール基を指す。かかる基の例として、フェノキシが挙げられる。本明細書で用いる「ヘテロアリールオキシ」および「ヘテロシクリルオキシ」という用語は、それぞれ $-O-$ ヘテロアリールおよび $-O-$ ヘテロシクリル基を指す。

30

## 【0060】

本明細書で用いる「ハロゲン」という用語は、特に明記しない限り、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を指す。

## 【0061】

本明細書で用いる「 $C_{x-y}$ アルキルアミノ」という用語は、第二級アミン基（ $-NH(R)$ ）を指し、Rの官能基は、 $x \sim y$ 個の炭素原子を含有する直鎖または分枝の飽和炭化水素基から選択される。 $C_{x-y}$ アルキルアミノ基の例として、メチルアミノ、エチルアミノおよびプロピルアミノが挙げられる。

40

## 【0062】

本明細書で用いる「 $C_{x-y}$ ジアルキルアミノ」という用語は、第三級アミン基（ $-NR(R^*)$ ）を指し、Rおよび $R^*$ の官能基は、 $x \sim y$ 個の炭素原子を含有する直鎖または分枝の飽和炭化水素基からそれぞれ選択される。 $C_{x-y}$ ジアルキルアミノ基の例として、ジメチルアミノ、メチルエチルアミノおよびジエチルアミノが挙げられる。

## 【0063】

本明細書で（例えば「式中のR8eおよびR8fは独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され」というフレーズにおいて）、Rとして特定される様々な官能基の特定に関して用いる「置換 $C_{x-y}$ アルキル」という用語は、特定のRの官能基（例えばR1a、R2c、R4d、R5eなど）が

50

、 $R'$ 、ハロゲン、OH、 $OR'$ 、SH、 $SR'$ 、 $OCOR'$ 、 $SCOR'$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR'$ 、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R'$ 、 $NR'COR'$ 、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NHCOR'$ 、 $NR'R'$ 、 $COR'$ 、 $CSR'$ 、CN、COOH、 $COOR'$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHOH$ 、 $CONHR'$ 、 $CONR'R'$ 、 $CONHOR'$ 、 $C(NO_2)NH_2$ 、 $SO_2R'$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ および $SO_2NR'R'$ から選択した1つ以上の基で置換されることが可能であることを意味し、式中の $R'$ および $R''$ は独立して $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、または $R'$ および $R''$ が一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができる。

#### 【0064】

本発明の化合物の「薬学的に許容し得る塩」は、無機塩基との塩、有機塩基との塩、無機酸との塩、有機酸との塩、および塩基性または酸性アミノ酸との塩を含む。場合によっては、特に酸との塩を用いてもよい。典型的な塩として、塩酸塩、酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、メタンスルホン酸塩、2-ヒドロキシプロパン-1,2,3-トリカルボン酸塩、(2R,3R)-2,3-ジヒドロキシコハク酸塩、リン酸塩およびシュウ酸塩が挙げられる。本発明の化合物は、溶媒和物（たとえば水和物）または無溶媒和物（たとえば無水和物）のどちらの形態であってもよい。溶媒和物の形態であるときは、追加溶媒がプロパン-2-オールのようなアルコールであってもよい。

10

#### 【0065】

本発明の化合物の「薬学的に許容し得るエステル」とは、かかる化合物中の1つ以上のカルボキシル（すなわち $-C(=O)OH$ ）基が、アルコール部分 $U-OH$ との反応によって変質して $-C(=O)OU$ 基が生成された誘導体であり、ここで $U$ は、 $C_{1-18}$ アルキル（例えば $C_{1-6}$ アルキル）、アリール、ヘテロアリール若しくは $C_{3-8}$ シクロアルキルまたはそれらの組合せであってもよい。

20

#### 【0066】

塩およびエステルの調製の一般的な方法は、当業者に周知である。塩およびエステルの薬学的な許容可能性は、製剤加工特性および生体内挙動を含む様々な要因に依存するが、当業者は、本開示を考慮して、かかる要因を迅速に評価することができるであろう。

#### 【0067】

本発明の化合物が様々なエナンチオマーおよび/またはジアステレオマーの形態で存在する場合（二重結合についての幾何学性を含む）、これらの化合物を異性体混合物またはラセミ化合物として調製してもよいが、本発明は、全てのかかるエナンチオマーまたは異性体に関するものであり、光学的に純粋な形態として存在しているか、または他の異性体との混合物として存在しているかどうかに関わらない。個々のエナンチオマーまたは異性体を、生成物または中間体の光学分割（例えばクロマトグラフィによるキラル分離（例えばキラルHPLC））、またはエナンチオマー合成法など、当技術分野において既知の方法で得てもよい。同様に、本発明の化合物が二者択一の互変異性型（例えばケト/エノール、アミド/イミド酸）として存在する場合、本発明は、個々の単独の互変異性体に、およびあらゆる割合の互変異性体の混合物に関するものである。

30

#### 【0068】

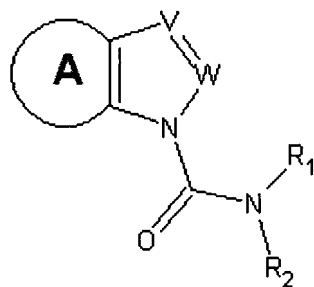
式IIの化合物において、 $X$ 、 $Y$ および $Z$ で示される原子または基のうち0個、1個または2個を $N$ とすることができる。

40

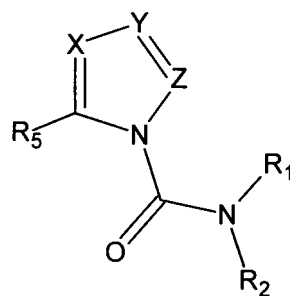
#### 【0069】

特定の実施形態において、本発明の化合物は、式Iおよび式II：

## 【化 2】



式 I



式 II

10

〔式中、R1およびR2は、それぞれ独立してH、C<sub>1-20</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキルから選択することができ、Hを除いたそのそれぞれをハロゲン、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、アミノ、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノおよびC<sub>1-6</sub>ジアルキルアミノから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、ただし、R1およびR2の両方ともHであることはなく、または、

20

## 【0070】

R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともにヘテロアリール若しくはヘテロシクリル基を形成することができ、そのそれぞれをヒドロキシ、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシおよびヘテロシクリルオキシから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、そのそれぞれをハロゲン、ヒドロキシル、C<sub>1-4</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールC<sub>1-4</sub>アルコキシおよびヘテロアリールC<sub>1-4</sub>アルコキシから選択した基で任意に置換してもよく、ハロゲンおよびヒドロキシルを除いたそのそれぞれをC<sub>1-4</sub>アルコキシで任意に置換してもよく、

30

## 【0071】

環Aはアリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリル部分から選択され、そのそれぞれをハロゲン、ヒドロキシル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシおよびヘテロシクリルオキシから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、ハロゲンおよびヒドロキシルを除いたそのそれぞれをハロゲン、シアノ、アミドおよびカルボン酸で任意に置換してもよく、

## 【0072】

VはN、CH若しくはC-R3とすることができ、ここでR3はハロゲン、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル若しくはC<sub>3-8</sub>シクロアルキルであり、ハロゲンを除いたそのそれぞれをハロゲンで任意に置換してもよく、

40

## 【0073】

WはN、CH若しくはC-R4とすることができ、ここでR4はC<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル若しくはC<sub>3-8</sub>シクロアルキルであり、そのそれぞれをハロゲンで任意に置換してもよく、

## 【0074】

R5はH、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-8</sub>シクロアルキルから選択され、Hを除いたそのそれぞれをハロゲンで任意に置換してもよく、

## 【0075】

50

XはN、CH若しくはC-R6とすることができ、ここでR6はC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルから選択され、Hを除いたそのそれぞれをハロゲン、ヒドロキシル、アミン、アミド、シアノ、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシおよびヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、

【0076】

YはN、CH若しくはC-R7とすることができ、ここでR7はC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルから選択され、Hを除いたそのそれぞれをハロゲン、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシおよびヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、そのそれぞれをC<sub>1-4</sub>アルキル、シアノ、アミノ、アミド、ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキルおよびヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルで任意に置換してもよく、

【0077】

ZはN、CH若しくはC-R8とすることができ、ここでR8はC<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-8</sub>シクロアルキルから選択され、そのそれぞれをハロゲンで任意に置換してもよく、

【0078】

ただし、R1およびR2と一緒に式Iを有する化合物にピペリジニルを形成する場合、かかるピペリジニルはメチル、ジメチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、トリフルオロメチル、クロロ、ブromoまたはベンジルでは置換されない]から選択した式を有し、

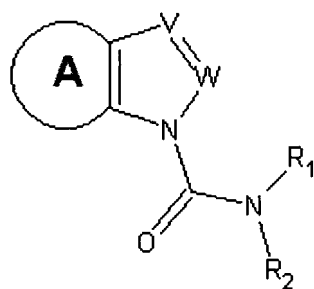
【0079】

またはその薬学的に許容し得る塩若しくはエステルである。

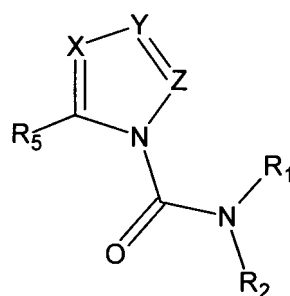
【0080】

本発明の別の態様では、式Iまたは式II:

【化3】



式I



式II

[式中、R1およびR2は、それぞれ独立してH、C<sub>1-20</sub>アルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、一部若しくは完全飽和ヘテロシクリル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル、R1a、ハロゲン、OH、OR1a、SH、SR1a、OCOR1a、SCOR1a、NH<sub>2</sub>、NH R1a、NR1aR1b、COR1a、CSR1a、CN、COOH、COOR1a、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R1a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR1 aR1bおよびSO<sub>2</sub>NR1aR1bから選択することができ、式中のR1aおよびR1bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR1aおよびR1bは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0081】

ここでR1若しくはR2がC<sub>1-20</sub>アルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、ヘテ



ロシクリル、 $C_{3-10}$ シクロアルキル、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-10}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、若しくはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR1c、ハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、アリール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ、 $C_{1-6}$ ジアルキルアミノ、 $C_{1-10}$ アルキル、OH、OR1c、OCOR1c、SH、SR1c、SCOR1c、 $NH_2$ 、NHR1c、NR1cR1d、COR1c、CSR1c、CN、COOH、COOR1c、 $CONH_2$ 、 $SO_2$ R1c、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、CONR1cR1d若しくは $SO_2NR1cR1d$ で任意に置換してもよく、式中のR1cおよびR1dは独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR1cおよびR1dは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

#### 【0082】

ここでR1若しくはR2の置換基が $C_{1-10}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、アリール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ、 $C_{1-6}$ ジアルキルアミノ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、若しくはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR1e、 $C_{1-10}$ アルキル、OH、OR1e、OCOR1e、SH、SR1e、SCOR1e、 $NH_2$ 、NHR1e、NR1eR1f、COR1e、CSR1e、CN、COOH、COOR1e、 $CONH_2$ 、 $SO_2$ R1e、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、CONR1eR1f若しくは $SO_2NR1eR1f$ で任意に置換してもよく、式中のR1eおよびR1fは独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR1eおよびR1fは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、ただし、R1およびR2の両方ともHであることはなく、または、

#### 【0083】

R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともにヘテロアリール若しくはヘテロシクリル基を形成することができ、そのそれぞれをヒドロキシ、アリール、ヘテロアリール、一部若しくは完全飽和ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R2a、ハロゲン、OH、OR2a、SH、SR2a、OCOR2a、SCOR2a、 $NH_2$ 、NHR2a、NR2aR2b、COR2a、CSR2a、CN、COOH、COOR2a、 $CONH_2$ 、 $SO_2$ R2a、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、CONR2aR2bおよび $SO_2NR2aR2b$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR2aおよびR2bは独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR2aおよびR2bは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

#### 【0084】

ここでR1およびR2と一緒に形成するヘテロアリール若しくはヘテロシクリルの置換基がアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、若しくはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキルオキシ、アリール $C_{1-4}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-4}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-4}$ アルコキシ、R2c、OR2c、SH、SR2c、OCOR2c、SCOR2c、 $NH_2$ 、NHR2c、NR2cR2d、COR2c、CSR2c、CN、COOH、COOR2c、 $CONH_2$ 、 $SO_2$ R2c、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、CONR2cR2dおよび $SO_2NR2cR$

10

20

30

40

50

2dから選択した1つの基で任意に置換してもよく、式中のR2cおよびR2dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR2cおよびR2dは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、  
【0085】

ここでR1およびR2が一緒に形成するヘテロアリール若しくはヘテロシクリルの置換基の置換基がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルオキシ、アリールC<sub>1-4</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-4</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-4</sub>アルコキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-4</sub>アルコキシ、若しくはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをC<sub>1-4</sub>アルコキシ、R2e、ハロゲン、OH、OR2e、SH、SR2e、OCOR2e、SCOR2e、NH<sub>2</sub>、NHR2e、NR2eR2f、COR2e、CSR2e、CN、COOH、COOR2e、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R2e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR2eR2f若しくはSO<sub>2</sub>NR2eR2fで任意に置換してもよく、式中のR2eおよびR2fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR2eおよびR2fは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

10

【0086】

環Aはアリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリル部分から選択され、そのそれぞれをハロゲン、C<sub>1-6</sub>アルキル、ヒドロキシル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、Ra、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、ORa、OCORa、SH、SRa、SCORa、NH<sub>2</sub>、NHRa、NRaRb、CORa、CSRa、CN、COOH、COORa、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>Ra、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONRaRbおよびSO<sub>2</sub>NRaRbから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のRaおよびRbは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにRaおよびRbは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

20

【0087】

ここで環AがC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>1-10</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基で置換されるとき、これら部分のそれぞれをRc、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、ORc、OCORc、SH、SRc、SCORc、NH<sub>2</sub>、NHRc、NRcRd、CORc、CSRc、CN、COOH、COORc、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>Rc、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONRcRdまたはおよびSO<sub>2</sub>NRcRdで任意に置換してもよく、式中のRcおよびRdは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにRcおよびRdは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

30

【0088】

VはN、CHまたはC-R3とすることができ、ここでR3はハロゲン、C<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R3a、OH、OR3a、SH、SR3a、OCOR3a、SCOR3a、NH<sub>2</sub>、NHR3a、NR3aR3b、COR3a、CSR3a、CN、COOH、COOR3a、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R3a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR3aR3bまたはSO<sub>2</sub>NR3aR3bであり、式中のR3aおよびR3bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR3aおよびR3bは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

40

【0089】

ここでR3がC<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R3c、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、OR3c、OCOR3c、SH、SR3c、SCOR3c、NH<sub>2</sub>、NHR3c、NR3cR3d、COR3c、CSR3c、CN、COOH、COOR3c、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R3c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR3cR3dまたはSO<sub>2</sub>NR3cR3dで任意に置換してもよく、

50

式中のR3cおよびR3dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR3cおよびR3dは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0090】

ここでR3の置換基がC<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR3e、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、OR3e、OCOR3e、SH、SR3e、SCOR3e、NH<sub>2</sub>、NHR3e、NR3eR3f、COR3e、CSR3e、CN、COOH、COOR3e、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R3e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR3eR3fまたはSO<sub>2</sub>NR3eR3fで任意に置換してもよく、式中のR3eおよびR3fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR3eおよびR3fは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

10

【0091】

WはN、CHまたはC-R4とすることができ、ここでR4はハロゲン、C<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、R4a、OH、OR4a、SH、SR4a、OCOR4a、SCOR4a、NH<sub>2</sub>、NHR4a、NR4aR4b、COR4a、CSR4a、CN、COOH、COOR4a、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R4a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR4aR4bまたはSO<sub>2</sub>NR4aR4bであり、式中のR4aおよびR4bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR4aおよびR4bは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

20

【0092】

ここでR4がC<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R4c、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、OR4c、OCOR4c、SH、SR4c、SCOR4c、NH<sub>2</sub>、NHR4c、NR4cR4d、COR4c、CSR4c、CN、COOH、COOR4c、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R4c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR4cR4dまたはSO<sub>2</sub>NR4cR4dで任意に置換してもよく、式中のR4cおよびR4dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR4cおよびR4dは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

30

【0093】

ここでR4の置換基がC<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR4e、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、OR4e、OCOR4e、SH、SR4e、SCOR4e、NH<sub>2</sub>、NHR4e、NR4eR4f、COR4e、CSR4e、CN、COOH、COOR4e、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R4e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR4eR4fまたはSO<sub>2</sub>NR4eR4fで任意に置換してもよく、式中のR4eおよびR4fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR4eおよびR4fは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

40

【0094】

R5はH、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R5a、ハロゲン、OH、OR5a、SH、SR5a、OCOR5a、SCOR5a、NH<sub>2</sub>、NHR5a、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R5a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR5aR5bおよびSO<sub>2</sub>NR5aR5bから選択され、式中のR5aおよびR5bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR5aおよびR5bは隣接するヘテ

50

口原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【 0 0 9 5 】

ここでR5がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R5c、C<sub>1-6</sub>アルキル、OH、OR5c、OCOR5c、SH、SR5c、SCOR5c、NH<sub>2</sub>、NHR5c、NR5cR5d、COR5c、CSR5c、CN、COOH、COOR5c、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R5c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR5cR5dまたはSO<sub>2</sub>NR5cR5dで任意に置換してもよく、式中のR5cおよびR5dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、またはR5cおよびR5dは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

10

【 0 0 9 6 】

ここでR5の置換基がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR5e、C<sub>1-6</sub>アルキル、OH、OR5e、OCOR5e、SH、SR5e、SCOR5e、NH<sub>2</sub>、NHR5e、NR5eR5f、COR5e、CSR5e、CN、COOH、COOR5e、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R5e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR5eR5fまたはSO<sub>2</sub>NR5eR5fで任意に置換してもよく、式中のR5eおよびR5fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR5eおよびR5fは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

20

【 0 0 9 7 】

XはN、CHまたはC-R6とすることができ、ここでR6はC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R6a、OH、OR6a、SH、SR6a、OCOR6a、SCOR6a、NH<sub>2</sub>、NHR6a、NR6aR6b、COR6a、CSR6a、CN、COOH、COOR6a、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R6a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR6aR6bおよびSO<sub>2</sub>NR6aR6bから選択され、式中のR6eおよびR6fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR6eおよびR6fは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【 0 0 9 8 】

30

ここでR6がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR6c、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、OH、OR6c、OCOR6c、SH、SR6c、SCOR6c、NH<sub>2</sub>、NHR6c、NR6cR6d、COR6c、CSR6c、CN、COOH、COOR6c、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R6c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR6cR6dまたはSO<sub>2</sub>NR6cR6dで任意に置換してもよく、式中のR6cおよびR6dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR6cおよびR6dは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

40

【 0 0 9 9 】

ここでR6の置換基がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR6e、C<sub>1-6</sub>アルキル、OH、OR6e、OCOR6e、SH、SR6e、SCOR6e、NH<sub>2</sub>、NHR6e、NR6eR6f、COR6e、CSR6e、CN、COOH、COOR6e、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R6e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR6eR6fまたはSO

50

<sub>2</sub>NR6eR6fで任意に置換してもよく、式中のR6eおよびR6fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR6eおよびR6fは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0100】

YはN、CHまたはC-R7とすることができ、ここでR7はC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R7a、ハロゲン、OH、OR7a、SH、SR7a、OCOR7a、SCOR7a、NH<sub>2</sub>、NHR7a、NR7aR7b、COR7a、CSR7a、CN、COOH、COOR7a、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R7a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR7aR7bおよびSO<sub>2</sub>NR7aR7bから選択され、式中のR7aおよびR7bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR7aおよびR7bは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

10

【0101】

ここでR7がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR7c、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、OH、OR7c、OCOR7c、SH、SR7c、SCOR7c、NH<sub>2</sub>、NHR7c、NR7cR7d、COR7c、CSR7c、CN、COOH、COOR7c、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R7c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR7cR7dまたはSO<sub>2</sub>NR7cR7dで任意に置換してもよく、式中のR7cおよびR7dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR7cおよびR7dは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

20

【0102】

ここでR7の置換基がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR7e、C<sub>1-6</sub>アルキル、OH、OR7e、OCOR7e、SH、SR7e、SCOR7e、NH<sub>2</sub>、NHR7e、NR7eR7f、COR7e、CSR7e、CN、COOH、COOR7e、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R7e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR7eR7fまたはSO<sub>2</sub>NR7eR7fで任意に置換してもよく、式中のR7eおよびR7fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR7eおよびR7fは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

30

【0103】

ZはN、CHまたはC-R8とすることができ、ここでR8はC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R8a、ハロゲン、OH、OR8a、SH、SR8a、OCOR8a、SCOR8a、NH<sub>2</sub>、NHR8a、NR8aR8b、COR8a、CSR8a、CN、COOH、COOR8a、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R8a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR8aR8bおよびSO<sub>2</sub>NR8aR8bから選択され、式中のR8aおよびR8bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR8aおよびR8bは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

40

【0104】

ここでR8がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR8c、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテ

50

ロアリール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルコキシ、OH、OR8c、OCOR8c、SH、SR8c、SCOR8c、NH<sub>2</sub>、NHR8c、NR8cR8d、COR8c、CSR8c、CN、COOH、COOR8c、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R8c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR8cR8dまたはSO<sub>2</sub>NR8cR8dで任意に置換してもよく、式中のR8cおよびR8dは独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR8cおよびR8dは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0105】

ここでR8の置換基が $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、アリール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR8e、 $C_{1-6}$ アルキル、OH、OR8e、OCOR8e、SH、SR8e、SCOR8e、NH<sub>2</sub>、NHR8e、NR8eR8f、COR8e、CSR8e、CN、COOH、COOR8e、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R8e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR8eR8fまたはSO<sub>2</sub>NR8eR8fで任意に置換してもよく、式中のR8eおよびR8fは独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR8eおよびR8fは隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0106】

ただし、R1およびR2と一緒に式Iを有する化合物にピペリジニルを形成する場合、かかるピペリジニルはメチル、ジメチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、トリフルオロメチル、クロロ、ブromoまたはベンジルでは置換されず、

【0107】

ただし、R1とR2と一緒に式Iを有する化合物に6,7-ジメトキシ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、6-メトキシ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、7-メトキシ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、7-アミノ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、7-ニトロ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-1-イル、3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル、ピロリジン-1-イル、3,6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル、8-アザ-スピロ[4.5]デシ-8-イル、1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル、オクタヒドロイソインドール-2-イル、1,2,6-トリアザ-スピロ[2.5]オクテ-1-エン-6-イルまたはアゼパン-1-イルを形成せず、また

【0108】

ただし、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともにピペリジニル、ピペラジニル、置換ピペリジニルまたは置換ピペラジニルを形成するとき、式Iを有する化合物中の環Aはピリジン、ピラジン、置換ピリジンまたは置換ピラジンを形成しない]を有する化合物、

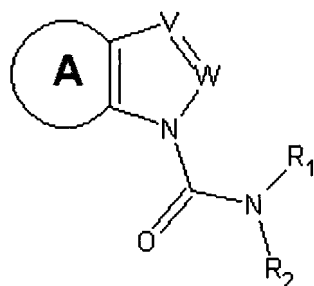
【0109】

またはその薬学的に許容し得る塩若しくはエステルを提供する。

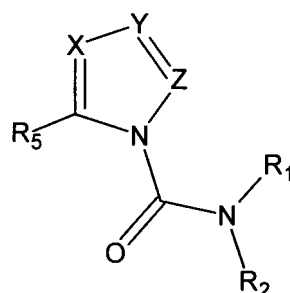
【0110】

本発明のさらなる態様では、式Iまたは式II:

【化4】



式I



式II

10

20

30

40

50

〔式中、R1およびR2は、それぞれ独立してH、C<sub>1-20</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、一部若しくは完全飽和ヘテロシクリル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル、R1a、ハロゲン、OH、OR1a、SH、SR1a、OCOR1a、SCOR1a、NH<sub>2</sub>、NHR1a、NR1aR1b、COR1a、CSR1a、CN、COOH、COOR1a、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R1a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR1aR1bおよびSO<sub>2</sub>NR1aR1bから選択することができ、式中のR1aおよびR1bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくはR1aおよびR1bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0111】

10

ここでR1若しくはR2がC<sub>1-20</sub>アルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、若しくはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR1c、ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1-6</sub>ジアルキルアミノ、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、OR1c、OCOR1c、SH、SR1c、SCOR1c、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR1c、NR1cR1d、COR1c、CSR1c、CN、COOH、COOR1c、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R1c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR1cR1dおよびSO<sub>2</sub>NR1cR1dから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR1cおよびR1dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくはR1cおよびR1dと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

20

【0112】

ここでR1若しくはR2の置換基がC<sub>1-10</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ、C<sub>1-6</sub>ジアルキルアミノ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、若しくはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR1e、ハロゲン、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、OR1e、OCOR1e、SH、SR1e、SCOR1e、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR1e、NR1eR1f、COR1e、CSR1e、CN、COOH、COOR1e、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R1e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR1eR1fおよびSO<sub>2</sub>NR1eR1fから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR1eおよびR1fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくはR1eおよびR1fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

30

【0113】

ただし、R1およびR2の両方ともHであることはなく、

40

【0114】

または、

【0115】

R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともにヘテロアリール若しくはヘテロシクリル基を形成することができ、そのそれぞれを1つ以上の酸素原子、若しくはヒドロキシ、アリール、ヘテロアリール、一部若しくは完全飽和ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R2a、ハロゲン、OH、OR2a、SH、SR2a、OCOR2a、SCOR2a、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR2a、NR2aR2b、COR2a、CSR2a、CN、COOH、COOR2a、CONH<sub>2</sub>、

50

SO<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR<sub>2a</sub>R<sub>2b</sub>およびSO<sub>2</sub>NR<sub>2a</sub>R<sub>2b</sub>から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR<sub>2a</sub>およびR<sub>2b</sub>は独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくはR<sub>2a</sub>およびR<sub>2b</sub>と一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0116】

ここでR<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>と一緒に形成するヘテロアリール若しくはヘテロシクリルの置換基がアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、若しくはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、ヒドロキシル、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルオキシ、アリールC<sub>1-4</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-4</sub>アルコキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-4</sub>アルコキシ、R<sub>2c</sub>、OR<sub>2c</sub>、SH、SR<sub>2c</sub>、OCOR<sub>2c</sub>、SCOR<sub>2c</sub>、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR<sub>2c</sub>、NR<sub>2c</sub>R<sub>2d</sub>、COR<sub>2c</sub>、CSR<sub>2c</sub>、CN、COOH、COOR<sub>2c</sub>、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R<sub>2c</sub>、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR<sub>2c</sub>R<sub>2d</sub>およびSO<sub>2</sub>NR<sub>2c</sub>R<sub>2d</sub>から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR<sub>2c</sub>およびR<sub>2d</sub>は独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくはR<sub>2c</sub>およびR<sub>2d</sub>と一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0117】

ここでR<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>と一緒に形成するヘテロアリール若しくはヘテロシクリルの置換基の置換基がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルオキシ、アリールC<sub>1-4</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-4</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-4</sub>アルコキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-4</sub>アルコキシ、若しくはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをC<sub>1-4</sub>アルコキシ、R<sub>2e</sub>、ハロゲン、OH、OR<sub>2e</sub>、SH、SR<sub>2e</sub>、OCOR<sub>2e</sub>、SCOR<sub>2e</sub>、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR<sub>2e</sub>、NR<sub>2e</sub>R<sub>2f</sub>、NHCOR<sub>2e</sub>、COR<sub>2e</sub>、CSR<sub>2e</sub>、CN、COOH、COOR<sub>2e</sub>、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R<sub>2e</sub>、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR<sub>2e</sub>R<sub>2f</sub>およびSO<sub>2</sub>NR<sub>2e</sub>R<sub>2f</sub>から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR<sub>2e</sub>およびR<sub>2f</sub>は独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、若しくはR<sub>2e</sub>およびR<sub>2f</sub>と一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0118】

環Aはアリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリル部分から選択され、そのそれぞれをハロゲン、C<sub>1-6</sub>アルキル、ヒドロキシル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、Ra、C<sub>1-10</sub>アルキル、OH、ORa、OCORa、SH、SRa、SCORa、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHRa、NRaRb、CORa、CSRa、CN、COOH、COORa、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHORa、SO<sub>2</sub>Ra、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONRaRbおよびSO<sub>2</sub>NRaRbから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のRaおよびRbは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはRaおよびRbと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0119】

ここで環AがC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>1-10</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基で置換されるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、Rc、C<sub>1-10</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、OH、ORc、OCORc、SH、SRc、SCORc、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHRc、NRcRd、CORc、CSRc、CN、COOH、COORc、CONH<sub>2</sub>

10

20

30

40

50



、 $\text{SO}_2\text{Rc}$ 、 $\text{SO}_3\text{H}$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $\text{CONRcRd}$ および $\text{SO}_2\text{NRcRd}$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のRcおよびRdは独立して $\text{C}_{1-6}$ アルキル、置換 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $\text{C}_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはRcおよびRdと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

#### 【0120】

VはN、CHまたはC-R3とすることができ、ここでR3はハロゲン、 $\text{C}_{1-10}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $\text{C}_{3-8}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R3a、OH、OR3a、SH、SR3a、OCOR3a、SCOR3a、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{NO}_2$ 、NHR3a、NR3aR3b、COR3a、CSR3a、CN、COOH、COOR3a、CONH<sub>2</sub>、 $\text{SO}_2\text{R3a}$ 、 $\text{SO}_3\text{H}$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、CONR3aR3bまたは $\text{SO}_2\text{NR3aR3b}$ であり、式中のR3aおよびR3bは独立して $\text{C}_{1-6}$ アルキル、置換 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $\text{C}_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR3aおよびR3bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

10

#### 【0121】

ここでR3が $\text{C}_{1-10}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{3-8}$ シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R3c、 $\text{C}_{1-10}$ アルキル、OH、OR3c、OCOR3c、SH、SR3c、SCOR3c、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{NO}_2$ 、NHR3c、NR3cR3d、COR3c、CSR3c、CN、COOH、COOR3c、CONH<sub>2</sub>、 $\text{SO}_2\text{R3c}$ 、 $\text{SO}_3\text{H}$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、CONR3cR3dおよび $\text{SO}_2\text{NR3cR3d}$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR3cおよびR3dは独立して $\text{C}_{1-6}$ アルキル、置換 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $\text{C}_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR3cおよびR3dと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

20

#### 【0122】

ここでR3の置換基が $\text{C}_{1-10}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{3-8}$ シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、R3e、 $\text{C}_{1-10}$ アルキル、OH、OR3e、OCOR3e、SH、SR3e、SCOR3e、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{NO}_2$ 、NHR3e、NR3eR3f、COR3e、CSR3e、CN、COOH、COOR3e、CONH<sub>2</sub>、 $\text{SO}_2\text{R3e}$ 、 $\text{SO}_3\text{H}$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、CONR3eR3fおよび $\text{SO}_2\text{NR3eR3f}$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR3eおよびR3fは独立して $\text{C}_{1-6}$ アルキル、置換 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $\text{C}_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR3eおよびR3fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

30

#### 【0123】

WはN、CHまたはC-R4とすることができ、ここでR4はハロゲン、 $\text{C}_{1-10}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $\text{C}_{3-8}$ シクロアルキル、R4a、OH、OR4a、SH、SR4a、OCOR4a、SCOR4a、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{NO}_2$ 、NHR4a、NR4aR4b、COR4a、CSR4a、CN、COOH、COOR4a、CONH<sub>2</sub>、 $\text{SO}_2\text{R4a}$ 、 $\text{SO}_3\text{H}$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、CONR4aR4bまたは $\text{SO}_2\text{NR4aR4b}$ であり、式中のR4aおよびR4bは独立して $\text{C}_{1-6}$ アルキル、置換 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $\text{C}_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR4aおよびR4bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

40

#### 【0124】

ここでR4が $\text{C}_{1-10}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{3-8}$ シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分

50

のそれぞれをハロゲン、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$  アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $R_{4c}$ 、 $C_{1-10}$  アルキル、OH、 $OR_{4c}$ 、 $OCOR_{4c}$ 、SH、 $SR_{4c}$ 、 $SCOR_{4c}$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR_{4c}$ 、 $NR_{4c}R_{4d}$ 、 $COR_{4c}$ 、 $CSR_{4c}$ 、CN、COOH、 $COOR_{4c}$ 、 $CONH_2$ 、 $SO_2R_{4c}$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $CONR_{4c}R_{4d}$ および $SO_2NR_{4c}R_{4d}$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中の $R_{4c}$ および $R_{4d}$ は独立して $C_{1-6}$  アルキル、置換 $C_{1-6}$  アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$  シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、または $R_{4c}$ および $R_{4d}$ と一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0125】

ここで $R_4$ の置換基が $C_{1-10}$  アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$  アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-8}$  シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれを $R_{4e}$ 、 $C_{1-10}$  アルキル、OH、 $OR_{4e}$ 、 $OCOR_{4e}$ 、SH、 $SR_{4e}$ 、 $SCOR_{4e}$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR_{4e}$ 、 $NR_{4e}R_{4f}$ 、 $COR_{4e}$ 、 $CSR_{4e}$ 、CN、COOH、 $COOR_{4e}$ 、 $CONH_2$ 、 $SO_2R_{4e}$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $CONR_{4e}R_{4f}$ および $SO_2NR_{4e}R_{4f}$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中の $R_{4e}$ および $R_{4f}$ は独立して $C_{1-6}$  アルキル、置換 $C_{1-6}$  アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$  シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、または $R_{4e}$ および $R_{4f}$ と一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0126】

$R_5$ はH、 $C_{1-6}$  アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $C_{1-6}$  アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $R_{5a}$ 、ハロゲン、OH、 $OR_{5a}$ 、SH、 $SR_{5a}$ 、 $OCOR_{5a}$ 、 $SCOR_{5a}$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR_{5a}$ 、 $NR_{5a}R_{5b}$ 、 $COR_{5a}$ 、 $CSR_{5a}$ 、CN、COOH、 $COOR_{5a}$ 、 $CONH_2$ 、 $SO_2R_{5a}$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $CONR_{5a}R_{5b}$ および $SO_2NR_{5a}R_{5b}$ から選択され、式中の $R_{5a}$ および $R_{5b}$ は独立して $C_{1-6}$  アルキル、置換 $C_{1-6}$  アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$  シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、または $R_{5a}$ および $R_{5b}$ と一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0127】

ここで $R_5$ が $C_{1-6}$  アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$  アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-8}$  シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$  アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $R_{5c}$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、OH、 $OR_{5c}$ 、 $OCOR_{5c}$ 、SH、 $SR_{5c}$ 、 $SCOR_{5c}$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR_{5c}$ 、 $NR_{5c}R_{5d}$ 、 $COR_{5c}$ 、 $CSR_{5c}$ 、CN、COOH、 $COOR_{5c}$ 、 $CONH_2$ 、 $SO_2R_{5c}$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $CONR_{5c}R_{5d}$ および $SO_2NR_{5c}R_{5d}$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中の $R_{5c}$ および $R_{5d}$ は独立して $C_{1-6}$  アルキル、置換 $C_{1-6}$  アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$  シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、または $R_{5c}$ および $R_{5d}$ と一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0128】

ここで $R_5$ の置換基が $C_{1-6}$  アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$  アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $C_{3-8}$  シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれを $R_{5e}$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、OH、 $OR_{5e}$ 、 $OCOR_{5e}$ 、SH、 $SR_{5e}$ 、 $SCOR_{5e}$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR_{5e}$ 、 $NR_{5e}R_{5f}$ 、 $COR_{5e}$ 、 $CSR_{5e}$ 、CN、COOH、 $COOR_{5e}$ 、 $CONH_2$ 、 $SO_2R_{5e}$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $CONR_{5e}R_{5f}$ および $SO_2NR_{5e}R_{5f}$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中の $R_{5e}$ および $R_{5f}$ は独立して $C_{1-6}$  アルキル、置換 $C_{1-6}$  アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$  シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、または $R_{5e}$ および $R_{5f}$ と一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0129】

10

20

30

40

50

XはN、CHまたはC-R6とすることができ、ここでR6はC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R6a、ハロゲン、OH、OR6a、SH、SR6a、OCOR6a、SCOR6a、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR6a、NR6aR6b、COR6a、CSR6a、CN、COOH、COOR6a、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R6a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR6aR6bおよびSO<sub>2</sub>NR6aR6bから選択され、式中のR6eおよびR6fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR6eおよびR6fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0130】

ここでR6がヘテロアリールまたはヘテロシクリルであるとき、これら部分のそれぞれを1つ以上の酸素原子で任意に置換してもよく、R6がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、R6c、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルキニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、OH、OR6c、OCOR6c、SH、SR6c、SCOR6c、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR6c、NR6cR6d、COR6c、CSR6c、CN、COOH、COOR6c、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、C(NOH)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R6c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR6cR6dおよびSO<sub>2</sub>NR6cR6dから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR6cおよびR6dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR6cおよびR6dと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0131】

ここでR6の置換基がヘテロアリールまたはヘテロシクリルであるとき、これら部分のそれぞれを1つ以上の酸素原子で任意に置換してもよく、R6の置換基がC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルキニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、R6e、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、OH、OR6e、OCOR6e、SH、SR6e、SCOR6e、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR6e、NR6eR6f、COR6e、CSR6e、CN、COOH、COOR6e、CONH<sub>2</sub>、C(NOH)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R6e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR6eR6fおよびSO<sub>2</sub>NR6eR6fから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR6eおよびR6fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR6eおよびR6fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0132】

YはN、CHまたはC-R7とすることができ、ここでR7はC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R7a、ハロゲン、OH、OR7a、SH、SR7a、OCOR7a、SCOR7a、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR7a、NR7aR7b、COR7a、CSR7a、CN、COOH、COOR7a、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R7a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR7aR7bおよびSO<sub>2</sub>NR7aR7bから選択され、式中のR7aおよびR7bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR7aおよびR7bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0133】

ここでR7がヘテロアリールまたはヘテロシクリルであるとき、これら部分のそれぞれを1つ以上の酸素原子で任意に置換してもよく、R7がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリ

10

20

30

40

50

ール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、 $R7c$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキニル、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリーール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリーール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、アリーール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロアリーール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルコキシ、OH、 $OR7c$ 、 $OCOR7c$ 、SH、 $SR7c$ 、 $SCOR7c$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR7c$ 、 $NR7cR7d$ 、 $COR7c$ 、 $CSR7c$ 、CN、 $COOH$ 、 $COOR7c$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHOH$ 、 $C(NO_2)NH_2$ 、 $SO_2R7c$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $CONR7cR7d$ および $SO_2NR7cR7d$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中の $R7c$ および $R7d$ は独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、または $R7c$ および $R7d$ が一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

10

#### 【0134】

ここで $R7$ の置換基がヘテロアリーールまたはヘテロシクリルであるとき、これら部分のそれぞれを1つ以上の酸素原子で任意に置換してもよく、 $R7$ の置換基が $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキニル、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリーール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリーール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、アリーール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロアリーール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル、アリーール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリーール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $R7e$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、OH、 $OR7e$ 、 $OCOR7e$ 、SH、 $SR7e$ 、 $SCOR7e$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR7e$ 、 $NR7eR7f$ 、 $COR7e$ 、 $CSR7e$ 、CN、 $COOH$ 、 $COOR7e$ 、 $CONH_2$ 、 $C(NO_2)NH_2$ 、 $SO_2R7e$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $CONR7eR7f$ および $SO_2NR7eR7f$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中の $R7e$ および $R7f$ は独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、または $R7e$ および $R7f$ が一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

20

#### 【0135】

ZはN、CHまたはC- $R8$ とすることができ、ここで $R8$ は $C_{1-10}$ アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $R8a$ 、ハロゲン、OH、 $OR8a$ 、SH、 $SR8a$ 、 $OCOR8a$ 、 $SCOR8a$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR8a$ 、 $NR8aR8b$ 、 $COR8a$ 、 $CSR8a$ 、CN、 $COOH$ 、 $COOR8a$ 、 $CONH_2$ 、 $SO_2R8a$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $CONR8aR8b$ および $SO_2NR8aR8b$ から選択され、式中の $R8a$ および $R8b$ は独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、または $R8a$ および $R8b$ が一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

30

#### 【0136】

ここで $R8$ が $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-10}$ アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、 $R8c$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリーール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリーール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、アリーール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロアリーール $C_{1-6}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルコキシ、OH、 $OR8c$ 、 $OCOR8c$ 、SH、 $SR8c$ 、 $SCOR8c$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR8c$ 、 $NR8cR8d$ 、 $COR8c$ 、 $CSR8c$ 、CN、 $COOH$ 、 $COOR8c$ 、 $CONH_2$ 、 $SO_2R8c$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $CONR8cR8d$ および $SO_2NR8cR8d$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中の $R8c$ および $R8d$ は独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリル

40

50

ルから選択されるか、またはR8cおよびR8dと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【 0 1 3 7 】

ここでR8の置換基がC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシ、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、R8e、C<sub>1-6</sub>アルキル、OH、OR8e、OCOR8e、SH、SR8e、SCOR8e、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR8e、NR8eR8f、COR8e、CSR8e、CN、COOH、COOR8e、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R8e、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR8eR8fおよびSO<sub>2</sub>NR8eR8fから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR8eおよびR8fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR8eおよびR8fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ；

【 0 1 3 8 】

ここでX、YおよびZで示される原子または基の多くとも2つはNとすることができ、

【 0 1 3 9 】

ここでWがNであるとき、CONR1R2基をWに結合してもよく、それに応じて式 I 中の二重結合が再配置され、

【 0 1 4 0 】

ただし、R1およびR2と一緒に式 I を有する化合物にピペリジニルを形成する場合、かかるピペリジニルはメチル、ジメチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、メトキシカルボニル、トリフルオロメチル、クロロ、プロモまたはベンジルでは置換されず、

【 0 1 4 1 】

ただし、R1とR2と一緒に式 I を有する化合物に6,7-ジメトキシ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、6-メトキシ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、7-メトキシ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、7-アミノ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、7-ニトロ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル、3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-1-イル、3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル、ピロリジン-1-イル、3,6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル、8-アザ-スピロ[4.5]デシ-8-イル、1,3-ジヒドロイソインドール-2-イル、オクタヒドロイソインドール-2-イル、1,2,6-トリアザ-スピロ[2.5]オクテ-1-エン-6-イルまたはアゼパン-1-イルを形成せず、また

【 0 1 4 2 】

ただし、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともにピペリジニル、ピペラジニル、置換ピペリジニルまたは置換ピペラジニルを形成するとき、式 I を有する化合物中の環Aはピリジン、ピリミジン、置換ピリジンまたは置換ピリミジンを形成しない]を有する化合物、

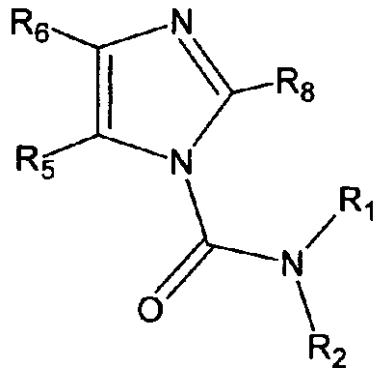
【 0 1 4 3 】

または、その薬学的に許容し得る塩若しくはエステルを提供する。

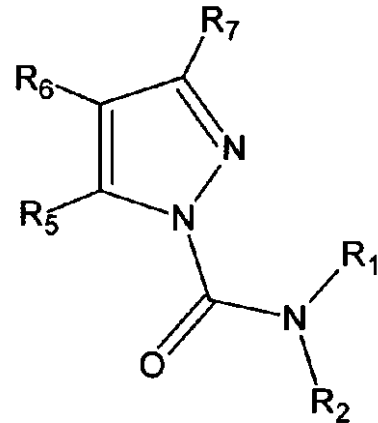
【 0 1 4 4 】

好ましくは、本発明の化合物は式 I、式 I I a、式 I I b、式 I I c および式 I I d から選択した式を有する。

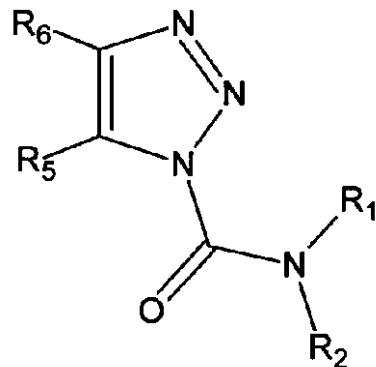
## 【化5】



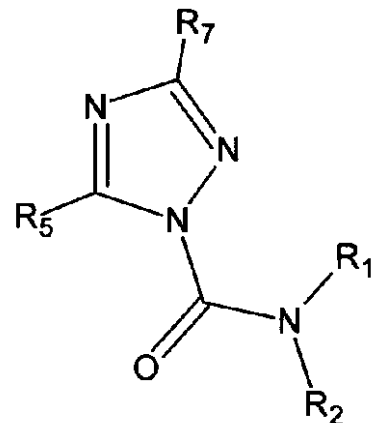
式II a



式II b



式II c

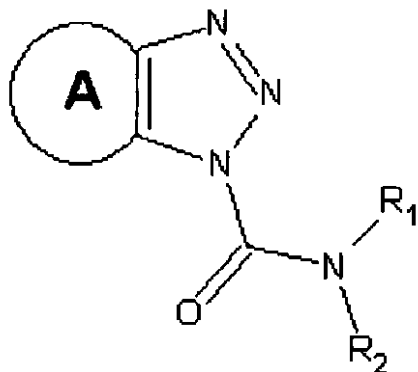


式II d

## 【0145】

より好ましくは、本発明の化合物は式I a、式II a、式II b、式II cおよび式I dから選択した式を有する。

## 【化6】



式I a

## 【0146】

本発明のある実施形態において、R1は、好ましくはHおよびC<sub>1-4</sub>アルキルから選択される。より好ましくは、R1はHおよびC<sub>1-3</sub>アルキルから選択され、さらにより好ましくは、R1はH、メチルおよびエチルから選択され、最も好ましくは、R1は、Hおよびメチルから選

10

20

30

40

50

択される。

【 0 1 4 7 】

R2は、好ましくはそれぞれ置換または非置換とし得るC<sub>1-4</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキルから選択される。好ましくは、かかるアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキル（アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキルを含む）は6員の単環構造を有する。より好ましくは、かかるアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキル（アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキルを含む）はフェニル、シクロヘキシル、フェニルC<sub>1-6</sub>アルキルおよびシクロヘキシルC<sub>1-6</sub>アルキルから選択され、そのそれぞれは置換または非置換とすることができる。好ましくは、かかるアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキルのそれぞれのC<sub>1-6</sub>アルキルは直鎖のアルキルである。

10

【 0 1 4 8 】

または、R2はアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキルおよびヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルから選択することができ、そのそれぞれは置換であっても非置換であってもよく、ここにかかるアリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリル（アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキルおよびヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルを含む）は二環構造を有し、好ましくは10員の二環構造を有する。より好ましくは、R2はナフタレニルおよびナフタレニルC<sub>1-6</sub>アルキルから選択される。

20

【 0 1 4 9 】

R2のかかるアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキル基（アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキルを含む）のそれぞれを1つ以上のハロゲンで置換することができる。

【 0 1 5 0 】

或いは、かかるアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキル基（アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキルを含む）のそれぞれをC<sub>1-4</sub>アルコキシまたはアリールオキシで置換することができる。好ましくは、かかるC<sub>1-4</sub>アルコキシはメトキシまたはエトキシである。好ましくは、かかるアリールオキシは単環式のアリールオキシであり、より好ましくは、フェノキシである。

30

【 0 1 5 1 】

好ましい実施形態において、R1はそれぞれ置換または非置換とし得るHおよびC<sub>1-4</sub>アルキルから選択され、R2はそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキルから選択される。より好ましくは、R1はそれぞれ置換または非置換とし得るH、メチルおよびエチルから選択され、R2はそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルから選択される。より好ましくは、R1はメチルである。より好ましくは、R2はアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>5-8</sub>シクロアルキルから選択され、そのそれぞれは単環式であり、および置換または非置換とし得る。さらにより好ましくは、R2は飽和ヘテロシクリルおよびC<sub>5-8</sub>シクロアルキルから選択され、そのそれぞれは単環式であり、および置換または非置換とし得る。R2が単環式のC<sub>5-8</sub>シクロアルキルであるとき、それは、好ましくは非置換である。好ましくは、R2は非置換シクロヘキシルのようなシクロヘキシルである。R2が単環式の飽和ヘテロシクリルであるとき、かかるヘテロシクリルの環は、好ましくは単一のヘテロ原子を含有する。好ま

40

50

しくは、かかるヘテロ原子は窒素または酸素原子である。より好ましくは、かかるヘテロシクリルはピペリジニルまたはテトラヒドロピラニル基のような6員環である。もしヘテロ原子が酸素原子であれば、かかるヘテロシクリルは、好ましくは非置換である。もしヘテロ原子が窒素原子であれば、かかる窒素ヘテロ原子は置換または非置換とし得る。もしかかる窒素ヘテロ原子が置換されれば、それは好ましくはそれぞれ置換または非置換とし得る $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-10}$ シクロアルキル、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキルおよび $C_{3-10}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキルから選択した基で置換される。より好ましくは、かかる窒素ヘテロ原子は $C_{1-6}$ アルキル、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキルおよび $C_{3-10}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキルから選択した基で置換される。より好ましくは、かかる窒素ヘテロ原子はアリール $C_{1-6}$ アルキルおよびヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキルから選択した基で置換され、ここでかかるアリールおよびヘテロアリールは単環式であり、好ましくは6員環である。好ましくは、かかる窒素ヘテロ原子はフェニル $C_{1-2}$ アルキルおよびピリジル $C_{1-2}$ アルキルから選択した基で置換される。好ましくは、かかるヘテロシクリル基中のヘテロ原子はかかるヘテロシクリル基R2の尿素窒素への結合位置に対し4位にある。R1およびR2が、この段落に定義された通りであるとき、かかる化合物は好ましくは式ⅠⅠaを有する。好ましくは、R1およびR2がこの段落に定義された通りであるとき、R6は置換または非置換アリールまたはヘテロアリールであり、好ましくは置換または非置換で単環式のアリールまたはヘテロアリールである。かかる単環式のアリールまたはヘテロアリールは、好ましくは6員環である。ある実施形態において、R6は置換または非置換アリール（フェニルなど）であり、好ましくは非置換である。別の実施形態において、R6は置換または非置換ヘテロアリールであり、好ましくは置換または非置換ピリジルである。ある実施形態において、かかるヘテロアリールは酸素で置換される。例えば、酸化のためにピリジルの窒素ヘテロ原子が酸素原子で置換され、すなわちN-酸化物が形成されてもよい。

#### 【0152】

前の段落におけるR1およびR2の選択性をもった化合物は、FAAHに対して比較的高い特異性を示すことが見出された。さらに、R2がピペリジニルまたはテトラヒドロピラニルのようなヘテロシクリルである化合物は、比較的、代謝的に安定であることが見出された。

#### 【0153】

別の実施形態において、R2は、好ましくは $C_{2-20}$ アルキルである。より好ましくは、R2は $C_{3-16}$ アルキルであり、さらにより好ましくは、R2は $C_{4-12}$ アルキルである。好ましくは、かかるアルキルは直鎖のアルキルである。

#### 【0154】

好ましい実施形態において、R1はHおよび $C_{1-4}$ アルキルから選択され、R2は $C_{2-20}$ アルキルである。

#### 【0155】

いくつかの実施形態において、R1が、H若しくは $C_{1-4}$ アルキルであり；H若しくは $C_{1-3}$ アルキルであり；H、メチル若しくはエチルであり；H若しくはメチルであり；または、メチルであるとき、R2は $C_{1-6}$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、一部または完全飽和ヘテロシクリル、 $C_{3-10}$ シクロアルキル、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-10}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキル、ハロゲン、OH、OR1a、OCOR1a、SH、SR1a、SCOR1a、 $NH_2$ 、NHR1a、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R1a$ 、NR1aCOR1b、NHCOR1a、NR1aR1b、COR1a、CSR1a、CN、COOH、COOR1a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR1a、CONHOR1a、 $SO_2R1a$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、CONR1aR1bおよび $SO_2NR1aR1b$ から選択することができ、式中のR1aおよびR1bは独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR1aおよびR1bが一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、ここでR2は、置換または非置換とすることができ、

#### 【0156】



或いは、別の実施形態において、R1が、HおよびC<sub>1-4</sub>アルキルであり；HおよびC<sub>1-3</sub>アルキルであり；H、メチルおよびエチルであり；Hおよびメチルであり；または、メチルであるとき、R2はアリール、ヘテロアリール、一部または完全飽和ヘテロシクリル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキルから選択することができ、ここでR2は置換または非置換とすることができる。

【0157】

好ましい実施形態において、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともに置換または非置換とし得るヘテロシクリル基を形成する。好ましくは、かかるヘテロシクリルは5または6員の単環であり、より好ましくは5員の単環である。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルは1つまたは2つ、好ましくは1つの追加ヘテロ原子（すなわち、Nに加えて）を含有する。これらの追加ヘテロ原子は、例えばN、Oおよび/またはSであってもよい。好ましくは、かかるヘテロシクリルはオキサゾリジニルである。好ましくは、かかるオキサゾリジニル中の酸素原子は尿素窒素に対し3位にある。好ましくは、かかるオキサゾリジニルは1つ、2つまたは3つのメチルまたはエチル基で置換される。より好ましくは、かかるオキサゾリジニルは2つのメチルまたはエチル基で置換される。さらにより好ましくは、かかるオキサゾリジニルは同じ炭素原子上で2つのメチル基で置換される。より好ましくは、かかるオキサゾリジニルは4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イルである。R1およびR2がこの段落に定義された通りであるとき、かかる化合物は、好ましくは式I aまたはI I aを有する。好ましくは、R1およびR2が、この段落に定義された通りであり、かかる化合物が式I I aを有するとき、R6は置換または非置換アリールであり、より好ましくはフェニルである。R1およびR2がこの段落に定義された通りであり、かかる化合物が式I aを有するとき、環Aは、好ましくは非置換または置換ベンゾ部分である。

【0158】

前の段落に定義されるR1およびR2を有する化合物は、比較的強力なFAAHの阻害剤であることが見出された。また、それらは、比較的高い特異性を示すことも見出された。

【0159】

別の実施形態において、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともに置換または非置換ヘテロシクリル基を形成することができる。好ましくは、かかるヘテロシクリルは、5または6員の単環であり、より好ましくは、6員の単環である。好ましくは、R1およびR2は、モルホリノ、ピペラジニル、オキサゾリジニル、ピロリジニルまたはピペリジニルとともに形成する。より好ましくは、R1およびR2は、モルホリノまたはピペラジニルとともに形成する。

【0160】

好ましくは、R1およびR2のヘテロシクリルはC<sub>1-4</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールC<sub>1-6</sub>アルコキシまたはヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルコキシとともに置換され、そのそれぞれを1つ以上のハロゲンまたはC<sub>1-4</sub>アルキル基で任意に置換してもよい。好ましくは、置換基のアリール、ヘテロアリールまたはC<sub>3-8</sub>シクロアルキルは、5または6員の単環である。より好ましくは、R1およびR2のヘテロシクリルはアリール、アリールC<sub>1-6</sub>アルキルまたはアリールオキシとともに置換され、そのそれぞれを1つ以上のハロゲンで任意に置換してもよい。さらにより好ましくは、フェニル、フェニルC<sub>1-6</sub>アルキルまたはフェノキシとともに置換され、そのそれぞれを1つ以上のハロゲンで任意に置換してもよい。

【0161】

或いは、R1およびR2のヘテロシクリルは、ヘテロアリールまたはヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキルとともに置換されてもよい。ある実施形態において、かかるヘテロアリールは、例えばベンゾジオキソリルメチルのような二環構造を有する。または、かかるヘテロアリールは、例えばピリジルなどの単環式であってもよい。

【0162】

別の代替形態においては、R1およびR2のヘテロシクリルは $C_{3-8}$ シクロアルキルとともに置換されてもよい。好ましくは、かかる $C_{3-8}$ シクロアルキルはシクロヘキシルのような単環式のシクロアルキルである。

#### 【0163】

ある実施形態において、R1およびR2のヘテロシクリルは、ともに1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカン-8-イル、ジメチルオキサゾリジニル、メチルピペラジニル、ベンジルオキシフェニルピペラジニル、トリルオキシピペリジニル、ピロリジニル $C_{1-4}$ アルキル、(コンマがあると想定)ピペリジニル、ピリジルピペリジニル、ピリジルオキサジアゾール-5-イルピペリジニルまたはベンジルオキシピペリジニルとすることができる。

#### 【0164】

ある実施形態において、R1およびR2のヘテロシクリルは、ともにフェノキシまたはフェニル $C_{1-4}$ アルキルで置換されるピペリジニルであり、ここにかかるフェニルは任意にハロゲンで置換されてもよい。

#### 【0165】

本発明のある実施形態において、VがC-R3であるとき、R3はHまたはハロゲンである。

#### 【0166】

本発明の別の実施形態において、WがC-R4であるとき、R4はHおよびアリールから選択される。好ましくは、R4はHおよびフェニルから選択される。より好ましくは、R4はHである。

#### 【0167】

本発明による化合物において、環Aは、好ましくは置換または非置換で単環式のアリールまたはヘテロアリール部分であり、より好ましくは単環式のアリール部分である。好ましくは、環Aは置換または非置換ベンゾ部分である。環Aの単環式のアリールが置換される場合、かかる置換基はハロゲン、シアノ、カルボン酸またはアミドのうちの1つ以上で任意に置換することができる、1つ以上のハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキルまたはアリールである。好ましくは、置換基のアリールは単環式のアリールであり、より好ましくはフェニルである。好ましい実施形態において、この段落に定義された通りの環Aを有する化合物は式I aを有する。

#### 【0168】

ある実施形態において、環Aは $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキルおよび $C_{0-6}$ アルキル-CO- $C_{0-6}$ アルキルから選択した部分で置換され、ここにかかる $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキルまたは $C_{0-6}$ アルキル-CO- $C_{0-6}$ アルキルはアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{3-10}$ シクロアルキルから選択した部分で置換され、ここでこれら部分のそれぞれをアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-10}$ シクロアルキル、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキルまたは $C_{3-10}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキルで任意に置換してもよい。好ましくは、環Aは $C_{0-6}$ アルキル-CO- $C_{0-6}$ アルキルで置換され、ここにかかる $C_{0-6}$ アルキル-CO- $C_{0-6}$ アルキルはアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{3-10}$ シクロアルキルから選択した部分で置換され、ここでこれら部分のそれぞれをアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-10}$ シクロアルキル、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキルまたは $C_{3-10}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキルで任意に置換してもよい。好ましくは、環Aはカルボニル部分(すなわち、 $C_0$ アルキル-CO- $C_0$ アルキル)で置換される。好ましくは、かかる $C_0$ アルキル-CO- $C_0$ アルキルはヘテロシクリルで置換され、より好ましくは単環式のヘテロシクリルで置換され、かかるヘテロシクリルは、さらにより好ましくは1つまたは2つの窒素ヘテロ原子を有するヘテロシクリルであり、なおより好ましくは6員のヘテロシクリルであり、最も好ましくはピペラジンである。好ましくは、かかる $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキルまたは $C_{0-6}$ アルキル-CO- $C_{0-6}$ アルキルは直鎖である。好ましくは、この段落に定義された通りの化合物は式I aを有する。

#### 【0169】

別の実施形態において、環 A はハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、OH、ORa、OCORa、SH、SRa、SCORa、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、NHRa、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2Ra$ 、NRaCORb、NHCORa、NHC(NH) $NH_2$ 、NRaRb、CORa、CSRa、CN、COOH、COORa、CONH $_2$ 、CONHRA、CONHOH、CONHORA、C(NOH) $NH_2$ 、CONRaRb、 $SO_2Ra$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ および $SO_2NRaRb$ から選択した 1 つ以上の基で置換され、式中のRaおよびRbは $C_{1-6}$ アルキルである。好ましくは、環Aはハロゲン、OH、SH、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、NHC(NH) $NH_2$ 、CN、COOH、CONH $_2$ 、CONHOH、C(NOH) $NH_2$ 、 $SO_3H$ および $SO_2NH_2$ から選択した 1 つ以上の基で置換される。好ましくは、この段落に定義された通りの化合物は式 I a を有する。

【0170】

好ましくは、本発明の化合物において、R5はHまたはハロゲンであり、より好ましくは、R5はHである。

10

【0171】

ある実施形態において、R5と一緒にこれを結合する環炭素とともにカルボニル基を形成しない。かかる化合物は前述の式 I I を有する。

【0172】

別の実施形態において、XはOではない。かかる化合物は前述の式 I I を有する。

【0173】

式 I I を有する化合物において、XがC-R6であるとき、R6は、好ましくは置換または非置換アリールである。好ましくは、かかるアリールR6はフェニルまたはナフタレニルである。より好ましくは、かかるアリールR6はフェニルである。好ましくは、かかるアリールR6は、それぞれ置換または非置換とし得るハロゲン、 $C_{1-4}$ アルコキシ、ヒドロキシル、アミド、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびアリールオキシから選択した 1 つ以上の基で置換される。好ましくは、R6のアリール置換基は置換または非置換とし得るフェニルである。R6がこの段落に定義された通りであるとき、式 I I の化合物は、好ましくはイミダゾールである（すなわち、XはCHまたはC-R6であり、YはNであり、およびZはCHまたはC-R8である）か、1,2,3-トリアゾールである（すなわち、XはCHまたはC-R6であり、YはNであり、およびZはNである）。より好ましくは、本化合物は式 I I a を有する。

20

【0174】

或いは、R6は、好ましくはH、ハロゲンまたはアリールであり、より好ましくはHである。R6がこの段落に定義された通りであるとき、式 I I の化合物は、好ましくはピラゾールである（すなわち、XはCHまたはC-R6であり、YはCHまたはC-R7であり、およびZはNである）。

30

【0175】

本発明のある実施形態において、YがC-R7であるとき、R7はアリールおよびヘテロアリールから選択され、そのそれぞれを置換または非置換とすることができる。好ましくは、かかるアリールおよびヘテロアリールは単環式である。好ましくは、かかるアリールまたはヘテロアリールは 1 つ以上のハロゲンで置換される。本発明の好ましい実施形態において、R7は置換または非置換アリールである。R7がこの段落に定義された通りであるとき、式 I I の化合物は、好ましくはピラゾールである（すなわち、XはCHまたはC-R6であり、YはCHまたはC-R7であり、およびZはNである）か、1,2,4-トリアゾールである（すなわち、XはNであり、YはCHまたはC-R7であり、ZはNである）。

40

【0176】

ある実施形態において、YがC-R7であるとき、R7はHである。

【0177】

本発明の別の実施形態において、ZがC-R8であるとき、R8はHおよびアリールから選択される。好ましくは、R8はHおよびフェニルから選択される。より好ましくは、R8はHである。

【0178】

本発明のある実施形態において、R6はアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよ

50

び $C_{3-10}$ シクロアルキルから選択した基であり、ここにかかる $R_6$ の基は $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキルおよび $C_{0-6}$ アルキル- $CO$ - $C_{0-6}$ アルキルから選択した基で置換され、ここにかかる $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキルまたは $C_{0-6}$ アルキル- $CO$ - $C_{0-6}$ アルキル基はアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{3-10}$ シクロアルキルから選択した基で置換される。好ましくは、 $R_6$ はアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{3-10}$ シクロアルキルから選択した基であり、ここにかかる $R_6$ の基は $C_{1-6}$ アルコキシおよび $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキルから選択した基で置換され、ここにかかる $C_{1-6}$ アルコキシまたは $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキルはヘテロシクリルで置換される。より好ましくは、 $R_6$ は $C_{1-6}$ アルコキシおよび $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキルから選択した基で置換されるアリールであり、ここにかかる $C_{1-6}$ アルコキシまたは $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキル基はヘテロシクリルで置換される。さらにより好ましくは、 $R_6$ は $C_{1-6}$ アルコキシで置換されるアリールであり、ここにかかる $C_{1-6}$ アルコキシはヘテロシクリルで置換される。

10

【0179】

好ましくは、 $R_6$ はアリールである。好ましくは、 $R_6$ は単環式のアリールのような単環構造を有する。ある実施形態において、 $R_6$ はフェニルのような6員環構造を有する。

【0180】

好ましくは、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキルまたは $C_{0-6}$ アルキル- $CO$ - $C_{0-6}$ アルキル基は直鎖である。

【0181】

好ましくは、かかる $C_{1-6}$ アルコキシまたは $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキルの置換基は単環式である。好ましくは、かかる $C_{1-6}$ アルコキシまたは $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキルの置換基は6員環である。好ましくは、かかる $C_{1-6}$ アルコキシまたは $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキルの置換基はヘテロシクリルである。好ましくは、かかるヘテロシクリルは完全飽和である。好ましくは、かかるヘテロシクリルは窒素または酸素などの1つまたは2つのヘテロ原子を含有する。好ましくは、かかるヘテロシクリルは少なくとも1つの窒素ヘテロ原子を含有する。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルはピペリジニル、ピペラジニルまたはテトラヒドロピラニルである。この実施形態において、かかる化合物は、好ましくは式IIaを有する。

20

【0182】

ある実施形態において、 $W$ が $N$ であるとき、 $CONR_1R_2$ 基を $W$ に結合しなくてもよい。この実施形態において、かかる化合物は前述の式Iを有する。

30

【0183】

(式IおよびIa)

式Iを有する化合物および、特に式Iaを有する化合物において、環Aは、好ましくは置換または非置換アリールまたはヘテロアリール部分である。より好ましくは、環Aは置換または非置換で単環式のアリールまたはヘテロアリール部分である。さらにより好ましくは、環Aは置換または非置換で6員のアリールまたはヘテロアリール部分である。より好ましくは、環Aはベンゾ部分のような置換または非置換で単環式のアリール部分である。

【0184】

環Aが置換されるとき、かかる置換基はハロゲン、OH、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、SH、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、CN、COOH、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、ベンゾキシアミノカルボニル、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{3-8}$ シクロアルキルから選択した1つ以上の基で置換されてもよい。かかる置換基が $C_{1-4}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルまたは $C_{3-8}$ シクロアルキルであるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、OH、SH、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、CN、COOH、CONH<sub>2</sub>、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-3}$ アルコキシおよびベンジルから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよい。

40

【0185】

好ましくは、環Aの置換基はハロゲン、OH、 $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-3}$ アルコキシ、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、CN、COOH、CONH<sub>2</sub>、単環式のアリール、単環式のヘテロアリール、単環式のヘテロシクリルおよび $C_{5-8}$ シクロアルキルから選択した1つ以上の基である。かかる置換基が $C_{1-3}$ ア

50

ルキル、単環式のアリール、単環式のヘテロアリール、単環式のヘテロシクリルまたは $C_{5-8}$ シクロアルキルであるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、CN、COOH、CONH<sub>2</sub>および $C_{1-3}$ アルコキシから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよい。

【0186】

より好ましくは、環Aの置換基はハロゲン、OH、 $C_{1-2}$ アルキル、 $C_{1-2}$ アルコキシおよびフェニルから選択した1つ以上の基である。かかる置換基が $C_{1-2}$ アルキルまたはフェニルであるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、CN、COOH、CONH<sub>2</sub>および $C_{1-3}$ アルコキシから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよい。

【0187】

式Iを有する化合物および、特に式Iaを有する化合物の好ましい実施形態において、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともに置換または非置換とし得るヘテロシクリル基を形成する。好ましくは、かかるヘテロシクリルは5または6員の単環であり、より好ましくは6員の単環である。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルは1つまたは2つ、好ましくは1つの追加ヘテロ原子（すなわち、Nに加えて）を含有する。これらの追加ヘテロ原子は、例えばN、Oおよび/またはSであってもよい。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルはモルホリノである。別の実施形態において、かかるヘテロシクリルはピペラジニルである。別の実施形態において、かかるヘテロシクリルは追加ヘテロ原子を含有しない（すなわち、単一のN原子を含有する）。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルはピペリジニルである。かかるヘテロシクリルが置換される場合、それは、好ましくはアリールまたはアリール $C_{1-4}$ アルキルで置換され、ここでかかるアリールは、好ましくは単環式であり、より好ましくはフェニルである。かかるアルキルは、好ましくは直鎖である。より好ましくは、かかるヘテロシクリルはアリールまたはアリール $C_{1-2}$ アルキルで置換され、ここでかかるアリールは、好ましくは単環式であり、より好ましくはフェニルである。

【0188】

式Iを有する化合物および、特に式Iaを有する化合物の好ましい実施形態において、R1はそれぞれ置換または非置換とし得るHおよび $C_{1-4}$ アルキルから選択され、R2はそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-10}$ シクロアルキル、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキルおよび $C_{3-10}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキルから選択される。ある実施形態において、R1はH、メチルおよびエチルから選択され、R2はアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{5-8}$ シクロアルキルから選択され、そのそれぞれは単環式であり、および置換または非置換とし得る。より好ましくは、R1はHおよびメチルから選択される。ある実施形態において、R1はメチルである。別の実施形態において、R1はHである。より好ましくは、R2は飽和ヘテロシクリルおよび $C_{5-8}$ シクロアルキルから選択され、そのそれぞれは単環式であり、および置換または非置換とし得る。R2が単環式の $C_{5-8}$ シクロアルキルであるとき、それは好ましくは置換されない。好ましくは、R2はシクロペンチルまたはシクロヘキシルである。より好ましくは、R2は非置換シクロヘキシルのようなシクロヘキシルである。R2が単環式の飽和ヘテロシクリルであるとき、かかるヘテロシクリルの環は、好ましくは単一のヘテロ原子を含有する。より好ましくは、かかるヘテロシクリルはピペリジニルまたはテトラヒドロピラニル基のような6員環である。窒素のヘテロ原子は置換または非置換とし得る。

【0189】

別の実施形態において、R1はそれぞれ置換または非置換とし得るH、メチルおよびエチルから選択され、R2はそれぞれ置換または非置換とし得るアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキルおよび $C_{5-8}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキルから選択される。より好ましくは、R2はアリール $C_{1-6}$ アルキルであり、かかるアリールは単環式であり、および置換または非置換とし得る。さらにより好ましくは、R2はアリール $C_{1-6}$ アルキルであり、かかるアリールは単環式であり、および置換であっても非置換であってもよく、かかる $C_{1-6}$ アルキルは直鎖である。なおより好ましくは、R2は置換また

は非置換とし得るフェニル $C_{1-6}$ アルキルであり、かかる $C_{1-6}$ アルキルは直鎖である。ある実施形態において、かかるフェニルは置換されない。

【0190】

別の実施形態において、R1はH、メチルおよびエチルから選択され、R2はアリール $C_{1-4}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-4}$ アルコキシ、ヘテロシクリル $C_{1-4}$ アルコキシおよび $C_{5-8}$ シクロアルキル $C_{1-4}$ アルコキシから選択した基で置換される $C_{1-4}$ アルキルであり、そのそれぞれは単環式であり、および置換または非置換とし得る。好ましくは、R2は置換 $C_{1-3}$ アルキルである。ある実施形態において、R2は $C_{1-2}$ アルキルである。好ましくは、R2の置換基はアリール $C_{1-4}$ アルコキシであり、かかるアリールは単環式であり、および置換または非置換とし得る。さらにより好ましくは、R2の置換基はアリール $C_{1-4}$ アルコキシであって、かかるアリールは単環式であり、および置換であっても非置換であってもよく、かかる $C_{1-4}$ アルコキシは直鎖である。なにより好ましくは、R2の置換基は置換または非置換とし得るフェニル $C_{1-4}$ アルコキシであり、かかる $C_{1-4}$ アルコキシは直鎖である。ある実施形態において、R2の置換基はアリール $C_{1-3}$ アルコキシであって、かかるアリールは単環式（例えばフェニル）であり、および置換であっても非置換であってもよく、かかる $C_{1-3}$ アルコキシは直鎖である。いくつかの実施形態において、かかるフェニルは置換されない。

10

【0191】

式Iを有する化合物および、特に式Iaを有する化合物のさらに別の実施形態において、R1はHおよび $C_{1-4}$ アルキルから選択され、R2は置換または非置換とし得るヘテロシクリルから選択される。好ましくは、R1はH、メチルまたはエチルであり、R2は置換または非置換とし得る二環式のヘテロシクリルである。より好ましくは、R1はHまたはメチルであり、R2は置換または非置換とし得る二環式のヘテロシクリルであり、ここにかかるヘテロシクリルの環の1つは2つの酸素原子をR2含有する。ある実施形態において、R2は3,3-ジメチル-1,5-ジオキサスピロ[5.5]ウンデシ-9-イルである。

20

【0192】

式Iを有する化合物および、特に式Iaを有する化合物の別の好ましい実施形態において、R1はHおよび $C_{1-4}$ アルキルから選択され、R2は $C_{2-20}$ アルキルである。より好ましくは、R1はH、メチルまたはエチルであり、さらにより好ましくは、R1はHまたはメチルである。好ましくは、R2は $C_{3-16}$ アルキルであり、ここにかかるアルキルは直鎖のアルキルである。より好ましくは、R2は $C_{4-14}$ アルキルであり、ここにかかるアルキルは直鎖のアルキルである。

30

【0193】

(式IIa)

式IIaを有する化合物の好ましい実施形態において、R1はそれぞれ置換または非置換とし得るHおよび $C_{1-4}$ アルキルから選択され、R2はそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-10}$ シクロアルキル、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキルおよび $C_{3-10}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキルから選択される。より好ましくは、R1はそれぞれ置換または非置換とし得るH、メチルおよびエチルから選択され、R2はそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{3-10}$ シクロアルキルから選択される。より好ましくは、R1はメチルである。より好ましくは、R2はアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{5-8}$ シクロアルキルから選択され、そのそれぞれは単環式であり、および置換または非置換とし得る。さらにより好ましくは、R2はフェニル、飽和ヘテロシクリルおよび $C_{5-8}$ シクロアルキルなどのアリールから選択され、そのそれぞれは単環式であり、および置換または非置換とし得る。R2が単環式の $C_{5-8}$ シクロアルキル（すなわち、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルまたはシクロオクチル）またはアリールであるとき、それは、好ましくは置換されない。好ましくは、R2は非置換シクロヘキシルのようなシクロヘキシルである。R2が単環式の飽和ヘテロシクリルであるとき、かかるヘテロシクリルの環は、好ましくは、窒素または酸素などの単一のヘテロ原子を含有する。より好ましくは、かかるヘテロシクリルはピペリジニルまたはテトラヒドロピラニル基の

40

50

ような6員環である。ある実施形態において、かかるヘテロ原子は置換または非置換とし得る窒素ヘテロ原子である。好ましくは、かかるヘテロシクリル基中のヘテロ原子は、かかるヘテロシクリル基R2の尿素窒素への結合位置に対し4位にある。ある実施形態において、かかる窒素原子は単環式のアリール（好ましくは、フェニル） $C_{1-3}$ アルキルで置換され；好ましくは、かかる窒素原子はベンジルまたはフェニルエチルで置換され；より好ましくは、かかる窒素原子はベンジルで置換される。

【0194】

式IIaを有する化合物の別の好ましい実施形態において、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともに置換または非置換とし得るヘテロシクリル基を形成する。好ましくは、かかるヘテロシクリルは5または6員の単環であり、より好ましくは5員の単環である。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルは、1つまたは2つ、好ましくは1つの追加ヘテロ原子（すなわち、Nに加えて）を含有する。これらの追加ヘテロ原子は、例えばN、Oおよび/またはSであってもよい。好ましくは、かかるヘテロシクリルはオキサゾリジニルである。好ましくは、かかるオキサゾリジニル中の酸素原子は尿素窒素に対し3位にある。好ましくは、かかるオキサゾリジニルは1つ、2つまたは3つのメチルまたはエチル基で置換される。より好ましくは、かかるオキサゾリジニルは2つのメチルまたはエチル基で置換される。さらにより好ましくは、かかるオキサゾリジニルは同じ炭素原子上で2つのメチル基で置換される。より好ましくは、かかるオキサゾリジニルは4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イルである。

【0195】

式IIaを有する化合物のさらに別の好ましい実施形態において、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともに置換または非置換とし得るヘテロシクリル基を形成することができる。好ましくは、かかるヘテロシクリルは5または6員の単環であり、より好ましくは6員の単環である。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルは1つまたは2つ、好ましくは1つの追加ヘテロ原子（すなわち、Nに加えて）を含有する。これらの追加ヘテロ原子は、例えばN、Oおよび/またはSであってもよい。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルはモルホリノである。別の実施形態において、かかるヘテロシクリルはピペラジニルである。別の実施形態において、かかるヘテロシクリルは、追加ヘテロ原子を含有しない（すなわち、単一のN原子を含有する）。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルはピペラディニルである。かかるヘテロシクリルが置換される場合、それは、好ましくはアリール、アリール $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{5-6}$ シクロアルキルまたは $C_{5-6}$ シクロアルキル $C_{1-4}$ アルキルで置換され、ここでかかるアリールは、好ましくは単環式であり、より好ましくはフェニルであり、および、かかるシクロアルキルは、好ましくはシクロヘキシルである。かかるアルキルは、好ましくは直鎖である。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルはアリールまたはアリール $C_{1-4}$ アルキル（好ましくは、 $C_{1-2}$ アルキル）で置換され、ここでかかるアリールは、好ましくは単環式であり、より好ましくはフェニルである。かかるアリールは、1つ以上のハロゲン原子で任意に置換されてもよい。

【0196】

式IIaを有する化合物において、R5は、好ましくはH、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R5a、ハロゲン、OH、OR5a、SH、SR5a、OCOR5a、SCOR5a、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、NHR5a、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH<sub>2</sub>、 $SO_2R5a$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、CONR5aR5bおよび $SO_2NR5aR5b$ から選択され、式中のR5aおよびR5bは独立して $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR5aおよびR5bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができる。より好ましくは、R5はH、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、ハロゲン、OH、SH、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、CN、COOH、CONH<sub>2</sub>、 $SO_3H$ および $SO_2NH_2$ から選択される。さらにより好ましくは、R5はH、 $C_{1-4}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{5-8}$ シクロアルキル

、 $C_{1-4}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、ハロゲン、OH、SH、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、CN、 $COOH$ 、 $CONH_2$ 、 $SO_3H$ および $SO_2NH_2$ から選択され、ここにかかるアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{5-8}$ シクロアルキル基は単環式である。なおより好ましくは、 $R_5$ はH、 $C_{1-3}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{5-8}$ シクロアルキル、ハロゲン、OH、 $NH_2$ 、 $COOH$ および $CONH_2$ から選択され、ここにかかるアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{5-8}$ シクロアルキル基は単環式である。さらにより好ましくは、 $R_5$ はH、 $C_{1-2}$ アルキルおよびハロゲンから選択される。なおより好ましくは、 $R_5$ はHおよび、FやClやBrなどのハロゲンから選択される。ある実施形態において、 $R_5$ はHである。

【0197】

式IIaを有する化合物において、 $R_6$ は、好ましくはそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{3-8}$ シクロアルキルから選択される。より好ましくは、 $R_6$ はそれぞれ置換または非置換とし得るアリールおよびヘテロアリールから選択される。ある実施形態において、かかるヘテロアリールは、例えば酸素または窒素原子などの1つのヘテロ原子を含有する。好ましくは、かかるアリールまたはヘテロアリールは単環式である。より好ましくは、かかるアリールまたはヘテロアリールは6員の単環であり、例えばフェニルまたはピリジルである。ある実施形態において、かかるヘテロアリールは、オキシドピリジルのような酸素原子で置換される窒素原子を含有する。別の実施形態において、 $R_6$ はフェニルのような非置換で単環式のアリール、またはハロゲン、 $C_{1-2}$ アルコキシ（1つ以上のハロゲン原子で任意に置換される）およびOHから選択した1つ以上の基で置換されるフェニルのような単環式のアリールである。

【0198】

ある実施形態において、 $R_6$ は非置換または置換2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾリルである。

【0199】

$R_6$ が置換されるとき、かかる置換基は、好ましくはハロゲン、 $C_{1-4}$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、OH、CN、 $CONH_2$ 、 $NH_2$ 、ヘテロシクリル $C_{1-4}$ アルコキシ、アリール $C_{1-4}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-4}$ アルコキシ、 $NO_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $SO_3$ 、 $C(NO_2)NH_2$ 、 $CONHOH$ 、2H-テトラゾール-5-イル、ジメチルアミノ、ベンジルアミノ、メチルスルホニルおよびピペリジニルスルホニルから選択した1つ以上の基である。かかるピペリジニルスルホニルは、アリールメトキシ（好ましくは、ベンゾキシ）またはOHで任意に置換されてもよい。好ましくは、かかるアリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルは単環式である。ある実施形態において、かかるアリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルは6員の単環である。 $R_6$ が単環式のアリールである特定の実施形態において、それはハロゲン、OH、 $C_{1-3}$ アルコキシ（好ましくは、 $C_{1-2}$ アルコキシ）、アリール（例えばフェニルなどの単環式のアリール）、ヘテロアリール（例えば1つ若しくは2つの窒素原子または1つの酸素原子を含有する単環式のヘテロアリール）、ヘテロシクリル（例えばピペラジニル、ピペラディニルまたはモルホリノ） $C_{1-3}$ アルコキシ（好ましくは、 $C_{1-2}$ アルコキシ）、アリール（例えばフェニルのような単環式のアリール） $C_{1-3}$ アルコキシ（好ましくは、 $C_{1-2}$ アルコキシ）、 $CONH_2$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $OCHF_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、モルホリノスルホニルおよび $C(NO_2)NH_2$ から選択した1つ以上の基で任意に置換されてもよい。

【0200】

$R_6$ が単環式のアリールである別の実施形態において、それはハロゲン、OH、メトキシ、フェニル、ピリジル、ピラジニル、ピラニル、ピペラジニルメトキシ、ピペラジニルメトキシ、モルホリノメトキシ、ベンジルオキシ、 $CONH_2$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $OCHF_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、モルホリノスルホニルおよび $C(NO_2)NH_2$ から選択した1つ以上の基で任意に置換されてもよい。

【0201】

ある実施形態において、 $R_6$ がフェニルなどの単環式のアリールであるとき、 $R_6$ の置換基はアリールであり、好ましくはフェニルなどの単環式のアリールであり、置換または非置換とし得る。それが置換される場合、好ましくは $CONH_2$ で置換される。



## 【 0 2 0 2 】

R6の置換基が $C_{1-4}$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_{1-4}$ アルコキシ、アリール $C_{1-4}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-4}$ アルコキシまたは $SO_3$ であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、OH、 $C_{1-3}$ アルコキシ（1つ以上のハロゲンで置換してもよい）、 $CONH_2$ 、CN、 $NCH_3CH_3$ 、 $NHCOCH_3$ 、メチルヒドロキシブチルおよびメチルヒドロキシブチニルから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよい。

## 【 0 2 0 3 】

式 I I a を有する化合物において、R8は、好ましくはH、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R8a、ハロゲン、OH、OR8a、SH、SR8a、OCOR8a、SCOR8a、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、NHR8a、NR8aR8b、COR8a、CSR8a、CN、COOH、COOR8a、 $CONH_2$ 、 $SO_2R8a$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、CONR8aR8bおよび $SO_2NR8aR8b$ から選択され、式中のR8aおよびR8bは独立して $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR8aおよびR8bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができる。より好ましくは、R8は、H、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、ハロゲン、OH、SH、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、CN、COOH、 $CONH_2$ 、 $SO_3H$ および $SO_2NH_2$ から選択される。さらにより好ましくは、R8は、H、 $C_{1-4}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{5-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、ハロゲン、OH、SH、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、CN、COOH、 $CONH_2$ 、 $SO_3H$ および $SO_2NH_2$ から選択され、ここにかかるアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{5-8}$ シクロアルキル基は単環式である。なおより好ましくは、R8は、H、 $C_{1-3}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{5-8}$ シクロアルキル、ハロゲン、OH、 $NH_2$ 、COOHおよび $CONH_2$ から選択され、ここにかかるアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{5-8}$ シクロアルキル基は単環式である。さらにより好ましくは、R8はH、 $C_{1-2}$ アルキルおよび、FやClやBrなどのハロゲンから選択される。ある実施形態において、R8はHである。

## 【 0 2 0 4 】

式 I I a を有する化合物のある実施形態において、R1はHおよび $C_{1-4}$ アルキルから選択され、

## 【 0 2 0 5 】

R2はアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-10}$ シクロアルキル、アリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロアリール $C_{1-6}$ アルキル、ヘテロシクリル $C_{1-6}$ アルキルおよび $C_{3-10}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキルから選択され、そのそれぞれをR2a、ハロゲン、OH、OR2a、OCOR2a、SH、SR2a、SCOR2a、 $NH_2$ 、NHR2a、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R2a$ 、NR2aCOR2b、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NHCOR2a$ 、NR2aR2b、COR2a、CSR2a、CN、COOH、COOR2a、 $CONH_2$ 、CONHOH、CONHR2a、CONHOR2a、 $C(NO)NH_2$ 、 $SO_2R2a$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、CONR2aR2bおよび $SO_2NR2aR2b$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR2aおよびR2bは独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR2aおよびR2bが遺書にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

## 【 0 2 0 6 】

ここでR2の置換基が $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、ヘテロシクリル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR2c、ハロゲン、OH、OR2c、OCOR2c、SH、SR2c、SCOR2c、 $NH_2$ 、NHR2c、 $NHSO_2NH_2$ 、 $NHSO_2R2c$ 、NR2cCOR2d、 $NHC(NH)NH_2$ 、 $NHCOR2c$ 、NR2cR2d、COR2c、CSR2c、CN、COOH、COOR2c、 $CONH_2$ 、CONHOH、CONHR2c、CONHOR2c、 $C(NO)NH_2$ 、 $SO_2R2c$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、CONR2cR2dおよび $SO_2NR2cR2d$ から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR2cおよびR2dは独立して $C_{1-6}$ アルキル、置換 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR2cおよ

びR2dと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

【0207】

R5はH、R5a、ハロゲン、OH、OR5a、OCOR5a、SH、SR5a、SCOR5a、NH<sub>2</sub>、NHR5a、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R5a、NR5aCOR5b、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NHCOR5a、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR5a、CONHOR5a、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R5a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR5aR5bおよびSO<sub>2</sub>NR5aR5bから選択され、式中のR5aおよびR5bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR5aおよびR5bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、

10

【0208】

R6はアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルから選択され、そのそれぞれをR6a、ハロゲン、OH、OR6a、OCOR6a、SH、SR6a、SCOR6a、NH<sub>2</sub>、NHR6a、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R6a、NR6aCOR6b、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NHCOR6a、NR6aR6b、COR6a、CSR6a、CN、COOH、COOR6a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR6a、CONHOR6a、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R6a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR6aR6bおよびSO<sub>2</sub>NR6aR6bから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR6eおよびR6fは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR6eおよびR6fと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、またR6がヘテロアリールまたはヘテロシクリルであるとき、これら部分のそれぞれを1つ以上の酸素原子で任意に置換してもよく、

20

【0209】

ここでR6の置換基がC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、ヘテロシクリル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをR6c、ハロゲン、OH、OR6c、OCOR6c、SH、SR6c、SCOR6c、NH<sub>2</sub>、NHR6c、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R6c、NR6cCOR6d、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NHCOR6c、NR6cR6d、COR6c、CSR6c、CN、COOH、COOR6c、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR6c、CONHOR6c、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R6c、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR6cR6dおよびSO<sub>2</sub>NR6cR6dから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR6cおよびR6dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR6cおよびR6dと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができ、またR6の置換基がヘテロアリールまたはヘテロシクリルであるとき、これら部分のそれぞれを1つ以上の酸素原子で任意に置換してもよく、

30

【0210】

R8はH、R5a、ハロゲン、OH、OR5a、OCOR5a、SH、SR5a、SCOR5a、NH<sub>2</sub>、NHR5a、NHSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NHSO<sub>2</sub>R5a、NR5aCOR5b、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NHCOR5a、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、CONHR5a、CONHOR5a、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R5a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR5aR5bおよびSO<sub>2</sub>NR5aR5bから選択した1つ以上の基で任意に置換されてもよく、式中のR5aおよびR5bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択されるか、またはR5aおよびR5bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができる。

40

【0211】

上記の実施形態において、好ましくは、R1はそれぞれ置換または非置換とし得るH、メチルおよびエチルから選択され、R2はそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-8</sub>シクロアルキルから選択される。より好ましくは、R1はメチルである。より好ましくは、R2はアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>5-8</sub>シクロアルキルから選択され、そのそれぞれは単環式であり、および置換または非置換とし得る。さらにより好ましくは、R2はヘテロシクリルおよびC<sub>5-8</sub>シクロアルキルから選択され、そのそれぞれは単環式であり、および置換または非置換とし得る。好ましくは、かかるヘテロシクリルは完全飽和である。R2が単環式のC<sub>5-8</sub>シクロアルキル(す

50

なわち、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルまたはシクロオクチル)であるとき、それは、好ましくは置換されない。ある実施形態において、R2は非置換シクロペンチルまたは非置換シクロヘキシルのようなシクロペンチルまたはシクロヘキシルである。R2が単環式の飽和ヘテロシクリルであるとき、かかるヘテロシクリルの環は、好ましくは窒素または酸素などの単一のヘテロ原子を含有する。好ましくは、かかるヘテロシクリルはピペリジニルまたはテトラヒドロピラニル基のような6員環である。好ましくは、かかるヘテロシクリル基のヘテロ原子はかかるヘテロシクリル基R2の尿素窒素への結合位置に対し4位にある。ある実施形態において、かかるヘテロ原子は、置換または非置換とし得る窒素ヘテロ原子である。

#### 【0212】

特定の実施形態において、かかる窒素原子はCN、CONH<sub>2</sub>、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>-C<sub>1-4</sub>アルキル、SO<sub>2</sub>-アリール(C<sub>1-4</sub>アルキル、またはトリフルオロメチルなどのC<sub>1-4</sub>ハロアルキルで任意に置換される)、CO-ヘテロアリール(ヘテロアリールまたはハロゲンで任意に置換される)、CO-C<sub>1-4</sub>アルキル、COO-C<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルキル(OH、CNまたはCOOHで任意に置換される)、アリールC<sub>1-3</sub>アルキル、ピペリジニルC<sub>1-3</sub>アルキルなどのヘテロアリールC<sub>1-3</sub>アルキル(COO-C<sub>1-3</sub>アルキルで任意に置換される)、ヘテロシクリルC<sub>1-3</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール(塩素などの1つ以上のハロゲンで任意に置換される)およびヘテロシクリルから選択した基で置換される。好ましくは、かかる窒素原子はCN、CONH<sub>2</sub>、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>-C<sub>1-4</sub>アルキル、SO<sub>2</sub>-単環式のアリール(トリフルオロメチルなどのC<sub>1-4</sub>ハロアルキルで任意に置換される)、CO-単環式ヘテロアリール(単環式のヘテロアリールまたはハロゲンで任意に置換される)、CO-C<sub>1-4</sub>アルキル、COO-C<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルキル(OH、CNまたはCOOHで任意に置換される)、単環式のアリールC<sub>1-3</sub>アルキル、ピペリジニルC<sub>1-3</sub>アルキルなどの単環式ヘテロアリールC<sub>1-3</sub>アルキル(COO-C<sub>1-3</sub>アルキルで任意に置換される)、単環式ヘテロシクリルC<sub>1-3</sub>アルキル、単環式のアリール、単環式ヘテロアリール(塩素などの1つ以上のハロゲンで任意に置換される)および単環式ヘテロシクリルから選択した基で置換される。より好ましくは、かかる窒素原子はCN、C<sub>1-4</sub>アルキル(OH、CNまたはCOOHで任意に置換される)、単環式のアリールC<sub>1-3</sub>アルキルおよび単環式ヘテロアリールC<sub>1-3</sub>アルキル(好ましくは、ピペリジニルC<sub>1-3</sub>アルキル)から選択した基で置換される。さらにより好ましくは、かかる窒素原子はC<sub>1-4</sub>アルキル(OH、CNまたはCOOHで任意に置換される)、単環式のアリールC<sub>1-3</sub>アルキルおよび単環式ヘテロアリールC<sub>1-3</sub>アルキル(好ましくは、ピペリジニルC<sub>1-3</sub>アルキル)から選択した基で置換される。

#### 【0213】

ある実施形態において、かかる窒素原子は単環式のアリール(好ましくは、フェニル)C<sub>1-3</sub>アルキルで置換され;好ましくは、かかる窒素原子はベンジルまたはフェニルエチルで置換され;より好ましくは、かかる窒素原子はベンジルで置換される。

#### 【0214】

ある実施形態において、R5はH、ハロゲン、OHまたはC<sub>1-4</sub>アルキルである。好ましくは、R5はHである。

#### 【0215】

別の実施形態において、R6はそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルから選択される。好ましくは、R6はそれぞれ置換または非置換とし得る単環式のアリール(例えばフェニル)、単環式のヘテロアリール(例えばピリジル)およびヘテロシクリルから選択される。ある実施形態において、R6は非置換アリールである。R6が置換アリールであるとき、それは、好ましくはハロゲン、R6a、OH、OR6a、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHC(NH)NH<sub>2</sub>、NHR6a、NR6aR6b、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、COR6a、COOH、COOR6a、CONH<sub>2</sub>、CONHOH、SO<sub>2</sub>R6aおよびSO<sub>2</sub>NR6aR6bから選択した1つ以上の基で置換され、式中のR6aおよびR6bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、

#### 【0216】

ここでR6の置換基がC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、ヘテロシクリル、またはこれら部分の1つ以上を含有する基であるとき、これら部分のそれぞれをOR6c、OHおよびCONH<sub>2</sub>から選択した1つ以上の基で任意に置換してもよく、式中のR6cおよびR6dは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、置換C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、またR6の置換基がヘテロアリールまたはヘテロシクリルであるとき、これら部分のそれぞれを1つ以上の酸素原子で任意に置換してもよい。

【0217】

好ましくは、R6が置換アリールであるとき、それはハロゲン、OH、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、CONH<sub>2</sub>、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>、CONHOH、SO<sub>2</sub>-C<sub>1-4</sub>アルキル、ヘテロシクリル（酸素原子で任意に置換される）およびアリール（CONH<sub>2</sub>で任意に置換される）から選択した1つ以上の基で置換される。ある実施形態において、R6は5-オキソ-4,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、3-カルバモイルフェニル、2H-テトラゾール-5-イル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、ハロゲン、OHおよびCONHOHから選択した1つ以上の基で置換されてもよい。

【0218】

R6がヘテロシクリルであるとき、それは、好ましくは酸素原子で置換される。R6の置換基は2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イルまたは2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルであってもよい。

【0219】

R6がヘテロアリールであるとき、それは、好ましくは酸素原子で置換され、または置換されない。例えば、ヘテロシクリルはN-酸化物を含有してもよい。ある実施形態において、R6はピリジルまたはピリジル酸化物である。

【0220】

別の実施形態において、R8はH、ハロゲン、OHまたはC<sub>1-4</sub>アルキルである。好ましくは、R8はHである。

【0221】

(式IIb)

式IIbを有する化合物の好ましい実施形態において、R1はそれぞれ置換または非置換とし得るHおよびC<sub>1-4</sub>アルキルから選択され、R2はそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、アリールC<sub>1-4</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキルから選択される。より好ましくは、R1はそれぞれ置換または非置換とし得るH、メチルおよびエチルから選択され、R2はそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルから選択される。より好ましくは、R1はメチルである。より好ましくは、R2はアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>5-8</sub>シクロアルキルから選択され、そのそれぞれは単環式であり、および置換または非置換とし得る。さらにより好ましくは、R2はフェニルのような単環式のアリールであり、置換または非置換とし得る。R2が置換されるとき、かかる置換基はアリール、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、アリールC<sub>1-4</sub>アルコキシまたはアリールオキシであってもよい。好ましくは、R2の置換基はアリール、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、アリールC<sub>1-3</sub>アルコキシまたはアリールオキシであり、ここにかかるアリールは単環式であり、より好ましくはフェニルである。

【0222】

R2が単環式のC<sub>5-8</sub>シクロアルキルまたはアリールであるとき、それは、好ましくは置換されない。好ましくは、R2は非置換シクロヘキシルのようなシクロヘキシルである。R2が単環式の飽和ヘテロシクリルであるとき、かかるヘテロシクリルの環は、好ましくは窒素または酸素などの単一のヘテロ原子を含有する。より好ましくは、かかるヘテロシクリルはピペリジニルまたはテトラヒドロピラニル基のような6員環である。ある実施形態において、かかるヘテロ原子は置換または非置換とし得る窒素ヘテロ原子である。好ましくは、かかるヘテロシクリル基中のヘテロ原子はかかるヘテロシクリル基R2の尿素窒素への結

10

20

30

40

50

合位置に対し4位にある。ある実施形態において、かかる窒素原子は単環式のアリール（好ましくは、フェニル） $C_{1-3}$ アルキルで置換される。

【0223】

式IIbを有する化合物の別の好ましい実施形態において、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともに置換または非置換とし得るヘテロシクリル基を形成する。好ましくは、かかるヘテロシクリルは5または6員の単環であり、より好ましくは5員の単環である。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルは、1つまたは2つ、好ましくは1つの追加ヘテロ原子（すなわち、Nに加えて）を含有する。これらの追加ヘテロ原子は、例えばN、Oおよび/またはSであってもよい。好ましくは、かかるヘテロシクリルはオキサゾリジニルである。好ましくは、かかるオキサゾリジニル中の酸素原子は尿素窒素に対し3位にある。好ましくは、かかるオキサゾリジニルは1つ、2つまたは3つのメチルまたはエチル基で置換される。より好ましくは、かかるオキサゾリジニルは2つのメチルまたはエチル基で置換される。さらにより好ましくは、かかるオキサゾリジニルは同じ炭素原子上で2つのメチル基で置換される。より好ましくは、かかるオキサゾリジニルは4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イルである。

【0224】

式IIbを有する化合物のさらに別の好ましい実施形態において、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともに置換または非置換とし得るヘテロシクリル基を形成することができる。好ましくは、かかるヘテロシクリルは5または6員の単環であり、より好ましくは6員の単環である。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルは1つまたは2つ、好ましくは1つの追加ヘテロ原子（すなわち、Nに加えて）を含有する。これらの追加ヘテロ原子は、例えばN、Oおよび/またはSであってもよい。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルはモルホリノである。別の実施形態において、かかるヘテロシクリルはピペラジニルである。別の実施形態において、かかるヘテロシクリルは追加ヘテロ原子を含有しない（すなわち、単一のN原子を含有する）。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルはピペラディニルである。かかるヘテロシクリルが置換される場合、それは、好ましくはアリール、アリール $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{5-6}$ シクロアルキルまたは $C_{5-6}$ シクロアルキル $C_{1-4}$ アルキルで置換され、ここでかかるアリールは、好ましくは単環式であり、より好ましくはフェニルであり、および、かかるシクロアルキルは、好ましくはシクロヘキシルである。かかるアルキルは、好ましくは直鎖である。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルはアリールまたはアリール $C_{1-4}$ アルキル（好ましくは、 $C_{1-2}$ アルキル）で置換され、ここでかかるアリールは、好ましくは単環式であり、より好ましくはフェニルである。かかるアリールは1つ以上のハロゲンで任意に置換されてもよい。

【0225】

式IIbを有する化合物において、R5は、好ましくはH、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R5a、ハロゲン、OH、OR5a、SH、SR5a、OCOR5a、SCOR5a、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、NHR5a、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R5a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR5aR5bおよびSO<sub>2</sub>NR5aR5bから選択され、式中のR5aおよびR5bは独立して $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びに、R5aおよびR5bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができる。より好ましくは、R5はH、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、ハロゲン、OH、SH、NH<sub>2</sub>、 $NO_2$ 、CN、COOH、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>3</sub>HおよびSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>から選択される。さらにより好ましくは、R5はH、 $C_{1-4}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{5-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、ハロゲン、OH、SH、NH<sub>2</sub>、 $NO_2$ 、CN、COOH、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>3</sub>HおよびSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>から選択され、ここでかかるアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{5-8}$ シクロアルキル基は単環式である。なおより好ましくは、R5はH、 $C_{1-3}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテ

10

20

30

40

50

ロシクリル、 $C_{5-8}$ シクロアルキル、ハロゲン、OH、 $NH_2$ 、COOHおよび $CONH_2$ から選択され、ここにかかるアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{5-8}$ シクロアルキル基は単環式である。さらにより好ましくは、 $R_5$ はH、 $C_{1-2}$ アルキルおよびハロゲンから選択される。なおより好ましくは、 $R_5$ はHおよび、FやClやBrなどのハロゲンから選択される。ある実施形態において、 $R_5$ はHである。

#### 【0226】

式IIbを有する化合物において、 $R_6$ は、好ましくはH、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、 $R_6a$ 、ハロゲン、OH、 $OR_6a$ 、SH、 $SR_6a$ 、 $OCOR_6a$ 、 $SCOR_6a$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $NHR_6a$ 、 $NR_6aR_6b$ 、 $COR_6a$ 、 $CSR_6a$ 、CN、COOH、 $COOR_6a$ 、 $CONH_2$ 、 $SO_2R_6a$ 、 $SO_3H$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $CONR_6aR_6b$ および $SO_2NR_6aR_6b$ から選択され、式中の $R_6e$ および $R_6f$ は独立して $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びに $R_6e$ および $R_6f$ は隣接するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができる。より好ましくは、 $R_6$ はH、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、ハロゲン、OH、SH、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、CN、COOH、 $CONH_2$ 、 $SO_3H$ および $SO_2NH_2$ から選択される。さらにより好ましくは、 $R_6$ はH、 $C_{1-4}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{5-8}$ シクロアルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、ハロゲン、OH、SH、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、CN、COOH、 $CONH_2$ 、 $SO_3H$ および $SO_2NH_2$ から選択され、ここにかかるアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{5-8}$ シクロアルキル基は単環式である。なおより好ましくは、 $R_6$ はH、 $C_{1-3}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C_{5-8}$ シクロアルキル、ハロゲン、OH、 $NH_2$ 、COOHおよび $CONH_2$ から選択され、ここにかかるアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{5-8}$ シクロアルキル基は単環式である。さらにより好ましくは、 $R_6$ はH、 $C_{1-2}$ アルキルおよびハロゲンから選択される。なおより好ましくは、 $R_6$ はHおよびFやClやBrなどのハロゲンから選択される。ある実施形態において、 $R_6$ はHである。

#### 【0227】

式IIbを有する化合物において、 $R_7$ は、好ましくはそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよび $C_{3-8}$ シクロアルキルから選択される。より好ましくは、 $R_7$ はそれぞれ置換または非置換とし得るアリールおよびヘテロアリールから選択される。ある実施形態において、かかるヘテロアリールは、例えば酸素または窒素原子などの1つのヘテロ原子を含有する。好ましくは、かかるアリールまたはヘテロアリールは単環式である。より好ましくは、かかるアリールまたはヘテロアリールは6員の単環である。かかるヘテロアリールはオキシドピリジルのような酸素原子で置換される窒素原子を含有する。別の実施形態において、 $R_7$ はフェニルのような非置換で単環式のアリール、またはハロゲン、 $C_{1-2}$ アルコキシ(1つ以上のハロゲン原子で任意に置換される)およびOHから選択した1つ以上の基で置換されるフェニルのような単環式のアリールである。特定の実施形態において、 $R_7$ はフェニルのような非置換で単環式のアリールである。

#### 【0228】

$R_7$ が置換されるとき、かかる置換基は、好ましくはハロゲン、 $C_{1-4}$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、OH、 $CONH_2$ 、 $NH_2$ 、ヘテロシクリル $C_{1-4}$ アルコキシ、アリール $C_{1-4}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-4}$ アルコキシ、 $NO_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $SO_3$ 、 $C(NOH)NH_2$ およびモルホリノスルホニルから選択した1つ以上の基である。好ましくは、かかるアリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルは単環式である。ある実施形態において、かかるアリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルは6員の単環である。 $R_7$ が単環式のアリールである特定の実施形態において、それはアリールまたはヘテロアリールで任意に置換されてもよく、そのそれぞれは単環式である。

#### 【0229】

( 式 I I c )

式 I I c を有する化合物の好ましい実施形態において、R1はそれぞれ置換または非置換とし得るHおよびC<sub>1-4</sub>アルキルから選択され、R2はそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキルから選択される。より好ましくは、R1はそれぞれ置換または非置換とし得るH、メチルおよびエチルから選択され、R2はそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルから選択され。より好ましくは、R1はメチルである。より好ましくは、R2はアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>5-8</sub>シクロアルキルから選択され、そのそれぞれは単環式であり、および置換または非置換とし得る。さらにより好ましくは、R2はフェニルのようなアリール、飽和ヘテロシクリルおよびC<sub>5-8</sub>シクロアルキルから選択され、そのそれぞれは単環式であり、および置換または非置換とし得る。好ましくは、R2は非置換シクロヘキシルのようなシクロヘキシルである。R2が単環式の飽和ヘテロシクリルであるとき、かかるヘテロシクリルの環は、好ましくは窒素または酸素などの単一のヘテロ原子を含有する。より好ましくは、かかるヘテロシクリルはピペリジニルまたはテトラヒドロピラニル基のような6員環である。ある実施形態において、かかるヘテロ原子は置換または非置換とし得る窒素ヘテロ原子である。好ましくは、かかるヘテロシクリル基中のヘテロ原子はかかるヘテロシクリル基R2の尿素窒素への結合位置に対し4位にある。ある実施形態において、かかる窒素原子は単環式のアリール（好ましくは、フェニル）C<sub>1-3</sub>アルキルで置換される。

【 0 2 3 0 】

式 I I c を有する化合物の別の好ましい実施形態において、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともに置換または非置換とし得るヘテロシクリル基を形成する。好ましくは、かかるヘテロシクリルは5または6員の単環であり、より好ましくは5員の単環である。ある実施形態において、かかるヘテロシクリルは1つまたは2つ、好ましくは1つの追加ヘテロ原子（すなわち、Nに加えて）を含有する。これらの追加ヘテロ原子は、例えばN、Oおよび/またはSであってもよい。好ましくは、かかるヘテロシクリルはオキサゾリジニルである。好ましくは、かかるオキサゾリジニル中の酸素原子は尿素窒素に対し3位にある。好ましくは、かかるオキサゾリジニルは1つ、2つまたは3つのメチルまたはエチル基で置換される。より好ましくは、かかるオキサゾリジニルは2つのメチルまたはエチル基で置換される。さらにより好ましくは、かかるオキサゾリジニルは同じ炭素原子上で2つのメチル基で置換される。より好ましくは、かかるオキサゾリジニルは4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イルである。

【 0 2 3 1 】

式 I I c を有する化合物のさらに別の好ましい実施形態において、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともに置換または非置換とし得るヘテロシクリル基を形成することができる。好ましくは、かかるヘテロシクリルは5または6員の単環であり、より好ましくは6員の単環である。ある実施形態において、ヘテロシクリルは1つまたは2つ、好ましくは1つの追加ヘテロ原子（すなわち、Nに加えて）を含有する。これらの追加ヘテロ原子は、例えばN、Oおよび/またはSであってもよい。ある実施形態において、ヘテロシクリルはモルホリノである。別の実施形態において、ヘテロシクリルはピペラジニルである。別の実施形態において、ヘテロシクリルは追加ヘテロ原子を含有しない（すなわち、単一のN原子を含有する）。ある実施形態において、ヘテロシクリルはピペラディニルである。ヘテロシクリルが置換される場合、それは、好ましくはアリール、アリールC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>5-6</sub>シクロアルキルまたはC<sub>5-6</sub>シクロアルキルC<sub>1-4</sub>アルキルで置換され、ここでアリールは、好ましくは単環式であり、より好ましくはフェニルであり、およびシクロアルキルは、好ましくはシクロヘキシルである。アルキルは、好ましくは直鎖である。ある実施形態において、ヘテロシクリルはアリールまたはアリールC<sub>1-4</sub>アルキル（好ましくは、C<sub>1-2</sub>アルキル）で置換され、ここでアリールは、好ましくは単環式であり、より好ましくはフェニルである。アリールは1つ以上のハロゲンで任意に置換されてもよい。

## 【 0 2 3 2 】

式 I I c を有する化合物において、R5は、好ましくはH、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R5a、ハロゲン、OH、OR5a、SH、SR5a、OCOR5a、SCOR5a、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR5a、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R5a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR5aR5bおよびSO<sub>2</sub>NR5aR5bから選択され、式中のR5aおよびR5bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR5aおよびR5bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができる。より好ましくは、R5はH、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、ハロゲン、OH、SH、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>3</sub>HおよびSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>から選択される。さらにより好ましくは、R5はH、C<sub>1-4</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>5-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、ハロゲン、OH、SH、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>3</sub>HおよびSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>から選択され、ここでアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>5-8</sub>シクロアルキル基は単環式である。なおより好ましくは、R5はH、C<sub>1-3</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>5-8</sub>シクロアルキル、ハロゲン、OH、NH<sub>2</sub>、COOHおよびCONH<sub>2</sub>から選択され、ここでアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>5-8</sub>シクロアルキル基は単環式である。さらにより好ましくは、R5はH、C<sub>1-2</sub>アルキルおよびハロゲンから選択される。なおより好ましくは、R5はHおよび、FやClやBrなどのハロゲンから選択される。ある実施形態において、R5はHである。

10

20

## 【 0 2 3 3 】

式 I I c を有する化合物において、R6は、好ましくはそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-8</sub>シクロアルキルから選択される。より好ましくは、R6はそれぞれ置換または非置換とし得るアリールおよびヘテロアリールから選択される。ある実施形態において、ヘテロアリールは、例えば酸素または窒素原子などの1つのヘテロ原子を含有する。好ましくは、アリールまたはヘテロアリールは単環式である。より好ましくは、アリールまたはヘテロアリールは6員の単環である。ある実施形態において、ヘテロアリールはオキシドピリジルのような酸素原子で置換される窒素原子を含有する。別の実施形態において、R6はフェニルのような非置換で単環式のアリール、またはハロゲン、C<sub>1-2</sub>アルコキシ（1つ以上のハロゲン原子で任意に置換される）およびOHから選択した1つ以上の基で置換されるフェニルのような単環式のアリールである。

30

## 【 0 2 3 4 】

R6が置換されるとき、置換基は、好ましくはハロゲン、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、OH、CONH<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、ヘテロシクリルC<sub>1-4</sub>アルコキシ、アリールC<sub>1-4</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-4</sub>アルコキシ、NO<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、SO<sub>3</sub>、C(NOH)NH<sub>2</sub>およびモルホリノスルホニルから選択した1つ以上の基である。好ましくはアリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルは単環式である。ある実施形態において、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルは6員の単環である。R6が単環式のアリールである特定の実施形態において、それはハロゲン、OH、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、アリール（例えばフェニルなどの単環式のアリール）、ヘテロアリール（例えば1つ若しくは2つの窒素原子または1つの酸素原子を含有する単環式のヘテロアリール）、ヘテロシクリル（例えばピペラジニル、ピペラディニルまたはモルホリノ）C<sub>1-3</sub>アルコキシ、アリール（例えばフェニルのような単環式のアリール）C<sub>1-3</sub>アルコキシ、CONH<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、OCHF<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、モルホリノスルホニルおよびC(NOH)NH<sub>2</sub>から選択した1つ以上の基で任意に置換されてもよい。

40

## 【 0 2 3 5 】

ある実施形態において、R6がフェニルなどの単環式のアリールであるとき、R6の置換基はアリールであり、好ましくはフェニルなどの単環式のアリールであり、置換または非置

50



換とし得る。それが置換される場合、好ましくはCONH<sub>2</sub>で置換される。

【0236】

R6の置換基がC<sub>1-4</sub>アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルC<sub>1-4</sub>アルコキシ、アリールC<sub>1-4</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-4</sub>アルコキシまたはSO<sub>3</sub>であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、OH、C<sub>1-3</sub>アルコキシ（1つ以上のハロゲンで置換されてもよい）、CONH<sub>2</sub>、CN、NCH<sub>3</sub>CH<sub>3</sub>、NHCOCH<sub>3</sub>、メチルヒドロキシブチルおよびメチルヒドロキシブチニルから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよい。

【0237】

(式IId)

式IIdを有する化合物の好ましい実施形態において、R1はそれぞれ置換または非置換とし得るHおよびC<sub>1-4</sub>アルキルから選択され、R2はそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-10</sub>シクロアルキル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロシクリルC<sub>1-6</sub>アルキルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキルから選択される。より好ましくは、R1はそれぞれ置換または非置換とし得るH、メチルおよびエチルから選択され、R2はそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-10</sub>シクロアルキルから選択される。より好ましくは、R1はメチルである。より好ましくは、R2はアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>5-8</sub>シクロアルキルから選択され、そのそれぞれは単環式であり、および置換または非置換とし得る。さらにより好ましくは、R2はフェニルのようなアリール、飽和ヘテロシクリルおよびC<sub>5-8</sub>シクロアルキルから選択され、そのそれぞれは単環式であり、および置換または非置換とし得る。なにより好ましくは、R2はフェニルなどのアリールであり、それは単環式であり、および置換または非置換とし得る。R2が置換されるとき、置換基は、好ましくは1つ以上のハロゲンである。

【0238】

ある実施形態において、R2は非置換シクロヘキシルのようなシクロヘキシルである。R2が単環式の飽和ヘテロシクリルであるとき、ヘテロシクリルの環は、好ましくは窒素または酸素などの単一のヘテロ原子を含有する。より好ましくは、ヘテロシクリルはピペリジンまたはテトラヒドロピラニル基のような6員環である。ある実施形態において、ヘテロ原子は置換または非置換とし得る窒素ヘテロ原子である。好ましくは、ヘテロシクリル基中のヘテロ原子はヘテロシクリル基R2の尿素窒素への結合位置に対し4位にある。ある実施形態において、窒素原子は単環式のアリール（好ましくはフェニル）C<sub>1-3</sub>アルキルで置換される。

【0239】

式IIdを有する化合物の別の好ましい実施形態において、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともに置換または非置換とし得るヘテロシクリル基を形成する。好ましくは、ヘテロシクリルは5または6員の単環であり、より好ましくは5員の単環である。ある実施形態において、ヘテロシクリルは1つまたは2つ、好ましくは1つの追加ヘテロ原子（すなわち、Nに加えて）を含有する。これらの追加ヘテロ原子は、例えばN、Oおよび/またはSであってもよい。好ましくは、ヘテロシクリルはオキサゾリジンである。好ましくは、オキサゾリジン中の酸素原子は尿素窒素に対し3位にある。好ましくは、オキサゾリジンは1つ、2つまたは3つのメチルまたはエチル基で置換される。より好ましくは、オキサゾリジンは2つのメチルまたはエチル基で置換される。さらにより好ましくは、オキサゾリジンは同じ炭素原子上で2つのメチル基で置換される。より好ましくは、オキサゾリジンは4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イルである。

【0240】

式IIdを有する化合物のさらに別の好ましい実施形態において、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともに置換または非置換とし得るヘテロシクリル基を形成することができる。好ましくは、ヘテロシクリルは5または6員の単環であり、より好ましくは6員の単環である。ある実施形態において、ヘテロシクリルは1つまたは2つ、好ましくは1つの追加ヘテロ原子（すなわち、Nに加えて）を含有する。これらの追加ヘテロ原子は、

例えばN、Oおよび/またはSであってもよい。ある実施形態において、ヘテロシクリルはモルホリノである。別の実施形態において、ヘテロシクリルはピペラジニルである。別の実施形態において、ヘテロシクリルは追加ヘテロ原子を含有しない(すなわち、単一のN原子を含有する)。ある実施形態において、ヘテロシクリルはピペラディニルである。ヘテロシクリルが置換される場合、それは、好ましくはアリール、アリールC<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>5-6</sub>シクロアルキルまたはC<sub>5-6</sub>シクロアルキルC<sub>1-4</sub>アルキルで置換され、ここでアリールは、好ましくは単環式であり、より好ましくはフェニルであり、およびシクロアルキルは、好ましくはシクロヘキシルである。アルキルは、好ましくは直鎖である。ある実施形態において、ヘテロシクリルはアリールまたはアリールC<sub>1-4</sub>アルキル(好ましくはC<sub>1-2</sub>アルキル)で置換され、ここでアリールは、好ましくは単環式であり、より好ましくはフェニルである。アリールは1つ以上のハロゲンで任意に置換されてもよい。

10

#### 【0241】

式IIdを有する化合物において、R5は、好ましくはH、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、R5a、ハロゲン、OH、OR5a、SH、SR5a、OCOR5a、SCOR5a、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、NHR5a、NR5aR5b、COR5a、CSR5a、CN、COOH、COOR5a、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>R5a、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CONR5aR5bおよびSO<sub>2</sub>NR5aR5bから選択され、式中のR5aおよびR5bは独立してC<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルおよびヘテロシクリルから選択され、並びにR5aおよびR5bと一緒にこれらを結合するヘテロ原子とともにヘテロシクリルを形成することができる。より好ましくは、R5はH、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、ハロゲン、OH、SH、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>3</sub>HおよびSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>から選択される。さらにより好ましくは、R5はH、C<sub>1-4</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>5-8</sub>シクロアルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクリルオキシ、ハロゲン、OH、SH、NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>3</sub>HおよびSO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>から選択され、ここでアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>5-8</sub>シクロアルキル基は単環式である。なおより好ましくは、R5はH、C<sub>1-3</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C<sub>5-8</sub>シクロアルキル、ハロゲン、OH、NH<sub>2</sub>、COOHおよびCONH<sub>2</sub>から選択され、ここでアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>5-8</sub>シクロアルキル基は単環式である。さらにより好ましくは、R5はH、C<sub>1-2</sub>アルキルおよびハロゲンから選択される。なおより好ましくは、R5はHおよび、FやClやBrなどのハロゲンから選択される。ある実施形態において、R5はHである。

20

30

#### 【0242】

式IIdを有する化合物において、R7は、好ましくはそれぞれ置換または非置換とし得るアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリルおよびC<sub>3-8</sub>シクロアルキルから選択される。より好ましくは、R7はそれぞれ置換または非置換とし得るアリールおよびヘテロアリールから選択される。ある実施形態において、ヘテロアリールは例えば酸素または窒素原子などの1つのヘテロ原子を含有する。好ましくは、アリールまたはヘテロアリールは単環式である。より好ましくは、アリールまたはヘテロアリールは6員の単環である。ある実施形態において、ヘテロアリールはオキシドピリジルのような酸素原子で置換される窒素原子を含有する。別の実施形態において、R7はフェニルのような非置換で単環式のアリール、またはハロゲン、C<sub>1-2</sub>アルコキシ(1つ以上のハロゲン原子で任意に置換される)およびOHから選択した1つ以上の基で置換されるフェニルのような単環式のアリールである。

40

#### 【0243】

R7が置換されるとき、置換基は、好ましくはハロゲン、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、OH、CONH<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、ヘテロシクリルC<sub>1-4</sub>アルコキシ、アリールC<sub>1-4</sub>アルコキシ、ヘテロアリールC<sub>1-4</sub>アルコキシ、NO<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、SO<sub>3</sub>、C(NO<sub>2</sub>)NH<sub>2</sub>およびモルホリノスルホニルから選択した1つ以上の基である。好ましくは、アリール、ヘ

50

テロアリールおよびヘテロシクリルは単環式である。ある実施形態において、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルは6員の単環である。R7が単環式のアリールである特定の実施形態において、それはハロゲン、OH、 $C_{1-3}$ アルコキシ、アリール（例えばフェニルなどの単環式のアリール）、ヘテロアリール（例えば1つ若しくは2つの窒素原子または1つの酸素原子を含有する単環式のヘテロアリール）、ヘテロシクリル（例えばピペラジニル、ピペラディニルまたはモルホリノ） $C_{1-3}$ アルコキシ、アリール（例えばフェニルのような単環式のアリール） $C_{1-3}$ アルコキシ、 $CONH_2$ 、 $NH_2$ 、 $NO_2$ 、 $OCHF_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、モルホリノスルホニルおよび $C(NO_2)NH_2$ から選択した1つ以上の基で任意に置換されてもよい。ある実施形態において、R7がフェニルのような単環式のアリールであるとき、R7の置換基はアリール（例えばフェニルのような単環式のアリール） $C_{1-3}$ アルコキシである。

10

## 【0244】

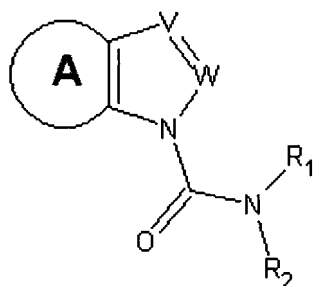
R7の置換基が $C_{1-4}$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル $C_{1-4}$ アルコキシ、アリール $C_{1-4}$ アルコキシ、ヘテロアリール $C_{1-4}$ アルコキシまたは $SO_3$ であるとき、これら部分のそれぞれをハロゲン、OH、 $C_{1-3}$ アルコキシ（1つ以上のハロゲンで置換されてもよい）、 $CONH_2$ 、CN、 $NCH_3CH_3$ 、 $NHCOCH_3$ 、メチルヒドロキシブチルおよびメチルヒドロキシブチニルから選択した1つ以上の基で任意に置換してもよい。

## 【0245】

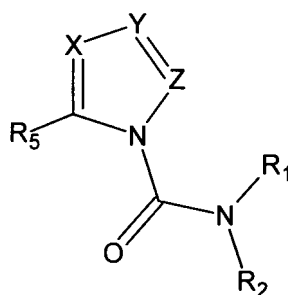
本発明の別の実施形態において、式Iまたは式II：

## 【化7】

20



式I



式II

【式中、R1、R2、R5、環A、V、W、X、YおよびZは、上述にて定義した通りであり、

30

## 【0246】

ただし、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともにピペリジニル、ピペラジニル、置換ピペリジニルまたは置換ピペラジニルを形成するとき、式Iを有する化合物中の環Aはピリジン、ピリミジン、置換ピリジンまたは置換ピリミジンを形成せず、

## 【0247】

ただし、環Aは非置換ベンゾ、ヒドロキシベンゾ、フェノキシベンゾ、フルオロクロロベンゾ、クロロベンゾ、プロモベンゾ、ニトロベンゾ、アミノベンゾ、シアノベンゾ、メチルベンゾ、トリフルオロメチルベンゾ、トリフルオロメチルクロロベンゾ、フェニルケトベンゾ、フェニルヒドロキシメチルベンゾ、シクロヘキシルチオベンゾ、メトキシカルボニルベンゾまたはメトキシベンゾでなく、

40

## 【0248】

ただし、R1またはR2がメチルであるとき、他方のR1またはR2は4-クロロブチル、4-アジドブチルまたは4-イソチオシアナトブチルでなく、また

## 【0249】

ただし、本化合物が(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)(4-(キノリン-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル)メタノンではない]を有する化合物、

## 【0250】

或いは、その薬学的に許容し得る塩またはエステルを提供する。

## 【0251】

本発明の第二の態様では、本発明の第一の態様による化合物を含む医薬組成物を、1つ

50

以上の薬学的に許容し得る賦形剤とともに提供する。

【0252】

本発明の医薬組成物は、任意の薬学的に許容し得るキャリア、補助剤または媒剤とともに、本発明の第一の態様の化合物のいずれかを含む。本発明の医薬組成物に用いられてもよい薬学的に許容し得るキャリア、補助剤および媒剤は、医薬製剤の分野において通常で使用されており、砂糖、糖アルコール、スターチ、イオン交換体、アルミナ、ステアリン酸アルミニウム、レシチン、血清アルブミンなどの血清タンパク質、リン酸などの緩衝物質、グリセリン、ソルビン酸、ソルビン酸カリウム、飽和植物脂肪酸の部分グリセリド混合物、水、硫酸プロタミンなどの塩または電解質、リン酸一水素二ナトリウム、リン酸水素カリウム、塩化ナトリウム、亜鉛塩、コロイドシリカ、三ケイ素マグネシウム、ポリビニルピロリドン、セルロース系物質、ポリエチレングリコール、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ポリアクリル酸塩、ワックス、ポリエチレン-ポリオキシプロピレン-ブロックポリマー、ポリエチレングリコールおよび羊毛脂を含むが、これに限定されるものではない。

10

【0253】

本発明の医薬組成物は、経口、非経口、吸入噴霧、経直腸、経鼻、口腔、経膈または注入リザーバーにより投与されてもよい。経口投与が、好ましい。本発明の医薬組成物は、任意の従来型で非毒性である薬学的に許容し得るキャリア、補助剤または媒剤を含んでもよい。本明細書で用いる非経口という用語は、皮下、皮内、静脈内、筋肉内、関節内、滑液嚢内、胸骨内、髄腔内、病巣内および頭蓋内の注射および注入技術を含む。

20

【0254】

医薬組成物は、例えば、無菌注射用の水性または油性懸濁液のような無菌注射製剤の形態であってもよい。この懸濁液は、適切な分散剤または湿潤剤（例えばツイン80）および懸濁化剤を用い、本技術分野で周知の技術によって調製してもよい。また、無菌注射製剤は、例えば1,3-ブタンジオール溶液のように、非毒性の薬学的に許容し得る希釈剤または溶媒の無菌注射溶液または懸濁液であってもよい。使用されている許容し得る媒剤および溶媒として、マンニトール、水、リンガー溶液および生理食塩水がある。さらに、無菌の固定油も、溶媒または懸濁化剤として通常に用いる。そのため、合成グリセリドまたはジグリセリドを含む任意の無菌の固定油を用いてもよい。オレイン酸およびそのグリセリド誘導体などの脂肪酸は、注射剤の調製に有用であり、これはオリーブ油またはヒマシ油などの、特にポリオキシエチル化された型の薬学的に許容し得る天然油と同様である。また、これらの油の溶液または懸濁液は、Ph. Helvに記載されているような長鎖アルコールの希釈剤若しくは分散剤、またはそれと同様のアルコールを含んでも良い。

30

【0255】

本発明の医薬組成物は、経口で許容し得る任意の剤形で経口投与されてもよく、その剤形としてカプセル、錠剤、粉末、顆粒並びに水性の懸濁液および溶液が挙げられるが、これに限定されるものではない。これらの剤形は、医薬製剤の分野で周知の技術によって調製される。経口用の錠剤について、一般的に用いられるキャリアとして、ラクトースおよびコーンスターチが挙げられる。また、ステアリン酸マグネシウムのような滑剤も通常加えられる。カプセルの経口投与にとって有用な希釈剤として、ラクトースおよび乾燥コーンスターチが挙げられる。水性懸濁液が経口投与されるとき、活性成分は、乳化剤および懸濁化剤と混ざる。必要に応じて、特定の甘味剤および/または香味剤および/または着色剤を加えてもよい。

40

【0256】

また、本発明の医薬組成物は、坐薬の形態で経直腸投与されてもよい。これらの組成物は、本発明の化合物を、室温では固体で直腸の温度では液体であり、つまり直腸にて融解して活性成分を放出するような適切な非刺激性の賦形剤と混合することにより調製できる。かかる原料として、ココアバター、蜜ろうおよびポリエチレングリコールが挙げられるが、これに限定されるものではない。

【0257】

50

本発明の医薬組成物は、鼻エアロゾルまたは鼻孔吸入により投与されてもよい。かかる組成物は、医薬製剤の分野で周知の技術によって調製され、生理食塩水、用いるベンジルアルコール若しくはその他の適切な保存料、バイオアベイラビリティを高めるための吸収促進剤、フルオロカーボン、および/または当分野で周知のその他の可溶化剤若しくは分散剤の溶液として調製されてもよい。

【0258】

本発明の化合物は、1回の投与でおよそ1~20,000 µg/kgの量が投与されてもよく、治療または予防対象の疾患、および本化合物を投与する被験体の特性による。多くの場合、かかる1回の投与量は、およそ1~1500 µg/kgかもしれない。本化合物の投与計画は、本開示を入手できる当業者によって迅速に決定することができる。

10

【0259】

ある特定の実施形態において、本発明の医薬組成物は、1つ以上の追加の薬学的に活性な成分をさらに含む。本発明の化合物は、1つ以上の追加の薬学的に活性な成分とともに投与されてもよい。これは、本発明の化合物および1つ以上の追加の薬学的に活性な成分を含む単一の組成物の形態であってもよい。或いは、これは、2つ以上の単独の組成物として、本発明の化合物が1つの組成物に含有され、1つ以上の追加の薬学的に活性な成分が1つ以上の単独の組成物に含有されていてもよい。

【0260】

第三の態様では、本発明は、治療に用いる、本発明の第一の態様による化合物または第二の態様による組成物を提供する。

20

【0261】

第四の態様では、本発明は、発症または兆候がFAAH酵素の基質に関連付けられる疾患の治療または予防に用いる、本発明の第一の態様による化合物または第二の態様による組成物を提供し、ただし、第一の態様において、i) R1およびR2が一緒にこれらを結合するNとともにピペリジニル、ピペラジニル、置換ピペリジニルまたは置換ピペラジニルを形成するとき、式Iを有する化合物中の環Aは、ピリジン、ピリミジン、置換ピリジンまたは置換ピリミジンを形成せず、ii) R1またはR2がメチルであるとき、他方のR1またはR2は、4-クロロブチル、4-アジドブチルまたは4-イソチオシアナトブチルでなく、およびiii) 本化合物が(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)(4-(キノリン-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル)メタノンではない。

30

【0262】

また、本発明は、発症または兆候がFAAH酵素の基質に関連付けられる疾患の治療または予防用の薬剤の製造における、本発明の第一の態様による化合物または第二の態様による組成物の使用方法を提供し、ただし、第一の態様においてi) R1およびR2が一緒にこれらを結合するNとともにピペリジニル、ピペラジニル、置換ピペリジニルまたは置換ピペラジニルを形成するとき、式Iを有する化合物中の環Aは、ピリジン、ピリミジン、置換ピリジンまたは置換ピリミジンを形成せず、ii) R1またはR2がメチルであるとき、他方のR1またはR2は、4-クロロブチル、4-アジドブチルまたは4-イソチオシアナトブチルでなく、およびiii) 本化合物が(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)(4-(キノリン-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル)メタノンではない。

40

【0263】

発症または兆候がFAAH酵素の基質に関連付けられる疾患の多くは、当業者に周知である。これらのいくつかは、上述している。

【0264】

第五の態様では、本発明はまた、発症または兆候がFAAH酵素の基質に関連付けられる疾患の治療または予防の方法も提供し、かかる方法は、かかる治療または予防を必要とする被験体に対し、本発明の第一の態様による化合物または第二の態様による組成物を、治療上有効な量だけ投与することを含み、ただし、第一の態様においてi) R1およびR2が一緒にこれらを結合するNとともにピペリジニル、ピペラジニル、置換ピペリジニルまたは置換ピペラジニルを形成するとき、式Iを有する化合物中の環Aは、ピリジン、ピリミジン

50

、置換ピリジンまたは置換ピリミジン形成せず、*i i*) R1またはR2がメチルであるとき、他方のR1またはR2は、4-クロロブチル、4-アジドブチルまたは4-イソチオシアナトブチルでなく、および *i i i*) 本化合物が(4-フェニル-1*H*-イミダゾール-1-イル)(4-(キノリン-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル)メタノンではない。

【0265】

第四の態様による化合物、または第五の態様による方法において、疾患とは、内因性カンナビノイドに関連する疾患のことである。

【0266】

ある実施形態において、治療する疾患は、

【0267】

(*i*) 痛み、特に、片頭痛および神経障害痛(例えば糖尿病性神経障害に伴う疼痛、疱疹後神経痛、三叉神経痛)などの急性または慢性の神経病; 関節炎、リウマチ性関節炎、骨関節炎、脊椎炎、通風、血管炎、クローン病および過敏性腸症候群などの、炎症性疾患に関連のある急性または慢性の痛み;

【0268】

(*i i*) 目まい、嘔吐および吐き気、とりわけ化学療法によって生じるもの;

【0269】

(*i i i*) 摂食障害、とりわけ様々な性質の食欲不振および悪液質;

【0270】

(*i v*) 震え、運動障害、筋失調症、痙直、脅迫的行動、トゥレットシンドローム、如何なる性質および起源をもつあらゆる形態の鬱病および不安、気分障害、並びに精神病などの、神経学的および精神医学的病変;

【0271】

(*v*) パーキンソン病、アルツハイマー病、老年性認知症、ハンチントン舞蹈病、並びに、脳虚血および頭蓋や延髄の外傷に関連する損傷などの、急性または慢性の神経変性疾患;

【0272】

(*v i*) てんかん;

【0273】

(*v i i*) 睡眠時無呼吸を含む睡眠障害;

【0274】

(*v i i i*) 心不全、高血圧、心律動異常、動脈硬化、心臓発作、心虚血および腎虚血などの、心疾患;

【0275】

(*i x*) 例えば皮膚良性腫瘍、脳腫瘍、乳頭腫、前立腺腫瘍および脳腫瘍(膠芽腫、髄様上皮腫、神経芽細胞腫、胚起源の腫瘍、星状細胞腫、星状芽細胞腫、上衣腫、乏突起膠腫、叢の腫瘍、神経上皮腫、骨端の腫瘍、上皮芽細胞腫、悪性髄膜腫、肉腫症、悪性黒色腫および神経鞘腫)などの、がん;

【0276】

(*x*) 免疫システムの疾患、とりわけ、乾癬、エリテマトーデス、結合組織の疾患またはコラーゲンの疾患、シェーグレン症候群、強直性脊椎炎、未分化型脊椎炎、ベーチェット病、自己免疫性溶血性貧血、多発性硬化症、筋萎縮性側索硬化症、アミロイド症、移植片拒絶、形質細胞の株に影響を及ぼす病気、アレルギー性疾患などの自己免疫疾患; 即時型または遅延型過敏症、アレルギー性の鼻炎または結膜炎、接触皮膚炎;

【0277】

(*x i*) AIDSなどの、寄生性、ウイルス性または細菌性の感染症、および髄膜炎;

【0278】

(*x i i*) 炎症性疾患、とりわけ、関節炎、リウマチ性関節炎、骨関節炎、脊椎炎、通風、血管炎、クローン病および過敏性腸症候群などの関節疾患;

【0279】

10

20

30

40

50

( x i i i ) 骨粗しょう症 ;

【 0 2 8 0 】

( x i v ) 高眼圧症および緑内障などの目の疾患 ;

【 0 2 8 1 】

( x v ) 気道の疾患、気管支けいれん、咳、ぜんそく、慢性気管支炎、慢性気道閉塞症、および気腫を含む肺疾患 ;

【 0 2 8 2 】

( x v i ) 過敏性腸症候群、炎症性腸管疾患、潰瘍、下痢、尿失禁および膀胱の炎症などの、胃腸疾患

から選択されてもよい。

10

【 0 2 8 3 】

第六の態様では、本発明は、発症または兆候がFAAH酵素の基質に関連付けられる疾患の治療または予防のための薬剤の調製における、本発明の第一の態様による化合物の使用を提供し、ただし、第一の態様において、R1およびR2と一緒にこれらを結合するNとともにピペリジニル、ピペラジニル、置換ピペリジニルまたは置換ピペラジニルを形成するとき、式 I を有する化合物中の環Aはピリジン、ピリミジン、置換ピリジンまたは置換ピリミジンを形成しない。

【 0 2 8 4 】

第六の態様に関連する典型的な疾患は、前述している。

【 0 2 8 5 】

20

第四、第五または第六のある実施形態では、第一の態様に対するその他の条件のうちの1つまたは両方もまた、適用される。

【実施例】

【 0 2 8 6 】

ここで本発明を、実施例のみの目的でさらに詳細に説明する。

【 0 2 8 7 】

1. 合成法

本発明の化合物の合成に用いる方法を、下記の一般的な手順およびその後の調製例によって説明する。全ての化合物および中間生成物は、核磁気共鳴 (NMR) によって特性を明らかにした。これらの化合物を調製する際の出発原料および試薬は、商業供給業者から入手でき、または当業者にとって明白な方法で調製することができる。これらの一般的な手順は、ただ本発明の化合物を合成する方法を説明するためだけのものであり、これらの手順に様々な変更を加えることができ、本開示を参照した当業者は、それを提案するであろう。

30

【 0 2 8 8 】

次に示す手順における室温とは、20 ~ 25 の範囲の温度を意味する。

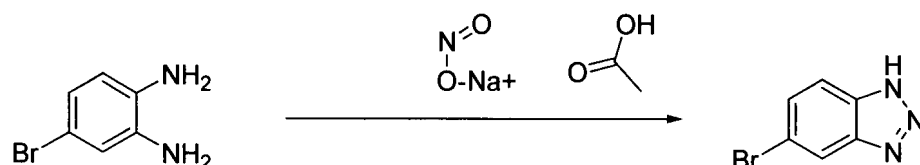
【 0 2 8 9 】

ベンゾトリアゾール :

5-ブロモ-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール (1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール誘導体形成)

40

【化 8】



水 (10 ml) に亜硝酸ナトリウム (4.06 g, 58.8 mmol) を加えた溶液を、0 ~ 5 の酢酸 (20 ml, 349 mmol) と水 (100 ml) の混合物に4-ブロモベンゼン-1,2-ジアミン (10 g, 53.5 mmol) を加えた溶液に、一滴ずつ加えた。この溶液を氷浴中で1時間攪拌し、さら

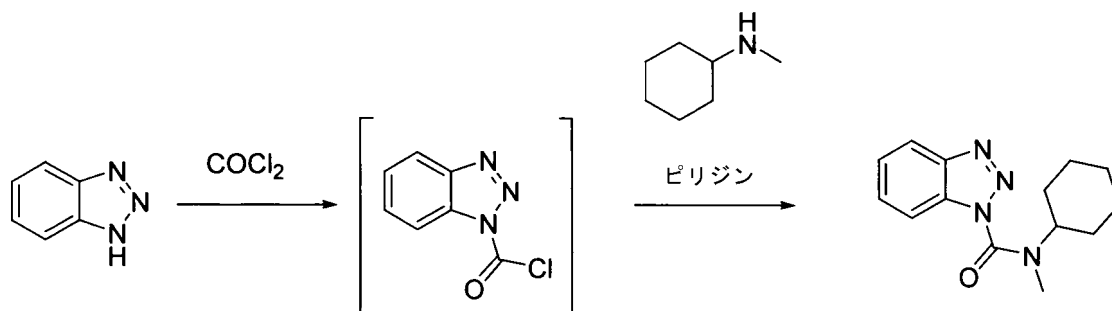
50

に酢酸 (20 ml, 349 mmol) を加え、1 時間かき混ぜながら 80 ~ 85 °C まで加熱し、ろ過で不溶性の黒色の物質を分離し、0 ~ 5 °C まで冷却し、30 分間熟成させ、沈殿物を採取し、水で洗浄し、45 °C で真空乾燥させた。9.48 g (90 %) を得た。

【0290】

N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド (二置換トリアゾール-1-カルボキサミド形成)

【化9】



10

テトラヒドロフラン (25 ml) に 1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール (0.5 g, 4.20 mmol) を加えた溶液を、トルエンにホスゲン (5.30 ml, 10.1 mmol) を加えた 0 ~ 5 °C の 20% 攪拌溶液に一滴ずつ加えた。この反応混合物を、20 ~ 25 °C で 2 時間攪拌した (TLC によって反応完了)。この溶液に、アルゴン を 15 分間吹き込んだ。その後、溶媒を真空蒸発させ、綺麗なオイルとして 1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボニルクロリド (0.763 g, 4.20 mmol) を得た。この生成物を、さらに精製はせずに使用した。テトラヒドロフラン (25 ml) にこのオイルを加えた 0 ~ 5 °C の攪拌溶液に、ピリジン (0.357 ml, 4.41 mmol) を一滴ずつ加えた。次に、0 ~ 5 °C の N-メチルシクロヘキサンアミン (0.499 g, 4.41 mmol) を一滴ずつ加えた。この溶液を、20 ~ 25 °C で一晩攪拌した。水および EtOAc を加え、有機層を分離し、1M HCl、水およびブラインで洗浄した。この有機層を乾燥させ (MgSO<sub>4</sub>)、真空蒸発させ、綺麗なオイルを得た。このオイルを 2-プロパノール / DCM から再結晶させ、固形物を採取し、40 ~ 45 °C で真空乾燥させた。230 mg (21%) を得た。

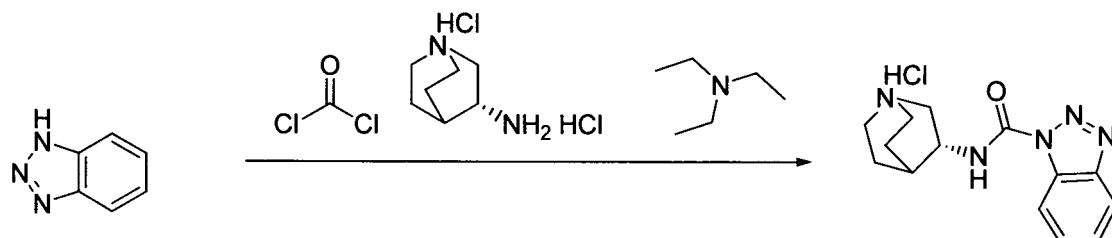
20

【0291】

(R)-N-(キヌクリジン-3-イル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド塩酸塩 (一置換トリアゾール-1-カルボキサミド形成)

30

【化10】



40

トルエンにホスゲン (1.052 ml, 2.000 mmol) を加えた 20% 溶液を、乾燥 DCM (5 ml) に 1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール (0.238 g, 2 mmol) を加えた 0 ~ 5 °C の溶液に加えた。この混合液を 20 ~ 25 °C で 30 分間攪拌し、0 ~ 5 °C まで冷却し、攪拌しながらトリエチルアミン (0.279 ml, 2.000 mmol) を加えた。この懸濁液を乾燥 DCM (5 ml) で希釈し、固形物の (R)-1-キヌクリジン-3-アミン二塩酸塩 (0.398 g, 2.000 mmol) およびトリエチルアミン (0.836 ml, 6.00 mmol) を、0 ~ 5 °C にて加えた。この混合液を 30 分間で 20 ~ 25 °C まで温め、2-プロパノールで希釈し、蒸発乾固させた。この残留物を水 (15 ml) と DCM (15 ml) に分配し、有機相を乾燥させ (MgSO<sub>4</sub>)、濃縮し、カラムで分離し (DCM-MeOH 9 : 1)、分画を採取してオイルを得た。このオイルを最低限の DCM が入ったエーテルに溶解させ、この溶液をエーテル中の 2M HCl で pH 1 ~ 2 まで酸性化させ、沈殿物を採取し、エーテル

50

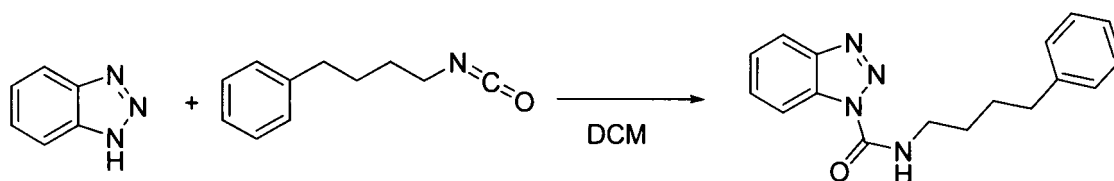


で洗浄し、45℃で真空乾燥させた。0.12 g (19.5%)を得た。

【0292】

N-(4-フェニルブチル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド (一置換トリアゾール-1-カルボキサミド形成)

【化11】



10

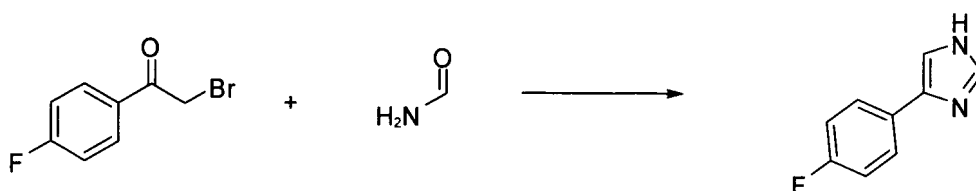
(4-イソシアナトブチル)ベンゼン(463 mg, 2.64 mmol)を、DCM (18 ml)に1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール (300 mg, 2.52 mmol)を加えた0~5℃の溶液に、一滴ずつ加えた。この綺麗な反応混合液を、20~25℃で一晩撹拌した。真空中で溶媒を除去し、綺麗なオイルを得た。このオイルを静置した状態で固形化させ、無色の固形物とした。この生成物を2-プロパノールから再結晶させ、固形分を採取し、45℃で真空乾燥させた。477 mg (64%)を得た。

【0293】

イミダゾール:

4-(4-フルオロフェニル)-1H-イミダゾール (イミダゾール合成)

【化12】



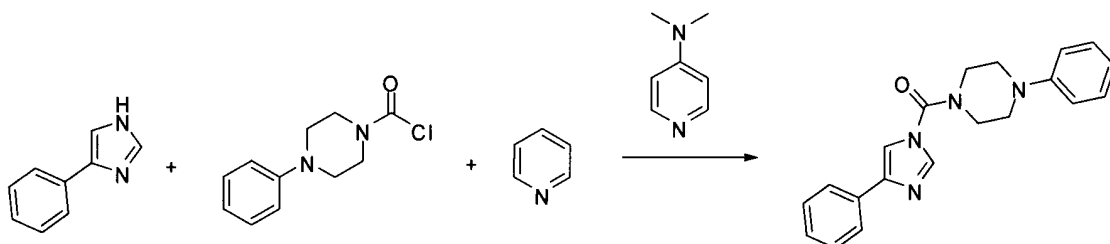
2-ブロモ-1-(4-フルオロフェニル)エタノン (5.93 g, 27.31 mmol)、ホルムアミド (13.45 ml, 339 mmol) および水 (1 ml) を、50 mlなし型フラスコに入れた。この反応液を140℃で4時間加熱した。その後、室温まで冷却し、150 mlの水に入れた。沈殿物をろ過で分離し、水で洗浄した。10%NaOH溶液を加え、ろ液のpHを12に調製した。得られた沈殿物をろ過で分離し、水で洗浄し、真空乾燥させた。(生成: 2.02g, 45%)

30

【0294】

(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)(4-フェニルピペラジン-1-イル)メタノン (アシル化)

【化13】



40

ピペリジン (0.489 ml, 6.00 mmol) およびDMAP (48.9 mg, 0.400 mmol) を、テトラヒドロフラン (20 ml) に4-フェニル-1H-イミダゾール (577 mg, 4 mmol)を加えた撹拌溶液に加えた。この淡黄色の溶液を4-フェニルピペラジン-1-カルボニルクロリド (944 mg, 4.20 mmol)で処理し、90℃で20時間加熱した。THFを真空中で除去し、すぐにその残留物をDCM:IPA (70:30) 混合液と水に分配した。有機相をMgSO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過した。蒸発させた後、粗生成物を加熱IPAから再結晶させ、ろ過し、真空乾燥させた。(生成: 7

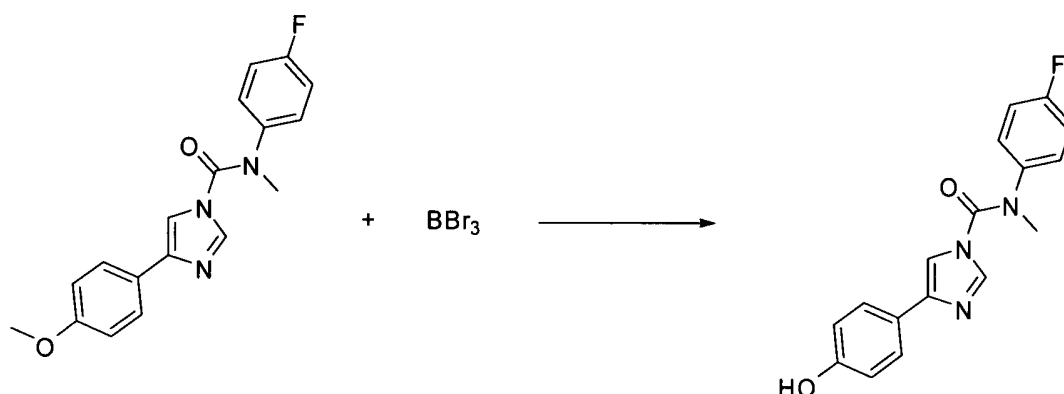
50

77 mg, 58%)

【 0 2 9 5 】

N-(4-フルオロフェニル)-4-(4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (脱保護)

【化 1 4】



10

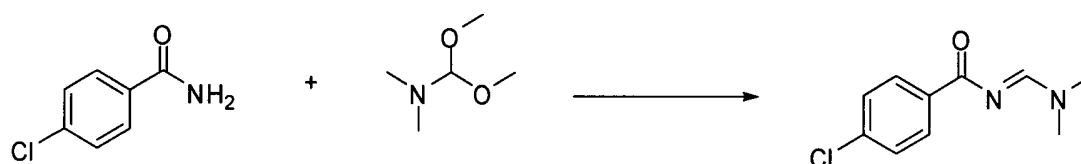
三臭化ホウ素 (0.164 ml, 1.740 mmol) を、ジクロロメタン (8 ml) に N-(4-フルオロフェニル)-4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (0.283 g, 0.870 mmol) を加えたメタノールドライアイス冷却溶液に加えた。この黒ずんだ反応液を室温まで温め、2時間攪拌した。TLCによって反応が完了したことが示された後、氷と水の混合物に入れ、30分間攪拌した。沈殿物はなかった。この混合液を DCM : IPA (70 : 30) で抽出し、有機相を  $\text{MgSO}_4$  で乾燥させ、ろ過した。DCM を真空中で除去し、生成物を IPA から沈殿させ、ろ過し、真空乾燥させた。(生成 : 210 mg, 78%)

20

【 0 2 9 6 】

1,2,4-トリアゾール :3-(4-クロロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール (環合成)

【化 1 5】

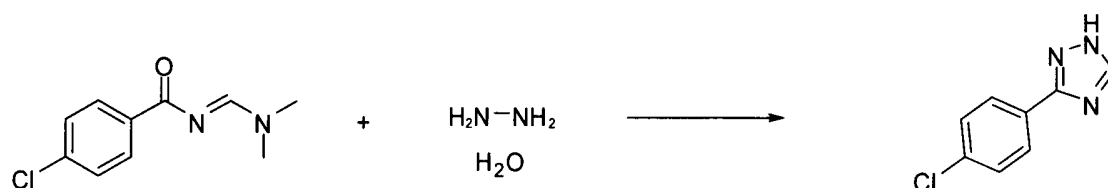


30

4-クロロベンズアミド (7.371 g, 47.4 mmol) を、1,1-ジメトキシ-N,N-ジメチルメタンアミン (15.73 ml, 118 mmol) に懸濁した。この反応混合液を 80 で 1 時間加熱した。その後、室温まで冷却し、過剰な 1,1-ジメトキシ-N,N-ジメチルメタンアミンを真空中で除去した。得られた固形分を石油エーテルとともに粉末にし、ろ過し、真空乾燥させた。(生成 : 9.44 g, 95%)

【 0 2 9 7 】

【化 1 6】



40

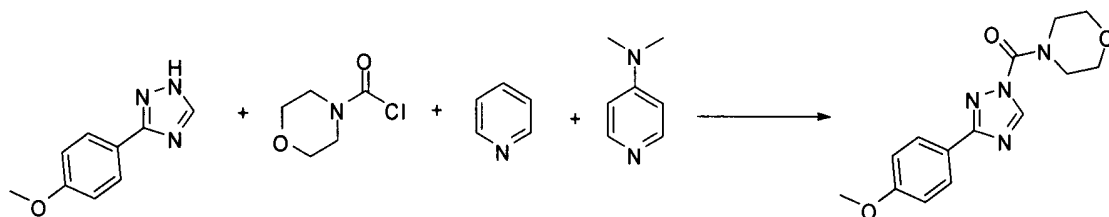
ヒドラジン水和物 (1.524 ml, 49.1 mmol) を、酢酸 (13.5 ml) に (E)-4-クロロ-N-((ジメチルアミノ)メチレン)ベンズアミド (9.4 g, 44.6 mmol) を加えた攪拌溶液に加えた。この反応混合液をすぐに凝固させ、120 で 2 時間加熱した。その後すぐに室温まで冷却し、トルエンと共沸させた。しばらくの間、結晶残留物を水とともに攪拌した。沈殿物をろ過で分離し、水で洗浄し、真空乾燥させた。(生成 : 7.27 g, 91%)

50

【 0 2 9 8 】

(3-(4-メトキシフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(モルホリノ)メタノン(アシル化)

【 化 1 7 】



10

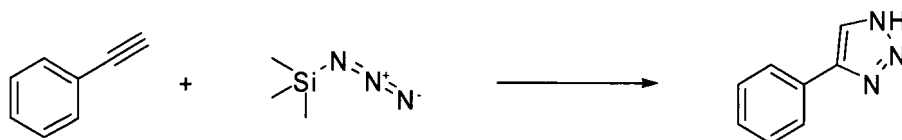
ピリジン (0.489 ml, 6.00 mmol) および DMAP (48.9 mg, 0.400 mmol) を、テトラヒドロフラン (20 ml) に 3-(4-メトキシフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール (701 mg, 4 mmol) を加えた攪拌溶液に加えた。この溶液をモルホリン-4-カルボニルクロリド (0.490 ml, 4.20 mmol) で処理し、90 で 20 時間加熱した。TLC によって、反応がほとんど完了したことが示された。THF を真空中で除去し、残留物を DCM と水に分配した。有機相を  $\text{MgSO}_4$  で乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。加熱 IPA からの再結晶により、749 mg の白い結晶を得た。(生成 : 65%)

【 0 2 9 9 】

1,2,3-トリアゾール :

4-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール (環合成)

【 化 1 8 】



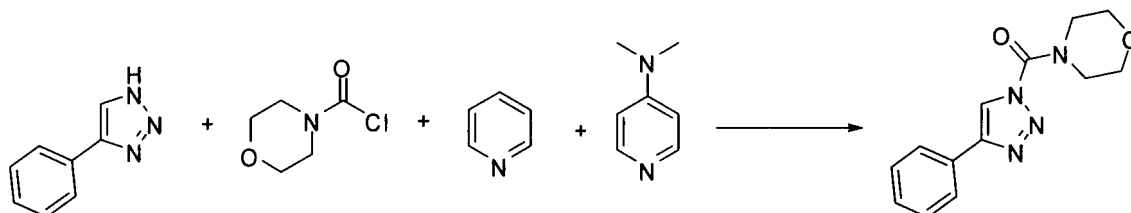
アジドトリメチルシラン (2.65 ml, 20.00 mmol) を、abs. トルエン (10 ml) にフェニルアセチレン (1.098 ml, 10 mmol) を加えた攪拌溶液に、一度に加えた。この反応液を 100 で 3 日間加熱し、その後すぐに室温まで冷却し、トルエンを真空中で除去した。残留物を DCM と水に分配した。有機相を  $\text{MgSO}_4$  で乾燥させ、ろ過した。蒸発の後、粗生成物をクロマトグラフィによって石油エーテル : EtOAc = 2 : 1 中で精製した。(生成 : 355 mg, 24%)

30

【 0 3 0 0 】

モルホリノ(4-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)メタノン(アシル化)

【 化 1 9 】



40

ピペリジン (0.286 ml, 3.51 mmol) および DAMP (0.029 g, 0.234 mmol) を、テトラヒドロフラン (12 ml) に 4-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール (0.340 g, 2.342 mmol) を加えた攪拌溶液に加えた。この溶液を、モルホリン-4-カルボニルクロリド (0.287 ml, 2.459 mmol) で処理した。この反応液を 90 で 20 時間加熱した。その後 THF を真空中で除去し、残留物を DCM と水に分配した。有機相を  $\text{MgSO}_4$  で乾燥させ、ろ過した。蒸発の後、粗生成物を IPA から再結晶させ、ろ過し、真空乾燥させた。(生成 : 193 mg, 29%)

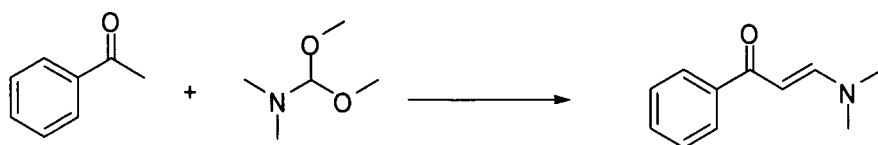
【 0 3 0 1 】

ピラゾール :

50

## 3-フェニル-1H-ピラゾール(環合成)

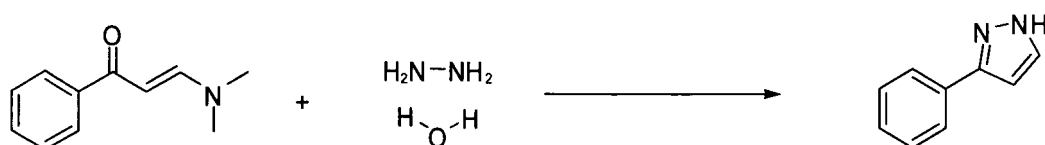
【化20】



アセトフェノン(5.89 ml, 50 mmol)を、1,1-ジメトキシ-N,N-ジメチルメタンアミン(13.39 ml, 100 mmol)に溶解させた。この反応混合液を120 で24時間加熱した。この赤黒い溶液を室温まで冷却し、過剰な1,1-ジメトキシ-N,N-ジメチルメタンアミンを真空中で除去した。得られた固形分を石油エーテルとともに粉末にし、ろ過し、真空乾燥させた。(生成: 6.78 g, 77%)

【0302】

【化21】

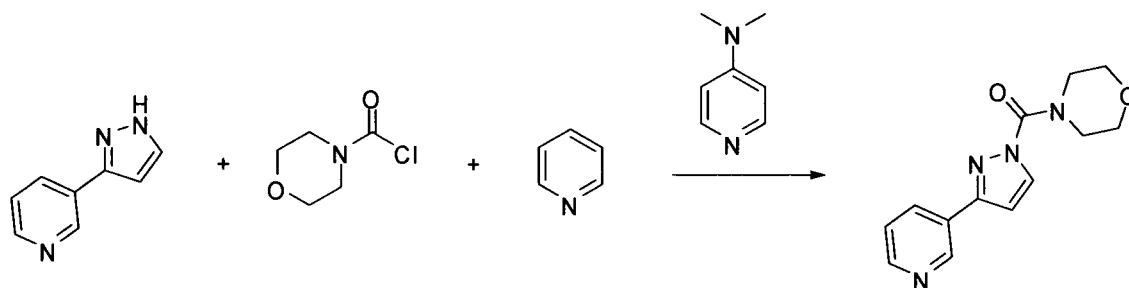


ヒドラジン水和物(1.459 ml, 30.0 mmol)を、エタノール(40 ml)に(E)-3-(ジメチルアミノ)-1-フェニル-2-プロペン-オン(2.63 g, 15 mmol)を加えた攪拌溶液に加えた。この反応混合液を100 で2時間加熱した、その後すぐに室温まで冷却し、エタノールを真空中で除去した。残留物をDCMと水に分配した。有機相をMgSO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過した。蒸発の後、粗生成物を、石油エーテルと酢酸エチルの混合液とともに粉末にし、精製した。(生成: 1.59 g, 73%)

【0303】

## モルホリノ(3-(ピリジン-3-イル)-1H-ピラゾール-1-イル)メタン(アシル化)

【化22】



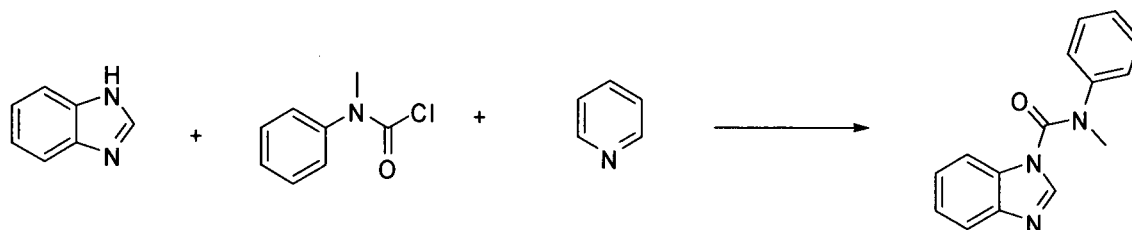
ピリジン(0.367 ml, 4.50 mmol)およびDMAP(18.33 mg, 0.150 mmol)を、テトラヒドロフラン(15 ml)に3-(1H-ピラゾール-3-イル)ピリジン(0.435 g, 3 mmol)を加えた攪拌溶液に加えた。この溶液を、4-モルホリニルカルボニルクロリド(0.368 ml, 3.15 mmol)で処理した。この反応液を80 で20時間加熱した。THFを真空中で除去し、残留物をDCMと水に分配した。有機相をMgSO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過した。蒸発の後、粗生成物をクロマトグラフィによって石油エーテル:EtOAc=2:1中で精製した。(生成: 174 mg, 21%)

【0304】

## ベンゾイミダゾール:

## N-メチル-N-フェニル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-1-カルボキサミド(アシル化)

## 【化 2 3】



ピリジン (0.367 ml, 4.50 mmol) を、テトラヒドロフラン (15 ml) に1H-ベンゾ[d]イミダゾール (354 mg, 3 mmol) を加えた攪拌溶液に加え、続いてメチル(フェニル)カルバミン酸クロリド (534 mg, 3.15 mmol) を加えた。この反応液を80 で20時間加熱した。THFを真空中で除去し、残留物をDCMと水に分配した。有機相をMgSO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過した。蒸発の後、粗生成物をクロマトグラフィによって石油エーテル:EtOAc=2:1中で精製した。(生成: 365 mg, 46%)

10

## 【0305】

次節では、特定の化合物のさらなる合成の例を提供する。

## 【0306】

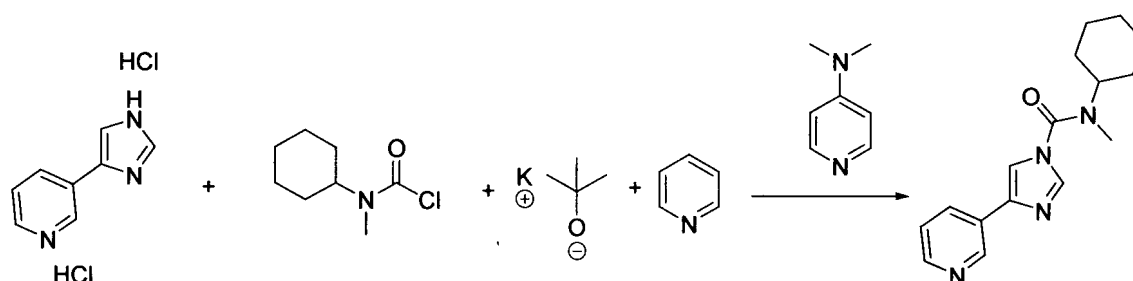
化合物 362 の調製

a) N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサ

ミド

20

## 【化 2 4】



カリウム tert-ブトキシド (1.795 g, 16.0 mmol) を、テトラヒドロフラン (29 mL) およびDMF (2.90 mL) の混合物に3-(1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン二塩酸塩 (1.745 g, 8 mmol) を加えた攪拌懸濁液に加え、この混合液を30分間還流させた。得られた茶色の懸濁液を室温まで冷却し、ピリジン (0.979 mL, 12 mmol) およびN,N-ジメチルピリジン-4-アミン (0.098 g, 0.8 mmol) で処理し、続いてシクロヘキシル(メチル)カルバミン酸クロリド (1.476 g, 8.4 mmol) を加えた。この反応液を90 で一晩加熱し、その後すぐにその混合液を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機相を乾燥させ (MgSO<sub>4</sub>)、ろ過した。蒸発の後、ジクロロメタン/メタノール (9:1) 混合液を用い、シリカゲルで粗生成物をクロマトグラフィ精製した。均質な分画を貯め、蒸発させ、白色の粉末が残った (160 mg, 7%)。

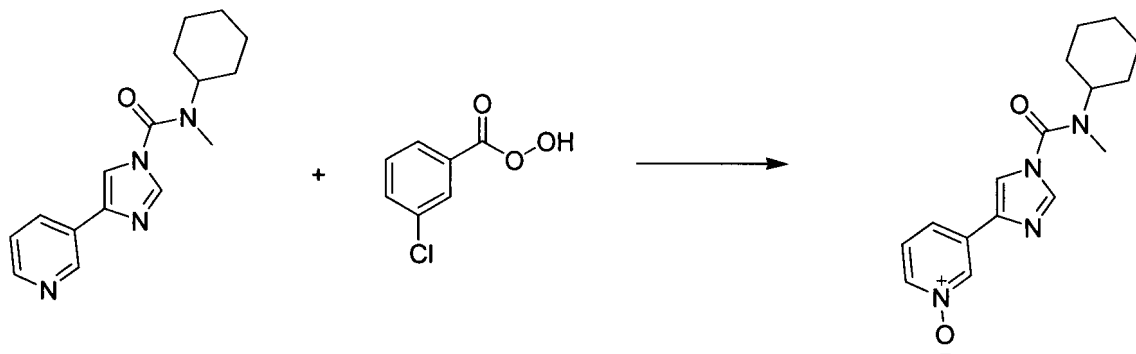
30

## 【0307】

40

b) 3-(1-(シクロヘキシル(メチル)カルバモイル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン1-オキサイド

## 【化 2 5】



10

3-クロロベンゾペルオキシ酸 (149 mg, 0.475 mmol) を、クロロホルム (5 mL) にN-シクロヘキシル-N-メチル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (90 mg, 0.317 mmol) を加えた溶液に、一度に加えた。この反応液を室温にて20時間攪拌した。TLCによって反応が完了したことが示され、この混合液を蒸発乾固させた。残留物をエーテルとともに粉末にし、得られた白色の結晶をろ過分離し、空气中で乾燥させた。加熱イソプロパノールからの再結晶により、白色の粉末を得た (46 mg, 46%)。

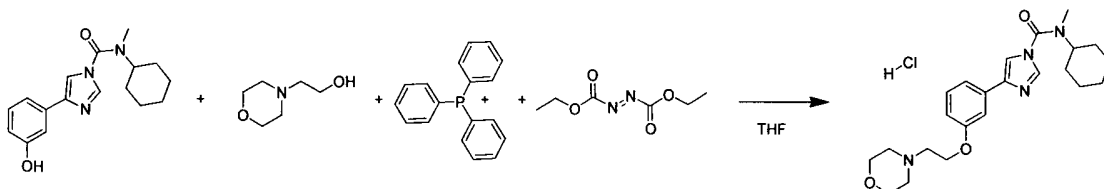
## 【0308】

化合物 408 の調製

20

N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(3-(2-モルホリノエトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド塩酸塩

## 【化 2 6】



N-シクロヘキシル-4-(3-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (170 mg, 0.568 mmol) を、窒素下で無水テトラヒドロフラン (10 mL) に取り込み、無色の溶液を得た。N-ベータ-ヒドロキシエチルモルホリン (0.068 mL, 0.568 mmol) を加え、その溶液を0℃まで冷却した。トリフェニルホスフィン (179 mg, 0.681 mmol) を加え、次にDEAD (0.108 mL, 0.68 mmol) を、一滴加えて黄色くなり、その色が消えてから次の一滴を加えるという操作を繰り返した。得られた淡黄色の溶液を室温まで温め、18時間攪拌した。その後、この反応混合液を0℃まで冷却し、新たなトリフェニルホスフィン (179 mg, 0.681 mmol) およびDEAD (0.108 mL, 0.68 mmol) を加えた。この溶液を、さらに6時間攪拌した。溶媒を蒸発させ、黄色のオイルをクロマトグラフィ精製した (シリカゲル H; 9/1、8/2、6/4、5/5、4/6 トルエン/アセトン)。純生成物を含む分画を蒸発させ、淡黄色のオイルを酢酸エチルに溶解させ、沈殿を生じさせた。この懸濁液を加熱して固形分を溶解させ、この溶液を0℃まで冷却した。2N HClを含むエーテル溶液を、一滴ずつ過剰に加えた。得られた混合液を0℃で10分間攪拌し、その後室温まで温め、さらに15分間攪拌した。沈殿物をろ過し、エーテルで洗浄し、乾燥させた。酢酸エチルからの再結晶により、淡いクリーム色の固形物を得た (39 mg, 14%)。

30

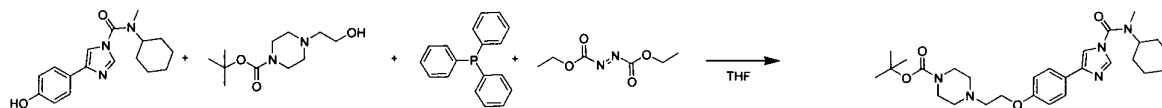
40

## 【0309】

化合物 397 の調製

a) tert-ブチル 4-(2-(4-(1-(シクロヘキシル(メチル)カルバモイル)-1H-イミダゾール-4-イル)フェノキシ)エチル)ピペラジン-1-カルボキシレート

## 【化 2 7】

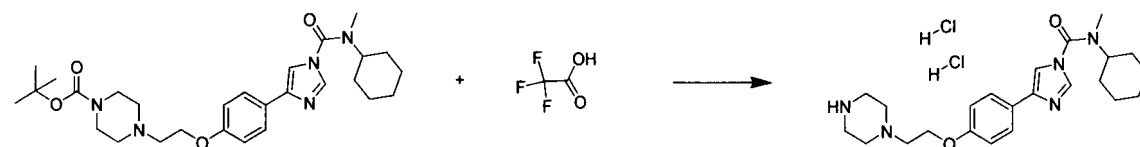


テトラヒドロフラン (10 mL) にN-シクロヘキシル-4-(4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (200 mg, 0.668 mmol) を加えた溶液を、窒素下で50 mLなし型フラスコに入れ、淡いピンク色の溶液を得た。tert-ブチル 4-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン-1-カルボキシレート (184 mg, 0.8 mmol) を加え、この溶液を0 まで冷却した。トリフェニルホスフィン (210 mg, 0.801 mmol) を加え、次にDEAD (0.12 7 mL, 0.8 mmol) を、一滴加えて黄色くなり、その色が消えてから次の一滴を加えるという操作を繰り返した。得られた淡黄色の溶液を室温まで温め、24時間攪拌した。溶媒を蒸発させ、淡黄色のオイルをクロマトグラフィ精製した (シリカゲル H; 10%、20%、30%、40%、50%、60% アセトン/トルエン)。純生成物を含む分画を蒸発させ、得られたページ 10  
 ュ色の固形分 (167 mg) を、さらに精製はせずに次の工程に使用した。

## 【 0 3 1 0】

b) N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(4-(2-(ピペラジン-1-イル)エトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 二塩酸塩

## 【化 2 8】



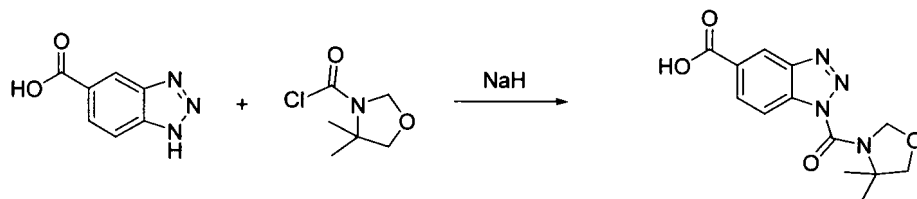
tert-ブチル 4-(2-(4-(1-(シクロヘキシル(メチル)カルバモイル)-1H-イミダゾール-4-イル)フェノキシ)エチル)ピペラジン-1-カルボキシレート (167 mg, 0.326 mmol) を、25 mLなし型フラスコに入れた。トリフルオロ酢酸 (3 mL, 38.9 mmol) を加え、淡黄色の溶液を得、室温で1時間攪拌した。溶媒を蒸発させ、残留した黄色いオイルを酢酸エチルに溶解させ、0 まで冷却した。その後すぐに、2N HClを含むエーテル溶液を過剰に加えた。混合液を0 で10分間攪拌し、その後室温まで温め、15分間攪拌した。混合液を蒸発させ、残留物をイソプロパノールから再結晶させた。この結晶をろ過し、イソプロパノールで洗浄し、乾燥させ、白色の固体生成物を得た (115 mg, 69 %)。 30

## 【 0 3 1 1】

化合物 3 8 9 の調製

a) 1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-カルボン酸

## 【化 2 9】



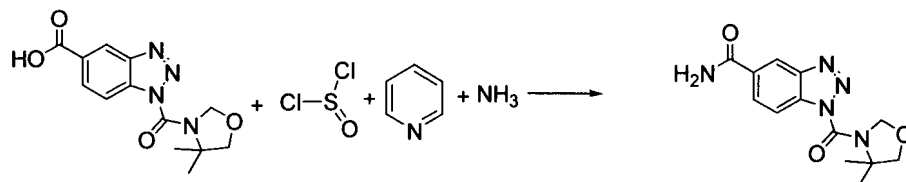
テトラヒドロフラン (90 mL) およびジメチルホルムアミド (50 mL) の混合物に1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-カルボン酸 (50 mL) を加えた溶液を、テトラヒドロフラン (30 mL) に水素化ナトリウム (1.839 g, 46 mmol) を加えた0 の攪拌懸濁液に、一滴ずつ加えた。この懸濁液を室温で30分間攪拌し、テトラヒドロフラン (10 mL) に4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニルクロリド (3.16 g, 19.31 mmol) を加えた0 の溶液を、一滴ずつ加えた。この反応混合液を室温で4時間攪拌した。0 の水を加え、溶媒を蒸発させた。ジクロロメタン/イソプロパノール (7:3) の混合液を加え、有機層を分 50

離した。水層をジクロロメタンで再抽出し、この合わせた有機層を乾燥させ (MgSO<sub>4</sub>)、ろ過し、蒸発させた。このオレンジ色の結晶をイソプロパノールから再結晶させ、ベージュ色の固形物 (840 mg) を得、これをさらに精製はせずに次の工程に使用した。

【0312】

b) 1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-カルボキサミド

【化30】



10

塩化チオニル (0.633 mL, 8.67 mmol) を、ジクロロメタン (17 mL) に1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-6-カルボン酸 (0.763 g, 2.63 mmol) およびピリジン (0.702 mL, 8.67 mmol) を加えた室温の攪拌溶液に、一滴ずつ加えた。この黄色の溶液を、室温で15分間攪拌した。その後、この溶液を、1.75 N アンモニア溶液 (15.02 mL, 26.3 mmol) を含む0 のエタノール溶液に一滴ずつ加え、すぐに白色の懸濁液が生じた。この反応混合液を室温でさらに30分間攪拌した。水を加え、エタノールを蒸発させた。その後、残留物をジクロロメタンで希釈し、有機層を分離し、1N HCl溶液で洗浄した。この有機層を乾燥させ (MgSO<sub>4</sub>)、ろ過し、蒸発させて黄色の固形物を得た。この固形物を、ジクロロメタン/エタノール混合液から再結晶させ、ベージュ色の固体生成物を得た (151 mg, 20 %)。

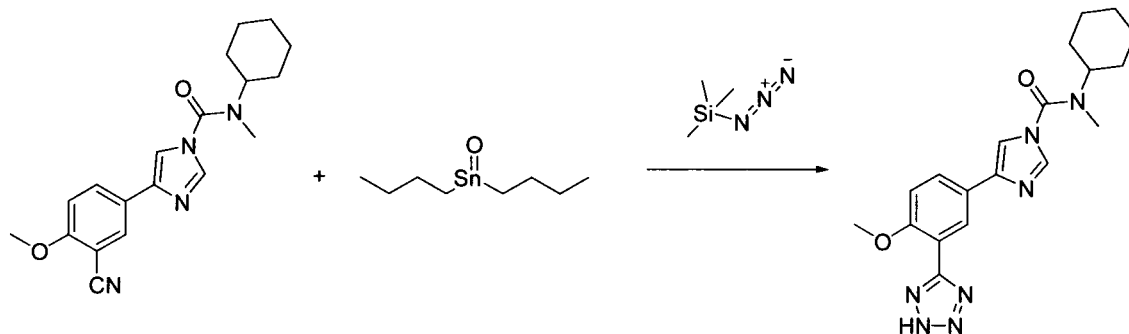
20

【0313】

化合物438の調製

N-シクロヘキシル-4-(4-メトキシ-3-(2H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

【化31】



30

4-(3-シアノ-4-メトキシフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (305 mg, 0.901 mmol)、ジブチルスチラン (28.0 mg, 0.113 mmol) およびアジドトリメチルシラン (0.239 mL, 1.803 mmol) の混合液を、トルエン (8 mL) 中で、115 °C で20時間加熱した。その後、この混合液を室温まで冷却し、蒸発乾固させた。ジクロロメタン/メタノール (95:5) 混合液を用い、粗生成物を、シリカゲルでクロマトグラフィ精製した。均質な分画の蒸発後、残留生成物をジエチルエーテルとともに粉末にし、ろ過し、乾燥させ、オフホワイト色の結晶生成物を得た (196 mg, 54 %)。

40

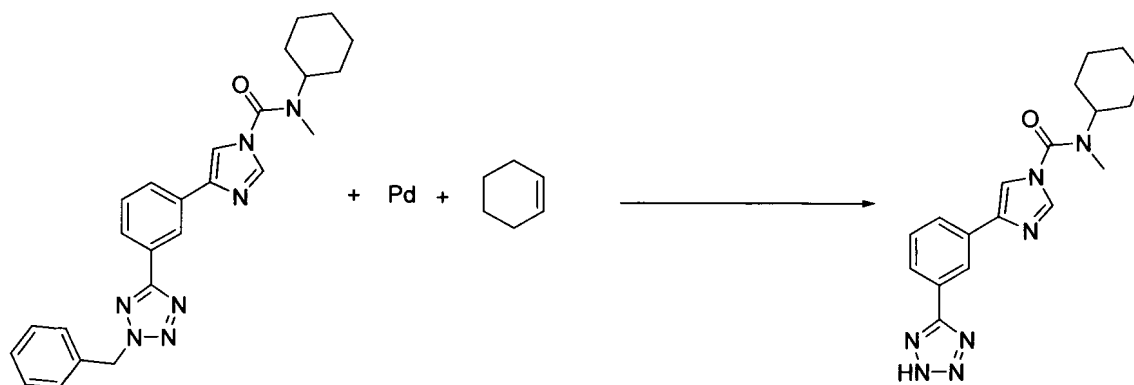
【0314】

化合物576の調製

4-(3-(2H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド



## 【化 3 2】



10

4-(3-(2-ベンジル-2H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (256 mg, 0.58 mmol)、10%パラジウム炭素 (30.9 mg, 0.029 mmol) およびシクロヘキセン (1.175 ml, 11.6 mmol) の攪拌混合液を、シールド管中で80 に加熱した。その後、この反応液を室温まで冷却し、セライトパッドでろ過し、蒸発乾固させた。得られたオイルを、ジクロロメタン/メタノール (90 : 10) を用い、シリカでクロマトグラフィ精製した。均質な分画を貯め、蒸発させ、その残留物をジエチルエーテルから結晶化させ、オフホワイト色の結晶生成物を得た (45 mg, 21%)。

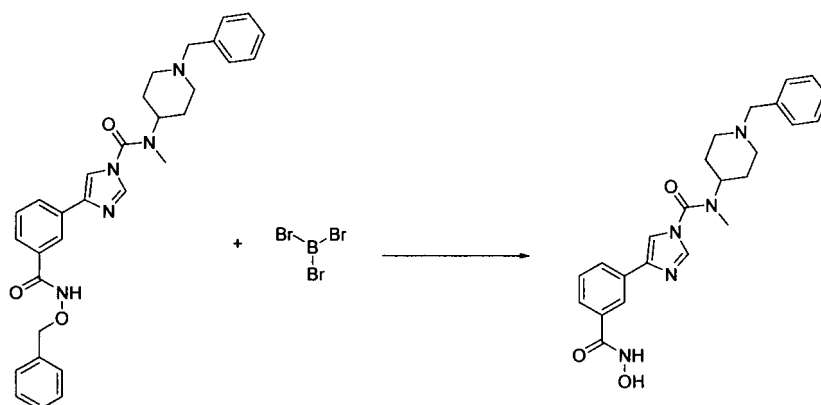
20

## 【 0 3 1 5】

化合物 4 2 3 の調製

N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(3-(ヒドロキシカルバモイル)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

## 【化 3 3】



30

三臭化ホウ素 (0.022 mL, 0.229 mmol) を、ジクロロメタン (5 mL) に4-(3-(ベンジロキシカルバモイル)フェニル)-N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (120 mg, 0.229 mmol) を加えた-78 の攪拌溶液に加えた。この反応液を冷却下で5分間攪拌し、室温まで1時間温めた。この反応液を-20 に冷却し、メタノールで注意深くクエンチした。その後すぐに溶媒を蒸発で除去し、残留物をジクロロメタン/イソプロパノール (7 : 3) の混合液に取り込み、飽和NaHCO<sub>3</sub>溶液で洗浄し、その後乾燥させた (MgSO<sub>4</sub>)。ろ過した後、ジクロロメタンを蒸発させて容量を小さくし、得られた沈殿物をろ過で分離し、イソプロパノールで洗浄し、乾燥させ、オフホワイト色の粉末生成物を得た (58 mg, 55%)。

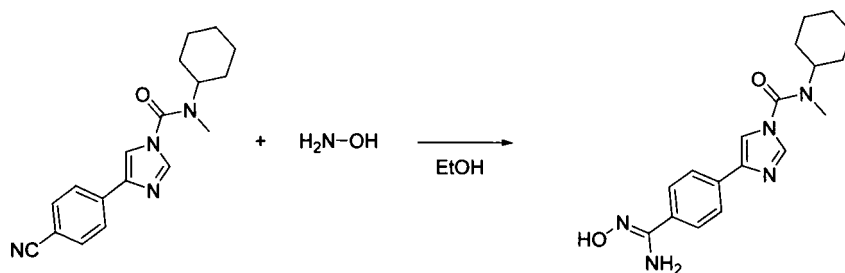
40

## 【 0 3 1 6】

化合物 5 5 1 の調製

a) (Z)-N-シクロヘキシル-4-(4-(N'-ヒドロキシカルバムイミドイル)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

## 【化 3 4】



エタノール（9 mL）に4-(4-シアノフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド（600 mg, 1.946 mmol）を加えた室温の溶液を、25 mL丸底フラスコに入れ、白色の懸濁液を得た。水（0.298 mL, 4.86 mmol）に50%のヒドロキシルアミンを加えた溶液を一滴ずつ加え、得られた混合液を90℃で90分間加熱した。その後、この混合液を室温まで冷却し、いくつかの沈殿物が生じ、それをろ過し、エタノールで洗浄した。この固形物を、加熱酢酸エチル（約70 mL）および石油エーテル（約150 mL）の混合液から再結晶させた。この結晶をろ過し、石油エーテルで洗浄し、乾燥させ、白色の固形物を得た（230 mg, 29%）。

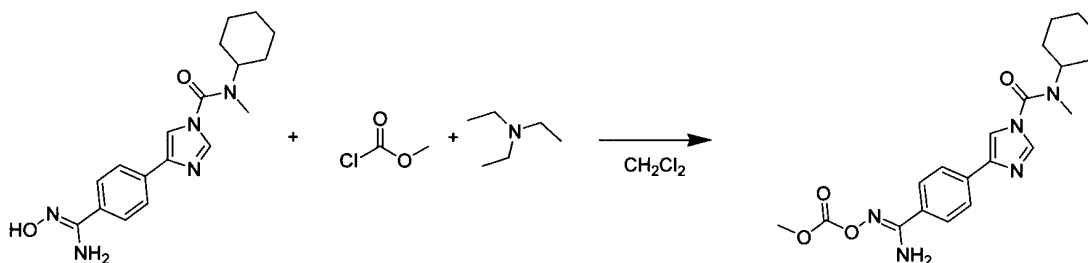
10

## 【 0 3 1 7】

b) (Z)-N-シクロヘキシル-4-(4-(N'-(メトキシカルボニルオキシ)カルバムイミドイル)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

20

## 【化 3 5】



無水ジクロロメタン（3 mL）に(Z)-N-シクロヘキシル-4-(4-(N'-(ヒドロキシカルバムイミドイル)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド（228 mg, 0.668 mmol）を加えた溶液を、窒素下で25 mLなし型フラスコに入れ、白色の懸濁液を得た。トリエチルアミン（0.102 mL, 0.735 mmol）を加え、この懸濁液を0℃に冷却し、30分間撹拌した。その後すぐにクロロギ酸メチルエステル（0.065 mL, 0.835 mmol）を一滴ずつ加え、この混合液を0℃で30分間撹拌し、室温まで温め、さらに30分間撹拌した。沈殿物をろ過で分離し、イソプロパノールおよびジクロロメタン（3:7）の混合液に溶解させた。この溶液を、上からろ液と混ぜ合わせ、1N HCl、水およびブラインで洗浄し、乾燥させ（Mg SO<sub>4</sub>）、ろ過し、蒸発させ、白色の固形物を得た（228 mg, 82%）。

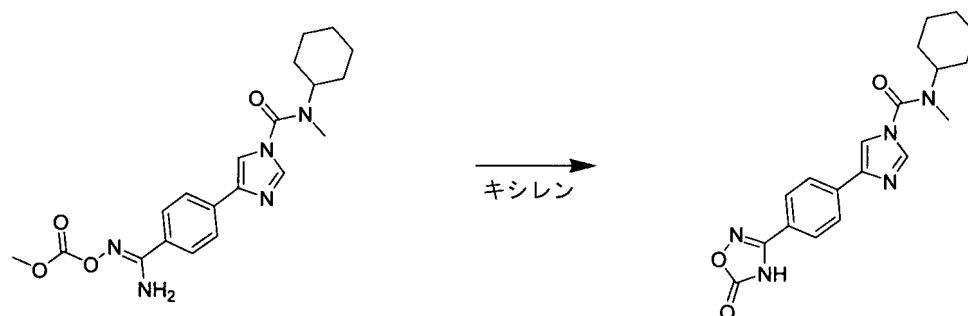
30

## 【 0 3 1 8】

c) N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(4-(5-オキソ-4,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

40

## 【化 3 6】



10

キシレン (10 mL) に (Z)-N-シクロヘキシル-4-(4-(N'-(メトキシカルボニルオキシ)カルバムイミドイル)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (200 mg, 0.501 mmol) を加えた溶液を、窒素下で 50 mL なし型フラスコに入れ、白色の懸濁液を得た。この混合液を 140 で 4 時間加熱し、室温まで冷却した。生じた沈殿物をろ過で分離し、ろ過ケーキをキシレンで洗浄した。この固形物を乾燥させた後、ジクロロメタンおよびイソプロパノールの混合液に溶解させた。蒸発によって容量を小さくした後、この溶液を室温まで冷却し、生じた沈殿物をろ過で分離し、乾燥させ、淡いピンク色の固形生成物を得た (134 mg, 69 %)。

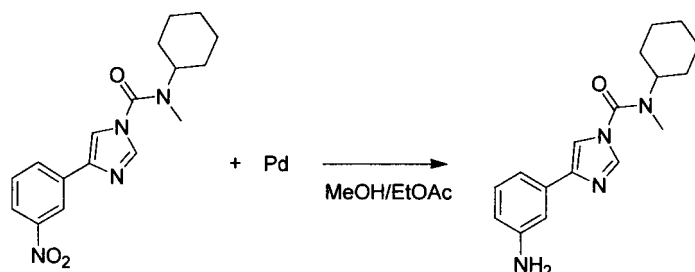
## 【 0 3 1 9】

化合物 5 5 3 の調製

20

a) 4-(3-アミノフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

## 【化 3 7】



30

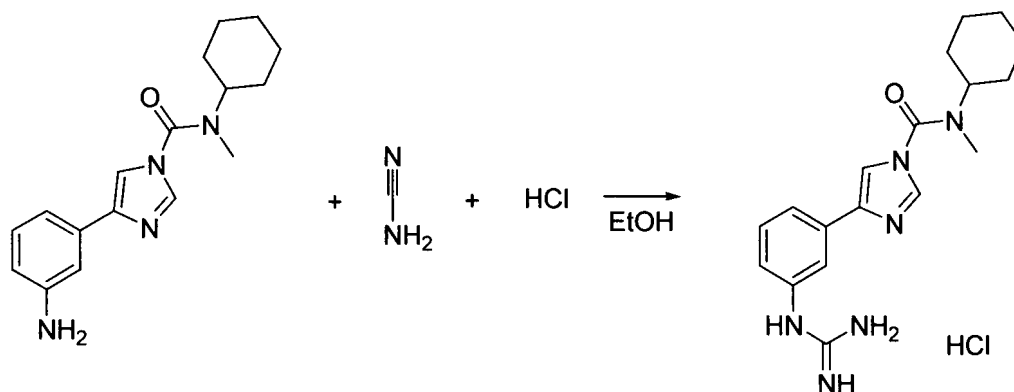
10%パラジウム炭素 (0.122 g, 0.115 mmol) を、酢酸エチル (46 mL) およびメタノール (46 mL) の混合物に N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(3-ニトロフェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (0.755 g, 2.299 mmol) を加えた室温の攪拌溶液に、アルゴン雰囲気下に加えた。その後、この混合液を、室温にて、水素雰囲気下で 50 分間攪拌した。この混合液をセライトでろ過し、パッドをメタノールで洗浄した。集められたろ液を蒸発させ、綺麗なオイル / 発泡体 (691 mg, 100 %) を得、これをさらに精製はせずに次の工程に使用した。

## 【 0 3 2 0】

b) N-シクロヘキシル-4-(3-グアニジノフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩

40

## 【化 3 8】



10

ガス状の無水塩酸（0.096 mL, 1.156 mmol）を、エタノール（1.2 mL）に4-(3-アミノフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド（0.345 g, 1.156 mmol）およびシアナミド（0.135 mL, 1.734 mmol）を加えた室温の攪拌懸濁液に加えた。この綺麗な溶液を1時間の還流で攪拌し、無色の固形物が生じた。この反応混合液をさらに7時間の還流で攪拌し、その後すぐに冷却した。この固形物をろ過で分離し、エタノールで洗浄し、無色の固体生成物を得た（298 mg, 68 %）。

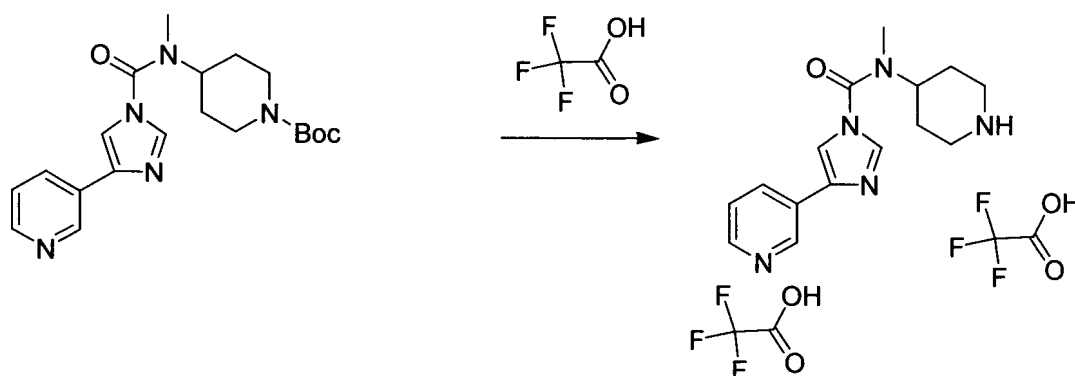
## 【 0 3 2 1】

BIA化合物 5 5 3 の調製

20

a) N-メチル-N-(ピペリジン-4-イル)-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド ビス(2,2,2-トリフルオロ酢酸塩)

## 【化 3 9】



30

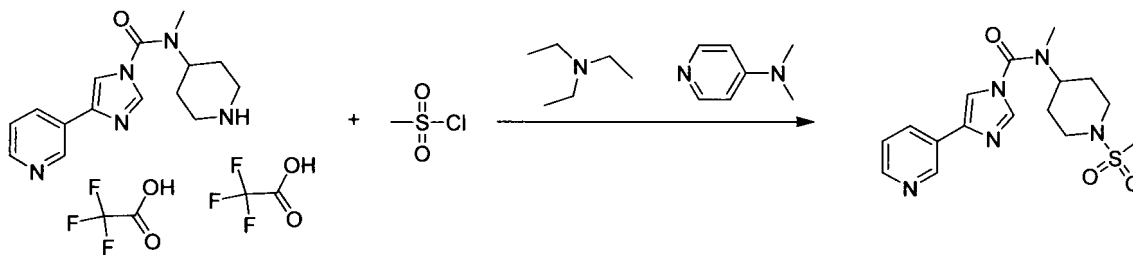
トリフルオロ酢酸（4 mL, 51.9 mmol）を、tert-ブチル 4-(N-メチル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド)ピペリジン-1-カルボン酸塩（500 mg, 1.297 mmol）に加え、濁った溶液を得た。この混合液を室温で1時間攪拌し、その後すぐに溶媒を蒸発で除去した。この油性の残留物をエーテルとともに粉末にし、得られた白色固形物をろ過で分離し、白色固形物を得た（653.2 mg, 88%生成）。

## 【 0 3 2 2】

40

b) N-メチル-N-(1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル)-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

## 【化 4 0】



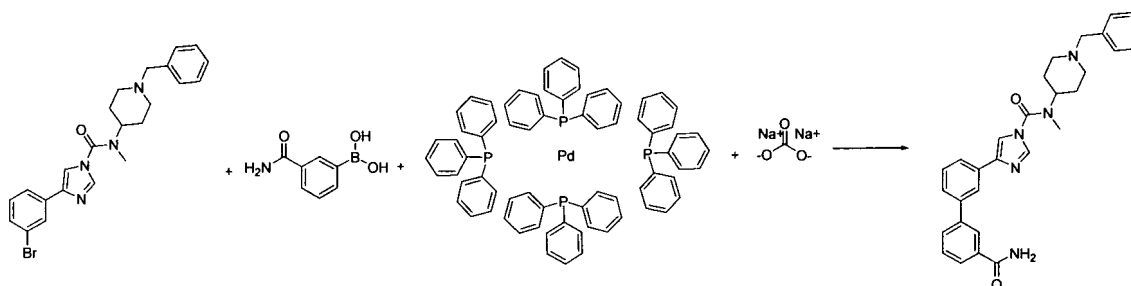
DMAP (35.7 mg, 0.292 mmol) を、ジクロロメタン (10 mL) にN-メチル-N-(ピペリジン-4-イル)-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド ビス(2,2,2-トリフルオロ酢酸塩) (300 mg, 0.584 mmol) を加えた氷冷懸濁液に加え、続いてトリエチルアミン (0.326 mL, 2.337 mmol) を一滴ずつ加え、次に塩化メタンスルホニル (0.072 mL, 0.934 mmol) を加えた。この溶液を室温で一晩攪拌し、その後すぐにメタノールを加えることによりクエンチし、室温で攪拌した。白色の沈殿物をろ過で採取し、メタノールおよびエーテルで洗浄し、乾燥させ、白色の固体生成物を得た (158 mg, 74 %)。

## 【 0 3 2 3】

化合物 5 5 0 の調製

N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(3'-カルバモイルピフェニル-3-イル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

## 【化 4 1】



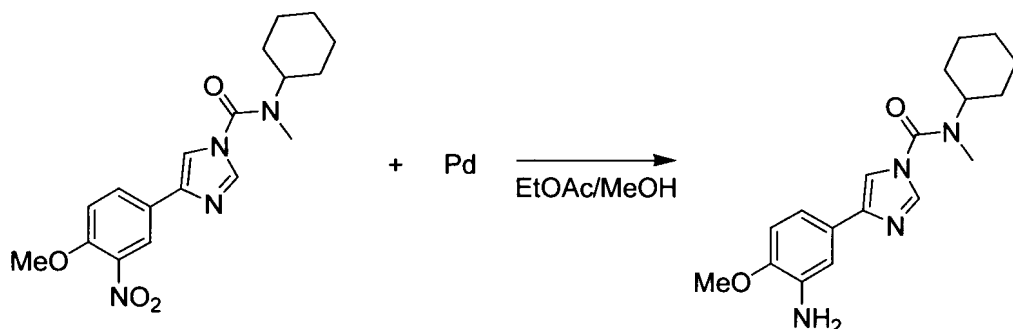
テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム錯体 (0.076 g, 0.066 mmol) を、室温の1-プロパノール (5 mL) および水 (1 mL) の混合物にN-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(3-ブロモフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (0.600 g, 1.323 mmol)、3-カルバモイルフェニルボロン酸 (0.229 g, 1.390 mmol) および2 M 炭酸ナトリウム溶液 (0.794 mL, 1.588 mmol) を加えた攪拌分散液に加えた。この反応混合液を90 °Cで1時間攪拌した。水を加え、有機層をジクロロメタン/イソプロパノール (7:3) の混合液で希釈した。この有機層を分離し、乾燥させ (MgSO<sub>4</sub>)、ろ過し、蒸発させてオレンジ色のオイルを得た。カラムクロマトグラフィ (シリカ、ジクロロメタン/メタノール 5%) により、オレンジ色のオイルの生成物を得た。このオイルを、石油エーテル/酢酸エチル/エーテルの混合液とともに粉末にし、ベージュ色の固体生成物を得た (123 mg, 17%)。

## 【 0 3 2 4】

化合物 4 8 5 の調製

a) 4-(3-アミノ-4-メトキシフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

## 【化 4 2】



10

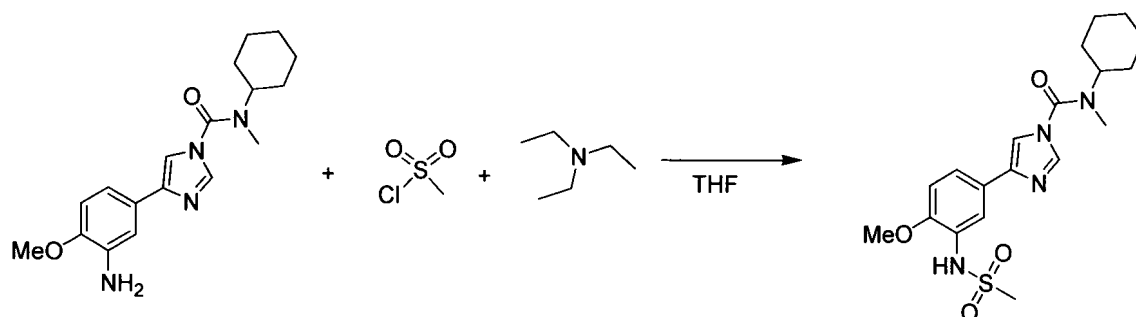
10%パラジウム炭素 (0.16 g, 0.15 mmol) を、酢酸エチル (50 mL) およびメタノール (50 mL) の混合物にN-シクロヘキシル-N-メチル-4-(4-メトキシ-3-ニトロフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (1.075 g, 3 mmol) を加えた室温の攪拌溶液に、アルゴン雰囲気下で加えた。この溶液に、水素を1時間吹き込んだ。その後、この溶液をセライトでろ過し、パッドを酢酸エチルで洗浄した。集められたろ液を蒸発させ、茶色の油性固形物を得、これをさらに精製はせずに次の工程に使用した。

## 【 0 3 2 5】

b) N-シクロヘキシル-4-(4-メトキシ-3-(メチルスルホンアミド)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

## 【化 4 3】

20



塩化メシル (0.247 mL, 3.17 mmol) を、テトラヒドロフラン (6 mL) に4-(3-アミノ-4-メトキシフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (1.04 g, 3.17 mmol) およびトリエチルアミン (0.441 mL, 3.17 mmol) を加えた室温の攪拌溶液に加えた。この茶色い混合液を室温で週末にかけて攪拌した。水を加え、溶媒を蒸発させた。その後、水層を酸性化させ、残留物を酢酸エチルで抽出した。この水層をジクロロメタン/イソプロパノール (7:3) の混合液で2回抽出した。有機層を分離し、乾燥させ (MgSO<sub>4</sub>)、ろ過し、蒸発させ、オフホワイト色の固形物を得た。この固形物を、エタノール/ジクロロメタンの混合液から再結晶させ、オフホワイト色の固体生成物を得た (434mg, 34%)。

30

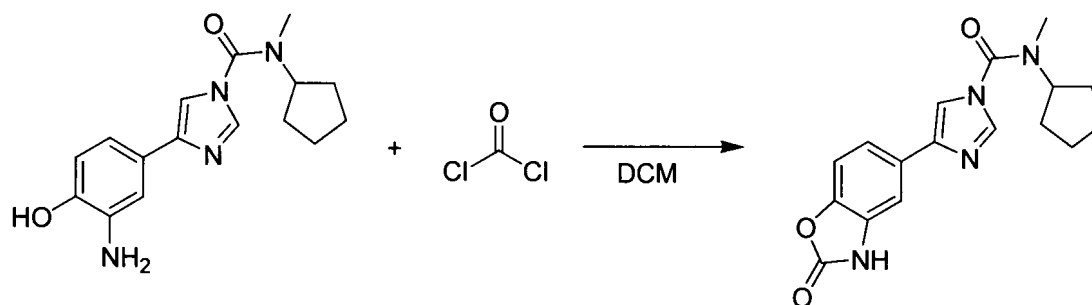
## 【 0 3 2 6】

化合物 5 6 4 の調製

40

N-シクロペンチル-N-メチル-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-yl)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

## 【化 4 4】



10

ホスゲン (0.590 mL, 1.121 mmol) を含む20%トルエン溶液を、ジクロロメタン (5 mL) に4-(3-アミノ-4-ヒドロキシフェニル)-N-シクロペンチル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (0.259 g, 0.862 mmol) を加えた室温の攪拌溶液に一滴ずつ加え、そのオフホワイト色の懸濁液を5時間攪拌した。水を加え、有機層をジクロロメタン/イソプロパノール (7:3) の混合液で希釈した。この有機層を分離し、乾燥させ (MgSO<sub>4</sub>)、ろ過し、蒸発させ、オフホワイト色の固形物を得、これを加熱メタノールとともに粉末にした。ろ過および乾燥により、オフホワイト色の固体生成物を得た (90 mg, 30%)。

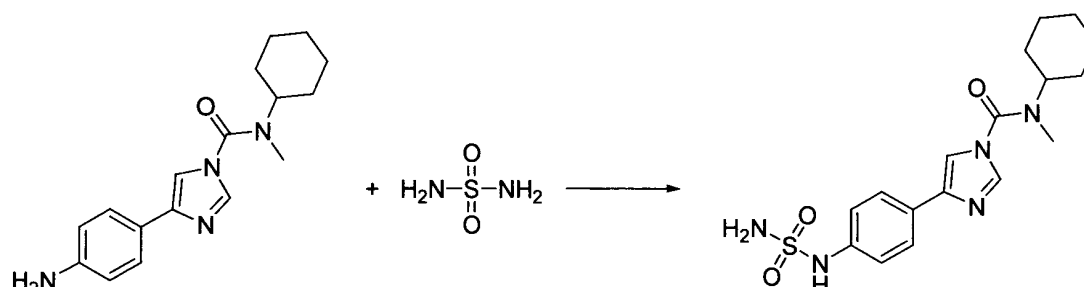
## 【 0 3 2 7】

化合物 5 8 0 の調製

N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(4-(スルファモイルアミノ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

20

## 【化 4 5】



30

スルファミド (0.089 g, 0.922 mmol) を、ジオキサン (2 mL) に4-(4-アミノフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (0.250 g, 0.838 mmol) を加えた室温の攪拌懸濁液に加えた。この懸濁液を4時間の還流で加熱し、綺麗な溶液を得、その後すぐにスルファミド (0.089 g, 0.922 mmol) をさらに加え、この混合液をさらに2.5時間の還流で加熱した。溶媒を除去し、茶色の残留物をクロマトグラフィ精製した (シリカ、ジクロロメタン/メタノール、1%、2%、5%)。均質な分画を貯め、蒸発させた。残留物を酢酸エチルとともに粉末にし、生じた無色の固形物をろ過で分離した。ろ液を蒸発させ、調製用TLCで再度精製した (シリカ、ジクロロメタン/10%メタノール)。酢酸エチル/10%メタノールの混合液で、生成物をシリカから抽出した。溶媒の蒸発により、綺麗なオイルを得、これを酢酸エチルおよびメタノールの混合液とともに粉末にし、オフホワイト色の固体生成物を得た (19 mg, 6%)。

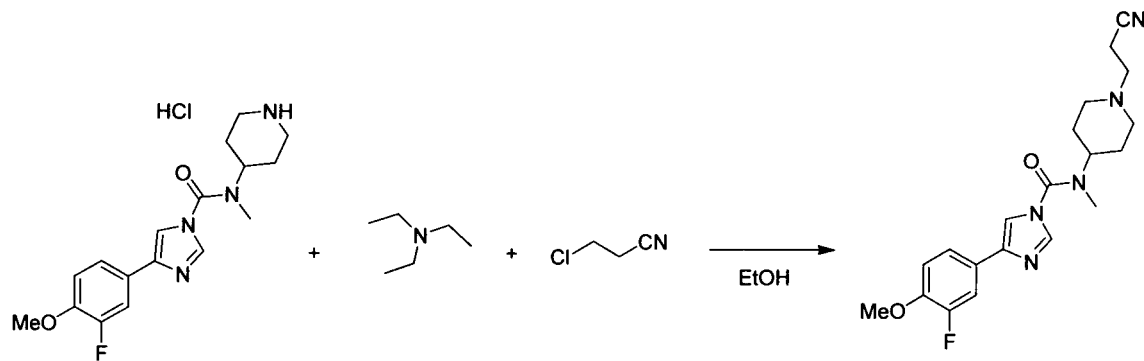
40

## 【 0 3 2 8】

化合物 5 4 1 の調製

N-(1-(2-シアノエチル)ピペリジン-4-イル)-4-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

## 【化 4 6】



10

トリエチルアミン (0.159 mL, 1.139 mmol) を、室温の4-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-N-メチル-N-(ピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩 (0.200 g, 0.542 mmol) および3-クロロプロパンニトリル (0.058 g, 0.651 mmol) の攪拌懸濁液に加えた。この綺麗な溶液を2時間の還流で攪拌し、この間に白色の懸濁液を生じた。この混合液を室温まで冷却し、ジクロロメタン/イソプロパノール (7:3) の混合液で希釈し、水で洗浄した。有機層を乾燥させ ( $\text{MgSO}_4$ )、ろ過し、蒸発させ、無色の固形物を得、これをエタノールとともに粉末にし、生成物を得た (142mg, 64%)。

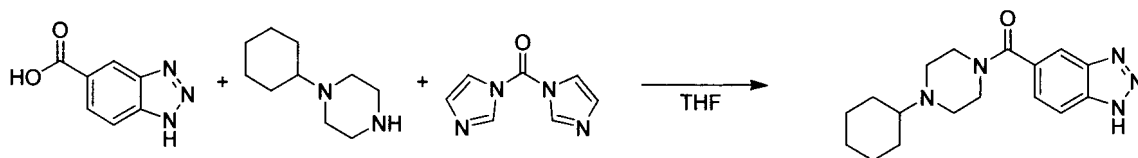
## 【 0 3 2 9】

化合物 5 0 5 の調製

20

a) (1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-イル)(4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)メタノン

## 【化 4 7】



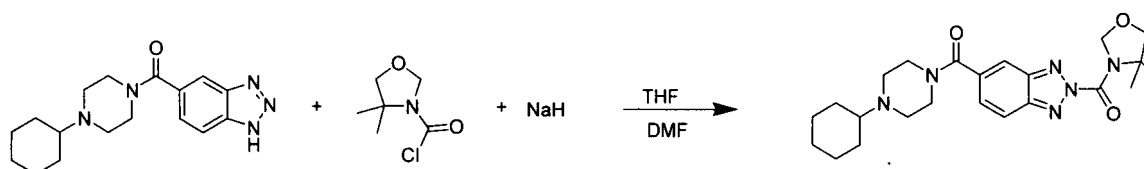
無水テトラヒドロフラン (10 mL) に1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-カルボン酸 (510 mg, 3.126 mmol) を加えたものを窒素下で100 mL丸底フラスコに入れ、茶色の懸濁液を得た。CDI (558 mg, 3.439 mmol) を数回にわけて加え、この混合液を室温で1.5時間攪拌した。その後、1-シクロヘキシルピペラジン (658 mg, 3.908 mmol) を数回にわけて加え、得られた茶色の溶液を室温でさらに30分間攪拌した。溶媒を蒸発させ、茶色のオイルを30%イソプロパノール/ジクロロメタン/水に分配した。有機相を分離し、水およびブラインで洗浄し、乾燥させ ( $\text{MgSO}_4$ )、ろ過し、蒸発させた。得られたベージュ色の発泡体を、クロマトグラフィ精製した (シリカゲル H; ジクロロメタン、2%、3%、5% メタノール/ジクロロメタン)。純生成物を含む分画を蒸発させ、淡いオレンジ色の発泡体をヘプタンとともに粉末にした。この固形物をろ過し、乾燥させ、ベージュ色の固形物を得た (605mg, 54%)。

30

## 【 0 3 3 0】

b) (4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)(2-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-2H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-イル)メタノン シュウ酸塩

## 【化 4 8】



40

テトラヒドロフラン (15 mL) およびN,N-ジメチルホルムアミド (3 mL) に(1H-ベンゾ[

50



d)[1,2,3]トリアゾール-5-イル)(4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)メタノン (612 mg, 1.953 mmol) を加えた溶液を、100 mL丸底フラスコに入れ、淡黄色の溶液を得た。この溶液を0℃まで冷却し、水素化ナトリウム (70.3 mg, 2.93 mmol) を含む60%鉱油分散液を加えた。得られた淡いピンク色の溶液を室温まで温め、45分間撹拌した。その後、この混合液を再び0℃まで冷却し、テトラヒドロフラン (2.5 mL) に4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニルクロリド (351 mg, 2.148 mmol) を加えた溶液を、一滴ずつ加えた。得られた淡黄色の溶液を室温まで温め、4時間撹拌した。溶媒を蒸発させ、残留物に水を加え、トルエンで抽出した。有機層を水およびブラインで洗浄し、乾燥させ (MgSO<sub>4</sub>)、ろ過し、蒸発させた。得られた黄色いオイルをクロマトグラフィ精製した (シリカゲル H; ジクロロメタン、2% メタノール/ジクロロメタン)。純生成物を含む分画を貯め、蒸発させ、淡黄色の発泡体を得た (690mg, 80%)。

【0331】

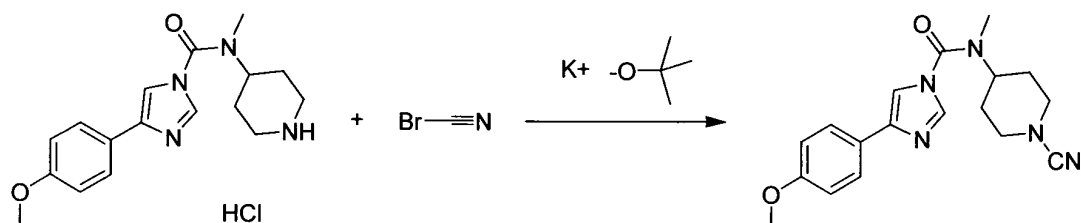
メタノール (5 mL) に(4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)(2-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-2H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-イル)メタノン (300 mg, 0.681 mmol) を加えた室温の溶液を50mLなし型フラスコに入れ、黄色い溶液を得た。シュウ酸二水和物 (86 mg, 0.681 mmol) を一度に加え、この溶液を室温で2時間撹拌した。溶媒を蒸発させ、得られた淡黄色の発泡体をイソプロパノールから再結晶させた。ろ過および乾燥の後、白色の固形物の生成物を得た (150mg, 39%)。

【0332】

化合物595の調製

a) N-(1-シアノピペリジン-4-イル)-4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

【化49】

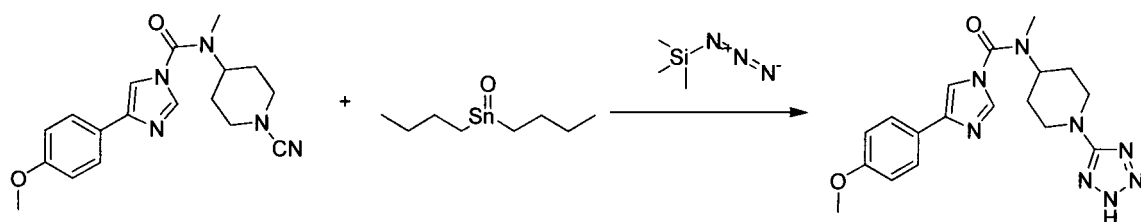


カリウムtert-ブトキシド (184 mg, 1.636 mmol) を、DMF (5 mL) に4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-N-(ピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩 (287 mg, 0.818 mmol) を加えた溶液に加え、この混合液を室温で30分間撹拌し、その後すぐに氷水浴で冷却し、臭化シアン (0.818 mL, 2.454 mmol, 3N ジクロロメタン溶液) を一滴ずつ10~15分間加えた。この反応混合液を1時間かけて室温までゆっくりと温め、水およびジクロロメタン/イソプロパノール (7:3) に分配した。有機層を分離し、水およびブラインでさらに洗浄し、乾燥させ (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>)、ろ過し、減圧下で溶媒を除去した。残留物を最少量のクロロホルムに溶解させ、不溶性物質をろ過で分離した。ろ液を濃縮し、オフホワイト色の固形物を得た (345 mg, 67%)。

【0333】

b) N-(1-(2H-テトラゾール-5-イル)ピペリジン-4-イル)-4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド

【化50】



10

20

30

40

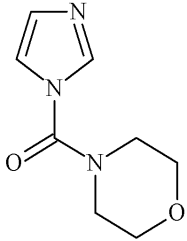
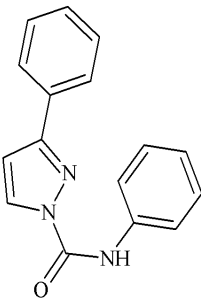
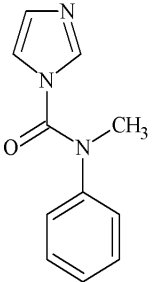
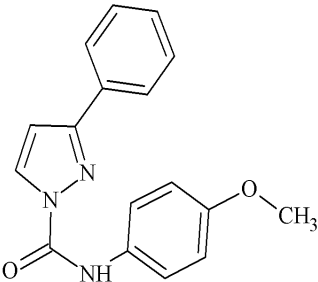
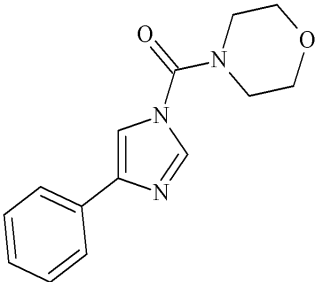
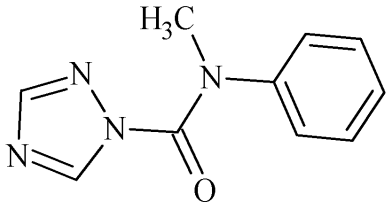
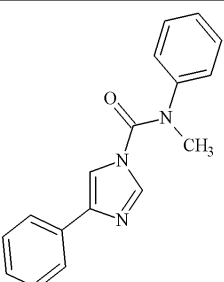
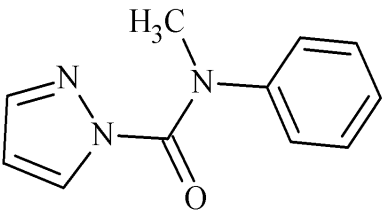
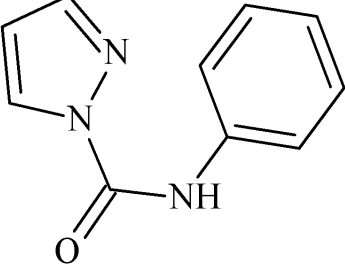
50

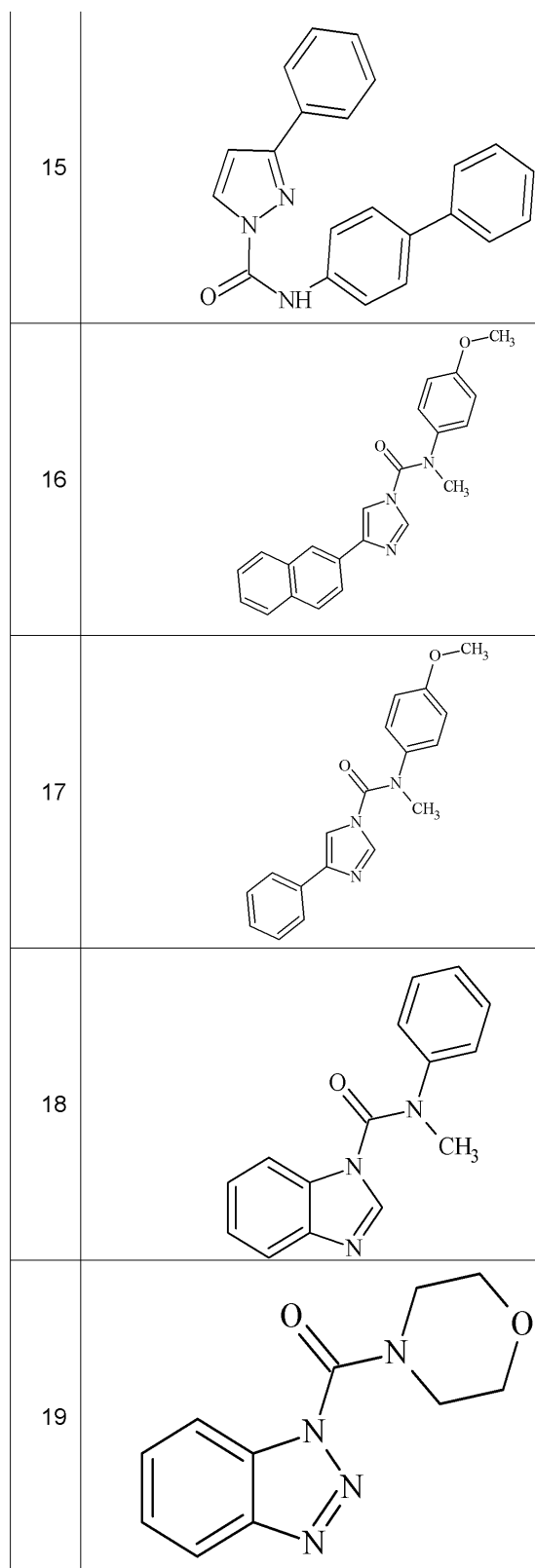
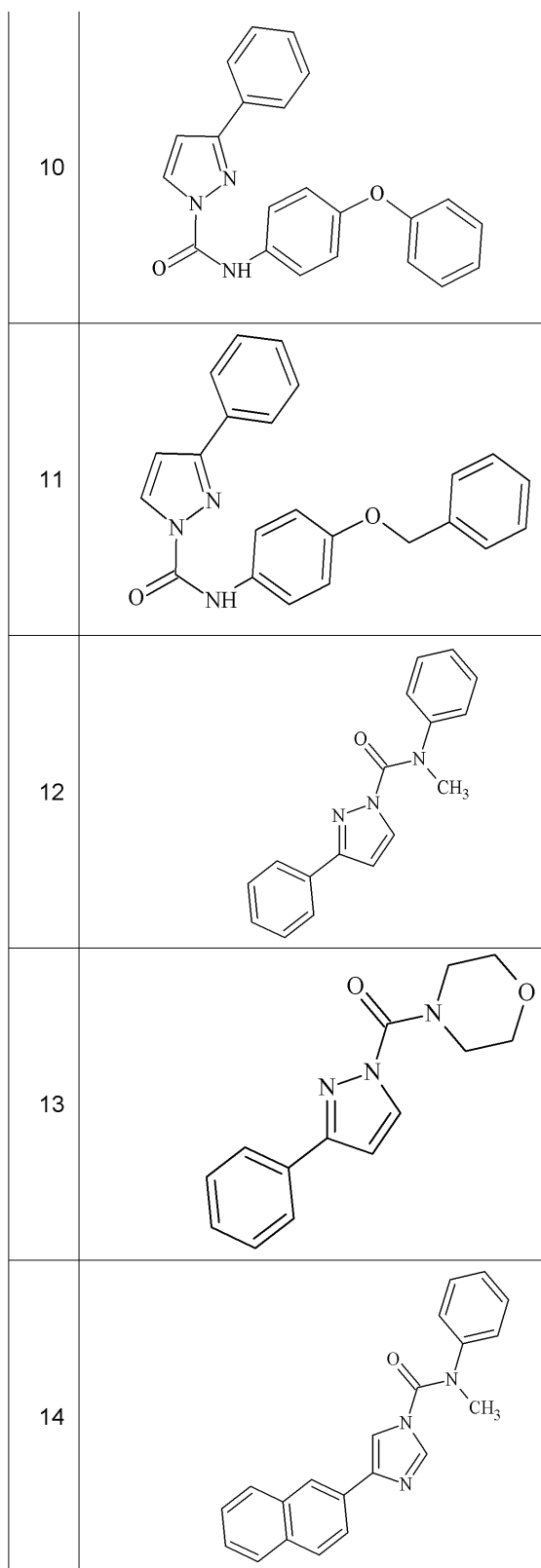
ジブチルスタンナノン (13.84 mg, 0.056 mmol) を、トルエン (10 mL) にN-(1-シアノピペリジン-4-イル)-4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (151 mg, 0.445 mmol) を加えた懸濁液に加え、続いてアジドトリメチルシラン (0.207 mL, 1.557 mmol) を加えた。この反応混合液を5時間の還流で加熱し、その後すぐに、熱いまる過し、得られたピンク色の固形物を、トルエン、ジクロロメタンおよび最後にエーテルで順次洗浄した。この固形物をメタノールから再結晶させ、薄いピンク色の固体生成物を得た (100 mg, 56%)。

【 0 3 3 4 】

2 . 化合物例

【表 1】

番号	構造			
1		5		10
2		6		
3		7		20
4		8		30
		9		40

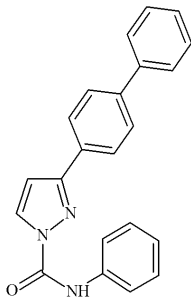
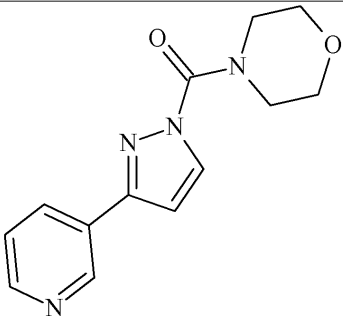
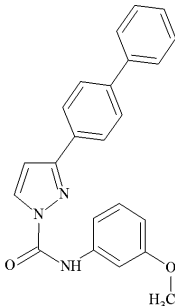
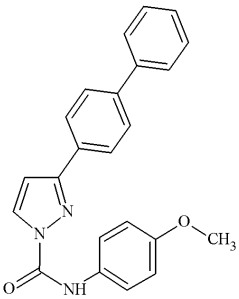
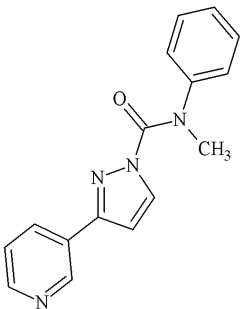
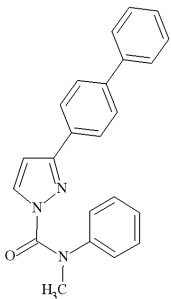
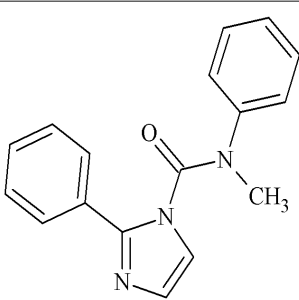
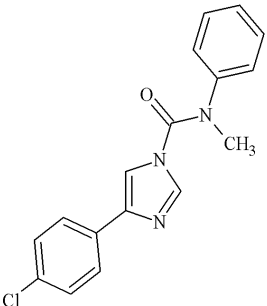
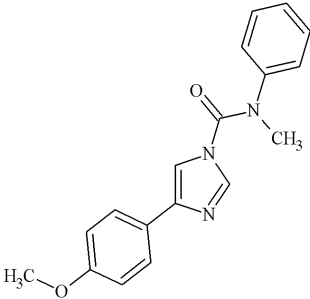
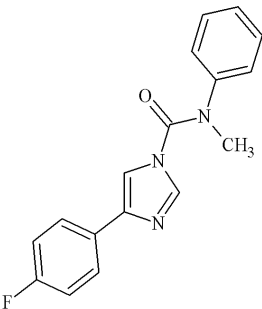


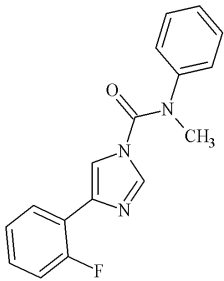
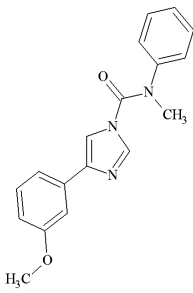
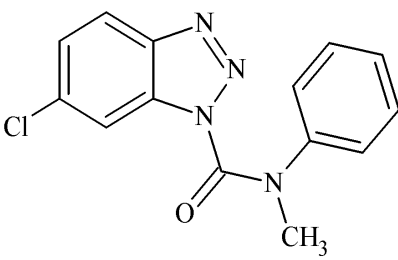
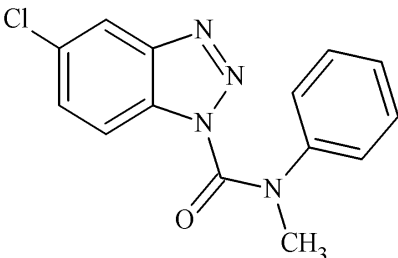
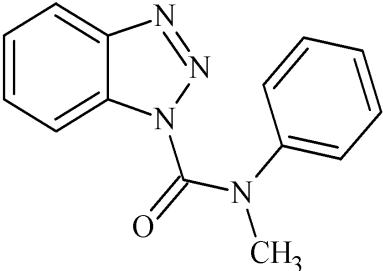
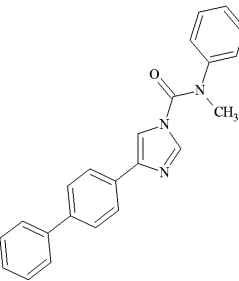
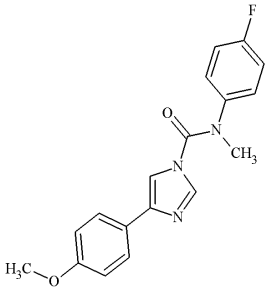
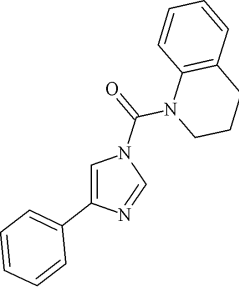
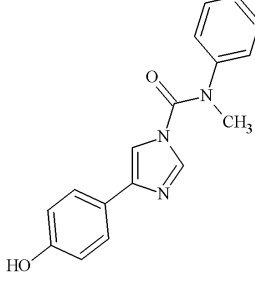
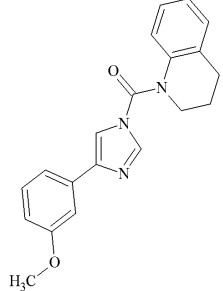
10

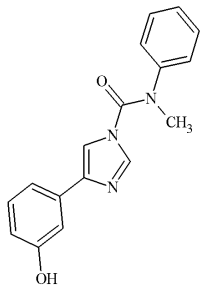
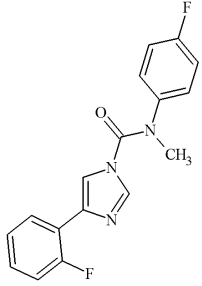
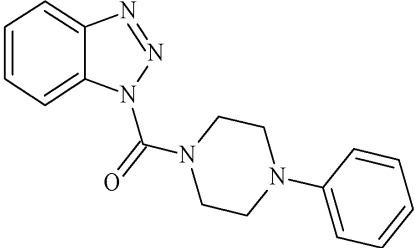
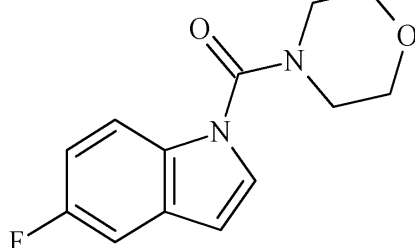
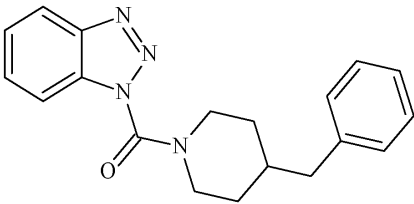
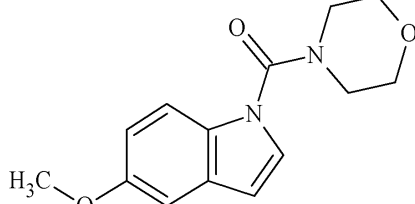
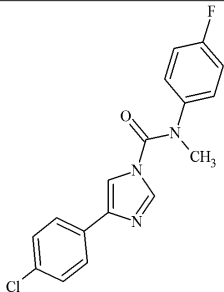
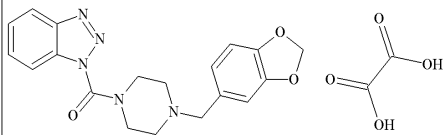
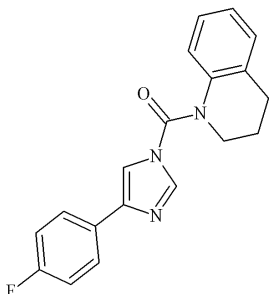
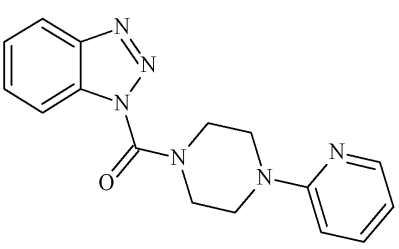
20

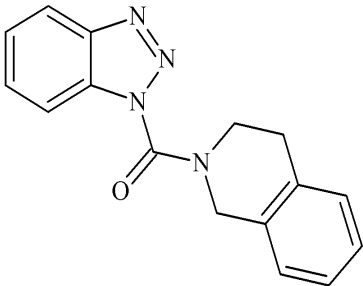
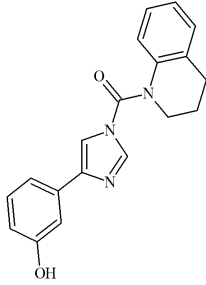
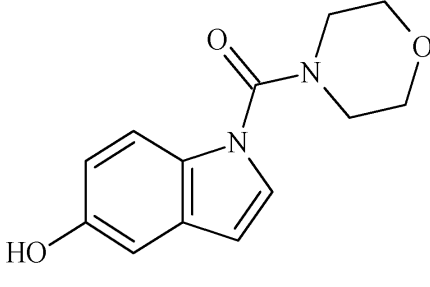
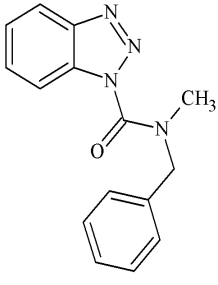
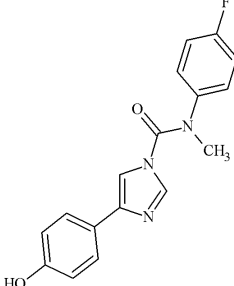
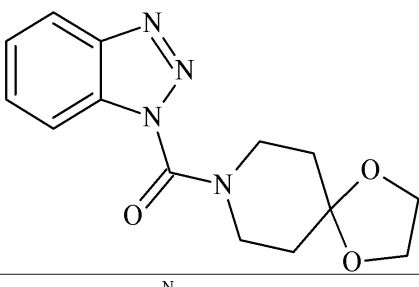
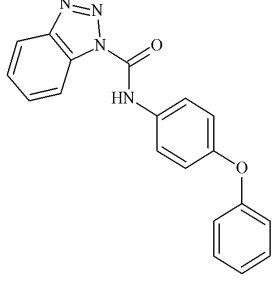
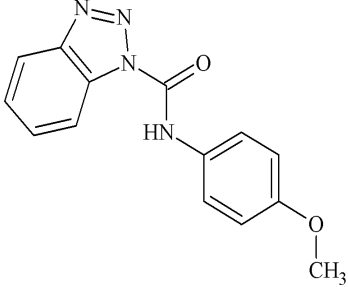
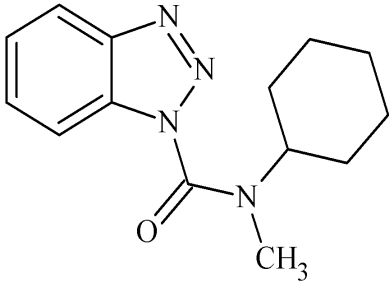
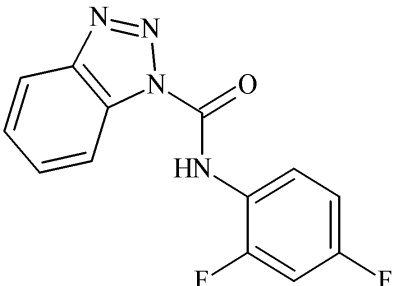
30

40

20		
21		
22		
23		
24		
25		
26		10
27		20
28		30
29		40

30		
31		
32		
33		
34		
35		
36		10
37		20
38		30
39		40

40		45		10
41		46		
42		47		
43		48		30
44		49		40

50		10
51		
52		
53		
54		20
55		
56		
57		
58		30
59		

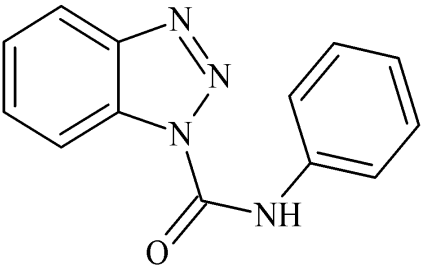
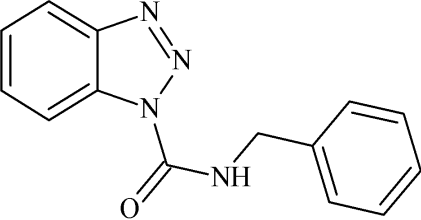
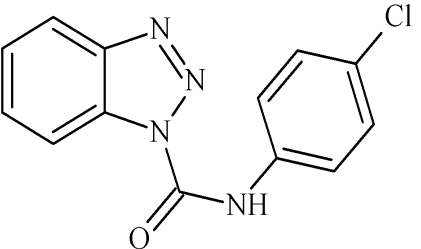
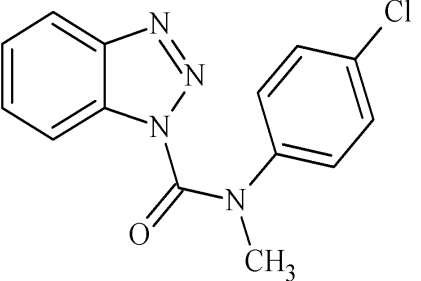
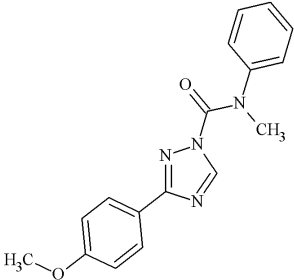
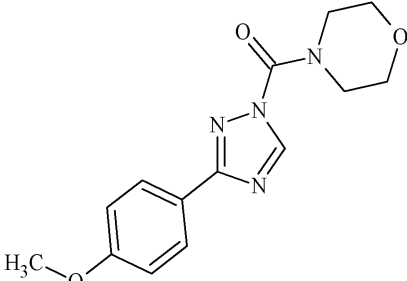
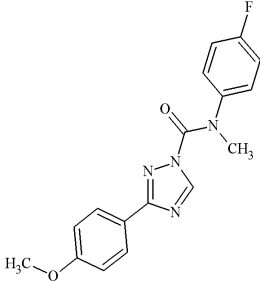
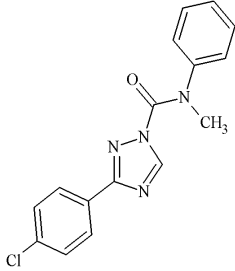
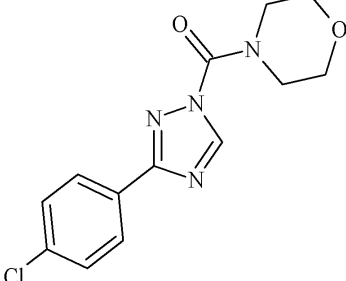
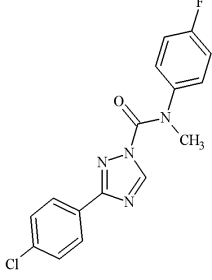
10

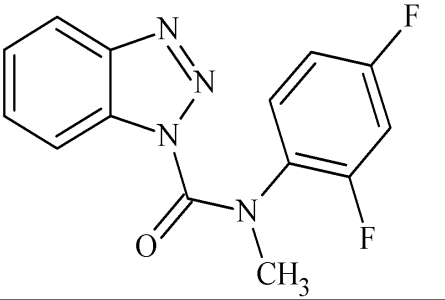
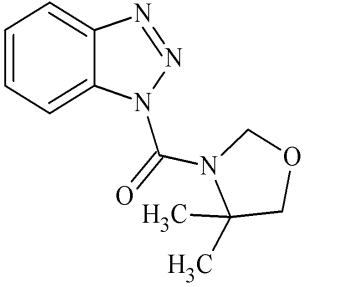
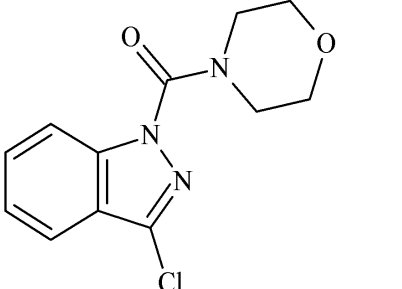
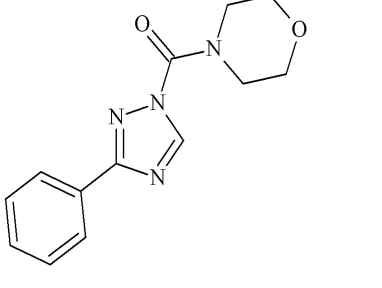
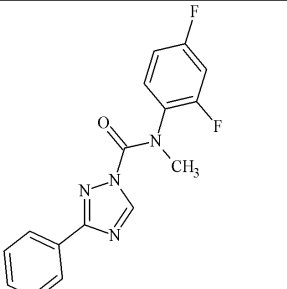
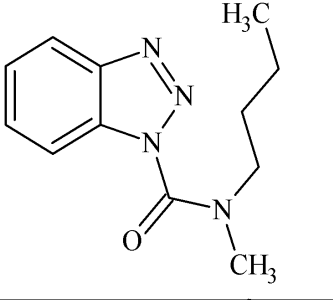
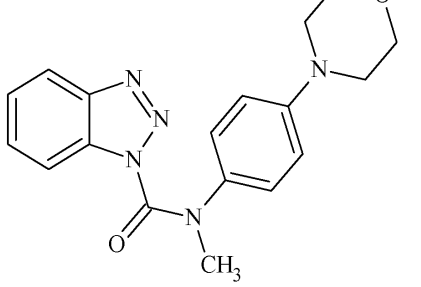
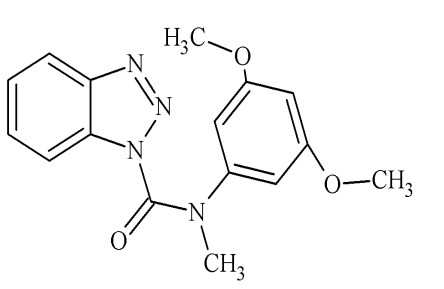
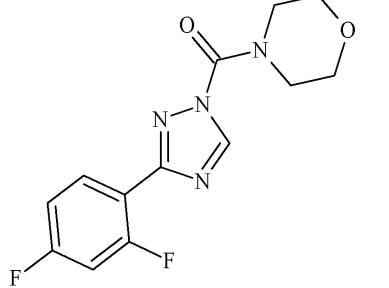
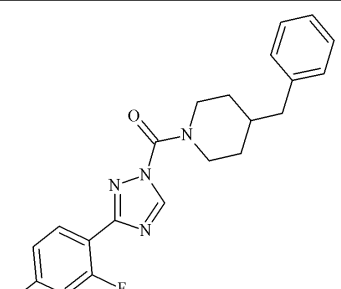
20

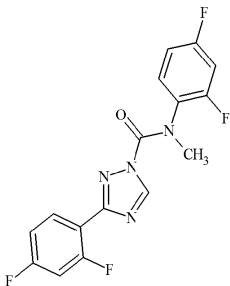
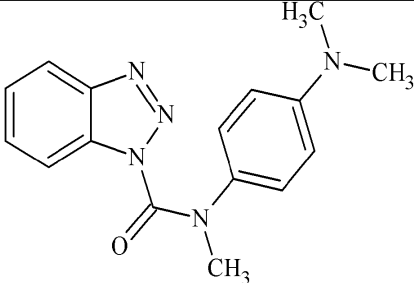
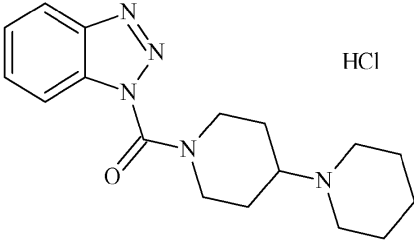
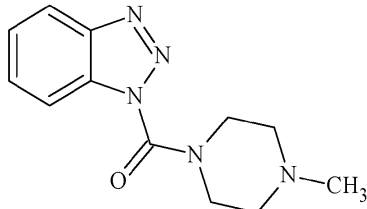
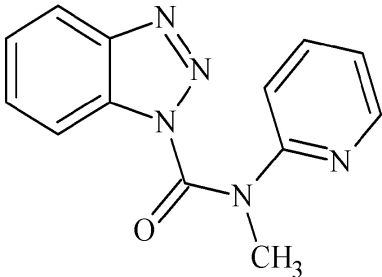
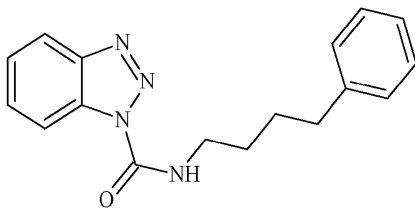
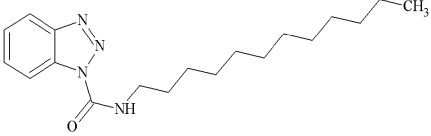
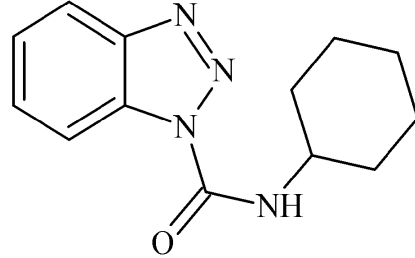
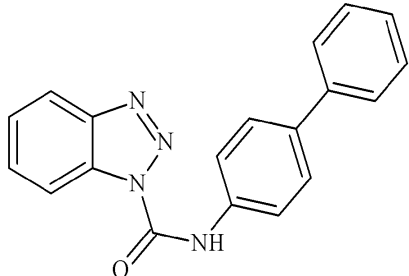
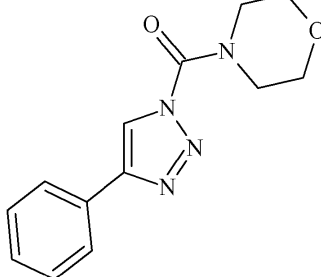
30

40



60		
61		
62		
63		
64		
65		
66		10
67		20
68		30
69		40

70		
71		
72		
73		
74		
75		
76		10
77		20
78		30
79		40

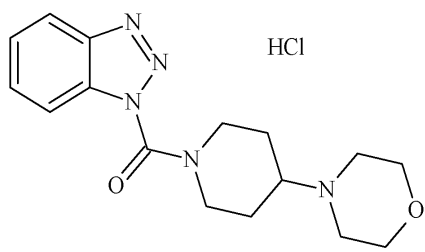
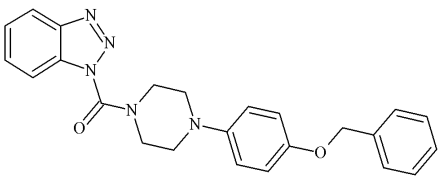
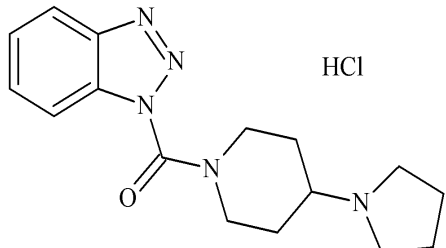
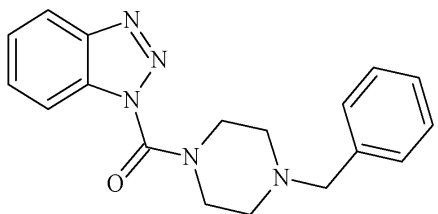
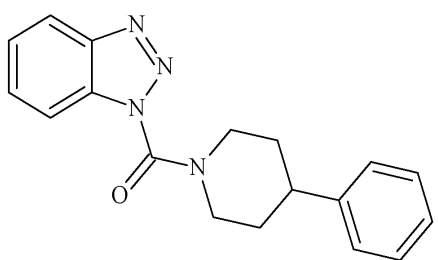
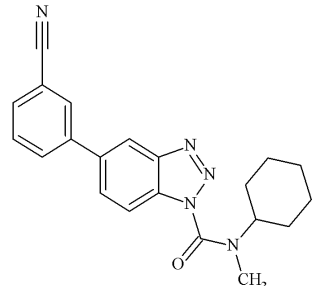
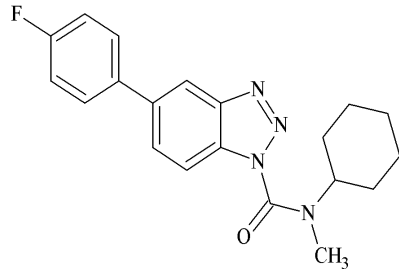
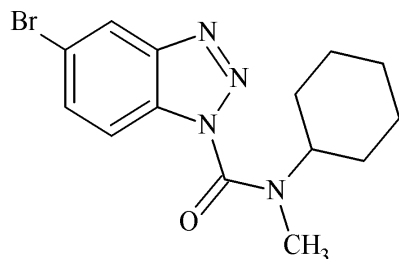
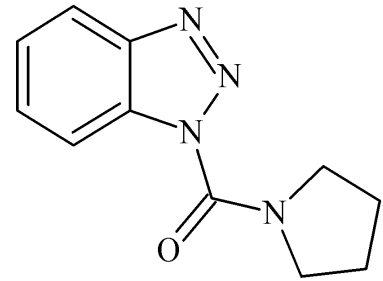
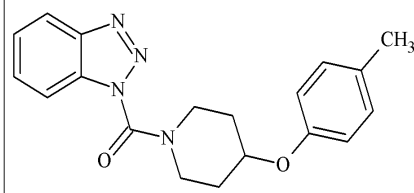
80		
81		
82		HCl
83		HCl
84		
85		
86		
87		
88		
89		

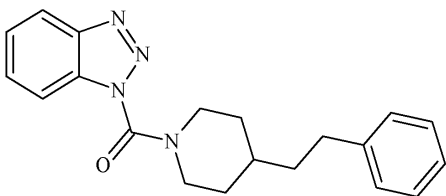
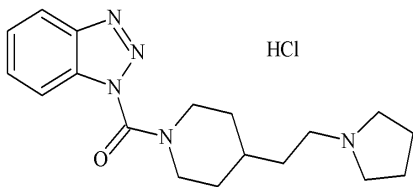
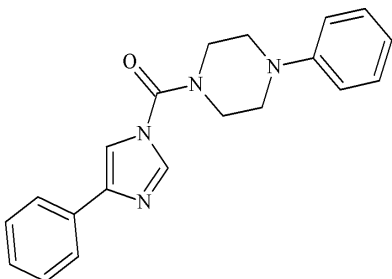
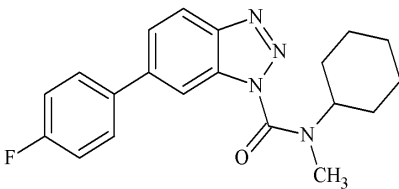
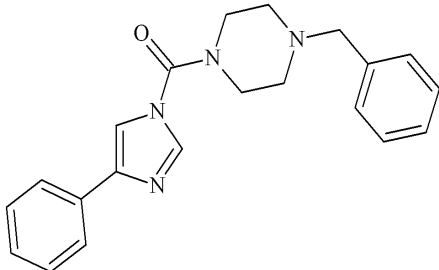
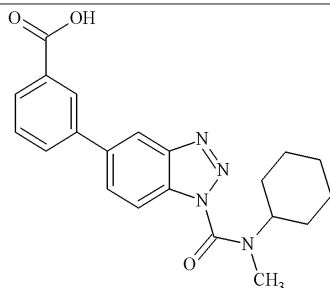
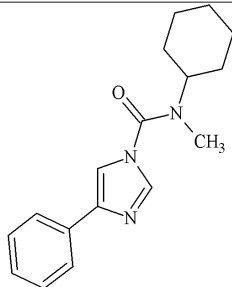
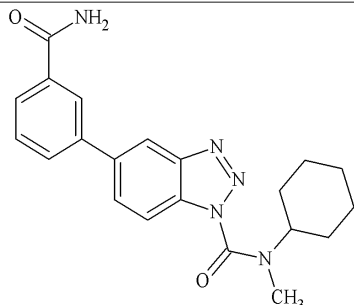
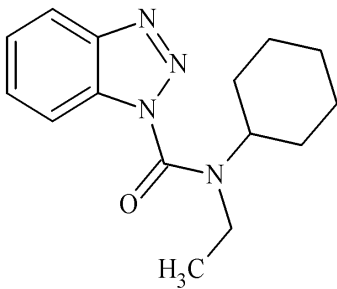
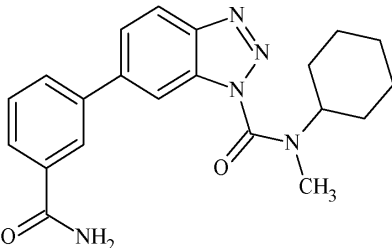
10

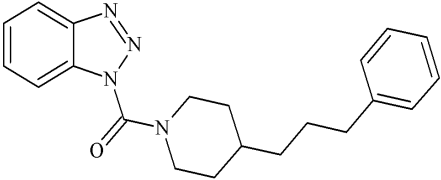
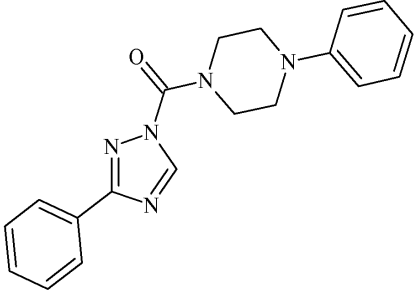
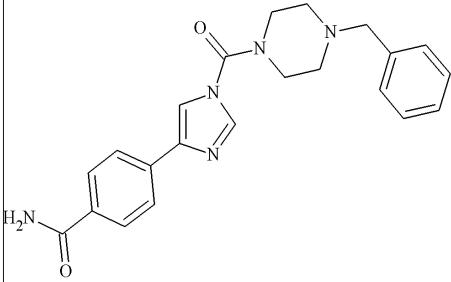
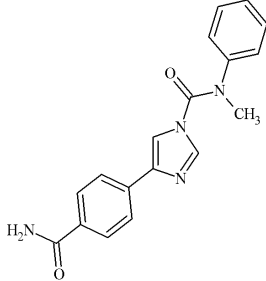
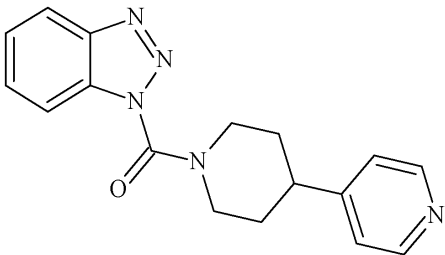
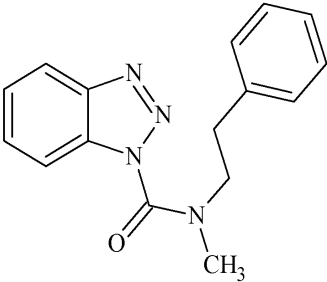
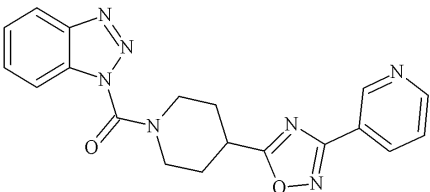
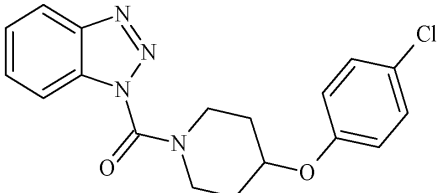
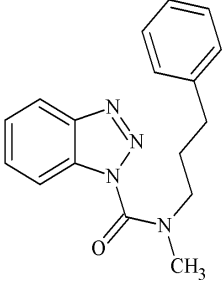
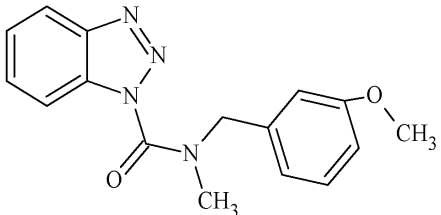
20

30

40

90	 HCl	
91		
92	 HCl	
93	 HCl	
94		
95		10
96		
97		20
98		30
99		40

100		105	 HCl	
101		106		10
102		107		20
103		108		30
104		109		40

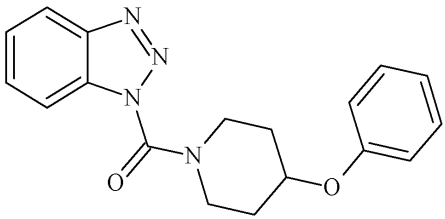
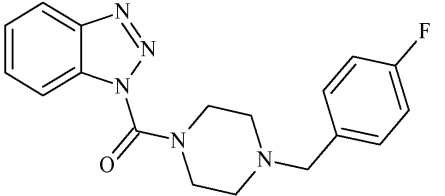
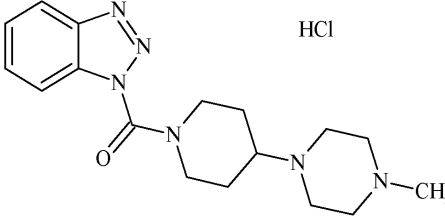
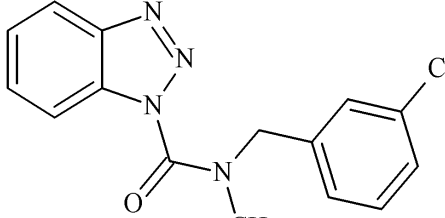
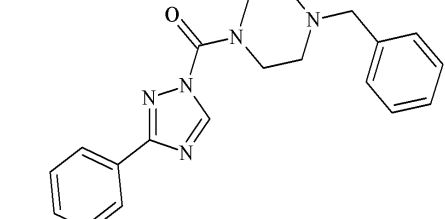
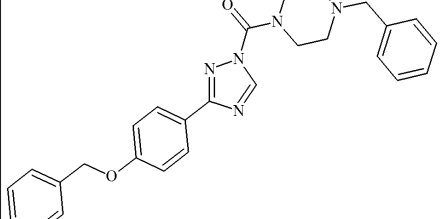
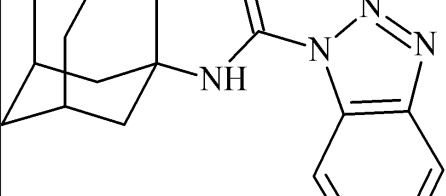
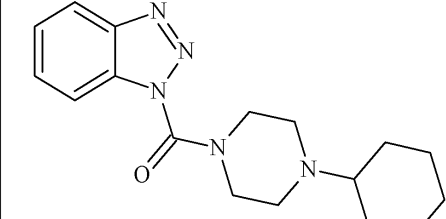
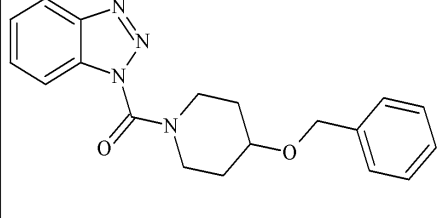
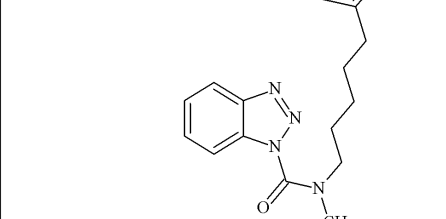
110		
111		
112		
113		
114		
115		
116		
117		
118		
119		

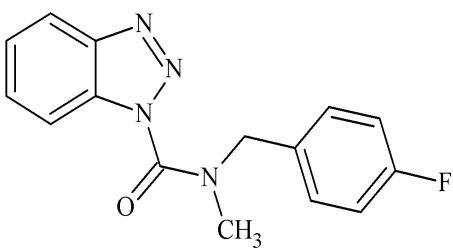
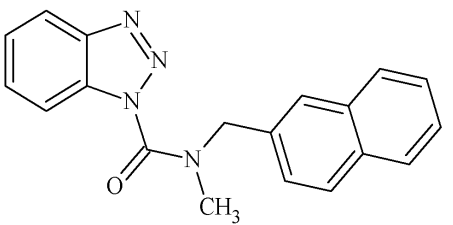
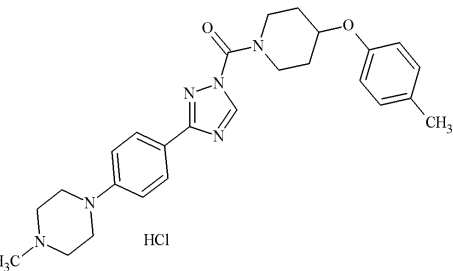
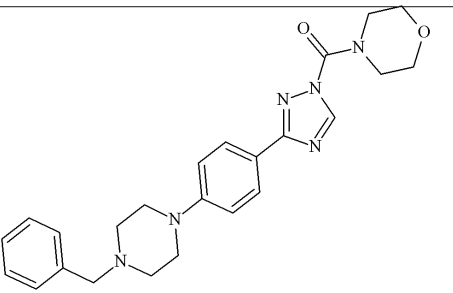
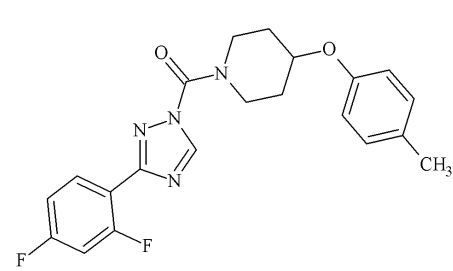
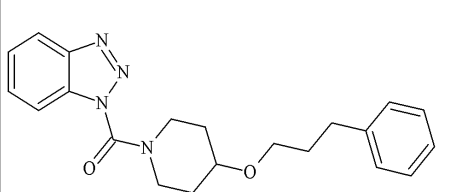
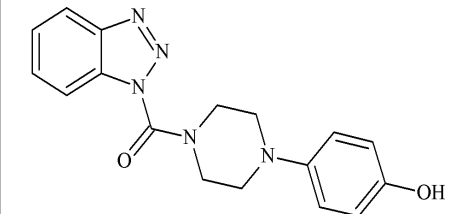
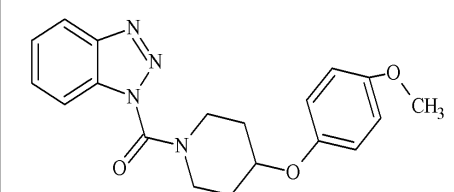
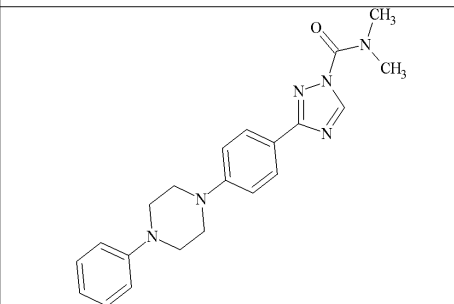
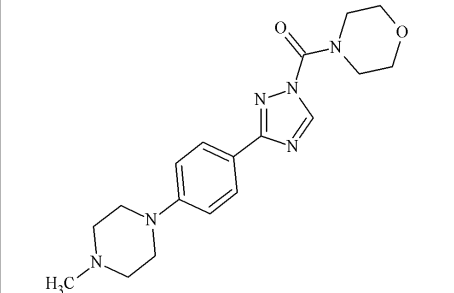
10

20

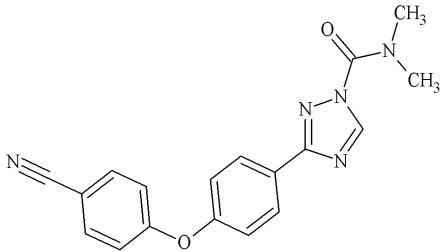
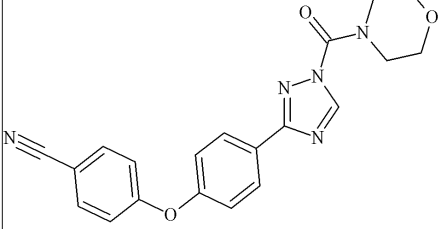
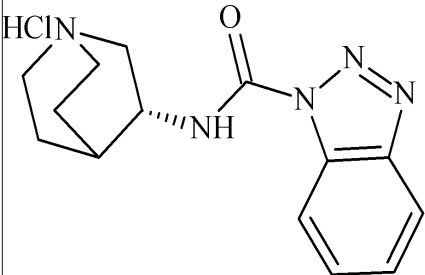
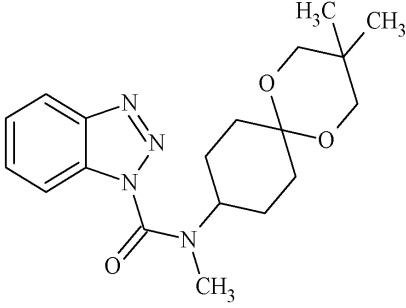
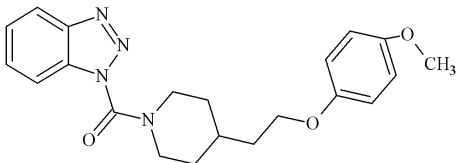
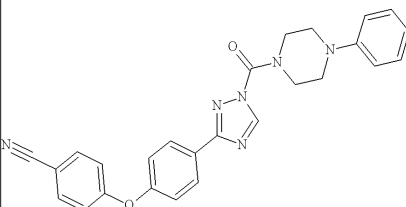
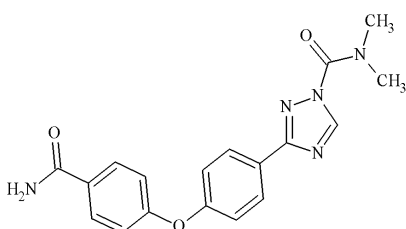
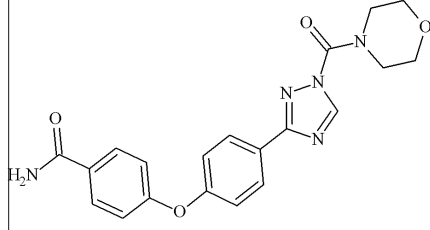
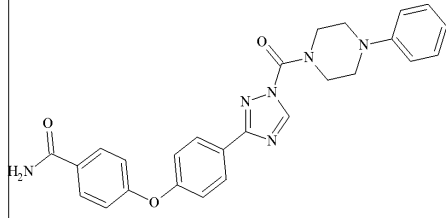
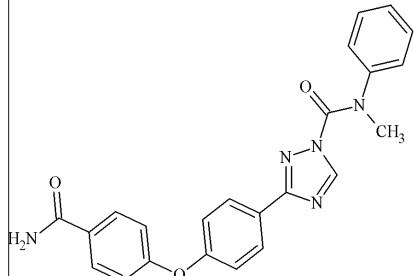
30

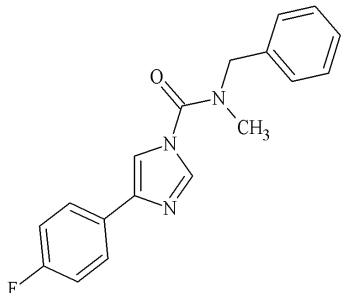
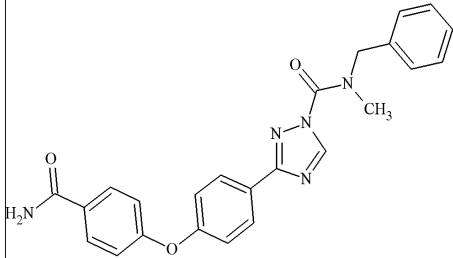
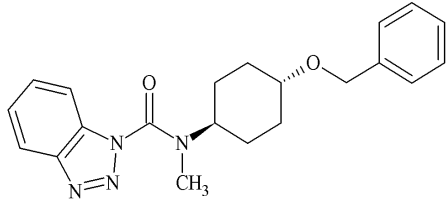
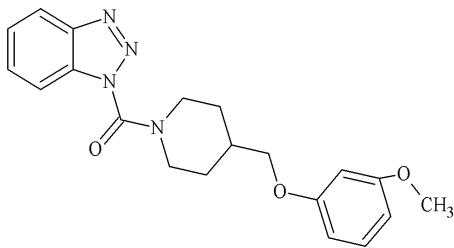
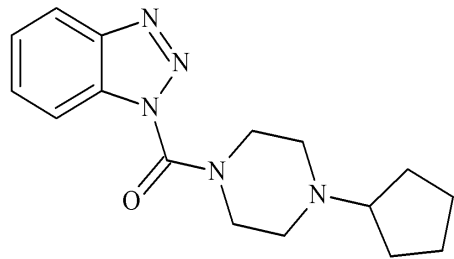
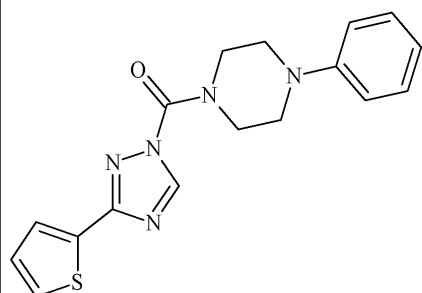
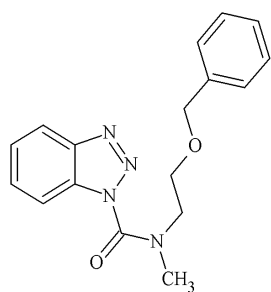
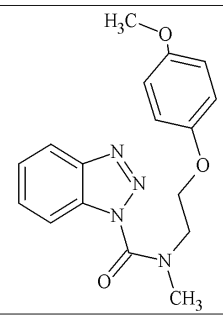
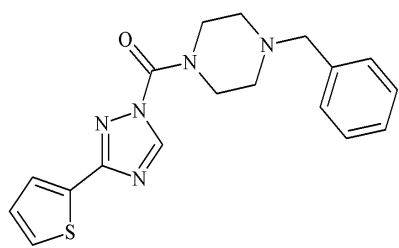
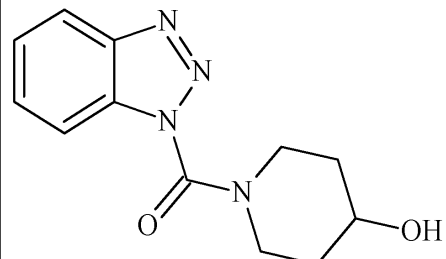
40

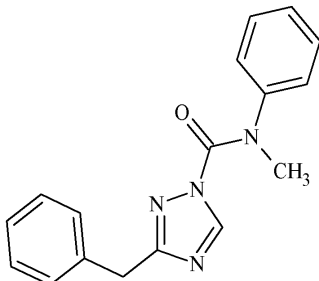
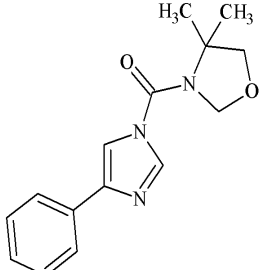
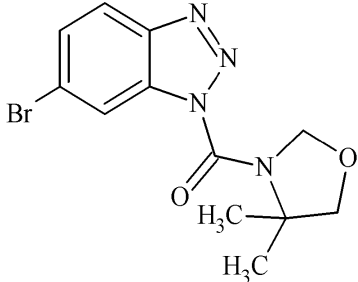
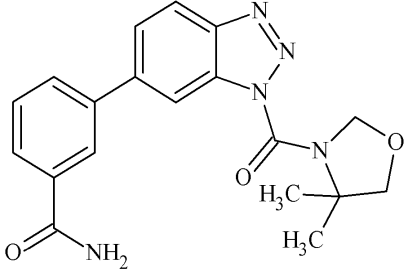
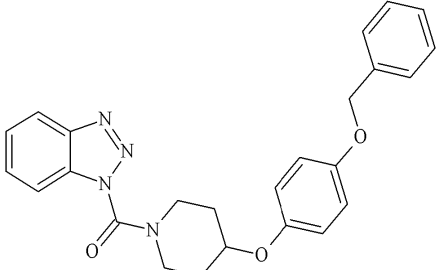
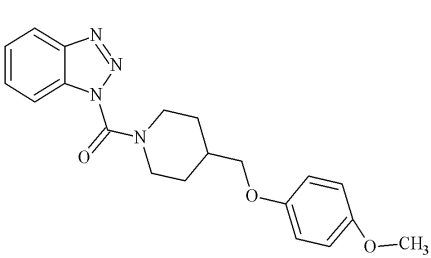
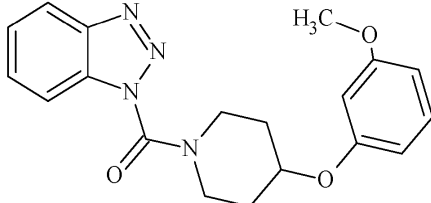
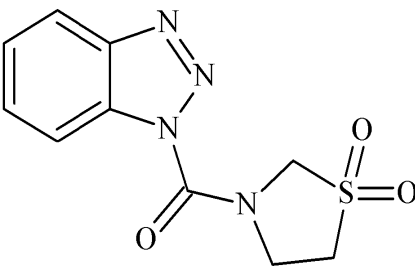
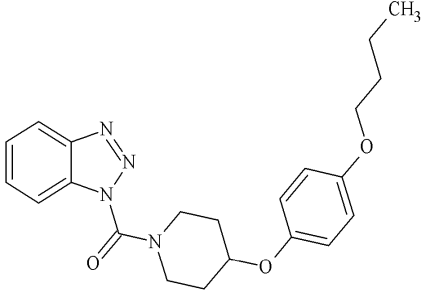
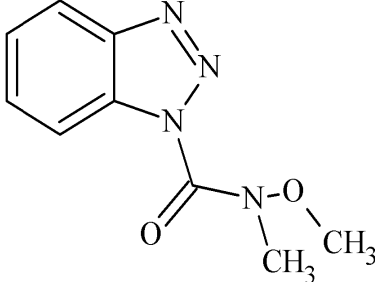
120		
121		
122	 HCl	
123		
124	 HCl	
125	 HCl	10
126		
127		20
128		30
129		40

130		
131		
132		
133		
134		
135		
136		10
137		20
138		30
139		40



140		
141		
142		
143		
144		
145		10
146		
147		20
148		30
149		40

150		
151		
152		
153		
154		
155		
156		10
157	 HCl	20
158		30
159		40

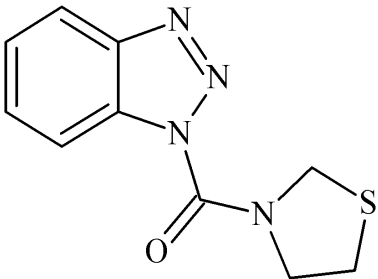
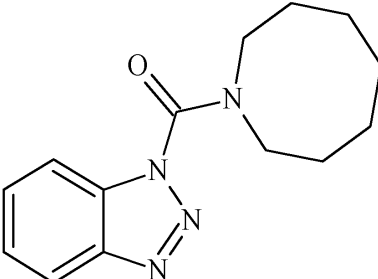
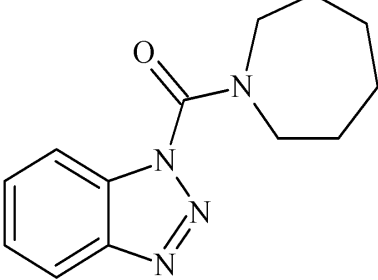
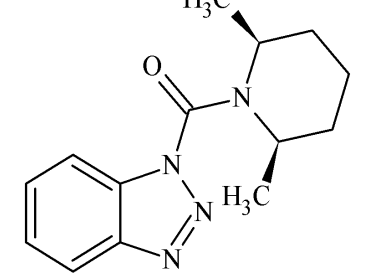
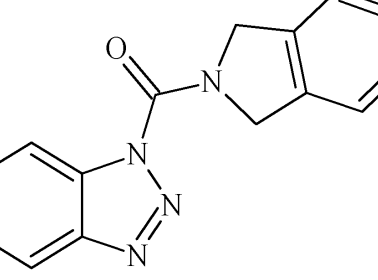
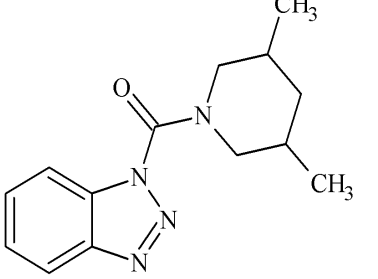
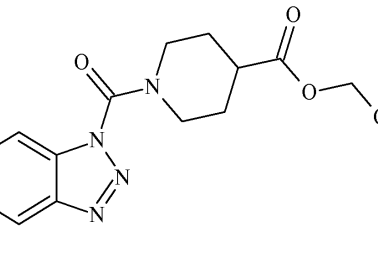
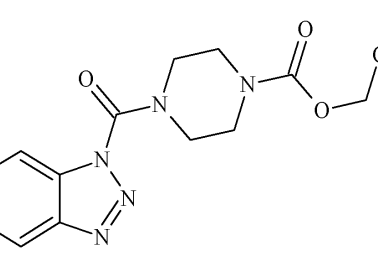
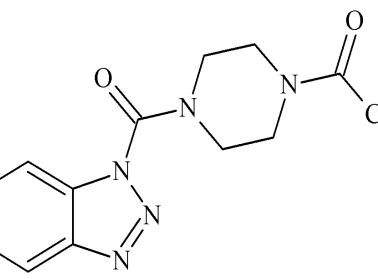
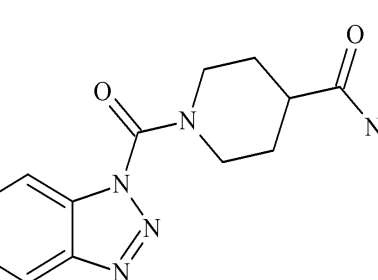
160		10
161		
162		
163		
164		
165		20
166		
167		
168		
169		

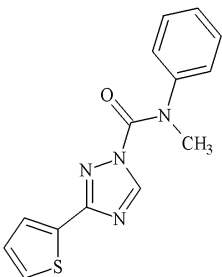
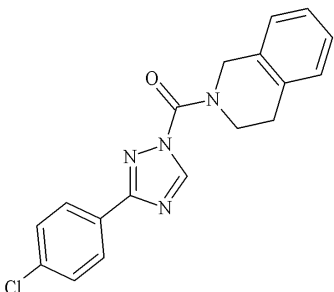
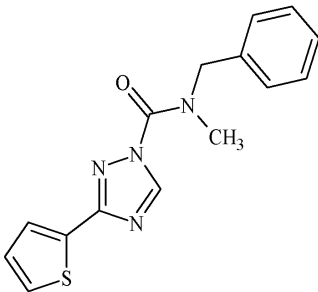
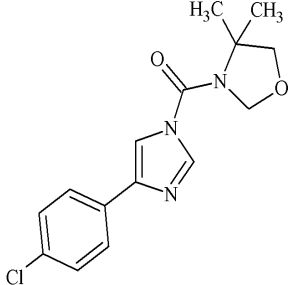
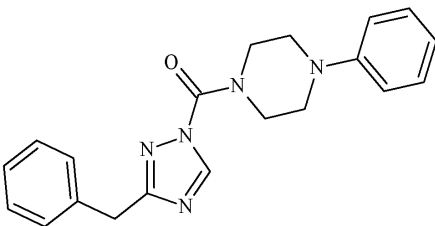
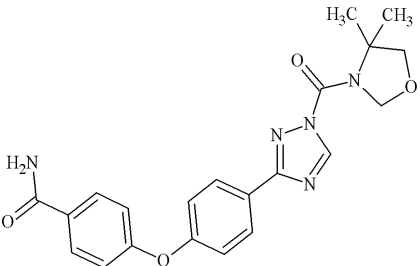
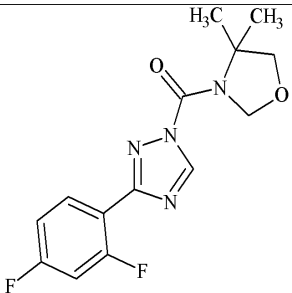
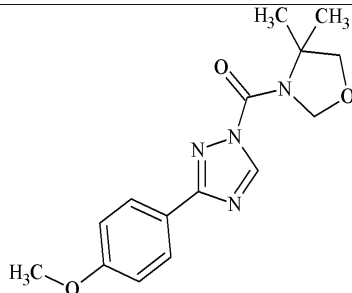
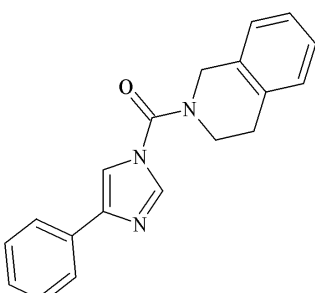
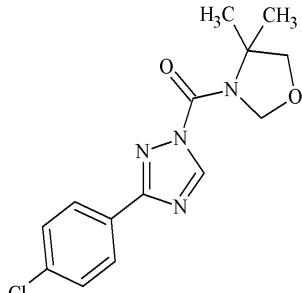
10

20

30

40

170		
171		
172		
173		
174		
175		
176		10
177		20
178		30
179		40

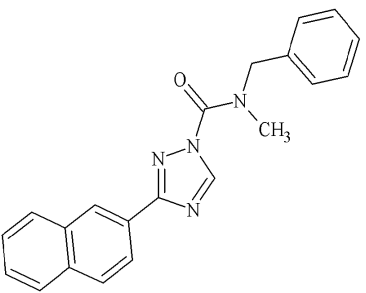
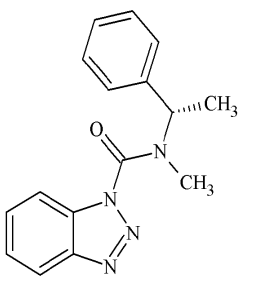
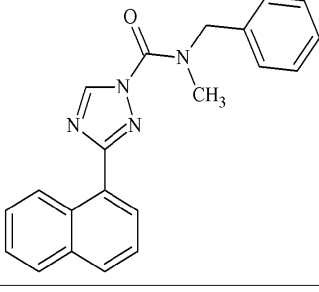
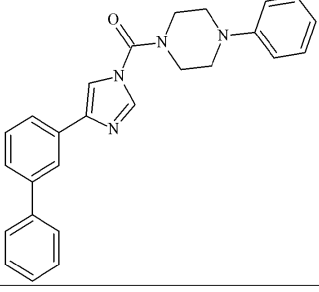
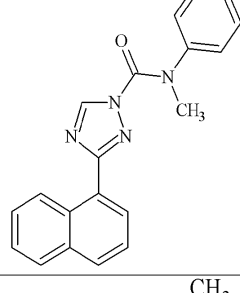
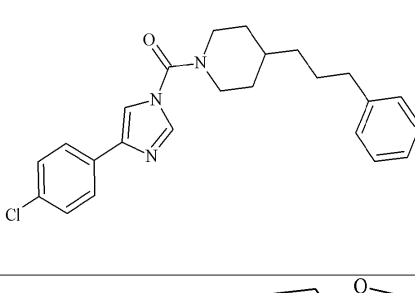
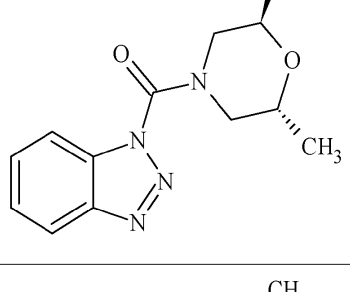
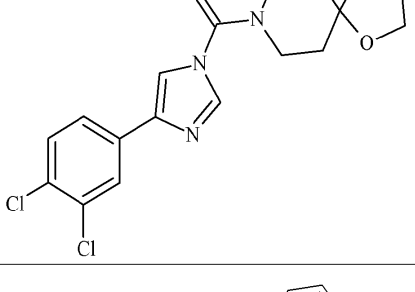
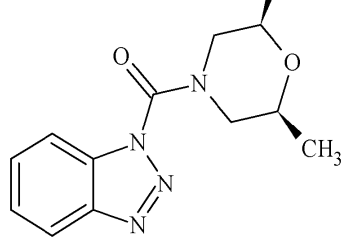
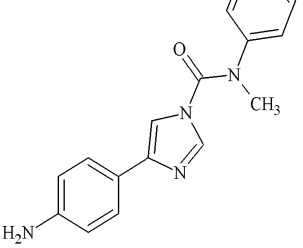
180		185		10
181		186		
182		187		
183		188		30
184		189		

10

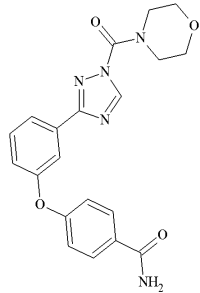
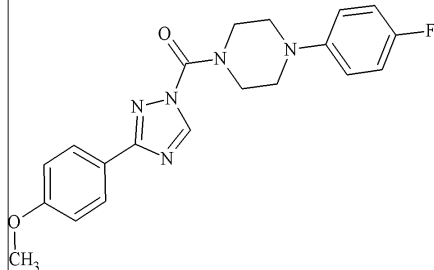
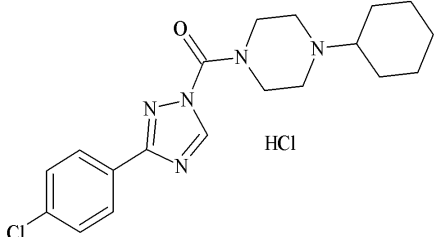
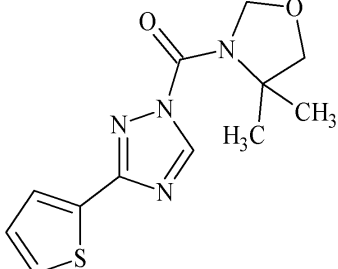
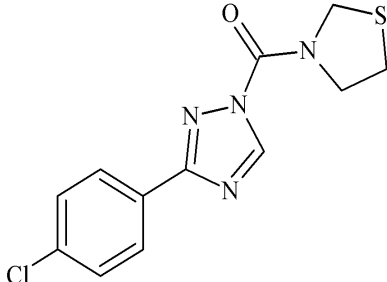
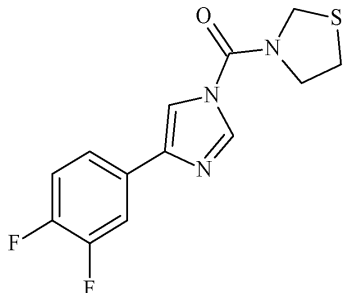
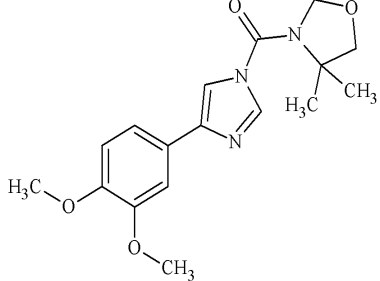
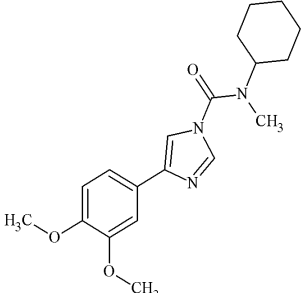
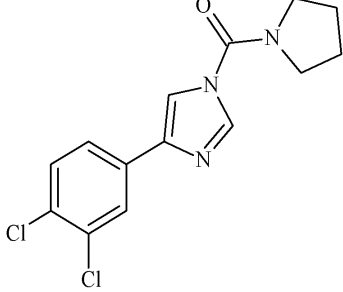
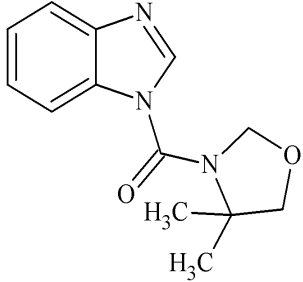
20

30

40

190		195		10
191		196		
192		197		
193		198		30
194		199		
				40

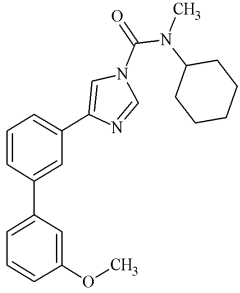
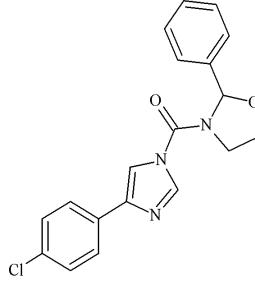
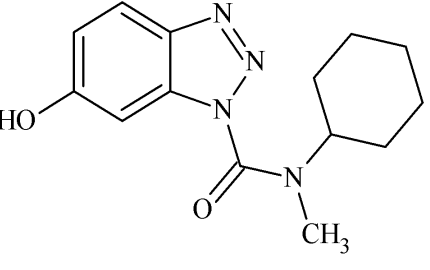
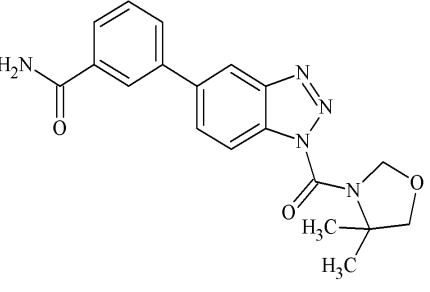
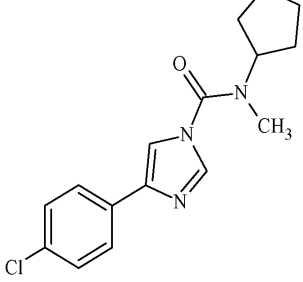
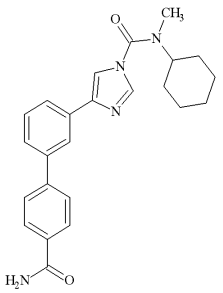
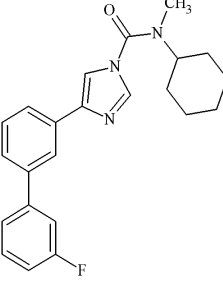
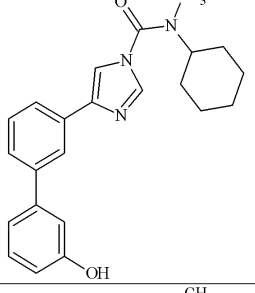
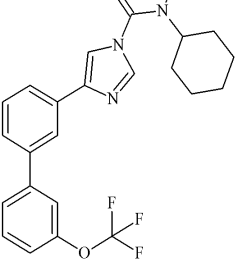
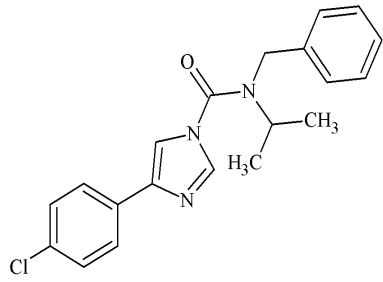
200	 <chem>CN(C)C(=O)n1cnc1-c2ccc(OCCN3CCCN3)cc2.Cl.Cl</chem>
201	 <chem>C1CCN(C1)C(=O)n2cnc2-c3ccc(OCC4CCNCC4)cc3F</chem>
202	 <chem>CCN(C(=O)n1cnc1-c2ccc(OCCc3ccccc3)cc2)n4cnc5ccccc45</chem>
203	 <chem>CN(C)C(=O)n1cnc1-c2ccc(OCCCN3CCCN3)cc2.Cl.Cl</chem>
204	 <chem>Clc1ccc(cc1)-c2nc3nnc3nc2C(=O)N4CC5CCOC5CC4</chem>
205	 <chem>COc1ccc(cc1)-c2nc3nnc3nc2C(=O)N4CC5CCOC5CC4</chem>
206	 <chem>c1ccc2ccccc2c1-c3nc4nnc4nc3C(=O)N5CC6CCOC6CC5</chem>
207	 <chem>Nc1ccc(Oc2ccc(cc2)-c3nc4nnc4nc3C(=O)N5CC6CCOC6CC5)cc1</chem>
208	 <chem>Nc1ccc(Oc2ccc(cc2)-c3nc4nnc4nc3C(=O)N5CC6CCOC6CC5)cc1</chem>
209	 <chem>Nc1ccc(Oc2ccc(cc2)-c3nc4nnc4nc3C(=O)N5CC6CCOC6CC5)cc1</chem>

210		
211		
212		
213		
214		
215		
216		10
217		20
218		30
219		40



220		225		10
221		226		20
222		227		30
223		228		40
224		229		

230	 <chem>CN(C(=O)Nc1ccc(cc1)c2nc3ccccc3n2)C4=CC=C(C=C4)OCCN5CCOCC5</chem> HCl	235	 <chem>CC1(C)COC(=O)N1c2nc3cc(Cl)ccc3n2</chem>	10
231	 <chem>CC1(C)COC(=O)N1c2nc3cc(ccc3c4ccccc4)n2</chem>	236	 <chem>COc1ccc(cc1)-c2ccc(cc2)-c3nc4cc(ccc4n3)C(=O)N5C(C)COC5</chem>	
232	 <chem>NC(=O)c1ccc(cc1)-c2ccc(cc2)-c3nc4cc(ccc4n3)C(=O)N5C(C)COC5</chem>	237	 <chem>c1ccc(cc1)-c2nc3cc(ccc3n2)C(=O)Nc4C5C6C7C8C9C6C5C7C8C9C4</chem>	20
233	 <chem>Clc1ccc(cc1)-c2nc3cc(ccc3n2)C(=O)N4C(C)COC4</chem>	238	 <chem>NC(=O)c1ccc(cc1)-c2ccc(cc2)-c3nc4cc(ccc4n3)C(=O)N5CC6CCCCC6C5</chem>	30
234	 <chem>c1ccc(cc1)-c2nc3cc(ccc3n2)C(=O)N4CCOC(=O)N5C6=CC=CC=C6N5C(=O)N7C8=CC=CC=C8N7C4</chem>	239	 <chem>C1CCN(C1)C(=O)N2c3cc(ccc3c4ccccc4)n2-c5ccc(cc5)-c6ccccc6</chem>	40

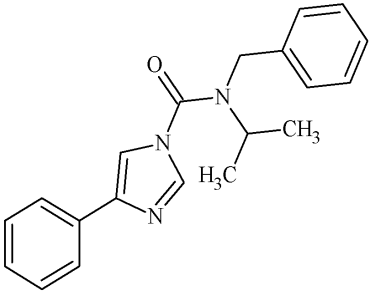
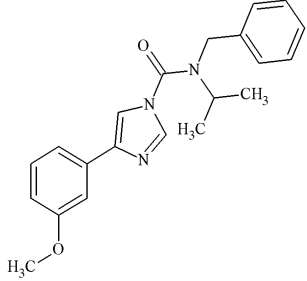
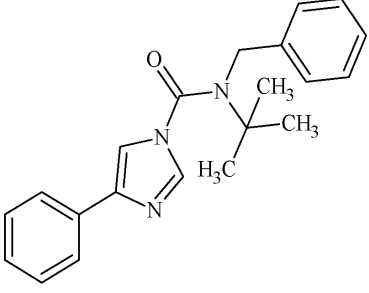
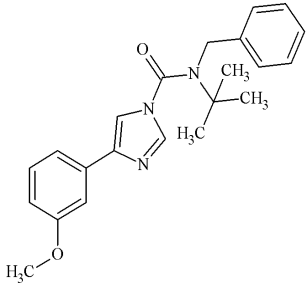
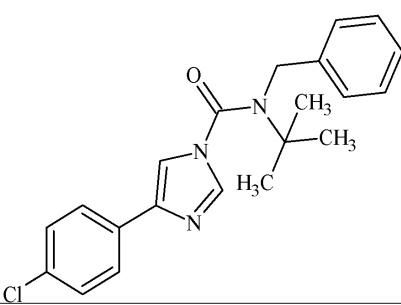
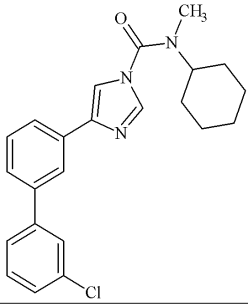
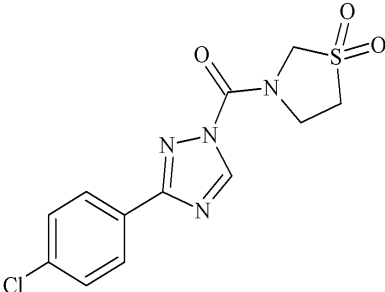
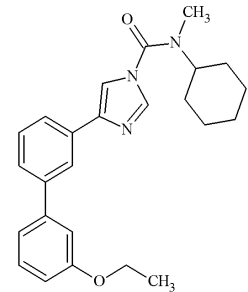
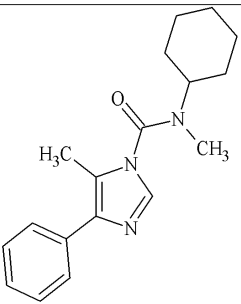
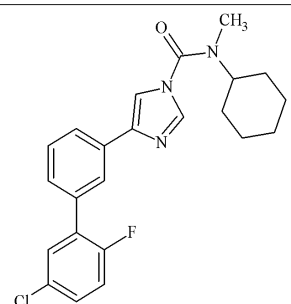
240		
241		
242		
243		
244		
245		
246		
247		
248		
249		

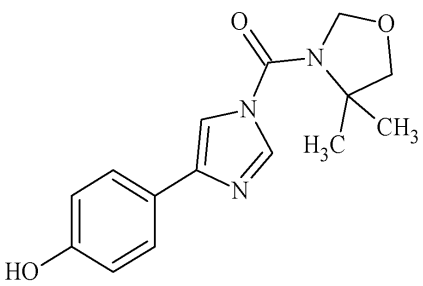
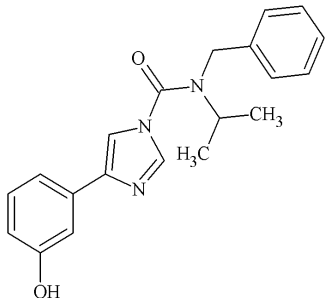
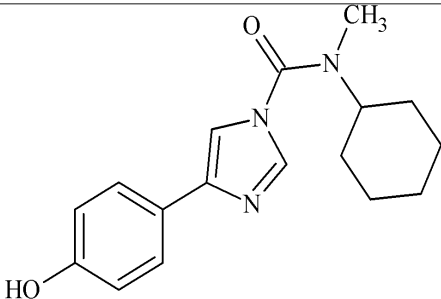
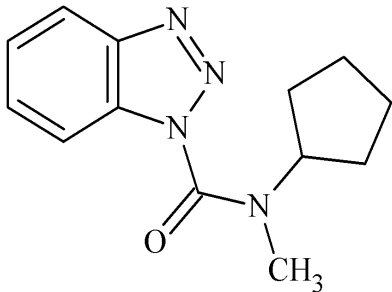
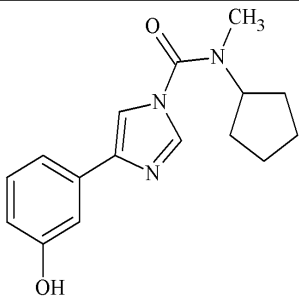
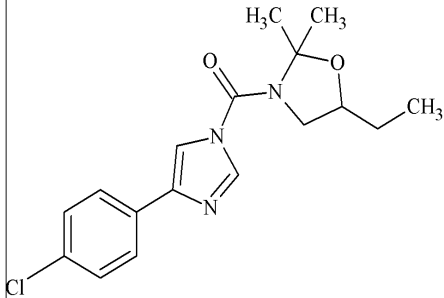
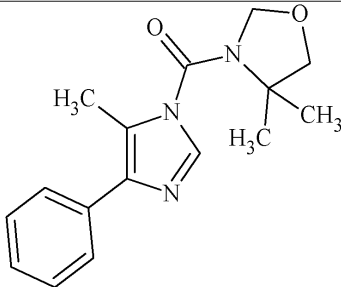
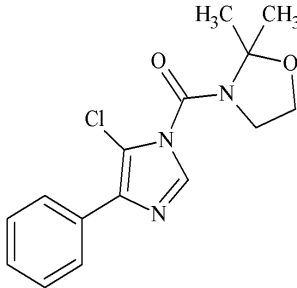
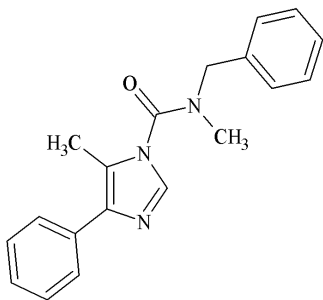
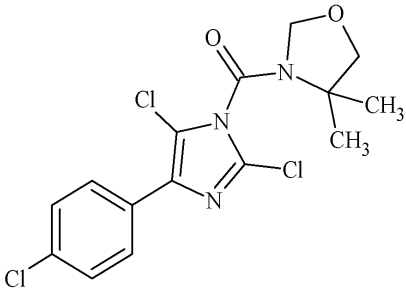
10

20

30

40

250		255		10
251		256		
252		257		20
253		258		30
254		259		40

260		265		10
261		266		
262		267		
263		268		30
264		269		

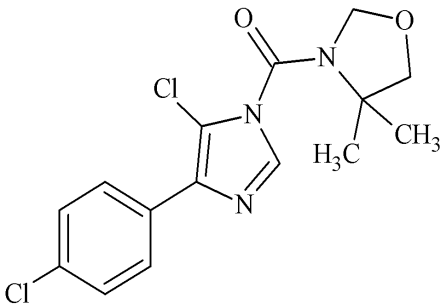
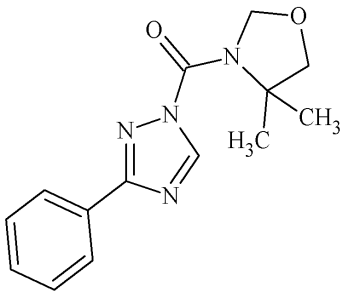
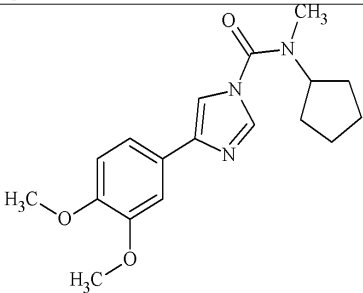
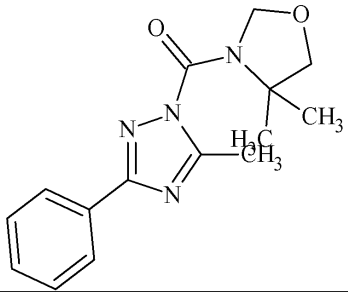
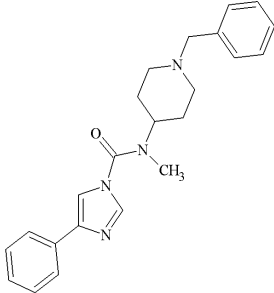
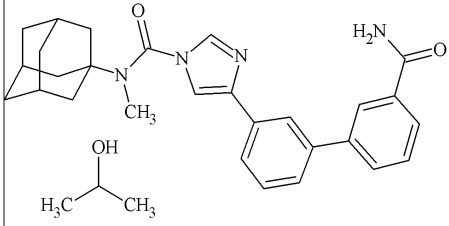
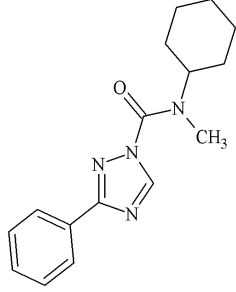
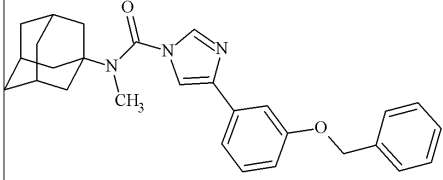
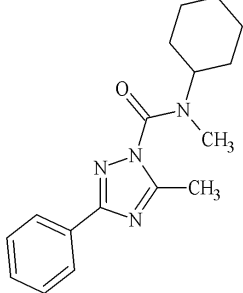
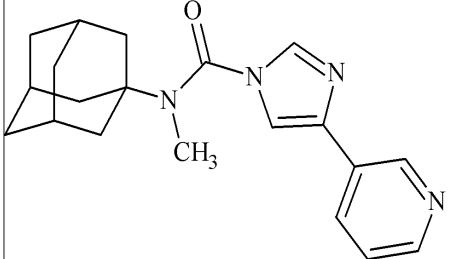
10

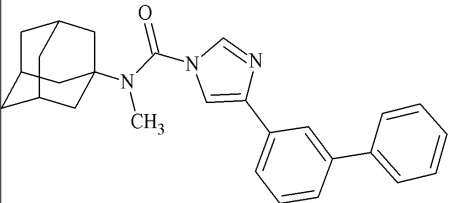
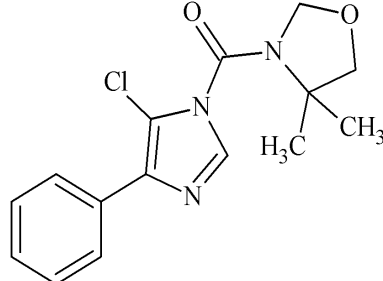
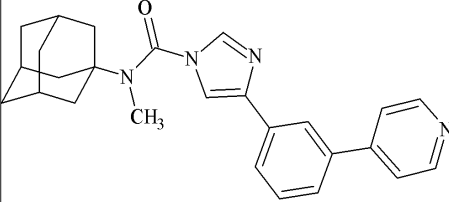
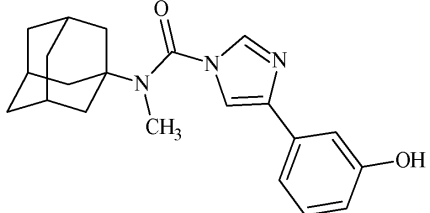
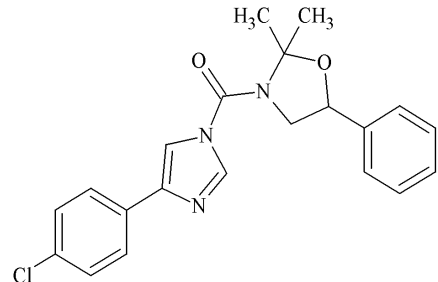
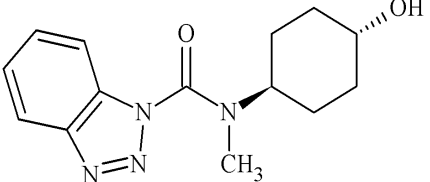
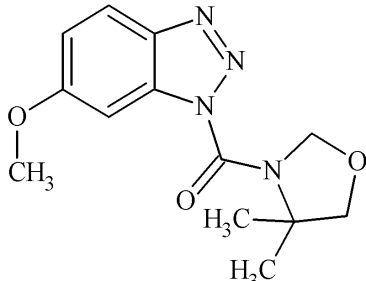
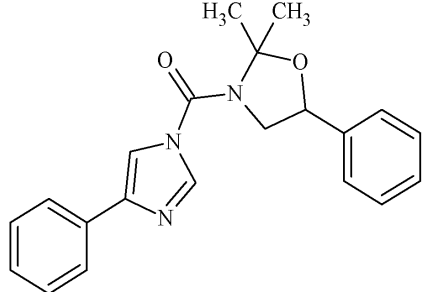
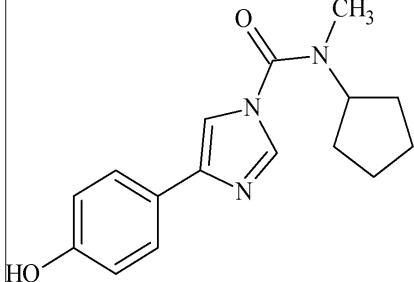
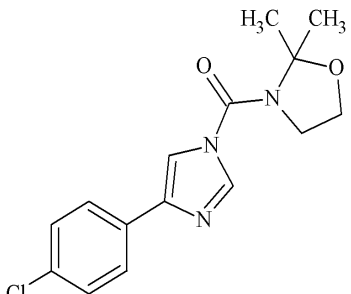
20

30

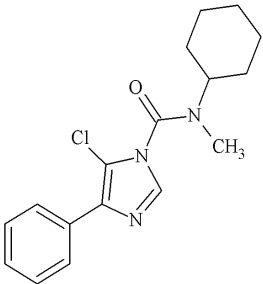
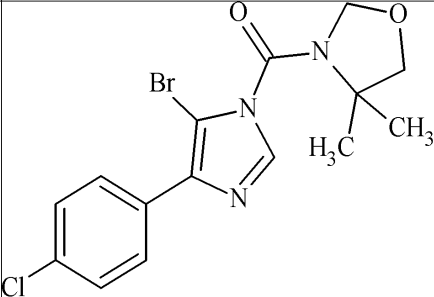
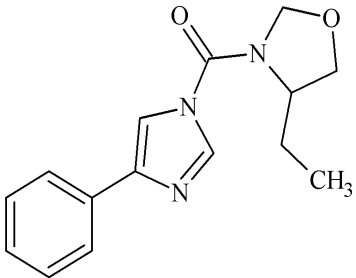
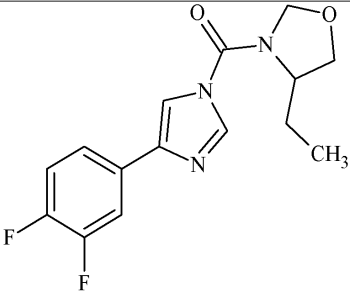
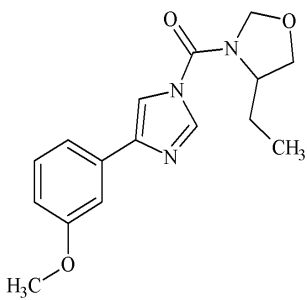
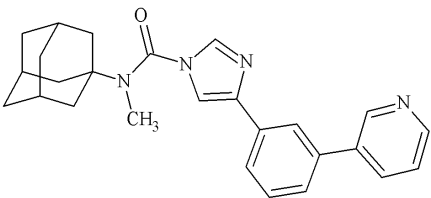
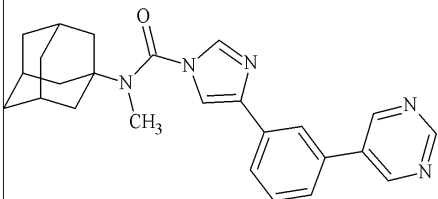
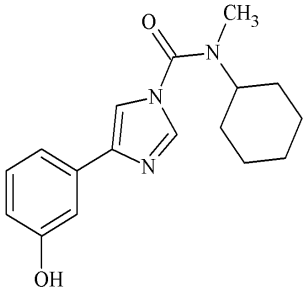
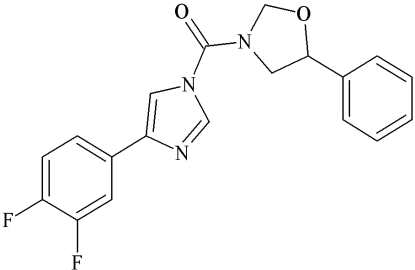
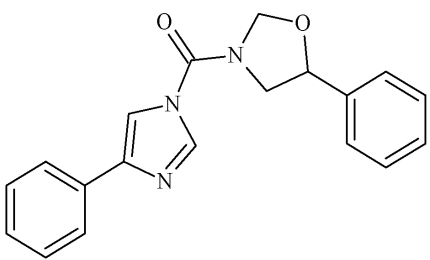
40

270		
271		
272		
273		
274		
275		
276		10
277		20
278		30
279		40

280		285		10
281		286		
282		287		20
283		288		30
284		289		40

290		295		10
291		296		
292		297		20
293		298		30
294		299		40



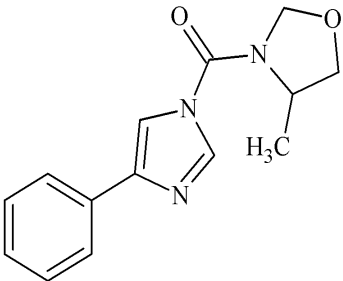
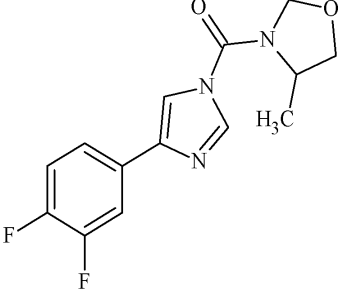
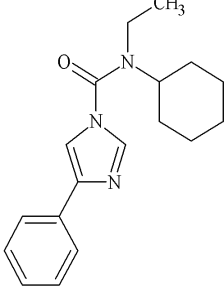
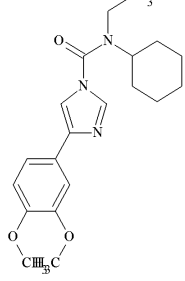
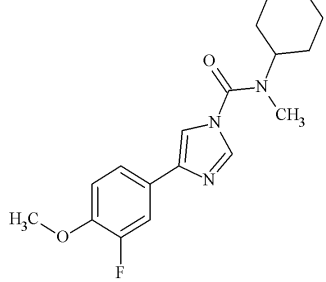
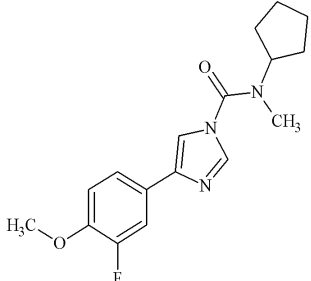
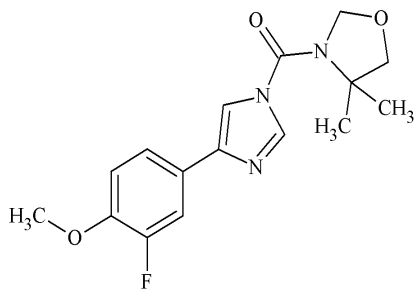
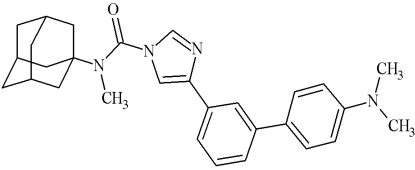
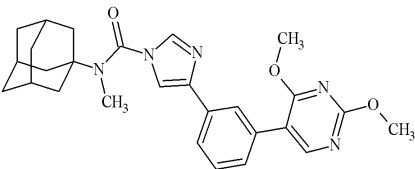
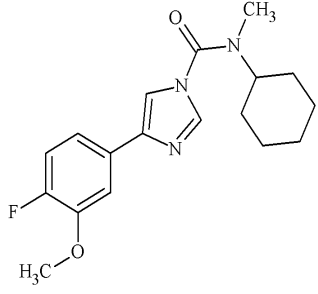
300		10
301		
302		
303		
304		
305		20
306		
307		
308		
309		

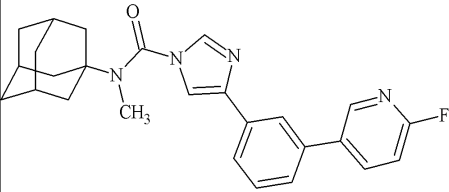
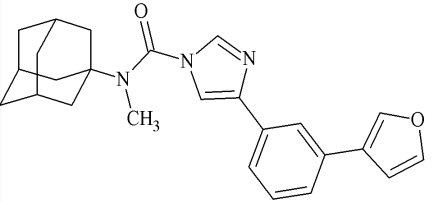
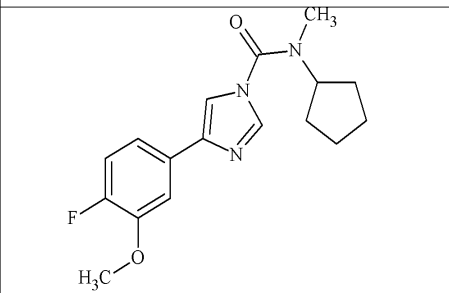
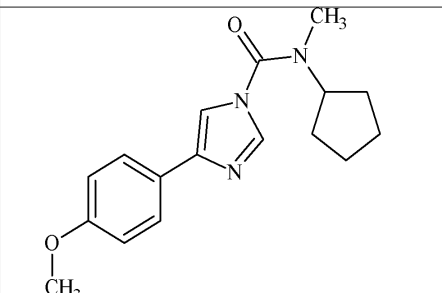
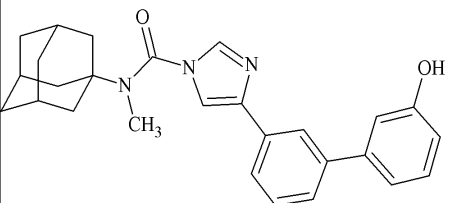
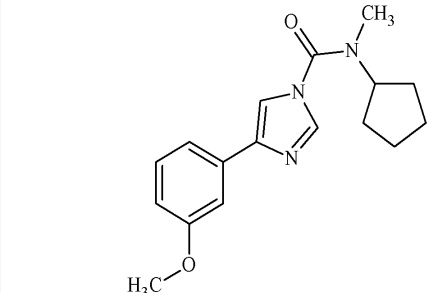
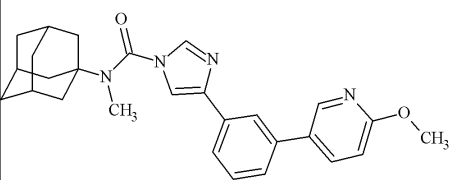
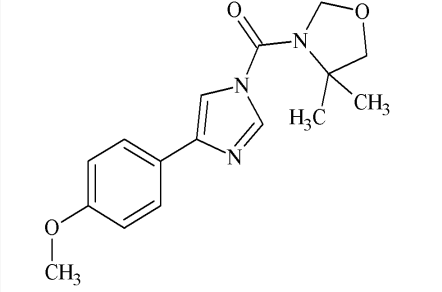
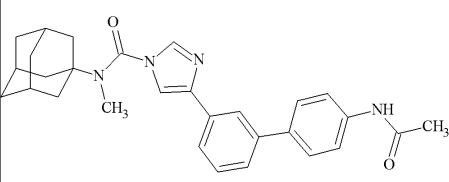
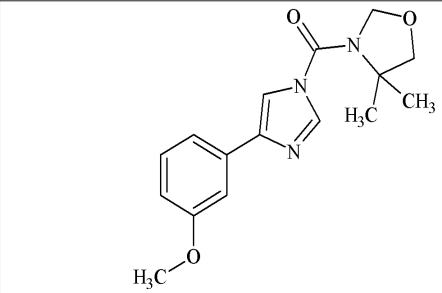
10

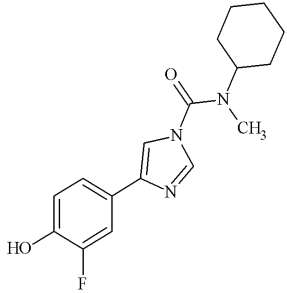
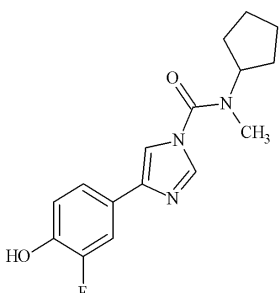
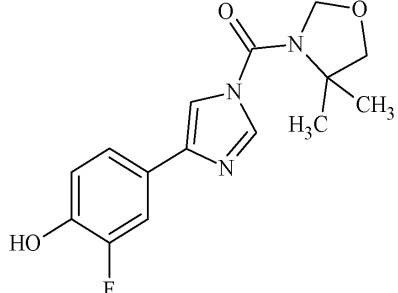
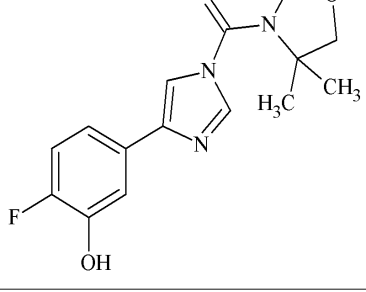
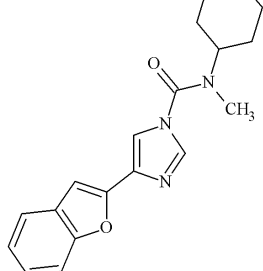
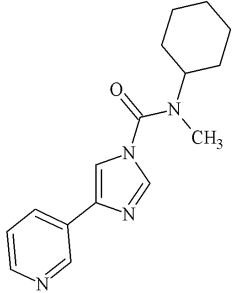
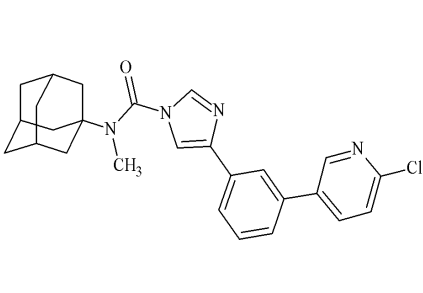
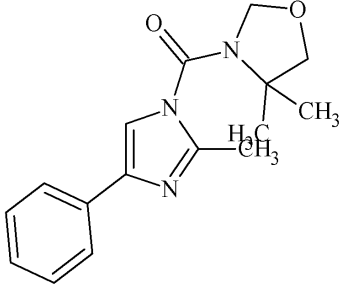
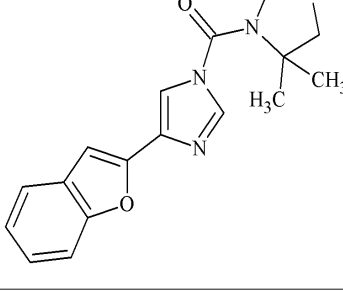
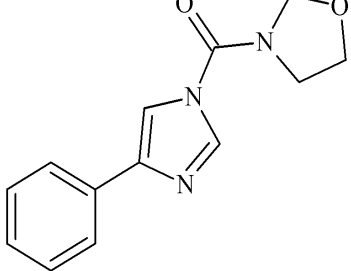
20

30

40

310		
311		
312		
313		
314		
315		
316		10
317		20
318		30
319		40

320		325		10
321		326		
322		327		
323		328		
324		329		40

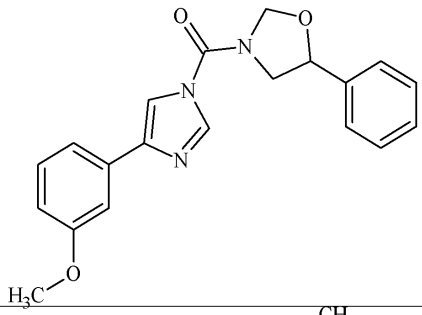
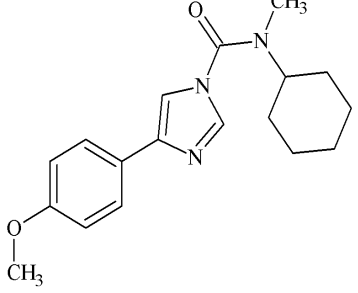
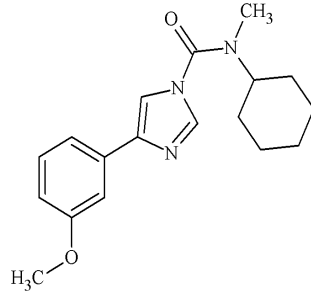
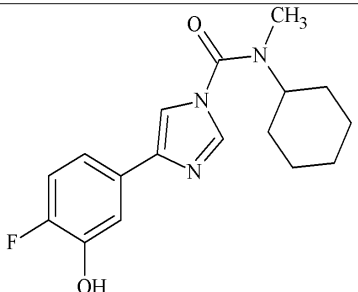
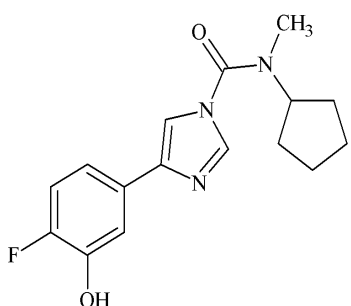
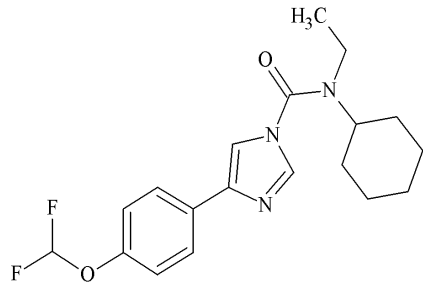
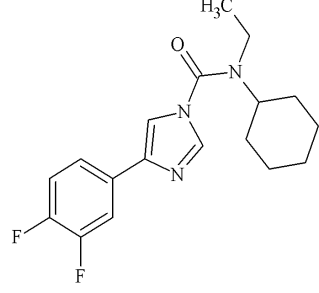
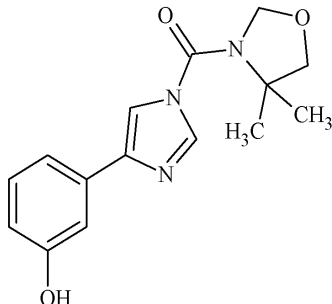
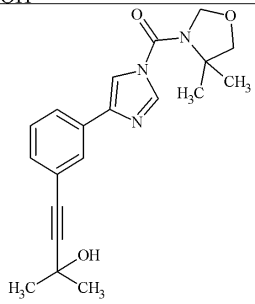
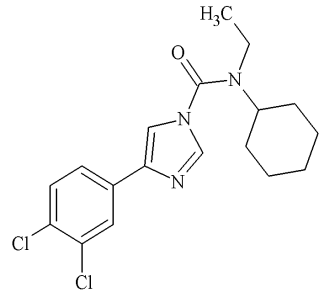
330		10
331		
332		
333		
334		
335		20
336		
337		
338		
339		

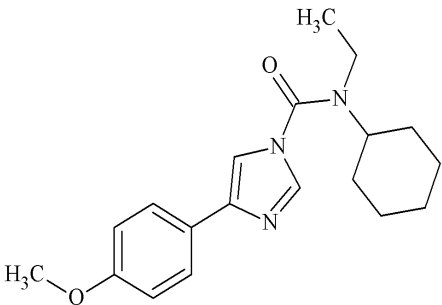
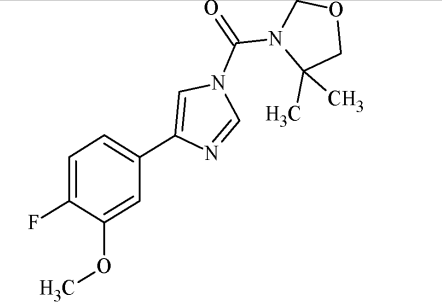
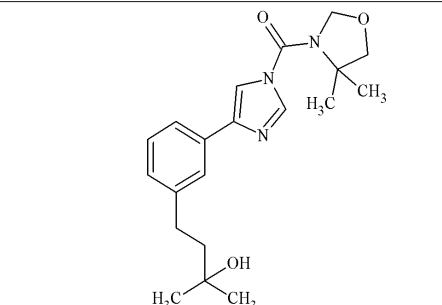
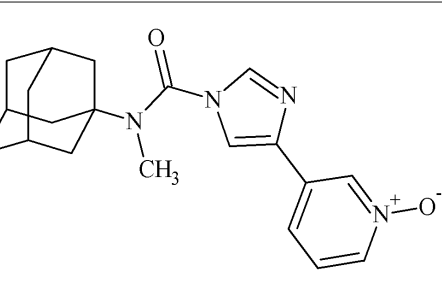
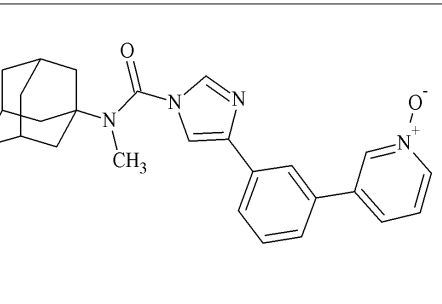
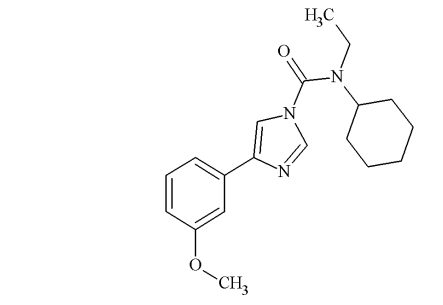
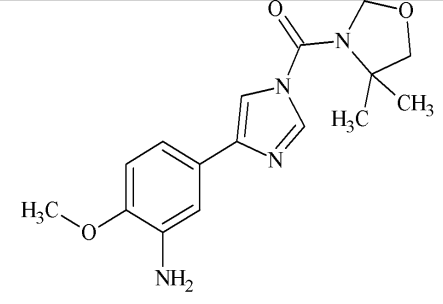
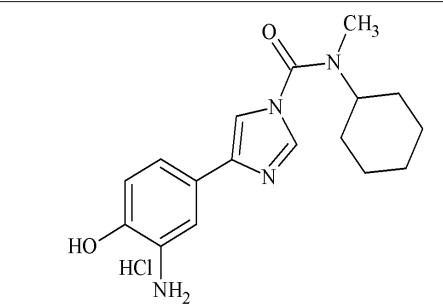
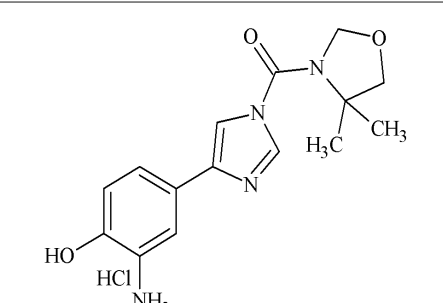
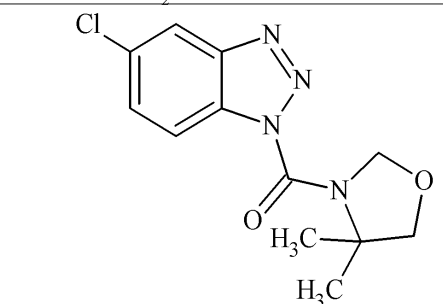
10

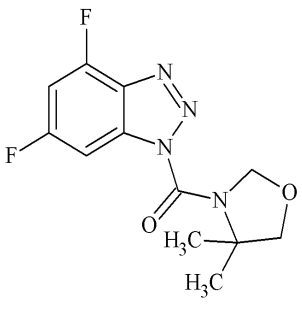
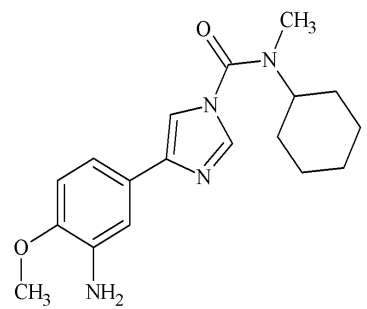
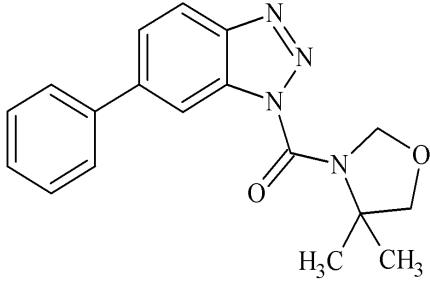
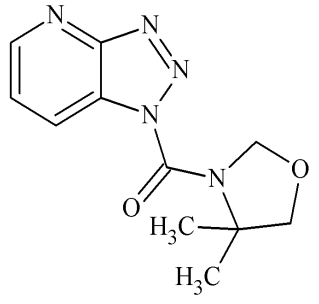
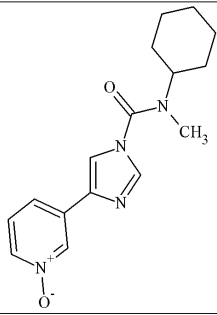
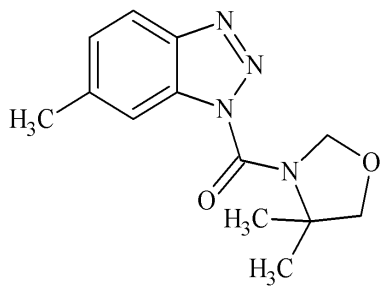
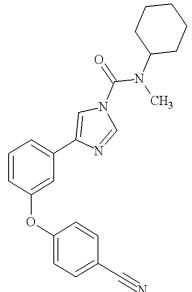
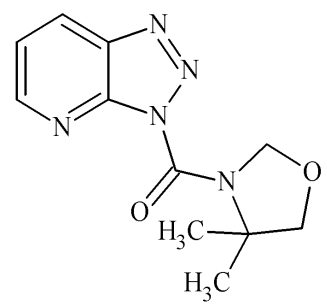
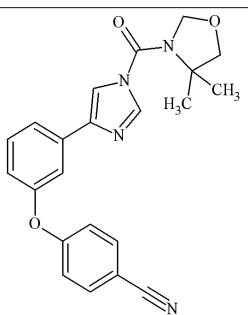
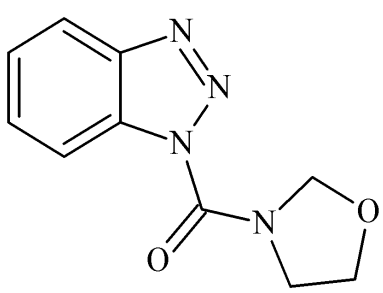
20

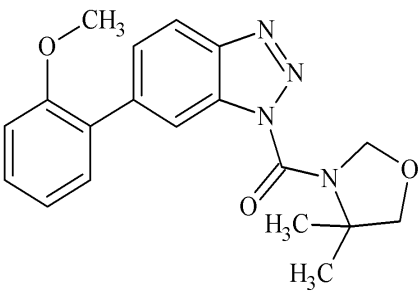
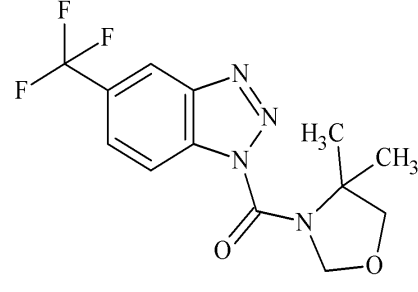
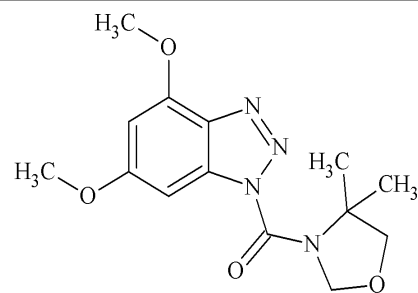
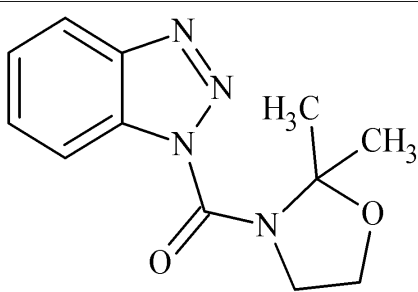
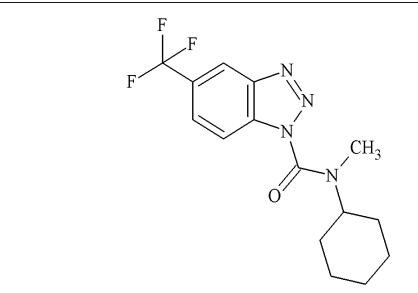
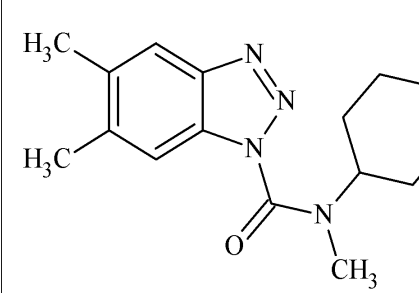
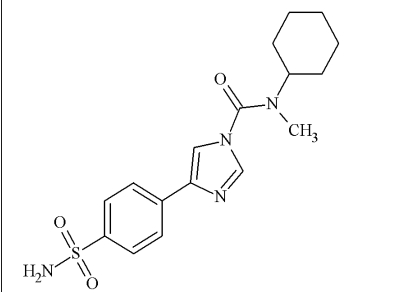
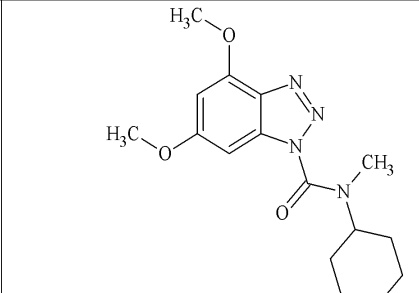
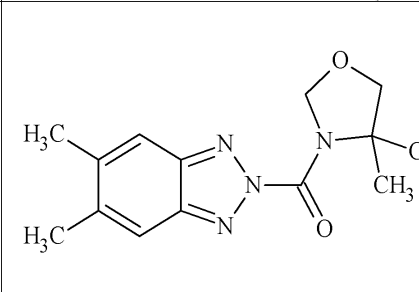
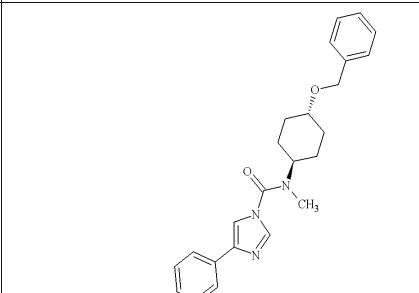
30

40

340		
341		
342		
343		
344		
345		10
346		
347		20
348		30
349		40

350		10
351		
352		
353		
354		20
355		
356		
357		
358		30
359		
		40

360		365		10
361		366		
362		367		
363		368		30
364		369		
				40

370		
371		
372		
373		
374		
375		
376		
377		
378		
379		

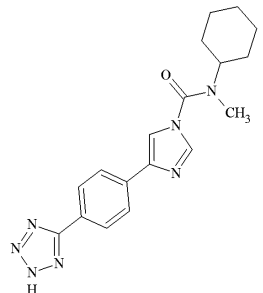
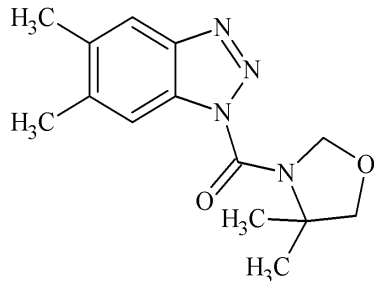
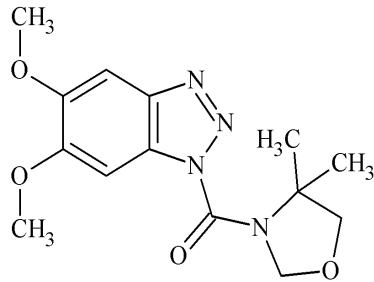
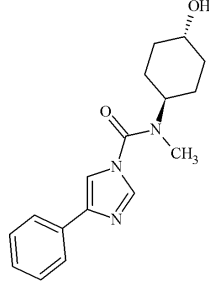
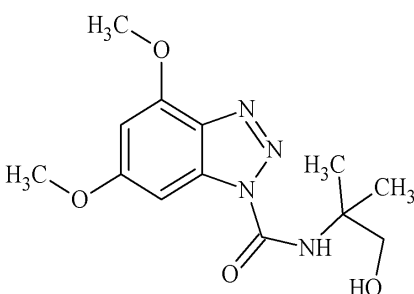
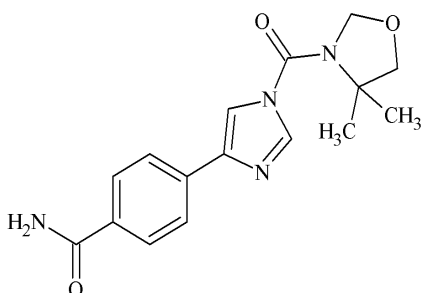
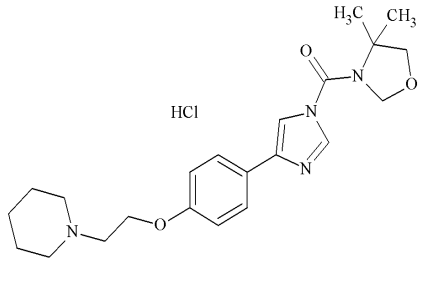
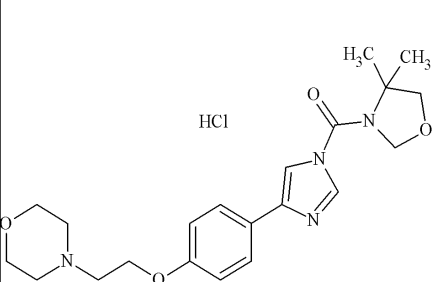
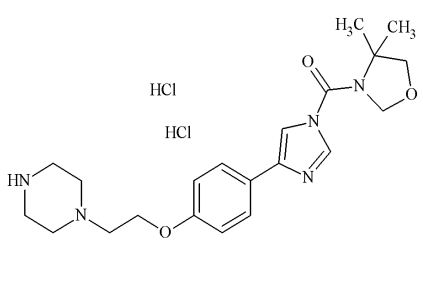
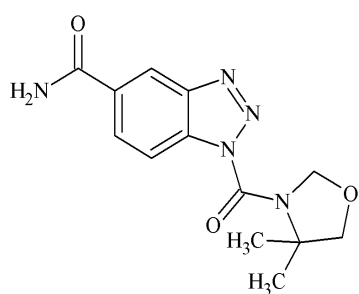
10

20

30

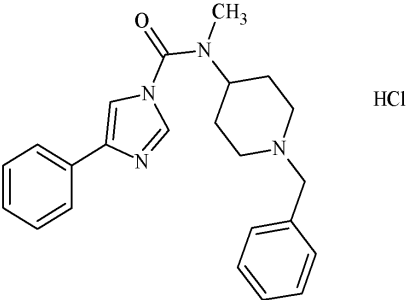
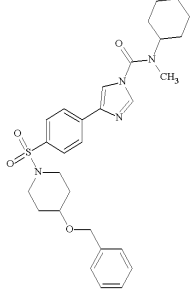
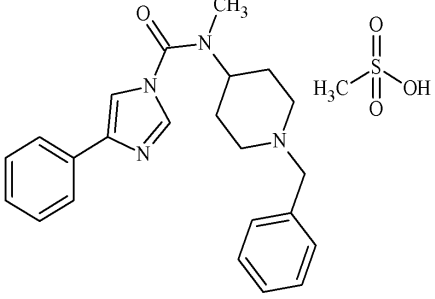
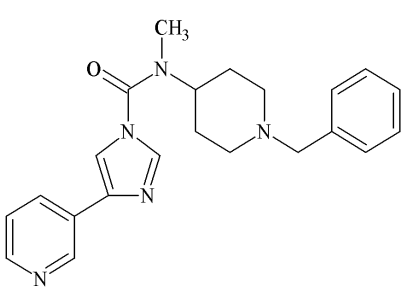
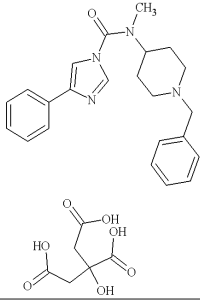
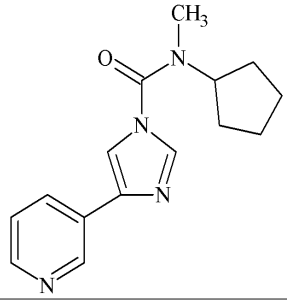
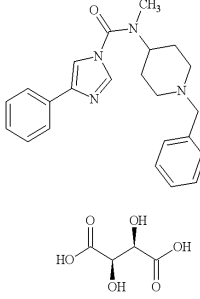
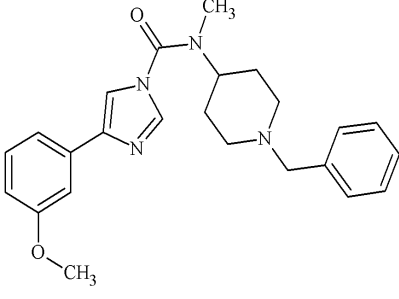
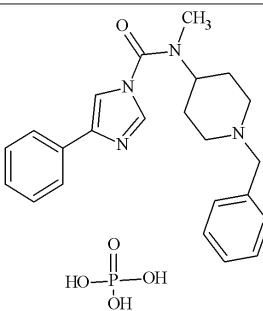
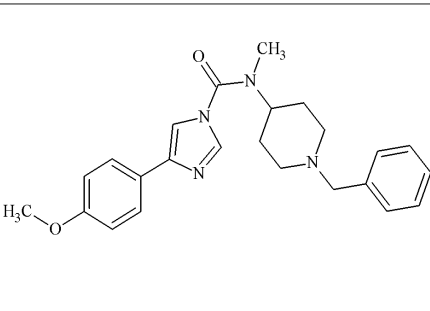
40

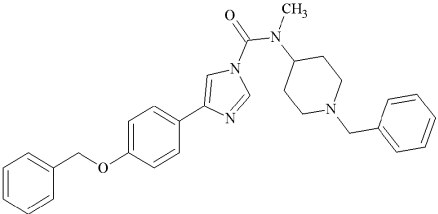
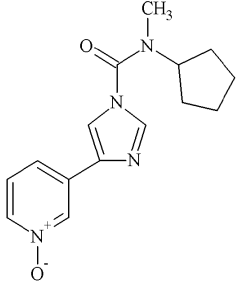
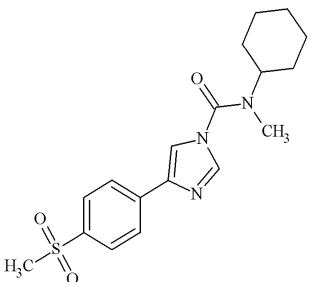
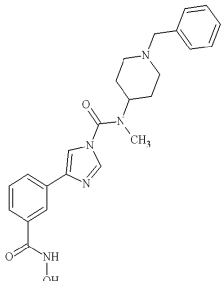
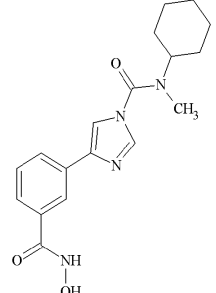
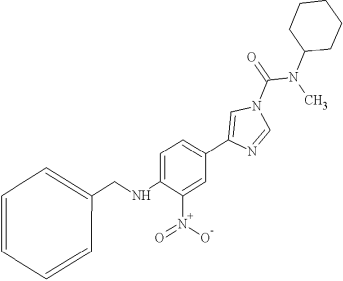
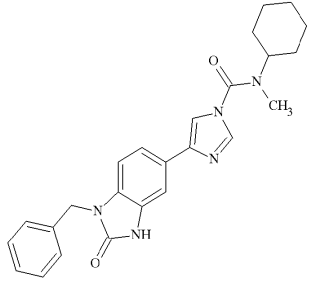
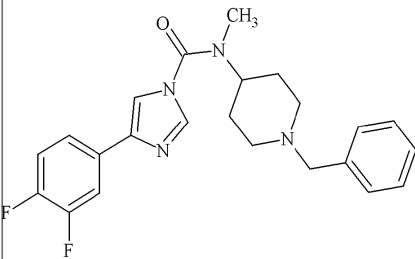
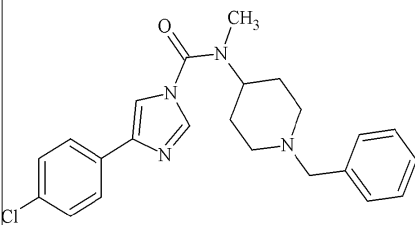
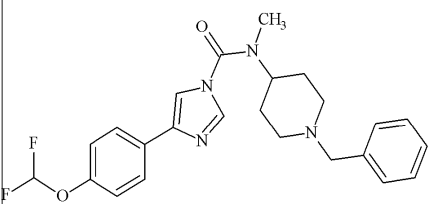


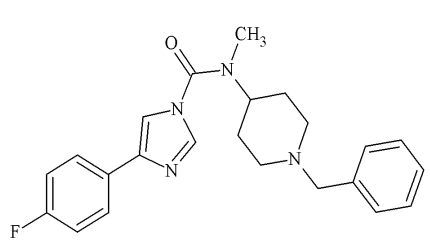
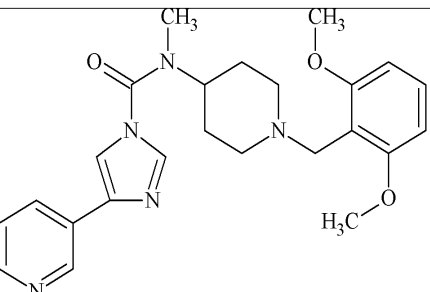
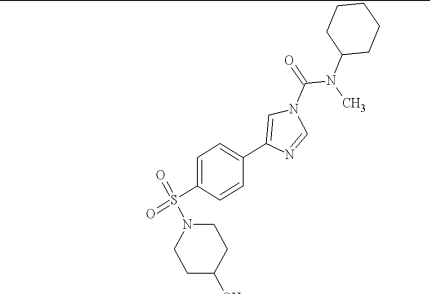
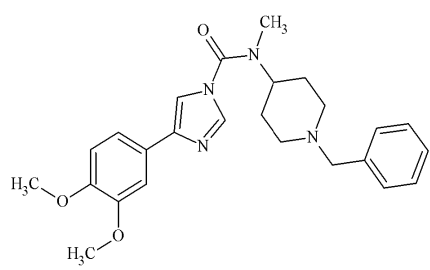
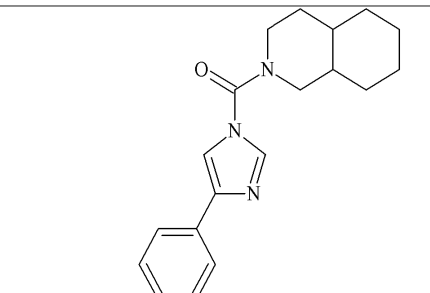
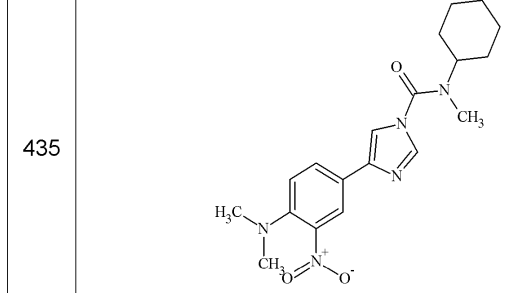
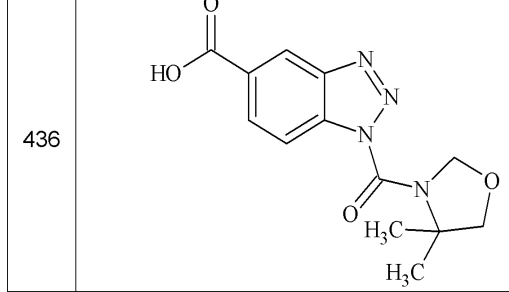
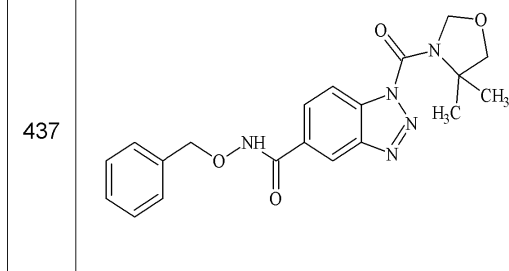
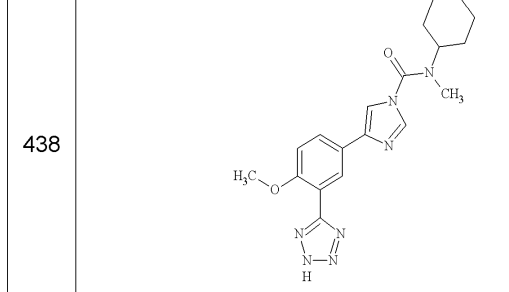
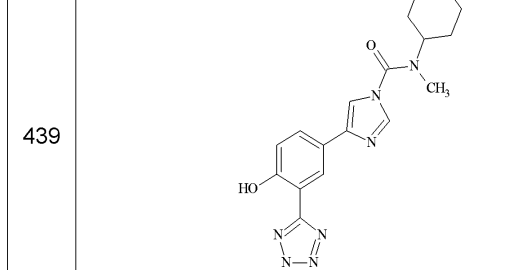
380		
381		
382		
383		
384		
385		
386		10
387		20
388		30
389		40

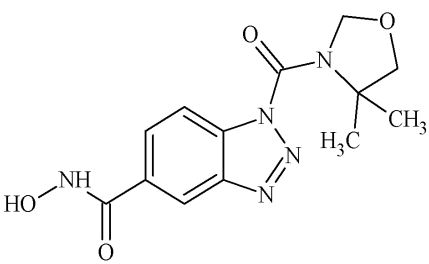
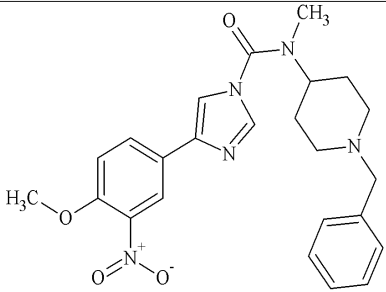
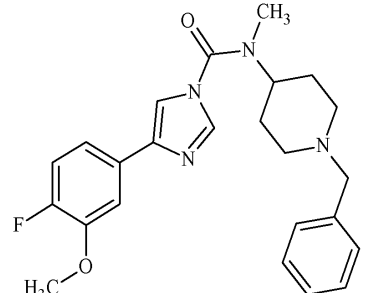
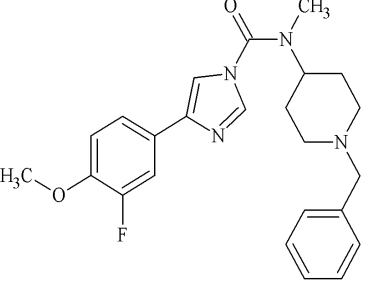
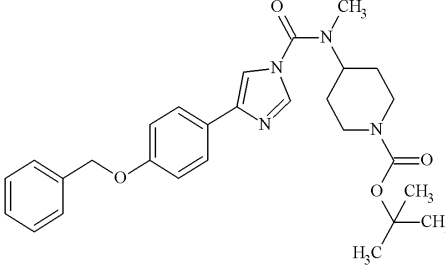
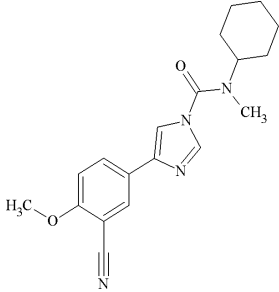
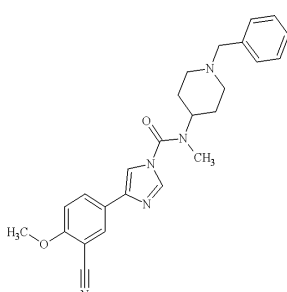
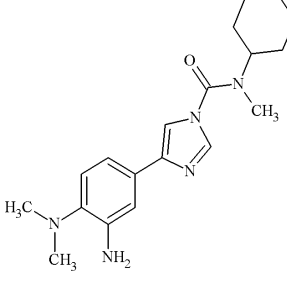
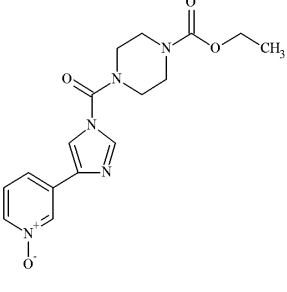
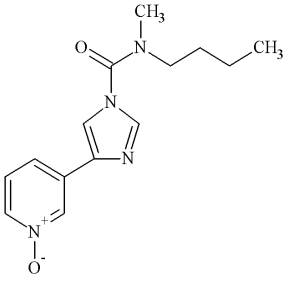
390		
391		
392		
393		
394		
395		
396		10
397		20
398		30
399		40

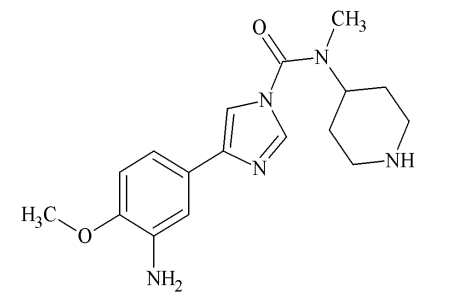
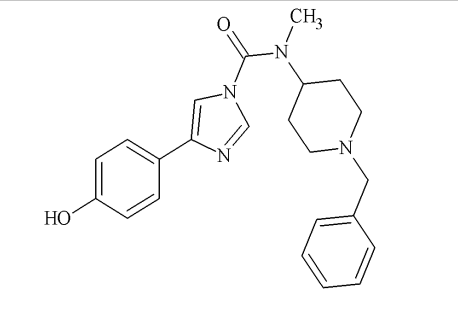
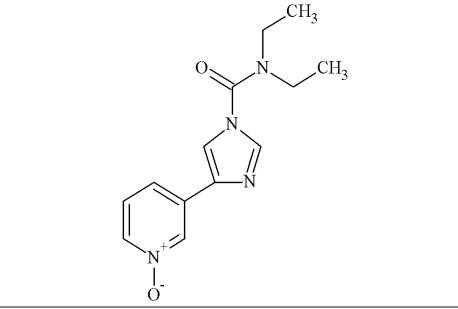
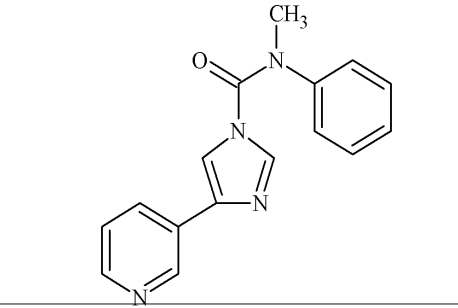
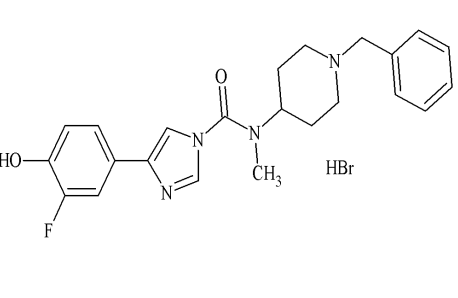
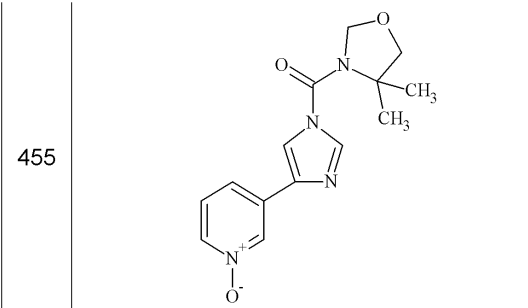
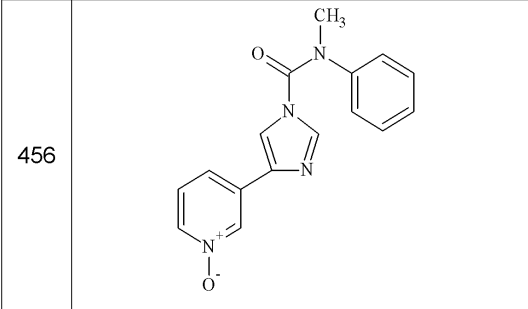
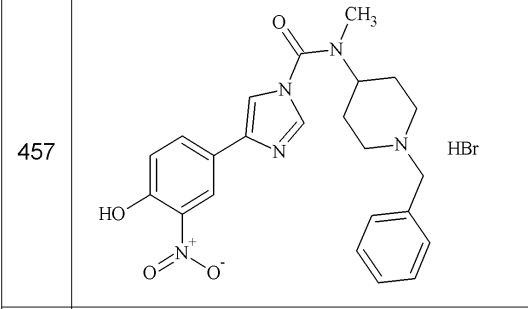
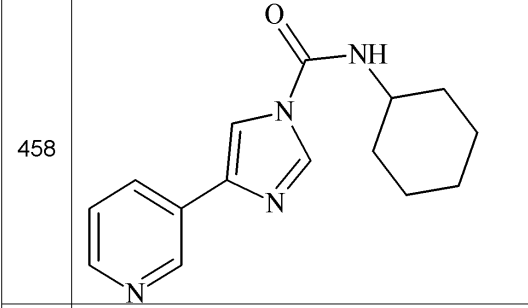
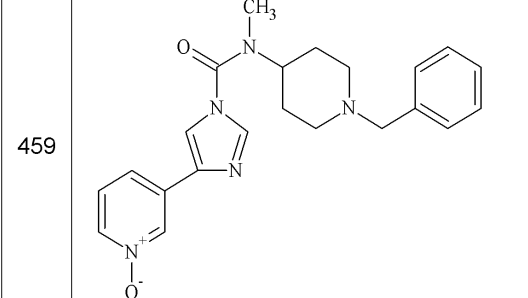
400	 HCl	405	 HCl	10
401	 HCl HCl	406	 HCl	
402	 HCl	407	 HCl HCl	20
403	 HCl	408	 HCl	30
404	 HCl	409	 HCl	40

410	 HCl	415		10
411	 $\text{H}_3\text{C}-\text{SO}_3\text{H}$	416		
412	 $\text{HO}-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{OH}$	417		20
413	 $\text{HO}-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}(\text{OH})-\text{CH}(\text{OH})-\text{C}(=\text{O})-\text{OH}$	418	 $\text{O}-\text{CH}_3$	30
414	 $\text{HO}-\text{P}(=\text{O})(\text{OH})-\text{OH}$	419	 $\text{H}_3\text{C}-\text{O}$	40

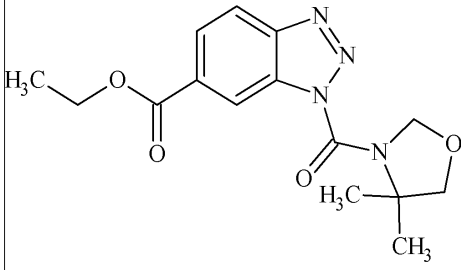
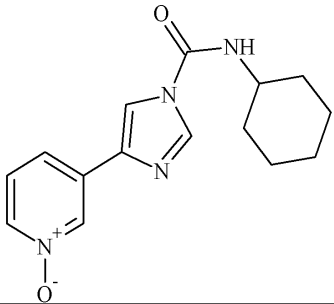
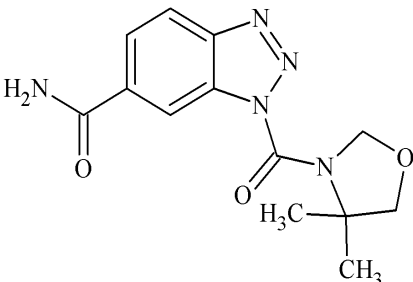
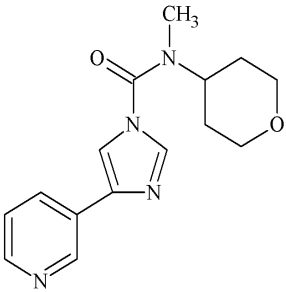
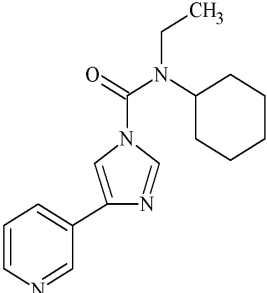
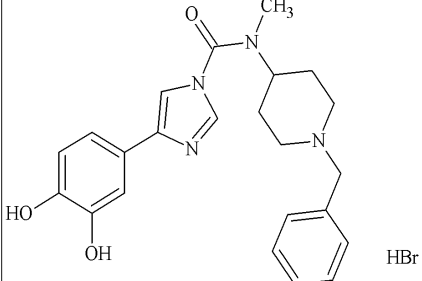
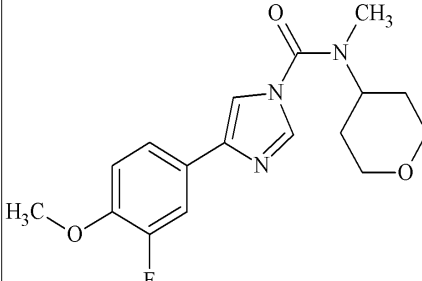
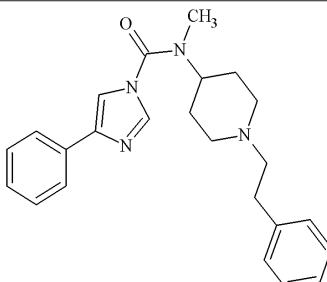
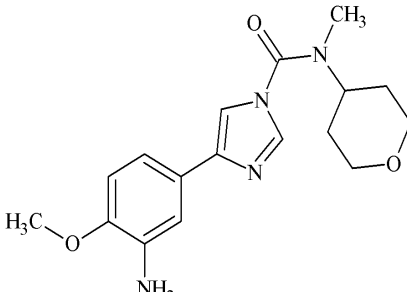
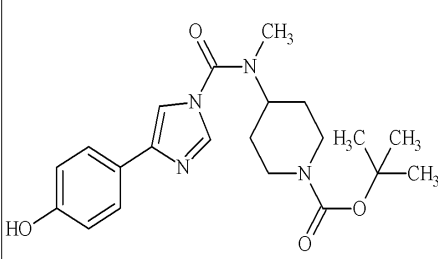
420		
421		
422		
423		
424		
425		
426		10
427		20
428		30
429		40

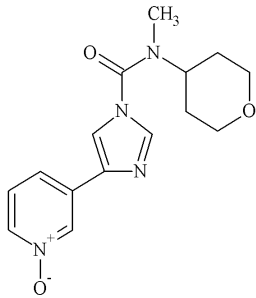
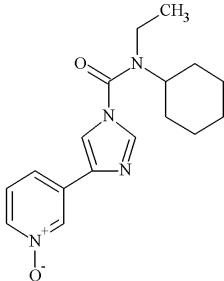
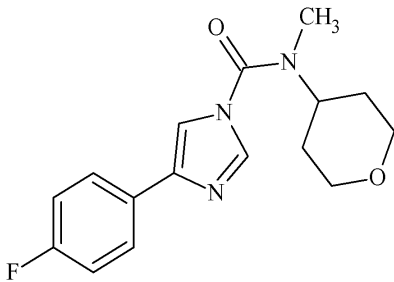
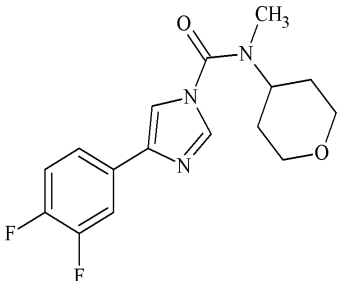
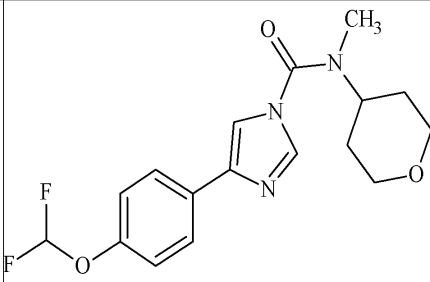
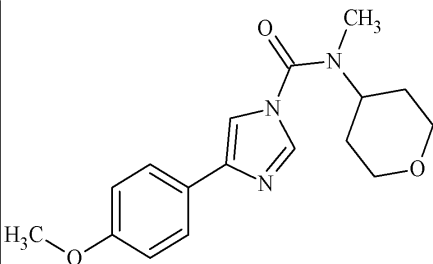
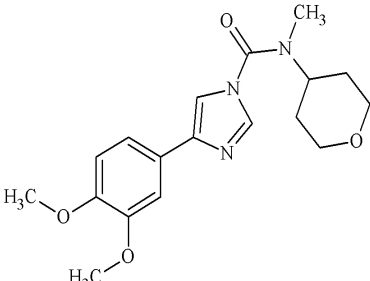
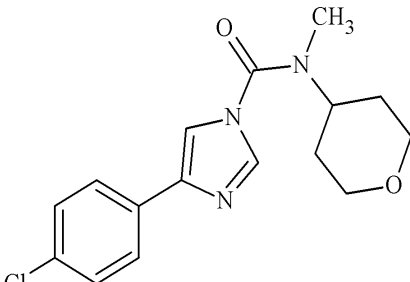
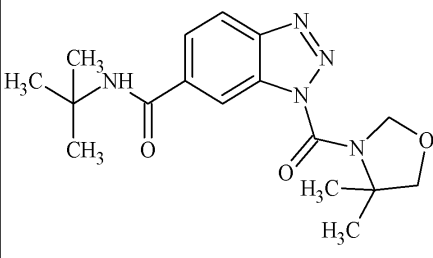
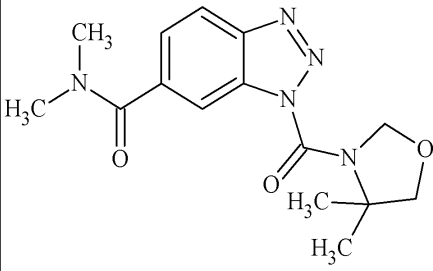
430		
431		
432		
433		
434		
435		10
436		
437		20
438		30
439		40

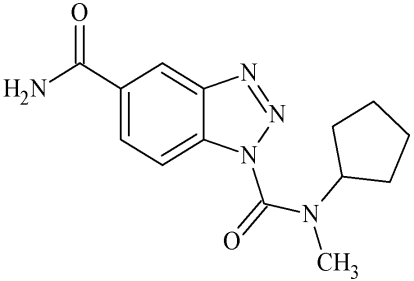
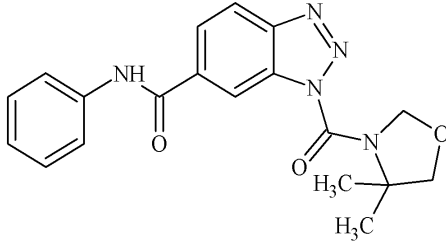
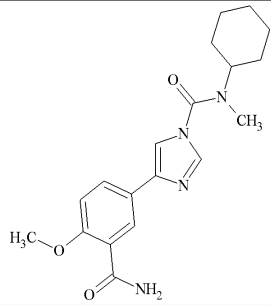
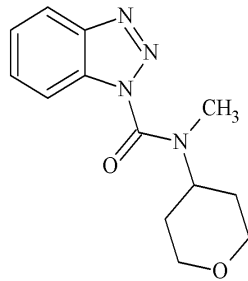
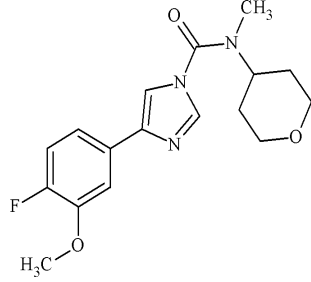
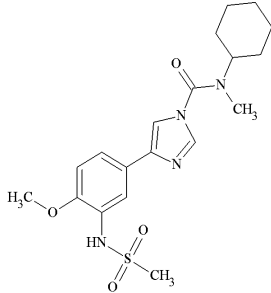
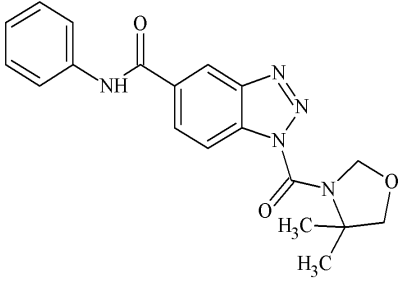
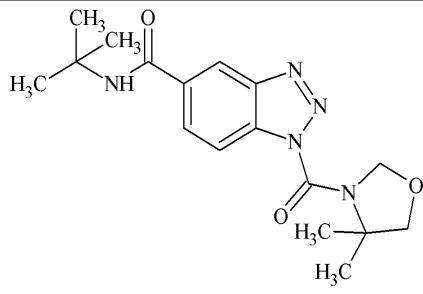
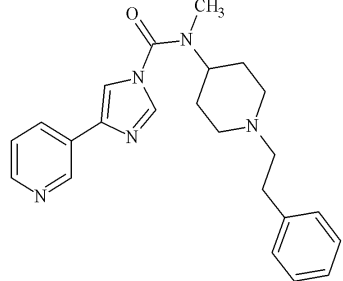
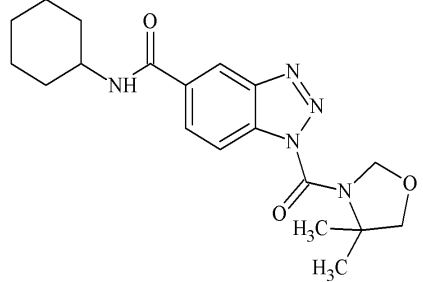
440		
441		
442		
443		
444		
445		
446		10
447		20
448		30
449		40

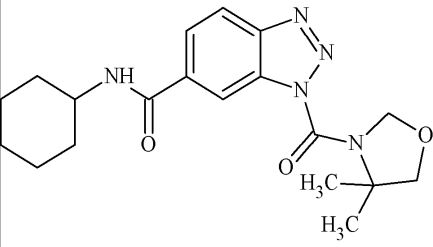
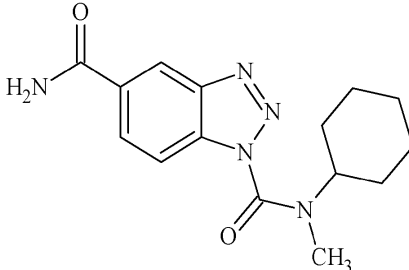
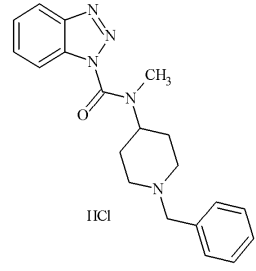
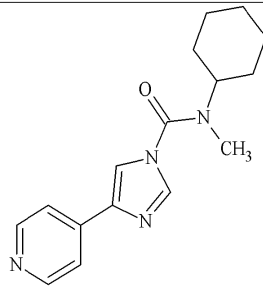
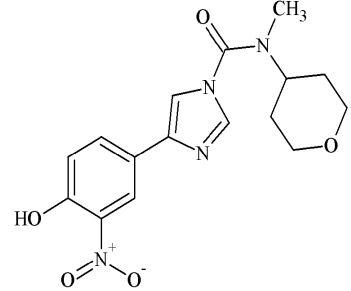
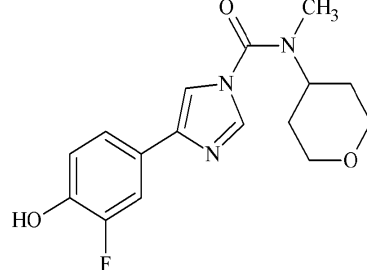
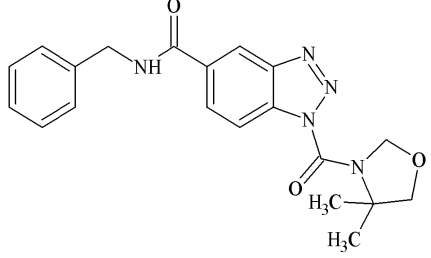
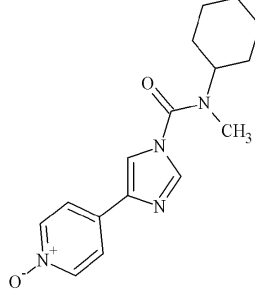
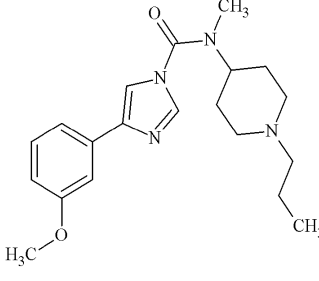
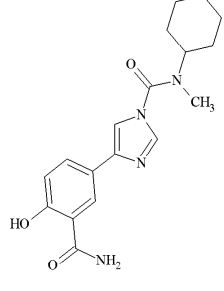
450		
451		
452		
453		
454		
455		
456		10
457		20
458		30
459		40

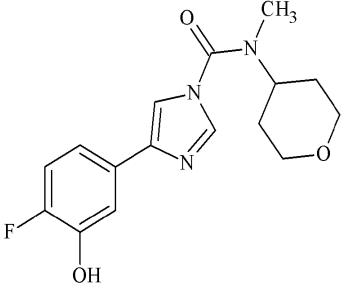
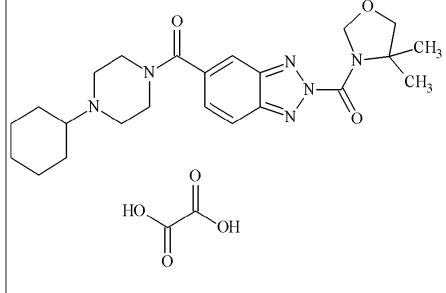
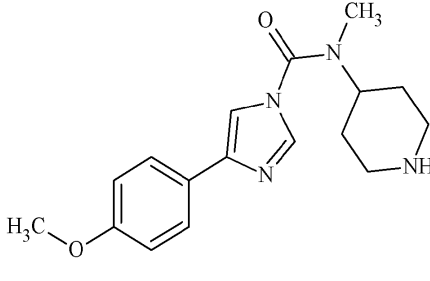
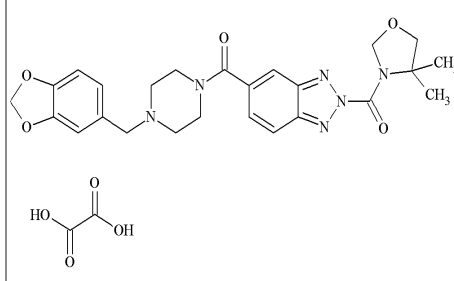
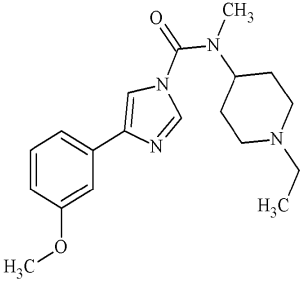
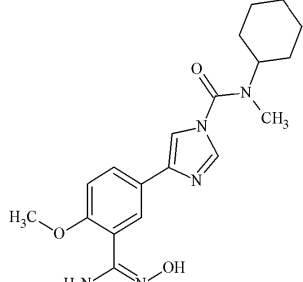
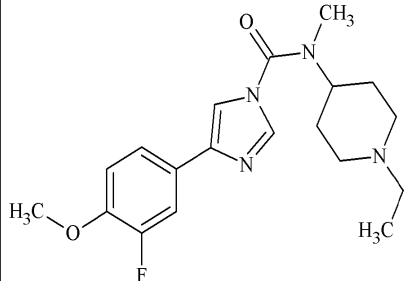
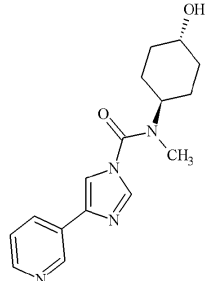
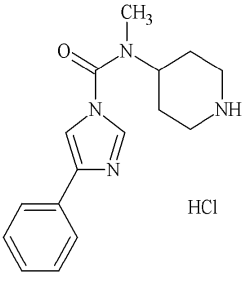
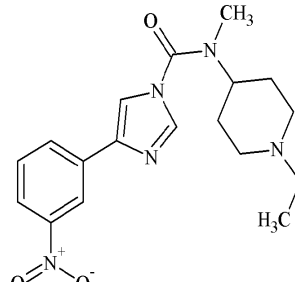


460		
461		
462		
463		
464		
465		10
466		
467		20
468		30
469		40

470		10
471		
472		
473		
474		
475		20
476		
477		
478		
479		40

480		
481		
482		
483		
484		
485		10
486		
487		20
488		30
489		40

490		
491		
492		
493		
494		
495		
496		10
497		20
498		30
499		40

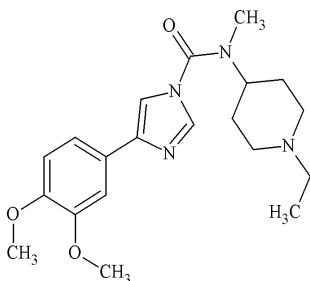
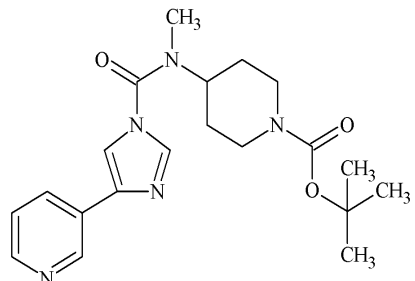
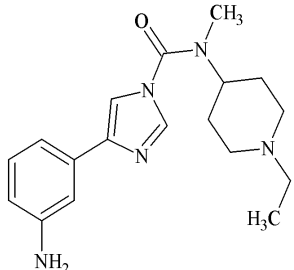
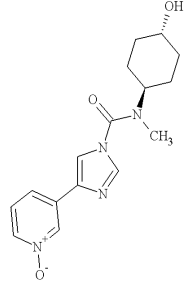
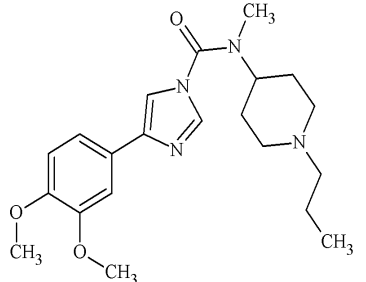
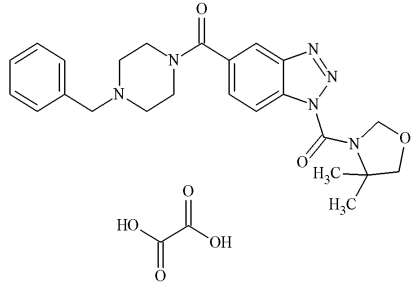
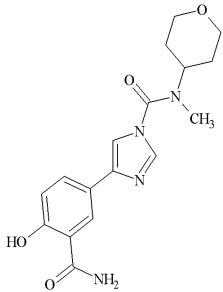
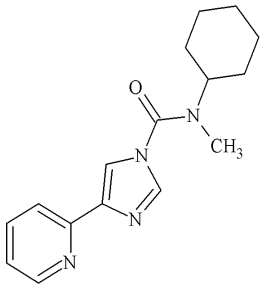
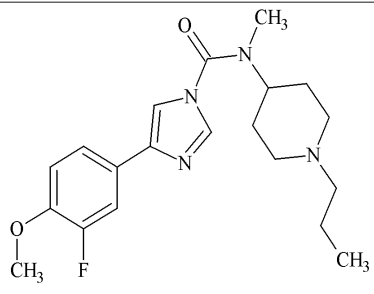
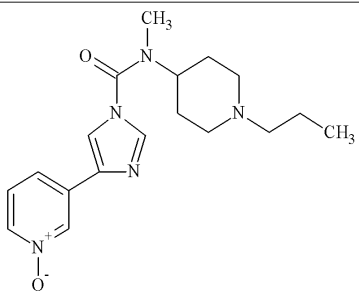
500		505	
501		506	
502		507	
503		508	
504		509	

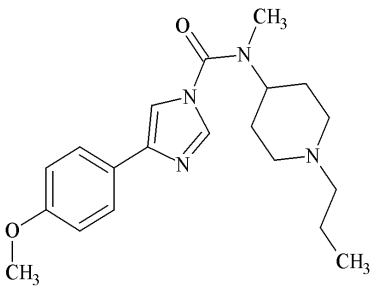
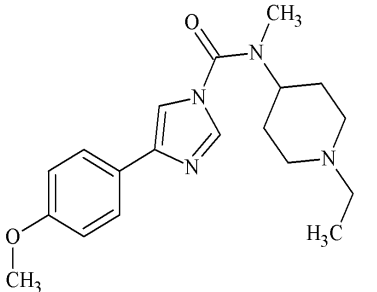
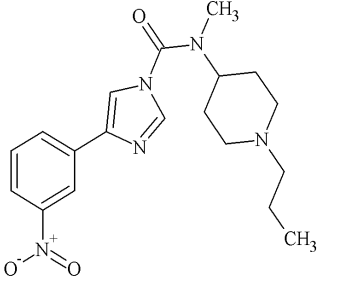
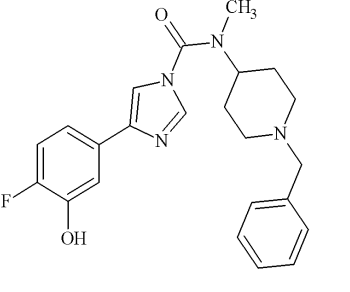
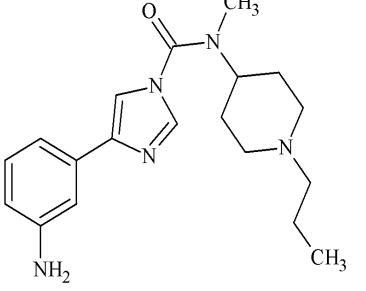
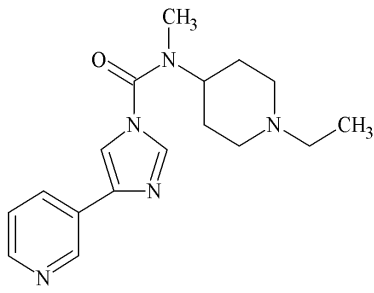
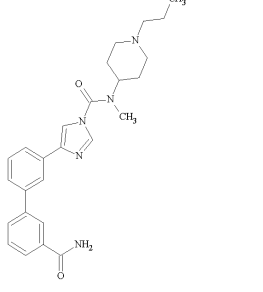
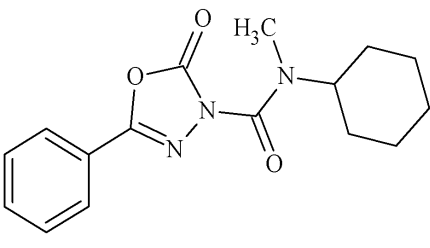
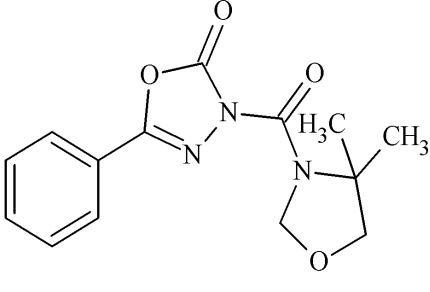
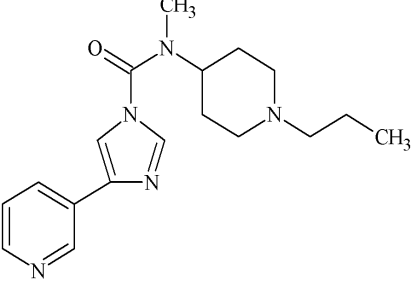
10

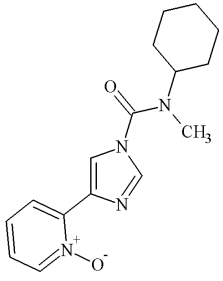
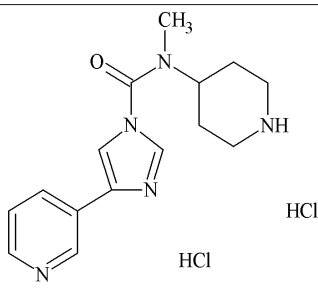
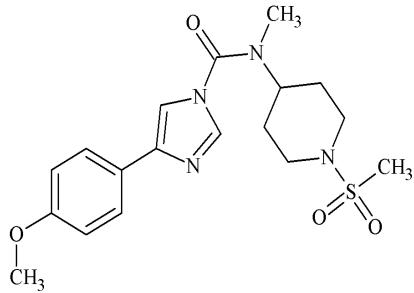
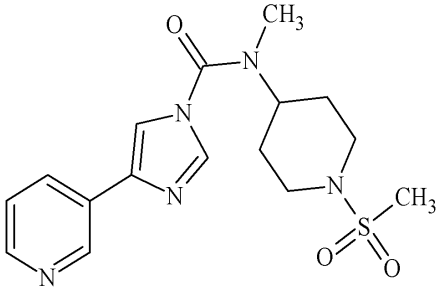
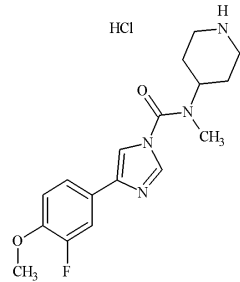
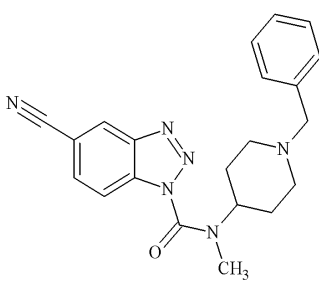
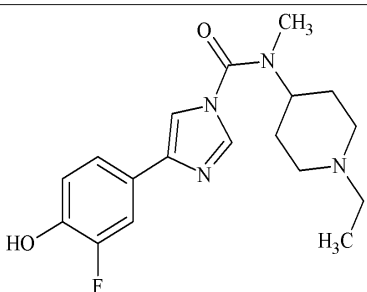
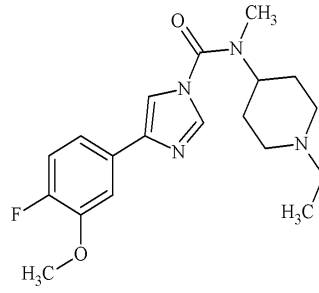
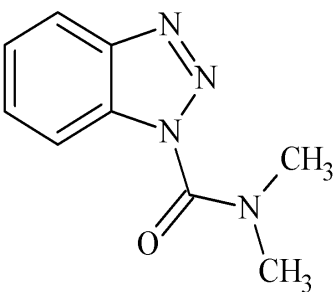
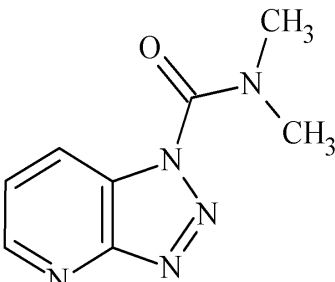
20

30

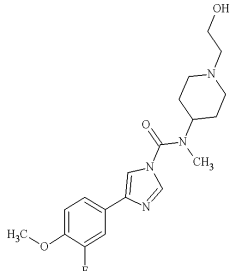
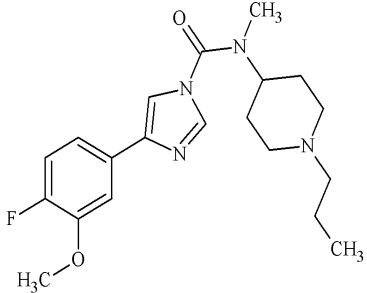
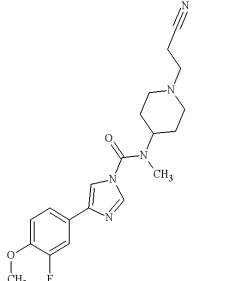
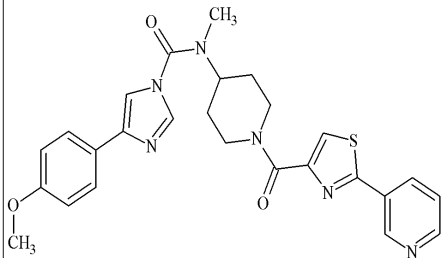
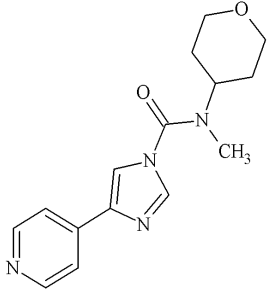
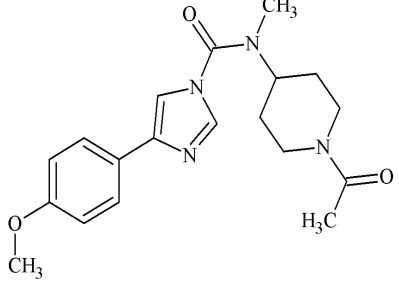
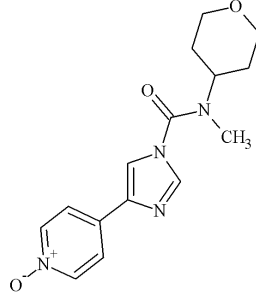
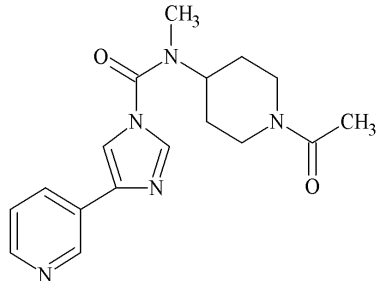
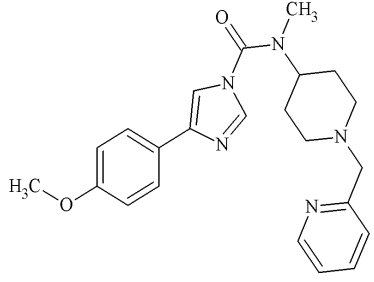
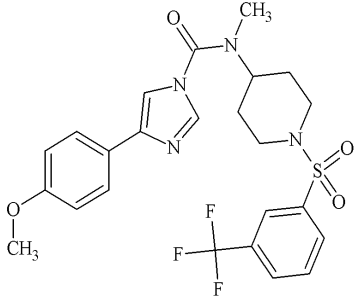
40

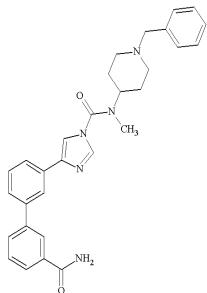
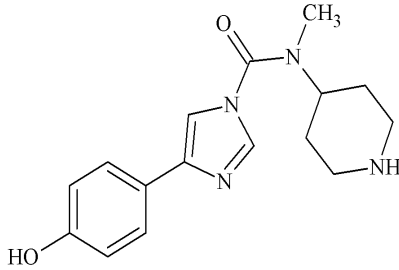
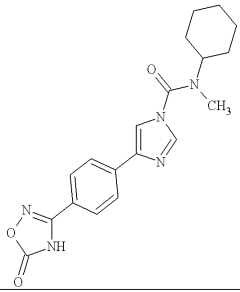
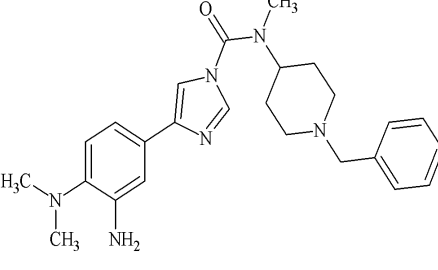
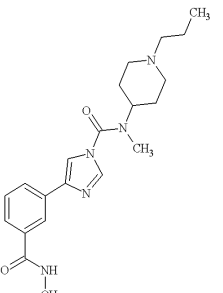
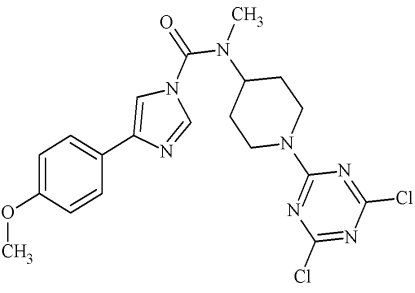
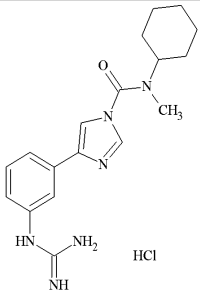
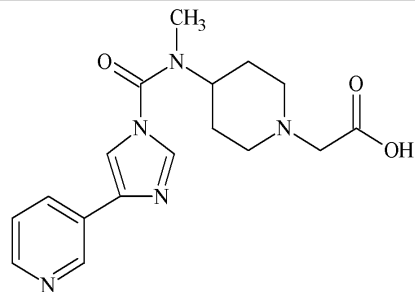
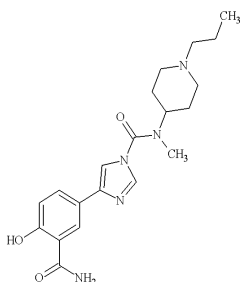
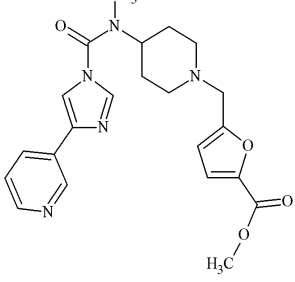
510		515		10
511		516		
512		517		20
513		518		30
514		519		40

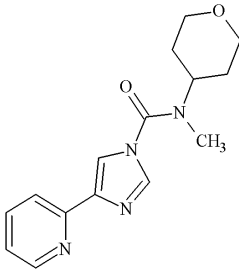
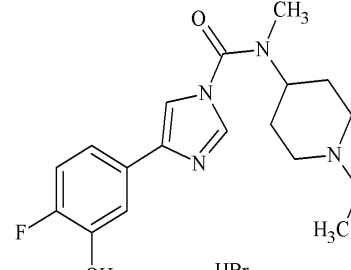
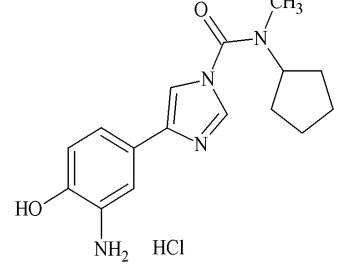
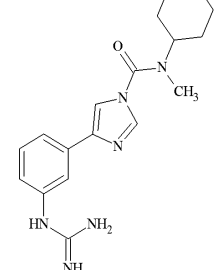
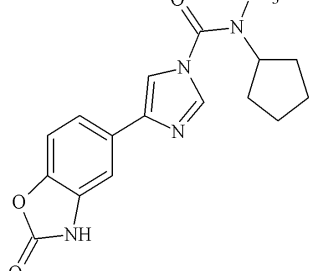
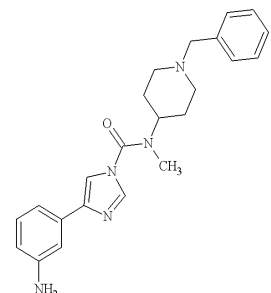
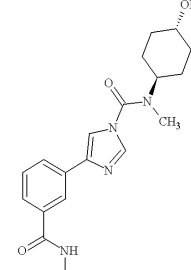
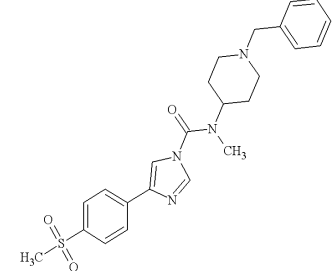
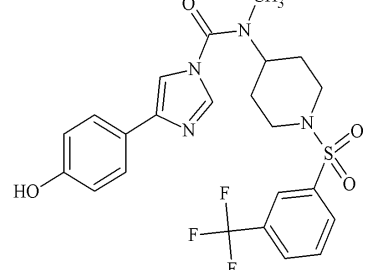
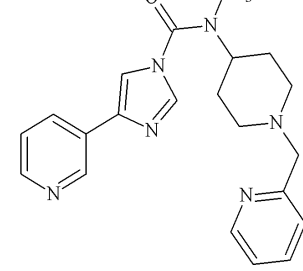
520		
521		
522		
523		
524		
525		
526		10
527		20
528		30
529		40

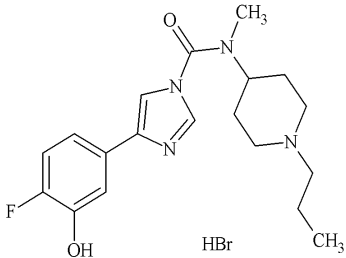
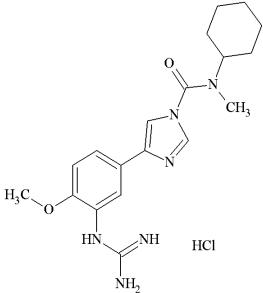
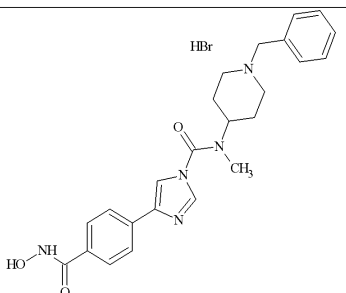
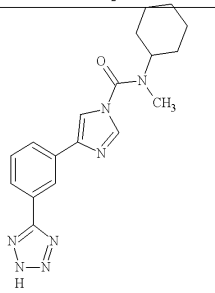
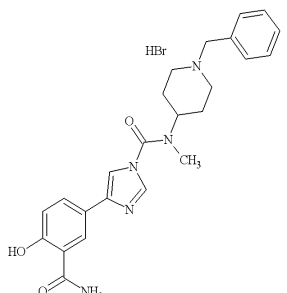
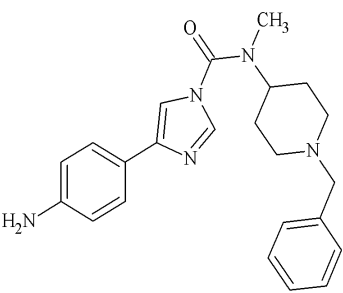
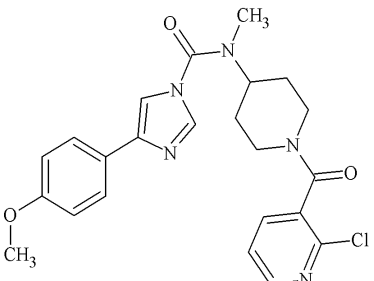
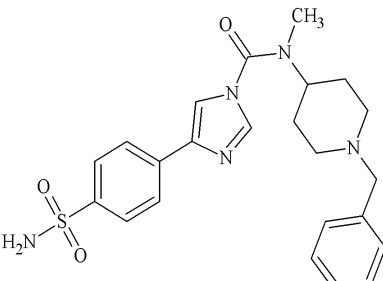
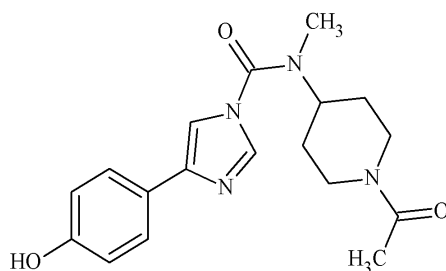
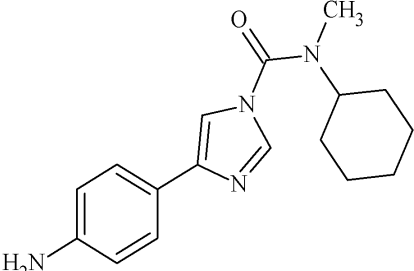
530		
531		10
532		20
533		30
534		40
535		
536		
537		
538		
539		



540		545		10
541		546		
542		547		20
543		548		30
544		549		40

550		555	 HBr	10
551		556		
552		557		20
553	 HCl	558		30
554		559		40

560		
561		
562		
563		
564		
565		10
566		
567		20
568		30
569		40

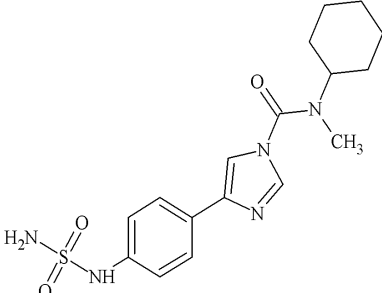
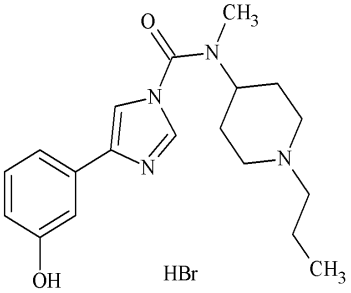
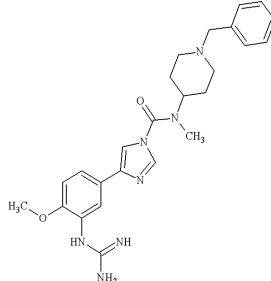
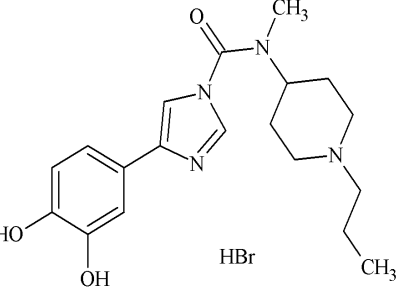
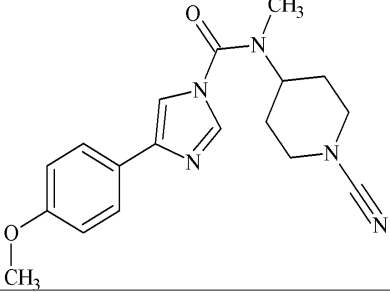
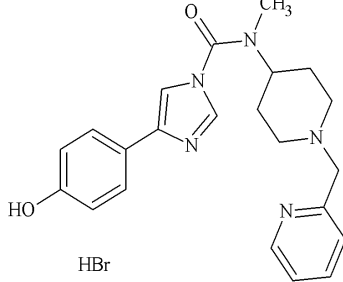
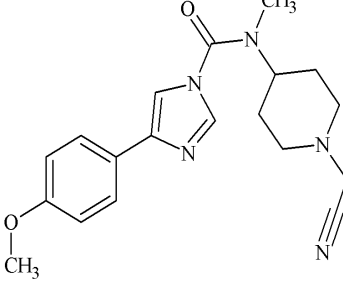
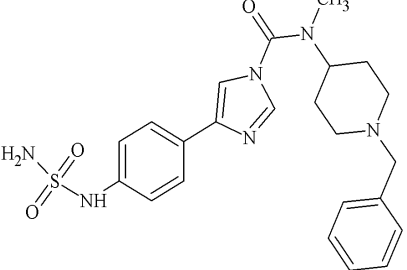
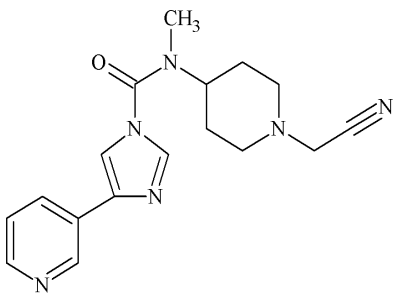
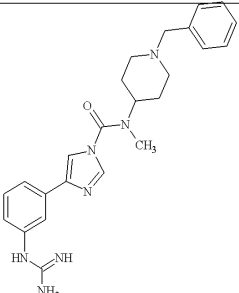
570	 HBr	575	 HCl	10
571	 HBr	576		
572	 HBr	577		
573		578		30
574	 H <sub>3</sub> C	579		

10

20

30

40

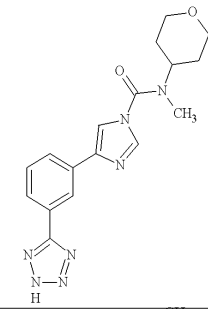
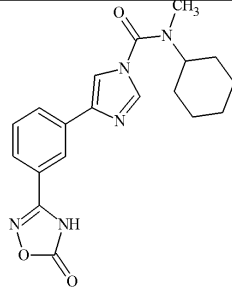
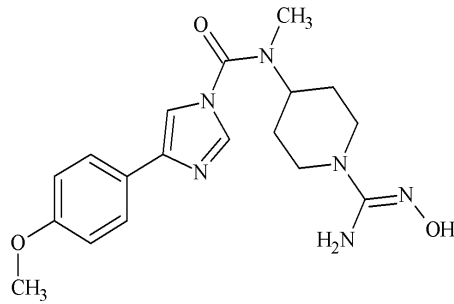
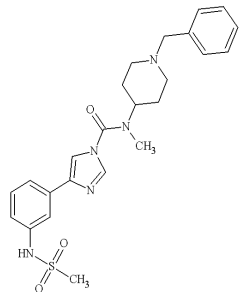
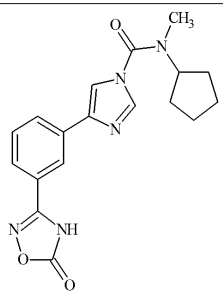
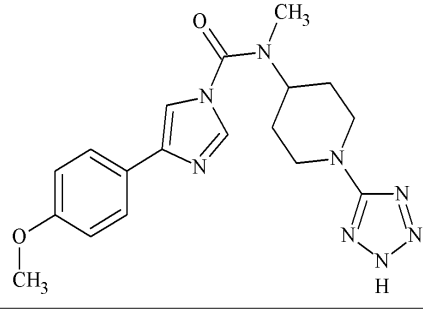
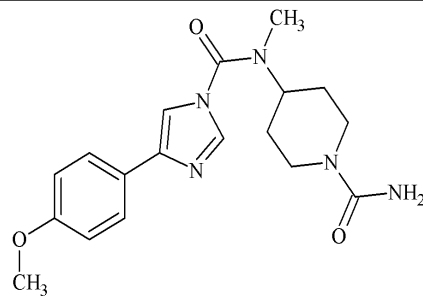
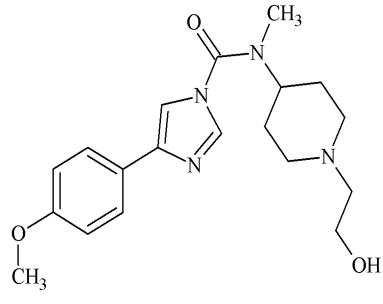
580		585		10
581		586		
582		587		
583		588		30
584		589		

10

20

30

40

590		
591		
592		
593		
594		
595		10
596		20
597		30
		40

## 【 0 3 3 5 】

上記の本発明の化合物は、以下で詳述するように、融点およびNMRによって特性を明らかにした。NMRスペクトルは、内部標準として用いられる溶媒を使用したBruker Avance D PX400分光計に記録された。100 MHzでの<sup>13</sup>Cスペクトルが記録され、400 MHzでの<sup>1</sup>Hスペクトルが記録された。次に示す順序でデータを記載した：およその化学シフト（ppm）、プロトン数、多重度（br, 広幅；d, 二重線；m, 多重線；s, 一重線；t, 三重線）および結合定数（Hz）。

化合物No. 1 (融点: 89~91). NMR 溶媒: DMSO  
13C: 150.4, 137.1, 128.9, 118.6, 65.7, 46.1  
1H: 8.04 (1H, s), 7.48 (1H, s), 7.03 (1H, s), 3.65 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.50 (4H, m, J = 5.0 Hz)

化合物No. 2 (融点: 58). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>  
13C: 150.2, 142.9, 137.7, 130.3, 129, 128, 125.9, 118.4, 40.1  
1H: 7.57 (1H, s), 7.39 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.32 (1H, t, J = 7.3 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.7 Hz), 6.85 (1H, s), 6.81 (1H, s), 3.50 (3H, s)

10

化合物No. 3 (融点: 97~99). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>  
13C: 150.8, 142.7, 136.9, 132.7, 128.7, 127.7, 125.2, 112.8, 66.5, 46.8  
1H: 7.92 (1H, s), 7.79 (2H, d, J = 7.8 Hz), 7.47 (1H, s), 7.41 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.30 (1H, m, J = 7.6 Hz), 3.78 (4H, m), 3.68 (4H, m)

化合物No. 4 (融点: 104~105). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>  
13C: 150.1, 142.9, 141.4, 137.7, 132.8, 130.4, 128.5, 128.2, 127.4, 126, 125, 113.5, 40.2  
1H: 7.60 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.53 (1H, s), 7.40 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.34 (1H, m), 7.32 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.25 (1H, m), 7.19 (2H, m), 7.18 (1H, s), 3.52 (3H, s)

20

化合物No. 5 (融点: 117). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>  
13C: 154.2, 146.9, 136.6, 131.7, 129.9, 129.2, 129.1, 128.8, 126.3, 124.7, 119.8, 106.7  
1H: 9.19 (1H, s), 8.36 (1H, d, J = 2.7 Hz), 7.91 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.67 (2H, d, J = 7.8 Hz), 7.49 (2H, m, J = 7.2 Hz), 7.43 (3H, m), 7.19 (1H, t, J = 7.4 Hz), 6.79 (1H, d, J = 2.7 Hz)

30

化合物No. 6 (融点: 98~99). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>  
13C: 156.7, 154.1, 147.2, 131.8, 129.9, 129.5, 129.1, 128.8, 126.2, 121.7, 114.4, 106.5, 55.5  
1H: 9.05 (1H, s), 8.34 (1H, d, J = 2.8 Hz), 7.89 (2H, m, J = 8.4 Hz), 7.55 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.47 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.41 (1H, t, J = 7.3 Hz), 6.94 (2H, m, J = 8.8 Hz), 6.76 (1H, d, J = 2.8 Hz), 3.83 (3H, s)

化合物No. 7 (融点: 62). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>  
13C: 151.7, 149.1, 145.7, 143.1, 129.6, 127.7, 125.8, 40.5  
1H: 8.64 (1H, s), 7.73 (1H, s), 7.37 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.3 Hz), 7.13 (2H, d, J = 7.8 Hz), 3.56 (3H, s)

40

化合物No. 8 (融点: 64~65). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>  
13C: 151.7, 144.6, 141.8, 131.1, 129.3, 126.6, 125.4, 107.3, 40.4  
1H: 8.01 (1H, d br, J = 2.7 Hz), 7.40 (1H, br), 7.33 (2H, m, J = 8.1 Hz), 7.23 (1H, m, J = 7.6 Hz), 7.11 (2H, m, J = 8.3 Hz), 6.25 (1H, d d, J = 1.7, 2.7 Hz), 3.55 (3H, s)

化合物No. 9 (融点: 71~72). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

50

<sup>13</sup>C: 146.8, 142.3, 136.6, 129.2, 128.7, 124.7, 119.6, 109

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

化合物No. 10 (融点: 125 ~ 126). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

10

化合物No. 11 (融点: 110). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 155.9, 154.1, 147.1, 136.8, 131.8, 129.9, 129.8, 129.1, 128.8, 128.6, 128, 127.5, 126.2, 121.7, 115.4, 106.5, 70.3

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

20

化合物No. 12 (融点: 79). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

化合物No. 13 (融点: 79 ~ 80). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 153.7, 151, 133.3, 132.1, 128.8, 128.7, 126, 104.9, 66.8, 47

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

30

化合物No. 14 (融点: 132). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

<sup>1</sup>H: 8.19 (1H, s), 7.85-7.77 (3H, m), 7.64 (1H, d d, J = 1.8, 8.7 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (4H, m), 7.36 (1H, m, J = 7.4 Hz), 7.34 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.21 (2H, m, J = 8.1 Hz), 3.54 (3H, s)

化合物No. 15 (融点: 134). NMR 溶媒: Acetone

<sup>13</sup>C: 154.8, 148.1, 141.2, 138, 137.9, 133, 131.1, 129.9, 129.8, 129.7, 128.2, 128.1, 127.6, 127.1, 121.5, 107.4

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

40

化合物No. 16 (融点: 119 ~ 120). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.2, 150.1, 141.2, 137.9, 135.5, 133.6, 132.8, 130.2, 128.2, 128.1, 127.6, 127.3, 126.2, 125.7, 123.6, 123.3, 115.5, 114.2, 55.5, 40.5

50



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

化合物No. 17 (融点: 138). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.1, 150.1, 141.2, 137.7, 135.5, 132.8, 128.6, 127.4, 127.3, 125, 115.5, 113.7, 55.5, 40.5

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

10

化合物No. 18 (融点: 123 ~ 124). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

化合物No. 19 (融点: 104). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.4, 145.3, 133.1, 129.5, 125.4, 119.9, 113.6, 66.7, 48.2, 45.6

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

20

化合物No. 20 (融点: 181 ~ 183). NMR 溶媒: DMSO

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

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

30

化合物No. 21 (融点: 208 ~ 211). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150, 147.8, 143.2, 140.7, 140, 134.5, 130.5, 126.8, 106.1, 66, 46.6

<sup>1</sup>H: 9.35 (1H, s), 8.86 (2H, m), 8.40 (1H, d, J = 2.5 Hz), 8.02 (1H, t br, J = 6.3 Hz), 7.31 (1H, d, J = 2.5 Hz), 3.77 (4H, br), 3.71 (4H, br)

化合物No. 22 (融点: 168 ~ 170). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 159.6, 153, 147.3, 140.6, 139.5, 138.6, 130.8, 130.7, 129.6, 129, 127.8, 127, 126.9, 126.7, 113, 109.9, 106.9, 106.6, 55.2

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

40

化合物No. 23 (融点: 163). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 156.2, 152.9, 147.5, 140.5, 139.5, 130.8, 130.7, 130.2, 129, 127.8, 127, 126.8, 126.7, 122.9, 113.9, 106.6, 55.3

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

50

化合物No. 24 (融点: 99). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.9, 150.1, 149.4, 147.4, 144.7, 133, 132.6, 129.3, 128.1, 126.9, 125.9, 123.4, 104.6, 40.5

<sup>1</sup>H: 8.61 (1H, s), 8.50 (1H, d, J = 4.9 Hz), 8.16 (1H, d, J = 2.6 Hz), 7.65 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.36 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.29 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.22 (1H, d d, J = 4.9, 7.9 Hz), 7.17 (2H, d, J = 7.8 Hz), 6.59 (1H, d, J = 2.6 Hz), 3.58 (3H, s)

化合物No. 25 (融点: 137). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.6, 150.7, 144.5, 140.1, 139.5, 133, 131, 129.1, 129, 127.7, 126.8, 126.6, 126.5, 126.1, 125.8, 105.1, 40

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

10

化合物No. 26 (融点: 123 ~ 125). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.9, 146.5, 141.4, 130.3, 129.3, 129, 128.9, 128.3, 127.3, 126.9, 124.1, 120, 38.9

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

20

化合物No. 27 (融点: 121). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.9, 142.8, 140.3, 137.8, 133, 131.3, 130.4, 128.7, 128.2, 126.2, 126, 113.7, 40.2

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

化合物No. 28 (融点: 127). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159, 150.1, 142.9, 141.2, 137.6, 130.3, 128.1, 126.3, 125.9, 125.5, 113.9, 112.4, 55.2, 40.2

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

30

化合物No. 29 (融点: 127 ~ 129). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.2 (d, J = 246.0 Hz), 150.0, 142.9, 140.5, 137.8, 130.4, 129.0 (d, J = 3.3 Hz), 128.2, 126.7 (d, J = 8.0 Hz), 126.0, 111.5 (d, J = 21.5 Hz), 113.2, 40.2

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

40

化合物No. 30 (融点: 126). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

<sup>1</sup>H: 8.02 (1H, d t, J = 2.0, 7.6 Hz), 7.65 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, m), 7.34 (1H, m), 7.31 (1H, d d, J = 1.3, 3.6 Hz), 7.19 (2H, m), 7.16 (1H, m), 7.15

50

(1H, m, J = 1.6, 7.4), 7.03 (1H, m, J = 1.5, 7.8, 11.4 Hz), 3.53 (3H, s)

化合物No. 31 (融点: 128 ~ 129). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.8, 150, 142.9, 141.2, 137.7, 134.2, 130.4, 129.6, 128.2, 126, 117.4, 113.8, 113.6, 109.9, 55.2, 40.2

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

化合物No. 32 (融点: 144 ~ 146). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

化合物No. 33 (融点: 112). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

化合物No. 34 (融点: 89 ~ 90). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

化合物No. 35 (融点: 166 ~ 169). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 149.8, 142.9, 139.7, 139.7, 138.7, 137.9, 132.1, 129.9, 129, 127.7, 127.4, 126.9, 126.5, 126.2, 125.2, 114.5, 39.6

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

化合物No. 36 (融点: オイル). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 160.8 (d, J = 245 Hz), 158.6, 149.9, 140.2, 139.3 (d, J = 3 Hz), 137.6, 128.6 (d, J = 9 Hz), 126.0, 125.6, 116.7 (d, J = 23.5 Hz), 114.1, 113.0, 55.1, 39.5

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

化合物No. 37 (融点: 162 ~ 164). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.7, 142, 137.6, 137.4, 132.8, 131.7, 128.9, 128.6, 127.5, 127.1, 125.8, 125.1, 123, 113.1, 45.8, 26.6, 23.9

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

10

20

30

40

50

化合物No. 38 (融点: 232 ~ 233). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 158.3, 147.9, 141.9, 137.2, 135.4, 129.9, 128.2, 126.9, 126.3, 118.8, 115.8, 114, 39.9

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

化合物No. 39 (融点: 97 ~ 98). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

10

化合物No. 40 (融点: 139 ~ 141). NMR 溶媒: DMSO

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

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

20

化合物No. 41 (融点: 152). NMR 溶媒: DMSO

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

<sup>1</sup>H: 8.21 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.97 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.71 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.55 (1H, m, J = 7.6 Hz), 7.25 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.0 (2H, d, J = 8.2 Hz), 6.83 (1H, t, J = 7.3 Hz), 3.92 (4H, m), 3.33 (4H, m)

30

化合物No. 42 (融点: 79 ~ 80). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 148.6, 144.7, 140, 132.5, 129.4, 129.1, 128.3, 125.9, 125.4, 119.6, 113.1, 47.6, 45, 41.9, 37.1, 31.6

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

化合物No. 43 (融点: 105). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 161.7 (d, J = 250.0 Hz), 149.8, 140.5, 138.8 (d, J = 3.6 Hz), 137.7, 133.1, 131.2, 128.8, 127.8 (d, J = 8.4 Hz), 126.3, 117.4 (d, J = 23.2 Hz), 113.6, 40.4

40

<sup>1</sup>H: 7.56 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.31 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.23 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.17 (2H, m), 7.12 (2H, m), 3.50 (3H, s)

化合物No. 44 (融点: 145). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

<sup>1</sup>H: 7.65 (2H, m), 7.65 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.24 (1H, m), 7.23 (1H, d, J = 1.

50

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

化合物No. 45 (融点: 93~96). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

10

化合物No. 46 (融点: 90~91). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 158.9 (d, J = 238.0 Hz), 154, 131.7, 130.2 (d, 10.0 Hz), 127.5, 114.2 (d, J = 9.5 Hz), 111.9 (d, J = 26.0 Hz), 106.3 (d, J = 27.5 Hz), 106.2, 66.6, 47.1

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

20

化合物No. 47 (融点: 112~113). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

化合物No. 48 (融点: 184). NMR 溶媒: DMSO

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

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

30

化合物No. 49 (融点: 89). NMR 溶媒: DMSO

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

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

40

化合物No. 50 (融点: 113~114). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 149.2, 144.7, 134.4, 132.6, 129.5, 128.6, 128.6, 126.8, 126.5, 126.3, 125.5, 119.6, 113.5, 48.6, 46.7, 45.5, 42.8, 28.8, 27.2

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

化合物No. 51 (融点: 188). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

50

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

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

化合物No. 52 (融点: 174). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 153.5, 152.6, 130.2, 129.1, 127.3, 113.8, 112.9, 105.1, 105, 65.9, 46.5

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

10

化合物No. 53 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

20

化合物No. 54 (融点: 218 ~ 220). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 161.8 (d, J = 251.0 Hz), 159, 146.3, 136.7 (d, J = 4.0 Hz), 136, 134.3, 127.9 (d, J = 9.0 Hz), 127, 117.2 (d, J = 23.0 Hz), 115.9, 115.6, 113.6, 40.1

<sup>1</sup>H: 8.89 (1H, m), 7.18 (2H, m), 7.09 (2H, m, J = 8.7 Hz), 7.05 (1H, m), 6.95 (2H, m, J = 8.6 Hz), 6.65 (2H, m, J = 8.7 Hz), 3.35 (3H, s)

化合物No. 55 (融点: 116). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.3, 145.3, 133.2, 129.3, 125.2, 119.8, 113.5, 106.6, 64.6, 46.1, 43.6, 35.3

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

30

化合物No. 56 (融点: 134). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 157.1, 154.5, 146.6, 146.5, 131.6, 131.3, 130.3, 129.8, 125.7, 123.4, 121.9, 120.2, 119.7, 118.7, 114

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

40

化合物No. 57 (融点: 156 ~ 157). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

化合物No. 58 (融点: 101 ~ 102). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.4, 145.2, 133.2, 129.1, 125, 119.7, 113.5, 57.1, 32.4, 30.4, 29.7, 2

50

5.5, 25.3

<sup>1</sup>H: 8.09 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.60 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.45 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.26 (1H, br), 3.18 (3H, s), 2.0 (2H, d br, J = 1.0 Hz), 1.87 (2H, br), 1.67 (1H, br), 1.63 (2H, m, J = 3.0, 12.3 Hz), 1.43 (2H, m), 1.16 (1H, m)

化合物No. 59 (融点: 148 ~ 150). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

10

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

化合物No. 60 (融点: 142 ~ 143). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.5, 146.4, 136.1, 131.6, 130.3, 129.4, 125.7, 125.3, 120.2, 120, 114  
<sup>1</sup>H: 9.19 (1H, s), 8.35 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.15 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.70 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.69 (1H, m), 7.52 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.45 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.25 (1H, t, J = 7.4 Hz)

20

化合物No. 61 (融点: 109). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.2, 146.3, 136.9, 131.6, 130, 128.9, 128, 127.8, 125.5, 120, 113.9, 44.4

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

化合物No. 62 (融点: 195 ~ 197). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.5, 146.3, 134.7, 131.5, 130.4 (2 sig.), 129.4, 125.9, 121.2, 120.3, 113.9

30

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

化合物No. 63 (融点: 62). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150, 145, 142.2, 133.1, 132.8, 129.7, 129.5, 127.3, 125.3, 119.9, 113.3, 40.3

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

40

化合物No. 64 (融点: 84 ~ 85). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

化合物No. 65 (融点: 105 ~ 106). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

50

<sup>13</sup>C: 162.6, 161.2, 148.8, 147.3, 128.3, 122.3, 114.1, 66.6, 55.3, 46.9  
<sup>1</sup>H: 8.81 (1H, s), 8.06 (2H, d, J = 8.9 Hz), 6.98 (2H, d, J = 8.9 Hz), 3.98 (4H, br), 3.87 (3H, s), 3.83 (4H, m br)

化合物No. 66 (融点: 116). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.1, 161.5 (d, J = 248.0 Hz), 161, 149.1, 146.5, 139.5 (d, J = 3.5 Hz), 128.1 (d, J = 9.0 Hz), 128, 122.3, 116.3 (d, J = 22.5 Hz), 113.9, 55.3, 40.7  
<sup>1</sup>H: 8.74 (1H, s), 7.72 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.20 (2H, m, J = 5.0, 9.0 Hz), 7.09 (2H, t, J = 8.8 Hz), 6.89 (2H, d, J = 8.9 Hz), 3.83 (3H, s), 3.56 (3H, s)

10

化合物No. 67 (融点: 91). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 161.2, 148.8, 146.5, 143.3, 135.8, 129.5, 128.7, 128.3, 127.8, 127.7, 126.1, 40.5  
<sup>1</sup>H: 8.69 (1H, s), 7.69 (2H, m, J = 8.3 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.32 (1H, m), 7.31 (2H, m, J = , 8.3 Hz), 7.19 (2H, d, J = 8.0 Hz), 3.58 (3H, s)

化合物No. 68 (融点: 120 ~ 121). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 161.9, 148.5, 147.6, 136.2, 129, 128.2, 128.1, 66.6, 47.5, 46  
<sup>1</sup>H: 8.84 (1H, s), 8.06 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.44 (2H, d, J = 8.7 Hz), 3.98 (4H, br), 3.84 (4H, s br)

20

化合物No. 69 (融点: 127 ~ 128). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 161.6 (d, J = 248.5 Hz), 161.4, 148.8, 146.7, 139.3 (d, J = 3.3 Hz), 135.9, 128.8, 128.2, 128.1 (d, J = 8.5 Hz), 127.8, 116.3 (d, J = 23.0 Hz), 40.7  
<sup>1</sup>H: 8.76 (1H, s), 7.71 (2H, d, J = 7.0 Hz), 7.35 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.19 (2H, m), 7.09 (2H, t, J = 8.5 Hz), 3.56 (3H, s)

化合物No. 70 (融点: 91 ~ 92). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 161.8 (d d, J = 11.5, 251.0 Hz), 157.7 (d d, J = 12.5, 252.0 Hz), 150.1, 144.9, 132.7, 129.6, 129.3 (d d, J = 1.5, 10.0 Hz), 127.7 (d d, J = 5.0, 12.0 Hz), 125.4, 119.9, 113.5, 112.1 (d d, J = 4.0, 23.0 Hz), 105.1 (d d, J = 24.0, 26.5 Hz), 39.7  
<sup>1</sup>H: 8.10 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.01 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.63 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.30 (1H, m), 6.88 (1H, m), 6.84 (1H, m), 3.60 (3H, s)

30

化合物No. 71 (融点: 65 ~ 66). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.1, 145.3, 132.8, 129.4, 125.5, 119.8, 114.4, 82.5, 79.6, 62.2, 23  
<sup>1</sup>H: 8.23 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.7 Hz), 5.54 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.69 (6H, s)

40

化合物No. 72 (融点: 85). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 152, 142.2, 138.9, 130.1, 124.2, 122.8, 119.8, 115.2, 67.1, 47.2  
<sup>1</sup>H: 8.09 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.69 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.58 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.36 (1H, t, J = 7.5 Hz), 3.87 (4H, br), 3.80 (4H, br)

化合物No. 73 (融点: 80). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.8, 148.7, 147.4, 130.2, 129.6, 128.7, 126.7, 66.6, 47.3, 46.2  
<sup>1</sup>H: 8.85 (1H, s), 8.12 (2H, m), 7.47 (3H, m), 4.02 (4H, br), 3.84 (4H, m)

50



化合物No. 74 (融点: 114). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.4, 162.0 (d d, J = 15.0, 251.0 Hz), 158.0 (d d, J = 13.0, 252.0 Hz), 148.9, 146.7, 130.0, 129.6, 129.2 (d d, J = 2.0, 10.0 Hz), 128.6, 127.6 (m, J = 13.0 Hz), 126.5, 111.8 (d d, J = 4.0, 22.5 Hz), 104.8 (t, J = 25.0 Hz), 39.9  
<sup>1</sup>H: 8.86 (1H, s), 7.74 (2H, br), 7.38 (3H, m br), 7.28 (1H, m), 6.95 (1H, m), 6.92 (1H, m), 3.52 (3H, s)

化合物No. 75 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.5, 145.2, 133.2, 129.2, 125.1, 119.7, 113.6, 51.7, 50.4, 38.0, 35.7, 30.1, 29.0, 19.8, 13.8  
<sup>1</sup>H: 8.10 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.59 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.6 Hz), 3.67 (2H, br), 3.31 (3H, m br), 1.78 (2H, m), 1.45-1.30 (2H, m br), 1.0-0.9 (3H, m br)

10

化合物No. 76 (融点: 130). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.3, 150.1, 144.9, 135.3, 132.8, 129.2, 126.8, 125, 119.8, 115.8, 113.2, 66.7, 48.7, 40.5  
<sup>1</sup>H: 8.04 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.60 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.42 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.08 (2H, d, J = 7.7 Hz), 6.80 (2H, d, J = 8.7 Hz), 3.83 (4H, m), 3.63 (3H, s), 3.13 (4H, m)

20

化合物No. 77 (融点: 163~138). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 161.2, 150.1, 145.2, 145, 132.8, 129.3, 125.1, 119.8, 113.2, 104.4, 99.1, 55.4, 40.3  
<sup>1</sup>H: 8.05 (1H, d, J = 8.7 Hz), 8.02 (1H, d, J = 8.9 Hz), 7.61 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.44 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.34 (1H, t, J = 2.0 Hz), 6.31 (2H, d, J = 2.0 Hz), 3.70 (6H, s), 3.65 (3H, s)

化合物No. 78 (融点: 155~157). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 163.8 (d d, J = 12.0, 253.0 Hz), 160.8 (d d, J = 12.0, 258.0 Hz), 158.4 (d, J = 6.0 Hz), 148.4, 146.9, 131.5 (d d, J = 4.0, 10.0 Hz), 114.3 (d d, J = 4.0, 11.5 Hz), 111.8 (d d, J = 4.0, 21.5 Hz), 105.0 (t, J = 25.0 Hz), 66.6, 47.9, 45.9  
<sup>1</sup>H: 8.87 (1H, s), 8.12 (1H, m, J = 6.7, 8.5 Hz), 7.0 (1H, m), 6.95 (1H, m), 4.10 (4H, br), 3.83 (4H, s br)

30

化合物No. 79 (融点: 86). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 163.8 (d d, J = 12.0, 253.0 Hz), 160.8 (d d, J = 12.5, 259.0 Hz), 158.2 (d, J = 5.5 Hz), 148.5, 146.7, 139.7, 131.5 (d d, J = 4.0, 10.0 Hz), 129, 128.3, 126.1, 114.6 (d d, J = 4.0, 11.0 Hz), 111.7 (d d, J = 4.5, 21.0 Hz), 105.0 (t, J = 26.0 Hz), 47.7, 46.2, 42.8, 38, 31.9  
<sup>1</sup>H: 8.83 (1H, s), 8.13 (1H, m, J = 6.8, 8.3 Hz), 7.31 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.23 (1H, m, J = 7.3 Hz), 7.17 (2H, d, J = 7.8 Hz), 7.0 (1H, m), 6.96 (1H, m), 4.62 (2H, m br), 3.02 (2H, br), 2.61 (2H, d, J = 6.9 Hz), 1.87 (1H, m), 1.81 (2H, d br, J = 14.0 Hz), 1.43 (2H, m, J = 4.0, 13.0 Hz)

40

化合物No. 80 (融点: 91). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 163.7 (d d, J = 12, 253.5 Hz), 162.1 (d d, J = 11.0, 250.5 Hz), 160.7 (d d, J = 12.0, 260.0 Hz), 158.2, 157.9 (d d, J = 12.5, 251.5 Hz), 148.8, 146.2, 131.2 (d d, J = 4.0, 10.0 Hz), 129.0 (d br, J = 10.5 Hz), 126.4 (d d, J = 4.5, 13

50

.0 Hz), 114.2 (d d, J = 4.0, 12.0 Hz), 111.8 (d d, J = 3.0, 22.5 Hz), 111.6 (d d, J = 4.0, 21.5 Hz), 104.9 (t, J = 25.3 Hz, 2 Carbons), 40.0

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

化合物No. 81 (融点: 99~100). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

<sup>1</sup>H: 8.03 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.59 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.41 (1H, t, 7.6 Hz), 7.03 (2H, br), 6.59 (2H, d br, J = 8.0 Hz), 3.62 (3H, s), 2.92 (6H, s)

10

化合物No. 82 (融点: 179~182 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 148.6, 144.7, 132.5, 129.6, 125.5, 119.7, 113.4, 61.7, 49, 46, 43.5, 25.8, 22.5, 21.6

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

20

化合物No. 83 (融点: 259~261 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 148.8, 144.8, 132.5, 129.8, 125.7, 119.7, 113.6, 51.9, 43.3, 42

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

化合物No. 84 (融点: 92). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 155.9, 150.4, 148.7, 145.2, 138.4, 132.6, 129.5, 125.3, 121.8, 119.9, 119.5, 113.5, 37.8

30

<sup>1</sup>H: 8.32 (1H, d d, J = 1.6, 5.0 Hz), 8.12 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.02 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.69 (1H, d t, J = 1.9, 7.9 Hz), 7.63 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.18 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.15 (1H, d d, J = 5.0, 7.5 Hz), 3.74 (3H, s)

化合物No. 85 (融点: 66). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.2, 146.2, 141.8, 131.6, 129.9, 128.4 (2 sig.), 125.9, 125.4, 120, 113.9, 40.3, 35.4, 29.1, 28.5

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

40

化合物No. 86 (融点: 60). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.2, 146.3, 131.6, 129.9, 125.3, 119.9, 114, 40.5, 31.9, 29.6, 29.6, 29.5, 29.5, 29.3, 29.2, 26.8, 22.7, 14.1

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

化合物No. 87 (融点: 73). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

50

<sup>13</sup>C: 148.4, 146.3, 131.7, 129.8, 125.3, 119.9, 114, 49.8, 33, 25.3, 24.7  
<sup>1</sup>H: 8.28 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.09 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.47 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.21 (1H, d, J = 7.5 Hz), 3.95 (1H, m), 2.11 (2H, m), 1.83 (2H, m), 1.69 (1H, m), 1.43 (4H, m), 1.29 (1H, m)

化合物No. 88 (融点: 186 ~ 188). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.5, 146.4, 140.2, 138.2, 135.3, 131.6, 130.3, 128.8, 128, 127.4, 126.9, 125.8, 120.3, 120.2, 114  
<sup>1</sup>H: 9.24 (1H, s), 8.37 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.16 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.78 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.69 (1H, m), 7.68 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.62 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.53 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.47 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.37 (1H, t, J = 7.6 Hz)

10

化合物No. 89 (融点: 167 (dec)). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 148.1, 146.8, 129.3, 129, 128.8, 125.9, 120.9, 66.6, 48.5, 45.8  
<sup>1</sup>H: 8.38 (1H, s), 7.88 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.47 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.39 (1H, m, J = 7.5 Hz), 4.04 (2H, m br), 3.84 (6H, m)

化合物No. 90 (融点: 230 ~ 231 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 148.6, 144.7, 132.5, 129.6, 125.6, 119.7, 113.4, 63.3, 61.9, 48.3, 45.6, 43.6, 25.8  
<sup>1</sup>H: 11.53 (1H, s br), 8.20 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.93 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.71 (1H, m, J = 7.5 Hz), 7.55 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.44 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 3.98 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.90 (2H, t, J = 12.0 Hz), 3.54 (1H, m), 3.45 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.22 (2H, br), 3.11 (2H, m), 2.28 (2H, br), 1.90 (2H, m, J = 4.0, 12.3 Hz)

20

化合物No. 91 (融点: 143). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 152.5, 148.7, 145.1, 144.7, 137.5, 132.6, 129.6, 128.4, 127.8, 127.6, 125.5, 119.7, 118, 115.4, 113.4, 69.4, 49.8, 47.5, 44.9  
<sup>1</sup>H: 8.21 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.96 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.71 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.55 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.43 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.31 (1H, m, J = 7.1 Hz), 6.94 (4H, m), 5.03 (2H, s), 3.90 (4H, m), 3.19 (4H, br)

30

化合物No. 92 (融点: 218 ~ 220 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 148.7, 144.8, 132.5, 129.6, 125.5, 119.7, 113.4, 60.2, 50.5, 45.7, 43.2, 27.9, 22.7  
<sup>1</sup>H: 11.24 (1H, s), 8.20 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.93 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.70 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.54 (1H, t, J = 7.4 Hz), 4.40 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.49 (2H, br), 3.45 (1H, m), 3.22 (2H, m br), 3.08 (2H, br), 2.20 (2H, br), 1.96 (4H, m), 1.89 (2H, m)

40

化合物No. 93 (融点: 254 ~ 256 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 148.8, 144.8, 132.5, 131.5, 129.8, 129.6, 129.4, 128.8, 125.7, 119.7, 113.6, 58.6, 50.1, 43.6, 42.1  
<sup>1</sup>H: 11.97 (1H, s br), 8.21 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.95 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.67 (2H, m), 7.56 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.47 (3H, m), 7.33 (1H, t, J = 7.6 Hz), 4.47 (2H, d br, J = 15.0 Hz), 4.39 (2H, s), 3.79 (2H, m), 3.43 (2H, m), 3.28 (2H, m)

50

化合物No. 94 (融点: 109~111). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.4, 145.4, 144.7, 133.2, 129.3, 128.6, 126.8, 126.6, 125.2, 119.8, 113.5, 48.8, 46.1, 42.6, 33.2

<sup>1</sup>H: 8.12 (1H, m, J = 8.3 Hz), 8.02 (1H, m, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, m, J = 1.0, 7.1 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1 Hz), 7.35 (2H, m, J = 7.7 Hz), 7.27 (2H, m), 7.25 (1H, m), 4.70 (2H, d br, J = 13.5 Hz), 3.29 (2H, br), 2.89 (1H, m), 2.01 (4H, m)

化合物No. 95 (融点: 157). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

10

<sup>13</sup>C: 150.2, 145.9, 141.5, 136.4, 133.2, 131.8, 131.1, 131, 129.9, 128.7, 118.6, 118, 114.4, 113.2, 58.6, 57.2, 32.6, 30.8, 29.7, 25.5, 25.3

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

化合物No. 96 (融点: 146~147). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

20

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

化合物No. 97 (融点: 158). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.9, 146.3, 132.4, 132.3, 122.4, 118.3, 114.9, 58.8, 57.1, 32.6, 30.9, 29.5, 25.5, 25.3

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

30

化合物No. 98 (融点: 93~94). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 148.8, 145.1, 133, 129.2, 125.2, 119.7, 114.3, 50.3, 48.5, 26.6, 24

<sup>1</sup>H: 8.18 (1H, m, J = 8.4 Hz), 8.09 (1H, m, J = 8.3 Hz), 7.60 (1H, m, J = 1.0, 7.0 Hz), 7.46 (1H, m, J = 1.0, 7.0 Hz), 4.08 (2H, m), 3.81 (2H, m), 2.04 (4H, m)

化合物No. 99 (融点: 139~141). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

40

<sup>13</sup>C: 154.7, 149.4, 145.4, 133.2, 130.7, 130.1, 129.3, 125.2, 119.8, 116.2, 113.5, 70.9, 44.4, 41.9, 30.4, 20.5

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

化合物No. 100 (融点: 80). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.3, 145.3, 142.1, 133.2, 129.2, 128.4, 128.3, 125.8, 125.1, 119.8, 113.4, 48.4, 45.8, 38, 35.4, 32.8, 32.2

<sup>1</sup>H: 8.10 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.61 (1H, t, J = 8.0

50

Hz), 7.46 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.31 (2H, t, J = 7.1 Hz), 7.21 (1H, m), 7.20 (2H, d, J = 7.9 Hz), 4.53 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.15 (2H, br), 2.69 (2H, m, J = 7.5 Hz), 1.93 (2H, br), 1.49 (2H, br), 1.67 (3H, m)

化合物No. 101 (融点: 134). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.7, 150.5, 142.6, 137, 132.8, 129.3, 128.7, 127.7, 125.2, 121.1, 116.9, 112.9, 49.5, 46.5

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

10

化合物No. 102 (融点: 122). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.6, 142.4, 137.1, 137, 132.8, 129.1, 128.7, 128.4, 127.6, 127.4, 125.1, 113, 62.7, 52.5, 46.5

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

化合物No. 103 (融点: 154). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.3, 142.1, 136.9, 133, 128.7, 127.5, 125.1, 113.2, 57.5, 31.3, 30, 25.4, 25.2

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

20

化合物No. 104 (融点: 83). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150, 145.2, 133.3, 129, 125, 119.7, 113.5, 58.9, 40, 31.2, 25.7, 25.3, 15.1

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

30

化合物No. 105 (融点: 204). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.2, 145.3, 133, 129.3, 125.2, 119.7, 113.4, 53.5, 53.1, 48, 45.4, 33.5, 31.7 (2 sig.), 23.3

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

40

化合物No. 106 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

50

化合物No. 107 (融点: 232~233). NMR 溶媒: DMSO

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

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

化合物No. 108 (融点: 183). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

10

化合物No. 109 (融点: 209~210). NMR 溶媒: DMSO

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

<sup>1</sup>H: 8.28 (1H, d, J = 8.6 Hz), 8.26 (1H, s br), 8.22 (1H, s br), 8.17 (1H, br), 7.94 (2H, m), 7.91 (1H, m), 7.61 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.53 (1H, s br), 4.03 (1H, br), 3.09 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.80 (2H, m), 1.60 (1H, m), 1.36 (2H, m), 1.67 (2H, m), 1.16 (1H, m)

20

化合物No. 110 (融点: 66~67). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

30

化合物No. 111 (融点: 83). NMR 溶媒: DMSO

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

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

化合物No. 112 (融点: 203). NMR 溶媒: DMSO

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

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

40

化合物No. 113 (融点: 231~233 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

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

<sup>1</sup>H: 7.95 (1H, s br), 7.84 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.74 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.72 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.60 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.41 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.35 (

50

1H, s br), 7.35 (2H, m), 7.31 (1H, t, J = 7.1 Hz), 3.43 (3H, s)

化合物No. 114 (融点: 135 ~ 136). NMR 溶媒: DMSO

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

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

10

化合物No. 115 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.5, 145.2, 138.1, 133.2, 129.1, 128.7, 128.6, 126.6, 125.1, 119.7, 113.8, 53.1 (br), 38.2 (very broad), 34.3 (br)

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

化合物No. 116 (融点: 147). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 181.1, 166.4, 152.1, 149.4, 148.6, 145.4, 134.7, 133.1, 129.5, 125.3, 123.7, 122.9, 119.9, 113.5, 46.9, 44.8, 34, 29.2

20

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

化合物No. 117 (融点: 138 ~ 139). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

30

化合物No. 118 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

化合物No. 119 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

40

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

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

化合物No. 120 (融点: 70 ~ 71). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 156.9, 149.4, 145.4, 133.2, 129.7, 129.3, 125.2, 121.3, 119.8, 116.1, 113.5, 70.6, 44.4, 42, 30.4

<sup>1</sup>H: 8.11 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.8 Hz)

50

z), 7.47 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.33 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.0 (1H, t, J = 7.4 Hz), 6.97 (2H, d, J = 8.3 Hz), 4.72 (1H, m), 4.01 (4H, s br), 2.16 (2H, m), 2.10 (2H, m)

化合物No. 121 (融点: 115). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.1 (d, J = 245.0 Hz), 149.3, 145.3, 133.1, 133.1, 130.6 (d, J = 8.0 Hz), 129.4, 125.2, 119.8, 115.2 (d, J = 21.0 Hz), 113.5, 61.9, 52.7, 48.1, 45.2

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

10

化合物No. 122 (融点: 188 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 148.6, 144.7, 132.5, 129.5, 125.4, 119.6, 113.3, 59.7, 52.9, 46.5, 45.6, 44.1, 42.1, 27.9

<sup>1</sup>H: 10.72 (1H, br), 8.19 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.91 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.70 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.53 (1H, t, J = 7.8 Hz), 4.28 (2H, s br), 3.21 (4H, m br), 2.96 (4H, m br), 2.68 (6H, m), 1.90 (2H, m br), 1.57 (2H, m br)

化合物No. 123 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

20

化合物No. 124 (融点: 258 ~ 259 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

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

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

30

化合物No. 125 (融点: 232 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

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

<sup>1</sup>H: 11.97 (1H, s), 9.12 (1H, s), 8.0 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.66 (2H, m), 7.45 (5H, m), 7.40 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.33 (1H, t, J = 7.2 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.6 Hz), 5.17 (2H, s), 4.55 (2H, m), 4.37 (2H, s), 3.70 (2H, m, J = 12.0 Hz), 3.41 (2H, m), 3.24 (2H, m)

40

化合物No. 126 (融点: 135). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 147.3, 146.3, 131.6, 129.7, 125.2, 119.9, 114.1, 52.8, 41.6, 36.1, 29.4

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

化合物No. 127 (融点: 101). NMR 溶媒: DMSO

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

<sup>1</sup>H: 8.18 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.91 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.69 (1H, t, J = 7.8

50



Hz), 7.56 (1H, t, J = 7.6 Hz), 3.71 (4H, m), 2.63 (4H, s br), 2.30 (1H, m), 1.76 (2H, m), 1.73 (2H, m), 1.56 (1H, d, J = 12.4 Hz), 1.20 (4H, m), 1.07 (1H, m)

化合物No. 128 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

<sup>1</sup>H: 8.10 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 7.46 (1H, d d d, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 7.40-7.28 (5H, m), 4.62 (2H, s), 4.06 (2H, m), 3.81 (3H, m), 2.08 (2H, m), 1.94 (2H, br)

10

化合物No. 129 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.5, 145.2, 142.3, 133.2, 129.2, 128.4, 128.3, 125.7, 125.1, 119.7, 113.6, 51.8, 50.6, 38.0, 35.8, 31.1, 28.0, 26.8, 26.2

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

化合物No. 130 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

20

化合物No. 131 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.9, 145.2, 133.9, 133.2, 130.9, 129.4, 128.9, 126.8, 126.1, 125.3 (2 signal Hs), 123.1, 119.9, 113.6, 53.1, 51.7, 37.5

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

30

化合物No. 132 (融点: 129 ~ 130 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 161.3, 154.6, 150.6, 148.5, 147.6, 130, 129.6, 127.4, 120.8, 115.9, 115.5, 71.1, 51.8, 44.7, 43, 41.9, 30.3, 20.1

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

40

化合物No. 133 (融点: 140). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 161.7, 152.1, 148.6, 147.7, 138, 129, 128.3, 127.4, 127.1, 119.5, 114.7, 65.9, 62, 52.4, 47.4, 46.2

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

化合物No. 134 (融点: オイル). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 163.1 (d d, J = 13.5, 251.5 Hz), 160.1 (d d, J = 13.0, 257.5 Hz), 157.1 (d, J = 6 Hz), 154.6, 148.2, 147.4, 131.6 (d d, J = 4.5, 10.5 Hz), 130.0, 129.6

50

, 116.0, 114.6 (d d, J = 4.0, 11.5 Hz), 112.3 (d d, J = 4.0, 22.0 Hz), 105.3 (t, J = 25.5 Hz), 71.1, 43.1 (br), 30.3, 20.1

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

化合物No. 135 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.4, 145.3, 141.8, 133.1, 129.3, 128.4, 128.3, 125.8, 125.1, 119.8, 113.4, 73.0, 67.3, 45.0, 42.4, 32.3, 31.5, 30.9

10

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

化合物No. 136 (融点: 197 ~ 198). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.5, 148.7, 144.7, 143.7, 132.6, 129.6, 125.5, 119.7, 118.6, 115.6, 113.4, 50.3, 47.4, 45.2

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

20

化合物No. 137 (融点: 100 ~ 101). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 154.4, 150.8, 149.4, 145.4, 133.1, 129.3, 125.2, 119.8, 117.8, 114.8, 113.5, 72, 55.7, 44.5, 41.9, 30.5

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

化合物No. 138 (融点: 187 ~ 188). NMR 溶媒: DMSO

30

<sup>13</sup>C: 161.5, 151.9, 150.9, 149.8, 147.4, 129, 127.4, 120, 119.3, 115.7, 115, 48.2, 47.5, 37.8

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

化合物No. 139 (融点: 161 ~ 162). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 161.7, 152, 148.6, 147.7, 127.4, 119.5, 114.7, 65.9, 54.4, 47.2, 46.3, 45.7

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

40

化合物No. 140 (融点: 167 ~ 168). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 161.8, 161, 156.4, 149.8, 147.2, 134.2, 128.8, 126.9, 120.3, 118.7, 118.4, 106.3, 39.3, 38.6

<sup>1</sup>H: 8.84 (1H, s), 8.19 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.64 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.08 (2H, d, J = 9.0 Hz), 3.41 (3H, s), 3.23 (3H, s)

化合物No. 141 (融点: 144 ~ 145). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

50

<sup>13</sup>C: 162, 160.9, 156.6, 148.6, 147.6, 134.2, 128.9, 126.5, 120.3, 118.7, 118.4, 106.4, 66.6, 46.6

<sup>1</sup>H: 8.85 (1H, s), 8.17 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.64 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.08 (2H, d, J = 8.9 Hz), 4.0 (8H, s br)

化合物No. 142 (融点: 202 ~ 203). NMR 溶媒: DMSO

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

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

10

化合物No. 143 (融点: 108 ~ 109). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

20

化合物No. 144 (融点: 67 ~ 68). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

化合物No. 145 (融点: 179 ~ 180 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

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

30

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

化合物No. 146 (融点: 192 ~ 193). NMR 溶媒: DMSO

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

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

40

化合物No. 147 (融点: 220 ~ 221). NMR 溶媒: DMSO

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

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

化合物No. 148 (融点: 187 ~ 188). NMR 溶媒: DMSO

50

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

<sup>1</sup>H: 9.16 (1H, s), 8.12 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.98 (1H, s br), 7.94 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.36 (1H, s br), 7.25 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.21 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.5 Hz), 6.98 (2H, d, J = 8.2 Hz), 6.82 (1H, t, J = 7.5 Hz), 3.90 (4H, m), 3.29 (4H, m)

化合物No. 149 (融点: 191 ~ 192). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.1, 160.3, 158.6, 157.4, 148.7, 147.4, 143.2, 129.8, 129.6, 129.3, 128.1, 127.3, 126.1, 125.4, 119.2, 118.2, 39.9

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

10

化合物No. 150 (融点: 91 ~ 92). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.3 (d, J = 246.5 Hz), 151.8, 141.5, 137, 135.2, 129.1, 129.0 (d, J = 3.3 Hz), 128.2, 127.5, 126.8 (d, J = 8.0 Hz), 115.6 (d, J = 21.5 Hz), 112.8, 54.1, 36.5

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

20

化合物No. 151 (融点: 143 ~ 144). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167, 160.9, 158.6, 157.3, 149.7, 147.7, 136.2, 129.6, 129.6, 128.5, 128.2, 127.5, 127.4, 125.4, 119.2, 117.9, 53.3, 36.3

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

30

化合物No. 152 (融点: 95 ~ 96). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.5, 145.2, 138.7, 133.2, 129.2, 128.4, 127.5, 127.5, 125.1, 119.8, 113.5, 76.1, 70.1, 56.3, 32.6, 31, 27.5

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

化合物No. 153 (融点: 75). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 160.8, 160, 149.4, 145.4, 133.2, 129.9, 129.3, 125.2, 119.8, 113.5, 106.5, 106.4, 100.9, 71.8, 55.3, 48.1, 45.4, 36.1, 29

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

40

化合物No. 154 (融点: 129 ~ 130). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 148.6, 144.7, 132.5, 129.6, 125.5, 119.7, 113.3, 66.4, 51.4, 47.7, 44.9, 29.8, 23.7

50

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

化合物No. 155 (融点: 108). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 158.9, 150.7, 148.4, 147.4, 132.4, 129.3, 127.9, 127.8, 127.7, 120.8, 116.7, 49.4, 46.4

<sup>1</sup>H: 8.83 (1H, s), 7.79 (1H d d, J = 1.2, 3.7 Hz), 7.44 (1H, d d, J = 1.2, 5.1 Hz), 7.33 (2H, d d, J = 7.3, 8.8 Hz), 7.15 (1H, d d, J = 3.7, 5.1 Hz), 6.98 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 6.95 (1H, m, J = 7.3 Hz), 4.11 (4H, br), 3.34 (4H, m, J = 5.2 Hz) 10

化合物No. 156 (融点: 66~67). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.9, 145.2, 137.8, 133.2, 129.2, 128.4, 127.7, 127.5, 125.1, 119.7, 113.6, 73.2, 68.2, 51.5, 51, 39.7, 37.1

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

化合物No. 157 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 154.1, 152.3, 150.9, 150.8, 145.2, 133.2, 129.3, 125.2, 119.8, 115.3, 114.6, 113.7, 66.9, 55.7, 50.9, 40, 37.3

<sup>1</sup>H: 8.10 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.03 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.3 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.3 Hz), 6.81 (4H, m br), 4.33 (2H, t br, J = 5.2 Hz), 4.10 (2H, br), 3.76 (3H, s), 3.55-3.42 (3H, m br) 20

化合物No. 158 (融点: 257~259 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.8, 148.2 (2 sig.), 132, 131.5, 129.6, 129.4, 128.8 (2 sig.), 128.3, 127.7, 58.6, 49.9, 42.6

<sup>1</sup>H: 11.94 (1H, s br), 9.13 (1H, s), 7.73 (2H, d, J = 4.0 Hz), 7.65 (2H, m), 7.46 (3H, m), 7.20 (1H, t, J = 4.2 Hz), 4.47 (2H, br), 4.37 (2H, s), 3.70 (2H, m, J = 12.5 Hz), 3.40 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.22 (2H, m) 30

化合物No. 159 (融点: 143). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.4, 145.3, 133.1, 129.3, 125.2, 119.8, 113.5, 66.4, 44.9, 42.4, 34

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

化合物No. 160 (融点: 78~80). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 163.6, 149.2, 146.1, 143.3, 136.8, 129.5, 128.7, 128.3, 127.4, 126.5, 125.8, 40.3, 34.4

<sup>1</sup>H: 8.52 (1H, s), 7.33 (3H, m), 7.21 (2H, m), 7.20 (1H, m), 7.11 (2H, d br, J = 8.0 Hz), 7.0 (2H, d br, J = 7.0 Hz), 3.86 (2H, s), 3.53 (3H, s) 40

化合物No. 161 (融点: 89). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

<sup>1</sup>H: 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (2H, m, J = 8.3 Hz), 7.52 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, m, J = 7.9 Hz), 7.30 (1H, m, J = 7.3 Hz), 5.13 (2H, s), 3.88 (2H, 50

s), 1.62 (6H, s)

化合物No. 162 (融点: 119 ~ 121). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 145.7, 144.1, 133.7, 129.3, 124.2, 120.8, 117.5, 82.4, 79.5, 62.4, 22.9

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

化合物No. 163 (融点: 231 ~ 232). NMR 溶媒: DMSO

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

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

10

化合物No. 164 (融点: 102). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

<sup>1</sup>H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.62 (1H, m, J = 1.0, 7.2, 8.2 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 7.44 (2H, d, J = 7.0 Hz), 7.40 (2H, m, J = 7.4 Hz), 7.34 (1H, m, J = 7.1 Hz), 6.93 (4H, m), 5.04 (2H, s), 4.58 (1H, m), 3.99 (4H, br), 2.10 (4H, m br)

20

化合物No. 165 (融点: 131). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 153.8, 152.9, 149.4, 145.3, 133.1, 129.3, 125.1, 119.8, 115.3, 114.6, 113.4, 72.5, 55.7, 48.1, 45.5, 36.2, 29.1

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

30

化合物No. 166 (融点: 87). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 160.9, 158.1, 149.4, 145.4, 133.1, 130.1, 129.4, 125.2, 119.8, 113.5, 110.8, 106.6, 102.6, 70.6, 55.3, 44.5, 41.9, 30.4

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

化合物No. 167 (融点: 162 (dec.)). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: NO DATA

<sup>1</sup>H: 8.15 (2H, m), 7.69 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 7.55 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 5.09 (2H, s br), 4.46 (2H, s br), 3.45 (2H, t, J = 7.1 Hz)

40

化合物No. 168 (融点: 72). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 153.9, 150.6, 149.4, 145.3, 133.1, 129.3, 125.2, 119.8, 117.8, 115.4, 113.5, 71.9, 68.2, 44.5, 41.8, 31.4, 30.5, 19.2, 13.9

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

50

化合物No. 169 (融点: 90). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151, 145.1, 132.9, 129.6, 125.4, 119.9, 113.5, 62.2, 36.4

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

化合物No. 170 (融点: 51). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 148.4, 145.2, 132.9, 129.6, 125.6, 119.9, 114.1, 51.8, 51, 31.7, 29.2

<sup>1</sup>H: 8.14 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.49 (1H, t, J = 7.4 Hz), 5.0 (2H, s br), 4.28 (2H, s br), 3.19 (2H, t, J = 6.3 Hz) 10

化合物No. 171 (融点: 81). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

化合物No. 172 (融点: 37~38). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.5, 145.1, 133.2, 129.1, 125, 119.7, 113.5, 50.4, 49, 29.1, 27.4, 27.3, 26.6 20

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

化合物No. 173 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.2, 145.1, 133.3, 129, 124.9, 119.7, 113.1, 49, 30.1, 21.4, 13.8

<sup>1</sup>H: 8.10 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.92 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.59 (1H, m, J = 7.9 Hz), 7.45 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.78 (2H, m), 1.94 (1H, m), 1.87 (2H, m), 1.69 (2H, d br, J = 13.5 Hz), 1.61 (1H, m), 1.45 (6H, d, J = 7.1 Hz) 30

化合物No. 174 (融点: 193). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

化合物No. 175 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.1, 149.2, 145.4, 133.3, 129.1, 125, 125, 119.8, 113.5, 113.4, 54.4, 52.6, 42.3, 39.2, 31.6, 27.4, 18.8, 18 40

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

化合物No. 176 (融点: 48). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 173.9, 149.4, 145.3, 133.1, 129.4, 125.2, 119.8, 113.5, 60.8, 47.4, 44.9, 40.7, 28, 14.2 50

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

化合物No. 177 (融点: 75). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 155.3, 149.5, 145.3, 133.1, 129.6, 125.4, 119.9, 113.6, 61.9, 47.8, 45.1, 43.5, 14.6

<sup>1</sup>H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, m, J = 8.2 Hz), 7.48 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.20 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.92 (4H, s br), 3.71 (4H, m), 1.30 (3H, t, J = 7.2 Hz)

10

化合物No. 178 (融点: 143). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

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

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

化合物No. 179 (融点: 197 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

20

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

<sup>1</sup>H: 8.19 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.91 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.70 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.53 (1H, m, J = 7.7 Hz), 7.38 (1H, s br), 6.90 (1H, s br), 4.23 (2H, s br), 3.24 (2H, s br), 2.47 (1H, m), 1.85 (2H, s br), 1.69 (2H, m, J = 4.2, 12.0 Hz)

化合物No. 180 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 158.2, 148.8, 146.4, 143.2, 132.5, 129.5, 127.7, 127.7, 127.5, 127.3, 126.1, 40.5

30

<sup>1</sup>H: 8.63 (1H, s), 7.47 (1H, d br, J = 3.6 Hz), 7.39 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.33 (1H, m, J = 7.3 Hz), 7.31 (1H, d d, J = 1.2, 5.0 Hz), 7.19 (2H, m, J = 8.3 Hz), 7.02 (1H, d d, J = 3.6, 5.0 Hz), 3.58 (3H, s)

化合物No. 181 (融点: 79). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 158.8, 149.9, 147.3, 135.8, 132.5, 128.8, 128, 127.8, 127.6, 127.6, 54.4, 36.9, 36.2

<sup>1</sup>H: 8.86 (1H, s), 7.46-7.30 (6H, m), 7.73 (1H, br), 7.11 (1H, t, J = 4.0 Hz), 4.93 (2H, br), 3.24 (3H, br)

40

化合物No. 182 (融点: 87). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 164.3, 150.7, 148.6, 147.3, 137, 129.3, 128.8, 128.6, 126.8, 120.7, 116.7, 49.4, 46.5, 34.7

<sup>1</sup>H: 8.73 (1H, s), 7.37-7.21 (5H, m), 7.32 (2H, m), 6.95 (2H, m), 6.93 (1H, m), 4.11 (2H, s), 4.03 (4H, br), 3.27 (4H, m)

化合物No. 183 (融点: 144). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 163.8 (d d, J = 12.0, 253.0 Hz), 160.8 (d d, J = 14.0, 261.0 Hz), 158.5 (d, J = 6.0 Hz), 145.6, 144.7, 131.4 (d d, J = 4.2, 10.0 Hz), 114.4 (d d, J = 4.0, 11.5 Hz), 111.8 (d d, J = 4.0, 22.0 Hz), 105.0 (t, J = 25.0 Hz), 82.1, 79.2,

50



62.2, 22.8

<sup>1</sup>H: 8.96 (1H, s), 8.12 (1H, m, J = 7.0, 8.4 Hz), 7.0 (1H, m), 6.95 (1H, m), 5.53 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.62 (6H, s)

化合物No. 184 (融点: 126). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151, 142.5, 136.9, 133.7, 132.8, 131.7, 128.9, 128.7, 127.6, 127.3, 126.8, 126.3, 125.2, 112.9, 48.5, 44.6, 28.5

<sup>1</sup>H: 7.99 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.82 (2H, m, J = 8.2 Hz), 7.55 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.31 (1H, m, J = 7.4 Hz), 7.27-7.19 (3H, m), 7.12 (1H, m), 4.80 (2H, br), 3.88 (2H, t, J = 5.8 Hz), 3.05 (2H, t, J = 5.8 Hz)

10

化合物No. 185 (融点: 125). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 160.4, 148.6, 147.8, 134.7, 134.2, 132.4, 129, 128.6, 128.4, 128, 126.7, 126.3, 126.2, 47.3, 44.2, 28

<sup>1</sup>H: 9.14 (1H, s), 8.10 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.59 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.23 (4H, br), 4.88 (2H, br), 3.93 (2H, t, J = 5.8 Hz), 3.02 (2H, t, J = 5.8 Hz)

化合物No. 186 (融点: 136). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.3, 141.6, 136.2, 133.3, 131.3, 128.9, 126.4, 112.3, 81.1, 80.4, 61.9, 22.8

20

<sup>1</sup>H: 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m, J = 8.7 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37 (2H, m, J = 8.7 Hz), 5.13 (2H, s), 3.89 (2H, s), 1.62 (6H, s)

化合物No. 187 (融点: 176 ~ 177). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.1, 161.1, 158.7, 157.5, 147.1, 144.6, 129.8, 129.6, 128.5, 125.5, 119.5, 118, 81.4, 78.4, 61.4, 22.4

<sup>1</sup>H: 9.21 (1H, s), 8.11 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.98 (1H, s br), 7.93 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.36 (1H, s br), 7.20 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.4 Hz), 5.44 (2H, s), 3.85 (2H, s), 1.52 (6H, s)

30

化合物No. 188 (融点: 88). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.8, 161.1, 146, 145, 128.2, 122.4, 114.1, 82, 79.3, 62.1, 55.3, 22.8

<sup>1</sup>H: 8.90 (1H, s), 8.05 (2H, m, J = 9.0 Hz), 6.98 (2H, m, J = 9.0 Hz), 5.56 (2H, s), 3.87 (3H, s), 3.84 (2H, s), 1.62 (6H, s)

化合物No. 189 (融点: 132). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.1, 146.3, 144.7, 136.1, 129, 128.3, 128, 81.9, 79.3, 62.3, 22.8

<sup>1</sup>H: 8.93 (1H, s), 8.05 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.44 (2H, m, J = 8.6 Hz), 5.55 (2H, s), 3.85 (2H, s), 1.62 (6H, s)

40

化合物No. 190 (融点: 82). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.7, 150.1, 147.4, 136, 134.1, 133.1, 128.8, 128.7, 128.4, 128, 127.8, 127.1, 126.9, 126.7, 126.5, 123.7, 54.5, 36.7

<sup>1</sup>H: 8.96 (1H, s), 8.64 (1H, br), 8.15 (1H, br), 7.90 (3H, m), 7.53 (2H, m), 7.47-7.31 (5H, m), 5.0 (2H, br), 3.28 (3H, br)

化合物No. 191 (融点: 107). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 161.7, 150, 147.3, 136.3, 133.6, 130.6, 128.7, 128.6, 128.5, 127.6, 127.1, 126.1, 125.8, 125.4, 53.6, 37.3, 35.8

<sup>1</sup>H: 9.34 (1H, s), 8.87 (1H, br), 8.27 (1H, d, J = 7.2 Hz), 8.06 (1H, d, J = 8

50

.0 Hz), 8.0 (1H, br), 7.63 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.55 (1H, br), 7.46-7.26 (6H, m), 4.90 (2H, br), 3.16 (3H, s)

化合物No. 192 (融点: 121 ~ 123 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 161, 148.7, 146.9, 143.5, 133.4, 130.5, 129.6, 129.5, 128.4, 128.3, 127.2, 127, 126 (2 sig.), 125.8, 125.2, 40.1

<sup>1</sup>H: 9.21 (1H, s), 8.10 (1H, d d, J = J = 1.2, 7.2 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.93 (2H, m), 7.60-7.30 (8H, m), 3.52 (3H, s)

化合物No. 193 (融点: 142). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.2, 145.3, 133.1, 129.5, 125.3, 119.9, 113.5, 71.8, 53.3, 50.2, 18.6

<sup>1</sup>H: 8.11 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.62 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.1 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.1 Hz), 4.42 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.83 (2H, m), 3.03-2.90 (2H, m br), 1.26 (6H, s br)

化合物No. 194 (融点: 75). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150, 145.3, 133.1, 129.5, 125.4, 119.9, 113.6, 66.1, 52.8, 49.7, 17.5

<sup>1</sup>H: 8.11 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.01 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.63 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.8 Hz), 4.22 (2H, s br), 4.06-3.90 (2H, m br), 3.66 (2H, s br), 1.31 (6H, s br)

化合物No. 195 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.9, 145.3, 139.1, 133.3, 129.3, 128.7, 127.9, 127.3, 125.2, 119.8, 113.6, 55, 32.2, 16

<sup>1</sup>H: 8.12 (1H, m, J = 8.3 Hz), 8.07 (1H, m, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, m, J = 1.0, 7.0, 8.0 Hz), 7.48 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.3 Hz), 7.45 (2H, br), 7.41 (2H, m, J = 7.4 Hz), 7.34 (1H, m J = 8.0 Hz), 5.95 (1H, q, J = 6.8 Hz), 3.0 (3H, s), 1.78 (3H, d, J = 7.1 Hz)

化合物No. 196 (融点: 140). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.7, 150.5, 142.6, 141.7, 140.9, 137.1, 133.2, 129.3, 129.2, 128.7, 127.4, 127.2, 126.5, 124.1, 124, 121.1, 116.9, 113.2, 49.5, 46.5

<sup>1</sup>H: 8.07 (1H, t, J = 1.7 Hz), 7.99 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.80 (1H, d t, J = 1.5, 7.6 Hz), 7.67 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.56 (1H, d t, J = 1.5, 7.7 Hz), 7.49 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.47 (2H, m, J = 7.7 Hz), 7.37 (1H, m, J = 7.2 Hz), 7.32 (2H, m, J = 8.2 Hz), 6.96 (3H, m), 3.85 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.30 (4H, m, J = 5.0 Hz)

化合物No. 197 (融点: 113). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.5, 142.2, 141.3, 137, 133.1, 131.5, 128.8, 128.3 (2 sig.), 126.4, 125.8, 113.3, 47, 35.9, 35.8, 35.7, 32.1, 28.4

<sup>1</sup>H: 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m), 7.45 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37 (2H, m), 7.30 (2H, m, J = 7.5 Hz), 7.20 (1H, m, J = 7.6 Hz), 7.19 (2H, m, J = 8.0 Hz), 4.14 (2H, d br, J = 13.2 Hz), 3.04 (2H, d t, J = 2.3, 13.0 Hz), 2.63 (2H, t, J = 7.7 Hz), 1.83 (2H, d br, J = 13.5 Hz), 1.67 (2H, m), 1.58 (1H, m), 1.36 (2H, m), 1.25 (2H, d q, J = 4.2, 13.1 Hz)

化合物No. 198 (融点: 178). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.3, 140.3, 137.2, 133, 132.8, 131.2, 130.6, 127, 124.3, 113.9, 106.1, 64.6, 44.8, 35

10

20

30

40

50

<sup>1</sup>H: 7.90 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.61 (1H, d d, J = 2.1, 8.4 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.46 (1H, d, J = 8.4 Hz), 4.01 (4H, s), 3.73 (4H, m, J = 5.5 Hz), 1.82 (4H, m, J = 5.5 Hz)

化合物No. 199 (融点: 174). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.2, 145.8, 143, 141.7, 137.5, 130.3, 128, 126.2, 125.9, 123.5, 115.1, 111.7, 40.1

<sup>1</sup>H: 7.49 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.41 (2H, m, J = 8.4 Hz), 7.40 (2H, m, J = 7.5 Hz), 7.33 (1H, m, J = 7.4 Hz), 7.17 (2H, m, J = 8.4 Hz), 7.04 (1H, d, J = 1.2 Hz), 6.65 (2H, m, J = 8.4 Hz), 3.69 (2H, s), 3.51 (3H, s)

10

化合物No. 200 (融点: Hygroscopic). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.8, 149, 142.4, 137.5, 130, 129.9, 127.9, 126.2, 118, 115.4, 114.4, 11, 62.3, 54.4, 48.4, 39.7

<sup>1</sup>H: 12.25 (1H, s br), 9.94 (2H, s), 8.04 (1H, s), 7.82 (1H, s), 7.42 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.39 (1H, s), 7.36 (2H, m), 7.32 (1H, m), 7.30 (2H, m), 6.92 (1H, m), 4.46 (2H, m), 3.63 (6H, m), 3.48 (4H, m), 3.45 (3H, s)

化合物No. 201 (融点: 119). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.8 (d d, J = 13.0, 244.5 Hz), 149.8, 148.5 (d d, J = 12.5, 245.0 Hz), 138.9, 137.9, 131.1 (d d, J = 4.0, 7.0 Hz), 121.4 (d d, J = 3.0, 6.5 Hz), 117.8 (d, J = 17.3 Hz), 115.2, 113.5 (d, J = 18.7 Hz), 62.7, 48.1, 46.5, 28.3, 25.8, 25.3

20

<sup>1</sup>H: 8.12 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.87 (1H, d d d, J = 2.0, 7.8, 12.0 Hz), 7.70 (1H, m), 7.46 (1H, d t, J = 8.7, 10.7 Hz), 3.51 (4H, m), 2.57 (4H, m), 2.29 (1H, br), 1.74 (4H, m), 1.57 (1H, d br, J = 12.0 Hz), 1.20 (4H, m), 1.07 (1H, t br, J = 10.0 Hz)

化合物No. 202 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.4, 145.1, 137.8, 133.2, 129.2, 128.4, 127.7, 127.6, 125.1, 119.7, 113.7, 73.3, 69.4, 68.3, 48.7, 45.1, 13.9, 12.6

30

<sup>1</sup>H: 8.09 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.98 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.58 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.45 (1H, m, J = 1.0, 7.2, 8.2 Hz), 7.31 (5H, m), 4.53 (2H, br), 3.95-3.75 (6H, m), 1.38 (3H, t, J = 6.9 Hz)

化合物No. 203 (融点: 132). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.4, 148.6, 142.2, 137.3, 136.6, 129.9, 128, 126.5, 126.3, 123.2, 115.2, 114.3, 62.4, 54.4, 48.4, 39.7 (2 sig.)

<sup>1</sup>H: 11.97 (1H, s br), 9.68 (2H, s), 7.88 (1H, s), 7.62 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.57 (1H, s), 7.42 (2H, t, J = 7.4 Hz), 7.36 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.32 (1H, t, J = 7.4 Hz), 7.0 (2H, d, J = 8.8 Hz), 4.42 (2H, m), 3.61 (6H, m), 3.47 (4H, m), 3.43 (3H, s)

40

化合物No. 204 (融点: 141). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 161.7, 148.5, 147.3, 136.1, 128.9, 128.4, 128, 106.5, 64.6, 44.7, 35.1

<sup>1</sup>H: 8.80 (1H, s), 8.07 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.43 (2H, d, J = 8.8 Hz), 4.02 (4H, s), 3.95 (4H, br), 1.89 (4H, m)

化合物No. 205 (融点: 74 ~ 75). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.3, 161, 148.8, 147, 142.3, 128.3 (2 sig.), 128.2, 125.7, 122.6, 114,

50

55.3, 47, 36, 35.8 (2 sig.), 32.1, 28.5

<sup>1</sup>H: 8.75 (1H, s), 8.07 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.28 (2H, m), 7.19 (3H, m), 6.98 (2H, d, J = 7.7 Hz), 4.61 (2H, br), 3.03 (2H, br), 3.86 (3H, s), 2.62 (2H, m), 1.84 (2H, m), 1.67 (2H, m), 1.59 (1H, m), 1.30 (4H, m)

化合物No. 206 (融点: 131). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 161.8, 150.6, 148.5, 147.3, 133.6, 130.7, 130, 129.1, 128.7, 128.4, 127.3, 126.4, 126.3, 125.8, 125.4, 119.5, 115.9, 48.2, 45.8

<sup>1</sup>H: 9.29 (1H, s), 9.03 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.28 (1H, d d, J = 1.0, 7.3 Hz), 8.10 (1H, d, J = 8.1 Hz), 8.05 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.72-7.57 (3H, m), 7.25 (2H, t, J = 7.8 Hz), 6.99 (2H, d, J = 8.3 Hz), 6.82 (1H, t, J = 7.3 Hz), 3.94 (4H, s br), 3.32 (4H, m, J = 5.0 Hz)

10

化合物No. 207 (融点: 181). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.1, 160.7, 158.8, 156.6, 148.7, 148, 134.2, 132.6, 131.7, 131.1, 129.9, 129.7, 128.6, 126.8, 126.4, 126.3, 121.8, 120.8, 118.2, 116.1, 46.9, 44.9, 28.2

<sup>1</sup>H: 9.15 (1H, s), 7.98 (1H, s br), 7.96 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.90 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.66 (1H, m br), 7.59 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.37 (1H, s br), 7.24 (1H, d d, J = 2.4, 8.2 Hz), 7.21 (4H, m br), 7.13 (2H, d, J = 8.8 Hz), 4.83 (2H, m br), 3.88 (2H, m br), 2.96 (2H, t, J = 5.3 Hz)

20

化合物No. 208 (融点: 217~218). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.2, 160.7, 159, 156.4, 150.6, 148.3, 148.1, 131.7, 131.1, 129.8, 129.6, 129.1, 122, 121, 119.5, 117.9, 116.6, 115.9, 48.2, 45.8

<sup>1</sup>H: 9.15 (1H, s), 7.98 (1H, s br), 7.94 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.91 (1H, m), 7.69 (1H, m br), 7.59 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.36 (1H, s br), 7.24 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.23 (1H, m), 7.11 (2H, d, J = 8.8 Hz), 6.97 (2H, d, J = 8.0 Hz), 6.82 (1H, t, J = 7.0 Hz), 3.88 (4H, br), 3.27 (4H, br)

30

化合物No. 209 (融点: 192~193). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.1, 160.8, 159, 156.3, 147.2, 144.5, 131.7, 131.1, 129.8, 129.5, 122.1, 121, 117.8, 116.8, 81.3, 78.3, 61.4, 22.3

<sup>1</sup>H: 9.20 (1H, s), 7.96 (1H, s br), 7.93 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.90 (1H, m), 7.69 (1H, d d, J = 1.8, 2.4 Hz), 7.57 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.35 (1H, s br), 7.22 (1H, d d d, J = 0.9, 2.5, 8.2 Hz), 7.09 (2H, m, J = 8.8 Hz), 5.39 (2H, s), 3.82 (2H, s), 1.50 (6H, s)

化合物No. 210 (融点: 185). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.1, 160.7, 158.9, 156.5, 148.3, 148.1, 131.7, 131.1, 129.8, 129.6, 122.2, 120.9, 118, 116.5, 65.8, 46.2

<sup>1</sup>H: 9.13 (1H, s), 7.97 (1H, s br), 7.93 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.88 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.65 (1H, m br), 7.58 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.35 (1H, s br), 7.22 (1H, d d, J = 1.9, 7.9 Hz), 7.10 (2H, d, J = 8.7 Hz), 3.80-3.63 (8H, m)

40

化合物No. 211 (融点: 116). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.6, 161.2, 157.7 (d, J = 240.0 Hz), 148.7, 147.4 (d, J = 2.0 Hz), 147.3, 128.3, 122.3, 118.7 (d, J = 7.8 Hz), 115.8 (d, J = 22.0 Hz), 114.1, 55.3, 50.5, 46.4

<sup>1</sup>H: 8.83 (1H, s), 8.08 (2H, m), 7.01 (2H, t, J = 9.4 Hz), 7.0 (2H, m), 6.93 (

50

2H, m), 4.12 (4H, br), 3.88 (3H, s), 3.25 (4H, m)

化合物No. 212 (融点: 281 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 160.6, 148.5, 148.1, 135, 129.2, 128.4, 128.2, 64.3, 47.3, 42.9, 26.1, 24.7, 24.5

<sup>1</sup>H: 11.29 (1H, s), 9.20 (1H, s), 8.10 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.60 (2H, m, J = 8.8 Hz), 4.55 (2H, m br), 3.75 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 3.55 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.23 (3H, m), 2.13 (2H, d br, J = 10.5 Hz), 1.82 (2H, d br, J = 12.8 Hz), 1.61 (1H, d br, J = 12.5 Hz), 1.43 (2H, m, J = 11.5 Hz), 1.26 (2H, m, J = 12.8 Hz), 1.10 (1H, m, J = 12.5 Hz)

10

化合物No. 213 (融点: 99). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159, 146.2, 144.7, 132.4, 127.9, 127.7, 127.6, 82, 79.2, 62.2, 22.8

<sup>1</sup>H: 8.89 (1H, s), 7.74 (1H, d, J = 3.0 Hz), 7.41 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.13 (1H, m), 5.51 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.61 (6H, s)

化合物No. 214 (融点: 121). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.1, 147.0 (2 sig.), 136.2, 129, 128.2, 128.1, 51.8, 51.1, 32, 28.9

<sup>1</sup>H: 8.93 (1H, s), 8.07 (2H, m, J = 8.8 Hz), 7.44 (2H, m, J = 8.8 Hz), 4.97 (2H, m br), 4.23 (2H, m br), 3.14 (2H, br)

20

化合物No. 215 (融点: 129). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.6 (d d, J = 13.0, 248.0 Hz), 149.9 (d d, J = 13.0, 249.0 Hz), 149.4, 140.9, 137, 129.9 (d d, J = 4.0, 7.0 Hz), 121.2 (d d, J = 4.0, 6.5 Hz), 117.6 (d, J = 17.7 Hz), 114.3 (d, J = 19.0 Hz), 113, 51.3, 50.9, 30.5

<sup>1</sup>H: 8.02 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 2.0, 7.7, 11.5 Hz), 7.55 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.50 (1H, m), 7.19 (1H, d t, J = 8.3, 10.0 Hz), 4.71 (2H, s), 3.98 (2H, t, J = 6.3 Hz), 3.14 (2H, t, J = 6.3 Hz)

化合物No. 216 (融点: 115). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.3, 149, 144.2, 136.4, 135.8, 121, 118, 114, 112, 109.1, 80.7, 79.3, 61.4, 55.8, 55.6, 22.2

<sup>1</sup>H: 9.22 (1H, s), 8.36 (1H, s), 7.55 (1H, d, J = 1.8 Hz), 7.49 (1H, d d, J = 1.8, 8.4 Hz), 7.05 (1H, d, J = 8.4 Hz), 5.22 (2H, s), 3.87 (2H, s), 3.83 (3H, s), 3.79 (3H, s), 1.52 (6H, s)

30

化合物No. 217 (融点: 154 ~ 155). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.3, 149.1, 148.5, 141.9, 136.7, 126.1, 117.4, 112.4, 111.2, 108.4, 57.5, 55.9 (2 sig.), 31.4, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.90 (1H, s), 7.43 (1H, s), 7.40 (1H, s), 7.31 (1H, d br, J = 8.6 Hz), 6.91 (1H, d, J = 8.3 Hz), 3.97 (3H, s), 3.97 (1H, m), 3.91 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.58 (2H, m), 1.38 (2H, m), 1.13 (1H, m)

40

化合物No. 218 (融点: 140 ~ 141). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.2, 139.9, 137, 133.1, 132.8, 131.1, 130.6, 126.9, 124.3, 113.6, 48.9, 25.3

<sup>1</sup>H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.90 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.65 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d d, J = 2.0, 8.5 Hz), 7.46 (1H, d, J = 8.5 Hz), 3.68 (4H, m), 2.03 (4H, m)

50

化合物No. 219 (融点: 106). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 147, 143.1, 139.8, 131.8, 124.8, 124, 120.7, 113, 81, 80.6, 61.5, 23.1

<sup>1</sup>H: 8.11 (1H, s), 7.82 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.70 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.40 (1H, d t, J = 1.5, 7.4 Hz), 7.36 (1H, d t, J = 1.5, 7.4 Hz), 5.04 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.67 (6H, s)

化合物No. 220 (融点: 114 ~ 115). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.9, 142.2, 136.6, 132.8, 128.7, 127.6, 125.1, 112.5, 96.3, 63.5, 48.2, 24.1

<sup>1</sup>H: 8.06 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.80 (2H, m, J = 8.2 Hz), 7.62 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.41 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.30 (1H, m, J = 7.4 Hz), 4.10 (2H, t, J = 6.0 Hz), 3.84 (2H, t, J = 6.0 Hz), 1.73 (6H, s)

10

化合物No. 221 (融点: 120). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.4, 142.2, 136.7, 133, 128.7, 127.4, 125.1, 113.2, 49.1, 30, 21.2, 13.6

<sup>1</sup>H: 7.87 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.80 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.46 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.41 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.29 (1H, m, J = 7.5 Hz), 4.41 (2H, m), 1.90 (1H, m), 1.77 (2H, m), 1.66 (2H, m), 1.62 (1H, m), 1.39 (6H, d, J = 7.2 Hz)

20

化合物No. 222 (融点: 116). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.7, 143.3, 141.4, 132.1, 124.5, 123.6, 120.6, 112.6, 57.4, 31.3, 30, 25.4, 25.3

<sup>1</sup>H: 8.16 (1H, s), 7.82 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.55 (1H, m), 7.38 (1H, d t, J = 1.5, 7.3 Hz), 7.35 (1H, d t, J = 1.5, 7.3 Hz), 4.0 (1H, m, J = 3.4, 12.1 Hz), 2.96 (3H, s), 1.89 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.61 (2H, d q, J = 4.0, 12.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 4.0, 13.5 Hz), 1.14 (1H, t q, J = 3.5, 13.5 Hz)

化合物No. 223 (融点: 155). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 157.9 (d, J = 241.0 Hz), 150.5, 147.1 (d, J = 2.5 Hz), 141.6, 137, 133.3, 131.3, 128.9, 126.4, 118.9 (d, J = 7.7 Hz), 115.8 (d, J = 22.0 Hz), 113.2, 50.5, 46.5

<sup>1</sup>H: 7.94 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.74 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.38 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.01 (2H, m), 6.91 (2H, m), 3.82 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.19 (4H, m, J = 5.0 Hz)

30

化合物No. 224 (融点: 201 ~ 202). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 156.8, 149.8, 143, 139.8, 137.7, 129.9, 127.7, 126.5, 126.3, 126, 114.9, 113.3, 62.2, 54.9, 52.8, 39.6, 22.5, 21.2

<sup>1</sup>H: 9.28 (1H, s br), 7.60 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.55 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.48 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.41 (2H, t, J = 7.4 Hz), 7.34 (2H, d, J = 7.3 Hz), 7.32 (1H, m, J = 7.2 Hz), 6.98 (2H, d, J = 8.9 Hz), 4.32 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.50 (2H, br), 3.48 (2H, m), 3.42 (3H, s), 3.0 (2H, br), 1.79 (2H, br), 1.69 (3H, br), 1.39 (1H, br)

40

化合物No. 225 (融点: 109). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.8, 147.8, 146.5, 142.5, 137, 136, 128.5, 127.8, 127.2, 126.4, 117.4, 114.1, 111.3, 108.9, 81.1, 80.4, 71, 61.8, 56, 22.9

<sup>1</sup>H: 7.93 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.46 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.42 (1H, d, J = 1.5

50

Hz), 7.41 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.31 (1H, m), 7.21 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 6.91 (1H, d, J = 8.3 Hz), 5.20 (2H, s), 5.12 (2H, s), 3.97 (3H, s), 3.88 (2H, s), 1.61 (6H, s)

化合物No. 226 (融点: 230 ~ 232 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 145.4, 140.5, 139.7, 138.3, 137.6, 134.8, 132.6, 127.5, 117.7, 80.7, 79.3, 61.1, 22.4

<sup>1</sup>H: 9.34 (1H, d, J = 1.8 Hz), 8.97 (1H, t d, J = 1.5, 8.2 Hz), 8.81 (1H, d br, J = 5.2 Hz), 8.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.41 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.11 (1H, d d, J = 5.2, 8.2 Hz), 5.20 (2H, s), 3.86 (2H, s), 1.50 (6H, s)

10

化合物No. 227 (融点: 118 ~ 119). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 148.7, 142.6, 136.7, 132.7, 128.7, 127.7, 125.2, 112.3, 88, 66.4, 48, 19.2

<sup>1</sup>H: 8.08 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.81 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.62 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.42 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.31 (1H, m, J = 7.4 Hz), 5.49 (1H, q, J = 5.2 Hz), 4.27 (1H, m), 3.89 (1H, m), 3.80 (2H, m), 1.57 (3H, d, J = 5.2 Hz)

化合物No. 228 (融点: 204 ~ 205). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 147.7, 146.3, 145.9, 141.3, 136.6, 124.8, 117.5, 115.6, 111.9, 109, 80.6, 79.3, 60.8, 55.6, 22.4

<sup>1</sup>H: 9.03 (1H, s), 8.09 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.87 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.38 (1H, d, J = 1.7 Hz), 7.26 (1H, d d, J = 1.7, 8.1 Hz), 6.77 (1H, d, J = 8.1 Hz), 5.17 (2H, s), 3.84 (2H, s), 3.81 (3H, s), 1.50 (6H, s)

20

化合物No. 229 (融点: 152). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.2, 142.1, 137.2, 133.1, 128.6, 127.4, 125.1, 113, 58.4, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

<sup>1</sup>H: 7.92 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.80 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.48 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.40 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.29 (1H, t, J = 7.3 Hz), 2.99 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

30

化合物No. 230 (融点: 67 ~ 68). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.4, 148.7, 142.3, 137.4, 136.8, 129.9, 127.9, 126.5, 126.3, 123.4, 115.1, 114.2, 63.1, 62.3, 54.7, 51.6, 39.7

<sup>1</sup>H: 11.54 (1H, s br), 8.28 (1H, s), 7.70 (1H, s), 7.66 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.43 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.40 (2H, d, J = 7.7 Hz), 7.34 (1H, m, J = 6.9 Hz), 7.03 (2H, d, J = 8.9 Hz), 4.46 (2H, m), 3.95 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.85 (2H, t br, J = 11.70 Hz), 3.54 (2H, m), 3.48 (2H, m), 3.46 (3H, s), 3.19 (2H, m)

40

化合物No. 231 (融点: 46 ~ 47). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.5, 142.5, 141.7, 140.9, 136.3, 133.2, 129.1, 128.7, 127.4, 127.2, 126.5, 124.1, 124, 112.2, 81.1, 80.4, 61.8, 22.9

<sup>1</sup>H: 8.05 (1H, t, J = 1.6 Hz), 7.99 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.77 (1H, t d, J = 1.3, 7.6 Hz), 7.66 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.58 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.54 (1H, t d, J = 1.3, 7.7 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.46 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.37 (1H, m, J = 7.4 Hz), 5.15 (2H, s), 3.89 (2H, s), 1.63 (6H, s)

化合物No. 232 (融点: 191 ~ 192). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.9, 146.2, 140.7, 140.1, 140, 137.1, 135, 134, 129.6, 129.4, 129, 126

50

.7, 125.8, 125.7, 124.2, 123.2, 114, 80.6, 79.3, 60.8, 22.4

<sup>1</sup>H: 8.23-8.17 (4H, m), 8.15 (1H, s br), 7.88 (3H, m), 7.63 (1H, m, J = 8.1 Hz), 7.57 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.52 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.49 (1H, s br), 5.20 (2H, s), 3.86 (2H, s), 1.51 (6H, s)

化合物No. 233 (融点: 130 ~ 131). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.5, 141.2, 136.7, 133.3, 131.4, 128.9, 126.4, 112.8, 98.6, 63.6, 48.8, 29.2, 22.3, 7.6

<sup>1</sup>H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.61 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.38 (2H, m, J = 8.6 Hz), 4.16 (1H, m), 4.06 (1H, m), 3.83 (2H, m), 2.21 (1H, m), 2.06 (1H, m), 1.70 (3H, s), 0.95 (3H, t, J = 7.4 Hz)

10

化合物No. 234 (融点: 135 ~ 136 (dec.)). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.1, 148.4, 143.6, 142.3, 142.2, 137.1, 137, 132.6, 132.3, 128.8, 128.7, 128, 127.7, 125.3, 125.2, 125.1, 112.8, 111.6, 65.2, 48.9, 32.8, 30.2, 22.1

<sup>1</sup>H: 8.18 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.98 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.81 (2H, m, J = 8.5 Hz), 7.77 (2H, m, J = 8.5 Hz), 7.67 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.42 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.40 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.33 (1H, m), 7.30 (1H, m), 5.61 (1H, m), 4.73 (2H, t, J = 5.3 Hz), 4.12 (2H, t, J = 5.3 Hz), 2.34 (2H, m), 2.30 (2H, m), 1.91 (2H, qt, J = 7.6 Hz)

20

化合物No. 235 (融点: 154 ~ 155). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 147.3, 141.7, 136.1, 133.3, 131.3, 128.9, 126.4, 112.3, 88.8, 78.6, 62.5, 24.8, 22, 20.7

<sup>1</sup>H: 7.92 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.74 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.38 (2H, d, J = 8.6 Hz), 5.48 (1H, q, J = 5.2 Hz), 3.93 (1H, d, J = 8.6 Hz), 3.72 (1H, d, J = 8.6 Hz), 1.62 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.20 (3H, d, J = 5.2 Hz)

化合物No. 236 (融点: 114 ~ 115). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

30

<sup>13</sup>C: 159.9, 146.5, 142.5 (2 sig.), 141.6, 136.3, 133.2, 129.7, 129.1, 126.6, 124.2, 124, 119.7, 112.8, 112.8, 112.3, 81.1, 80.4, 61.9, 55.3, 22.9

<sup>1</sup>H: 8.02 (1H, t, J = 1.8 Hz), 7.99 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.78 (1H, t d, J = 1.5, 7.6 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.53 (1H, t d, J = 1.5, 7.7 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.38 (1H, t, J = 8.1 Hz), 7.25 (1H, d d d, J = 1.0, 1.5, 7.6 Hz), 7.19 (1H, d d, J = 1.8, 2.6 Hz), 6.92 (1H, d d d, J = 1.0, 2.6, 8.2 Hz), 5.15 (2H, s), 3.89 (5H, s), 1.63 (6H, s)

化合物No. 237 (融点: 148 ~ 149). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.8, 143.2, 135.9, 132.9, 128.7, 127.6, 125.2, 110.7, 53.2, 41.5, 36.1, 29.4

40

<sup>1</sup>H: 8.10 (1H, s), 7.79 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.52 (1H, s), 7.40 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.5 Hz), 5.39 (1H, s), 2.17 (3H, s), 2.11 (6H, s), 1.74 (6H, s)

化合物No. 238 (融点: 175). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 169.3, 151.3, 141.8, 141.5, 140.6, 137, 133.8, 133.7, 130.7, 129.3, 129, 126.3, 126.3, 126.1, 124.5, 124, 113.6, 57.5, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 8.11 (1H, t, J = 1.8 Hz), 8.08 (1H, t, J = 1.6 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.81 (2H, m), 7.78 (1H, m), 7.57 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.52 (1H, t, J = 7.6

50



Hz), 7.51 (1H, m), 7.48 (1H, t, J = 7.6 Hz), 6.43 (1H, s br), 5.93 (1H, s br), 3.97 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.3, 13.0 Hz)

化合物No. 239 (融点: 129). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.3, 142.1, 141.7, 141, 137, 133.5, 129.1, 128.7, 127.3, 127.2, 126.3, 124, 124, 113.4, 57.5, 31.3, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 8.07 (1H, t, J = 1.8 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (1H, t d, J = 1.7, 7.7 Hz), 7.67 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.54 (1H, d t, J = 1.8, 7.9 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.46 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.37 (1H, m), 3.97 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

10

化合物No. 240 (融点: 129 ~ 130). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.9, 151.3, 142.6, 142, 141.5, 137, 133.5, 129.7, 129.1, 126.4, 124.2, 124, 119.8, 113.4, 112.8, 112.8, 57.5, 55.3, 31.3, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 8.04 (1H, t, J = 1.6 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (1H, t t, J = 1.5, 7.5 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.52 (1H, d t, J = 2.0, 7.9 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.38 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.25 (1H, d d d, J = 1.0, 1.7, 7.7 Hz), 7.19 (1H, d d, J = 1.8, 2.5 Hz), 6.92 (1H, d d d, J = 1.0, 2.6, 8.2), 3.97 (1H, m), 3.89 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.3 Hz), 1.39 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.3, 13.0 Hz)

20

化合物No. 241 (融点: 173 ~ 174). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.1, 141.7, 136.7 (2 sig.), 133.4, 131.2, 129.7, 128.9, 128.8, 126.9, 126.4, 112.5, 91, 66.2, 47.9

<sup>1</sup>H: 8.01 (1H, br), 7.68 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.54 (1H, br), 7.51 (2H, m), 7.42 (3H, m), 7.36 (2H, d, J = 8.3 Hz), 6.39 (1H, s), 4.32 (1H, br), 4.12 (1H, m), 4.04 (1H, m), 3.94 (1H, m)

30

化合物No. 242 (融点: 173 ~ 174). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 158.9, 151.8, 140.2, 134.6, 120.8, 117, 97.4, 59.7, 57.3, 33.2, 30.9, 29.6, 25.4, 25.3

<sup>1</sup>H: 8.61 (1H, s br), 7.94 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.53 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.06 (1H, d d, J = 2.0, 9.0 Hz), 3.21 (3H, s), 2.0 (2H, m), 1.89 (2H, m), 1.70 (2H, m), 1.61 (3H, m), 1.18 (1H, m)

40

化合物No. 243 (融点: 165 ~ 166). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.7, 145.6, 145.5, 139, 137.4, 135.1, 131.9, 130, 129.2, 129.1, 127.1, 126.1, 117.3, 114.5, 81.8, 78.7, 61.6, 22.6

<sup>1</sup>H: 8.57 (1H, d d, J = 0.7, 1.6 Hz), 8.31 (1H, t, J = 1.7 Hz), 8.21 (1H, d d, J = 0.7, 8.8 Hz), 8.18 (1H, s br), 8.11 (1H, d d, J = 1.6, 8.8 Hz), 7.98 (1H, d t, J = 1.5, 7.8 Hz), 7.91 (1H, d t, J = 1.4, 7.8 Hz), 7.60 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.51 (1H, s br), 5.46 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.60 (6H, s)

化合物No. 244 (融点: 148). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.5, 141.1, 137, 133.1, 131.5, 128.8, 126.4, 113.5, 59.3, 31.2, 28.9,

50

## 24.4

<sup>1</sup>H: 7.91 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.73 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.37 (2H, d, J = 8.6 Hz), 4.44 (1H, qt, J = 8.2 Hz), 3.0 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.78 (2H, m), 1.68 (2H, m), 1.63 (2H, m)

化合物No. 245 (融点: 213~215). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.6, 150.9, 142.7, 140.4, 139.6, 137.7, 134.2, 133.2, 129.4, 128.2, 126.6, 125.6, 124.4, 123.1, 115, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.9

<sup>1</sup>H: 8.20 (1H, t, J = 1.8 Hz), 8.18 (1H, d, J = 1.1 Hz), 8.15 (1H, d, J = 1.1 Hz), 8.07 (1H, s br), 8.0 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.90 (1H, t d, J = 1.4, 7.7 Hz), 7.83 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.62 (1H, t d, J = 1.6, 8.0 Hz), 7.51 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.44 (1H, s br), 3.84 (1H, m), 2.95 (3H, s), 1.80 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.57 (2H, m), 1.30 (2H, m, J = 12.7 Hz), 1.11 (1H, m, J = 13 Hz)

10

化合物No. 246 (融点: 118~119). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 163.1 (d, J = 245.0 Hz), 151.3, 143.3 (d, J = 8.0 Hz), 141.8, 140.4 (d, J = 2.0 Hz), 137, 133.7, 130.1 (d, J = 8.5 Hz), 129.2, 126.2, 124.5, 123.9, 122.8 (d, J = ), 114.1 (d, J = 22.0 Hz), 114.1 (d, J = 21.0 Hz), 113.5, 57.6, 31.4, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 8.05 (1H, m), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (1H, t d, J = 2.0, 6.7 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (2H, m), 7.44 (2H, m), 7.37 (1H, d d d, J = 1.7, 2.5, 10.5 Hz), 7.06 (1H, m), 3.98 (1H, m), 3.02 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.87 (2H, m), 1.71 (1H, d br, J = 11.5 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.6, 12.5 Hz), 1.39 (2H, t q, J = 3.2, 13.2 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.3, 13.0 Hz)

20

化合物No. 247 (融点: 208~209). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.9, 150.9, 141.6, 140.7, 140.5, 137.7, 134, 130, 129.2, 125.3, 123.8, 122.9, 117.6, 114.8, 114.5, 113.6, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.9

<sup>1</sup>H: 9.56 (1H, s, br), 8.14 (2H, s), 8.08 (1H, s), 7.83 (1H, t d, J = 2.0, 6.6 Hz), 7.47 (1H, m), 7.45 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.27 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.13 (1H, d d d, J = 1.0, 1.7, 7.6 Hz), 7.08 (1H, t, J = 1.9 Hz), 6.78 (1H, d d d, 1.0, 2.4, 8.0 Hz), 3.84 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.57 (2H, m), 1.30 (2H, q, J = 12.7 Hz), 1.13 (1H, m, J = 13.0 Hz)

30

化合物No. 248 (融点: 131~132). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.9, 149 (m, J = 2.0 Hz), 142.5, 140.3, 138.8, 137.7, 134.3, 130.9, 129.5, 126.0, 125.6, 124.6, 123.1, 120.2 (q, J = 256.0 Hz), 119.9, 119.4, 115.1, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.9

<sup>1</sup>H: 8.20 (1H, d, J = 1.2 Hz), 8.17 (1H, t, J = 1.6 Hz), 8.15 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.91 (1H, t d, J = 1.4, 7.8 Hz), 7.79 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.71 (1H, br), 7.62 (1H, t, J = 8.1 Hz), 7.61 (1H, m), 7.51 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.39 (1H, d, J = 8.2 Hz), 2.94 (3H, s), 3.84 (1H, m), 1.78 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.56 (2H, m), 1.30 (2H, m, J = 12.8 Hz), 1.11 (1H, m)

40

化合物No. 249 (融点: 162~163). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.5, 141.2, 136.9, 136.8, 133.1, 131.4, 128.9, 128.8, 127.7, 126.6, 126.3, 113.1, 51.7, 48.6, 20.4

<sup>1</sup>H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.46 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.34 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.32 (1H, m), 7.31 (2H, d, J = 8.2 Hz), 4.61 (2H, s), 4.20 (1H, m, J = 6.8 Hz), 1.37 (6H, d, J = 6.8 Hz)

50

)

化合物No. 250 (融点: 111). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

13C: 151.7, 142.3, 137, 136.7, 132.9, 128.9, 128.6, 127.7, 127.5, 126.6, 125.1, 112.9, 51.7, 48.5, 20.4

1H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.48 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.39 (2H, m), 7.37 (2H, m), 7.31 (3H, m), 7.27 (1H, m), 4.62 (2H, s), 4.21 (1H, m, J = 6.7 Hz), 1.37 (6H, d, J = 6.7 Hz)

化合物No. 251 (融点: 132 ~ 133). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

10

13C: 152.2, 142, 138.4, 136.8, 133, 129, 128.6, 127.6, 127.3, 126.1, 125, 113, 59.4, 51.3, 28.1

1H: 7.91 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.65 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.46 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.1 Hz), 7.35 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.31 (1H, m, J = 7.4 Hz), 7.26 (2H, m), 7.25 (1H, m), 4.69 (2H, s), 1.52 (9H, s)

化合物No. 252 (融点: 129 ~ 130). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

13C: 152.1, 141, 138.4, 136.9, 133, 131.5, 129, 128.8, 127.6, 126.2, 126.1, 113.2, 59.5, 51.3, 28.1

1H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.57 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.43 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.31 (1H, m), 7.31 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.24 (2H, d, J = 8.0 Hz), 4.68 (2H, s), 1.52 (9H, s)

20

化合物No. 253 (融点: 147 ~ 148). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

13C: 162.9, 147.5, 147.3, 136.8, 129.1, 128.2, 127.5, 64.6, 47.3, 44.2

1H: 8.95 (1H, s), 8.07 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.47 (2H, d, J = 8.7 Hz), 5.15 (2H, br), 4.36 (2H, br), 3.40 (2H, t, J = 6.8 Hz)

化合物No. 254 (融点: 141 ~ 142). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

13C: 151.5, 138.3, 134.2, 133.9, 128.4, 127.1, 126.8, 122.9, 57.2, 30.8, 30.1, 25.4, 25.2, 10.5

1H: 7.68 (2H, d, J = 8.1 Hz), 7.62 (1H, s), 7.43 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.4 Hz), 3.91 (1H, m), 2.91 (3H, s), 2.46 (3H, s), 1.86 (2H, m), 1.81 (2H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.57 (2H, m), 1.36 (2H, m), 1.12 (1H, m)

30

化合物No. 255 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

13C: 159.9, 151.6, 142.1, 137, 136.7, 134.3, 129.7, 128.9, 127.7, 126.6, 117.5, 113.7, 113.2, 110, 55.3, 51.7, 48.6, 20.4

1H: 7.92 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.47 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.2 Hz), 7.31 (4H, m), 7.28 (2H, m), 6.84 (1H, m), 4.61 (2H, s), 4.21 (1H, m, J = 6.8 Hz), 3.85 (3H, s), 1.37 (6H, d, J = 6.8 Hz)

40

化合物No. 256 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

13C: 159.8, 152.2, 141.8, 138.5, 136.8, 134.4, 129.6, 129, 127.6, 126.1, 117.4, 113.8, 113.3, 109.7, 59.4, 55.2, 51.2, 28.1

1H: 7.91 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.45 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.30 (1H, m, J = 7.3 Hz), 7.26 (2H, m), 7.24 (2H, m), 7.19 (1H, m), 6.81 (1H, d d d, J = 1.2, 2.6, 8.0 Hz), 4.69 (2H, s), 3.82 (3H, s), 1.53 (9H, s)

化合物No. 257 (融点: 138 ~ 139). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

50

<sup>13</sup>C: 151.3, 142.8, 141.8, 140.2, 137, 134.6, 133.7, 129.9, 129.2, 127.3, 127.3, 126.2, 125.4, 124.5, 123.9, 113.6, 57.6, 31.4, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 8.04 (1H, m), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (1H, m), 7.66 (1H, t, J = 1.7 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.54 (1H, t d, J = 1.5, 7.6 Hz), 7.49 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.48 (1H, m), 7.39 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 1.5, 2.2, 8.1 Hz), 3.98 (1H, m), 3.02 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.87 (2H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.3 Hz), 1.60 (2H, m), 1.39 (2H, t q, J = 3.0, 12.7 Hz), 1.14 (1H, t q, J = 3.3, 13.0 Hz)

化合物No. 258 (融点: 115 ~ 118). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

10

<sup>13</sup>C: 159.2, 151.3, 142.5, 142, 141.6, 137, 133.5, 129.7, 129.1, 126.4, 124.1, 124, 119.6, 113.4 (2 sig.), 113.3, 63.5, 57.5, 31.4, 30, 25.4, 25.2, 14.9

<sup>1</sup>H: 8.04 (1H, m, J = 1.7 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.78 (1H, t d, J = 1.7, 7.5 Hz), 7.55 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.52 (1H, d t, J = 1.5, 7.9 Hz), 7.47 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.36 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.24 (1H, d d d, J = 1.0, 1.7, 7.7 Hz), 7.19 (1H, d d, J = 1.7, 2.5 Hz), 6.91 (1H, d d d, J = 1.0, 2.5, 8.2 Hz), 4.11 (2H, q, J = 7.0 Hz), 3.97 (1H, m), 3.01 (3H, s), 1.89 (2H, m), 1.86 (2H, m), 1.71 (1H, d br, J = 12.5 Hz), 1.59 (2H, qd, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.46 (3H, t, J = 7.0 Hz), 1.39 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

20

化合物No. 259 (融点: 137 ~ 139). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 158.3 (d, J = 248.0 Hz), 151.3, 141.7, 137.0, 135.0 (d, J = 1.3 Hz), 133.5, 130.5 (d, J = 3.5 Hz), 130.4 (m, J = 14.0 Hz), 129.3 (d, J = 3.3 Hz), 128.9, 128.7 (d, J = 8.5 Hz), 128.0, 125.6 (d, J = 2.5 Hz), 124.9, 117.4 (d, J = 25.0 Hz), 113.6, 57.5, 31.4, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.97 (1H, s br), 7.93 (1H, d, J = 1.1 Hz), 7.82 (1H, t d, J = 1.7, 7.2 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.1 Hz), 7.52-7.43 (3H, m), 7.29 (1H, m), 7.11 (1H, t, J = 9.5 Hz), 3.96 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.39 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

30

化合物No. 260 (融点: 190 ~ 191). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 156.8, 146.3, 141.3, 136.7, 126.2, 124.4, 115.4, 111.6, 80.6, 79.3, 60.8, 22.5

<sup>1</sup>H: 9.48 (1H, s), 8.09 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 6.76 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 5.14 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.49 (6H, s)

化合物No. 261 (融点: 197 ~ 199). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 156.7, 151, 140.9, 137.3, 126.1, 124.4, 115.4, 112.5, 56.8, 31.3, 29.1, 25.2, 24.9

40

<sup>1</sup>H: 9.48 (1H, s), 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.77 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (2H, m, J = 8.3 Hz), 6.77 (2H, m, J = 8.3 Hz), 3.80 (1H, m), 2.91 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.59 (1H, m), 1.55 (2H, m), 1.28 (2H, m), 1.10 (1H, m)

化合物No. 262 (融点: 170 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.9, 149, 137.3, 135.3, 130.2, 129.5, 116.3, 116, 115.9, 112.3, 58.7, 31.5, 28.2, 24

<sup>1</sup>H: 9.70 (1H, s), 9.24 (1H, s), 8.32 (1H, s), 7.29 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.27 (1H, m), 7.24 (1H, m), 6.83 (1H, m, J = 2.2, 6.7 Hz), 4.39 (1H, m), 2.97 (3H, s)

50

, 1.89 (2H, m), 1.70 (4H, m), 1.53 (2H, m)

化合物No. 263 (融点: 89~91). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.8, 138.7, 134, 133.1, 128.4, 127.2, 126.9, 122.8, 81.2, 80.7, 61, 23, 10.6

<sup>1</sup>H: 7.66 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.63 (1H, s), 7.43 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.31 (1H, t, J = 7.4 Hz), 4.93 (2H, s), 3.90 (2H, s), 2.49 (3H, s), 1.61 (6H, s)

化合物No. 264 (融点: 118~119). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 152.1, 138.7, 135.3, 134.2, 134.1, 129.1, 128.4, 128.2, 127.7, 127.2, 126.9, 123.2, 53.9, 36, 10.6

<sup>1</sup>H: 7.69 (1H, s), 7.67 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.43 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.31 (1H, t, J = 7.4 Hz), 7.40-7.27 (5H, m), 4.66 (2H, s), 3.01 (3H, s), 2.49 (3H, s)

化合物No. 265 (融点: 178~180 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.9, 149.1, 137.3, 136.8, 135.8, 130.2, 129.5, 128.5, 127.2, 126.8, 116.3, 116.1, 115.4, 112.4, 51.4, 47.1, 20.1

<sup>1</sup>H: 9.73 (1H, s), 9.18 (1H, s), 8.29 (1H, s), 7.36-7.28 (5H, m), 7.27 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.21 (1H, m), 7.18 (1H, m), 6.82 (1H, m, J = 2.5, 8.1 Hz), 4.65 (2H, s), 4.16 (1H, m), 1.28 (6H, d, J = 6.7 Hz)

化合物No. 266 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.7, 145.2, 133.2, 129.1, 125.1, 119.7, 113.5, 59.3, 28.8, 24.3

<sup>1</sup>H: 8.09 (1H, m d, J = 8.3 Hz), 7.98 (1H, m d, J = 8.3 Hz), 7.59 (1H, m, J = 7.7 Hz), 7.45 (1H, m, J = 7.7 Hz), 4.78 (1H, m), 3.17 (3H, s), 2.07 (2H, m), 1.75 (4H, m), 1.63 (2H, m)

化合物No. 267 (融点: 142~143). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.6, 141.2, 136.7, 133.2, 131.4, 128.9, 126.4, 112.8, 96.5, 75.9, 53.4, 25.6, 25.4, 23.7, 9.8

<sup>1</sup>H: 8.03 (1H, br), 7.73 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.59 (1H, br), 7.37 (2H, d, J = 8.5 Hz), 4.10 (1H, m), 3.81 (1H, d d, J = 5.3, 9.0 Hz), 3.43 (1H, t, J = 9.2 Hz), 1.74 (3H, s), 1.72 (2H, m), 1.66 (3H, s), 1.0 (3H, t, J = 7.5 Hz)

化合物No. 268 (融点: 117~118). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 144.9, 136.5, 133.6, 131.7, 128.5, 127.8, 126.4, 110.8, 95.7, 63.1, 47.7, 23.9

<sup>1</sup>H: 7.96 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.78 (1H, s), 7.45 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.35 (1H, t, J = 7.5 Hz), 4.07 (2H, t, J = 6.2 Hz), 3.58 (2H, t, J = 6.2 Hz), 1.74 (6H, s)

化合物No. 269 (融点: 92~93). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 141.6, 135.3, 133.9, 129.4, 128.8, 128.1, 127.5, 111.0, 80.6, 61.3, 29.7, 22.7, 22.5

<sup>1</sup>H: 7.85 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.40 (2H, d, J = 8.8 Hz), 4.81 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.65 (6H, s)

化合物No. 270 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.7, 142.2, 136.6, 132.9, 128.7, 127.6, 125.2, 112.5, 96.4, 75.9, 53.4, 25.6, 25.4, 23.7, 9.8

<sup>1</sup>H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.61 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.4 Hz), 4.11 (1H, m), 3.81 (1H, d d, J = 5.2, 9.0 Hz), 3.44 (1H, t, J = 9.5 Hz), 1.75 (3H, s), 1.73 (3H, s), 1.72 (2H, m), 1.0 (3H, t, J = 7.7 Hz)

化合物No. 271 (融点: 113~114). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 156, 151.7, 137.4, 136, 128, 127.6, 121.7, 120.9, 117.2, 110.6, 57.5, 55.2, 31.1, 30.1, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 8.23 (1H, d d, J = 1.8, 7.7 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.82 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.28 (1H, d t, J = 2.0, 7.6 Hz), 7.07 (1H, J = 1.1, 7.6 Hz), 6.97 (1H, d, J = 8.3 Hz), 3.95 (3H, s), 3.95 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.69 (1H, d br, J = 12.3 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.37 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.3, 13.1 Hz)

10

化合物No. 272 (融点: 178~181). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.0, 150.5 (d d, J = 12.7, 247 Hz), 149.7 (d d, J = 13.0, 248.0 Hz), 140.3, 137, 130.3 (d d, J = 3.7, 6.6 Hz), 121.0 (d d, J = 3.5, 6.3 Hz), 117.5 (d, J = 17.5 Hz), 114.1 (d, J = 18.5 Hz), 113.5 (d, J = 1.0 Hz), 57.6, 31.3, 29.9, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 2.2, 7.7, 11.6 Hz), 7.49 (1H, m), 7.45 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.17 (1H, d t, J = 8.4, 10.5 Hz), 3.93 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d br), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.3 Hz), 1.37 (2H, t q, 3.0, 13.0 Hz), 1.12 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

20

化合物No. 273 (融点: 142~143). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.3 (d, J = 246 Hz), 151.3, 141.3, 136.9, 129.2 (d, J = 3.2 Hz), 126.8 (d, J = 8.0 Hz), 115.6 (d, J = 22.0 Hz), 112.9, 57.5, 31.3, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.76 (2H, m, J = 5.4, 8.9 Hz), 7.74 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.09 (2H, m, J = 8.8 Hz), 3.95 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.2 Hz), 1.37 (2H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

30

化合物No. 274 (融点: 156~158). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151, 140, 137.1, 133.2, 132.8, 131.1, 130.6, 126.9, 124.3, 114, 57.6, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.91 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.90 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.61 (1H, d d, J = 2.0, 8.4 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.45 (1H, d, J = 8.4 Hz), 3.94 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.71 (1H, m), 1.58 (2H, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

40

化合物No. 275 (融点: 160~162). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.9, 148.6, 140, 137.3, 134.9, 130.9, 129.7, 122, 119.9, 114.6, 57.6, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 8.61 (1H, t, J = 2 Hz), 8.14 (2H, m), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.57 (1H, t, J = 8.0 Hz), 3.96 (1H, m, J = 12.0 Hz), 3.02 (3H, s), 1.88 (4H, m), 1.72 (1H, m), 1.60 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.39 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.14 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

化合物No. 276 (融点: 130~131). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.2, 150.5 (t, J = 2.7 Hz), 141.1, 137, 130.5, 126.5, 119.7, 115.9 (t,

50

J = 259.5 Hz), 113.2, 57.6, 31.3, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.47 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.8 Hz), 6.54 (1H, t, J = 7.4 Hz), 3.95 (1H, m, J = 11.0 Hz), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, dbr, J = 14.0 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.6, 12.2 Hz), 1.37 (2H, J = 3.2, 13.0 Hz), 1.13 (1H, J = 3.5, 13.0 Hz)

化合物No. 277 (融点: 168 ~ 169). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.2, 141.1, 137, 133.1, 131.6, 128.8, 126.4, 113.4, 57.6, 31.3, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37 (2H, J = 8.7 Hz), 3.95 (1H, m, J = 11.8 Hz), 2.99 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d, J = 13.5 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.3 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13 Hz) 10

化合物No. 278 (融点: 160). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.5, 142.3, 136.9, 132.8, 128.7, 127.6, 125.1, 113.1, 67, 54.4, 31.8, 29.5

<sup>1</sup>H: 7.94 (1H, s), 7.80 (2H, d, J = 7.6 Hz), 7.51 (1H, s), 7.41 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.3 Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.0, 11.5 Hz), 3.50 (2H, t, J = 11.5 Hz), 3.04 (3H, s), 1.94 (2H, d q, J = 4.5, 12.3 Hz), 1.77 (2H, d br, J = 12.0 Hz) 20

化合物No. 279 (融点: 157 ~ 159). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 152.2, 145.6, 140.7, 133.3, 128.6, 127.1, 125, 112.4, 57, 30.7, 30.1, 25.4, 25.2, 14

<sup>1</sup>H: 7.76 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.26 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.21 (1H, s), 3.90 (1H, m br), 2.88 (3H, s), 2.52 (3H, s), 1.81 (4H, m), 1.68 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.55 (2H, d q, J = 3.3, 12.2 Hz), 1.35 (2H, q br, J = 12.5 Hz), 1.11 (1H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz) 30

化合物No. 280 (融点: 137). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 143.9, 135.7, 133.7, 133.7, 130.1, 128.7, 127.7, 111.2, 80.9, 80.6, 61.3, 22.9

<sup>1</sup>H: 7.90 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.73 (1H, s), 7.41 (2H, s, J = 8.6 Hz), 4.88 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.62 (6H, s)

化合物No. 281 (融点: 132 ~ 134). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.7, 149.1, 148.5, 142, 136.7, 126.1, 117.4, 112.4, 111.2, 108.4, 59.3, 55.9, 55.9, 31.2, 28.8, 24.3

<sup>1</sup>H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.30 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 6.90 (1H, d, J = 8.3 Hz), 4.44 (1H, m, J = 8.2 Hz), 3.96 (3H, s), 3.91 (3H, s), 2.99 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.73 (4H, m), 1.62 (2H, m) 40

化合物No. 282 (融点: 189 ~ 191). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.5, 142.2, 138.1, 137, 132.9, 129.1, 128.7, 128.3, 127.6, 127.2, 125.1, 113.1, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

<sup>1</sup>H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.37-7.25 (6H, m), 4.03 (1H, m), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br, J = 11.2 Hz), 1.90 (2H, q br, J = 12.0 Hz) 50

Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物No. 283 (融点: 128). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.3, 149.8, 147.2, 130.1, 129.9, 128.7, 126.7, 57.6, 30.2 (2 sig.), 25.5, 25.3

<sup>1</sup>H: 8.82 (1H, s), 8.15 (2H, m), 7.48 (3H, m), 4.32 (1H, m br), 3.14 (3H, s), 1.93 (4H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.3 Hz), 1.59 (2H, m), 1.40 (2H, m), 1.15 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

化合物No. 284 (融点: 151 ~ 153). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

10

<sup>13</sup>C: 160.3, 153.3, 151, 130.3, 129.6, 128.6, 126.5, 58.7, 30.8, 29.5, 25.5, 25.2, 13.8

<sup>1</sup>H: 8.10 (2H, m, J = 7.5 Hz), 7.45 (3H, m), 4.21+3.80 (1H, m), 3.03-2.99 (3H, m), 2.69 (3H, s), 1.88 (4H, m), 1.72 (1H, m), 1.58 (2H, m), 1.54 (2H, m), 1.12 (1H, m)

化合物No. 285 (融点: 135 ~ 138). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.9, 146.2, 144.9, 130.1, 129.8, 128.7, 126.7, 82, 79.3, 62.2, 22.8

<sup>1</sup>H: 8.94 (1H, s), 8.12 (2H, m), 7.47 (3H, m), 5.57 (2H, s), 3.86 (2H, s), 1.63 (6H, s)

20

化合物No. 286 (融点: 125 ~ 127). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 160, 157.7, 146.4, 129.9, 129.9, 128.6, 126.6, 82.2, 79.6, 61.7, 22.8, 15.1

<sup>1</sup>H: 8.08 (2H, m), 7.45 (3H, m), 5.40 (2H, s), 3.85 (2H, s), 2.80 (3H, s), 1.62 (6H, s)

化合物No. 287 (融点: 222 ~ 224). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.8, 150.7, 140.5, 140.2, 140, 137.8, 135, 134.2, 129.6, 129.3, 129, 126.7, 125.8, 125.6, 124.1, 123.1, 114.7, 57.5, 37.9, 35.9, 33.8, 29.2

30

<sup>1</sup>H: 8.21 (1H, m, J = 1.6 Hz), 8.17 (1H, m, J = 1.6 Hz), 8.15 (1H, s br), 8.14 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d d, J = 1.6, 7.8 Hz), 7.88 (2H, m), 7.62 (1H, m), 7.57 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.51 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.48 (1H, s br), 2.94 (3H, s), 2.16 (6H, s), 2.11 (3H, s), 1.66 (6H, s)

化合物No. 288 (融点: 138 ~ 139). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.2, 151.2, 141.9, 137.2, 137, 134.6, 129.7, 128.5, 127.9, 127.5, 117.8, 114.3, 113.3, 111.2, 69.9, 58.4, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

<sup>1</sup>H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (1H, m), 7.47 (2H, m), 7.46 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (2H, m), 7.38 (1H, m), 7.34 (1H, m), 7.31 (1H, t, J = 7.9 Hz), 6.92 (1H, d d d, J = 1.0, 2.5, 8.2 Hz), 5.14 (2H, s), 2.99 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.74 (6H, s)

40

化合物No. 289 (融点: 165 ~ 169 (dec.)). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.9, 148.4, 146.7, 139.1, 137.6, 132.4, 129.1, 123.6, 113.8, 58.5, 38.5, 36.2, 34.1, 29.6

<sup>1</sup>H: 9.0 (1H, d, J = 1.5 Hz), 8.52 (1H, d d, J = 1.3, 4.7 Hz), 8.11 (1H, d t, J = 1.8, 7.8 Hz), 7.94 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.33 (1H, d d, J = 4.9, 7.7 Hz), 2.99 (3H, s), 2.19 (9H, s), 1.73 (6H, s)

50



化合物No. 290 (融点: 149). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.2, 142, 141.6, 141, 137.3, 133.6, 129.1, 128.7, 127.3, 127.2, 126.3, 124, 123.9, 113.2, 58.4, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

<sup>1</sup>H: 8.05 (1H, t br, J = 1.8 Hz), 7.95 (1H, d, J = .13 Hz), 7.78 (1H, d t, J = 1.5, 7.5 Hz), 7.67 (2H, m, J = 8.5 Hz), 7.53 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.53 (1H, m), 7.48 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.46 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.37 (1H, m, J = 7.5 Hz), 3.0 (3H, s), 2.21 (9H, s), 1.74 (6H, s)

化合物No. 291 (融点: 208~210). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.1, 150.2, 148.2, 141.5, 138.6, 137.4, 134.1, 129.4, 126, 125.7, 123.8, 121.7, 113.5, 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7 10

<sup>1</sup>H: 8.67 (2H, m, J = 5.0 Hz), 8.11 (1H, m, J = 2.0 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.84 (1H, d t, J = 1.7, 7.5 Hz), 7.58 (2H, m), 7.55 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.55 (1H, m), 7.51 (1H, t, J = 7.6 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

化合物No. 292 (融点: 75~77). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.4, 141.3, 136.9, 136.3, 133.2, 131.3, 129, 128.9, 128.8, 126.4, 126.2, 112.5, 97, 76.3, 55.5, 25.4, 24

<sup>1</sup>H: 8.05 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.70 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.46-7.38 (5H, m), 7.35 (2H, d, J = 8.5 Hz), 5.21 (1H, d d, J = 5.5, 9.8 Hz), 4.10 (1H, d d, J = 5.5, 9.3 Hz), 3.68 (1H, t, J = 9.5 Hz), 1.88 (3H, s), 1.87 (3H, s) 20

化合物No. 293 (融点: 164~165). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 161.4, 146.5, 140.5, 134.4, 120.3, 117.9, 94.7, 82.6, 79.6, 62.1, 56, 23

<sup>1</sup>H: 7.92 (1H, d d, J = 0.5, 9.0 Hz), 7.58 (1H, d, J = 2.5 Hz), 7.08 (1H, d d, J = 2.5, 9.0 Hz), 5.53 (1H, s), 3.94 (3H, s), 3.90 (2H, s), 1.69 (6H, s)

化合物No. 294 (融点: 190~193 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 156.9, 151, 140.3, 137.2, 126.2, 123.8, 115.4, 112.7, 58.4, 31.2, 28.2, 24 30

<sup>1</sup>H: 9.53 (1H, s), 8.18 (1H, s), 7.81 (1H, s), 7.65 (2H, d, J = 8.7 Hz), 6.79 (2H, d, J = 8.7 Hz), 4.36 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.86 (2H, m), 1.67 (4H, m), 1.53 (2H, m)

化合物No. 295 (融点: 91~93). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 144.0, 136.6, 133.6, 131.6, 128.5, 127.9, 126.5, 110.9, 81.0, 80.6, 61.3, 22.9

<sup>1</sup>H: 7.96 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.74 (1H, s), 7.45 (2H, m, J = 7.8 Hz), 7.35 (1H, m, J = 7.6 Hz), 4.88 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.62 (6H, s) 40

化合物No. 296 (融点: 106~110). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 156.9, 150.9, 141.6, 137.3, 134, 130, 117.1, 115.1, 113.5, 112.6, 58.5, 38.5, 36.2, 34.1, 29.7

<sup>1</sup>H: 7.95 (1H, s), 7.46 (1H, m), 7.42 (1H, s), 7.24 (1H, m), 7.23 (1H, m), 6.91 (1H, m), 2.96 (3H, s), 2.18 (9H, s), 1.72 (6H, s)

化合物No. 297 (融点: 119~121). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 149.8, 144.6, 132.6, 129.3, 125.3, 119.6, 113.3, 67.9, 57.6, 56.1, 34.2, 27.2 50

<sup>1</sup>H: 8.18 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.90 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.68 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.52 (1H, t, J = 7.6 Hz), 4.64 (1H, s br), 4.03 (1H, s br), 3.40 (1H, s br), 3.03 (3H, s), 1.90 (2H, s br), 1.82 (2H, s br), 1.75 (2H, s br), 1.26 (2H, s br)

化合物No. 298 (融点: 94 ~ 95). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.6, 142.4, 136.9, 136.3, 132.8, 129, 128.9, 128.7, 127.6, 126.2, 125.2, 112.3, 96.9, 76.3, 55.5, 25.4, 24

<sup>1</sup>H: 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (2H, m, J = 8.3 Hz), 7.58 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (5H, m), 7.39 (2H, m, J = 7.8 Hz), 7.29 (1H, m, J = 7.4 Hz), 5.21 (1H, d d, J = 5.5, 9.8 Hz), 4.11 (1H, d d, J = 5.5, 9.3 Hz), 3.69 (1H, t, J = 9.5 Hz), 1.89 (3H, s), 1.87 (3H, s)

10

化合物No. 299 (融点: 140 ~ 142). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.7, 141.2, 136.7, 133.3, 131.4, 128.9, 126.4, 112.8, 96.4, 63.6, 48.3, 24.1

<sup>1</sup>H: 8.06 (1H, br), 7.73 (2H, m, J = 8.6 Hz), 7.61 (1H, br), 7.38 (2H, m, J = 8.6 Hz), 4.12 (2H, t, J = 6.0 Hz), 3.85 (2H, t, J = 6.0 Hz), 1.74 (6H, s)

化合物No. 300 (融点: 149 ~ 150). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

20

<sup>13</sup>C: 149.1, 136.3, 134.3, 131.9, 128.5, 127.7, 126.4, 111.6, 57, 30.6, 29.8, 25.3, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.98 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.72 (1H, br), 7.45 (2H, m, J = 7.6 Hz), 7.34 (1H, m, J = 7.5 Hz), 4.24 (1H, m br), 2.88 (3H, br), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, m), 1.56 (2H, m), 1.40 (2H, m), 1.13 (1H, m)

化合物No. 301 (融点: 136 ~ 137). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 144.3, 138.8, 135.2, 133.8, 130.5, 128.6, 128.1, 96.1, 81.1, 80.7, 61.3, 22.9

<sup>1</sup>H: 7.91 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.82 (1H, s), 7.41 (2H, d, J = 8.5 Hz), 4.84 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.63 (6H, s)

30

化合物No. 302 (融点: 108). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.4, 143.0, 136.4, 132.6, 128.7, 127.8, 125.2, 112.2, 80.7, 71.4, 57.8, 24.9, 9.8

<sup>1</sup>H: 7.98 (1H, br), 7.81 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.54 (1H, br), 7.42 (2H, t, J = 7.4 Hz), 7.31 (1H, t, J = 7.3 Hz), 5.13 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.0 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.32 (2H, m), 3.73 (1H, m), 1.91 (1H, m), 1.64 (1H, m), 0.98 (3H, t, J = 7.5 Hz)

40

化合物No. 303 (融点: 80 ~ 81). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.6 (d d, J = 13.0, 247.5 Hz), 149.9 (d d, J = 13.0, 249.0 Hz), 149.1, 141.1, 136.5, 129.9 (d d, J = 3.8, 7.0 Hz), 121.2 (d d, J = 3.5, 6.2 Hz), 117.6 (d, J = 17.5 Hz), 114.3 (d, J = 18.6 Hz), 112.5, 80.7, 71.5, 57.8, 24.9, 9.8

<sup>1</sup>H: 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.62 (1H, d d d, J = 2.0, 7.5, 11.5 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, m), 7.19 (1H, d t, J = 8.4, 10.2 Hz), 5.12 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.99 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.33 (2H, m), 3.74 (1H, m), 1.90 (1H, m), 1.64 (1H, m), 0.98 (3H, t, J = 7.4 Hz)

化合物No. 304 (融点: 100 ~ 101). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

50

<sup>13</sup>C: 159.9, 149.3, 142.8, 136.4, 134, 129.7, 117.6, 113.9, 112.4, 110.3, 80.7, 71.4, 57.8, 55.3, 24.9, 9.8

<sup>1</sup>H: 7.98 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.52 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.39 (1H, m), 7.36 (1H, d t, J = 1.5, 7.7 Hz), 7.31 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.88 (1H, d d d, J = 1.4, 2.6, 8.0 Hz), 5.13 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.0 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.32 (2H, m), 3.88 (3H, s), 3.73 (1H, m), 1.90 (1H, m), 1.63 (1H, m), 0.98 (3H, t, J = 7.5 Hz)

化合物No. 305 (融点: 131 ~ 132). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.1, 148.5, 148.3, 141.6, 138.3, 137.3, 136.5, 134.5, 134, 129.4, 126.2, 124.8, 123.9, 123.5, 113.4, 58.4, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

<sup>1</sup>H: 8.91 (1H, d, J = 2.5 Hz), 8.61 (1H, d d, J = 1.7, 4.8 Hz), 8.05 (1H, m), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.95 (1H, m), 7.82 (1H, m), 7.55 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.51 (1H, m), 7.50 (1H, m), 7.38 (1H, d d d, J = 0.8, 4.8, 7.9 Hz), 3.0 (3H, s), 2.10 (9H, s), 1.73 (6H, s)

10

化合物No. 306 (融点: 195 ~ 196). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 157.5, 155, 151, 141.2, 137.4, 134.7, 134.4, 134.2, 129.7, 125.9, 125.6, 123.7, 113.6, 58.5, 38.5, 36.2, 34.1, 29.6

<sup>1</sup>H: 9.22 (1H, s), 9.01 (2H, s), 8.05 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.85 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.56 (1H, s), 7.54 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.48 (1H, d, J = 7.5 Hz), 3.0 (3H, s), 2.19 (9H, s), 1.73 (6H, s)

20

化合物No. 307 (融点: 150 ~ 151). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.6, 150.8, 140.7, 137.5, 134.6, 129.6, 115.7, 114.3, 114.1, 111.7, 56.8, 31.3, 29.1, 25.2, 24.9

<sup>1</sup>H: 9.43 (1H, s), 8.09 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.90 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.26 (2H, m), 7.16 (1H, t, J = 8.0 Hz), 6.65 (1H, d d d, J = 1.0, 2.2, 8.0 Hz), 3.80 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.59 (1H, m), 1.55 (2H, m), 1.29 (2H, m, J = 11.5 Hz), 1.10 (1H, q, J = 13.0 Hz)

30

化合物No. 308 (融点: 139 ~ 140). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.6 (d d, J = 13.0, 248.0 Hz), 149.9 (d d, J = 13.0, 249.0 Hz), 148.1, 141.1, 136.7, 136.1, 129.8 (d d, J = 3.9, 6.5 Hz), 129.1, 128.9, 126.1, 121.2 (d d, J = 3.5, 6.2 Hz), 117.6 (d, J = 17.8 Hz), 114.3 (d, J = 18.5 Hz), 112.4, 80.4, 80.1, 53.0

<sup>1</sup>H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.62 (1H, d d d, J = 2.0, 7.6, 11.5 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.45 (1H, m), 7.42-7.37 (5H, m), 7.18 (1H, d t, J = 8.3, 10.0 Hz), 5.44 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.26 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.18 (1H, d d, J = 6.1, 8.8 Hz), 4.16 (1H, d d, J = 6.1, 10.0 Hz), 3.68 (1H, d d, J = 9.0, 10.0 Hz)

40

化合物No. 309 (融点: 155 ~ 157). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 148.4, 142.9, 136.6, 136.2, 132.5, 129.0, 128.9, 128.7, 127.8, 126.1, 125.2, 112.1, 80.4, 80.0, 53.0

<sup>1</sup>H: 8.08 (1H, br), 7.80 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.60 (1H, br), 7.42 (7H, m), 7.31 (1H, t, J = 7.5 Hz), 5.44 (1H, d, J = 4.8 Hz), 5.27 (1H, d, J = 4.8 Hz), 5.16 (1H, d d, J = 6.3, 8.8 Hz), 4.16 (1H, d d, J = 6.3, 10.1 Hz), 3.68 (1H, t, J = 9.6 Hz)

化合物No. 310 (融点: 126 ~ 127). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 148.9, 142.9, 136.4, 132.6, 128.7, 127.8, 125.2, 112.1, 80.4, 73.4, 52.9

50

, 17

<sup>1</sup>H: 7.99 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, m d, J = 8.4 Hz), 7.54 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42 (2H, m t, J = 7.8 Hz), 7.31 (1H, m t, J = 7.5 Hz), 5.14 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.04 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.39 (1H, m), 4.36 (1H, m), 3.63 (1H, d d, J = 6.9, 8.4 Hz), 1.37 (3H, d, J = 6.0 Hz)

化合物No. 311 (融点: 127). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.6 (d d, J = 12.5, 247.5 Hz), 149.9 (d d, J = 13.0, 248.5 Hz), 148.6, 141.1, 136.4, 129.9 (d d, J = 3.5, 7.0 Hz), 121.2 (d d, J = 3.5, 6.3 Hz), 117.6 (d, J = 17.5 Hz), 114.3 (d, J = 18.6 Hz), 112.5, 80.4, 73.4, 53, 17.0

10

<sup>1</sup>H: 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.62 (1H, d d d, J = 2.1, 7.7, 11.5 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, m), 7.19 (1H, d t, J = 8.3, 10.1 Hz), 5.13 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.04 (1H, d, J = 4.5 Hz), 4.39 (1H, m), 4.36 (1H, m), 3.65 (1H, m), 1.37 (3H, d, J = 6.0 Hz)

化合物No. 312 (融点: 118). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.9, 142.2, 136.5, 133, 128.7, 127.4, 125.1, 113, 58.9, 39.4, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

<sup>1</sup>H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.81 (2H, m d, J = 8.3 Hz), 7.48 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, m t, J = 7.9 Hz), 7.30 (1H, m t, J = 7.5 Hz), 3.77 (1H, t t, J = 3.5, 12.0 Hz), 3.43 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.82 (4H, m), 1.66 (3H, m), 1.30 (2H, m), 1.25 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.13 (1H, m)

20

化合物No. 313 (融点: 121 ~ 122). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.9, 149.1, 148.5, 142, 136.2, 126.2, 117.3, 112.3, 111.2, 108.4, 58.9, 55.9, 55.9, 39.4, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

<sup>1</sup>H: 7.86 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (1H, s), 7.41 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.91 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.30 (1H, d d, J = 2.0, 8.4 Hz), 3.96 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.77 (1H, t t, J = 3.5, 12.0 Hz), 3.43 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.84 (4H, m), 1.68 (3H, m), 1.29 (2H, m), 1.25 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.12 (1H, m)

30

化合物No. 314 (融点: 208). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.6 (d, J = 243.0 Hz), 150.6, 146.1 (d, J = 11.0 Hz), 139.5 (d, J = 2.5 Hz), 137.2, 126.8 (d, J = 7.0 Hz), 120.8 (d, J = 3.4 Hz), 114.1 (d, J = 2.0 Hz), 113.7, 112.1 (d, J = 19.5 Hz), 56.8, 56, 31, 28.9, 25, 24.6

<sup>1</sup>H: 8.04 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 7.61 (1H, m), 7.18 (1H, t, J = 9.3 Hz), 3.86 (3H, s), 3.80 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.62 (1H, m), 1.59 (2H, m), 1.30 (2H, m), 1.12 (1H, m)

40

化合物No. 315 (融点: 162 ~ 163). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.6 (d, J = 242.5 Hz), 150.7, 146.4 (d, J = 10.5 Hz), 138.5, 137.5, 125.7 (d, J = 7.6 Hz), 121.2 (d, J = 3.0 Hz), 114.3, 114.1 (d, J = 2.0 Hz), 112.4 (d, J = 19.5 Hz), 58.5, 56.1, 31.3, 28.2, 24

<sup>1</sup>H: 8.31 (1H, s br), 8.03 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.69 (1H, d d, J = 2.0, 12.5 Hz), 7.65 (1H, m), 7.21 (1H, t, J = 8.8 Hz), 4.37 (1H, m), 3.86 (3H, s), 2.93 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.68 (4H, m), 1.53 (2H, m)

化合物No. 316 (融点: 205). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.6 (d, J = 243.5 Hz), 147.2 (d, J = 10.5 Hz), 144.6, 136.8, 136, 122.

50

9, 121.8 (d,  $J = 3.3$  Hz), 114.3, 114.3, 112.9 (d,  $J = 20.0$  Hz), 80.7, 79.3, 61.3, 56.1, 22.3

$^1\text{H}$ : 9.05 (1H, s br), 8.31 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.82 (1H, d d,  $J = 2.2, 12.7$  Hz), 7.74 (1H, d,  $J = 8.5$  Hz), 7.28 (1H, t,  $J = 8.7$  Hz), 5.21 (2H, s), 3.87 (3H, s), 3.86 (2H, s), 1.51 (6H, s)

化合物No. 317 (融点: 173 ~ 174). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 151.3, 150, 142.3, 141.5, 137.2, 133.4, 129 (2 sig.), 127.7, 125.4, 123, 122.8, 113.1, 112.7, 58.3, 40.6, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

$^1\text{H}$ : 8.01 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.69 (1H, d,  $J = 7.5$  Hz), 7.59 (2H, m,  $J = 8.8$  Hz), 7.51 (1H, s), 7.50 (1H, d,  $J = 8.0$  Hz), 7.43 (1H, t,  $J = 7.7$  Hz), 6.82 (2H, m,  $J = 8.8$  Hz), 3.01 (6H, s), 3.0 (3H, s), 2.21 (9H, s), 1.74 (6H, s)

10

化合物No. 318 (融点: 181 ~ 182). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 168.1, 164.5, 157.6, 151.1, 141.7, 137.2, 133.7, 133.4, 128.7, 128, 125.5, 124.4, 116.1, 113.3, 58.4, 54.8, 54.2, 38.5, 36.2, 34.1, 29.6

$^1\text{H}$ : 8.31 (1H, s), 7.93 (1H, s), 7.91 (1H, s), 7.78 (1H, d,  $J = 7.6$  Hz), 7.50 (1H, s), 7.46 (1H, t,  $J = 7.5$  Hz), 7.40 (1H, d,  $J = 7.5$  Hz), 4.04 (3H, s), 4.03 (3H, s), 2.99 (3H, s), 2.19 (9H, s), 1.73 (6H, s)

20

化合物No. 319 (融点: 109 ~ 111). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 151.9 (d,  $J = 246.0$  Hz), 151.2, 147.8 (d,  $J = 11.0$  Hz), 141.3, 136.8, 129.6 (d,  $J = 3.5$  Hz), 117.3 (d,  $J = 7.0$  Hz), 116.1 (d,  $J = 19.0$  Hz), 113.1, 110.3 (d,  $J = 1.5$  Hz), 57.6, 56.2, 31.3, 30, 25.4, 25.2

$^1\text{H}$ : 7.89 (1H, d,  $J = 1.2$  Hz), 7.50 (1H, d d,  $J = 2.0, 8.2$  Hz), 7.45 (1H, d,  $J = 1.2$  Hz), 7.24 (1H, d d d,  $J = 2.0, 4.3, 8.3$  Hz), 7.09 (1H, d d,  $J = 8.3, 11.0$  Hz), 3.96 (3H, s), 3.95 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d br,  $J = 13.0$  Hz), 1.58 (2H, d q,  $J = 4.5, 13.5$  Hz), 1.37 (2H, t q,  $J = 3.0, 13.0$  Hz), 1.13 (1H, t q,  $J = 3.4, 13.0$  Hz)

30

化合物No. 320 (融点: 170 ~ 171). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 163.1 (d,  $J = 240.0$  Hz), 151.1, 145.9 (d,  $J = 15.0$  Hz), 141.5, 139.9 (d,  $J = 8.0$  Hz), 137.4, 137.2, 134.7 (d,  $J = 4.5$  Hz), 134.1, 129.5, 126.1, 124.8, 123.8, 113.5, 109.4 (d,  $J = 37.5$  Hz), , 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

$^1\text{H}$ : 8.49 (1H, m,  $J = 2.5$  Hz), 8.05 (1H, m,  $J = 2.5, 7.5$  Hz), 8.02 (1H, m,  $J = 1.6$  Hz), 7.95 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.81 (1H, d t,  $J = 1.5, 7.5$  Hz), 7.55 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.51 (1H, t,  $J = 7.5$  Hz), 7.46 (1H, d t,  $J = 1.5, 7.8$  Hz), 7.03 (1H, m,  $J = 3.0, 8.5$  Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.74 (6H, s)

化合物No. 321 (融点: 100 ~ 103). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

40

$^{13}\text{C}$ : 151.9 (d,  $J = 246.0$  Hz), 151.5, 147.8 (d,  $J = 11.0$  Hz), 141.3, 136.8, 129.5 (d,  $J = 3.5$  Hz), 117.3 (d,  $J = 7.0$  Hz), 116.2 (d,  $J = 19.0$  Hz), 113.2, 110.3, 59.3, 56.2, 31.2, 28.9, 24.3

$^1\text{H}$ : 7.94 (1H, d,  $J = 1.0$  Hz), 7.50 (1H, d d,  $J = 2.0, 7.50$  Hz), 7.47 (1H, d,  $J = 1.0$  Hz), 7.24 (1H, d d d,  $J = 2.0, 4.3, 8.3$  Hz), 7.09 (1H, d d,  $J = 8.3, 11.0$  Hz), 4.44 (1H, qt,  $J = 8.0$  Hz), 3.97 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.96 (2H, m), 1.75 (4H, m), 1.63 (2H, m)

化合物No. 322 (融点: 216 ~ 217). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 156.9, 151, 142.4, 141.9, 141.4, 137.3, 132.9, 129.7, 129, 126.3, 124.2,

50

124.1, 118.8, 114.7, 114.5, 113.4, 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

<sup>1</sup>H: 8.07 (1H, br), 8.03 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.90 (1H, s br), 7.70 (1H, d t, J = 1.7, 7.4 Hz), 7.52 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (1H, d t, J = 1.8, 7.8 Hz), 7.40 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.24 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.17 (1H, s br), 7.13 (1H, m), 6.85 (1H, d d d, J = 0.9, 2.5, 8.0 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.74 (6H, s)

化合物No. 323 (融点: 184 ~ 185). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 163.6, 151.2, 145, 141.8, 138.3, 137.6, 137.3, 133.8, 130, 129.3, 125.7, 124, 123.5, 113.3, 110.7, 58.4, 53.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

<sup>1</sup>H: 8.44 (1H, d d, J = 0.6, 2.5 Hz), 7.98 (1H, m), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.87 (1H, d d, J = 2.5, 8.6 Hz), 7.77 (1H, d t, J = 1.8, 7.0 Hz), 7.53 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.48 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.45 (1H, m), 6.83 (1H, d d, J = 0.6, 8.6 Hz), 3.99 (3H, s), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

10

化合物No. 324 (融点: 138 ~ 140). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 168.4, 151.2, 142, 140.9, 137.3, 137.3, 136.8, 133.5, 129.1, 127.6, 126, 123.8, 123.6, 120, 113.3, 58.4, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7, 24.6

<sup>1</sup>H: 8.01 (1H, t, J = 1.7 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.74 (1H, d t, J = 1.7, 7.3 Hz), 7.60 (4H, br), 7.52 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.49 (1H, d t, J = 1.9, 7.8 Hz), 7.44 (1H, t, J = 7.6 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 2.19 (3H, s), 1.73 (6H, s)

20

化合物No. 325 (融点: 150 ~ 152). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.1, 143.6, 141.8, 138.7, 137.2, 133.6, 132.8, 129.1, 126.3, 124.9, 123.7, 122.5, 113.2, 108.9, 58.4, 38.5, 36.2, 34.1, 29.6

<sup>1</sup>H: 7.96 (1H, s), 7.94 (1H, s), 7.81 (1H, s), 7.66 (1H, m), 7.51 (1H, s), 7.49 (1H, m), 7.40 (2H, m), 6.78 (1H, m), 2.99 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

化合物No. 326 (融点: 105 ~ 107). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.1, 151.8, 142, 136.8, 126.4, 125.8, 114, 112.1, 59.3, 55.3, 31.1, 28.8, 24.3

<sup>1</sup>H: 7.91 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.73 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.41 (1H, d, J = 1.2 Hz), 6.95 (2H, d, J = 8.8 Hz), 4.45 (1H, qt, J = 8.0 Hz), 3.85 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.76 (2H, m), 1.67 (2H, m), 1.63 (2H, m)

30

化合物No. 327 (融点: 92 ~ 94). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.9, 151.6, 142, 136.9, 134.4, 129.7, 117.5, 113.6, 113.5, 110.1, 59.3, 55.3, 31.2, 28.9, 24.3

<sup>1</sup>H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d d, J = 1.4, 2.4 Hz), 7.36 (1H, td, J = 1.2, 7.6 Hz), 7.32 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.86 (1H, d d d, J = 1.3, 2.7, 8.0 Hz), 4.45 (1H, m), 3.88 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.96 (2H, m), 1.78 (2H, m), 1.68 (2H, m), 1.60 (2H, m)

40

化合物No. 328 (融点: 153 ~ 154). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.2, 146.6, 142.5, 136.1, 126.4, 125.5, 114.1, 110.9, 81.1, 80.3, 61.8, 55.3, 22.9

<sup>1</sup>H: 7.93 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.71 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.41 (1H, d, J = 1.5 Hz), 6.94 (2H, d, J = 8.9 Hz), 5.13 (2H, s), 3.88 (2H, s), 3.84 (3H, s), 1.61 (6H, s)

50

化合物No. 329 (融点: 100~101). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.9, 146.4, 142.4, 136.1, 134.1, 129.7, 117.5, 113.8, 112.3, 110.2, 81, 80.3, 61.8, 55.3, 22.8

<sup>1</sup>H: 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d d, J = 1.5, 2.5 Hz), 7.34 (1H, t d, J = 1.5, 7.6 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.8 Hz), 6.85 (1H, d d d, J = 1.5, 2.7, 7.9 Hz), 5.12 (2H, s), 3.87 (2H, s), 3.86 (3H, s), 1.61 (6H, s)

化合物No. 330 (融点: 164~166). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.2 (d, J = 240.0 Hz), 150.8, 144.0 (d, J = 12.3 Hz), 139.9 (d, J = 2.0 Hz), 137.4, 125.4 (d, J = 7.0 Hz), 121.0 (d, J = 3.0 Hz), 117.9 (d, J = 3.2 Hz), 113.5, 112.5 (d, J = 19.5 Hz), 56.8, 31.3, 29, 25.1, 24.8

<sup>1</sup>H: 9.89 (1H, s), 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.58 (1H, d d, J = 2.0, 12.7 Hz), 7.48 (1H, m, J = 2.0, 8.4 Hz), 6.95 (1H, d d, J = 8.4, 9.0 Hz), 3.80 (1H, m), 2.91 (3H, s), 1.76 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.55 (2H, m), 1.29 (2H, m), 1.10 (1H, m)

化合物No. 331 (融点: 170~171). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.2 (d, J = 240.0 Hz), 151.2, 144.0 (d, J = 12.5 Hz), 139.9 (d, J = 2.6 Hz), 137.4, 125.4 (d, J = 6.9 Hz), 121.0 (d, J = 3.0 Hz), 117.9 (d, J = 3.3 Hz), 113.5, 112.5 (d, J = 19.5 Hz), 58.4, 31.2, 28.2, 24

<sup>1</sup>H: 9.89 (1H, s), 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.58 (1H, d d, J = 2.0, 12.7 Hz), 7.48 (1H, d d d, J = 1.0, 2.0, 8.4 Hz), 6.95 (1H, d d, J = 8.4, 9.1 Hz), 4.35 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.87 (2H, m), 1.67 (4H, m), 1.53 (2H, m)

化合物No. 332 (融点: 194~196). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.2 (d, J = 240.0 Hz), 146.2, 144.1 (d, J = 12.0 Hz), 140.2 (d, J = 2.3 Hz), 136.9, 125.3 (d, J = 6.8 Hz), 121.1 (d, J = 3.0 Hz), 117.9 (d, J = 3.7 Hz), 112.5 (d, J = 20.0 Hz), 112.5, 80.6, 79.3, 60.8, 22.4

<sup>1</sup>H: 9.91 (1H, s), 8.11 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d d, J = 2.1, 12.5 Hz), 7.48 (1H, m, J = 2.1, 8.6 Hz), 6.95 (1H, d d, J = 8.6, 9.1 Hz), 5.16 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.49 (6H, s)

化合物No. 333 (融点: 173~176). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.4 (d, J = 240.0 Hz), 146.1, 145.0 (d, J = 12.5 Hz), 140.2, 136.9, 130.1 (d, J = 3.0 Hz), 116.2 (d, J = 18.5 Hz), 115.9 (d, J = 6.3 Hz), 114.3 (d, J = 2.7 Hz), 113.1, 80.6, 79.3, 60.8, 22.4

<sup>1</sup>H: 9.93 (1H, s), 8.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.46 (1H, d d, J = 2.1, 8.8 Hz), 7.24 (1H, d d d, J = 2.1, 4.4, 8.5 Hz), 7.13 (1H, d d, J = 8.5, 11.2 Hz), 5.16 (2H, s), 3.84 (2H, s), 1.49 (6H, s)

化合物No. 334 (融点: 154~155). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 154.6, 150.9, 150.7, 137.8, 134.3, 128.9, 124.2, 122.9, 121, 114.6, 110.9, 101.9, 57.6, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.97 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.60 (1H, m), 7.49 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.28 (1H, d t, J = 1.5, 7.5 Hz), 7.24 (1H, d t, J = 1.1, 7.3 Hz), 7.10 (1H, s), 3.97 (1H, m), 3.01 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.39 (2H, q, J = 13.0 Hz), 1.14 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

10

20

30

40

50

化合物No. 335 (融点: 161 ~ 163). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151, 148.5, 146.7, 139.2, 137.3, 132.4, 129, 123.6, 114, 57.6, 31.4, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 9.01 (1H, d d, J = 0.8, 2.3 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.7, 4.8 Hz), 8.12 (1H, d d d, J = 1.8, 2.2, 8.0 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.58 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 0.8, 4.9, 8.0 Hz), 3.95 (1H, m), 3.01 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.5 Hz)

10

化合物No. 336 (融点: 211 ~ 213). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151, 150.4, 148, 141.4, 137.4, 137.3, 137, 135.5, 134.2, 129.5, 126, 125.1, 124.2, 123.8, 113.6, 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.7

<sup>1</sup>H: 8.66 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.02 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.92 (1H, d d, J = 2.5, 8.3 Hz), 7.81 (1H, d, J = 7.3 Hz), 7.55 (1H, s), 7.51 (1H, t, J = 7.51 Hz), 7.46 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.41 (1H, d, J = 8.3 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

化合物No. 337 (融点: オイル). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 147.5, 145.8, 140.9, 133, 128.6, 127.3, 125, 111.1, 81, 80.6, 61, 22.9, 14.3

<sup>1</sup>H: 7.74 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.27 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.20 (1H, s), 4.90 (2H, s), 3.88 (2H, s), 2.56 (3H, s), 1.61 (6H, s)

20

化合物No. 338 (融点: 129 ~ 130). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 154.6, 150.4, 146.1, 137.3, 134.9, 128.8, 124.3, 123, 121.1, 113.2, 110.9, 102.3, 81.1, 80.3, 62, 22.8

<sup>1</sup>H: 8.04 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d, 1.3 Hz), 7.60 (1H, m), 7.48 (1H, m, J = 7.8 Hz), 7.30 (1H, d t, J = 1.5, 7.3 Hz), 7.24 (1H, d t, J = 1.2, 7.4 Hz), 7.10 (1H, s), 5.16 (2H, s), 3.89 (2H, s), 1.62 (6H, s)

30

化合物No. 339 (融点: 154 ~ 155). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 148.6, 142.8, 136.5, 132.6, 128.7, 127.8, 125.2, 112.2, 80.3, 67.1, 46.0

<sup>1</sup>H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, m d, J = 8.4 Hz), 7.60 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, m t, J = 7.5 Hz), 7.31 (1H, m t, J = 7.3 Hz), 5.12 (2H, s), 4.15 (2H, t, J = 6.5 Hz), 3.80 (2H, t, J = 6.5 Hz)

化合物No. 340 (融点: 122 ~ 123). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.9, 148.4, 142.8, 136.6, 136.2, 133.9, 129.7, 129, 128.9, 126.1, 117.6, 113.9, 112.3, 110.3, 80.4, 80, 55.3, 53

<sup>1</sup>H: 8.97 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.47-7.37 (5H, m), 7.40 (1H, m), 7.36 (1H, m), 7.31 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.87 (1H, d d d, J = 1.3, 2.6, 7.9 Hz), 5.43 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.26 (1H, d, J = 4.5 Hz), 5.16 (1H, d d, J = 6.1, 8.8 Hz), 4.16 (1H, d d, J = 6.2, 10.0 Hz), 3.87 (3H, s), 3.68 (1H, t, J = 9.5 Hz)

40

化合物No. 341 (融点: 164 ~ 165). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.1, 151.4, 142, 136.8, 126.4, 125.8, 114, 112.1, 57.5, 55.3, 31.3, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.33 (2H, m d, J = 9.

50



0 Hz), 6.95 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 3.95 (1H, m), 3.84 (3H, s), 2.99 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.37 (2H, t q, J = 3.2, 13.0 Hz), 1.12 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

化合物No. 342 (融点: 122 ~ 123). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.9, 151.3, 141.9, 136.8, 134.4, 129.7, 117.5, 113.6, 113.5, 110.1, 57.5, 55.3, 31.3, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d d, J = 1.4, 2.5 Hz), 7.36 (1H, t d, J = 1.4, 7.7 Hz), 7.31 (1H, 1H, t, J = 8.0 Hz), 6.85 (1H, d d d, J = 1.2, 2.5, 7.9 Hz), 3.95 (1H, m), 3.88 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.86 (2H, m), 1.84 (2H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 4.5, 13.3 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.2, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

10

化合物No. 343 (融点: 150 ~ 152). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.3 (d, J = 240.0 Hz), 150.8, 144.9 (d, J = 12.5 Hz), 139.9, 137.5, 130.2 (d, J = 3.5 Hz), 116.2 (d, J = 18.7 Hz), 115.9 (d, J = 6.3 Hz), 114.2 (d, J = 3.0 Hz), 114.1, 56.8, 31.3, 29, 25.1, 24.8

<sup>1</sup>H: 9.89 (1H, s br), 8.08 (1H, s), 7.89 (1H, s), 7.45 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.24 (1H, s br), 7.13 (1H, m, J = 9.0, 11.0 Hz), 3.79 (1H, s br), 2.91 (3H, s), 1.76 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, m), 1.10 (1H, m)

20

化合物No. 344 (融点: 144 ~ 145). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.1, 150.3 (d, J = 241.0 Hz), 144.9 (d, J = 12.5 Hz), 140.0, 137.5, 130.2 (d, J = 3.2 Hz), 116.3 (d, J = 18.5 Hz), 115.9 (d, J = 6.5 Hz), 114.2 (d, J = 3.0 Hz), 114.1, 58.4, 31.2, 28.2, 24.0

<sup>1</sup>H: 9.91 (1H, s), 8.08 (1H, s), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.45 (1H, d d, J = 2.0, 8.7 Hz), 7.24 (1H, m), 7.13 (1H, d d, J = 8.6, 11.2 Hz), 4.35 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.87 (2H, m), 1.68 (4H, m), 1.53 (2H, m)

化合物No. 345 (融点: 113 ~ 114). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.8, 150.5 (t, J = 3.0 Hz), 141.2, 136.6, 130.5, 126.5, 119.7, 115.9 (t, J = 259.5 Hz), 113.1, 58.9, 39.4, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

<sup>1</sup>H: 7.87 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.45 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.16 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 6.54 (1H, t, J = 7.4 Hz), 3.75 (1H, t t, J = 3.5, 12.0 Hz), 3.43 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.85 (4H, m), 1.68 (2H, m), 1.64 (1H, m), 1.29 (2H, m), 1.25 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.12 (1H, m)

30

化合物No. 346 (融点: 129 ~ 131). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.6 (d d, J = 13.0, 247.5 Hz), 150.6, 149.7 (d d, J = 12.5, 248.0 Hz), 140.4 (d, J = 2.0 Hz), 136.6, 130.3 (d d, J = 3.5, 7.0 Hz), 121.0 (d d, J = 3.6, 6.1 Hz), 117.5 (d, J = 17.5 Hz), 114.1 (d, J = 18.5 Hz), 113.4, 59, 39.5, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

<sup>1</sup>H: 7.85 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 2.2, 7.6, 11.6 Hz), 7.49 (1H, m), 7.44 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.18 (1H, d t, J = 8.4, 10.2 Hz), 3.74 (1H, t t, J = 3.5, 12.0 Hz), 3.43 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.85 (4H, m), 1.67 (2H, m), 1.64 (1H, m), 1.30 (2H, m), 1.25 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.13 (1H, m)

40

化合物No. 347 (融点: 144 ~ 145). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.6, 146.2, 141, 136.9, 134.6, 129.6, 115.7, 114.2, 113.4, 111.7, 80.6, 79.3, 60.8, 22.4

50

<sup>1</sup>H: 9.43 (1H, s), 8.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.26 (2H, m), 7.16 (1H, t, J = 7.8 Hz), 6.66 (1H, d d d, J = 1.5, 2.0, 8.0 Hz), 5.17 (2H, s), 3.83 (2H, s), 1.50 (6H, s)

化合物No. 348 (融点: 129 ~ 130). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.4, 141.8, 136.4, 132.9, 130.6, 128.7, 128.5, 125, 123.1, 112.4, 94, 81.9, 81.1, 80.3, 65.5, 61.9, 31.5, 22.8

<sup>1</sup>H: 7.97 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (1H, br), 7.74 (1H, m), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (2H, m), 5.12 (2H, s), 3.88 (2H, s), 1.63 (6H, s), 1.61 (6H, s)

10

化合物No. 349 (融点: 129 ~ 131). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.3, 138.4, 137.5, 134.2, 131.5, 130.9, 129.1, 126.3, 124.8, 115.7, 58.3, 39.1, 30.2, 25.3, 24.7, 14.7

<sup>1</sup>H: 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.11 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.09 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.84 (1H, d d, J = 2.0, 8.4 Hz), 7.65 (1H, d, J = 8.4 Hz), 3.57 (1H, t br, J = 10.5 Hz), 3.38 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.79 (2H, m), 1.75 (2H, m), 1.64 (2H, m), 1.55 (1H, m), 1.17 (2H, m), 1.1 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.10 (1H, m)

化合物No. 350 (融点: 92 ~ 93). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.1, 151, 142, 136.4, 126.4, 125.8, 114.1, 111.9, 58.9, 55.3, 39.3, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

20

<sup>1</sup>H: 7.87 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.38 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.85 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 3.84 (3H, s), 3.77 (1H, t t, J = 3.5, 12.0 Hz), 3.43 (2H, t, J = 7.1 Hz), 1.85 (4H, m), 1.68 (2H, m), 1.64 (1H, m), 1.30 (2H, m), 1.25 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.12 (1H, m)

化合物No. 351 (融点: 100 ~ 101). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 152.0 (d, J = 246.5 Hz), 147.8 (d, J = 11.0 Hz), 146.4, 141.8, 136.1, 129.4 (d, J = 3.5 Hz), 117.4 (d, J = 7.0 Hz), 116.2 (d, J = 18.5 Hz), 112, 110.4 (d, J = 1.5 Hz), 81.1, 80.3, 61.9, 56.2, 22.8

30

<sup>1</sup>H: 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.48 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 7.47 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.23 (1H, d d d, J = 2.0, 4.3, 8.3 Hz), 7.09 (1H, d d, J = 8.3, 11.0 Hz), 5.13 (2H, s), 3.96 (3H, s), 3.89 (2H, s), 1.61 (6H, s)

化合物No. 352 (融点: 113 ~ 114). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.5, 143.1, 142.6, 136.2, 132.8, 128.8, 127.8, 125.2, 122.6, 112, 81.1, 80.4, 70.9, 61.8, 45.7, 30.7, 29.3, 22.9

<sup>1</sup>H: 7.97 (1H, d, J = , 1.3 Hz), 7.68 (1H, t br, J = 2.0 Hz), 7.58 (1H, m d, J = 7.7 Hz), 7.50 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.32 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.15 (1H, m d, J = 7.7 Hz), 5.13 (2H, s), 3.89 (2H, s), 2.75 (2H, m), 1.84 (2H, m), 1.62 (6H, s), 1.30 (6H, s)

40

化合物No. 353 (融点: 192 (dec.)). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.4, 137.9, 137.5, 136.7, 136, 132.9, 125.9, 122.7, 115.2, 58.7, 38.5, 36.1, 34.1, 29.6

<sup>1</sup>H: 8.68 (1H, s), 8.13 (1H, d, J = 6.3 Hz), 7.92 (1H, d, J = 0.9 Hz), 7.70 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.56 (1H, d, J = 0.9 Hz), 7.30 (1H, d d, J = 6.3, 8.1 Hz), 2.98 (3H, s), 2.18 (9H, m), 1.72 (6H, m)

化合物No. 354 (融点: 217 (dec.)). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

50

<sup>13</sup>C: 151, 141.1, 140.2, 137.6, 137.6, 137.5, 135.5, 134.4, 129.7, 125.9, 125.8, 125.7, 124.8, 123.7, 113.6, 58.5, 38.6, 36.2, 34.1, 29.6

<sup>1</sup>H: 8.54 (1H, t, J = 1.5 Hz), 8.21 (1H, d d d, J = 1.0, 1.6, 6.4 Hz), 8.0 (1H, t, J = 1.8 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.86 (1H, td, J = 1.5, 7.8 Hz), 7.56 (1H, d d d, J = 1.0, 1.5, 8.0 Hz), 7.55 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.52 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.44 (1H, d d d, J = 1.5, 1.8, 7.8 Hz), 7.36 (1H, d d, J = 6.5, 8.0 Hz), 3.0 (3H, s), 2.20 (9H, s), 1.73 (6H, s)

化合物No. 355 (融点: 144 ~ 147). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 160, 149.9, 140.6, 135.9, 132.5, 129.9, 117.6, 114.5, 113.5, 110.3, 59.2, 55.5, 39.7, 31.3, 25.5, 25, 14.9 10

<sup>1</sup>H: 8.13 (1H, br), 7.50 (1H, m), 7.50 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.38 (1H, m, J = 7.7 Hz), 7.34 (1H, t, J = 7.8 Hz), 6.90 (1H, d d d, J = 1.3, 2.6, 8.0 Hz), 3.90 (3H, s), 3.72 (1H, t t, J = 3.5, 12 Hz), 3.44 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.86 (4H, m), 1.69 (2H, m), 1.65 (1H, m), 1.30 (2H, m), 1.27 (3H, t, J = 7.1 Hz), 1.13 (1H, m)

化合物No. 356 (融点: 120 ~ 121). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 146.3, 145.9, 141.7, 137.5, 136.5, 126.1, 113.2, 111.7, 110.7, 110.6, 80.6, 79.3, 60.8, 55.3, 22.5 20

<sup>1</sup>H: 8.07 (1H, d, 1.3 Hz), 7.71 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.14 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.0 (1H, d d, J = 2.0, 8.5 Hz), 6.79 (1H, d, J = 8.5 Hz), 5.16 (2H, s), 4.72 (2H, s), 3.83 (2H, s), 3.77 (3H, s), 1.49 (6H, s)

化合物No. 357 (融点: 176 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.8, 149.5, 137.3, 136.7, 126.1, 122, 121, 119.7, 116.6, 114.3, 57, 31.4, 28.9, 25, 24.8

<sup>1</sup>H: 11.13 (1H, s), 10.0 (3H, br), 8.75 (1H, s br), 8.05 (1H, s br), 7.81 (1H, s br), 7.70 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.13 (1H, d, J = 7.7 Hz), 3.85 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.55 (3H, m), 1.30 (2H, m), 1.16 (1H, m) 30

化合物No. 358 (融点: 209 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.7, 145.2, 137.8, 136.9, 126.1, 122.8, 121, 119.6, 116.6, 113.3, 80.6, 79.3, 61.1, 22.4

<sup>1</sup>H: 11.08 (1H, s), 9.98 (3H, s br), 8.62 (1H, s br), 8.04 (1H, s br), 7.81 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.70 (1H, d d, J = 2.0, 8.5 Hz), 7.11 (1H, d, J = 8.5 Hz), 5.18 (2H, s), 3.85 (2H, s), 1.50 (6H, s)

化合物No. 359 (融点: 97 ~ 98). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 145.9, 145.6, 131.5, 131.3, 130.3, 119.2, 115.4, 82.4, 79.5, 62.4, 22.9 40

<sup>1</sup>H: 8.18 (1H, d, J = 8.8 Hz), 8.08 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.58 (1H, d d, J = 1.4, 8.8 Hz), 5.53 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.68 (6H, s)

化合物No. 360 (融点: 138 ~ 140). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 163.3 (d d, J = 10.0, 252.0 Hz), 152.9 (d d, J = 15.0, 262.5 Hz), 145.3, 135.1 (d d, J = 7.2, 16.8 Hz), 132.7 (d, J = 19.0 Hz), 101.7 (d d, J = 20.0, 30.0 Hz), 97.2 (d d, J = 5.5, 29.5 Hz), 82.4, 79.5, 62.5, 22.9

<sup>1</sup>H: 7.75 (1H, d d d, J = 0.9, 2.1, 8.0 Hz), 6.97 (1H, d t, J = 2.1, 9.4 Hz), 5.52 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.67 (6H, s)

化合物No. 361 (融点: 146~147). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.2, 144.7, 143.1, 140.2, 133.5, 128.9, 128.1, 127.9, 125.7, 119.9, 112.4, 82.5, 79.6, 62.2, 23

<sup>1</sup>H: 8.44 (1H, d d, J = 1.7, 1.6 Hz), 8.14 (1H, d d, J = 0.7, 8.7 Hz), 7.74 (1H, d d, J = 1.6, 8.7 Hz), 7.71 (2H, m, J = 8.2 Hz), 7.50 (2H, m, J = 7.9 Hz), 7.42 (1H, m, J = 7.5 Hz), 5.57 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.70 (6H, s)

化合物No. 362 (融点: 225 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.4, 138.3, 137.1, 135.7, 134.7, 132.8, 126.7, 121.2, 117, 56.8, 31.4, 29, 25.1, 24.8

<sup>1</sup>H: 8.70 (1H, t, J = 1.5 Hz), 8.28 (1H, s), 8.20 (1H, s), 8.11 (1H, d, J = 6.5 Hz), 7.78 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.45 (1H, d d, J = 6.5, 8.1 Hz), 3.80 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.56 (3H, m), 1.30 (2H, m), 1.11 (1H, m)

化合物No. 363 (融点: 171). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 161.6, 155.2, 151.1, 141, 137, 135.5, 134.1, 130.5, 121.8, 119.3, 118.9, 117.9, 117, 113.9, 105.7, 57.6, 31.3, 29.9, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (1H, t d, J = 1.2, 7.9 Hz), 7.60 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.53 (1H, t br, J = 2.0 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.43 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.05 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.0 (1H, d d d, J = 1.0, 2.5, 7.9 Hz), 3.94 (1H, m), 2.99 (3H, s), 1.87 (2H, m), 1.84 (2H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.4, 12.3 Hz), 1.37 (2H, t q, J = 3.0, 12.7 Hz), 1.12 (1H, t q, J = 3.2, 13.2 Hz)

化合物No. 364 (融点: 173). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 161.6, 155.3, 146.2, 141.5, 136.2, 135.2, 134.1, 130.5, 121.8, 119.5, 118.9, 118, 117.1, 112.8, 105.8, 81, 80.3, 61.9, 22.8

<sup>1</sup>H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (1H, m), 7.61 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 7.53 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.52 (1H, t br, J = 2.0 Hz), 7.44 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.05 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 7.0 (1H, d d d, J = 1.0, 2.5, 8.0 Hz), 5.11 (2H, s), 3.88 (2H, s), 1.61 (6H, s)

化合物No. 365 (融点: 154 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.6, 148.4, 139.9, 137.4, 130, 125.9, 118.8, 114.9, 113.4, 111.6, 56.8, 55.8, 31.3, 29, 25.2, 24.8

<sup>1</sup>H: 8.19 (1H, s br), 7.84 (1H, s br), 7.44 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.38 (1H, dd, J = 2.0, 8.6 Hz), 7.01 (1H, d, J = 8.6 Hz), 3.84 (3H, s), 3.80 (1H, br), 2.92 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.57 (3H, m br), 1.29 (2H, q br, J = 13.0 Hz), 1.11 (1H, q bbr, J = 13.0 Hz)

化合物No. 366 (融点: 135~136). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 156.8, 149.5, 145.4, 125.7, 124, 123.6, 82.4, 79.4, 62.5, 22.9

<sup>1</sup>H: 8.82 (1H, d d, J = 1.6, 4.5 Hz), 8.60 (1H, d d, J = 1.6, 8.4 Hz), 7.57 (1H, d d, J = 4.5, 8.4 Hz), 5.58 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.68 (6H, s)

化合物No. 367 (融点: 67~68). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 146.1, 144, 140.4, 133.3, 127.6, 119.1, 113.7, 82.5, 79.6, 62.1, 23, 22

<sup>1</sup>H: 8.02 (1H, br), 7.95 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.29 (1H, d d, J = 1.0, 8.5 Hz), 5.53 (2H, s), 3.89 (2H, s), 2.55 (3H, s), 1.68 (6H, s)

10

20

30

40

50

- 化合物No. 368 (融点: 111 ~ 112). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>  
13C: 152.2, 145.9, 144.3, 136.8, 129, 121, 81.9, 80, 62.1, 22.9  
1H: 8.88 (1H, d d, J = 1.0, 4.4 Hz), 8.46 (1H, d d, J = 1.0, 8.3 Hz), 7.48 (1H, d d, J = 4.4, 8.3 Hz), 5.37 (2H, s), 3.93 (2H, s), 1.72 (6H, s)
- 化合物No. 369 (融点: 84 ~ 85). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>  
13C: 147.4, 145.4, 132.6, 129.7, 125.6, 119.8, 114.3, 81.3, 80.5, 68.5, 65.8, 47.7, 45.7  
1H: 8.24 (1H, d, J = 8.3 Hz), 8.11 (1H, m, J = 1.0, 8.3 Hz), 7.63 (1H, m, J = 1.0, 7.2, 8.3 Hz), 7.49 (1H, m, J = 1.2, 7.2, 8.3 Hz), 5.50-5.30 (2H, 2 s), 4.20-3.91 (4H, 2 s) 10
- 化合物No. 370 (融点: 121 ~ 123). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>  
13C: 156.4, 146.2, 144.4, 140.7, 133, 131.2, 129.6, 129.5, 128.1, 120.9, 118.7, 114.6, 111.1, 82.5, 79.6, 62.1, 55.6, 23  
1H: 8.33 (1H, m), 8.09 (1H, d d, J = 0.7, 8.5 Hz), 7.67 (1H, d d, J = 1.5, 8.5 Hz), 7.39 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.38 (1H, m), 7.06 (1H, d t, J = 1.0, 7.5 Hz), 7.02 (1H, d, J = 8.4 Hz), 5.54 (2H, s), 3.90 (2H, s), 3.83 (3H, s), 1.68 (6H, s)
- 化合物No. 371 (融点: 134 ~ 136). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub> 20  
13C: 145.5, 144.6, 134.4, 128.2 (q, J = 33.0 Hz), 126.0 (q, J = 3.3 Hz), 123.7 (q, J = 273.0 Hz), 117.9 (q, J = 5.0 Hz), 115.5, 82.5, 79.6, 62.5, 22.9  
1H: 8.42 (1H, m), 8.38 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.85 (1H, d d, J = 1.5, 8.8 Hz), 5.55 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.69 (6H, s)
- 化合物No. 372 (融点: 157 ~ 159). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>  
13C: 162.9, 151.6, 146.5, 135.7, 133, 97.8, 87.1, 82.6, 79.6, 62.1, 56.2, 56.1, 23  
1H: 7.14 (1H, s), 6.42 (1H, s), 5.50 (2H, s), 4.05 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.88 (2H, s), 1.67 (6H, s) 30
- 化合物No. 373 (融点: 118 ~ 119). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>  
13C: 146.5, 145.1, 133.1, 129.4, 125.4, 119.8, 114.3, 96.5, 64, 49, 24.2  
1H: 8.18 (1H, m, J = 8.3 Hz), 8.11 (1H, m, J = 8.3 Hz), 7.62 (1H, m, J = 7.7 Hz), 7.48 (1H, m, J = 7.7 Hz), 4.29 (2H, m, J = 6.2 Hz), 4.15 (2H, m, J = 6.2 Hz), 1.81 (6H, s)
- 化合物No. 374 (融点: 143 ~ 144). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>  
13C: 149.8, 144.5, 134.9, 127.8 (q, J = 33.0 Hz), 125.7 (q, J = 3.3 Hz), 123.8 (q, J = 272.5 Hz), 117.9 (q, J = 4.5 Hz), 114.7, 58.9, 57.2, 32.5, 30.7, 30.2, 29.5, 25.5, 25.3  
1H: 8.41 (1H, m), 8.12 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.83 (1H, d d, J = 1.5, 8.8 Hz), 4.28 (1H, m), 3.19 (3H, s), 2.0 (2H, d, br), 1.90 (2H, br), 1.73 (1H, br), 1.64 (2H, m), 1.46 (2H, br), 1.18 (1H, br) 40
- 化合物No. 375 (融点: 102 ~ 104). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>  
13C: 150.7, 144.4, 139.6, 134.8, 132.2, 118.8, 113, 57.6, 32.4, 29.9, 25.5, 25.3, 20.9, 20.4  
1H: 7.81 (1H, s), 7.75 (1H, s), 4.24 (1H, m), 3.15 (3H, s), 2.43 (3H, s), 2.41 (3H, s), 1.98 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 1.87 (2H, br), 1.70 (1H, m), 1.61 (2H, 50

d q,  $J = 3.7, 12.5$  Hz), 1.40 (2H, br), 1.16 (1H, m)

化合物No. 376 (融点: 220 ~ 221 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

$^{13}\text{C}$ : 150.6, 142.3, 139.3, 138.1, 136.7, 126.2, 124.9, 116.2, 56.9, 31.4, 29, 25.2, 24.9

$^1\text{H}$ : 8.19 (2H, s), 8.04 (2H, d,  $J = 8.5$  Hz), 7.83 (2H, d,  $J = 8.5$  Hz), 7.37 (2H, s), 3.83 (1H, m br), 2.95 (3H, s), 1.80 (4H, m), 1.60 (3H, m), 1.31 (2H, m), 1.14 (1H, m)

化合物No. 377 (融点: 93 ~ 95). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

10

$^{13}\text{C}$ : 162.6, 151.6, 150.9, 136.1, 132.9, 97.3, 86.2, 58.9, 56.8, 56.2, 56, 32.7, 30.8, 29.5, 25.5, 25.3

$^1\text{H}$ : 6.89 (1H, d,  $J = 2.0$  Hz), 6.39 (1H, d,  $J = 2.0$  Hz), 4.25 (1H, m), 4.05 (3H, s), 3.88 (3H, s), 3.15 (3H, s), 1.98 (2H, d br,  $J = 12.0$  Hz), 1.87 (2H, br), 1.69 (1H, br), 1.60 (2H, d q,  $J = 3.4, 12.2$  Hz), 1.43 (2H, br), 1.15 (1H, m)

化合物No. 378 (融点: 118 ~ 119). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 145.4, 143.8, 139.8, 117.1, 82.4, 79.6, 62.3, 22.6, 21.1

$^1\text{H}$ : 7.61 (2H, s), 5.41 (2H, s), 3.88 (2H, s), 2.40 (6H, s), 1.67 (6H, s)

20

化合物No. 379 (融点: 175). NMR 溶媒: DMSO

$^{13}\text{C}$ : 150.9, 140.6, 139.2, 137.7, 133.4, 128.6, 128.3, 127.4, 127.3, 127.1, 124.7, 114.4, 75.6, 69.1, 56.1, 31.5, 30.8, 26.6

$^1\text{H}$ : 8.12 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 8.0 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.85 (2H, m d,  $J = 8.5$  Hz), 7.39 (2H, t,  $J = 7.6$  Hz), 7.35-7.29 (4H, m), 7.27 (1H, m), 7.25 (1H, m t,  $J = 7.3$  Hz), 4.51 (2H, s), 3.86 (1H, m), 3.33 (1H, m), 2.91 (3H, s), 2.13 (2H, d br,  $J = 11.5$  Hz), 1.81 (2H, d br,  $J = 12.5$  Hz), 1.68 (2H, d q,  $J = 2.5, 12.5$  Hz), 1.30 (2H, q br,  $J = 12.5$  Hz)

化合物No. 380 (融点: 207). NMR 溶媒: DMSO

30

$^{13}\text{C}$ : 155.1, 150.7, 139.6, 138, 136.2, 127.4, 125.5, 122.4, 115.9, 56.9, 31.4, 29, 25.2, 24.8

$^1\text{H}$ : 16.76 (1H, br), 8.18 (2H, m), 8.07 (4H, m), 3.83 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.58 (2H, m), 1.30 (2H, q br,  $J = 13.0$  Hz), 1.11 (1H, m,  $J = 12.9$  Hz)

化合物No. 381 (融点: 102 ~ 103). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 146.4, 144.5, 140.1, 135.3, 131.7, 118.9, 113.8, 82.5, 79.6, 62.1, 23, 20.9, 20.4

$^1\text{H}$ : 7.99 (1H, s), 7.82 (1H, s), 5.53 (2H, s), 3.89 (2H, s), 2.44 (3H, s), 2.42 (3H, s), 1.68 (6H, s)

40

化合物No. 382 (融点: 112 ~ 114). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 152.5, 149.2, 146.4, 139.7, 128.4, 98.6, 94.7, 82.6, 79.5, 62.1, 56.6, 56.2, 23

$^1\text{H}$ : 7.63 (1H, s), 7.39 (1H, s), 5.55 (2H, s), 4.04 (3H, s), 4.0 (3H, s), 3.89 (2H, s), 1.68 (6H, s)

化合物No. 383 (融点: 139). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 151.4, 142.2, 137, 132.8, 128.7, 127.6, 125.1, 113.1, 69.6, 56.4, 34.1,

50

31.7, 27.4

<sup>1</sup>H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.80 (2H, m d, J = 8.0 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, m t, J = 7.9 Hz), 7.30 (1H, m t, J = 7.5 Hz), 4.01 (1H, m), 3.62 (1H, m), 2.99 (3H, s), 2.11 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 1.90 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 1.71 (2H, d q, J = 3.0, 12.5 Hz), 1.46 (2H, d q, J = 3.5, 13.0 Hz)

化合物No. 384 (融点: 158 ~ 160). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 163.3, 151.7, 149.2, 134.4, 133.9, 97.6, 86.7, 69.5, 56.3, 56.2, 56.1, 24.3

<sup>1</sup>H: 7.43 (1H, s), 7.13 (1H, d, J = 2.0 Hz), 6.40 (1H, d, J = 2.0 Hz), 4.05 (3H, s), 3.90 (3H, s), 3.82 (2H, d, J = 5.5 Hz), 3.34 (1H, t, J = 5.5 Hz), 1.51 (6H, s) 10

化合物No. 385 (融点: 224 ~ 226). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.6, 146.1, 140.1, 137.3, 136, 132.6, 128, 124.4, 114.7, 80.6, 79.3, 60.9, 22.4

<sup>1</sup>H: 8.20 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.98 (1H, s br), 7.91 (4H, m), 7.36 (1H, s br), 5.19 (2H, s), 3.85 (2H, s), 1.50 (6H, s)

化合物No. 386 (融点: 183 ~ 185). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.8, 144.5, 136.6, 136.3, 126.9, 122.5, 115.2, 113.8, 80.7, 79.3, 62.5, 61.3, 54.6, 52.6, 22.3, 22.3, 21.3

<sup>1</sup>H: 10.83 (1H, s), 9.05 (1H, s br), 8.27 (1H, s), 7.89 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.10 (2H, d, J = 8.6 Hz), 5.21 (2H, s), 4.48 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.87 (2H, s), 3.49 (2H, m), 3.45 (2H, m), 2.99 (2H, m), 1.80 (4H, m), 1.69 (1H, d, J = 15.0 Hz), 1.51 (6H, s), 1.38 (1H, m) 20

化合物No. 387 (融点: 172 ~ 175). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.9, 144.2, 136.6, 135.7, 127, 122, 115.2, 114, 80.7, 79.3, 63.2, 62.4, 61.3, 54.7, 51.7, 22.3

<sup>1</sup>H: 11.69 (1H, s), 9.18 (1H, s), 8.31 (1H, s), 7.91 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.12 (2H, d, J = 8.6 Hz), 5.22 (2H, s), 4.51 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.96 (2H, d br, J = 12.6 Hz), 3.87 (2H, m), 3.87 (2H, s), 3.56 (2H, m), 3.49 (2H, d br, J = 12.4 Hz), 3.20 (2H, m), 1.51 (6H, s) 30

化合物No. 388 (融点: 218 ~ 220). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.6, 144.6, 136.6, 136.6, 126.8, 122.9, 115.3, 113.7, 80.7, 79.3, 62.4, 61.3, 54.5, 48.5, 39.5, 22.3

<sup>1</sup>H: 12.18 (1H, br), 9.89 (2H, s), 8.98 (1H, s), 8.24 (1H, s), 7.88 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.11 (2H, d, J = 8.9 Hz), 5.20 (2H, s), 4.48 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.86 (2H, s), 3.64 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.75 (4H, m), 2.50 (4H, br), 1.50 (6H, s) 40

化合物No. 389 (融点: 216 ~ 218). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 166.9, 145.4, 144.6, 133.7, 131.9, 129.1, 119, 113.9, 81.7, 78.7, 61.7, 22.5

<sup>1</sup>H: 8.71 (1H, d d, J = 0.8, 1.3 Hz), 8.26 (1H, s br), 8.21 (1H, d, J = 1.3, 8.6 Hz), 8.16 (1H, d d, J = 0.8, 8.6 Hz), 7.63 (1H, s br), 5.43 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.58 (6H, s)

化合物No. 390 (融点: 245 ~ 247). NMR 溶媒: DMSO

50

<sup>13</sup>C: 167.6, 150.7, 139.8, 137.9, 136.1, 132.5, 128, 124.3, 115.6, 56.8, 31.3, 29, 25.1, 24.8

<sup>1</sup>H: 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.97 (1H, s), 7.92 (2H, m), 7.89 (2H, m), 7.35 (1H, s), 3.82 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.59 (3H, m), 1.30 (2H, q br, J = 12.7 Hz), 1.11 (1H, q br, J = 13.0 Hz)

化合物No. 391 (融点: 165 (dec)). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 155.9, 154.1, 144.5, 137.7, 137.1, 136.9, 129.4, 128.9, 127.7, 124.7, 82.5, 79.6, 62.8, 22.6

<sup>1</sup>H: 9.21 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.40 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.68 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.56 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.50 (1H, t, J = 7.3 Hz), 5.50 (2H, s), 3.93 (2H, s), 1.71 (6H, s) 10

化合物No. 392 (融点: 120). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 156.2, 149.4, 145.6, 137.8, 136.8, 129.3, 128.9, 127.9, 126.1, 121, 82.5, 79.4, 62.6, 22.9

<sup>1</sup>H: 9.07 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.75 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.71 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.54 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.49 (1H, t, J = 7.4 Hz), 5.61 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.70 (6H, s) 20

化合物No. 393 (融点: 179 ~ 180). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 158.9, 144.2, 136.5, 135.9, 127, 121.3, 115, 113.7, 80.7, 79.3, 71.4, 61.3, 42.6, 33.1, 25.1, 22.2

<sup>1</sup>H: 9.25 (1H, d, J = 11.0 Hz), 9.17 (1H, s), 8.93 (1H, q, J = 9.5 Hz), 8.29 (1H, s), 7.88 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.06 (2H, d, J = 8.6 Hz), 5.22 (2H, s), 3.91 (2H, d, J = 6.2 Hz), 3.88 (2H, s), 3.28 (2H, d, J = 12.0 Hz), 2.89 (2H, q, J = 11.5 Hz), 2.08 (1H, m), 1.92 (2H, d, J = 13.0 Hz), 1.54 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.52 (6H, s)

化合物No. 394 (融点: 189 ~ 190). NMR 溶媒: DMSO 30

<sup>13</sup>C: 157.9, 148.9, 137, 135.5, 127, 122, 115.2, 114.7, 62.5, 57.2, 54.6, 52.6, 31.5, 28.8, 25, 24.8, 22.3, 21.2

<sup>1</sup>H: 10.86 (1H, br), 9.14 (1H, s), 8.28 (1H, s), 7.91 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.11 (2H, d, J = 9.0 Hz), 4.49 (2H, t, J = 5.2 Hz), 3.84 (1H, m), 3.48 (2H, m), 3.46 (2H, m), 2.99 (2H, m), 2.96 (3H, s), 1.80 (8H, m), 1.69 (1H, m), 1.58 (3H, m), 1.39 (1H, m), 1.30 (2H, m), 1.12 (1H, m)

化合物No. 395 (融点: 74 ~ 76). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 158, 148.7, 136.9, 134.8, 127.1, 121.3, 115.3, 115, 63.2, 62.5, 57.2, 54.7, 51.7, 31.5, 28.8, 25, 24.8 40

<sup>1</sup>H: 11.72 (1H, br), 9.32 (1H, s), 8.35 (1H, s), 7.94 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.15 (2H, d, J = 8.6 Hz), 4.53 (2H, t, J = 5.0 Hz), 3.97 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.90 (1H, m), 3.88 (2H, t br, J = 11.8 Hz), 3.57 (2H, m), 3.50 (2H, d br, J = 12.4 Hz), 3.21 (2H, m), 2.98 (3H, s), 1.80 (4H, m), 1.61 (3H, m), 1.33 (2H, m, J = 12.5 Hz), 1.14 (1H, m)

化合物No. 396 (融点: 180 ~ 181). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 159, 144.3, 136.5, 136, 127, 121.3, 115, 113.6, 80.7, 79.4, 65.3, 61.4, 43, 34.7, 30.4, 28.3, 22.3

<sup>1</sup>H: 9.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 9.04 (1H, m), 8.82 (1H, m), 8.25 (1H, d, J = 1. 50



3 Hz), 7.85 (2H, d, J = 9.0 Hz), 7.03 (2H, d, J = 9.0 Hz), 5.21 (2H, s), 4.06 (2H, t, J = 6.1 Hz), 3.87 (2H, s), 3.22 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 2.83 (2H, q br, J = 11.5 Hz), 1.85 (2H, d br, J = 14.0 Hz), 1.76 (1H, m), 1.68 (2H, m), 1.51 (6H, s), 1.41 (2H, d q, J = 4.0, 13.8 Hz)

化合物No. 397 (融点: 205 ~ 207). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.8, 148.8, 137, 135.3, 127, 121.9, 115.3, 114.8, 62.4, 57.2, 54.4, 48.4, 39.7, 31.5, 28.8, 25, 24.8

<sup>1</sup>H: 12.35 (1H, s br), 10.02 (2H, s), 9.21 (1H, s), 8.31 (1H, s), 7.92 (2H, d, J = 8.6 Hz), 7.14 (2H, d, J = 8.6 Hz), 4.50 (2H, t, J = 4.8 Hz), 3.81 (1H, m), 3.65 (2H, t, J = 4.8 Hz), 3.50 (8H, s br), 2.96 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.59 (3H, m), 1.31 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.12 (1H, q, J = 13.0 Hz)

10

化合物No. 398 (融点: 201 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 156.7, 151.2, 141, 137.3, 126.1, 124.5, 115.3, 112.5, 66.3, 54.1, 31.5, 29.1

<sup>1</sup>H: 9.46 (1H, s), 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 6.77 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 4.09 (1H, m), 3.93 (2H, d d, J = 4.3, 11.1 Hz), 3.73 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 2.94 (3H, s), 1.85 (2H, d q, J = 4.5, 12.2 Hz), 1.69 (2H, m d, J = 12.3 Hz)

20

化合物No. 399 (融点: 176 ~ 178). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.9, 144.9, 137.4, 136.9, 131.9, 130.2, 118.2, 114.9, 114.8, 111.1, 80.7, 79.3, 62.5, 61.2, 54.6, 52.6, 22.3, 22.3, 21.2

<sup>1</sup>H: 10.80 (1H, s), 8.83 (1H, s), 8.35 (1H, s), 7.59 (1H, br), 7.54 (1H, d br, J = 7.5 Hz), 7.39 (1H, t, J = 7.9 Hz), 6.96 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 5.21 (2H, s), 4.50 (2H, t, J = 5.2 Hz), 3.87 (2H, s), 3.46 (4H, m), 3.0 (2H, m), 1.80 (4H, m), 1.69 (1H, m), 1.51 (6H, s), 1.38 (1H, m)

化合物No. 400 (融点: 200 ~ 202). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 159, 148.8, 136.9, 135.3, 127, 121, 115, 114.6, 71.4, 57.2, 42.6, 33.1, 31.5, 28.8, 25.1, 25, 24.8

<sup>1</sup>H: 9.24 (1H, m), 9.22 (1H, s), 8.93 (1H, m), 8.29 (1H, s), 7.88 (2H, d, J = 8.9 Hz), 7.06 (2H, d, J = 8.9 Hz), 3.91 (2H, d, J = 6.3 Hz), 3.85 (1H, m), 3.27 (2H, d br, J = 12.4 Hz), 2.96 (3H, s), 2.88 (2H, q, J = 11.0 Hz), 2.07 (1H, m), 1.91 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 1.79 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.55 (2H, m), 1.31 (2H, m, J = 13.0 Hz), 1.12 (1H, m, J = 13.0 Hz)

30

化合物No. 401 (融点: 160 ~ 162). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.8, 145.1, 138.1, 136.9, 132.5, 130.1, 118.2, 114.7, 114.6, 111.1, 80.6, 79.3, 62.4, 61.1, 54.4, 48.5, 25.5, 22.3

<sup>1</sup>H: 12.23 (1H, s br), 9.84 (2H, s), 8.69 (1H, br), 8.29 (1H, s), 7.58 (1H, br), 7.53 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.38 (1H, t, J = 7.9 Hz), 6.97 (1H, d d, J = 1.8, 8.0 Hz), 5.20 (2H, s), 4.50 (2H, m), 3.86 (2H, s), 3.66 (2H, m), 3.50 (8H, br), 1.51 (6H, s)

40

化合物No. 402 (融点: 137 ~ 140). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.9, 144.6, 136.8, 136.6, 131.1, 130.2, 118.3, 115.2, 115.1, 111.2, 80.7, 79.3, 63.2, 62.5, 61.3, 54.7, 51.7, 22.3

<sup>1</sup>H: 11.70 (1H, s), 9.0 (1H, s), 8.41 (1H, s), 7.62 (1H, br), 7.56 (1H, d, J =

50

7.8 Hz), 7.40 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.0 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 5.22 (2H, s), 4.54 (2H, t, J = 4.7 Hz), 3.96 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.87 (2H, s), 3.87 (2H, m), 3.57 (2H, m), 3.51 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 3.22 (2H, m), 1.51 (6H, s)

化合物No. 403 (融点: 204~206). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.9, 150.8, 140.1, 137.7, 134.7, 133.5, 128.6, 127.3, 126.1, 123.9, 114.9, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.8

<sup>1</sup>H: 8.35 (1H, t, J = 1.5 Hz), 8.15 (1H, d, J = 1.2 Hz), 8.06 (1H, d, J = 1.2 Hz), 8.03 (1H, s br), 7.98 (1H, d t, J = 1.5, 7.9 Hz), 7.75 (1H, d t, J = 1.5, 7.9 Hz), 7.47 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.42 (1H, s br), 3.83 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, m), 1.11 (1H, m)

10

化合物No. 404 (融点: 198~200). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.9, 140.3, 137.9, 137.3, 133.3, 128.4, 125.5, 115.2, 66.1, 57.7, 46, 31.4, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.97 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.64 (1H, d, J = 1.3 Hz), 3.95 (1H, m, J = 11.5 Hz), 3.75 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.02 (4H, m, J = 5.0 Hz), 3.01 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.72 (1H, m), 1.59 (2H, d q, J = 3.5, 12.3 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.3, 13.0 Hz), 1.14 (1H, t q, J = 3.5, 13.2 Hz)

20

化合物No. 405 (融点: 152~154). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 159, 144.7, 137.2, 136.8, 131.5, 130.1, 117.6, 114.9, 114.9, 110.9, 80.7, 79.3, 71.4, 61.2, 42.6, 33.2, 25.2, 22.3

<sup>1</sup>H: 9.14 (1H, m), 8.89 (1H, s), 8.85 (1H, m), 8.34 (1H, s), 7.52 (1H, br), 7.49 (1H, m), 7.35 (1H, t, J = 7.8 Hz), 6.91 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 5.20 (2H, s), 3.92 (2H, d, J = 6.5 Hz), 3.86 (2H, s), 3.28 (2H, d br, J = 12.2 Hz), 2.89 (2H, q br, J = 11.5 Hz), 2.08 (1H, m), 1.93 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 1.52 (2H, m), 1.51 (6H, s)

30

化合物No. 406 (融点: 190~191). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.8, 150.6, 140.2, 137.7, 133.9, 131.8, 125.6, 124.4, 114.8, 56.8, 31.3, 29, 25.2, 24.8

<sup>1</sup>H: 9.64 (1H, s), 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.04 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.84 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.69 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 5.82 (2H, s), 3.81 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.59 (2H, m), 1.57 (1H, m), 1.29 (2H, q br, J = 12.8 Hz), 1.11 (1H, q br, J = 12.9 Hz)

化合物No. 407 (融点: hygroscopic). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.9, 149.3, 137.4, 136.4, 131.1, 130.3, 118.4, 116, 115.2, 111.4, 62.6, 57.2, 54.5, 48.5, 39.7, 31.6, 28.9, 25.1, 24.8

<sup>1</sup>H: 12.09 (1H, br), 9.87 (2H, s), 8.97 (1H, s), 8.37 (1H, s), 7.62 (1H, br), 7.55 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.41 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.01 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 4.50 (2H, m), 3.90 (1H, m), 3.70 (4H, br), 3.67 (2H, m), 3.50 (4H, m), 2.96 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.31 (2H, m), 1.14 (1H, m)

40

化合物No. 408 (融点: 124~127). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 158, 148.8, 137.3, 135.4, 130.3, 130.2, 118.4, 116.3, 115.5, 111.4, 63.2, 62.6, 57.2, 54.7, 51.7, 31.6, 28.8, 25, 24.8

<sup>1</sup>H: 11.80 (1H, s), 9.21 (1H, s br), 8.48 (1H, s), 7.67 (1H, br), 7.58 (1H, d,

50

J = 7.5 Hz), 7.42 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.02 (1H, d d, J = 1.5, 8.1 Hz), 4.55 (2H, m), 3.96 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 3.90 (1H, m), 3.87 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 3.58 (2H, m), 3.51 (2H, d br, J = 12.1 Hz), 3.22 (2H, m), 2.97 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.59 (3H, m), 1.32 (2H, m), 1.12 (1H, m)

化合物No. 409 (融点: 183). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 164, 151.1, 140.7, 137.8, 133.3, 132.4, 130.6, 128.8, 128.7, 128.7, 127.1, 124.8, 114.4, 59.5, 53.1, 50.8, 31.6, 25.8

<sup>1</sup>H: 8.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.49-7.40 (5H, m), 7.39 (2H, t, J = 7.7 Hz), 7.26 (1H, m t, J = 7.5 Hz), 4.05 (2H, s), 4.05 (1H, m), 3.26 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 2.94 (3H, s), 2.81 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 2.08 (2H, d q, J = 3.3, 12.7 Hz), 1.90 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

10

化合物No. 410 (融点: 177 ~ 178). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 149.6, 137.6, 136.6, 131.4, 129.9, 129.6, 129.5, 129, 128.8, 128.5, 125.3, 115.6, 58.7, 52.3, 50.2, 31.6, 24.6

<sup>1</sup>H: 11.36 (1H, s br), 9.0 (1H, s), 8.31 (1H, s), 7.92 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.64 (2H, m), 7.50-7.43 (5H, m), 7.37 (1H, m t, J = 7.7 Hz), 4.26 (2H, d, J = 5.0 Hz), 4.20 (1H, m), 3.39 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.09 (2H, q br, J = 12.0 Hz), 2.97 (3H, s), 2.43 (2H, d q, J = 3.3, 13.0 Hz), 1.95 (2H, d br, J = 13.0 Hz)

20

化合物No. 411 (融点: 191 ~ 192). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.2, 140.7, 137.8, 133.3, 131.3, 129.7, 129, 128.7, 127.2, 124.8, 114.4, 59.2, 52.2, 50.7, 39.8, 31.8, 25.2

<sup>1</sup>H: 9.42 (1H, s br), 8.14 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (2H, m d, J = 8.3 Hz), 7.50 (5H, m), 7.39 (2H, t, J = 8.0 Hz), 7.26 (1H, m t, J = 7.3 Hz), 4.29 (1H, m), 4.29 (2H, s br), 3.44 (2H, m, J = 12.3 Hz), 3.13 (2H, m), 2.93 (3H, s), 2.35 (3H, s), 2.12 (2H, q br, J = 13.5 Hz), 2.0 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

30

化合物No. 412 (融点: 178). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 175.7, 171.4, 151.1, 140.7, 137.7, 135.7, 133.4, 129.7, 128.7, 128.5, 127.9, 127.2, 124.8, 114.4, 72, 60.8, 54.5, 51.7, 43.4, 31.6, 27.2

<sup>1</sup>H: 8.13 (1H, s br), 8.00 (1H, s, br), 7.84 (2H, d, J = 7.9 Hz), 7.43-7.30 (7H, m), 7.26 (1H, t, J = 7.5 Hz), 3.93 (1H, m), 3.73 (2H, s), 3.07 (2H, d br, J = 11.0 Hz), 2.93 (3H, s), 2.68 (2H, d br, J = 15.3 Hz), 2.58 (2H, d, J = 15.3 Hz), 2.37 (2H, t br, J = 12.5 Hz), 1.92 (2H, q br, J = 12.5 Hz), 1.80 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

40

化合物No. 413 (融点: 195). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 173.4, 151, 140.6, 137.7, 137.3, 133.4, 129.2, 128.6, 128.3, 127.3, 127.1, 124.7, 114.4, 72.1, 61.4, 55, 52, 31.5, 27.8

<sup>1</sup>H: 8.12 (1H, s), 8.0 (1H, s), 7.84 (2H, d br, J = 7.7 Hz), 7.38 (2H, t, J = 7.6 Hz), 7.35-7.28 (5H, m), 7.25 (1H, m t, J = 7.5 Hz), 4.24 (2H, s), 3.87 (1H, m), 3.58 (2H, s), 2.96 (2H, m), 2.94 (3H, s), 2.15 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.87 (2H, q br, J = 12.3 Hz), 1.76 (2H, d br, J = 11.0 Hz)

化合物No. 414 (融点: 192). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151, 140.6, 137.7, 136.8, 133.4, 129.3, 128.6, 128.4, 127.5, 127.1, 124.

50

8, 114.4, 61.2, 54.9, 51.8, 31.5, 27.6

<sup>1</sup>H: 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.0 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.85 (2H, m d, J = 8.3 Hz), 7.39 (2H, t, J = 7.5 Hz), 7.36-7.27 (5H, m), 7.23 (1H, m t, J = 7.4 Hz), 3.89 (1H, m), 3.62 (2H, s), 2.99 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 2.94 (3H, s), 2.21 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.91 (2H, d q, J = 3.3, 12.2 Hz), 1.77 (2H, d br, J = 11.8 Hz)

化合物No. 415 (融点: 175). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151, 140.5, 138.3, 137.4, 137.3, 134.5, 128.4, 128.2, 127.6, 127.4, 125.4, 115, 71.9, 69.8, 57.7, 43.3, 31.4, 30.2, 30, 25.4, 25.2

10

<sup>1</sup>H: 7.95 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.78 (2H, m, J = 8.0 Hz), 7.62 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34-7.21 (5H, m), 4.46 (2H, s), 3.95 (1H, m), 3.46 (1H, m), 3.29 (2H, m), 3.0 (3H, s), 2.96 (2H, m), 1.90 (2H, m), 1.87 (4H, m), 1.80 (2H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.3 Hz), 1.60 (2H, d q, J = 3.5, 13.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.5, 13.3 Hz), 1.14 (1H, t q, J = 3.5, 13.2 Hz)

化合物No. 416 (融点: 176 ~ 177). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.2, 148.6, 146.7, 139.3, 138, 137.3, 132.4, 129.1, 129, 128.3, 127.2, 123.6, 113.9, 62.8, 55.9, 52.5, 31.7, 28.9

20

<sup>1</sup>H: 9.0 (1H, d d, J = 0.7, 2.2 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.7, 4.9 Hz), 8.12 (1H, d t, J = 1.7, 7.9 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.58 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.35 (1H, m), 7.34-7.24 (5H, m), 4.02 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.11 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物No. 417 (融点: 112 ~ 113). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.4, 148.5, 146.6, 139.2, 137.3, 132.4, 129, 123.6, 114, 59.4, 31.2, 28.9, 24.3

<sup>1</sup>H: 9.01 (1H, d, J = 1.7 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.5, 4.8 Hz), 8.12 (1H, t d, J = 2.0, 7.9 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d, J = 4.8, 7.9 Hz), 4.44 (1H, qt, J = 8.2 Hz), 3.0 (3H, s), 1.96 (2H, m), 1.77 (2H, m), 1.70 (2H, m), 1.63 (2H, m)

30

化合物No. 418 (融点: 138 ~ 140). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.9, 151.5, 142.1, 138, 136.9, 134.3, 129.7, 129.1, 128.3, 127.2, 117.5, 113.7, 113.4, 110.1, 62.8, 55.8, 55.3, 52.5, 31.6, 28.9

<sup>1</sup>H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d d, J = 1.4, 2.4 Hz), 7.38-7.24 (6H, m), 7.31 (1H, t, J = 7.6 Hz), 6.86 (1H, d d d, J = 1.2, 2.5, 7.9 Hz), 4.02 (1H, m), 3.88 (3H, s), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.3, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

40

化合物No. 419 (融点: 190 ~ 191). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.2, 151.6, 142.1, 138, 136.8, 129.1, 128.3, 127.2, 126.4, 125.8, 114.1, 112, 62.8, 55.8, 55.3, 52.5, 31.6, 28.9

<sup>1</sup>H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 7.39 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.23 (5H, m), 6.85 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 4.03 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.6, 12.0 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 13.0 Hz)

50

化合物No. 420 (融点: 190~191). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 158.4, 151.6, 142.1, 138, 136.9, 136.8, 129.1, 128.6, 128.3, 128, 127.5, 127.2, 126.4, 126, 115, 112.1, 70, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

<sup>1</sup>H: 7.89 (1H, s), 7.72 (2H, m d, J = 8.6 Hz), 7.45 (2H, d, J = 7.5 Hz), 7.40 (2H, m), 7.38 (1H, s), 7.37-7.23 (6H, m), 7.02 (2H, m d, J = 8.6 Hz), 5.10 (2H, s), 4.01 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.01 (3H, s), 2.99 (2H, m), 2.09 (2H, t br, J = 10.7 Hz), 1.93 (2H, q br, J = 12.5 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

化合物No. 421 (融点: 165~166). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.9, 137.6, 137.6, 136.9, 136, 132.8, 125.9, 122.6, 115.3, 59.4, 31.2, 28.9, 24.3

<sup>1</sup>H: 8.67 (1H, t br, J = 1.5 Hz), 8.13 (1H, d d d, J = 1.7, 6.5 Hz), 7.98 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.71 (1H, t d, J = 1.2, 8.0 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.31 (1H, d d, J = 6.5, 8.0 Hz), 4.40 (1H, qt, J = 8.0 Hz), 3.0 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.77 (2H, m), 1.69 (2H, m), 1.63 (2H, m)

10

化合物No. 422 (融点: 197). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.6, 139.0, 138.8, 138.4, 138.2, 127.5, 125.2, 116.8, 56.8, 43.6, 31.3, 29.0, 25.1, 24.8

<sup>1</sup>H: 8.26 (1H, s), 8.20 (1H, s), 8.11 (2H, d, J = 8.5 Hz), 7.93 (2H, d, J = 8.5 Hz), 3.81 (1H, m), 3.22 (3H, s), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q br, J = 12.7 Hz), 1.12 (1H, m)

20

化合物No. 423 (融点: 179). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 164.1, 150.9, 140.1, 138.5, 137.8, 133.6, 133.5, 128.8, 128.7, 128.2, 127, 127, 125.4, 123.2, 114.9, 61.9, 55.5, 52.2, 31.5, 28.2

<sup>1</sup>H: 11.20 (1H, br), 9.15 (1H, br), 8.23 (1H, br), 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.95 (1H, m d, J = 7.8 Hz), 7.62 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.36-7.21 (5H, m), 3.83 (1H, m), 3.47 (2H, s), 2.95 (3H, s), 2.90 (2H, d br, J = 11.2 Hz), 2.0 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.83 (2H, d q, J = 3.3, 11.9 Hz), 1.73 (2H, d br, J = 12.3 Hz)

30

化合物No. 424 (融点: 176). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 163.8, 149.2, 137.8, 136.1, 133.6, 130, 129.2, 127.8, 126.6, 124, 116.1, 57.1, 31.5, 28.8, 25.1, 24.8

<sup>1</sup>H: 11.31 (1H, br), 9.0 (1H, s), 8.37 (1H, s), 8.27 (1H, t br, J = 1.5 Hz), 8.0 (1H, t d, J = 1.5, 7.7 Hz), 7.73 (1H, t d, J = 1.4, 7.8 Hz), 7.56 (1H, t, J = 7.7 Hz), 3.86 (1H, m), 2.98 (3H, s), 1.81 (4H, m), 1.60 (3H, m), 1.32 (2H, q br, J = 12.8 Hz), 1.13 (1H, q br, J = 13.0 Hz)

40

化合物No. 425 (融点: 140~142). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.1, 144.6, 140.2, 137.2, 137, 133.6, 132.1, 129, 127.8, 127.1, 122.9, 121.2, 114.7, 112.5, 57.6, 47.2, 31.5, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 8.61 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.50 (1H, t, J = 5.7 Hz), 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.89 (1H, d d, J = 2.2, 9.0 Hz), 7.43 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42-7.29 (5H, m), 6.89 (1H, d, J = 9.0 Hz), 4.61 (2H, d, J = 5.7 Hz), 3.96 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.60 (2H, m), 1.39 (2H, q br, J = 13.0 Hz), 1.13 (1H, m, J = 3.5, 13.2 Hz)

化合物No. 426 (融点: 261). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

50

<sup>13</sup>C: 155.4, 151.1, 141.6, 137.1, 136.2, 130, 128.8, 128.4, 127.7, 127.3, 126.8, 118.5, 112.6, 108.6, 106.4, 57.6, 44.5, 31.5, 29.9, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 9.87 (1H, s), 8.17 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.74 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.45 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.39 (1H, d d, J = 1.4, 8.2 Hz), 7.36-7.25 (5H, m), 6.87 (1H, d, J = 8.2 Hz), 5.10 (2H, s), 3.97 (1H, m), 3.02 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.70 (1H, m), 1.58 (2H, q br, J = 13.0 Hz), 1.38 (2H, q br, J = 13.0 Hz), 1.13 (1H, q br, J = 12.8 Hz)

化合物No. 427 (融点: 204~205). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.6 (d d, J = 13.0, 247.5 Hz), 151.2, 149.8 (d d, J = 12.0, 248.0 Hz), 140.4, 138, 137, 130.2 (d d, J = 4.0, 6.5 Hz), 129.1, 128.3, 127.2, 121.0 (d d, J = 3.5, 6.2 Hz), 117.5 (d, J = 17.5 Hz), 114.2 (d, J = 19.0 Hz), 113.5, 62.8, 55.9, 52.5, 31.7, 28.9

<sup>1</sup>H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 2.2, 7.2, 11.5 Hz), 7.50 (1H, m), 7.46 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.25 (5H, m), 7.18 (1H, d t, J = 8.4, 10.2 Hz), 4.02 (1H, m), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物No. 428 (融点: 222~223). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.3, 141.2, 138, 137, 133.1, 131.5, 129.1, 128.8, 128.3, 127.2, 126.4, 113.4, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

<sup>1</sup>H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.37 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.35-7.25 (5H, m), 4.02 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.93 (2H, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物No. 429 (融点: 203~204). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.4, 150.5, 141.2, 138, 137, 130.4, 129.1, 128.3, 127.2, 126.6, 119.7, 115.9, 113.2, 62.8, 55.9, 52.5, 31.6, 28.9

<sup>1</sup>H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.47 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.25 (5H, m), 7.16 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 6.54 (1H, t, J = 74.0 Hz), 4.03 (1H, m), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

化合物No. 430 (融点: 211~212). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.3 (d, J = 247.0 Hz), 151.4, 141.4, 138, 136.9, 129.2 (d, J = 3.5 Hz), 129.1, 128.3, 127.2, 126.8 (d, J = 8.0 Hz), 115.6 (d, J = 21.5 Hz), 112.9, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

<sup>1</sup>H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.76 (2H, m, J = 5.3, 8.8 Hz), 7.45 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.25 (5H, m), 7.10 (2H, m t, J = 8.9 Hz), 4.03 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 10.5 Hz)

化合物No. 431 (融点: 190~191). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.3, 151.2, 148.5, 146.7, 139.2, 137.2, 132.4, 129, 128.7, 123.6, 114, 113.7, 103.8, 56.2, 55.8, 52.1, 48.9, 31.5, 29.1

<sup>1</sup>H: 9.0 (1H, d, J = 1.8 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.5, 4.8 Hz), 8.11 (1H, t d, J = 1.8, 7.9 Hz), 7.92 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.34 (1H, d d, J = 4.8, 7.9 Hz), 7.22 (1H, t, J = 8.3 Hz), 6.57 (2H, d, J = 8.3 Hz), 3.91 (1H, m), 3.81 (6H, s), 3.71 (2H, s), 3.09 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.0 (3H, s),

10

20

30

40

50

2.20 (2H, t br,  $J = 11.6$  Hz), 1.94 (2H, d q,  $J = 3.2, 12.0$  Hz), 1.72 (2H, d br,  $J = 12.0$  Hz)

化合物No. 432 (融点: 190 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

$^{13}\text{C}$ : 150.4, 139.1, 137.9, 137.7, 133.4, 127.8, 125, 116.3, 63.8, 56.7, 43.1, 32.8, 31.2, 29, 25.1, 24.8

$^1\text{H}$ : 8.24 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 8.19 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 8.09 (2H, m d,  $J = 8.5$  Hz), 7.73 (2H, m d,  $J = 8.5$  Hz), 4.68 (1H, d,  $J = 4.0$  Hz), 3.81 (1H, m br), 3.51 (1H, m), 3.16 (2H, m), 2.93 (3H, s), 2.71 (2H, m), 1.78 (4H, m), 1.73 (2H, m), 1.58 (3H, m), 1.42 (2H, m), 1.30 (2H, q br,  $J = 12.8$  Hz), 1.12 (1H, q br,  $J = 12.5$  Hz)

10

化合物No. 433 (融点: 161 ~ 162). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 151.6, 149.1, 148.6, 142.1, 138, 136.7, 129.1, 128.3, 127.2, 126.1, 117.4, 112.3, 111.3, 108.4, 62.8, 55.9, 55.9, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

$^1\text{H}$ : 7.90 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.42 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.40 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 7.37-7.24 (5H, m), 7.30 (1H, d d,  $J = 1.9, 8.3$  Hz), 6.91 (1H, d,  $J = 8.3$  Hz), 4.03 (1H, m), 3.97 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br,  $J = 11.5$  Hz), 1.94 (2H, d q,  $J = 3.2, 11.8$  Hz), 1.79 (2H, d br,  $J = 11.8$  Hz)

20

化合物No. 434 (融点: 126 ~ 128). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 150.7, 142.2, 136.8, 133, 128.7, 127.5, 125.1, 113.1, 56.2, 42.2, 35.3, 31, 25.9, 25.4, 24.4, 23.7, 19.9

$^1\text{H}$ : 7.88 (1H, s), 7.81 (2H, d,  $J = 7.8$  Hz), 7.46 (1H, s), 7.41 (2H, t,  $J = 7.7$  Hz), 7.30 (1H, t,  $J = 7.4$  Hz), 4.19 (1H, s br), 3.91 (1H, s br), 3.14 (1H, t,  $J = 12.7$  Hz), 2.10-1.20 (13H, m)

化合物No. 435 (融点: 127 ~ 128). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 151.2, 145.3, 140.4, 139.1, 137, 130, 123.4, 123.2, 118.3, 112.6, 57.5, 42.5, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

30

$^1\text{H}$ : 8.18 (1H, d,  $J = 2.2$  Hz), 7.89 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.85 (1H, d d,  $J = 2.2, 8.8$  Hz), 7.43 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.06 (1H, d,  $J = 8.8$  Hz), 3.95 (1H, m), 3.0 (3H, s), 2.93 (6H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.70 (1H, d br,  $J = 13.0$  Hz), 1.58 (2H, d q,  $J = 3.4, 12.2$  Hz), 1.38 (2H, t q,  $J = 3.0, 13.0$  Hz), 1.13 (1H, t q,  $J = 3.5, 13.2$  Hz)

化合物No. 436 (融点: 215 ~ 217). NMR 溶媒: DMSO

$^{13}\text{C}$ : 166.6, 145.3, 144.6, 134.6, 130, 128.6, 121.5, 114.3, 81.7, 78.7, 61.7, 22.5

40

$^1\text{H}$ : 13.38 (1H, br), 8.70 (1H, s), 8.24 (1H, d,  $J = 9.0$  Hz), 8.19 (1H, d,  $J = 9.0$  Hz), 5.43 (2H, s), 3.90 (2H, s), 1.58 (6H, s)

化合物No. 437 (融点: 181). NMR 溶媒: DMSO

$^{13}\text{C}$ : 163.6, 144.4, 144.3, 142.8, 135.9, 132.7, 129.1, 128.4, 128.4, 127.3, 119.5, 118.7, 81.6, 78.7, 77.1, 61.8, 22.2

$^1\text{H}$ : 12.06 (1H, br), 8.39 (1H, s), 8.11 (1H, d,  $J = 9.0$  Hz), 7.87 (1H, d,  $J = 9.0$  Hz), 7.49 (2H, d,  $J = 7.0$  Hz), 7.41 (3H, m), 5.29 (2H, s), 4.98 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.57 (6H, s)

50

化合物No. 438 (融点: 194). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 155.6, 151.2, 150.8, 139.6, 137.7, 129.3, 126.7, 125.6, 114, 112.5, 112.4, 56.8, 56, 31.4, 29, 25.2, 24.9

<sup>1</sup>H: 16.04 (1H, br), 8.58 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.13 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.04 (1H, d d, J = 2.2, 8.9 Hz), 7.31 (1H, d, J = 8.9 Hz), 3.99 (3H, s), 3.82 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.11 (1H, q, J = 13.0 Hz)

化合物No. 439 (融点: 226 ~ 228 (DEC.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 154.5, 151.9, 150.9, 139.9, 137.6, 129.1, 125.4, 125.2, 116.7, 113.4, 110.8, 56.8, 31.3, 29, 25.2, 24.9

<sup>1</sup>H: 16.0 (1H, br), 11.14 (1H, br), 8.48 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.95 (1H, s br), 7.87 (1H, d d, J = 2.2, 8.5 Hz), 7.09 (1H, d, J = 8.5 Hz), 3.82 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.57 (3H, m), 1.30 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.11 (1H, q, J = 13.0 Hz)

化合物No. 440 (融点: 104 ~ 105). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 163.3, 144.4, 144.2, 142.9, 133.2, 127.4, 119.3, 118.1, 81.6, 78.7, 61.8, 22.2

<sup>1</sup>H: 11.56 (1H, br), 9.27 (1H, s br), 8.39 (1H, s), 8.10 (1H, d, J = 9.1 Hz), 7.89 (1H, d, J = 9.1 Hz), 5.29 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.57 (6H, s)

化合物No. 441 (融点: 169 ~ 170). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 152.2, 151.2, 139.9, 139.6, 138, 137.2, 130.7, 129.1, 128.3, 127.2, 126, 122.3, 113.8, 113.3, 62.8, 56.6, 55.9, 52.5, 31.7, 28.8

<sup>1</sup>H: 8.24 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.0 (1H, d d, J = 2.2, 8.8 Hz), 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.25 (5H, m), 7.13 (1H, d, J = 8.8 Hz), 4.03 (1H, m), 4.0 (3H, s), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.11 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物No. 442 (融点: 162). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.9 (d, J = 246.0 Hz), 151.4, 147.8 (d, J = 11.2 Hz), 141.5, 138, 136.8, 129.6 (d, J = 4.0 Hz), 129.1, 128.3, 127.2, 117.3 (d, J = 7.0 Hz), 116.2 (d, J = 18.5 Hz), 113.1, 110.4 (d, J = 1.7 Hz), 62.8, 56.2, 55.9, 52.5, 31.7, 28.9

<sup>1</sup>H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (1H, d d, J = 1.8, 8.3 Hz), 7.46 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.27 (5H, m), 7.24 (1H, m), 7.09 (1H, d d, J = 8.5, 11.0 Hz), 4.03 (1H, m), 3.97 (3H, s), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 11.8 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.0, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 11.5 Hz)

化合物No. 443 (融点: 188 ~ 189). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 152.5 (d, J = 245.0 Hz), 151.4, 147.1 (d, J = 11.0 Hz), 141.1 (d, J = 2.5 Hz), 138, 136.9, 129.1, 128.3, 127.2, 126.5 (d, J = 7.2 Hz), 120.9 (d, J = 3.5 Hz), 113.5 (d, J = 2.5 Hz), 113.1 (d, J = 19.7 Hz), 112.6, 62.8, 56.3, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

<sup>1</sup>H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.53 (1H, m), 7.50 (1H, d d, J = 2.5, 8.5 Hz), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.23 (5H, m), 6.99 (1H, t, J = 8.4 Hz), 4.02 (1H, m), 3.92 (3H, s), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 11.8 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.78 (2H, m)

10

20

30

40

50



化合物No. 444 (融点: 168). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.6, 153.8, 151.1, 140.6, 137.5, 137.1, 128.5, 127.9, 127.8, 126.3, 126.1, 114.9, 113.2, 78.8, 69.2, 55.1, 43, 42.2, 31.7, 28.1(2 sig.)

<sup>1</sup>H: 8.09 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.77 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.46 (2H, d, J = 8.4 Hz), 7.40 (2H, t, J = 7.4 Hz), 7.33 (1H, t, J = 7.3 Hz), 7.03 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 5.12 (2H, s), 4.03 (3H, m), 2.92 (3H, s), 2.79 (2H, br), 1.76 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 1.66 (2H, d q, J = 4.3, 12.1 Hz), 1.41 (9H, s)

10

化合物No. 445 (融点: 170 ~ 171). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 160.4, 151.1, 140, 137.1, 131.1, 130.3, 126.5, 116.3, 113, 111.6, 102, 57.6, 56.2, 31.4, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.98 (1H, d d, J = 2.2, 8.5 Hz), 7.97 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.02 (1H, d, J = 8.5 Hz), 3.96 (3H, s), 3.95 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.71 (1H, m), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.5, 13 Hz)

化合物No. 446 (融点: 176 ~ 177). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 160.5, 151.2, 140.1, 138, 137.1, 131.1, 130.3, 129.1, 128.3, 127.2, 126.4, 116.3, 112.9, 111.6, 102, 62.8, 56.2, 55.9, 52.5, 31.7, 28.9

<sup>1</sup>H: 7.98 (1H, d d, J = 2.2, 8.5 Hz), 7.97 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.44 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37-7.23 (5H, m), 7.01 (1H, d, J = 8.5 Hz), 4.01 (1H, m), 3.96 (3H, s), 3.53 (2H, s), 3.03 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

20

化合物No. 447 (融点: 103 ~ 105). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.5, 142.3, 141.4, 140.3, 136.8, 128.9, 119.4, 115.4, 112.4, 112, 57.5, 43.6, 31.3, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.38 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.22 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.15 (1H, d d, J = 2.2, 8.1 Hz), 7.03 (1H, d, J = 8.1 Hz), 4.03 (2H, br), 3.94 (1H, m), 2.99 (3H, s), 2.69 (6H, s), 1.85 (4H, m), 1.70 (1H, d br, J = 14.0 Hz), 1.58 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.37 (2H, m q, J = 13.0 Hz), 1.13 (1H, m q, J = 13.0 Hz)

30

化合物No. 448 (融点: 180 ~ 182). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 155.1, 150.2, 137.9, 137.6, 137.5, 136.2, 132.5, 126, 122.7, 115, 62.1, 46.4, 43.3, 14.6

<sup>1</sup>H: 8.68 (1H, s br), 8.15 (1H, d, J = 6.3 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.71 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.33 (1H, d d, J = 6.3, 8.0 Hz), 4.20 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.64 (8H, m), 1.30 (3H, t, J = 7.2 Hz)

40

化合物No. 449 (融点: 110 ~ 112). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.8, 137.6, 137.6, 136.9, 136, 132.7, 125.9, 122.7, 115.3, 50.6, 36.4, 29.3, 19.8, 13.7

<sup>1</sup>H: 8.67 (1H, t, J = 1.5 Hz), 8.14 (1H, d d d, J = 1.0, 1.6, 6.4 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.71 (1H, t d, J = 1.3, 8.1 Hz), 7.58 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.32 (1H, d d, J = 6.4, 8.1 Hz), 3.46 (2H, t, J = 7.6 Hz), 3.13 (3H, s), 1.68 (2H, m), 1.37 (2H, m), 0.97 (3H, t, J = 7.4 Hz)

50

化合物No. 450 (融点: 122 ~ 123). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.1, 145.9, 141.4, 137.6, 137.2, 126.2, 113.2, 112.6, 110.7, 110.6, 55.7, 55.4, 45.4, 31.4, 29.5

<sup>1</sup>H: 8.03 (1H, s), 7.68 (1H, s), 7.14 (1H, d, J = 1.8 Hz), 7.0 (1H, d d, J = 1.8, 8.2 Hz), 6.79 (1H, d, J = 8.2 Hz), 4.73 (2H, s br), 3.88 (1H, m), 3.76 (3H, s), 3.01 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 2.93 (3H, s), 2.47 (2H, m), 1.67 (4H, m)

化合物No. 451 (融点: 170 ~ 172). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.6, 150.2, 138.3, 137.3, 131.4, 129.7, 129.7, 129, 126.7, 121.6, 115.7, 113.3, 59.1, 52.3, 50.6, 31.9, 25

<sup>1</sup>H: 9.62 (2H, m br), 8.67 (1H, s), 8.0 (1H, s), 7.65 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.55 (2H, m), 7.49 (3H, m), 6.82 (2H, d, J = 8.2 Hz), 4.32 (2H, m), 4.18 (1H, m), 3.45 (2H, m), 3.16 (2H, m), 2.94 (3H, s), 2.19 (2H, q br, J = 12.0 Hz), 2.0 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物No. 452 (融点: 74 ~ 76). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.3, 137.6, 137.3, 136.9, 136, 132.7, 125.9, 122.8, 115.1, 42.8, 13.2

<sup>1</sup>H: 8.67 (1H, t br, J = 1.3 Hz), 8.14 (1H, d, J = 6.4 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.32 (1H, d d, J = 6.4, 8.0 Hz), 3.49 (4H, q, J = 7.2 Hz), 1.31 (6H, t, J = 7.2 Hz)

化合物No. 453 (融点: 130 ~ 132). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 149.6, 147.8, 145.7, 142.8, 138.2, 137.1, 132.2, 129.9, 129, 127.7, 126.3, 124, 115.6, 39.6

<sup>1</sup>H: 8.87 (1H, d d, J = 0.8, 2.2 Hz), 8.43 (1H, d d, J = 1.7, 4.9 Hz), 8.04 (1H, t d, J = 1.9, 8.0 Hz), 7.81 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.45-7.28 (6H, m), 3.43 (3H, s)

化合物No. 454 (融点: 170 ~ 172). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.2 (d, J = 240.0 Hz), 151.1, 144.0 (d, J = 12.2 Hz), 140.0 (d, J = 2.5 Hz), 137.6, 131.4, 129.7 (2 sig.), 128.9, 125.2 (d, J = 7.0 Hz), 121.1 (d, J = 2.5 Hz), 117.9 (d, J = 3.0 Hz), 113.5, 112.5 (d, J = 20.0 Hz), 59.0, 52.1, 50.6, 31.7, 25.1

<sup>1</sup>H: 9.91 (1H, s), 9.57 (1H, m), 8.10 (1H, s), 7.90 (1H, s), 7.58 (1H, m), 7.55 (2H, m), 7.48 (4H, m), 6.96 (1H, t, J = 8.8 Hz), 4.31 (2H, s br), 4.16 (1H, m), 3.45 (2H, m), 3.15 (2H, m), 2.92 (3H, s), 2.17 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.98 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

化合物No. 455 (融点: 171 ~ 173). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 145.8, 137.7, 137.2, 136.8, 136.1, 132.6, 126, 122.7, 114.3, 81, 80.3, 62.1, 22.8

<sup>1</sup>H: 8.69 (1H, t br, J = 1.5 Hz), 8.14 (1H, d d d, J = 1.0, 1.5, 6.4 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.70 (1H, t d, J = 1.2, 8.2 Hz), 7.63 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.31 (1H, d d, J = 6.4, 8.2 Hz), 5.12 (2H, s), 3.90 (2H, d), 1.62 (6H, s)

化合物No. 456 (融点: 181 ~ 182). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 149.4, 142.6, 138.3, 137.1, 135.2, 134.6, 132.4, 129.9, 127.7, 126.6, 126.2, 121.1, 117.1, 39.6

<sup>1</sup>H: 8.50 (1H, t br, J = 1.5 Hz), 8.08 (1H, d d d, J = 1.0, 1.8, 6.4 Hz), 7.96

(1H, d, J = 1.3 Hz), 7.61 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.60 (1H, m), 7.38 (1H, m), 7.50-7.29 (5H, m), 3.43 (3H, s)

化合物No. 457 (融点: 179 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.4, 150.6, 137.9, 137.7, 137, 131.7, 131.4, 129.7, 129.1, 128.9, 123.9, 121, 119.6, 114.7, 59, 52.2, 50.5, 31.9, 25

<sup>1</sup>H: 11.13 (1H, s br), 9.59 (1H, s), 8.39 (1H, s), 8.33 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.14 (1H, s), 8.02 (1H, d d, J = 2.0, 8.6 Hz), 7.55 (2H, m), 7.49 (3H, m), 7.19 (1H, d, J = 8.6 Hz), 4.32 (2H, d, J = 4.9 Hz), 4.18 (1H, m), 3.46 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.16 (2H, m), 2.93 (3H, s), 2.18 (2H, q br, J = 12.5 Hz), 1.99 (2H, d br, J = 12.3 Hz)

10

化合物No. 458 (融点: 163 ~ 164). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 148.1, 147.7, 146.1, 138.3, 136.8, 131.9, 129.1, 123.9, 113.6, 50, 32.2, 25.1, 24.8

<sup>1</sup>H: 9.02 (1H, d d, J = 0.8, 2.2 Hz), 8.46 (1H, d d, J = 1.7, 4.7 Hz), 8.38 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.33 (1H, d br, J = 7.3 Hz), 8.30 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.15 (1H, t d, J = 1.9, 7.9 Hz), 7.42 (1H, d d d, J = 0.8, 4.7, 7.9 Hz), 3.63 (1H, m), 1.90 (2H, m), 1.75 (2H, m), 1.61 (1H, d br, J = 12.7 Hz), 1.32 (4H, m), 1.14 (1H, m)

20

化合物No. 459 (融点: 199 ~ 201). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.8, 137.9, 137.6, 137.6, 136.9, 136, 132.7, 129.1, 128.3, 127.2, 125.9, 122.6, 115.3, 62.8, 56, 52.4, 31.7, 28.9

<sup>1</sup>H: 8.66 (1H, s br), 8.13 (1H, d, J = 6.3 Hz), 7.93 (1H, s br), 7.70 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.58 (1H, s br), 7.30 (6H, m), 3.99 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.02 (3H, s), 3.01 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 10.9 Hz), 1.93 (2H, m), 1.78 (2H, d br, J = 10.9 Hz)

化合物No. 460 (融点: 148). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

30

<sup>13</sup>C: 165.8, 147.2, 145.6, 132.6, 131.5, 126.5, 119.6, 116.6, 82.4, 79.6, 62.4, 61.7, 23, 14.3

<sup>1</sup>H: 8.91 (1H, d d, J = 0.8, 1.4 Hz), 8.17 (1H, d d, J = 1.4, 8.7 Hz), 8.12 (1H, d d, J = 0.8, 8.7 Hz), 5.53 (2H, s), 4.45 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.91 (2H, s), 1.70 (6H, s), 1.44 (3H, t, J = 7.2 Hz)

化合物No. 461 (融点: 186). NMR 溶媒: MeOD

<sup>13</sup>C: 149.5, 138.8, 138.8, 137.7, 136.9, 135, 128.4, 127.1, 116.7, 52.2, 33.8, 26.7, 26.5

<sup>1</sup>H: 8.75 (1H, br), 8.36 (1H, d, J = 1.2 Hz), 8.25 (1H, m), 8.24 (1H, m), 7.98 (1H, d, J = 8.2 Hz), 7.58 (1H, d d, J = 6.6, 8.2 Hz), 3.73 (1H, m), 2.02 (2H, m), 1.87 (2H, m), 1.70 (1H, d br, J = 13.5 Hz), 1.45 (2H, m), 1.38 (2H, m), 1.24 (1H, m)

40

化合物No. 462 (融点: 125 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.1, 145.8, 145.4, 135.3, 132.2, 124.9, 119.4, 113.9, 81.7, 78.7, 61.6, 22.5

<sup>1</sup>H: 8.63 (1H, s), 8.34 (1H, s br), 8.25 (1H, d, J = 8.5 Hz), 8.01 (1H, d d, J = 1.5, 8.7 Hz), 7.65 (1H, s br), 5.43 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.60 (6H, s)

50

化合物No. 463 (融点: 181~183). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.2, 148.6, 146.7, 139.4, 137.3, 132.5, 128.9, 123.6, 113.9, 66.9, 54.5, 31.8, 29.5

<sup>1</sup>H: 9.00 (1H, d d, J = 1.0, 2.2 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.7, 4.8 Hz), 8.11 (1H, d d d, J = 1.8, 2.3, 7.9 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 1.0, 4.8, 7.9 Hz), 4.29 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.6, 11.5 Hz), 3.50 (2H, d t, J = 2.2, 12.0 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, m), 1.78 (2H, m)

化合物No. 464 (融点: 143~144). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

10

<sup>13</sup>C: 150.6, 148.5, 146.7, 139.3, 136.9, 132.4, 129.1, 123.6, 113.8, 59, 39.5, 31.4, 25.6, 25.1, 14.9

<sup>1</sup>H: 9.01 (1H, d, J = 2.3 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.7, 4.8 Hz), 8.12 (1H, t d, J = 2.0, 8.0 Hz), 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.56 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 0.8, 4.8, 8.0 Hz), 3.75 (1H, m), 3.44 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.84 (4H, m), 1.66 (3H, m), 1.30 (2H, m, J = 13.0 Hz), 1.26 (3H, t, J = 7.0 Hz), 1.13 (1H, m, J = 13.0 Hz)

化合物No. 465 (融点: 184~185). NMR 溶媒: MeOD

20

<sup>13</sup>C: 151.9, 147.7, 147.1, 140.6, 138.4, 132.6, 131.6, 130.6, 130.4, 123, 118.8, 116.9, 114.7, 114.1, 61.8, 54.7, 52.8, 33.5, 26.8

<sup>1</sup>H: 8.64 (1H, s br), 7.82 (1H, s br), 7.58 (2H, m), 7.52 (3H, m), 7.18 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.11 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 6.83 (1H, d, J = 8.3 Hz), 4.36 (2H, s), 4.28 (1H, m), 3.63 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 3.24 (2H, m, J = 12.5 Hz), 3.06 (3H, s), 2.30 (2H, m, J = 13.0 Hz), 2.17 (2H, d br, J = 13.0 Hz)

化合物No. 466 (融点: 221~222). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.7 (d, J = 242.5 Hz), 151.0, 146.2 (d, J = 10.8 Hz), 139.6 (d, J = 2.5 Hz), 137.7, 126.7 (d, J = 7.5 Hz), 120.9 (d, J = 3.5 Hz), 114.1 (2 sig.), 112.3 (d, J = 19.7 Hz), 66.3, 56.0, 54.2, 31.6, 29.1

30

<sup>1</sup>H: 8.11 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.98 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.66 (1H, m), 7.63 (1H, m), 7.19 (1H, t, J = 8.7 Hz), 4.09 (1H, m), 3.93 (2H, d d, J = 4.5, 12.3 Hz), 3.85 (3H, s), 3.38 (2H, m), 2.94 (3H, s), 1.85 (2H, d q, J = 4.5, 12.3 Hz), 1.69 (2H, d br, J = 12.3 Hz)

化合物No. 467 (融点: 177). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.5, 142.3, 140, 137, 132.9, 128.7, 128.6, 128.4, 127.6, 126.1, 125.1, 113.1, 60.2, 55.7, 52.6, 33.8, 31.6, 28.9

<sup>1</sup>H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.81 (2H, m d, J = 8.2 Hz), 7.51 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.41 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.30 (3H, t, J = 7.4 Hz), 7.22 (1H, m), 7.21 (2H, d, J = 7.4 Hz), 4.06 (1H, m), 3.13 (2H, d br, J = 11.8 Hz), 3.04 (3H, s), 2.82 (2H, m), 2.63 (2H, m), 2.17 (2H, d t, J = 2.4, 12.0 Hz), 1.96 (2H, d q, J = 3.6, 12.1 Hz), 1.85 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

40

化合物No. 468 (融点: 186~187). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.2, 145.9, 141.4, 137.5, 137.2, 126.2, 113.2, 112.6, 110.7, 110.6, 66.3, 55.3, 54.1, 31.6, 29.1

<sup>1</sup>H: 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.69 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.15 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.0 (1H, d d, J = 2.2, 8.4 Hz), 6.79 (1H, d, J = 8.4 Hz), 4.73 (2H, s), 4.09 (1H, m), 3.93 (2H, d d, J = 4.3, 11.3 Hz), 3.77 (3H, s), 3.38 (2H, d t, J = 1.5, 12.0 Hz)

50

5, 12.0 Hz), 2.94 (3H, s), 1.84 (2H, d q, J = 4.5, 12.3 Hz), 1.69 (2H, d d, J = 2.8, 12.3 Hz)

化合物No. 469 (融点: 111 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 156.7, 153.8, 151.1, 141, 137.3, 126.1, 124.4, 115.3, 112.5, 78.8, 55, 43, 42.2, 31.7, 28.1, 28.1

<sup>1</sup>H: 9.46 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.78 (1H, s), 7.64 (2H, d, J = 8.7 Hz), 6.77 (2H, d, J = 8.7 Hz), 4.03 (3H, m), 2.91 (3H, s), 2.79 (2H, s br), 1.75 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.66 (2H, d q, J = 4.1, 12.2 Hz), 1.41 (9H, s)

10

化合物No. 470 (融点: 217 (dec.)). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.8, 137.7, 137.6, 137, 136.1, 132.7, 126, 122.8, 115.3, 66.9, 54.6, 31.9, 29.5

<sup>1</sup>H: 8.68 (1H, t, J = 1.3 Hz), 8.15 (1H, d d d, J = 1.0, 1.6, 6.4 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (1H, t d, J = 1.2, 8.1 Hz), 7.60 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.33 (1H, d d, J = 6.4, 8.1 Hz), 4.28 (1H, m), 4.10 (2H, d d, J = 4.5, 11.6 Hz), 3.51 (2H, d t, J = 1.8, 12.0 Hz), 3.04 (3H, s), 1.96 (2H, d q, J = 4.4, 12.2 Hz), 1.79 (2H, m)

化合物No. 471 (融点: 205 ~ 207). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

20

<sup>13</sup>C: 150.1, 137.6, 137.2, 136.9, 136, 132.8, 125.9, 122.8, 115.1, 59.1, 39.6, 31.3, 25.5, 25, 14.9

<sup>1</sup>H: 8.67 (1H, t, J = 1.6 Hz), 8.14 (1H, d d d, J = 1.0, 1.6, 6.4 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (1H, t d, J = 1.3, 8.1 Hz), 7.55 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.31 (1H, d d, J = 6.4, 8.1 Hz), 3.69 (1H, m), 3.42 (2H, q, J = 7.0 Hz), 1.84 (4H, m), 1.68 (3H, m), 1.27 (2H, m, J = 13.0 Hz), 1.25 (3H, t, J = 7.0 Hz), 1.12 (1H, m, J = 12.8 Hz)

化合物No. 472 (融点: 153 ~ 154). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 162.3 (d, J = 246.7 Hz), 151.4, 141.5, 136.9, 129.1 (d, J = 3.6 Hz), 126.8 (d, J = 8.5 Hz), 115.6 (d, J = 21.7 Hz), 112.8, 67, 54.4, 31.8, 29.5

30

<sup>1</sup>H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.76 (2H, m, J = 5.5, 8.9 Hz), 7.46 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.10 (2H, m t, J = 8.8 Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.6, 11.6 Hz), 3.50 (2H, d t, J = 1.7, 11.9 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.6, 12.3 Hz), 1.77 (2H, d br, J = 11.0 Hz)

化合物No. 473 (融点: 146 ~ 147). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.2, 150.6 (d d, J = 13.1, 247.3 Hz), 149.8 (d d, J = 12.8, 248.2 Hz), 140.5, 137.0, 130.1 (d d, J = 4.0, 6.5 Hz), 121.1 (d d, J = 3.8, 6.3 Hz), 117.5 (d, J = 17.6 Hz), 114.2 (d, J = 18.8 Hz), 113.4, 67.0, 54.5, 31.8, 29.5

40

<sup>1</sup>H: 7.91 (1H, d, J = 1.1 Hz), 7.61 (1H, d d d, J = 2.1, 7.8, 11.6 Hz), 7.50 (1H, m), 7.46 (1H, s), 7.18 (1H, d t, J = 8.5, 10.0 Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.5, 11.5 Hz), 3.50 (2H, d t, J = 1.3, 12.0 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.4, 12.2 Hz), 1.77 (2H, d br, J = 13.5 Hz)

化合物No. 474 (融点: 148 ~ 149). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.4, 150.6 (t, J = 2.7 Hz), 141.3, 137, 130.3, 126.6, 119.7, 115.9 (t, J = 260.0 Hz), 113.1, 67, 54.4, 31.8, 29.5

<sup>1</sup>H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.48 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.16 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 6.54 (1H, t, J = 74.0 Hz), 4.29 (1H, m), 4.09

50

(2H, d d,  $J = 4.5, 11.5$  Hz), 3.50 (2H, d t,  $J = 2.0, 12.0$  Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q,  $J = 4.5, 12.3$  Hz), 1.78 (2H, m)

化合物No. 475 (融点: 183~184). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 159.2, 151.6, 142.2, 136.8, 126.4, 125.6, 114.1, 112, 67, 55.3, 54.3, 31.8, 29.5

$^1\text{H}$ : 7.91 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.72 (2H, m d,  $J = 8.9$  Hz), 7.40 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 6.94 (2H, m d,  $J = 8.9$  Hz), 4.28 (1H, m), 4.08 (2H, d d,  $J = 4.4, 11.5$  Hz), 3.84 (3H, s), 3.50 (2H, d t,  $J = 1.9, 11.8$  Hz), 3.03 (3H, s), 1.94 (2H, d q,  $J = 4.5, 12.2$  Hz), 1.76 (2H, m d,  $J = 12.3$  Hz)

10

化合物No. 476 (融点: 130). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 151.5, 149.1, 148.6, 142.2, 136.7, 125.9, 117.4, 112.3, 111.2, 108.4, 67, 55.9, 55.9, 54.4, 31.8, 29.5

$^1\text{H}$ : 7.91 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.43 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.39 (1H, d,  $J = 2.0$  Hz), 7.30 (1H, d d,  $J = 2.0, 8.3$  Hz), 6.90 (1H, d,  $J = 8.3$  Hz), 4.29 (1H, m), 4.09 (2H, d d,  $J = 4.3, 11.6$  Hz), 3.96 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.50 (2H, d t,  $J = 1.7, 12.0$  Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q,  $J = 4.5, 12.4$  Hz), 1.77 (2H, d br,  $J = 12.3$  Hz)

20

化合物No. 477 (融点: 174~176). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 151.3, 141.3, 137, 133.2, 131.4, 128.9, 126.4, 113.3, 67, 54.4, 31.8, 29.5

$^1\text{H}$ : 7.92 (1H, s), 7.73 (2H, d,  $J = 8.5$  Hz), 7.50 (1H, s), 7.37 (2H, d,  $J = 8.5$  Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d,  $J = 4.5, 11.5$  Hz), 3.50 (2H, t,  $J = 11.5$  Hz), 3.03 (3H, s), 1.95 (2H, d q,  $J = 4.5, 12.2$  Hz), 1.77 (2H, d br,  $J = 12.5$  Hz)

化合物No. 478 (融点: 222~225). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 166.1, 146.3, 145.9, 137.5, 132.5, 125.2, 120, 112.4, 82.5, 79.5, 62.4, 52.1, 28.8, 23

$^1\text{H}$ : 8.46 (1H, d d,  $J = 0.8, 1.5$  Hz), 8.10 (1H, d d,  $J = 0.8, 8.7$  Hz), 7.91 (1H, d d,  $J = 1.5, 8.7$  Hz), 6.12 (1H, s), 5.53 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.69 (6H, s), 1.51 (9H, s)

30

化合物No. 479 (融点: 193~195). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 170.3, 145.7, 145.3, 137.7, 132.4, 124.7, 120.2, 113.2, 82.4, 79.6, 62.3, 39.6, 35.4, 22.9

$^1\text{H}$ : 8.30 (1H, s br), 8.14 (1H, d,  $J = 8.6$  Hz), 7.53 (1H, d d,  $J = 1.4, 8.6$  Hz), 5.53 (2H, s), 3.91 (2H, s), 3.16 (3H, s), 3.0 (3H, s), 1.68 (6H, s)

40

化合物No. 480 (融点: 233~234). NMR 溶媒: DMSO

$^{13}\text{C}$ : 167, 149.8, 144.5, 134, 131.6, 128.8, 119, 113.1, 59, 31.9, 28.4, 24

$^1\text{H}$ : 8.71 (1H, s), 8.25 (1H, s br), 8.18 (1H, d d,  $J = 1.4, 8.3$  Hz), 7.94 (1H, d,  $J = 8.3$  Hz), 7.61 (1H, s br), 4.57 (1H, br), 3.07 (3H, s), 1.93 (2H, m), 1.78 (2H, m), 1.72 (2H, m), 1.54 (2H, m)

化合物No. 481 (融点: 171~172). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 165, 145, 144.6, 143.5, 137.6, 135.9, 129.1, 127.5, 124.9, 120.4, 119.9, 118.7, 82.4, 79.6, 62.7, 22.6

$^1\text{H}$ : 8.39 (1H, s), 8.21 (1H, s br), 7.95 (2H, m), 7.69 (2H, d,  $J = 7.9$  Hz), 7.

50

39 (2H, t, J = 7.9 Hz), 7.19 (1H, t, J = 7.3 Hz), 5.40 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.69 (6H, s)

化合物No. 482 (融点: 185 ~ 186). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 166.4, 156.3, 150.9, 140, 137.6, 128.6, 127.1, 126, 123, 113.6, 112.3, 56.7, 56, 31.3, 29, 25.2, 24.9

<sup>1</sup>H: 8.25 (1H, d, J = 2.3 Hz), 8.09 (1H, s br), 7.95 (1H, s br), 7.92 (1H, d d, J = 2.3, 8.7 Hz), 7.67 (1H, s br), 7.56 (1H, s br), 7.16 (1H, d, J = 8.7 Hz), 3.90 (3H, s), 3.81 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.60 (1H, m), 1.56 (2H, m), 1.30 (2H, m, J = 13.0 Hz), 1.11 (1H, m)

10

化合物No. 483 (融点: 117). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.6, 145.3, 133.2, 129.3, 125.2, 119.8, 113.6, 67.1, 54.6, 29.9 (2 sig.)

<sup>1</sup>H: 8.10 (1H, m d, J = 8.4 Hz), 7.99 (1H, m d, J = 8.4 Hz), 7.61 (1H, m, J = 1.0, 7.0, 8.2 Hz), 7.47 (1H, m, J = 1.0, 7.1, 8.2 Hz), 4.54 (1H, m), 4.10 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.51 (2H, s br), 3.21 (3H, s), 2.03 (2H, d q, J = 4.6, 12.3 Hz), 1.91 (2H, d br, J = 11.5 Hz)

化合物No. 484 (融点: 119 ~ 120). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

20

<sup>13</sup>C: 151.9 (d, J = 246.5 Hz), 151.4, 147.8 (d, J = 11.2 Hz), 141.5, 136.8, 129.5 (d, J = 3.8 Hz), 117.3 (d, J = 6.9 Hz), 116.2 (d, J = 18.7 Hz), 113, 110.3 (d, J = 2.0 Hz), 67, 56.2, 54.4, 31.8, 29.5

<sup>1</sup>H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 7.47 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.24 (1H, m), 7.09 (1H, d d, J = 8.3, 11.0 Hz), 4.29 (1H, m), 4.10 (2H, d d, J = 4.5, 11.5 Hz), 3.96 (3H, s), 3.50 (2H, d t, J = 1.8, 12.0 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.6, 12.4 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

化合物No. 485 (融点: 181). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 153.2, 148.8, 137.1, 135, 126.4, 124.2, 123.2, 121.1, 115, 112.4, 57.2, 56.1, 40.7, 31.5, 28.8, 25, 24.8

30

<sup>1</sup>H: 9.20 (1H, s br), 9.10 (1H, s), 8.31 (1H, s), 7.77 (1H, d d, J = 2.3, 8.2 Hz), 7.76 (1H, s), 7.20 (1H, d, J = 8.2 Hz), 3.87 (3H, s), 3.84 (1H, br), 3.03 (3H, s), 2.96 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.61 (1H, m), 1.57 (2H, m), 1.32 (2H, m), 1.12 (1H, m)

化合物No. 486 (融点: 200 ~ 203 (dec.)). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 164.7, 145.6, 145, 137.7, 134.5, 132.8, 129.2, 128.6, 124.9, 120.4, 118.8, 115, 82.4, 79.5, 62.5, 23

<sup>1</sup>H: 8.61 (1H, s), 8.30 (1H, d, J = 8.6 Hz), 8.19 (1H, s br), 8.15 (1H, d d, J = 1.3, 8.6 Hz), 7.70 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.41 (2H, t, J = 8.3 Hz), 7.20 (1H, t, J = 7.5 Hz), 5.53 (2H, s), 3.92 (2H, s), 1.70 (6H, s)

40

化合物No. 487 (融点: 175 ~ 177). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 165.7, 145.7, 145.1, 134.2, 133.8, 128.4, 118.3, 114.6, 82.5, 79.5, 62.4, 52, 28.8, 23

<sup>1</sup>H: 8.42 (1H, d d, J = 0.5, 1.6 Hz), 8.25 (1H, d d, J = 0.5, 8.7 Hz), 8.03 (1H, d d, J = 1.6, 8.7 Hz), 6.09 (1H, s br), 5.54 (2H, s), 3.91 (2H, s), 1.69 (6H, s), 1.53 (9H, s)

50

化合物No. 488 (融点: 175). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.2, 148.6, 146.7, 140, 139.3, 137.3, 132.4, 128.9, 128.6, 128.4, 126.1, 123.6, 113.9, 60.2, 55.8, 52.6, 33.8, 31.7, 28.8

<sup>1</sup>H: 9.01 (1H, d d, J = 0.7, 2.2 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.6, 4.8 Hz), 8.12 (1H, d d d, J = 1.7, 2.6, 8.0 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 1.0, 4.8, 8.0 Hz), 7.30 (2H, m, J = 7.5 Hz), 7.21 (1H, m), 7.20 (2H, m, J = 7.1 Hz), 4.05 (1H, m), 3.14 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.05 (3H, s), 2.81 (2H, m), 2.63 (2H, m), 2.17 (2H, d t, J = 2.0, 11.6 Hz), 1.97 (2H, d q, J = 3.7, 12.0 Hz), 1.85 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

10

化合物No. 489 (融点: 197). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 164.3, 145.4, 144.5, 133.6, 132.4, 129, 118.7, 113.9, 81.7, 78.7, 61.7, 48.7, 32.5, 25.3, 25, 22.5

<sup>1</sup>H: 8.68 (1H, s), 8.49 (1H, d, J = 8.0 Hz), 8.18 (1H, d d, J = 1.4, 8.7 Hz), 8.15 (1H, d, J = 8.7 Hz), 5.44 (2H, s), 3.90 (2H, s), 3.80 (1H, m), 1.86 (2H, m), 1.75 (2H, m), 1.61 (1H, m), 1.58 (6H, s), 1.35 (2H, m), 1.30 (2H, m), 1.15 (1H, m)

化合物No. 490 (融点: 194 ~ 196). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 164.6, 144.4, 144.2, 143, 135.2, 128, 118.9, 118.4, 81.7, 78.7, 61.8, 48.7, 32.4, 25.3, 25, 22.2

<sup>1</sup>H: 8.52 (1H, s), 8.50 (1H, m), 8.07 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.97 (1H, d d, J = 1.4, 9.0 Hz), 5.31 (2H, s), 3.92 (2H, s), 3.79 (1H, m), 1.85 (2H, m), 1.75 (2H, m), 1.62 (1H, m), 1.58 (6H, s), 1.34 (2H, m), 1.31 (2H, m), 1.15 (1H, m)

20

化合物No. 491 (融点: 254 ~ 256). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167, 149.5, 144.5, 134.1, 131.6, 128.8, 119, 113.1, 58.4, 56.8, 32.3, 30.1, 28.9, 25.1, 24.8

<sup>1</sup>H: 8.71 (1H, s), 8.24 (1H, s), 8.18 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.93 (1H, d, J = 8.8 Hz), 7.60 (1H, s), 4.0 (1H, m br), 3.06 (3H, s), 1.97-1.00 (10H, m)

30

化合物No. 492 (融点: 223 ~ 224). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150, 144.7, 132.6, 131.4, 129.9, 129.5, 129.5, 128.8, 125.5, 119.6, 113.5, 58.7, 52.8, 50.3, 32.5, 25.4

<sup>1</sup>H: 11.21 (1H, s br), 8.19 (1H, m, J = 8.3 Hz), 7.91 (1H, m d, J = 8.3 Hz), 7.70 (1H, m, J = 1.0, 7.0 Hz), 7.63 (2H, m), 7.54 (1H, m, J = 1.0, 7.0 Hz), 7.45 (3H, m), 4.39 (1H, m br), 4.26 (2H, m br), 3.40 (2H, m), 3.06 (3H, s), 3.05 (2H, m br), 2.47 (2H, m), 2.05 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物No. 493 (融点: 140). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.8, 150.2, 140.4, 139.6, 137.3, 119.4, 115.7, 57.7, 31.4, 30, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 8.62 (2H, m), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.68 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.67 (2H, m), 3.94 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.71 (1H, d br, J = 13.0 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 3.4, 12.3 Hz), 1.38 (2H, m q, J = 13.0 Hz), 1.13 (1H, t q, J = 3.4, 13.0 Hz)

40

化合物No. 494 (融点: 193 ~ 194). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 154.4, 151.2, 139.9, 137.2, 134.5, 133.7, 126, 121, 120.3, 113.4, 67, 54.5, 31.9, 29.5

50



<sup>1</sup>H: 10.61 (1H, s), 8.51 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.02 (1H, d d, J = 2.2, 8.7 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.52 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.21 (1H, d, J = 8.7 Hz), 4.29 (1H, m), 4.10 (2H, d d, J = 4.5, 11.5 Hz), 3.51 (2H, d t, J = 1.8, 12.0 Hz), 3.05 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.6, 12.4 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

化合物No. 495 (融点: 185~187). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.1 (d, J = 241.0 Hz), 149.2, 145.5 (d, J = 12.2 Hz), 137.2, 135.3, 122.0 (d, J = 3.0 Hz), 120.5, 118.2 (d, J = 3.5 Hz), 114.8, 113.4 (d, J = 20.5 Hz), 66.2, 54.5, 31.7, 28.9

<sup>1</sup>H: 10.36 (1H, s br), 9.08 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.74 (1H, d d, J = 2.0, 12.4 Hz), 7.56 (1H, d d, J = 1.5, 8.3 Hz), 7.07 (1H, t, J = 8.7 Hz), 4.11 (1H, m), 3.94 (2H, d d, J = 4.0, 11.5 Hz), 3.39 (2H, t, J = 11.5 Hz), 2.97 (3H, s), 1.86 (2H, d q, J = 4.2, 12.2 Hz), 1.70 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

10

化合物No. 496 (融点: 116~118). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 166.2, 145.6, 145.1, 137.8, 134.4, 132.2, 128.9, 128.4, 128, 127.8, 118.8, 114.8, 82.5, 79.5, 62.4, 44.5, 23

<sup>1</sup>H: 8.52 (1H, s), 8.28 (1H, d, J = 8.8 Hz), 8.09 (1H, d d, J = 1.5, 8.7 Hz), 7.40-7.30 (5H, m), 6.56 (1H, t, J = 5.3 Hz), 5.54 (2H, s), 4.72 (2H, d, J = 5.3 Hz), 3.91 (2H, s), 1.69 (6H, s)

20

化合物No. 497 (融点: 173 (dec.)). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.6, 139.3, 138.2, 137.5, 131.5, 121.8, 115.4, 57.7, 31.4, 29.9, 25.4, 25.1

<sup>1</sup>H: 8.22 (2H, d, J = 7.0 Hz), 7.90 (1H, s), 7.68 (2H, d, J = 7.0 Hz), 7.61 (1H, s), 3.93 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.86 (4H, m), 1.71 (1H, d, J = 13.0 Hz), 1.59 (2H, d q, J = 2.8, 12.2 Hz), 1.38 (2H, q, J = 13.0 Hz), 1.13 (1H, q, J = 13.0 Hz)

化合物No. 498 (融点: 109~110). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

30

<sup>13</sup>C: 159.6, 151.1, 141.7, 136.5, 133.9, 129.4, 117.2, 113.3, 113, 109.8, 60, 55.4, 54.9, 52.3, 31.2, 28.4, 19.8, 11.6

<sup>1</sup>H: 7.92 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.39 (1H, d d, J = 1.4, 2.6 Hz), 7.35 (1H, d t, J = 1.4, 7.7 Hz), 7.31 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.85 (1H, d d d, J = 1.4, 2.6, 8.0 Hz), 4.02 (1H, m), 3.87 (3H, s), 3.06 (2H, d br, J = 1.7 Hz), 3.02 (3H, s), 2.32 (2H, m), 2.06 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.95 (2H, d q, J = 3.4, 12.2 Hz), 1.80 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.52 (2H, m), 0.91 (3H, t, J = 7.4 Hz)

化合物No. 499 (融点: 170~171). NMR 溶媒: DMSO

40

<sup>13</sup>C: 171.2, 160.9, 149, 137.2, 135.4, 130.8, 125.9, 119.6, 118, 115.2, 114.7, 57.2, 31.6, 28.8, 25, 24.8

<sup>1</sup>H: 12.99 (1H, s br), 9.11 (1H, s), 8.42 (1H, s), 8.40 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.19 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.87 (1H, d d, J = 2.0, 8.6 Hz), 7.02 (1H, d, J = 8.5 Hz), 3.86 (1H, m), 2.98 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.60 (3H, m), 1.33 (2H, q, J = 1.2 Hz), 1.12 (1H, q, J = 13.0 Hz)

化合物No. 500 (融点: 191~193 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.0, 150.3 (d, J = 240.0 Hz), 144.9 (d, J = 12.5 Hz), 140.0, 137.6, 130.1, 116.2 (d, J = 18.0 Hz), 115.9 (d, J = 6.3 Hz), 114.2 (d, J = 1.5 Hz), 114.

50

1, 66.3, 54.2, 31.6, 29.1

<sup>1</sup>H: 9.89 (1H, s), 8.10 (1H, s), 7.90 (1H, s), 7.46 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.24 (1H, m), 7.13 (1H, m, J = 9.2 Hz), 4.08 (1H, m), 3.93 (2H, d br, J = 10.0 Hz), 3.36 (2H, m), 2.94 (3H, s), 1.84 (2H, d q, J = 12.0 Hz), 1.69 (2H, d br, J = 11.0 Hz)

化合物No. 501 (融点: 138 ~ 140). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 158.5, 151, 140.6, 137.4, 126.1, 126, 114, 113.1, 55.1, 55.1, 44.9, 31.5, 28.7

<sup>1</sup>H: 8.08 (1H, s), 7.87 (1H, s), 7.77 (2H, d, J = 8.3 Hz), 6.96 (2H, d, J = 8.3 Hz), 3.95 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.07 (2H, d, J = 12.0 Hz), 2.93 (3H, s), 2.56 (2H, m), 1.73 (4H, m) 10

化合物No. 502 (融点: 120 ~ 121). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.9, 151.5, 142.1, 136.9, 134.3, 129.7, 117.5, 113.7, 113.4, 110.2, 55.7, 55.3, 52.2, 52.1, 31.6, 28.8, 12.1

<sup>1</sup>H: 7.92 (1H, s), 7.49 (1H, s), 7.39 (1H, t br), 7.36 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.30 (1H, t, J = 7.9 Hz), 6.85 (1H, d br, J = 8.1 Hz), 4.03 (1H, m), 3.87 (3H, s), 3.08 (2H, d br, J = 11.0 Hz), 3.02 (3H, s), 2.45 (2H, q, J = 7.3 Hz), 2.05 (2H, t br, J = 11.4 Hz), 1.96 (2H, d q, J = 2.5, 11.8 Hz), 1.85 (2H, d br, J = 11.0 Hz), 1.11 (3H, t, J = 7.3 Hz) 20

化合物No. 503 (融点: 158 ~ 159). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 152.5 (d, J = 245.0 Hz), 151.4, 147.1 (d, J = 11.0 Hz), 141.1 (d, J = 2.5 Hz), 136.9, 126.4 (d, J = 7.0 Hz), 120.9 (d, J = 3.6 Hz), 113.5 (d, J = 2.5 Hz), 113.0 (d, J = 20.0 Hz), 112.6, 56.3, 55.7, 52.2, 52.1, 31.6, 28.7, 12.1

<sup>1</sup>H: 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (2H, m), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.99 (1H, t, J = 8.3 Hz), 4.03 (1H, m), 3.91 (3H, s), 3.09 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.02 (3H, s), 2.45 (2H, q, J = 7.3 Hz), 2.06 (2H, t, J = 12.0 Hz), 1.96 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.83 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.11 (3H, t, J = 7.3 Hz) 30

化合物No. 504 (融点: 183 ~ 184). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 149.3, 137.5, 136.1, 129.1, 129, 128.7, 125.4, 115.8, 52.6, 42.3, 31.8, 24.6

<sup>1</sup>H: 9.33 (1H, q br, J = 10.0 Hz), 9.20 (1H, d br, J = 10.0 Hz), 9.13 (1H, s), 8.37 (1H, s), 7.94 (2H, d, J = 8.2 Hz), 7.48 (2H, t, J = 7.8 Hz), 7.39 (1H, t, J = 7.3 Hz), 4.23 (1H, m), 3.34 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.0 (2H, m), 2.98 (3H, s), 2.19 (2H, d q, J = 3.5, 12.8 Hz), 1.92 (2H, d br, J = 12.4 Hz)

化合物No. 505 (融点: 143 ~ 144). NMR 溶媒: DMSO 40

<sup>13</sup>C: 167.9, 163.8, 144.4, 143.5, 142.8, 135.5, 128, 119.7, 118, 81.6, 78.7, 63.9, 61.8, 47.7, 45.2, 26.8, 25.1, 24.8, 22.2

<sup>1</sup>H: 8.16 (1H, s br), 8.11 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.59 (1H, d d, J = 1.2, 8.9 Hz), 5.29 (2H, s), 3.92 (2H, m), 3.84 (2H, br), 3.59 (2H, br), 3.08 (4H, br), 2.93 (1H, m), 1.96 (2H, d br, J = 10.8 Hz), 1.80 (2H, d, J = 12.4 Hz), 1.58 (1H, m), 1.57 (6H, s), 1.29 (4H, m), 1.09 (1H, m)

化合物No. 506 (融点: 133 ~ 135). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 168, 162.4, 147.4, 147, 144.4, 143.4, 142.8, 135.9, 128.5, 127.9, 123.3, 119.7, 117.7, 109.8, 108.1, 101.1, 81.6, 78.7, 61.8, 60.6, 51.6, 46.1, 40.7, 22 50

.2

<sup>1</sup>H: 8.10 (1H, d, J = 9.3 Hz), 8.09 (1H, s), 7.54 (1H, d, J = 9.3 Hz), 6.94 (1H, s), 6.90 (1H, d, J = 8.0 Hz), 6.83 (1H, d, J = 8.0 Hz), 6.01 (2H, s), 5.29 (2H, s), 3.92 (2H, s), 3.75 (2H, m), 3.72 (2H, s), 3.47 (2H, m), 2.69 (4H, m), 1.57 (6H, s)

化合物No. 507 (融点: 213~214). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 156.3, 150.9, 150.7, 140.2, 137.5, 126.5, 126.3, 125.7, 122.9, 113.3, 111.9, 56.7, 55.7, 31.3, 29, 25.2, 24.8

<sup>1</sup>H: 9.38 (1H, s), 8.07 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.84 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.82 (1H, d d, J = 2.2, 8.6 Hz), 7.08 (1H, d, J = 8.6 Hz), 5.63 (2H, s), 3.81 (1H, m), 3.81 (3H, s), 2.92 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, q, J = 12.7 Hz), 1.11 (1H, q, J = 13.0 Hz)

10

化合物No. 508 (融点: 172~173). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.7, 147.4, 145.5, 138.1, 137.5, 132.5, 129.4, 124.1, 115.7, 67.9, 56.3, 34.2, 31.4, 26.8

<sup>1</sup>H: 9.08 (1H, s), 8.49 (1H, d, J = 4.8 Hz), 8.24 (1H, t d, J = 1.7, 8.0 Hz), 8.19 (1H, s), 8.18 (1H, s), 7.47 (1H, d d, J = 5.0, 8.0 Hz), 4.62 (1H, br), 3.79 (1H, m), 3.38 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.89 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.80-1.60 (4H, m), 1.23 (2H, q, J = 11.3 Hz)

20

化合物No. 509 (融点: 137~139 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.7, 148.4, 138.5, 138.2, 135.2, 131, 130.3, 121.6, 118.9, 116.3, 55.6, 51.9, 51.4, 31.5, 28.1, 12.2

<sup>1</sup>H: 8.66 (1H, t, J = 1.8 Hz), 8.31 (1H, s), 8.29 (1H, d t, J = 1.8, 8.0 Hz), 8.20 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.10 (1H, d br, J = 8.0 Hz), 7.69 (1H, t, J = 8.0 Hz), 3.83 (1H, m), 2.96 (2H, m), 2.95 (3H, s), 2.32 (2H, q, J = 7.1 Hz), 1.93 (2H, t br, J = 10.5 Hz), 1.82 (2H, d q, J = 3.0, 12.0 Hz), 1.73 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 0.99 (3H, t, J = 10.5 Hz)

30

化合物No. 510 (融点: 133~134). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.5, 149.1, 148.6, 142.1, 136.7, 126, 117.4, 112.3, 111.2, 108.4, 55.9, 55.9, 55.6, 52.2, 52.1, 31.6, 28.7, 12.1

<sup>1</sup>H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.39 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.30 (1H, d d, J = 2.0, 8.4 Hz), 6.90 (1H, d, J = 8.4 Hz), 4.04 (1H, m), 3.96 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.08 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 3.02 (3H, s), 2.44 (2H, q, J = 7.4 Hz), 2.05 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.96 (2H, d q, J = 3.0, 11.8 Hz), 1.82 (2H, d br, J = 11.8 Hz), 1.10 (3H, t, J = 7.4 Hz)

40

化合物No. 511 (融点: 142~144). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.6, 146.7, 142.3, 136.8, 133.9, 129.6, 115.5, 114.4, 113.1, 111.9, 55.7, 52.2, 52.1, 31.6, 28.7, 12.1

<sup>1</sup>H: 7.90 (1H, s), 7.45 (1H, s), 7.20 (1H, s), 7.16 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.13 (1H, d, J = 7.8 Hz), 6.63 (1H, d, J = 7.0 Hz), 4.03 (1H, m), 3.73 (2H, s br), 3.08 (2H, d br, J = 11.0 Hz), 3.01 (3H, s), 2.45 (2H, t, J = 7.1 Hz), 2.05 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.96 (2H, q, J = 12.0 Hz), 1.82 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.11 (3H, t, J = 7.1 Hz)

化合物No. 512 (融点: 153~154). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

50

<sup>13</sup>C: 151.5, 149.1, 148.6, 142.1, 136.7, 126.1, 117.4, 112.3, 111.3, 108.4, 60.4, 55.9, 55.9, 55.8, 52.6, 31.6, 28.9, 20.3, 11.9

<sup>1</sup>H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.42 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.40 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.30 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 6.90 (1H, d, J = 8.3 Hz), 4.02 (1H, m), 3.96 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.04 (2H, d, J = 11.0 Hz), 3.02 (3H, s), 2.31 (2H, m), 2.05 (2H, d t, J = 1.8, 11.8 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.7, 12.0 Hz), 1.80 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.51 (2H, m), 0.9 (3H, t, J = 7.3 Hz)

化合物No. 513 (融点: 215 ~ 216 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 172.1, 160.3, 151, 140.2, 137.5, 130.5, 124.4, 124.2, 117.7, 114.4, 113.3, 66.3, 54.2, 31.7, 29.1 10

<sup>1</sup>H: 13.02 (1H, s), 8.48 (1H, s), 8.32 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.14 (1H, s), 7.96 (1H, s), 7.89 (1H, d d, J = 2.2, 8.5 Hz), 7.86 (1H, s), 6.92 (1H, d, J = 8.5 Hz), 4.11 (1H, m), 3.94 (2H, d d, J = 3.5, 11.0 Hz), 3.38 (2H, m), 2.96 (3H, s), 1.96 (2H, d q, J = 4.6, 12.4 Hz), 1.70 (2H, d br, J = 12.3 Hz)

化合物No. 514 (融点: 185 ~ 186). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 152.5 (d, J = 245.0 Hz), 151.4, 147.0 (d, J = 11.0 Hz), 141.1 (d, J = 2.6 Hz), 136.9, 126.4 (d, J = 7.3 Hz), 120.9 (d, J = 3.5 Hz), 113.4 (d, J = 2.0 Hz), 113.0 (d, J = 20.0 Hz), 112.6, 60.4, 56.2, 55.8, 52.6, 31.6, 28.9, 20.3, 11.9 20  
<sup>1</sup>H: 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (2H, m), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.99 (1H, t, J = 8.4 Hz), 4.0 (1H, m), 3.91 (3H, s), 3.04 (2H, d br, J = 11.7 Hz), 3.01 (3H, s), 2.31 (2H, m), 2.05 (2H, d t, J = 2.0, 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.80 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.51 (2H, m), 0.9 (3H, t, J = 7.5 Hz)

化合物No. 515 (融点: 171 ~ 172). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 154.5, 151.2, 148.6, 146.7, 139.4, 137.4, 132.5, 128.9, 123.6, 113.9, 80, 55.7, 42.9, 31.9, 28.7, 28.4  
<sup>1</sup>H: 9.01 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.54 (1H, d d, J = 1.7, 4.8 Hz), 8.12 (1H, d d, J = 1.7, 2.2, 8.0 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.35 (1H, d d d, J = 0.9, 4.8, 8.0 Hz), 4.28 (2H, br), 4.20 (1H, m), 3.02 (3H, s), 2.81 (2H, br), 1.88-1.69 (4H, m), 1.48 (9H, s) 30

化合物No. 516 (融点: hygroscopic). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.1, 138.7, 137.4, 135.1, 134.4, 133, 127.6, 127.4, 118.1, 67.9, 56.4, 34.2, 31.5, 26.8  
<sup>1</sup>H: 9.0 (1H, t, J = 1.5 Hz), 8.47 (1H, m d, J = 6.3 Hz), 8.42 (1H, s), 8.40 (1H, s), 8.19 (1H, m d, J = 8.1 Hz), 7.74 (1H, d d, J = 6.3, 8.1 Hz), 3.79 (1H, m br), 3.40 (1H, m), 2.91 (3H, s), 1.88 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.70 (4H, m), 1.23 (2H, q br, J = 12.0 Hz) 40

化合物No. 517 (融点: 130 ~ 132). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 168, 162.4, 145.4, 144.2, 135.1, 133, 132.7, 129.7, 128.8, 128.5, 128, 118.4, 114.5, 81.7, 78.7, 61.6, 61, 51.8, 46.3, 40.8, 22.5  
<sup>1</sup>H: 8.21 (1H, s), 8.16 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.71 (1H, d d, J = 1.5, 8.5 Hz), 7.40-7.25 (5H, m), 5.42 (2H, s), 3.91 (2H, s), 3.65 (2H, s br), 3.43 (4H, m), 2.55 (4H, m), 1.60 (6H, s)

化合物No. 518 (融点: 122). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 152.2, 151.2, 149.3, 142.3, 137.5, 136.8, 122.2, 119.7, 115.9, 57.4, 31. 50

4, 29.8, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 8.56 (1H, d d d, J = 1.0, 1.8, 4.8 Hz), 8.0 (1H, t d, J = 1.1, 8.0 Hz), 7.97 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.75 (1H, d t, J = 1.9, 7.7 Hz), 7.19 (1H, d d d, J = 1.2, 4.8, 7.6 Hz), 3.98 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.85 (2H, m), 1.69 (1H, d, J = 13.0 Hz), 1.56 (2H, d q, J = 3.7, 12.2 Hz), 1.38 (2H, t q, J = 3.0, 13.0 Hz), 1.12 (1H, t q, J = 3.5, 13.0 Hz)

化合物No. 519 (融点: 158~159). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.8, 137.6, 137.6, 136.9, 136, 132.7, 125.9, 122.8, 115.3, 60.4, 56, 52.6, 31.7, 28.8, 20.2, 11.9

10

<sup>1</sup>H: 8.66 (1H, t, J = 1.6 Hz), 8.13 (1H, d d d, J = 1.0, 1.7, 6.4 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.71 (1H, t d, J = 1.2, 7.9 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.31 (1H, d d, J = 6.4, 7.9 Hz), 3.98 (1H, m), 3.04 (2H, m d, J = 12.0 Hz), 3.01 (3H, s), 2.30 (2H, m), 2.04 (2H, d t, J = 2.0, 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.80 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 1.50 (2H, m), 0.9 (3H, t, J = 7.4 Hz)

化合物No. 520 (融点: 170). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.2, 151.6, 142.1, 136.8, 126.4, 125.7, 114.1, 112, 60.4, 55.8, 55.3, 52.6, 31.5, 28.9, 20.2, 11.9

<sup>1</sup>H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.94 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 4.01 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.04 (2H, m), 3.01 (3H, s), 2.30 (2H, m), 2.04 (2H, d t, J = 2.0, 12.0 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.7, 12.0 Hz), 1.80 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.50 (2H, m), 0.9 (3H, t, J = 7.4 Hz)

20

化合物No. 521 (融点: 163~164). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.1, 151.6, 142.1, 136.8, 126.4, 125.7, 114.1, 112, 55.7, 55.3, 52.2, 52.1, 31.5, 28.8, 12.2

<sup>1</sup>H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.39 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.94 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 4.02 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.07 (2H, m d, J = 11.7 Hz), 3.01 (3H, s), 2.43 (2H, q, J = 7.3 Hz), 2.03 (2H, d t, J = 2.0, 12.0 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.82 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.09 (3H, t, J = 7.2 Hz)

30

化合物No. 522 (融点: 127). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.7, 148.4, 138.5, 138.2, 135.2, 131, 130.3, 121.6, 118.9, 116.4, 59.6, 55.6, 52.4, 31.6, 28.2, 19.8, 11.9

<sup>1</sup>H: 8.66 (1H, t, J = 1.8 Hz), 8.32 (1H, s), 8.30 (1H, d br, J = 7.9 Hz), 8.20 (1H, s), 8.11 (1H, d d, J = 2.2, 8.1 Hz), 7.69 (1H, t, J = 8.1 Hz), 3.82 (1H, m), 2.95 (3H, s), 2.93 (2H, m), 2.21 (2H, t br, J = 7.5 Hz), 1.91 (2H, t br, J = 11.2 Hz), 1.81 (2H, d q, J = 3.0, 11.7 Hz), 1.72 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.41 (2H, m), 0.84 (3H, t, J = 7.5 Hz)

40

化合物No. 523 (融点: 163~164 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151, 150.4 (d, J = 240.5 Hz), 144.9 (d, J = 12.5 Hz), 140, 138.5, 137.6, 130.2 (d, J = 3.2 Hz), 128.9, 128.3, 127, 116.3 (d, J = 19.0 Hz), 115.9 (d, J = 6.5 Hz), 114.2 (d, J = 2.5 Hz), 114.1, 61.8, 55.4, 52.2, 31.5, 28.2

<sup>1</sup>H: 9.20 (1H, s), 8.08 (1H, s), 7.89 (1H, s), 7.45 (1H, d d, J = 1.7, 8.7 Hz), 7.39-7.19 (6H, m), 7.13 (1H, d d, J = 8.7, 11.2 Hz), 3.82 (1H, m br), 3.47 (2H, s), 2.93 (3H, s), 2.90 (2H, m br), 2.0 (2H, m br), 1.83 (2H, m br), 1.72 (2H, m br)

50

化合物No. 524 (融点: 124 ~ 125). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.1, 148.8, 141.4, 137.3, 133.8, 129.1, 113.7, 113, 112.8, 110.4, 59.6, 55.6, 52.4, 31.4, 28.2, 19.8, 11.9

<sup>1</sup>H: 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.79 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.08 (1H, t, J = 2.0 Hz), 7.0 (1H, t, J = 7.6 Hz), 6.95 (1H, t d, J = 1.2, 7.5 Hz), 6.45 (1H, d d d, J = 1.4, 2.4, 7.8 Hz), 5.08 (2H, s), 3.79 (1H, m), 2.95 (2H, m), 2.92 (3H, s), 2.23 (2H, t, br, J = 7.5 Hz), 1.92 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.81 (2H, d q, J = 3.0, 11.7 Hz), 1.71 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.42 (2H, m), 0.84 (3H, t, J = 7.3 Hz)

10

化合物No. 525 (融点: 167 ~ 168). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.2, 148.6, 146.7, 139.3, 137.3, 132.4, 128.9, 123.6, 113.9, 55.9, 52.2, 52.1, 31.6, 28.8, 12.2

<sup>1</sup>H: 9.0 (1H, d d, J = 1.0, 2.3 Hz), 8.52 (1H, d d, J = 1.7, 4.9 Hz), 8.11 (1H, d d d, J = 1.7, 2.2, 7.9 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.58 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 1.0, 4.9, 8.0 Hz), 4.03 (1H, m), 3.07 (2H, m d, J = 11.5 Hz), 3.03 (3H, s), 2.43 (2H, q, J = 7.3 Hz), 2.03 (2H, d t, J = 2.0, 11.7 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.83 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.09 (3H, t, J = 7.3 Hz)

20

化合物No. 526 (融点: 117). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.9, 151, 140.5, 140.2, 140, 137.7, 135, 134.1, 129.6, 129.4, 129, 126.8, 125.8, 125.7, 124.2, 123.1, 115, 59.3, 55.2, 52.2, 31.6, 27.9, 19.5, 11.8

<sup>1</sup>H: 8.21 (1H, t, J = 1.7 Hz), 8.19 (1H, t, J = 1.7 Hz), 8.16 (3H, m), 7.88 (3H, m), 7.63 (1H, d d d, J = 1.2, 2.0, 7.8 Hz), 7.57 (1H, t, J = 7.7 Hz), 7.52 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.49 (1H, s br), 3.87 (1H, m br), 3.0 (2H, m br), 2.96 (3H, s), 2.31 (2H, m br), 2.05 (2H, m br), 1.86 (2H, q br, J = 12.0 Hz), 1.46 (2H, d br, J = 10.5 Hz), 1.45 (2H, m), 0.85 (3H, t, J = 7.4 Hz)

30

化合物No. 527 (融点: 85 ~ 87). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 154.4, 150.3, 148.9, 132.3, 129, 126.2, 123, 58.8, 56.6, 31.1, 30.6, 29.4, 25.4, 25.3

<sup>1</sup>H: 7.90 (2H, m d, J = 8.4 Hz), 7.56 (1H, m t, J = 7.3 Hz), 7.49 (2H, m t, J = 7.8 Hz), 4.13, 3.70 (1H, 2 s br), 3.0 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.68 (1H, d, J = 12.0 Hz), 1.52 (2H, q, J = 12.0 Hz), 1.40 (2H, s br), 1.12 (1H, t q, J = , 3.2, 13.0 Hz)

化合物No. 528 (融点: 138 ~ 140). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 153.3, 149.8, 144.2, 132.5, 129.1, 126.2, 122.7, 81, 79.8, 61.8, 22.8

<sup>1</sup>H: 7.87 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.57 (1H, m t, J = 7.3 Hz), 7.50 (2H, m t, J = 7.2 Hz), 5.23 (2H, s), 3.83 (2H, s), 1.59 (6H, s)

40

化合物No. 529 (融点: 154 ~ 155). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.2, 148.6, 146.7, 139.3, 137.3, 132.4, 128.9, 123.6, 113.9, 60.4, 55.9, 52.6, 31.6, 28.9, 20.3, 11.9

<sup>1</sup>H: 9.0 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.52 (1H, d d, J = 1.6, 4.8 Hz), 8.11 (1H, t d, J = 2.0, 8.1 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.33 (1H, d d, J = 4.8, 8.1 Hz), 4.01 (1H, m), 3.05 (2H, m), 3.02 (3H, s), 2.30 (2H, m), 2.04 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.1, 12.0 Hz), 1.81 (2H, d br, J

50

= 11.2 Hz), 1.50 (2H, m), 0.9 (3H, t, J = 7.4 Hz)

化合物No. 530 (融点: 185 ~ 186 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151, 143.1, 140, 137.5, 132.9, 125.7, 124.2, 122.8, 121.8, 57.4, 31.4, 29.9, 25.4, 25.2

<sup>1</sup>H: 8.87 (1H, d, J = 1.3 Hz), 3.37 (1H, d d, J = 2.0, 8.3 Hz), 8.31 (1H, d, J = 6.0 Hz), 8.06 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37 (1H, d t, J = 1.2, 8.4 Hz), 7.17 (1H, d t, J = 2.2, 7.1 Hz), 4.0 (1H, m), 3.0 (3H, s), 1.87 (4H, m), 1.69 (1H, d, J = 13.0 Hz), 1.57 (2H, d q, J = 3.5, 13.0 Hz), 1.39 (2H, m q, J = 13.0 Hz), 1.12 (1H, m q, J = 13.0 Hz)

10

化合物No. 531 (融点: slow dec. >160). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.4, 140.2, 139.9, 139, 137.9, 134.8, 132.6, 127.4, 118.6, 52.4, 42.4, 31.8, 24.7

<sup>1</sup>H: 9.33 (1H, s), 9.25 (1H, q, J = 10.0 Hz), 9.10 (1H, d, J = 10.0 Hz), 8.94 (1H, d, J = 8.2 Hz), 8.80 (1H, d, J = 5.3 Hz), 8.55 (1H, s), 8.38 (1H, s), 8.08 (1H, d d, J = 5.3, 8.2 Hz), 4.22 (1H, m), 3.34 (2H, d, J = 12.0 Hz), 3.01 (2H, q, J = 13.0 Hz), 2.96 (3H, s), 2.17 (2H, q, J = 13.2 Hz), 1.92 (2H, d, J = 12.0 Hz)

20

化合物No. 532 (融点: 245 ~ 246 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 158.5, 151.2, 140.6, 137.5, 126.1, 126, 114, 113.1, 55.1, 54.5, 44.9, 34.3, 31.6, 27.7

<sup>1</sup>H: 8.10 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.77 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 6.96 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 3.98 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.66 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 2.95 (3H, s), 2.88 (3H, s), 2.84 (2H, m), 1.87 (4H, m)

化合物No. 533 (融点: 259 ~ 260). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.9, 148.1, 146.2, 138.2, 137.8, 131.9, 129.1, 123.8, 115.5, 54.5, 44.9, 34.4, 31.7, 27.7

<sup>1</sup>H: 9.07 (1H, s), 8.46 (1H, s), 8.19 (3H, m), 7.42 (1H, s br), 3.98 (1H, m br), 3.66 (2H, m d, J = 10.0 Hz), 2.96 (3H, s), 2.88 (3H, s), 2.85 (2H, m br), 1.88 (4H, m br)

30

化合物No. 534 (融点: 162). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.5 (d, J = 243.0 Hz), 149.4, 147.3 (d, J = 10.6 Hz), 137.4, 135.4, 122.4 (m), 121.9 (d, J = 2.8 Hz), 115.2, 114.3 (d, J = 1.5 Hz), 113.0 (d, J = 20.2 Hz), 56.2, 52.5, 42.3, 31.7, 24.6

<sup>1</sup>H: 8.91 (2H, m), 8.49 (1H, s), 8.11 (1H, s), 7.71 (1H, d d, J = 2.0, 12.7 Hz), 7.67 (1H, m d, J = 8.8 Hz), 7.23 (1H, t, J = 8.8 Hz), 4.21 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.36 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 3.02 (2H, m br), 2.95 (3H, s), 2.11 (2H, d q, J = 4.0, 12.8 Hz), 1.92 (2H, d br, J = 12.8 Hz)

40

化合物No. 535 (融点: 141 ~ 142). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 149.6, 144.4, 137.9, 135.2, 131.4, 129.1, 128.3, 127.2, 125.6, 118.1, 115.3, 109.1, 62.8, 57.6, 55.6, 52.5, 32.8, 29.8, 28.5

<sup>1</sup>H: 8.49 (1H, d d, J = 1.0, 1.4 Hz), 8.12 (1H, d d, J = 1.0, 8.7 Hz), 7.82 (1H, d d, J = 1.4, 8.7 Hz), 7.43-7.20 (5H, m), 4.32-4.20 (1H, 2s br), 3.54 (2H, s), 3.21 (3H, s), 3.03 (2H, s br), 2.18 (2H, s br), 2.01 (2H, m br), 1.94 (2H, m br)

50

化合物No. 536 (融点: 173~174). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.2 (d, J = 240.0 Hz), 151, 144 (d, J = 12.5 Hz), 139.9 (d, J = 2.4 Hz), 137.5, 125.4 (d, J = 7.0 Hz), 121 (d, J = 3.0 Hz), 117.9 (d, J = 3.5 Hz), 113.4, 112.5 (d, J = 19.4 Hz), 55.2, 51.7, 51.3, 31.5, 27.8, 12

<sup>1</sup>H: 9.88 (1H, s), 8.08 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d d, J = 2.0, 12.5 Hz), 7.48 (1H, d d d, J = 1.0, 2.0, 8.5 Hz), 6.95 (1H, d d, J = 8.5, 9.2 Hz), 3.85 (1H, m br), 3.02 (2H, m br), 2.93 (3H, s), 2.40 (2H, m br), 1.98 (2H, m br), 1.85 (2H, m br), 1.77 (2H, m br), 1.02 (3H, m br)

10

化合物No. 537 (融点: 144~146). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.9 (d, J = 246.2 Hz), 151.4, 147.8 (d, J = 11.0 Hz), 141.5, 136.8, 129.6 (d, J = 3.8 Hz), 117.3 (d, J = 6.8 Hz), 116.1 (d, J = 19.0 Hz), 113.1, 110.3 (d, J = 1.5 Hz), 56.2, 55.8, 52.2, 52.1, 31.6, 28.8, 12.2

<sup>1</sup>H: 7.90 (1H, s), 7.49 (1H, d d, J = 1.7, 8.5 Hz), 7.45 (1H, s), 7.24 (1H, m), 7.08 (1H, d d, J = 8.6, 11.1 Hz), 4.03 (1H, m), 3.96 (3H, s), 3.08 (2H, d br, J = 11.2 Hz), 3.02 (3H, s), 2.44 (2H, q, J = 7.4 Hz), 2.05 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.95 (2H, d q, J = 2.6, 11.9 Hz), 1.83 (2H, d br, J = 10.5 Hz), 1.10 (3H, t, J = 7.4 Hz)

20

化合物No. 538 (融点: 44~46). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.7, 145.2, 133.1, 129.3, 125.2, 119.8, 113.6, 40, 38

<sup>1</sup>H: 8.11 (1H, d, J = 8.4 Hz), 8.0 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.60 (1H, m t, J = 7.6 Hz), 7.46 (1H, m t, J = 7.7 Hz), 3.34 (6H, 2 s br)

化合物No. 539 (融点: 90~91). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 156.8, 149.9, 149.2, 126, 123.9, 123, 40, 38.3

<sup>1</sup>H: 8.82 (1H, d d, J = 1.6, 4.4 Hz), 8.42 (1H, d d, J = 1.6, 8.5 Hz), 7.57 (1H, d d, J = 4.4, 8.5 Hz), 3.49, 3.31 (6H, 2s)

30

化合物No. 540 (融点: 164). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.7 (d, J = 242.5 Hz), 151, 146.2 (d, J = 10.5 Hz), 139.5 (d, J = 2.5 Hz), 137.6, 126.7 (d, J = 7.3 Hz), 120.9 (d, J = 3.0 Hz), 114 (2 C), 112.2 (d, J = 9.4 Hz), 60, 58.8, 56, 55.5, 52.8, 31.5, 28.2

<sup>1</sup>H: 8.09 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.66 (1H, d d, J = 2.0, 13.5 Hz), 7.63 (1H, m), 7.19 (1H, t, J = 8.7 Hz), 4.41 (1H, t, J = 5.3 Hz), 3.85 (3H, s), 3.80 (1H, m), 3.48 (2H, m), 2.95 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 2.93 (3H, s), 2.38 (2H, t, J = 6.4 Hz), 2.01 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.81 (2H, d q, J = 3.6, 12.1 Hz), 1.69 (2H, d br, 12.0 Hz)

40

化合物No. 541 (融点: 220~221). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 152.5 (d, J = 245.0 Hz), 151.5, 147.1 (d, J = 10.0 Hz), 141.2 (d, J = 3.0 Hz), 136.9, 126.4 (d, J = 7.0 Hz), 120.9 (d, J = 3.5 Hz), 118.7, 113.5 (d, J = 2.0 Hz), 113.1 (d, J = 19.0 Hz), 112.6, 56.3, 55.3, 53, 52.2, 31.7, 28.7, 16.3

<sup>1</sup>H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.50 (2H, m), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.0 (1H, t, J = 8.5 Hz), 4.04 (1H, m), 3.93 (3H, s), 3.03 (3H, s), 3.02 (2H, m), 2.71 (2H, t, J = 7.0 Hz), 2.52 (2H, t, J = 7.0 Hz), 2.22 (2H, d t, J = 2.0, 11.5 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.5, 12.2 Hz), 1.83 (2H, d br, J = 12.2 Hz)

化合物No. 542 (融点: 175). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

50



<sup>13</sup>C: 151, 150.3, 140.2, 139.8, 137.3, 119.4, 115.6, 66.9, 54.5, 31.9, 29.5  
<sup>1</sup>H: 8.63 (2H, m d, J = 4.6 Hz), 7.95 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.69 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.67 (2H, m d, J = 4.6 Hz), 4.28 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.7, 11.5 Hz), 3.50 (2H, d t, J = 2.1, 12.0 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.9, 12.5 Hz), 1.78 (2H, m d, J = 12.3 Hz)

化合物No. 543 (融点: 173 ~ 174 (dec.)). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 150.8, 139.3, 138.5, 137.5, 131.3, 121.8, 115.3, 66.9, 54.6, 31.9, 29.5  
<sup>1</sup>H: 8.22 (2H, d, J = 6.8 Hz), 7.93 (1H, s), 7.68 (2H, d, J = 6.8 Hz), 7.62 (1H, s), 4.28 (1H, m), 4.10 (2H, d d, J = 4.0, 11.7 Hz), 3.51 (2H, t, J = 11.7 Hz), 3.04 (3H, s), 1.95 (2H, d q, J = 4.5, 12.2 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

10

化合物No. 544 (融点: 163 ~ 164). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.1, 158.2, 151.6, 149.4, 142.1, 136.8, 136.4, 126.4, 125.7, 123.2, 122.1, 114.1, 112, 64.3, 55.6, 55.3, 52.8, 31.6, 28.8  
<sup>1</sup>H: 8.59 (1H, m d, J = 4.9 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.66 (1H, d t, J = 1.8, 7.7 Hz), 7.39 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.36 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.18 (1H, d d d, J = 1.0, 4.9, 7.4 Hz), 6.94 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 4.04 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.66 (2H, s), 3.02 (2H, m), 3.01 (3H, s), 2.20 (2H, d t, J = 1.8, 12.0 Hz), 1.97 (2H, d q, J = 3.8, 12.2 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

20

化合物No. 545 (融点: 127 ~ 128). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.9 (d, J = 246.5 Hz), 151.4, 147.8 (d, J = 11.0 Hz), 141.4, 136.8, 129.6 (d, J = 4.0 Hz), 117.3 (d, J = 7.0 Hz), 116.1 (d, J = 18.8 Hz), 113.1, 110.3 (d, J = 2.0 Hz), 60.4, 56.2, 55.8, 52.6, 31.6, 28.8, 20.2, 11.9  
<sup>1</sup>H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.49 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 7.45 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.24 (1H, m), 7.09 (1H, d d, J = 8.3, 11.0 Hz), 4.02 (1H, m), 3.96 (3H, s), 3.05 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.02 (3H, s), 2.31 (2H, m), 2.05 (2H, d t, J = 2.0, 12.0 Hz), 1.94 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.80 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 1.51 (2H, m), 0.91 (3H, t, J = 7.5 Hz)

30

化合物No. 546 (融点: 240 ~ 241). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 163.6, 161.9, 158.5, 151.3, 151.1, 151, 147.1, 140.6, 137.5, 133.9, 128.6, 126.1, 126, 125, 124.4, 114, 113.1, 55.1, 55, 45.9, 41.3, 31.8, 28.9, 28.1  
<sup>1</sup>H: 9.18 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.71 (1H, d d, J = 1.6, 4.9 Hz), 8.35 (1H, t d, J = 1.8, 7.9 Hz), 8.27 (1H, s), 8.11 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.90 (1H, d, J = 1.0 Hz), 7.77 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.58 (1H, d d, J = 4.9, 7.9 Hz), 6.96 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 4.64 (1H, d br, J = 12.0 Hz), 4.37 (1H, d br, J = 12.0 Hz), 4.22 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.25 (1H, m), 2.97 (3H, s), 2.92 (1H, m), 1.88 (4H, m)

40

化合物No. 547 (融点: 204 ~ 205). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 168.8, 159.2, 151.6, 142.3, 136.9, 126.4, 125.6, 114.1, 111.9, 55.3 (2 s ig.), 45.5, 40.7, 31.9, 29.1, 28.4, 21.4  
<sup>1</sup>H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.94 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 4.82 (1H, m d, J = 13.5 Hz), 4.27 (1H, m), 3.95 (1H, m d, J = 14.0 Hz), 3.84 (3H, s), 3.18 (1H, d t, J = 2.5, 13.5 Hz), 3.0 (3H, s), 2.61 (1H, d t, J = 2.5, 13.0 Hz), 2.13 (3H, s), 1.93 (1H, m), 1.88 (1H, m), 1.74 (2H, m)

50

化合物No. 548 (融点: 196~197). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 168.8, 151.2, 148.6, 146.7, 139.4, 137.4, 132.5, 128.8, 123.6, 113.8, 55.4, 45.4, 40.6, 32, 29.1, 28.3, 21.4

<sup>1</sup>H: 9.0 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.6, 4.9 Hz), 8.11 (1H, d d d, J = 1.8, 2.2, 7.9 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.59 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 0.9, 4.9, 8.0 Hz), 4.83 (1H, m d, J = 13.5 Hz), 4.28 (1H, m), 3.96 (1H, m d, J = 14.0 Hz), 3.19 (1H, m t, J = 2.7, 13.5 Hz), 3.01 (3H, s), 2.61 (1H, d t, J = 2.8, 13.2 Hz), 2.13 (3H, s), 1.94 (1H, m), 1.89 (1H, m), 1.75 (2H, m)

10

化合物No. 549 (融点: 206~207). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.2, 151.6, 142.3, 137.3, 136.8, 132.0 (q, J = 34.0 Hz), 130.7, 130.1, 129.7 (q, J = 3.8 Hz), 126.4, 125.5, 124.5 (q, J = 3.8 Hz), 123.1 (q, J = 273.0 Hz), 114.1, 111.9, 55.3, 54.2, 45.6, 31.9, 28.0

<sup>1</sup>H: 8.03 (1H, t br), 7.97 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.90 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.87 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.70 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.36 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.93 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 4.01 (3H, m), 3.84 (3H, s), 3.02 (3H, s), 2.42 (2H, d t, J = 2.8, 11.8 Hz), 2.0 (2H, d q, J = 4.0, 12.3 Hz), 1.93 (2H, d br)

20

化合物No. 550 (融点: 89~101 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 167.9, 151, 140.5, 140.1, 140, 138.5, 137.7, 135, 134.1, 129.6, 129.4, 129, 128.8, 128.2, 127, 126.7, 125.8, 125.6, 124.2, 123.1, 114.9, 61.9, 55.5, 52.2, 31.6, 28.2

<sup>1</sup>H: 8.20 (1H, t, J = 1.6 Hz), 8.18 (1H, t, J = 1.7 Hz), 8.15 (2H, s), 8.14 (1H, s br), 7.88 (3H, m), 7.62 (1H, d d d, J = 1.2, 1.8, 7.8 Hz), 7.57 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.51 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.47 (1H, s br), 7.37-7.20 (5H, m), 3.85 (1H, m), 3.47 (2H, s), 2.96 (3H, s), 2.90 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 2.01 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.84 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.73 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

30

化合物No. 551 (融点: 258~260 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 160.1, 157.3, 150.6, 139.4, 138.1, 137.1, 126.5, 125.3, 121.5, 116.2, 56.9, 31.4, 29, 25.2, 24.8

<sup>1</sup>H: 12.94 (1H, s br), 8.19 (1H, s), 8.18 (1H, s), 8.04 (2H, m d, J = 8.4 Hz), 7.83 (2H, m d, J = 8.4 Hz), 3.82 (1H, m br), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q, J = 13.0 Hz), 1.11 (1H, q, J = 13.0 Hz)

化合物No. 552 (融点: 126 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 164.2, 150.9, 140, 137.8, 133.6, 133.3, 128.7, 127.3, 125.4, 123.3, 115, 59.6, 55.6, 52.4, 31.5, 28.2, 19.8, 11.9

<sup>1</sup>H: 11.25 (1H, s br), 9.09 (1H, s br), 8.23 (1H, t, J = 1.7 Hz), 8.15 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.05 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.97 (1H, m d, J = 7.9 Hz), 7.62 (1H, m d, J = 7.8 Hz), 7.46 (1H, t, J = 7.7 Hz), 3.81 (1H, m), 2.94 (3H, s), 2.93 (2H, m), 2.22 (2H, m), 1.91 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.81 (2H, d q, J = 3.2, 11.7 Hz), 1.72 (2H, d br, J = 11.7 Hz), 1.42 (2H, m), 0.84 (3H, t, J = 7.5 Hz)

40

化合物No. 553 (融点: 271~272). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 156.2, 150.7, 139.7, 137.8, 135.7, 134.9, 130, 123.1, 122.8, 120.7, 115.2, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.8

<sup>1</sup>H: 10.12 (1H, s), 8.16 (1H, s), 8.10 (1H, s), 7.77 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.71

50

(1H, t br), 7.60 (4H, s br), 7.45 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.11 (1H, d d, J = 1.3, 7.9 Hz), 3.81 (1H, m br), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.11 (1H, q, J = 13.0 Hz)

化合物No. 554 (融点: 187~188). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 172.1, 160.3, 151, 140.2, 137.4, 130.5, 124.4, 124.2, 117.7, 114.4, 113.3, 59.5, 55.4, 52.3, 31.6, 28, 19.7, 11.9

<sup>1</sup>H: 13.03 (1H, s), 8.50 (1H, s br), 8.32 (1H, d, J = 2.0 Hz), 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.97 (1H, s br), 7.88 (1H, d d, J = 2.0, 8.5 Hz), 7.86 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.91 (1H, d, J = 8.5 Hz), 3.84 (1H, m), 2.98 (2H, m), 2.95 (3H, s), 2.26 (2H, m), 1.97 (2H, br), 1.84 (2H, q, J = 12.5 Hz), 1.73 (2H, d, J = 11.5 Hz), 1.44 (2H, m), 0.84 (3H, t, J = 7.3 Hz)

10

化合物No. 555 (融点: 219~222). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 158.4, 149, 137, 135.4, 127.2, 118.7, 115.9, 114.2, 52.7, 42.5, 32, 24.8

<sup>1</sup>H: 9.89 (1H, br), 9.3 (1H, s), 8.7 (1H, d, J = 10.5 Hz), 8.42 (1H, q, J = 10.5 Hz), 8.24 (1H, s), 7.68 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 6.88 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 4.22 (1H, m), 3.40 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.06 (2H, q br, J = 11.5 Hz), 2.97 (3H, s), 2.09 (2H, d q, J = 3.5, 12.5 Hz), 1.96 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

20

化合物No. 556 (融点: 141). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.7, 142.4, 141.4, 140.3, 138.1, 136.8, 129.1, 128.8, 128.3, 127.1, 119.4, 115.4, 112.3, 111.9, 62.8, 55.8, 52.5, 43.5, 31.6, 28.9

<sup>1</sup>H: 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.38 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.36-7.23 (5H, m), 7.21 (1H, d, J = 2.0 Hz), 7.15 (1H, d d, J = 2.0, 8.2 Hz), 7.03 (1H, d, J = 8.2 Hz), 4.01 (3H, m), 3.52 (2H, s), 3.0 (3H, s), 2.99 (2H, m), 2.69 (6H, s), 2.09 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.92 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.77 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物No. 557 (融点: 183~184). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

30

<sup>13</sup>C: 170.5, 163.9, 159.3, 151.7, 142.4, 136.9, 126.5, 125.5, 114.1, 111.9, 55.3, 54.9, 43.4, 32.1, 28.3

<sup>1</sup>H: 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 7.41 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.95 (2H, m d, J = 8.9 Hz), 4.97 (2H, m d, J = 13.5 Hz), 4.38 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.05 (2H, d t, J = 2.7, 13.5 Hz), 3.02 (3H, s), 2.02 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 1.82 (2H, d q, J = 4.5, 12.5 Hz)

化合物No. 558 (融点: 179 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 169.4, 150.9, 148.1, 146.2, 138.2, 137.8, 131.9, 129.1, 123.8, 115.5, 58.1, 54.1, 51.5, 31.5, 26.9

40

<sup>1</sup>H: 9.07 (1H, s), 8.46 (1H, m), 8.18 (3H, m), 7.43 (1H, m), 3.95 (1H, m), 3.31 (2H, s), 3.18 (2H, m), 2.96 (3H, s), 2.58 (2H, m), 2.0 (2H, q br, J = 12.0 Hz), 1.81 (2H, d br, J = 11.0 Hz)

化合物No. 559 (融点: 194~195). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.1, 156.1, 151.2, 148.6, 146.7, 144, 139.3, 137.3, 132.4, 128.9, 123.6, 118.8, 113.9, 110.9, 55.4, 54.5, 52.2, 51.9, 31.7, 28.6

<sup>1</sup>H: 9.0 (1H, d, J = 1.8 Hz), 8.52 (1H, d d, J = 1.5, 4.7 Hz), 8.10 (1H, t d, J = 1.8, 7.9 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.33 (1H, d d, J = 4.9, 7.9 Hz), 7.14 (1H, d, J = 3.5 Hz), 6.35 (1H, d, J = 3.5 Hz), 4.0 (

50

1H, m), 3.88 (3H, s), 3.64 (2H, s), 3.04 (2H, m), 3.02 (3H, s), 2.21 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.96 (2H, d q, J = 3.6, 12.0 Hz), 1.81 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物No. 560 (融点: 165). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 152.1, 151.5, 149.3, 142.6, 137.6, 136.9, 122.4, 119.8, 115.8, 67, 54.4, 31.8, 29.5

<sup>1</sup>H: 8.57 (1H, d d d, J = 1.0, 2.0, 4.8 Hz), 8.01 (1H, t d, J = 1.1, 8.1 Hz), 8.0 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.5 Hz), 7.76 (1H, t d, J = 1.8, 7.7 Hz), 7.20 (1H, d d d, J = 1.1, 4.8, 7.4 Hz), 4.31 (1H, m), 4.09 (2H, d d, J = 4.7, 11.6 Hz), 3.51 (2H, d t, J = 2.1, 12.0 Hz), 3.05 (3H, s), 1.94 (2H, d q, J = 4.5, 12.0 Hz), 1.78 (2H, m d, J = 12.3 Hz)

10

化合物No. 561 (融点: 201 ~ 202). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.1, 150.4 (d, J = 240.5 Hz), 144.9 (d, J = 12.5 Hz), 140, 137.7, 130.1 (d, J = 3.5 Hz), 116.3 (d, J = 18.5 Hz), 116.0 (d, J = 6.5 Hz), 114.3 (d, J = 2.5 Hz), 114.1, 52.1, 50.9, 50.2, 31.8, 25.3, 9.2

<sup>1</sup>H: 9.90 (1H, s), 9.36 (1H, s br), 8.13 (1H, s), 7.92 (1H, s), 7.46 (1H, d d, J = 2.0, 8.7 Hz), 7.25 (1H, m), 7.14 (1H, d d, J = 8.5, 11.3 Hz), 4.19 (1H, m), 3.58 (2H, m d, J = 11.5 Hz), 3.10 (4H, m), 2.94 (3H, s), 2.18 (2H, m q, J = 12.5 Hz), 2.0 (2H, d br, J = 12.5 Hz), 1.24 (3H, t, J = 7.2 Hz)

20

化合物No. 562 (融点: 190 ~ 192 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.3, 149.5, 137.2, 135.8, 126.5, 121.4, 121, 119.7, 116.7, 114.6, 58.7, 31.4, 28.2, 24.1

<sup>1</sup>H: 11.26 (1H, s br), 10.14 (3H, br), 8.96 (1H, s), 8.10 (1H, s), 7.84 (1H, d, J = 2.2 Hz), 7.74 (1H, d d, J = 2.2, 8.5 Hz), 7.19 (1H, d, J = 8.6 Hz), 4.36 (1H, m), 2.95 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.69 (4H, m), 1.53 (2H, m)

化合物No. 563 (融点: 250 ~ 252). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 155.3, 150.8, 140.1, 138.9, 137.7, 134.8, 129.8, 122.9, 121.7, 120.5, 114.9, 56.8, 31.3, 29, 25.2, 24.8

<sup>1</sup>H: 8.12 (1H, s), 8.03 (1H, s), 7.63 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.57 (1H, t br), 7.37 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.0 (3H, br), 6.98 (1H, d, J = 8.2 Hz), 3.8 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, m q, J = 12.5 Hz), 1.11 (1H, m q, J = 12.5 Hz)

30

化合物No. 564 (融点: 250). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 154.7, 151.1, 142.6, 140.3, 137.6, 130.8, 129.6, 118.6, 114.2, 109.6, 106, 58.4, 31.3, 28.2, 24

<sup>1</sup>H: 11.71 (1H, br), 8.10 (1H, d, J = 1.2 Hz), 8.0 (1H, d, J = 1.2 Hz), 7.59 (1H, d d, J = 1.7, 8.3 Hz), 7.53 (1H, d, J = 1.7 Hz), 7.29 (1H, d, J = 8.3 Hz), 4.36 (1H, m), 2.93 (3H, s), 1.87 (2H, m), 1.68 (4H, m), 1.53 (2H, m)

40

化合物No. 565 (融点: 188 ~ 189). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.5, 146.7, 142.2, 138, 136.8, 133.9, 129.6, 129.1, 128.3, 127.2, 115.5, 114.4, 113.1, 111.9, 62.8, 55.8, 52.5, 31.6, 28.9

<sup>1</sup>H: 7.90 (1H, s), 7.45 (1H, s), 7.38-7.24 (5H, m), 7.21 (1H, t br), 7.17 (1H, m), 7.16 (1H, m), 6.63 (1H, m d, J = 7.5 Hz), 4.02 (1H, m), 3.74 (2H, s), 3.52 (2H, s), 3.01 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.10 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.93 (2H, d q, J = 3.3, 12.0 Hz), 1.78 (2H, d br, J = 11.0 Hz)

50

化合物No. 566 (融点: 196). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 163.9, 149.6, 137.8, 136.9, 133.5, 130.7, 129.1, 127.7, 126.4, 123.9, 115.9, 67.9, 56.5, 34.1, 31.5, 26.7

<sup>1</sup>H: 11.30 (1H, br), 8.81 (1H, s), 8.29 (1H, s), 8.25 (1H, s), 7.98 (1H, t d, J = 1.4, 7.9 Hz), 7.70 (1H, t d, J = 1.2, 7.9 Hz), 7.54 (1H, t, J = 7.8 Hz), 3.85 (1H, m), 3.41 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.90 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 7.71 (4H, m), 1.25 (2H, q br, J = 12.3 Hz)

化合物No. 567 (融点: 219~220). NMR 溶媒: DMSO

10

<sup>13</sup>C: 150.7, 139, 138.8, 138.5, 138.4, 138.3, 128.8, 128.2, 127.6, 127, 125.2, 116.8, 61.9, 55.6, 52.2, 43.7, 31.6, 28.2

<sup>1</sup>H: 8.25 (1H, d, J = 1.1 Hz), 8.20 (1H, d, J = 1.1 Hz), 8.10 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.93 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.36-7.20 (5H, m), 3.83 (1H, m), 3.46 (2H, s), 3.22 (3H, s), 2.95 (3H, s), 2.90 (2H, m d, J = 11.0 Hz), 2.0 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.83 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.72 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物No. 568 (融点: 193~194). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 158.3, 148.9, 137.0, 136.9, 135.3, 131.6, 131.3, 130.1 (q, J = 33.0 Hz), 130.0 (q, J = 3.5 Hz), 127.1, 123.8 (q, J = 4.2 Hz), 123.4 (q, J = 273.0 Hz), 118.8, 115.9, 114.2, 54.3, 45.2, 31.9, 27.3

20

<sup>1</sup>H: 9.88 (1H, br), 9.21 (1H, s), 8.17 (1H, s), 8.14 (1H, d br, J = 7.8 Hz), 8.10 (1H, d br, J = 8.0 Hz), 7.99 (1H, t br), 7.92 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.64 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 6.86 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 3.91 (1H, m), 3.84 (2H, m), 2.94 (3H, s), 2.48 (2H, m), 1.86 (4H, m)

化合物No. 569 (融点: 157~158). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 157.9, 151.2, 149.5, 148.5, 146.7, 139.3, 137.3, 136.4, 132.4, 128.9, 123.6, 123.3, 122.2, 113.9, 64.2, 55.7, 52.7, 31.7, 28.7

<sup>1</sup>H: 9.0 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.59 (1H, d d d, J = 1.0, 1.8, 4.9 Hz), 8.53 (1H, d d, J = 1.6, 4.8 Hz), 8.11 (1H, d d d, J = 1.8, 2.2, 7.9 Hz), 7.94 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.67 (1H, d t, J = 1.9, 7.7 Hz), 7.57 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.37 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.34 (1H, d d d, J = 0.8, 4.8, 7.9 Hz), 7.19 (1H, d d d, J = 1.0, 4.9, 7.7 Hz), 4.05 (1H, m), 3.68 (2H, s), 3.04 (2H, m d, J = 12.0 Hz), 3.03 (3H, s), 2.23 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 2.01 (2H, d q, J = 3.5, 12.0 Hz), 1.79 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

30

化合物No. 570 (融点: 206~207). NMR 溶媒: MeOD

<sup>13</sup>C: 153.2, 152.8 (d, J = 241.0 Hz), 146.6 (d, J = 13.5 Hz), 142.5, 139.2, 131.0 (d, J = 3.5 Hz), 118.0 (d, J = 6.5 Hz), 117.3 (d, J = 19.3 Hz), 116.0 (d, J = 3.0 Hz), 115.1, 60.0, 55.2, 53.3, 33.3, 27.4, 19.5, 11.6

40

<sup>1</sup>H: 8.12 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.75 (1H, d, J = 1.4 Hz), 7.36 (1H, d d, J = 2.3, 8.5 Hz), 7.22 (1H, m), 7.06 (1H, d d, J = 8.4, 11.0 Hz), 4.22 (1H, m), 3.60 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 3.07 (3H, s), 2.98 (4H, m), 2.25 (2H, d q, J = 3.0, 13.0 Hz), 2.12 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 1.76 (2H, m), 1.02 (3H, t, J = 7.5 Hz)

化合物No. 571 (融点: 182). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 163.7, 150.3, 138.1, 138, 134.1, 131.7, 131.4, 129.7, 129.7, 129, 127.5, 124.8, 116.1, 59, 52.3, 50.5, 31.9, 25

<sup>1</sup>H: 11.29 (1H, br), 9.65 (1H, s br), 8.59 (1H, s), 8.27 (1H, s), 7.93 (2H, m

50

d,  $J = 8.5$  Hz), 7.81 (2H, m d,  $J = 8.6$  Hz), 7.56 (2H, m), 7.48 (3H, m), 4.32 (2H, d,  $J = 5.0$  Hz), 4.19 (1H, m), 3.46 (2H, d br,  $J = 12.0$  Hz), 3.17 (2H, m), 3.95 (3H, s), 2.21 (2H, q br,  $J = 13.0$  Hz), 2.0 (2H, d br,  $J = 12.5$  Hz)

化合物No. 572 (融点: 223). NMR 溶媒: DMSO

$^{13}\text{C}$ : 171.3, 160.9, 149.5, 137.4, 136, 131.5, 130.8, 129.7, 129.7, 128.9, 125.9, 120, 118, 115.1, 114.7, 59, 52.4, 50.5, 32, 24.9

$^1\text{H}$ : 13.0 (1H, br), 9.77 (1H, s), 9.06 (1H, s), 8.47 (1H, s), 8.44 (1H, s), 8.23 (1H, s), 8.08 (1H, s), 7.89 (1H, d,  $J = 8.5$  Hz), 7.59 (2H, m), 7.49 (3H, m), 7.02 (1H, d,  $J = 8.5$  Hz), 4.35 (2H, d,  $J = 4.0$  Hz), 4.26 (1H, m), 3.48 (2H, d br,  $J = 11.0$  Hz), 3.18 (2H, m), 3.0 (3H, s), 2.26 (2H, q br,  $J = 12.0$  Hz), 2.02 (2H, d br,  $J = 12.5$  Hz)

10

化合物No. 573 (融点: 173 ~ 174). NMR 溶媒:  $\text{CDCl}_3$

$^{13}\text{C}$ : 165.1, 164.9, 159.2, 151.7, 151.6, 150.4, 150.2, 147.1, 146.8, 142.3, 142.3, 136.9, 136.9, 136.8, 132, 131.8, 126.4, 125.5, 125.5, 122.8, 122.8, 114.1, 111.9, 111.8, 55.3, 55.2, 54.9, 46.4, 45.6, 41, 40.9, 32.3, 32, 28.9, 28.9, 28.3, 28.2

$^1\text{H}$ : 8.48 (1H, d d,  $J = 1.8, 4.8$  Hz), 7.91 (1H, m), 7.71 (2H, m d,  $J = 8.8$  Hz), 7.71 and 7.64 (1H, 2 m), 7.40 (1H, m), 7.35 (1H, d d,  $J = 4.9, 7.5$  Hz), 6.94 (2H, m d,  $J = 8.8$  Hz), 4.98 (1H, m), 4.32 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.54 (1H, m), 3.34 and 3.15 (1H, 2 m), 3.04 and 3.03 (3H, 2 s), 2.89 (1H, m), 2.11-1.58 (4H, m)

20

化合物No. 574 (融点: 242 ~ 243). NMR 溶媒: DMSO

$^{13}\text{C}$ : 168.1, 156.7, 151.2, 141, 137.4, 126.1, 124.5, 115.4, 112.5, 55.1, 44.9, 40, 31.6, 28.6, 28, 21.4

$^1\text{H}$ : 9.46 (1H, s), 8.07 (1H, s), 7.79 (1H, s), 7.64 (2H, d,  $J = 8.0$  Hz), 6.77 (2H, d,  $J = 8.0$  Hz), 4.50 (1H, d,  $J = 12.5$  Hz), 4.09 (1H, m br), 3.90 (1H, d,  $J = 12.5$  Hz), 3.10 (1H, m), 2.91 (3H, s), 2.50 (1H, m), 2.01 (3H, s), 1.78 (3H, m), 1.61 (1H, m)

30

化合物No. 575 (融点: 233 ~ 234). NMR 溶媒: DMSO

$^{13}\text{C}$ : 156.2, 153.3, 150.9, 139.8, 137.6, 126.6, 125.2, 124.2, 123.1, 113.8, 112.8, 56.8, 55.9, 31.3, 29, 25.2, 24.8

$^1\text{H}$ : 9.13 (1H, s), 8.10 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.97 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.83 (1H, d d,  $J = 2.3, 8.6$  Hz), 7.69 (1H, d,  $J = 2.3$  Hz), 7.21 (3H, s br), 7.19 (1H, d,  $J = 8.6$  Hz), 3.85 (3H, s), 3.80 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.59 (3H, m), 1.29 (2H, q br,  $J = 12.5$  Hz), 1.11 (1H, q br,  $J = 12.5$  Hz)

化合物No. 576 (融点: 137 ~ 138). NMR 溶媒: DMSO

$^{13}\text{C}$ : 155.8, 150.7, 139.7, 137.9, 134.5, 129.7, 127.1, 125.4, 125.2, 123.1, 115.3, 56.8, 31.4, 29, 25.2, 24.9

$^1\text{H}$ : 8.56 (1H, s br), 8.19 (1H, s), 8.13 (1H, s), 8.02 (1H, m d,  $J = 7.9$  Hz), 7.91 (1H, m d,  $J = 7.8$  Hz), 7.61 (1H, t,  $J = 7.9$  Hz), 3.83 (1H, m), 2.95 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q br,  $J = 13.0$  Hz), 1.12 (1H, q br,  $J = 13.0$  Hz)

40

化合物No. 577 (融点: 146 ~ 147). NMR 溶媒: DMSO

$^{13}\text{C}$ : 151.3, 148, 141.7, 138.5, 137.1, 128.8, 128.2, 127, 125.8, 121.2, 113.9, 111.4, 61.9, 55.5, 52.3, 31.4, 28.3

50

<sup>1</sup>H: 8.0 (1H, s), 7.65 (1H, s), 7.49 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 7.36-7.21 (5H, m), 6.56 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 5.13 (2H, s), 3.80 (1H, m), 3.46 (2H, s), 2.92 (3H, s), 2.88 (2H, d br, J = 13.0 Hz), 1.99 (2H, t br, J = 11.0 Hz), 1.81 (2H, d q, J = 3.0, 12.0 Hz), 1.70 (2H, d br, J = 11.5 Hz)

化合物No. 578 (融点: 167~168). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 150.8, 142.3, 139.3, 138.1, 136.6, 129, 128.7, 128.3, 127.1, 126.2, 124.9, 116.2, 61.8, 55.4, 52.1, 31.6, 28

<sup>1</sup>H: 8.18 (2H, 2 s), 8.03 (2H, m d, J = 8.6 Hz), 7.83 (2H, m d, J = 8.6 Hz), 7.40-7.20 (5H, m), 7.28 (2H, s br), 3.86 (1H, m br), 3.49 (2H, br), 2.95 (5H, m), 2.02 (2H, br), 1.87 (2H, br), 1.76 (2H, br)

10

化合物No. 579 (融点: 168). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.1, 148, 141.7, 137, 125.8, 121.3, 113.9, 111.4, 56.8, 31.3, 29.1, 25.2, 24.9

<sup>1</sup>H: 8.0 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.64 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.48 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 6.56 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 5.13 (2H, s), 3.80 (1H, m), 2.91 (3H, s), 1.77 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.29 (2H, m, J = 12.6 Hz), 1.11 (1H, m, J = 12.6 Hz)

化合物No. 580 (融点: 183~184). NMR 溶媒: DMSO

20

<sup>13</sup>C: 150.9, 140.6, 138.5, 137.4, 127.3, 125.3, 118, 113.4, 56.8, 31.3, 29, 25.2, 24.9

<sup>1</sup>H: 9.55 (1H, s br), 8.07 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.16 (2H, m d, J = 8.7 Hz), 7.13 (2H, s br), 3.81 (1H, m), 2.92 (3H, s), 1.78 (4H, m), 1.57 (3H, m), 1.29 (2H, q br, J = 12.7 Hz), 1.11 (1H, m q, J = 12.5 Hz)

化合物No. 581 (融点: 182 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 155.7, 153, 151, 140.1, 138.5, 137.5, 128.8, 128.2, 127, 126.5, 123.6 (2 sig.), 113.5, 112.6, 61.9, 55.7, 55.5, 52.2, 31.5, 28.2

30

<sup>1</sup>H: 8.09 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.93 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (1H, d d, J = 1.7, 8.6 Hz), 7.59 (1H, s br), 7.36-7.21 (5H, m), 7.12 (1H, d, J = 8.6 Hz), 7.01 (4H, br), 3.81 (1H, m), 3.81 (3H, s), 3.47 (2H, s), 2.93 (3H, s), 2.90 (2H, d br, J = 11.5 Hz), 1.99 (2H, t br, J = 11.2 Hz), 1.83 (2H, d q, J = 3.5, 12.1 Hz), 1.71 (2H, d br, J = 12.5 Hz)

化合物No. 582 (融点: 199~200). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.3, 151.7, 142.4, 136.9, 126.5, 125.5, 117.4, 114.1, 111.8, 55.3, 53.8, 49, 32.2, 27.7

<sup>1</sup>H: 7.91 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 7.39 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.95 (2H, m d, J = 8.8 Hz), 4.19 (1H, m), 3.85 (3H, s), 3.59 (2H, m d, J = 13.5 Hz), 3.19 (2H, d t, J = 2.9, 12.9 Hz), 3.06 (3H, s), 2.0 (2H, d q, J = 4.4, 12.3 Hz), 1.91 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

40

化合物No. 583 (融点: 166~167). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 159.2, 151.6, 142.2, 136.8, 126.5, 125.6, 114.5, 114.1, 112, 55.3, 54.5, 51.5, 46, 31.9, 28.3

<sup>1</sup>H: 7.90 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.72 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 7.40 (1H, d, J = 1.3 Hz), 6.94 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 4.07 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.54 (2H, s), 3.03 (3H, s), 2.94 (2H, m d, J = 11.5 Hz), 2.51 (2H, d t, J = 3.0, 11.5 Hz), 1.97 (

50

2H, d q,  $J = 4.0, 12.0$  Hz), 1.90 (2H, m)

化合物No. 584 (融点: 189 ~ 191). NMR 溶媒: CDCl<sub>3</sub>

<sup>13</sup>C: 151.2, 148.6, 146.7, 139.4, 137.3, 132.5, 128.9, 123.6, 114.5, 113.8, 54.7, 51.4, 45.9, 32, 28.3

<sup>1</sup>H: 9.02 (1H, d,  $J = 2.0$  Hz), 8.55 (1H, d d,  $J = 1.7, 4.9$  Hz), 8.13 (1H, t d,  $J = 1.9, 8.0$  Hz), 7.96 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.59 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.35 (1H, d d,  $J = 4.9, 8.0$  Hz), 4.08 (1H, m), 3.55 (2H, s), 3.05 (3H, s), 2.96 (2H, d br,  $J = 11.4$  Hz), 2.53 (2H, d t,  $J = 3.0, 11.5$  Hz), 1.98 (2H, d q,  $J = 3.9, 12.0$  Hz), 1.92 (2H, m)

10

化合物No. 585 (融点: 197 ~ 198 (dec)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 157.8, 149.8, 137.6, 137.1, 131.1, 130, 116.1, 115.4, 115.3, 112.1, 57.3, 52.3, 50.7, 31.9, 25.1, 17, 11

<sup>1</sup>H: 9.39 (1H, s), 8.90 (1H, s), 8.21 (1H, s), 7.26 (3H, m), 6.78 (1H, m), 4.22 (1H, m), 3.59 (2H, d br,  $J = 11.5$  Hz), 3.12 (2H, q br,  $J = 11.5$  Hz), 3.0 (2H, m), 2.97 (3H, s), 2.23 (2H, d q,  $J = 3.0, 13.0$  Hz), 2.0 (2H, d br,  $J = 12.5$  Hz), 1.70 (2H, m), 0.91 (3H, t,  $J = 7.5$  Hz)

化合物No. 586 (融点: 183 (dec.)). NMR 溶媒: MeOD

20

<sup>13</sup>C: 150.1, 149.1, 147.6, 137.9, 136.6, 119.3, 118.8, 117.1, 116, 114.4, 59.8, 55.1, 53, 33.7, 26.9, 18.9, 11.4

<sup>1</sup>H: 9.31 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 8.09 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.17 (1H, d,  $J = 2.2$  Hz), 7.10 (1H, d d,  $J = 2.2, 8.2$  Hz), 6.90 (1H, d,  $J = 8.2$  Hz), 4.33 (1H, m), 3.74 (2H, d br,  $J = 12.5$  Hz), 3.19 (2H, d t,  $J = 2.8, 13.0$  Hz), 3.11 (3H, s), 3.11 (2H, m), 2.36 (2H, d q,  $J = 3.2, 12.8$  Hz), 2.23 (2H, d br,  $J = 13.5$  Hz), 1.82 (2H, m), 1.04 (3H, t,  $J = 7.5$  Hz)

化合物No. 587 (融点: 153 ~ 156 (dec.)). NMR 溶媒: MeOD

<sup>13</sup>C: 158.7, 153.4, 152.4, 151.1, 143.5, 139.3, 139, 127.9, 125.6, 125.6, 125.5, 116.6, 113.8, 61.5, 54.8, 53.6, 33.3, 26.9

30

<sup>1</sup>H: 8.69 (1H, d,  $J = 5.0$  Hz), 8.11 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.92 (1H, d t,  $J = 1.7, 7.6$  Hz), 7.67 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.61 (2H, m d,  $J = 8.7$  Hz), 7.52 (1H, d,  $J = 7.9$  Hz), 7.47 (1H, d d,  $J = 5.0, 7.6$  Hz), 6.81 (2H, m d,  $J = 8.7$  Hz), 4.45 (2H, s), 4.28 (1H, m), 3.65 (2H, d br,  $J = 11.5$  Hz), 3.25 (2H, m), 3.09 (3H, s), 2.31 (2H, q br,  $J = 13.0$  Hz), 2.14 (2H, d br,  $J = 12.5$  Hz),

化合物No. 588 (融点: 184). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 151.1, 140.6, 138.5, 138.5, 137.4, 128.8, 128.2, 127.3, 127, 125.3, 118, 113.3, 61.9, 55.5, 52.2, 31.5, 28.2

40

<sup>1</sup>H: 9.55 (1H, s br), 8.08 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.88 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.73 (2H, m d,  $J = 8.7$  Hz), 7.36-7.20 (5H, m), 7.16 (2H, m d,  $J = 8.7$  Hz), 7.13 (2H, s br), 3.81 (1H, m), 3.46 (2H, s), 2.94 (3H, s), 2.89 (2H, m d,  $J = 11.0$  Hz), 2.0 (2H, t br,  $J = 11.0$  Hz), 1.83 (2H, d q,  $J = 3.0, 12.0$  Hz), 1.71 (2H, d br,  $J = 12.0$  Hz)

化合物No. 589 (融点: 126 ~ 129 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 152.8, 151.1, 148.9, 141.1, 138.5, 137.5, 134, 129.1, 128.8, 128.2, 127, 122, 119.6, 117.8, 114.1, 61.9, 55.5, 52.2, 31.5, 28.3

<sup>1</sup>H: 8.08 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.91 (1H, d,  $J = 1.3$  Hz), 7.37 (1H, t d,  $J = 1.$

50



3, 7.8 Hz), 7.33-7.23 (6H, m), 7.21 (1H, t, J = 7.7 Hz), 6.72 (1H, d, J = 7.9 Hz), 5.58 (4H, s br), 3.81 (1H, m), 3.46 (2H, s), 2.93 (3H, s), 2.89 (2H, m d, J = 11.5 Hz), 2.0 (2H, t br, J = 11.5 Hz), 1.82 (2H, d q, J = 3.3, 12.0 Hz), 1.71 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

化合物No. 590 (融点: 179 ~ 180). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 155.6, 150.9, 139.7, 138, 134.5, 129.8, 127.2, 125.5, 125, 123.1, 115.3, 66.3, 54.2, 31.7, 29.1

<sup>1</sup>H: 8.57 (1H, s), 8.22 (1H, s), 8.16 (1H, s), 8.04 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.92 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.62 (1H, t, J = 7.6 Hz), 4.12 (1H, m), 3.94 (2H, d d, J = 3.7, 11.2 Hz), 3.39 (2H, t, J = 11.5 Hz), 2.98 (3H, s), 1.87 (2H, d q, J = 4.3, 12.2 Hz), 1.71 (2H, d br, J = 12.0 Hz)

10

化合物No. 591 (融点: 187 ~ 188). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 160.1, 157.5, 150.7, 139.4, 138, 134.5, 129.7, 128.2, 124.5, 123.8, 122.2, 115.5, 56.8, 31.4, 29, 25.1, 24.8

<sup>1</sup>H: 13.0 (1H, s br), 8.32 (1H, t, J = 1.5 Hz), 8.19 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.11 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.06 (1H, t d, J = 1.5, 7.8 Hz), 7.68 (1H, t d, J = 1.5, 7.8 Hz), 7.59 (1H, t, J = 7.8 Hz), 3.83 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.79 (4H, m), 1.58 (3H, m), 1.30 (2H, q br, J = 13.5 Hz), 1.58 (1H, m)

20

化合物No. 592 (融点: 148 ~ 149). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 158.5, 155.6, 151, 140.6, 137.5, 126.1, 126, 114, 113.1, 55.5, 55.1, 45.7, 31.6, 27.6

<sup>1</sup>H: 8.31 (1H, s), 8.09 (1H, s), 7.88 (1H, s), 7.77 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 6.95 (2H, m d, J = 8.5 Hz), 5.20 (2H, s), 3.95 (1H, m br), 3.78 (3H, s), 3.69 (2H, d br, J = 12.0 Hz), 2.92 (3H, s), 2.53 (2H, m), 1.78 (2H, q br, J = 12.5 Hz), 1.70 (2H, m)

化合物No. 593 (融点: 100 ~ 103 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

30

<sup>13</sup>C: 150.9, 140.2, 138.8, 138.4, 137.7, 134.5, 129.6, 128.9, 128.2, 127, 120.5, 118.6, 116.2, 114.8, 61.8, 55.5, 52.2, 39.2, 31.5, 28.1

<sup>1</sup>H: 9.78 (1H, s), 8.12 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.96 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.73 (1H, t br, J = 1.8 Hz), 7.56 (1H, m d, J = 8.0 Hz), 7.33 (1H, t, J = 8.0 Hz), 7.38-7.20 (5H, m), 7.11 (1H, m d, J = 8.0 Hz), 3.83 (1H, m br), 3.48 (2H, br), 3.0 (3H, s), 2.94 (3H, s), 2.90 (2H, m br), 2.01 (2H, m br), 1.84 (2H, q br, J = 11.0 Hz), 1.73 (2H, d br, J = 11.0 Hz)

化合物No. 594 (融点: 138 ~ 140). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 160.1, 157.6, 151, 139.4, 138, 134.4, 129.7, 128.2, 124.5, 123.9, 122.2, 115.4, 58.4, 31.3, 28.2, 24

40

<sup>1</sup>H: 13.02 (1H, s br), 8.32 (1H, t br, J = 1.6 Hz), 8.19 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.10 (1H, d, J = 1.3 Hz), 8.08 (1H, m d, J = 8.0 Hz), 7.69 (1H, m d, J = 8.0 Hz), 7.60 (1H, t, J = 8.0 Hz), 4.38 (1H, m), 2.94 (3H, s), 1.88 (2H, m), 1.69 (4H, m), 1.54 (2H, m)

化合物No. 595 (融点: 228 ~ 229). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: 159.1, 158.5, 151.1, 140.6, 137.5, 126.1, 126.0, 114.0, 113.1, 55.1, 54.6, 46.4, 31.7, 27.2

<sup>1</sup>H: 14.96 (1H, br), 8.10 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.89 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.77

50

(2H, m d, J = 9.0 Hz), 6.96 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 4.12 (1H, m br), 3.95 (2H, m d, J = 13.0 Hz), 3.77 (3H, s), 3.13 (2H, d t, J = 3.5, 12.5 Hz), 2.93 (3H, s), 1.90 (2H, m), 1.86 (2H, m)

化合物No. 596 (融点: 178 ~ 180 (dec.)). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: データなし

<sup>1</sup>H: 8.09 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.88 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.77 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 6.95 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 5.99 (2H, s), 4.06 (2H, d br, J = 13.5 Hz), 4.02 (1H, m), 3.77 (3H, s), 2.91 (3H, s), 2.71 (2H, t br, J = 12.0 Hz), 1.71 (2H, m), 1.64 (2H, d q, J = 4.0, 12.0 Hz)

10

化合物No. 597 (融点: 162 ~ 163). NMR 溶媒: DMSO

<sup>13</sup>C: データなし

<sup>1</sup>H: 8.08 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.87 (1H, d, J = 1.3 Hz), 7.76 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 6.95 (2H, m d, J = 9.0 Hz), 4.51 (1H, s br), 3.85 (1H, m br), 3.77 (3H, s), 3.51 (2H, s br), 3.05 (2H, br), 2.93 (3H, s), 2.48 (2H, m), 2.10 (2H, br), 1.88 (2H, s br), 1.75 (2H, s br)

### 【 0 3 3 6 】

#### 3 . 本発明の化合物の生物学的効能

20

以下に記載されているプロトコールに従って、生体外試験を行った。生体外および生体内の両試験におけるコントロールは、かかる反応混合物から試験化合物を除いたものとした。従って、試験化合物に関する下記の表 2 において、低い値は、強い阻害剤であることを示す。値が100の場合には、測定可能な阻害が起きていないことを示す。

### 【 0 3 3 7 】

以下に記載されているプロトコールに従って、生体内試験を行った。BRhは、中枢神経組織における阻害を示し、LVhは、末梢組織の、この場合は肝臓における阻害を示す。

### 【 0 3 3 8 】

#### 生体外プロトコール

次の方法に従って、生体外におけるFAAHの薬学的活性を測定した。

30

### 【 0 3 3 9 】

冷凍したウィスター系ラットの脳（小脳以外）を用い、各々の脳を、15 mLの1 mM MgCl<sub>2</sub>およびpH7.0の20 mM HEPES中で、Potter Elvehjem（8ストローク、500 rpm）を用いて均質化した。ホモジネートを、4 、36000gで20分間遠心分離した（Beckman、70Tiローター）。ペレットを、15 mLの同じ緩衝剤に再懸濁し、同じ条件で遠心分離した。ペレットを、15 mLの同じ緩衝剤に再懸濁し、37 °で15分間培養し、その後、4 、36000 gで20分間遠心分離した。その後、各々のペレットを、15 mLの3 mM MgCl<sub>2</sub>、1 mM EDTA、およびpH7.4の50 mM トリスに再懸濁し、BSA（50-250 μg/ml）の検量線を用い、BioRad Protein Assay（BioRad）でタンパク質を測定した。この膜懸濁液を等分し、-80 °で保存した。

### 【 0 3 4 0 】

40

基質としてAEA（分子のエタノールアミン部分の3Hで標識される）を用い、生じる3H-エタノールアミンを測ることでFAAHの活性を測定した。反応混合液（全容量200 μl）は、2 μM AEA（2 μM AEA + 5 nM 3H-AEA）、0.1%の遊離脂肪酸BSA、および5 μgのタンパク質を含み、1 mM EDTAおよび10 mM pH7.6のトリス、並びに10 μMまたは0.1 μMの化合物を含有していた。試験化合物の保存溶液（10 mM）を100%のDMSOで調製し、試験におけるかかるDMSOの濃度を0.1%とした。37 °での15分間の前培養期間の後、基質溶液（冷却EAE + 放射標識されたEAE + BSA）を加えて反応を開始した。10分間の反応を実施した後、400 μlの活性炭懸濁液（32 mlの0.5 M HCl に8 gの炭を加え、連続攪拌したもの）を加えて終了した。室温および攪拌下での30分間の培養時間の後、微量遠心管での遠心分離により、炭を沈降させた（13000 rpmで10分間）。上澄みのうちの200 μlを、あらかじめ24ウ

50

エルプレートに分配した800  $\mu$ lのOptiphase Supermix シンチレーションカクテルに加えた。Microbeta TriLux シンチレーションカウンターで、カウント毎分 (cpm) を測定した (10分間、またはs=2になるまで計数した)。

#### 【0341】

各々の試験では、ブランク (タンパク質なし、通常は200 cpm未満) およびコントロール (化合物なし) を作製した。コントロールからブランクを減算し、パーセントとして表2に結果を報告する。

#### 【0342】

##### 生体内プロトコール

##### (動物の処置)

試験では、インターファウナイベリカ (スペイン) から得られたNMRIマウス (重さ 27 ~ 44 g) を用いた。管理された環境条件下 (12時間の明るい / 暗いのサイクル、室温は22  $\pm$  1) で、1つのケージに5匹のマウスをまとめた。常時、食物および水道水を摂取できる状態とし、日中の間に全ての試験を実施した。

#### 【0343】

動物に対し、30 mg/kg若しくは3 mg/kgの本発明の化合物 (8 ml/kg; 化合物を0.5%のカルボキシメチルセルロース (CMC) に懸濁する、または水に可溶化する) を経口にて、または、媒剤 (コントロール) を動物給餌用のステンレス製曲針 (Perfectum、アメリカ) で、投与した。15分後、60 mg/kgのペントバルビタールを犠牲動物の腹腔内に投与し、麻酔をかけた。肝臓、左肺の肺葉および小脳以外の脳の一片を取り除き、膜緩衝剤 (3 mM  $MgCl_2$ 、1 mM EDTA、pH7.4の50 mM トリスHCl) の入ったプラスチックのバイアルに入れた。分析まで、組織を-30  $^{\circ}C$  で保存した。

#### 【0344】

化合物を投与するまで、夜間は常に動物を絶食させたが、18時間以上経過した時点は例外で、そのときは投与日の午前中に食物を取り去り、同日の午後に化合物を投与した。その後、動物に水を与えたが、他は何も与えなかった。

#### 【0345】

動物に関する全ての手順は、実験および他の科学的目的に使用される脊椎動物の保護に関する欧州指針 (86/609CEE) およびポルトガルの法律 (Decreto-Lei 129/92, Portarias 1005/92 e 1131/97) を厳守して実施した。用いた動物の数は、現行の規則および科学的完全性に従った最低限の数とした。

#### 【0346】

##### (試薬および溶液)

アナンダミド [エタノールアミン -1- $^3H$ ] (40-60 Ci/mmol) は、American Radiochemicalsから入手した。その他の全ての試薬は、Sigma-Aldrichから入手した。Optiphase Supermixは、Perkin Elmerから入手し、活性炭は、Sigma-Aldrichから入手した。

#### 【0347】

##### (組織の調製)

組織を氷上で解凍し、10倍容量の膜緩衝剤 (3 mM  $MgCl_2$ 、1 mM EDTA、pH7.4の50 mM トリスHCl) 中で、Potter Elvehjem (脳、8ストローク、500 rpm) またはHeidolph Diax (肝臓、ポジション5で20秒間2ストロークおよび30秒間停止) で均質化した。

#### 【0348】

組織中の全タンパク質を、BSA (50-250  $\mu$ g/ml) の検量線を用い、BioRad Protein Assay (BioRad) で測定した。

#### 【0349】

##### (酵素アッセイ)

反応混合液 (総容量200  $\mu$ l) は、2  $\mu$ M AEA (2  $\mu$ M AEA + 5 nM  $^3H$ -AEA)、0.1%の遊離脂肪酸BSA、および15  $\mu$ g (脳)、5  $\mu$ g (肝臓) または50  $\mu$ g (肺) のタンパク質を含み、1 mM EDTAおよび10 mM pH7.6のトリスを含有する。37  $^{\circ}C$  での15分間の前培養期間の後、基質溶液 (冷却AEA + 放射標識されたAEA + BSA) を加えて反応を開始した。10分間

10

20

30

40

50

(脳および肺)または7分間(肝臓)の反応を実施した後、400  $\mu$ lの活性炭懸濁液(32 mlの0.5 M HCl に8 gの炭を加え、連続攪拌したもの)を加えて停止した。室温および攪拌下での30分間の培養時間の後、微量遠心管での遠心分離により、炭を堆積させた(1300 rpmで10分間)。上澄みのうちの200  $\mu$ lを、あらかじめ24ウェルプレートに分配した800  $\mu$ lのOptipase Supermix シンチレーションカクテルに加えた。Microbeta TriLux シンチレーションカウンターで、カウント毎分(cpm)を測定した。

【0350】

各々の試験で、ブランク(タンパク質なし)を調製した。

【0351】

コントロールおよびブランクを減算したコントロールに関し、残留する酵素活性の割合を算出した。

10

【0352】

【表 2】

	名 称	分 類	生体外		生体内			
			10 uM	100 nM	BRh 30mg.k g.1h	LVh 30mg.k g.1h	BRh 3mg.kg .8h	LVh 3mg.kg .8h
1	(1H-イミダゾール-1-イル)(モルホリノ)メタノン	イミダゾール	62.6					
2	N-メチル-N-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	11.7					
3	モルホリノ(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール	4.8					
4	N-メチル-N,4-ジフェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	0.1	83.6	14.3	10.6		
5	N,3-ジフェニル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド	ピラゾール	91.3					
6	N-(4-メトキシフェニル)-3-フェニル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド	ピラゾール	91.1					
7	N-メチル-N-フェニル-1H,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール	0	17				
8	N-メチル-N-フェニル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド	ピラゾール	13.2					
9	N-フェニル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド	ピラゾール	78.6					
10	N-(4-フェノキシフェニル)-3-フェニル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド	ピラゾール	55					
11	N-(4-(ベンジルオキシ)フェニル)-3-フェニル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド	ピラゾール	82.6					
12	N-メチル-N,3-ジフェニル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド	ピラゾール	86					
13	モルホリノ(3-フェニル-1H-ピラゾール-1-イル)メタノン	ピラゾール	89.7					
14	N-メチル-4-(ナフタレン-2-イル)-N-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	0	68.3	96.7	77.3		
15	N-(ピフェニル-4-イル)-3-フェニル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド	ピラゾール	66.9	103.8				
16	N-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-4-(ナフタレン-2-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	24.7					
17	N-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	65					

10

20

30

40

	ルボキサミド							
18	N-メチル-N-フェニル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	67.9					
19	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(モルホリノ)メタノン	ペンゾトリアゾール	0.1	3.1	46.6	41.1		
20	3-(ビフエニル-4-イル)-N-フェニル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド	ピラゾール	97.3					
21	モルホリノ(3-(ピリジン-3-イル)-1H-ピラゾール-1-イル)メタノン塩酸塩	ピラゾール	79.1					
22	3-(ビフエニル-4-イル)-N-(3-メトキシフェニル)-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド	ピラゾール	95.8					
23	3-(ビフエニル-4-イル)-N-(4-メトキシフェニル)-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド	ピラゾール	93					
24	N-メチル-N-フェニル-3-(ピリジン-3-イル)-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド	ピラゾール	22.9					
25	3-(ビフエニル-4-イル)-N-メチル-N-フェニル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド	ピラゾール	99					
26	N-メチル-N,2-ジフェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	92.6					
27	4-(4-クロロフェニル)-N-メチル-N-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	0.2	71.4				
28	4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-N-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	0.7	85.1				
29	4-(4-フルオロフェニル)-N-メチル-N-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	0	52.5	10.7	17.2		
30	4-(2-フルオロフェニル)-N-メチル-N-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	0.1	72.5				
31	4-(3-メトキシフェニル)-N-メチル-N-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	0	69				

	ルボキサミド								
32	6-クロロ-N-メチル-N-フエニル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0	0.1	85.9	64.9			
33	5-クロロ-N-メチル-N-フエニル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0	6.2	82.3	76.7			
34	N-メチル-N-フエニル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0	0.6	33.6	34.3			
35	4-(ピフエニル-4-イル)-N-メチル-N-フエニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	103.1						
36	N-(4-フルオロフエニル)-4-(4-メトキシフエニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	5						
37	(3,4-ジヒドロキノリン-1(2H)-イル)(4-フエニル-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール	51.7						
38	4-(4-ヒドロキシフエニル)-N-メチル-N-フエニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	0	83.9					
39	(3,4-ジヒドロキノリン-1(2H)-イル)(4-(3-メトキシフエニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール	16				120.6	101.1	
40	4-(3-ヒドロキシフエニル)-N-メチル-N-フエニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	0.1	88.8	81.5	4.5	102.8	25.6	
41	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-フエニルピペラジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0	0	87.6	30			
42	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-ベンジルピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0	0	8.4	6.4			
43	4-(4-クロロフエニル)-N-(4-フルオロフエニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	0.1	88					

44	(3,4-ジヒドロキノリン-1(2H)-イル)(4-(4-フルオロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール				97.8				
45	4-(2-フルオロフェニル)-N-(4-フルオロフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール				83				
46	(5-フルオロ-1H-インドル-1-イル)(モルホリノ)メタノン	インドル				104.3				
47	(5-メトキシ-1H-インドル-1-イル)(モルホリノ)メタノン	インドル				97.2				
48	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(ベンゾ[d][1,3]ジオキサソール-5-イルメチル)ピペラジン-1-イル)メタノン シュウ酸塩	ベンゾトリアゾール			20.1	0.1	21.8			
49	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(ピリジン-2-イル)ピペラジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール			14.9	0.1	16.9			
50	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール			7.8	0	32.6			
51	(3,4-ジヒドロキノリン-1(2H)-イル)(4-(3-ヒドロキシフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール			130.4	100.8			132.3	
52	(5-ヒドロキシ-1H-インドル-1-イル)(モルホリノ)メタノン	インドル				102.7				
53	N-ベンジル-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール			6.3	0	1.4			
54	N-(4-フルオロフェニル)-4-(4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール				91				
55	1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル(1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカ-8-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール			42.6	0.2	2.2	2.5		37.8
56	N-(4-フェノキシフェニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール				90.7				
57	N-(4-メトキシフェニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール				96.9				

10

20

30

40



58	N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール		1	0.3	0.9	0.5	0.3
59	N-(2,4-ジフルオロフェニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール		100.4				
60	N-フェニル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール		93.8				
61	N-ベンジル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール		2.2	87.5	83.9		
62	N-(4-クロロフェニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール		93.7				
63	N-(4-クロロフェニル)-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール		12.6	57	49.7		
64	3-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-N-フェニル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール		67.9				
65	(3-(4-メトキシフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(モルホリノ)メタン	1,2,4-トリアゾール		86.5				
66	N-(4-フルオロフェニル)-3-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール		80.9				
67	3-(4-クロロフェニル)-N-メチル-N-フェニル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール		61				
68	(3-(4-クロロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(モルホリノ)メタン	1,2,4-トリアゾール		73.5				
69	3-(4-クロロフェニル)-N-(4-フルオロフェニル)-N-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール		80.8				
70	N-(2,4-ジフルオロフェニル)-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール	ベンゾトリアゾール		1.9	52	42.5		

	ル-1-カルボキシミド	ル										
71	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.1	2.3	0.3	2.2	1.8	2.5				
72	(3-クロロ-1H-インダゾール-1-イル)(モルホリノ)メタノン	インダゾール		87.6								
73	モルホリノ(3-フェニル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール		85.8								
74	N-(2,4-ジフルオロフェニル)-N-メチル-3-フェニル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキシミド	1,2,4-トリアゾール		73.2								
75	N-ブチル-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキシミド	ベンゾトリアゾール		0	0.4	2.7						
76	N-メチル-N-(4-モルホリノフェニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキシミド	ベンゾトリアゾール		97.1								
77	N-(3,5-ジメトキシフェニル)-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキシミド	ベンゾトリアゾール		76.3								
78	(3-(2,4-ジフルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(モルホリノ)メタノン	1,2,4-トリアゾール		81.9								
79	(4-ベンジルピペリジン-1-イル)(3-(2,4-ジフルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール		0.8	10.3	9.8	70	45.2				
80	N,3-ビス(2,4-ジフルオロフェニル)-N-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキシミド	1,2,4-トリアゾール		89.5								
81	N-(4-(ジメチルアミノ)フェニル)-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキシミド	ベンゾトリアゾール		49.2								
82	1,4'-ビピペリジン-1'-イル(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)メタノン 塩酸塩	ベンゾトリアゾール		69.3								
83	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-メチルピペラジン-1-イル)メタノン 塩酸塩	ベンゾトリアゾール		2.5								

84	N-メチル-N-(ピリジン-2-イル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	62.5				
85	N-(4-フェニル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0.1				
86	N-ドデシル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0				
87	N-シクロヘキシル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0			3.4	4
88	N-(ピフェニル-4-イル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	105.4				
89	モルホリノ(4-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)メタノン	1,2,3-トリアゾール	4.5				
90	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-モルホリノピペリジン-1-イル)メタノン 塩酸塩	ベンゾトリアゾール	38.6				
91	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(4-ベンジルオキシ)フェニル)ピペラジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0				
92	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(ピロリジン-1-イル)ピペリジン-1-イル)メタノン 塩酸塩	ベンゾトリアゾール	96				
93	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-ベンジルピペラジン-1-イル)メタノン 塩酸塩	ベンゾトリアゾール	0				
94	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-フェニルピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0				
95	5-(3-シアノフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0.7				
96	N-シクロヘキシル-5-(4-フルオロフェニル)-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	14.3				

10

20

30

40

97	5-ブプロモ-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0					
98	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(ピロリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.6					
99	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(p-トリルオキシ)ピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.2				99.1	71.4
100	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-フェネチルピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.2				68.1	40.5
101	(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)(4-フェニルピペラジン-1-イル)メタノン	イミダゾール	0.5					
102	(4-ベンジルピペラジン-1-イル)(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール	0.9					
103	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	37.5	0				
104	N-シクロヘキシル-N-エチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	94.2					
105	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(2-(ピロリジン-1-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)メタノン 塩酸塩	ベンゾトリアゾール	64.7					
106	N-シクロヘキシル-6-(4-フルオロフェニル)-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	2.3					
107	3-(1-(シクロヘキシル(メチル)カルバモイル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-イル)安息香酸	ベンゾトリアゾール	13.5					
108	5-(3-カルバモイルフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	7.4					
109	6-(3-カルバモイルフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-ベンゾ	ベンゾトリアゾール	0					

10

20

30

40

	[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ル						
110	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(3-フェニルプロピル)ピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.1				51.7	10.2
111	(3-フェニル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(4-フェニルピペラジン-1-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール	1.5					
112	4-(1-(4-ベンジルピペラジン-1-カルボニル)-1H-イミダゾール-4-イル)ベンズアミド	イミダゾール	7.2					
113	4-(4-カルバモイルフェニル)-N-メチル-N-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	90.3				84.1	32.3
114	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(ピリジン-4-イル)ピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.1				102.9	109.9
115	N-メチル-N-フェネチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0					
116	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(3-(ピリジン-3-イル)-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)ピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.5				126.2	113.2
117	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(4-クロロフェノキシ)ピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.1					
118	N-メチル-N-(3-フェニルプロピル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0					
119	N-(3-メトキシベンジル)-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0					
120	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-フェノキシピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.1					
121	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(4-フルオロベンジル)ピペラジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0				118.6	116.1

10

20

30

40

122	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(4-メチルピペラジン-1-イル)ピペリジン-1-イル)メタノン 塩酸塩	ベンゾトリアゾール	93					
123	N-(3-クロロベンジル)-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0					
124	(4-ベンジルピペラジン-1-イル)(3-フェニル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)メタノン 塩酸塩	1,2,4-トリアゾール	1.5					
125	(3-(4-(ベンジルオキシ)フェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(4-ベンジルピペラジン-1-イル)メタノン 塩酸塩	1,2,4-トリアゾール	53.5					
126	N-アザマンチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0	0.2				2.2
127	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.1	111.5				107.3
128	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(ベンジルオキシ)ピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0					
129	N-メチル-N-(5-フェニルペンチル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0	2.5				2
130	N-(4-フルオロベンジル)-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0					
131	N-メチル-N-(ナフタレン-2-イルメチル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0					
132	(3-(4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(4-(p-トリルオキシ)ピペリジン-1-イル)メタノン 塩酸塩	1,2,4-トリアゾール	85.1					
133	(3-(4-(4-ベンジルピペラジン-1-イル)フェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(モルホリノ)メタノン	1,2,4-トリアゾール	90.7					
134	(3-(2,4-ジフルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(4-(p-トリ	1,2,4-トリアゾール	34.5					

10

20

30

40

	ルオキシ)ピペリジン-1-イル)メタノン								
135	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(3-フェニルプロポキシ)ピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.1				26.5	30.1	
136	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(4-ヒドロキシフェニル)ピペラジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.2						
137	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(4-メトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.1						
138	N,N-ジメチル-3-(4-(4-フェニルピペラジン-1-イル)フェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール	83.8						
139	(3-(4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(モルホリノ)メタノン	1,2,4-トリアゾール	80.2				97.1	105.7	
140	3-(4-(4-シアノフェノキシ)フェニル)-N,N-ジメチル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール	58.6						
141	4-(4-(1-(モルホリン-4-カルボニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)フェノキシ)ベンゾニトリル	1,2,4-トリアゾール	15.9						
142	(R)-N-(キヌクリジン-3-イル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩	ベンゾトリアゾール	101.8						
143	N-(3-(3-ジメチル-1,5-ジオキサスピロ[5.5]ウンデカ-9-イル)-N-メチル-1H-ベンゾトリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	2.5				0.4	0.7	
144	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(2-(4-メトキシフェノキシ)エチル)ピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.1				68.2	17.6	
145	4-(4-(1-(4-フェニルピペラジン-1-カルボニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)フェノキシ)ベンゾニトリル 塩酸塩	1,2,4-トリアゾール	0.3				89.9	116.5	
146	3-(4-(4-カルバモイルフェノキシ)フェニル)-N,N-ジメチル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール	77.1						

147	4-(4-(1-(モルホリン-4-カルボニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)フェ ノキシ)ベンズアミド	1,2,4-トリアゾール	55.1			124.4	103
148	4-(4-(1-(4-フェニルピペラジン-1-カルボニル)-1H-1,2,4-トリアゾール -3-イル)フェノキシ)ベンズアミド	1,2,4-トリアゾール	0.3			113.7	87.6
149	3-(4-(4-カルバモイルフェノキシ)フェニル)-N-メチル-N-フェニル -1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール	49.9				
150	N-ベンジル-4-(4-フルオロフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カ ルボキサミド	イミダゾール	1.2			5.6	3.8
151	N-ベンジル-3-(4-(4-カルバモイルフェノキシ)フェニル)-N-メチル -1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール	0.4			116.7	65.8
152	N-((1r,4r)-4-(ベンジルオキシ)シクロヘキシル)-N-メチル-1H-ベンゾ [d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾー ル	1.3				
153	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-((3-メトキシフェノキシ) メチル)ピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾー ル	0				
154	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-シクロペンチルピペラジ ン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾー ル	0.2				
155	(4-フェニルピペラジン-1-イル)(3-(チオフェン-2-イル)-1H-1,2,4-トリ アゾール-1-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール	0.4			144.1	108.2
156	N-(2-(ベンジルオキシ)エチル)-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾ ール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾー ル	0.1			67.2	24.4
157	N-(2-(4-メトキシフェノキシ)エチル)-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]ト リアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾー ル	0			5.2	3.5
158	(4-ベンジルピペラジン-1-イル)(3-(チオフェン-2-イル)-1H-1,2,4-トリ アゾール-1-イル)メタノン 塩酸塩	1,2,4-トリアゾール	0.3			92	85.6
159	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-ヒドロキシピペリジン-1-	ベンゾトリアゾー	4.8				



	イル)メタノン	ル						
160	3-ベンジル-N-メチル-N-フェニル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール	18.8					
161	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール	93.6	3.3				
162	(6-ブロモ-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0		0.9		3.1	
163	3-(3-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-3H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-イル)ベンズアミド	ベンゾトリアゾール	0.6		6.3		2.4	
164	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(4-(ベンジルオキシ)フェノキシ)ペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.3					
165	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-((4-メトキシフェノキシ)メチル)ペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0					
166	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(3-メトキシフェノキシ)ペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0					
167	1-[(1,1-ジオキシシド-1,3-チアゾリジン-3-イル)カルボニル]-1H-ベンゾトリアゾール	ベンゾトリアゾール	96.2		99.9		104	
168	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4-(4-ブトキシフェノキシ)ペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0					
169	N-メトキシ-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	73.6					
170	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(チアゾリジン-3-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	2.1					
171	アゾカン-1-イル(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	15.2					

10

20

30

40

172	アゼパン-1-イル(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.3						
173	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)((2R,6S)-2,6-ジメチルピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	70.6						
174	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(iso インドール in-2-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	0.7						
175	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(3,5-ジメチルピペリジン-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール	21						
176	エチル 1-(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボニル)ピペリジン-4-カルボキレート	ベンゾトリアゾール	0.2						
177	エチル 4-(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボニル)ピペラジン-1-カルボキレート	ベンゾトリアゾール	6.9						
178	1-(4-(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボニル)ピペラジン-1-イル)エタノン	ベンゾトリアゾール	94.5						
179	1-(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボニル)ピペリジン-4-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	49						
180	N-メチル-N-フェニル-3-(チオフェン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール	57.5						
181	N-ベンジル-N-メチル-3-(チオフェン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール	0.9						
182	(3-ベンジル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(4-フェニルピペラジン-1-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール	0.6				90.6	111	
183	(3-(2,4-ジフルオロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール	102				92.4	78.1	
184	(3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)(4-フェニル-1H-イミダゾール	イミダゾール	30.2						

10

20

30

40

	-1-イル)メタノン								
185	(3-(4-クロロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール					71.8		
186	(4-(4-クロロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリン-3-イル)メタノン	イミダゾール					96.5	78.7	37.7
187	4-(4-(1-(4,4-ジメチルオキサゾリン-3-カルボニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)フェノキシ)ベンズアミド	1,2,4-トリアゾール					92.8	85.6	108.6
188	(4,4-ジメチルオキサゾリン-3-イル)(3-(4-メトキシフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール					103.3	78.7	89
189	(3-(4-クロロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリン-3-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール					98.5	105.9	87.6
190	N-ベンジル-N-メチル-3-(ナフトレン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール					20.7		
191	N-ベンジル-N-メチル-3-(ナフトレン-1-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール					21	60	20.8
192	N-メチル-3-(ナフトレン-1-イル)-N-フェニル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1,2,4-トリアゾール					64.6		
193	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)((2R,6R)-2,6-ジメチルモルホリン)メタノン	ベンゾトリアゾール					110.2		
194	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)((2S,6R)-2,6-ジメチルモルホリン)メタノン	ベンゾトリアゾール					64.2		
195	(S)-N-メチル-N-(1-フェニルエチル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール					15.7	9.1	5.7
196	(4-(ピフェニル-3-イル)-1H-イミダゾール-1-イル)(4-フェニルピペラジン-1-イル)メタノン	イミダゾール					2.5	88.1	78.3

197	(4-(4-クロロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(4-(3-フェニルプロピル)ピペリジン-1-イル)メタノン	イミダゾール	0.3				
198	(4-(3,4-ジクロロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカン-8-イル)メタノン	イミダゾール	33				
199	4-(4-アミノフェニル)-N-メチル-N-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	89	45.9			19.7
200	N-メチル-N-フェニル-4-(3-(2-(ピペラジン-1-イル)エトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 二塩酸塩	イミダゾール	100.1				
201	(4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)(4-(3,4-ジフルオロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール	0.3				
202	N-(2-(ベンジルオキシ)エチル)-N-エチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0.1				
203	N-メチル-N-フェニル-4-(4-(2-(ピペラジン-1-イル)エトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 二塩酸塩	イミダゾール	93.5	101.8			64.3
204	(3-(4-クロロフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカン-8-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール	15.8				
205	(3-(4-メトキシフェニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(4-(3-フェニルプロピル)ピペリジン-1-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール	0.2				
206	(3-(ナフタレン-1-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(4-フェニルピペラジン-1-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール	3.3				
207	4-(3-(1-(1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-2-カルボニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)フェノキシ)ベンズアミド	1,2,4-トリアゾール	31.6				
208	4-(3-(1-(4-フェニルピペラジン-1-カルボニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)フェノキシ)ベンズアミド	1,2,4-トリアゾール	0.2	97.2			96.7
209	4-(3-(1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-1,2,4-トリア	1,2,4-トリアゾール	101.5	99.8			70.1

	ゾール-3-イル)フエノキシ)ベンズアミド								
210	4-(3-(1-(モルホリン-4-カルボニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)フエノキシ)ベンズアミド	1,2,4-トリアゾール				73.3			
211	(4-(4-フルオロフエニル)ピペラジン-1-イル)(3-(4-メトキシフエニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール				1.9			
212	(3-(4-クロロフエニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)メタノン 塩酸塩	1,2,4-トリアゾール				0.8			
213	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(3-(チオフエン-2-イル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール				105.6	53.7		6.9
214	(3-(4-クロロフエニル)-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)(チアゾリジン-3-イル)メタノン	1,2,4-トリアゾール				23.7			
215	(4-(3,4-ジフルオロフエニル)-1H-1-イル)イミダゾール-1-イル)(チアゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール				16.7			
216	(4-(3,4-ジメトキシフエニル)-1H-1-イル)イミダゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール	38.3			108.6	29.3		13.3
217	N-シクロヘキシル-4-(3,4-ジメトキシフエニル)-N-メチル-1H-1-イル)イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	0			80.5	6		4.2
218	(4-(3,4-ジクロロフエニル)-1H-1-イル)イミダゾール-1-イル)(ピロリジン-1-イル)メタノン	イミダゾール				31.6			
219	(1H-ベンゾ[d]イミダゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール	50.6			111.6	86.8		89
220	(2,2-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-フエニル-1H-1-イル)イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール				103.7	31.5		20
221	((2R,6S)-2,6-ジメチルピペリジン-1-イル)(4-フエニル-1H-1-イル)イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール				105.8	104.5		44.9

222	N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール			102.9			111.5	59.2
223	(4-(4-クロロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル)メタノン	イミダゾール			1.1				
224	N-メチル-N-フェニル-4-(2-(ピペリジン-1-イル)エトキシ)フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 臭化水素酸塩	イミダゾール			90				
225	(4-(4-(ベンジルオキシ)-3-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール			79				
226	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン 二塩酸塩	イミダゾール			76.6			8.4	5.1
227	(2-メチルオキサゾリジン-3-イル)(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール			64.7				
228	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール			78.1			56.4	31.9
229	N-アダマンチル-N-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール			99.2				
230	N-メチル-4-(2-モルホリノエトキシ)フェニル-N-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩	イミダゾール			96.1				
231	(4-(ピフェニル-3-イル)-1H-イミダゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール			54.2			3.9	3.6
232	3'-(1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピフェニル-3-カルボキサミド	イミダゾール	0		84.7			82.8	6.5
233	(4-(4-クロロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(2-エチル-2-メチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール			74.1			33.5	21.1
234	2-(N-シクロペンテニル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール			78.2				

10

20

30

40

	ド)エチル 4-フエニル-1H-イミダゾール-1-カルボキラート								
235	(4-(4-クロロフエニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(2,4,4-トリメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール	76.2				108.5		80.1
236	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(3'-メトキシビフエニル-3-イル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール	75.4				67.7		37.7
237	N-アダマンチル-4-フエニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	91.6						
238	4-(3'-カルバモイルビフエニル-3-イル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-イル-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	1.2				67.9		2.8
239	4-(ビフエニル-3-イル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	4				16.4		4.6
240	N-シクロヘキシル-4-(3'-メトキシビフエニル-3-イル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	22.4				99		39.5
241	(4-(4-クロロフエニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(2-フエニルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール	76.5						
242	N-シクロヘキシル-6-ヒドロキシ-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール	0						
243	3-(1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-イル)ベンズアミド	ベンゾトリアゾール	39.7						
244	4-(4-クロロフエニル)-N-シクロペンチル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	5.4						
245	4-(4'-カルバモイルビフエニル-3-イル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	0.4				90.6		15.8
246	N-シクロヘキシル-4-(3'-フルオロビフエニル-3-イル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	2.9						
247	N-シクロヘキシル-4-(3'-ヒドロキシビフエニル-3-イル)-N-メチル-1H-イミダゾール	イミダゾール	0.5				131.7		85.5

10

20

30

40

	イミダゾール-1-カルボキサミド							
248	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(3'-(トリフルオロメトキシ)ピフェニル-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	68.9				104.2	57
249	N-ベンジル-4-(4-クロロピフェニル)-N-イソプロピル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	95.8					
250	N-ベンジル-N-イソプロピル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	90.5				102.1	52.6
251	N-ベンジル-N-tert-ブチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	91.7					
252	N-ベンジル-N-tert-ブチル-4-(4-クロロピフェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	83.6					
253	3-(4-クロロピフェニル)-1-[(1,1-ジオキシド-1,3-チアゾリジン-3-イル)カルボニル]-1H-1,2,4-トリアゾール	1,2,4-トリアゾール	107.7					
254	N-シクロヘキシル-N,5-ジメチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	81	109			98.3	89.9
255	N-ベンジル-N-イソプロピル-4-(3-メトキシピフェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	96.7					
256	N-ベンジル-N-tert-ブチル-4-(3-メトキシピフェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	105.6					
257	4-(3'-クロロピフェニル-3-イル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	65.6				60.1	12.2
258	N-シクロヘキシル-4-(3'-エトキシピフェニル-3-イル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	39.9					
259	4-(5'-クロロ-2'-フルオロピフェニル-3-イル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	33.7					



260	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(4-ヒドロキシフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール	37.3	95.3			8.1	7.8
261	N-シクロヘキシル-4-(4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	0	54.1			1.2	1.2
262	N-シクロペンチル-4-(3-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール		7.5				
263	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(5-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール		92.1			98.1	98.8
264	N-ベンジル-N,5-ジメチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール		88			115	76.6
265	N-ベンジル-4-(3-ヒドロキシフェニル)-N-イソプロピル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール		99.6				
266	N-シクロペンチル-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール		0.2				
267	(4-(4-クロロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(5-エチル-2,2-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール		84.1			79.4	83.7
268	(5-クロロ-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)(2,2-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール		104.1				
269	(2,5-ジクロロ-4-(4-クロロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール		106.2				
270	(5-エチル-2,2-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール		113.1				
271	N-シクロヘキシル-4-(2-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール		55.8				
272	N-シクロヘキシル-4-(3,4-ジフルオロフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール	イミダゾール		63.6			19	7.1

	ール-1-カルボキサミド								
273	N-シクロヘキシル-4-(4-フルオロフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	65.1					3.4	2.6
274	N-シクロヘキシル-4-(3,4-ジクロロフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	85						
275	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(3-ニトロフェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	43.8					12.8	2.4
276	N-シクロヘキシル-4-(4-(ジフルオロメトキシ)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	71.5					1.4	2
277	4-(4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	72.1						
278	N-メチル-4-フェニル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	103.5					1.6	1.8
279	N-シクロヘキシル-N,2-ジメチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	87.3					91.6	94.1
280	(5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール	111.8						
281	N-シクロペンチル-4-(3,4-ジメトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	25.5						
282	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	40.9					0.5	1.6
283	N-シクロヘキシル-N-メチル-3-フェニル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1, 2, 4 - トリアゾール	75.1						
284	N-シクロヘキシル-N,5-ジメチル-3-フェニル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド	1, 2, 4 - トリアゾール	146.2					130.7	145.6

285	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(3-フェニル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)メタノン	1, 2, 4 - トリアゾール	85.4					
286	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(5-メチル-3-フェニル-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)メタノン	1, 2, 4 - トリアゾール	112.8				104	93
287	4-(3-カルバモイルピフェニル-3-イル)-N-メチル-N-トリシクロ [3.3.1.1 <sup>3,7</sup> ]デカ-1-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド - プロパ-2-オール (1:1)	イミダゾール	127.3				105.8	85.7
288	4-[3-(ベンジルオキシ)フェニル]-N-メチル-N-トリシクロ [3.3.1.1 <sup>3,7</sup> ]デカ-1-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	114.8					
289	N-メチル-4-ピリジン-3-イル-N-トリシクロ [3.3.1.1 <sup>3,7</sup> ]デカ-1-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	109.8				113.2	96.1
290	4-ピフェニル-3-イル-N-メチル-N-トリシクロ [3.3.1.1 <sup>3,7</sup> ]デカ-1-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					115	112.4
291	N-メチル-4-(3-ピリジン-4-イルフェニル)-N-トリシクロ [3.3.1.1 <sup>3,7</sup> ]デカ-1-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						
292	(4-(4-クロロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(2,2-ジメチル-5-フェニルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール						
293	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(6-メトキシ-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)メタノン	ベンゾ トリアゾール					3.5	1.7
294	N-シクロペンチル-4-(4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					1.4	1.4
295	(5-クロロ-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール	99.2				77.9	32.4
296	4-(3-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-N-トリシクロ [3.3.1.1 <sup>3,7</sup> ]デカ-1-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						

10

20

30

40

297	N-((1r,4r)-4-ヒドロキシシクロヘキシル)-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール							
298	(2,2-ジメチル-5-フェニルオキサゾリジン-3-イル)(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール	74.4					59.2	
299	(4-(4-クロロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(2,2-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール							
300	5-クロロ-N-シクロヘキシル-N-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
301	(5-ブromo-4-(4-クロロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール							
302	(4-エチルオキサゾリジン-3-イル)(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール							
303	(4-(3,4-ジフルオロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(4-エチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール							
304	(4-エチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(3-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール							
305	N-メチル-4-(3-ピリジン-3-イルフェニル)-N-トリシクロ[3.3.1.1.3,7]デカ-1-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
306	N-メチル-4-(3-ピリミジン-5-イルフェニル)-N-トリシクロ[3.3.1.1.3,7]デカ-1-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
307	N-シクロヘキシル-4-(3-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	137.6	56.2				10.1	
308	(4-(3,4-ジフルオロフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(5-フェニルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール		2.5					
309	(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)(5-フェニルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール							

10

20

30

40

[illegible]

322	4-(3'-ヒドロキシビフェニル-3-イル)-N-メチル-N-トリシクロ [3.3.1.13,7]デカ-1-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
323	4-[3-(6-メトキシピリジン-3-イル)フェニル]-N-メチル-N-トリシクロ [3.3.1.13,7]デカ-1-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
324	4-[4-(アセチルアミノ)ビフェニル-3-イル]-N-メチル-N-トリシクロ [3.3.1.13,7]デカ-1-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
325	4-(3-フラン-3-イルフェニル)-N-メチル-N-トリシクロ[3.3.1.13,7]デカ -1-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
326	N-シクロペンチル-4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール -1-カルボキサミド	イミダゾール							
327	N-シクロペンチル-4-(3-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール -1-カルボキサミド	イミダゾール							
328	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(4-メトキシフェニル)-1H-イ ミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール							
329	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(3-メトキシフェニル)-1H-イ ミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール	99.5				83.3	18.5	
330	N-シクロヘキシル-4-(3-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル -1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	29.7				22.8	11.1	
331	N-シクロペンチル-4-(3-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル -1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	3.6				4	4.9	
332	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(3-フルオロ-4-ヒドロキシフェ ニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール	88.5				60	19.5	
333	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(4-フルオロ-3-ヒドロキシフェ ニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール	81.9				119	81.5	
334	4-(ペンゾフラン-2-イル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾー	イミダゾール	58.2				9.9	5.1	

	ル-1-カルボキサミド											
335	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	75.4						3.1		1	
336	4-[3-(6-クロロピリジン-3-イル)フェニル]-N-メチル-N-トリシクロ[3.3.1.1 <sup>3,7</sup> ]デカ-1-イル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール										
337	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(2-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール										
338	(4-(ベンゾフラン-2-イル)-1H-イミダゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール										
339	オキサゾリジン-3-イル(4-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール										
340	(4-(3-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)(5-フェニルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	イミダゾール										
341	N-シクロヘキシル-4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	75.4									
342	N-シクロヘキシル-4-(3-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール										
343	N-シクロヘキシル-4-(4-フルオロ-3-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	44.7						95.5		19.7	
344	N-シクロペンチル-4-(4-フルオロ-3-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	1.7						121.1		2.1	
345	N-シクロヘキシル-4-(4-(ジフルオロメトキシ)フェニル)-N-エチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール										
346	N-シクロヘキシル-4-(3,4-ジフルオロフェニル)-N-エチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール										
347	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(3-ヒドロキシフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	イミダゾール	109.6						76.6		24.5	

[illegible]



360	(4,6-ジフルオロ-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール				3.1	3.7
361	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(6-フェニル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール				6.3	1.4
362	3-(1-(シクロヘキシル(メチル)カルバモイル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン 1-オキサイド	イミダゾール			78.2	1.6	1.7
363	4-(3-(4-シアノフェノキシ)フェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					
364	4-(3-(1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-イミダゾール-4-イル)フェノキシ)ベンゾニトリル	イミダゾール					
365	4-(3-アミノ-4-メトキシフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					
366	(1H-[1,2,3]トリアゾール o[4,5-b]ピリジン-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	トリアゾール oピリジン					
367	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(6-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール					
368	(3H-[1,2,3]トリアゾール o[4,5-b]ピリジン-3-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	トリアゾール oピリジン				4.9	9.6
369	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(オキサゾリジン-3-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール					
370	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(6-(2-メトキシフェニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール					
371	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(5-(トリフルオロメチル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール					
372	(4,6-ジメトキシ-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4,4-ジメチル	ベンゾトリアゾール					

	ルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	ル							
373	(1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(2,2-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール							
374	N-シクロヘキシル-N-メチル-5-(トリフルオロメチル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール							
375	N-シクロヘキシル-N,5,6-トリメチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール							
376	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(4-スルファモイルフェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール				95.3		5.7	
377	N-シクロヘキシル-4,6-ジメトキシ-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール							
378	(5,6-ジメチル-2H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-2-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール							
379	N-((1r,4r)-4-(ベンジルオキシ)シクロヘキシル)-N-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
380	4-(4-(2H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール				77.3		51.3	
381	(5,6-ジメチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール							
382	(5,6-ジメトキシ-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)メタノン	ベンゾトリアゾール							
383	N-((1r,4r)-4-ヒドロキシシクロヘキシル)-N-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
384	N-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロパン-2-イル)-4,6-ジメトキシ-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール							

385	4-(1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-イミダゾール-4-イル)ベンズアミド								イミダゾール
386	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(4-(2-(ピペリジン-1-イル)エトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン 塩酸塩								イミダゾール
387	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(4-(2-モルホリノエトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン 塩酸塩								イミダゾール
388	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(4-(2-(ピペラジン-1-イル)エトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン 二塩酸塩								イミダゾール
389	1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-カルボキサミド								ベンゾ tri アゾール
390	4-(4-カルバモイルフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド								イミダゾール
391	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(6-フェニル-3H-[1,2,3]トリアゾール o[4,5-b]ピリジン-3-イル)メタノン								トリアゾール o ピリジン
392	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(6-フェニル-1H-[1,2,3]トリアゾール o[4,5-b]ピリジン-1-イル)メタノン								トリアゾール o ピリジン
393	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(4-(ピペリジン-4-イルメトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン 塩酸塩								イミダゾール
394	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(4-(2-(ピペリジン-1-イル)エトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩								イミダゾール
395	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(4-(2-モルホリノエトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩								イミダゾール
396	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(4-(2-(ピペリジン-4-イル)エトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン 塩酸塩								イミダゾール
397	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(4-(2-(ピペラジン-1-イル)エトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩								イミダゾール

	エニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 二塩酸塩								
398	4-(4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
399	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(3-(2-(ピペリジン-1-イル)エトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン 塩酸塩	イミダゾール							
400	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(4-(ピペリジン-4-イルメトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩	イミダゾール							
401	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(3-(2-(ピペラジン-1-イル)エトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン 二塩酸塩	イミダゾール							
402	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(3-(2-モルホリノエトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン 塩酸塩	イミダゾール							
403	4-(3-カルバモイルフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
404	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(4-(モルホリノスルホニル)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
405	(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-イル)(4-(3-(ピペリジン-4-イルメトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン 塩酸塩	イミダゾール							
406	(Z)-N-シクロヘキシル-4-(4-(N'-ヒドロキシカルバミドミドイル)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					66.8		16.3
407	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(3-(2-(ピペラジン-1-イル)エトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 二塩酸塩	イミダゾール							
408	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(3-(2-モルホリノエトキシ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩	イミダゾール							
409	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド シュウ酸塩	イミダゾール							

410	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩	イミダゾール								
411	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド メタンサルホン酸塩	イミダゾール								
412	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 2-ヒドロキシプロパン-1,2,3-トリカルボキレート	イミダゾール								
413	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド (2R,3R)-2,3-ジヒドロキシサクシネート	イミダゾール								
414	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド リン酸塩	イミダゾール								
415	4-(4-(4-ベンジルオキシ)ピペリジン-1-イルスルホニル)フェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						109.1	95.4	
416	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
417	N-シクロペンチル-N-メチル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
418	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(3-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
419	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						0.8	1	
420	4-(4-(4-ベンジルオキシ)フェニル)-N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
421	3-(1-(シクロペンチル(メチル)カルバモイル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン 1-オキサイド	イミダゾール								

10

20

30

40

422	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(4-(メチルスルホニル)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						1.7	2.7
423	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(3-(ヒドロキシカルバモイル)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						90	2.1
424	N-シクロヘキシル-4-(3-(ヒドロキシカルバモイル)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						1	0.5
425	4-(4-(ベンジルアミノ)-3-ニトロフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						111.4	104.6
426	4-(1-ベンジル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						96.9	115.8
427	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(3,4-ジフルオロフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
428	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(4-クロロフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
429	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(4-(ジフルオロメトキシ)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
430	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(4-フルオロフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
431	N-(1-(2,6-ジメトキシベンジル)ピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
432	N-シクロヘキシル-4-(4-(ヒドロキシピペリジン-1-イルスルホニル)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						96.1	65.5
433	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(3,4-ジメトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
434	(オクタヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)(4-フェニル-1H-イミダゾール	イミダゾール							

	-1-イル)メタノン								
435	N-シクロヘキシル-4-(4-(ジメチルアミノ)-3-ニトロフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					4.3		4.9
436	1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-カルボン酸	ベンゾトリアゾール							
437	N-(ベンジルオキシ)-1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール							
438	N-シクロヘキシル-4-(4-メトキシ-3-(2H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					92.4		6.1
439	N-シクロヘキシル-4-(4-ヒドロキシ-3-(2H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					94.4		58.6
440	1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-N-ヒドロキシ-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール					23.2		3.3
441	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(4-メトキシ-3-ニトロフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
442	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
443	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
444	tert-ブチル 4-(4-(ベンジルオキシ)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
445	4-(3-シアノ-4-メトキシフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
446	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(3-シアノ-4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							

447	4-(3-アミノ-4-(ジメチルアミノ)フェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						11.8	6.5
448	3-(1-(4-(エトキシカルボニル)ピペラジン-1-カルボニル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン 1-オキサイド	イミダゾール							
449	3-(1-(ブチル(メチル)カルバモイル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン 1-オキサイド	イミダゾール							
450	4-(3-アミノ-4-メトキシフェニル)-N-メチル-N-(ピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					114.2	65.4	
451	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 臭化水素酸塩	イミダゾール					1.1	0.3	
452	3-(1-(ジエチルカルバモイル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン 1-オキサイド	イミダゾール							
453	N-メチル-N-フェニル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
454	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(3-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 臭化水素酸塩	イミダゾール					3.1	3	
455	3-(1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン 1-オキサイド	イミダゾール							
456	3-(1-(メチル(フェニル)カルバモイル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン 1-オキサイド	イミダゾール							
457	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(4-ヒドロキシ-3-ニトロフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 臭化水素酸塩	イミダゾール					28.1	10.6	
458	N-シクロヘキシル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
459	3-(1-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)(メチル)カルバモイル)-1H-イミダ	イミダゾール					1.3	1.9	



	ゾール-4-イル)ピリジン 1-オキサイド								
460	エチル 1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-6-カルボキレート	ペンゾトリアゾール							
461	3-(1-(シクロヘキシルカルバモイル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン 1-オキサイド	イミダゾール							
462	1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-6-カルボキサミド	ペンゾトリアゾール							
463	N-メチル-4-(ピリジン-3-イル)-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
464	N-シクロヘキシル-N-エチル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
465	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(3,4-ジヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 臭化水素酸塩	イミダゾール	3.8					3.1	
466	4-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
467	N-メチル-N-(1-フエネチルピペリジン-4-イル)-4-フェニル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
468	4-(3-アミノ-4-メトキシフェニル)-N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	4.7					4.3	
469	tert-ブチル 4-(4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミドピペリジン-1-カルボキレート	イミダゾール	1.4					0.7	
470	3-(1-(メチル(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)カルバモイル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン 1-オキサイド	イミダゾール							
471	3-(1-(シクロヘキシル(エチル)カルバモイル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン 1-オキサイド	イミダゾール							

472	4-(4-フルオロフェニル)-N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
473	4-(3,4-ジフルオロフェニル)-N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
474	4-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
475	4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
476	4-(3,4-ジメトキシフェニル)-N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
477	4-(4-クロロフェニル)-N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
478	N-tert-ブチル-1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-6-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール								
479	1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-N,N-ジメチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-6-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール								
480	N1-シクロペンチル-N1-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1,5-ジカルボキサミド	ベンゾトリアゾール								
481	1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-N-フェニル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-6-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール								
482	4-(3-カルバモイル-4-メトキシフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						83.2	16.7	
483	N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール								
484	4-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピ	イミダゾール								

10

20

30

40

		ラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド							
485	N-シクロヘキシル-4-(4-メトキシ-3-(メチルスルホンアミド)フェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						92.1	15.1
486	1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-N-フェニル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール							
487	N-tert-ブチル-1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール							
488	N-メチル-N-(1-フェネチルピペリジン-4-イル)-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						3.8	2
489	N-シクロヘキシル-1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール							
490	N-シクロヘキシル-1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-6-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール							
491	N <sup>1</sup> -シクロヘキシル-N <sup>1</sup> -メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1,5-ジカルボキサミド	ベンゾトリアゾール							
492	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩	ベンゾトリアゾール						0.9	0.7
493	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(ピリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
494	4-(4-ヒドロキシ-3-ニトロフェニル)-N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						48.9	22.9
495	4-(3-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール						2.1	2.3
496	N-ベンジル-1-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール							

497	4-(1-(シクロヘキシル(メチル)カルバモイル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン 1-オキシサイド	イミダゾール							
498	4-(3-メトキシフェニル)-N-メチル-N-(1-プロピルピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					21.4	12.6	
499	4-(3-カルバモイル-4-ヒドロキシフェニル)-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					120.6	44.1	
500	4-(4-フルオロ-3-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					75.1	21.8	
501	4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-N-(ピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					108.5	67.4	
502	N-(1-エチルピペリジン-4-イル)-4-(3-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					50.2	11.5	
503	N-(1-エチルピペリジン-4-イル)-4-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					78.8	25.1	
504	N-メチル-4-フェニル-N-(ピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩	イミダゾール					112.5	51.2	
505	(4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)(2-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-2H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-5-イル)メタノンシユウ酸塩	ベンゾトリアゾール							
506	(4-(ベンゾ[d][1,3]ジオキサソール-5-イルメチル)ピペラジン-1-イル)(2-(4,4-ジメチルオキサゾリジン-3-カルボニル)-2H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-	ベンゾトリアゾール							
507	(E)-N-シクロヘキシル-4-(3-(N'-ヒドロキシカルバミドイル)-4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール					101.7	34	
508	N-((1r,4r)-4-ヒドロキシシクロヘキシル)-N-メチル-4-(ピリジン-3-イ	イミダゾール							

10

20

30

40

[illegible]

521	N-(1-エチルピペリジン-4-イル)-4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
522	N-メチル-4-(3-ニトロフェニル)-N-(1-プロピルピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
523	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(4-フルオロ-3-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
524	4-(3-アミノフェニル)-N-メチル-N-(1-プロピルピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
525	N-(1-エチルピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
526	4-(3-カルバモイルビルフェニル-3-イル)-N-メチル-N-(1-プロピルピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
527	N-シクロヘキシル-N-メチル-2-オキソ-5-フェニル-1,3,4-オキサジアゾール-3(2H)-カルボキサミド	オキサジアゾール							
528	3-(4,4-ジメチルオルキサゾリジン-3-カルボニル)-5-フェニル-1,3,4-オキサジアゾール-2(3H)-オン	オキサジアゾール							
529	N-メチル-N-(1-プロピルピペリジン-4-イル)-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
530	2-(1-(シクロヘキシル(メチル)カルバモイル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン 1-オキサイド	イミダゾール							
531	N-メチル-N-(ピペリジン-4-イル)-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 二塩酸塩	イミダゾール							
532	4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-N-(1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
533	N-メチル-N-(1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル)-4-(ピリジン-3-	イミダゾール						12	0.2

	イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド									
534	4-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-N-メチル-N-(ピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩	イミダゾール								
535	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-5-シアノ-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール								
536	N-(1-エチルピペリジン-4-イル)-4-(3-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							74.6	18.3
537	N-(1-エチルピペリジン-4-イル)-4-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
538	N,N-ジメチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール								
539	N,N-ジメチル-1H-[1,2,3]トリアゾール o[4,5-b]ピリジン-1-カルボキサミド	ベンゾトリアゾール								
540	4-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-N-(1-(2-ヒドロキシエチル)ピペリジン-4-イル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							89.7	33.7
541	N-(1-(2-シアノエチル)ピペリジン-4-イル)-4-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
542	N-メチル-4-(ピリジン-4-イル)-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
543	4-(1-(メチル(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)カルバモイル)-1H-イミダゾール-4-イル)ピリジン 1-オキサイド	イミダゾール								
544	4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-N-(1-(ピリジン-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
545	4-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)-N-メチル-N-(1-プロピルピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								

546	4-(4-メトキシフエニル)-N-メチル-N-(1-(2-(ピリジン-3-イル)チアゾール-4-カルボニル)ピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
547	N-(1-アセチルピペリジン-4-イル)-4-(4-メトキシフエニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
548	N-(1-アセチルピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
549	4-(4-メトキシフエニル)-N-メチル-N-(1-(3-(トリフルオロメチル)フエニル)ホルニル)ピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
550	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(3-カルバモイルピフエニル-3-イル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	94.3					5.7	
551	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(4-(5-オキソ-4,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)フエニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	85.2					3.8	
552	4-(3-(ヒドロキシカルバモイル)フエニル)-N-メチル-N-(1-プロピルピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	90.2					45	
553	N-シクロヘキシル-4-(3-グアニジノフエニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩	イミダゾール	72.3					15.4	
554	4-(3-カルバモイル-4-ヒドロキシフエニル)-N-メチル-N-(1-プロピルピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	102.2					85.6	
555	4-(4-ヒドロキシフエニル)-N-メチル-N-(ピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 臭化水素酸塩	イミダゾール							
556	4-(3-アミノ-4-(ジメチルアミノ)フエニル)-N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
557	N-(1-(4,6-ジクロロ-1,3,5-トリアジン-2-イル)ピペリジン-4-イル)-4-(4-	イミダゾール							



	メトキシフエニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド								
558	2-(4-(N-メチル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド)ピペリジン-1-イル)酢酸	イミダゾール	83.1	91.1					
559	メチル 5-((4-(N-メチル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド)ピペリジン-1-イル)メチル)フラン-2-カルボキレート	イミダゾール							
560	N-メチル-4-(ピリジン-2-イル)-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
561	N-(1-エチルピペリジン-4-イル)-4-(4-フルオロ-3-ヒドロキシフエニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 臭化水素酸塩	イミダゾール	82.2	78.6					
562	4-(3-アミノ-4-ヒドロキシフエニル)-N-シクロペンチル-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 塩酸塩	イミダゾール							
563	N-シクロヘキシル-4-(3-グアニジノフエニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
564	N-シクロペンチル-N-メチル-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	37.6	2.3					
565	4-(3-アミノフエニル)-N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
566	4-(3-(ヒドロキシカルバモイル)フエニル)-N-(1r,4r)-4-ヒドロキシシクロヘキシル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	88.5	69.8					
567	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-(4-(メチルスルホニル)フエニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール	87.8	6.3					
568	4-(4-ヒドロキシフエニル)-N-メチル-N-(1-(3-(トリフルオロメチル)フエニルスルホニル)ピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール							
569	N-メチル-N-(1-(ピリジン-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル)-4-(ピリジ	イミダゾール							

[illegible]

582	N-(1-シアノピペリジン-4-イル)-4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
583	N-(1-(シアノメチル)ピペリジン-4-イル)-4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
584	N-(1-(シアノメチル)ピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
585	4-(3-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-N-(1-プロピルピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 臭化水素酸塩	イミダゾール								
586	4-(3,4-ジヒドロキシフェニル)-N-メチル-N-(1-プロピルピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 臭化水素酸塩	イミダゾール								
587	4-(4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-N-(1-(ピリジン-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド 臭化水素酸塩	イミダゾール								
588	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-(4-(スルファモイルアミノ)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
589	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-4-(3-グアニジノフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
590	4-(3-(2H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-N-メチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
591	N-シクロヘキシル-N-メチル-4-(3-(5-オキソ-4,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
592	(E)-N-(1-(N'-ヒドロキシカルバミミドイル)ピペリジン-4-イル)-4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
593	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-(3-(メチルスルホンアミド)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	イミダゾール								
594	N-シクロペンチル-N-メチル-4-(3-(5-オキソ-4,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサ	イミダゾール								

	ジアゾール-3-イル)フェニル)1H-イミダゾール-1-カルボキサミド								
595	N-(1-(2H-テトラゾール-5-イル)ピペリジン-4-イル)-4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド							イミダゾール	
596	4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド)ピペリジン-1-カルボキサミド							イミダゾール	
597	N-(1-(2-ヒドロキシエチル)ピペリジン-4-イル)-4-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド							イミダゾール	

【 0 3 5 3 】

10

20

30

40

50

#### 4. 本発明の化合物の生物学的選択性

前述のように、FAAHの阻害性を測定した。以下に記述されているプロトコールに従って、モノアシルグリセロールリパーゼ (MAGL) およびカルボキシルエステラーゼ (CE) の阻害を実施した。生体外および生体内の両試験におけるコントロールは、かかる反応混合液から試験化合物を除いたものである。従って、試験化合物に関する下記の表 3 において、低い値は、強い阻害剤であることを示す。

##### 【 0 3 5 4 】

(MAGL)

MAGL活性の測定は、基質としての $[^3\text{H}]$  2-OG (標識されたグリセロール)の加水分解速度を基盤とした。簡潔に言えば、あらかじめ成人のウィスター系ラットから得られた小脳のサイトゾル (CRBcyt) の画分を、トリス-HCl緩衝剤 (10 mM、pH7.2) に1 mM EDTAを加えたもので希釈して適切な試験タンパク質濃度にし、試験化合物を含む試験管に加えた。コントロールとして、サイトゾル試料の代わりに試験用緩衝剤を含むブランクを用いた。その後、基質 (最終濃度 2  $\mu\text{M}$  OG) を加え、試料を37 °Cで10分間培養した。最終的な試験では、0.125% w/v<sup>-1</sup>の遊離脂肪酸BSAを含んでいた。培養段階の後、400  $\mu\text{L}$ のクロロホルム：メタノール (1/1 v/v<sup>-1</sup>) を加え、渦搅拌を2回行い、氷上に置いて反応を停止した。遠心分離によって相を分離し、メタノール/緩衝剤の相のアリコート量を200  $\mu\text{L}$ 取り、クエンチ補正を用いた液体シンチレーション分光法でトリチウム含有量を分析した。

##### 【 0 3 5 5 】

(CE)

CE活性の測定は、p-ニトロフェニル酢酸からのp-ニトロフェノールの形成を基盤としている。簡潔に言えば、8  $\mu\text{g/ml}$ のラットまたはマウスの肝臓ミクロソーム (LVms) を、96ウェルプレートで10  $\mu\text{M}$  FAAH阻害剤とともに15分間培養し、その後、基質であるp-ニトロフェニル酢酸を、最終濃度が1 mMとなるように加えた。基質を加えて10分後、分光光度計を用い、405 nmで、プレートのp-ニトロフェノールの存在を読み取った。阻害剤を加えていないミクロソーム抽出液でのカルボキシルエステラーゼ活性をコントロールとして100%と定め、阻害剤とともに培養した後の残りのCE活性を、コントロールと比較して算出した。

10

20

## 【 表 3 】

	名 称	生体外		生体内		生体内		
		FAAH 10uM	FAAH 100nM	FAAH BRh 3mg.kg.8h	FAAH LVh 3mg.kg.8h	CE マウス LVms 10uM 10min	CE ラット LVms 10uM 10min	MAGL ラット CRBcyto 12.5uM 8min
16	N-(4-メトキシフェニル)-N-メチル-4-(ナフタレン-2-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド	24.7				95.4	87.5	
39	(3,4-ジヒドロキノリン-1(2H)-イル)(4-(3-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-1-イル)メタノン	16		120.6	101.1	84.3	94.7	87
85	N-(4-フェニルブチル)-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド		0.1			31	33	
97	5-ブロモ-N-シクロヘキシル-N-メチル-1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-カルボキサミド		0			50.7	41.1	
564	N-シクロペンチル-N-メチル-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド			37.6	2.3	87.4	96.1	91.6
567	N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-メチル-4-(4-(メチルスルホニル)フェニル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミド			87.8	6.3	88.6	97.8	94.2

10

20

30

40

## フロントページの続き

(51)Int.Cl.

F I

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/496 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/454 (2006.01)  
 C 0 7 D 405/12 (2006.01)  
 C 0 7 D 401/12 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4725 (2006.01)  
 C 0 7 D 491/113 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/438 (2006.01)  
 C 0 7 D 413/06 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/422 (2006.01)  
 C 0 7 D 417/06 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/427 (2006.01)  
 C 0 7 D 413/14 (2006.01)  
 C 0 7 D 403/10 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/506 (2006.01)  
 C 0 7 D 405/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/16 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/14 (2006.01)  
 A 6 1 P 21/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 21/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/28 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/08 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/18 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/24 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/20 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/08 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/32 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/34 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/12 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 11/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 27/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 27/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/16 (2006.01)  
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 19/10 (2006.01)  
 C 0 7 D 401/06 (2006.01)  
 C 0 7 D 401/10 (2006.01)  
 C 0 7 D 405/10 (2006.01)  
 C 0 7 D 405/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709  
 A 6 1 K 31/496  
 A 6 1 K 31/454  
 C 0 7 D 405/12  
 C 0 7 D 401/12  
 A 6 1 K 31/4725  
 C 0 7 D 491/113  
 A 6 1 K 31/438  
 C 0 7 D 413/06  
 A 6 1 K 31/422  
 C 0 7 D 417/06  
 A 6 1 K 31/427  
 C 0 7 D 413/14  
 C 0 7 D 403/10  
 A 6 1 K 31/506  
 C 0 7 D 405/04  
 A 6 1 P 3/04  
 A 6 1 P 3/00  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 25/16  
 A 6 1 P 25/14  
 A 6 1 P 21/04  
 A 6 1 P 21/00  
 A 6 1 P 21/00  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 25/08  
 A 6 1 P 25/18  
 A 6 1 P 25/24  
 A 6 1 P 25/20  
 A 6 1 P 1/08  
 A 6 1 P 25/32  
 A 6 1 P 25/34  
 A 6 1 P 9/12  
 A 6 1 P 9/00  
 A 6 1 P 9/10  
 A 6 1 P 11/06  
 A 6 1 P 27/06  
 A 6 1 P 27/02  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 1/04  
 A 6 1 P 1/16  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 19/10  
 A 6 1 P 19/10  
 C 0 7 D 401/06  
 C 0 7 D 401/10  
 C 0 7 D 405/10  
 C 0 7 D 405/10

1 0 1

C 0 7 D 401/14	(2006.01)	C 0 7 D 405/14
C 0 7 D 417/14	(2006.01)	C 0 7 D 401/14
C 0 7 D 403/04	(2006.01)	C 0 7 D 417/14
A 6 1 K 31/4439	(2006.01)	C 0 7 D 403/04
A 6 1 K 31/4545	(2006.01)	A 6 1 K 31/4439
A 6 1 K 31/4245	(2006.01)	A 6 1 K 31/4545
A 6 1 K 31/424	(2006.01)	A 6 1 K 31/4245
A 6 1 K 31/53	(2006.01)	A 6 1 K 31/424
		A 6 1 K 31/53

- (31)優先権主張番号 61/174,712  
 (32)優先日 平成21年5月1日(2009.5.1)  
 (33)優先権主張国 米国(US)  
 (31)優先権主張番号 61/221,166  
 (32)優先日 平成21年6月29日(2009.6.29)  
 (33)優先権主張国 米国(US)  
 (31)優先権主張番号 61/242,472  
 (32)優先日 平成21年9月15日(2009.9.15)  
 (33)優先権主張国 米国(US)

- (72)発明者 ラズロ エルノ キス  
 ポルトガル国 4 5 4 7 - 4 5 7 サン マメデ ド コロナド アヴェニダ ダ シデルジア  
 ナショナル  
 (72)発明者 ダヴィッド アレクサンダー リアマン  
 ポルトガル国 4 5 4 7 - 4 5 7 サン マメデ ド コロナド アヴェニダ ダ シデルジア  
 ナショナル  
 (72)発明者 カーラ パトリシア ダ コスタ ペレイラ ローザ  
 ポルトガル国 4 5 4 7 - 4 5 7 サン マメデ ド コロナド アヴェニダ ダ シデルジア  
 ナショナル  
 (72)発明者 リタ グスマン デ ノローニャ  
 ポルトガル国 4 5 4 7 - 4 5 7 サン マメデ ド コロナド アヴェニダ ダ シデルジア  
 ナショナル  
 (72)発明者 ペドロ ヌノ レアル パルマ  
 ポルトガル国 4 5 4 7 - 4 5 7 サン マメデ ド コロナド アヴェニダ ダ シデルジア  
 ナショナル  
 (72)発明者 パトリシオ マニエル ヴィエイラ アラウージョ ソアレス ダ シルヴァ  
 ポルトガル国 4 5 4 7 - 4 5 7 サン マメデ ド コロナド アヴェニダ ダ シデルジア  
 ナショナル  
 (72)発明者 アレクサンダー ベリエフ  
 ポルトガル国 4 5 4 7 - 4 5 7 サン マメデ ド コロナド アヴェニダ ダ シデルジア  
 ナショナル

審査官 小川 由美

- (56)参考文献 国際公開第2007/045393(WO, A1)  
 特表2006-509734(JP, A)  
 国際公開第2005/014576(WO, A1)  
 特表2003-528070(JP, A)  
 特開2001-302640(JP, A)  
 特開平03-246206(JP, A)



米国特許出願公開第2003/0045559 (US, A1)

特表2004-526727 (JP, A)

国際公開第2008/064255 (WO, A1)

国際公開第2007/051981 (WO, A1)

特表2008-513427 (JP, A)

特表2004-532235 (JP, A)

特表2004-528351 (JP, A)

特開平06-049041 (JP, A)

米国特許第04233059 (US, A)

特開平05-059017 (JP, A)

国際公開第2007/030680 (WO, A1)

特表2006-515313 (JP, A)

特開2003-327532 (JP, A)

特表2005-518377 (JP, A)

国際公開第02/030886 (WO, A1)

特表2004-509949 (JP, A)

米国特許第06262093 (US, B1)

米国特許第05883110 (US, A)

国際公開第2008/023720 (WO, A1)

特表2006-511484 (JP, A)

国際公開第2006/054652 (WO, A1)

特表2011-507910 (JP, A)

国際公開第2009/117444 (WO, A1)

国際公開第2008/129129 (WO, A1)

特開平05-247028 (JP, A)

特開昭63-010767 (JP, A)

特開昭61-267574 (JP, A)

特開昭48-062937 (JP, A)

国際公開第2007/014290 (WO, A1)

特表2011-505379 (JP, A)

OPACIC NINOSLAV, THE NOVEL L-AND D-AMINO ACID DERIVATIVES OF HYDROXYUREA AND HYDANTOIN S: 以下備考, JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, 2005年, V48 N2, P475-482, SYNTHESIS, X-RAY CRYSTAL STRUCTURE STUDY, AND CYTOSTATIC AND ANTIVIRAL ACTIVITY EVALUATIONS

DZIMBEG G, THE NOVEL PRIMAQUINE DERIVATIVES OF N-ALKYL, CYCLOALKYL OR ARYL UREA: 以下備考, EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, 2007年 9月15日, V43, P1181, SYNTHESIS, CYTOSTATIC AND ANTIVIRAL ACTIVITY EVALUATIONS

OPACIC N, SYNTHESIS AND X-RAY CRYSTAL STRUCTURE STUDY OF THE HYDROXYUREA AND HYDANTOIN DERIVATIVES OF L-VALINE, JOURNAL OF PEPTIDE RESEARCH, 2005年, V66, P85-93

RAJIC ZRINKA, HYDANTOIN DERIVATIVES OF L-AND D-AMINO ACIDS: SYNTHESIS AND EVALUATION OF THEIR ANTIVIRAL 以下備考, MOLECULES, 2006年, V11 N11, P837-848, AND ANTITUMORAL ACTIVITY

ASANO YASUTOMI, DISCOVERY, SYNTHESIS AND BIOLOGICAL EVALUATION OF ISOQUINOLONES AS NOVEL 以下備考, BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY, 2008年12月15日, V16, P4699-4714, AND HIGHLY SELECTIVE JNK INHIBITORS(2)

TAHA MUTASEM O, COMBINING LIGAND-BASED PHARMACOPHORE MODELING, QUANTITATIVE STRUCTURE-ACTIVITY 以下備考, JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, 2008年10月23日, V51, P6478-6494, RELATIONSHIP ANALYSIS AND IN SILICO SCREENING FOR THE DISCOVERY OF NEW POTENT HORMONE SENSITIVE

Cancer Chemotherapy and Pharmacology, 1991年, 28(6), 470-474

Journal of Polymer Science. Part A. Polymer Chemistry, 2008年, 46(1), 33-37

Medicinal Chemistry Research , 2 0 0 2 年 , 11(4) , 219-237

Australian Journal of Chemistry , 1 9 6 6 年 , 19(1) , 165-168

Chemische Berichte , 1 9 5 9 年 , 92 , 550-563

Registry[STN online] , RN:526190-56-7, RN:432017-91-9, RN:432016-58-5, RN:432002-54-5

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)

C 0 7 D , A 6 1 K

C A p l u s ( S T N )

R E G I S T R Y ( S T N )