

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5015016号
(P5015016)

(45) 発行日 平成24年8月29日 (2012. 8. 29)

(24) 登録日 平成24年6月15日 (2012. 6. 15)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 H 15/04 (2006. 01)

C O 7 H 15/04 C S P F

C O 7 H 17/08 (2006. 01)

C O 7 H 17/08 B

A 6 1 K 31/7032 (2006. 01)

A 6 1 K 31/7032

A 6 1 K 31/7052 (2006. 01)

A 6 1 K 31/7052

A 6 1 K 31/7056 (2006. 01)

A 6 1 K 31/7056

請求項の数 17 (全 355 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2007-557762 (P2007-557762)
 (86) (22) 出願日 平成19年2月7日 (2007. 2. 7)
 (86) 国際出願番号 PCT/JP2007/000068
 (87) 国際公開番号 W02007/091393
 (87) 国際公開日 平成19年8月16日 (2007. 8. 16)
 審査請求日 平成20年8月4日 (2008. 8. 4)
 (31) 優先権主張番号 特願2006-30207 (P2006-30207)
 (32) 優先日 平成18年2月7日 (2006. 2. 7)
 (33) 優先権主張国 日本国 (JP)
 (31) 優先権主張番号 特願2007-20213 (P2007-20213)
 (32) 優先日 平成19年1月30日 (2007. 1. 30)
 (33) 優先権主張国 日本国 (JP)

(73) 特許権者 000002819
 大正製薬株式会社
 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号
 (73) 特許権者 000006091
 Meiji Seikaファルマ株式会社
 東京都中央区京橋 2 丁目 4 番 1 6 号
 (74) 代理人 110000109
 特許業務法人特許事務所サイクス
 (72) 発明者 杉本 智洋
 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正
 製薬株式会社内
 (72) 発明者 山本 加奈子
 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正
 製薬株式会社内

最終頁に続く

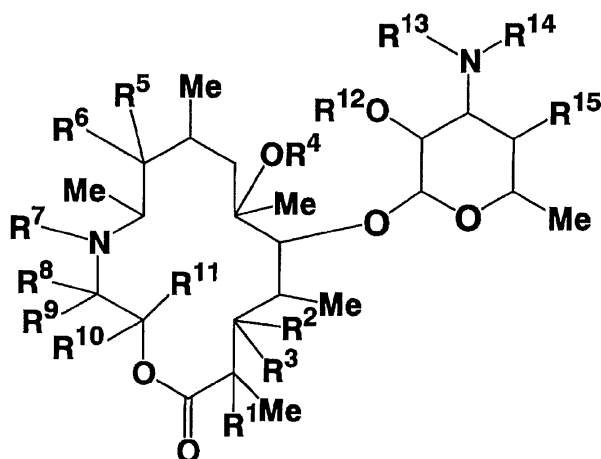
(54) 【発明の名称】 1 O a -アザライド化合物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

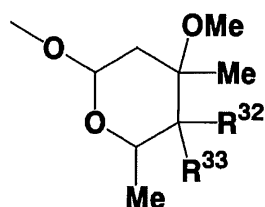
【化 3 6】



{式 (I) 中、R¹は、
 水素原子であり、

R²及びR³は、一緒になってオキソ基であるか又は

一方が水素原子であって、他方は、
 水素原子、
 水酸基、
 保護された水酸基、
 式 $-X^{031}-R^{031}$ で示される基、
 式 $-X^{031}-A^{031}-X^{032}-R^{031}$ で示される基、
 式 $-X^{031}-A^{031}-X^{032}-A^{032}-X^{033}-R^{031}$ で示される基、
 式 $-X^{031}-A^{031}-X^{032}-A^{032}-X^{033}-A^{033}-X^{034}-R^{031}$ で示される基又は式
 【化 3 7】



で示される基であり、
 ここで、 X^{031} は、
 式 $-O-$ で示される基、
 式 $-OCO-$ で示される基、
 式 $-OCO_2-$ で示される基又は
 式 $-OCON(R^{20})-$ で示される基であり、
 R^{32} 及び R^{33} は、一方が水素原子であって、他方は
 水素原子、
 アミノ基、
 水酸基、
 保護された水酸基、
 式 $-OCON(R^{24})R^{25}$ （式中、 R^{24} 及び R^{25} は、共に水素原子を示すか、又は隣接する窒素原子と一緒にあって環状アミノ基を形成する基を示す。）で示される基、
 式 $-X^{331}-R^{331}$ で示される基、
 式 $-X^{331}-A^{331}-X^{332}-R^{331}$ で示される基、
 式 $-X^{331}-A^{331}-X^{332}-A^{332}-X^{333}-R^{331}$ で示される基又は
 式 $-X^{331}-A^{331}-X^{332}-A^{332}-X^{333}-A^{333}-X^{334}-R^{331}$ で示される基であり、
 ここで、 X^{331} は、
 単結合、
 式 $-O-$ で示される基、
 式 $-OCO-$ で示される基、
 式 $-OCO_2-$ で示される基、
 式 $-OCON(R^{20})-$ で示される基、
 式 $-N(R^{20})-$ で示される基、
 式 $-N(R^{20})CO-$ で示される基、
 式 $-N(R^{20})CO_2-$ で示される基、
 式 $-N(R^{20})CON(R^{21})-$ で示される基又は
 式 $-N(R^{20})SO_2-$ で示される基であり、
 又は、 R^{32} 及び R^{33} は、一方が水酸基であって、他方は、
 式 $-CH_2NH_2$ で示される基、
 式 $-X^{335}-R^{332}$ で示される基、
 式 $-X^{335}-A^{334}-X^{336}-R^{332}$ で示される基、
 式 $-X^{335}-A^{334}-X^{336}-A^{335}-X^{337}-R^{332}$ で示される基又は
 式 $-X^{335}-A^{334}-X^{336}-A^{335}-X^{337}-A^{336}-X^{338}-R^{332}$ で示される基であり、

ここで、 X^{335} は、

単結合、

式 $-(CH_2)_n-N(R^{20})-$ で示される基、

式 $-(CH_2)_n-N(R^{20})CO-$ で示される基、

式 $-(CH_2)_n-N(R^{20})CO_2-$ で示される基、

式 $-(CH_2)_n-N(R^{20})CON(R^{21})-$ で示される基、

式 $-(CH_2)_n-N(R^{20})O-$ で示される基、

式 $-(CH_2)_n-OC(=O)N(R^{20})-$ で示される基、

式 $-(CH_2)_n-ON(R^{20})CO-$ で示される基、

式 $-(CH_2)_n-O-$ で示される基、

式 $-(CH_2)_n-OCO-$ で示される基、

式 $-(CH_2)_n-OCO_2-$ で示される基又は

式 $-(CH_2)_n-OC(=O)N(R^{20})-$ で示される基又は

式 $-(CH_2)_n-S(O)_p-$ で示される基であり、

又は R^{32} 及び R^{33} は、一緒になって

オキソ基、

オキシム基、

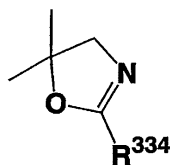
式 $=N-X^{339}-R^{333}$ で示される基、

式 $=N-X^{339}-A^{337}-X^{340}-R^{333}$ で示される基、

式 $=N-X^{339}-A^{337}-X^{340}-A^{338}-X^{341}-R^{333}$ で示される基、

式 $=N-X^{339}-A^{337}-X^{340}-A^{338}-X^{341}-A^{339}-X^{342}-R^{333}$ で示される基若しくは式

【化 3 8】



で示される基であり、

ここで、 X^{339} は、

単結合、

式 $-O-$ で示される基、

式 $-N(R^{20})-$ で示される基、

式 $-N(R^{20})CO-$ で示される基、

式 $-N(R^{20})CO_2-$ で示される基、

式 $-N(R^{20})CON(R^{21})-$ で示される基又は

式 $-N(R^{20})SO_2-$ で示される基であり、

R^{334} は、

式 $-SH$ で示される基、

式 $-OH$ で示される基、

式 $-X^{343}-R^{335}$ で示される基、

式 $-X^{343}-A^{340}-X^{344}-R^{335}$ で示される基、

式 $-X^{343}-A^{340}-X^{344}-A^{341}-X^{345}-R^{335}$ で示される基又は

式 $-X^{343}-A^{340}-X^{344}-A^{341}-X^{345}-A^{342}-X^{346}-R^{335}$ で示される基であり、

ここで、 X^{343} は、

単結合、

式 $-S-$ で示される基又は

式 $-(CH_2)_nCO-$ であり、

R^4 は、

水素原子、

式-CONHCO₂Meで示される基

式-X⁰⁴¹-R⁰⁴¹で示される基、

式-X⁰⁴¹-A⁰⁴¹-X⁰⁴²-R⁰⁴¹で示される基、

式-X⁰⁴¹-A⁰⁴¹-X⁰⁴²-A⁰⁴²-X⁰⁴³-R⁰⁴¹で示される基又は

式-X⁰⁴¹-A⁰⁴¹-X⁰⁴²-A⁰⁴²-X⁰⁴³-A⁰⁴³-X⁰⁴⁴-R⁰⁴¹で示される基であり、

ここで、X⁰⁴¹は、

単結合、

式-CO-で示される基、

式-CON(R²⁰)-で示される基又は

式-CO₂-で示される基であり、

又はR⁴はR⁶と一緒にって環状カーボネート [-CO₂-] を形成してもよく、

R⁵及びR⁶は、一方が水素原子であって、他方は、

水素原子、

水酸基、

保護された水酸基、

アミノ基、

保護されたアミノ基、

ハロゲン原子、

式-CONH₂で表される基、

式-X⁰⁶¹-R⁰⁶¹で示される基、

式-X⁰⁶¹-A⁰⁶¹-X⁰⁶²-R⁰⁶¹で示される基、

式-X⁰⁶¹-A⁰⁶¹-X⁰⁶²-A⁰⁶²-X⁰⁶³-R⁰⁶¹で示される基若しくは

式-X⁰⁶¹-A⁰⁶¹-X⁰⁶²-A⁰⁶²-X⁰⁶³-A⁰⁶³-X⁰⁶⁴-R⁰⁶¹で示される基であるか、

又はR⁷と一緒にって環状カーバメート [-OCO-] を形成してもよく、

ここで、X⁰⁶¹は

単結合、

式-O-で示される基、

式-OCO-で示される基、

式-OCO₂-で示される基、

式-CON(R²⁰)-で示される基、

式-N(R²⁰)-で示される基、

式-N(R²⁰)CO-で示される基、

式-N(R²⁰)CO₂-で示される基、

式-N(R²⁰)CON(R²¹)-で示される基、

式-N(R²⁰)SO₂-で示される基又は

式-CH₂N(R²⁰)-で示される基であり、

又はR⁵及びR⁶は、一緒にって

オキシ基、

オキシム基、

式=N-NH₂で示される基、

保護されたオキシム基、

式=N-X⁰⁶⁵-R⁰⁶²で示される基、

式=N-X⁰⁶⁵-A⁰⁶⁴-X⁰⁶⁶-R⁰⁶²で示される基、

式=N-X⁰⁶⁵-A⁰⁶⁴-X⁰⁶⁶-A⁰⁶⁵-X⁰⁶⁷-R⁰⁶²で示される基又は

式=N-X⁰⁶⁵-A⁰⁶⁴-X⁰⁶⁶-A⁰⁶⁵-X⁰⁶⁷-A⁰⁶⁶-X⁰⁶⁸-R⁰⁶²で示される基であり

ここで、X⁰⁶⁵は、

単結合、

式-O-で示される基、

式-N(R²⁰)-で示される基、

式-N(R²⁰)CO-で示される基、

10

20

30

40

50

式 $-N(R^{20})CO_2-$ で示される基、
 式 $-N(R^{20})CON(R^{21})-$ で示される基又は
 式 $-N(R^{20})SO_2-$ で示される基であり、
 R^7 は、
 水素原子、
 水酸基、
 アミノ基の保護基、
 式 $-X^{071}-R^{071}$ で示される基、
 式 $-X^{071}-A^{071}-X^{072}-R^{071}$ で示される基若しくは
 式 $-X^{071}-A^{071}-X^{072}-A^{072}-X^{073}-R^{071}$ で示される基であるか、
 又は R^{10} と一緒に環状カーバメート $[-CO_2CH_2-]$ を形成してもよく、
 ここで、 X^{071} は、
 単結合、
 式 $-O-$ で示される基、
 式 $-CO-$ で示される基、
 式 $-CO_2-$ で示される基又は
 式 $-SO_2-$ で示される基であり、
 R^8 及び R^9 は、同一又は相異なって、
 水素原子又は
 C_{1-10} アルキル基であり、
 R^{10} 及び R^{11} は、同一又は相異なって、
 水素原子、
 式 $-X^{101}-R^{101}$ で示される基、
 式 $-X^{101}-A^{101}-X^{102}-R^{101}$ で示される基、
 式 $-X^{101}-A^{101}-X^{102}-A^{102}-X^{103}-R^{101}$ で示される基又は
 式 $-X^{101}-A^{101}-X^{102}-A^{102}-X^{103}-A^{103}-X^{104}-R^{101}$ で示される基であり、
 ここで、 X^{101} は、
 単結合、
 式 $-CO-$ で示される基、
 式 $-CO_2-$ で示される基又は
 式 $-CON(R^{20})-$ で示される基であり、
 R^{12} は、
水素原子であり、
 R^{13} 及び R^{14} は、同一又は相異なって、
 C_{1-10} アルキル基であり、
 R^{15} は、
水素原子であり、
 前記、 X^{032} 、 X^{033} 、 X^{034} 、 X^{332} 、 X^{333} 、 X^{334} 、 X^{336} 、 X^{337} 、 X^{338} 、 X^{340} 、 X^{341} 、 X^{342} 、 X^{344} 、 X^{345} 、 X^{346} 、 X^{042} 、 X^{043} 、 X^{044} 、 X^{062} 、 X^{063} 、 X^{064} 、 X^{066} 、 X^{067} 、 X^{068} 、 X^{072} 、 X^{073} 、 X^{102} 、 X^{103} 及び X^{104} は、同一又は相異なって、
 単結合
 式 $-O-$ で示される基、
 式 $-OCO-$ で示される基、
 式 $-OCO_2-$ で示される基、
 式 $-OCN(R^{20})-$ で示される基、
 式 $-S(O)_p-$ で示される基、
 式 $-SO_2N(R^{20})-$ で示される基、
 式 $-OCS-$ で示される基、
 式 $-CO-$ で示される基、
 式 $-CO_2-$ で示される基、

10

20

30

40

50

式-CON(R²⁰)-で示される基、
 式-CH=N-で示される基、
 式-CH=N-O-で示される基、
 式-CH=N(R²⁰)-で示される基、
 式-CH=N(R²⁰)O-で示される基、
 式-CH=N(R²⁰)N(R²¹)-で示される基、
 式-CH=N(OR²⁰)-で示される基、
 式-CH=N-N(R²⁰)R²¹-で示される基、
 式-CS-で示される基、
 式-C(S)O-で示される基、
 式-CSN(R²⁰)-で示される基、
 式-O-N=CH-で示される基、
 式-N=CH-で示される基、
 式-N(R²⁰)-で示される基、
 式-N(R²⁰)CO-で示される基、
 式-N(R²⁰)CS-で示される基、
 式-N(R²⁰)SO₂-で示される基、
 式-N(R²⁰)CO₂-で示される基又は
 式-N(R²⁰)CON(R²¹)-で示される基であり、
 前記A⁰³¹、A⁰³²、A⁰³³、A³³¹、A³³²、A³³³、A³³⁴、A³³⁵、A³³⁶、A³³⁷、A³³⁸
 、A³³⁹、A³⁴⁰、A³⁴¹、A³⁴²、A⁰⁴¹、A⁰⁴²、A⁰⁴³、A⁰⁶¹、A⁰⁶²、A⁰⁶³、A⁰⁶⁴、
 A⁰⁶⁵、A⁰⁶⁶、A⁰⁷¹、A⁰⁷²、A¹⁰¹、A¹⁰²及びA¹⁰³は、同一又は相異なって、
 水酸基で置換されても良い2価のC₁₋₁₀脂肪族炭化水素基、
 アリーレン基又は
 2価のヘテロ環基であり、
 前記R⁰³¹、R³³¹、R³³²、R³³³、R³³⁵、R⁰⁴¹、R⁰⁶¹、R⁰⁶²、R⁰⁷¹及びR¹⁰¹は、同
 一又は相異なって、
 置換されてもよいC₁₋₁₀アルキル基、
 置換されてもよいC₂₋₁₀アルケニル基、
 置換されてもよいC₂₋₁₀アルキニル基、
 置換されてもよいC₃₋₁₀シクロアルキル基、
 置換されてもよい、アリール基が縮環したC₃₋₁₀シクロアルキル基、
 置換されてもよいアリール基又は
 置換されてもよいヘテロ環基であり、
 上記の「置換されてもよい」の置換基とは、以下の置換基群から選択される任意の1～5
 個の置換基であり、その置換基群は
 ・カルボキシ基、
 ・ハロゲン原子、
 ・オキシ基、
 ・水酸基、
 ・シアノ基、
 ・ニトロ基、
 ・オキシド基、
 ・スルホン酸基、
 ・チオール基、
 並びに、A群で置換されても良い、
 ・C₁₋₁₀アルキル基、
 ・C₂₋₁₂アルケニル基、
 ・C₂₋₁₂アルキニル基、
 ・C₃₋₁₀シクロアルキル基、

10

20

30

40

50

- ・ C_{1-10} アルコキシ基、
- ・ C_{1-10} ヒドロキシアルコキシ基、
- ・ C_{2-12} アルケニルオキシ基、
- ・ カルボキシル C_{1-6} アルキルオキシ基、
- ・ シアノ C_{1-6} アルキルオキシ基、
- ・ C_{1-10} アルキルチオ基、
- ・ C_{1-6} アルキルスルホニル基、
- ・ C_{1-6} アルキル基又はハロゲン原子で置換されてもよいアリールスルホニル基、
- ・ C_{1-10} ハロアルキルチオ基、
- ・ C_{2-10} アルケニルチオ基、
- ・ C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキル基、
- ・ C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ基、
- ・ C_{1-10} ハロアルキル基、
- ・ C_{2-12} アルカノイル基、
- ・ C_{2-12} アルカノイルオキシ基、
- ・ C_{2-12} アルカノイルオキシ C_{1-6} アルキル基、
- ・ 1～3個のハロゲン原子又はニトロ基で置換されてもよいベンゾイル基、
- ・ C_{2-6} アルカノイルアミノ基、
- ・ 1若しくは2個の C_{1-6} アルキル基で置換されてもよいアミノスルホニル基、
- ・ C_{1-6} アルキルスルホニル基、
- ・ C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基、
- ・ C_{1-6} アルキルで置換されてもよいベンゼンスルホニルアミノ基、
- ・ スクシンイミド基、
- ・ マレイミド基、
- ・ フタルイミド基、
- ・ C_{2-10} アルコキシカルボニル基、
- ・ C_{2-10} アルコキシカルボニルアルコキシ基、
- ・ トリ- C_{1-6} アルキルシリルオキシ基、
- ・ 式- $N(R^{22})R^{23}$ (式中、 R^{22} 及び R^{23} は、それぞれ水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル基、 C_{3-10} アルコキシカルボニルアルキル基若しくはシアノ C_{1-6} アルキル基を示すか隣接する窒素原子と一緒にあって「 C_{1-6} アルキル基、シアノ C_{1-6} アルキル基、 C_{3-10} シクロアルキル基、 C_{2-6} アルカノイル基、ベンゾイル基、「 C_{1-6} アルキル基若しくは C_{1-6} アルコキシ基」で置換されてもよいアリールオキシ C_{2-6} アルカノイル基、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルコキシカルボニル基、オキソ基若しくは水酸基」で置換されてもよい環状アミノ基を形成する基を示す。)で表される基、
- ・ 式- $CON(R^{22})R^{23}$ (式中、 R^{22} 及び R^{23} は前記と同意義である。)で表される基、
- ・ 式- $OCN(R^{22})R^{23}$ (式中、 R^{22} 及び R^{23} は前記と同意義である。)で表される基、
- ・ 式- $CH_2N(R^{22})R^{23}$ (式中、 R^{22} 及び R^{23} は前記と同意義である。)で表される基、
- ・ 式- $O(CH_2)_mN(R^{22})R^{23}$ (式中、 R^{22} 及び R^{23} は前記と同意義である。)で表される基、及び
- ・ 「 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基、1若しくは2個の C_{1-6} アルキル基で置換されてもよいアミノスルホニル基、1若しくは2個の C_{1-6} アルキル基で置換されてもよいアミノスルホニルアミノ基、1若しくは2個の C_{1-6} アルキル基で置換されてもよいアミノ C_{1-6} アルキル基、飽和複素環基、飽和複素環基で置換された C_{1-6} アルキル基、カルボキシル基、 C_{2-10} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル基、シアノ基、シアノ C_{1-6} アルキル基、1若しくは2個の C_{1-6} アルキル基で置換されてもよいアミノ基、水酸基、 C_{1-10} アルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基及びニトロ基」からなる群から任意に選択される1～5個の基で置換されてもよい「アリール基、ヘテロ環基、アリールオキシ基、アリールチオ基、ヘテロシリルオキシ基若しくはヘテロシリルチオ基」からなる群

であって、

前記 A 群は、「ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル基、水酸基若しくはニトロ基」で置換されてもよい「アリール基、ヘテロ環基、ヘテロシクリルチオ基若しくはアリールオキシ基」、シアノ基、シアノチオ基、カルボキシ基、水酸基、 C_{2-10} アルコキシカルボニル基又は C_{1-10} アルコキシ基であり、

前記 R^{20} 及び R^{21} は、同一又は相異なって、

水素原子又は上記置換基で置換されてもよい C_{1-10} アルキル基から適宜選択される基であり、

前記 p は 0 から 2 の整数であり、

前記 n は 1 又は 2 であり、

前記 m は 2 から 4 の整数であり、

「保護された水酸基」とは「水酸基の保護基」で保護された水酸基を意味し、

「保護されたアミノ基」とは「アミノ基の保護基」で保護されたアミノ基を意味し、

「保護されたオキシム基」とは「オキシム基の保護基」で保護されたオキシム基を意味し、

、

前記の各保護基はシリル系保護基、アシル系保護基、エーテル系保護基、又はカーボネート系保護基から選択される。} で表される 10 a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

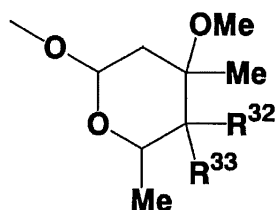
【請求項 2】

R^{13} 及び R^{14} がメチル基である請求項 1 に記載の 10 a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

【請求項 3】

R^8 及び R^9 が水素原子であり、 R^2 及び R^3 の一方が水素原子であって、他方が式

【化 39】



で示される基であり、 R^4 が水素原子、又は

式 $-R^{041}$ で示される基であり、 R^5 及び R^6 の一方が水素原子であって、他方が水酸基であるか、又は R^5 及び R^6 が一緒になって、オキシ基、オキシム基、保護されたオキシム基、

式 $=N-X^{065}-R^{062}$ で示される基、

式 $=N-X^{065}-A^{064}-X^{066}-R^{062}$ で示される基、

式 $=N-X^{065}-A^{064}-X^{066}-A^{065}-X^{067}-R^{062}$ で示される基、若しくは

式 $=N-X^{065}-A^{064}-X^{066}-A^{065}-X^{067}-A^{066}-X^{068}-R^{062}$ で示される基であり、

R^7 がメチル基である請求項 2 に記載の 10 a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

【請求項 4】

R^8 及び R^9 が水素原子であり、 R^2 及び R^3 の一方が水素原子であって、他方が式

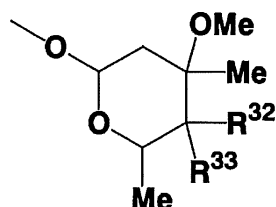
10

20

30

40

【化 4 0】



で示される基であり、 R^4 が水素原子、又は

式 $-R^{041}$ で示される基であり、 R^5 及び R^6 の一方が水素原子であって、他方が水酸基、アミノ基、

式 $-OCONH_2$ で表される基、

式 $-X^{061}-R^{061}$ で示される基、若しくは

式 $-X^{061}-A^{061}-X^{062}-R^{061}$ で示される基であるか、又は R^5 及び R^6 が一緒になって、オキシ基、オキシム基、

式 $=N-NH_2$ で示される基、

式 $=N-O-R^{062}$ で示される基、若しくは

式 $=N-O-A^{064}-X^{066}-R^{062}$ で示される基であり、 R^7 がメチル基であり、 R^{10} 及び R^{11} の一方が水素原子であって、他方が水素原子、

式 $-X^{101}-R^{101}$ で示される基、又は

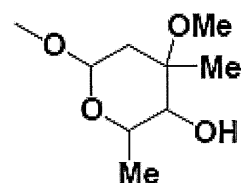
式 $-X^{101}-A^{101}-X^{102}-R^{101}$ で示される基であり、 X^{101} は単結合、又は

式 $-CO_2-$ で示される基である請求項 2 に記載の 10 a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

【請求項 5】

R^8 及び R^9 が水素原子であり、 R^2 及び R^3 の一方が水素原子であって、他方が式

【化 4 1】



で示される基であり、 R^4 が水素原子、メチル基、又は

式 $-CONHCO_2Me$ で示される基であり、 R^7 がメチル基であり、 R^5 及び R^6 の一方が水素原子であって、他方が水酸基であり、 R^{10} 及び R^{11} の一方が水素原子であって、他方が水素原子、

式 $-X^{101}-R^{101}$ で示される基、又は

式 $-X^{101}-A^{101}-X^{102}-R^{101}$ で示される基であり、 X^{101} は単結合、又は

式 $-CO_2-$ で示される基である請求項 2 に記載の 10 a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

【請求項 6】

R^8 及び R^9 が水素原子であり、 R^2 及び R^3 の一方が水素原子であって、他方が水酸基、

式 $-OCO-R^{031}$ で示される基、若しくは

式 $-OCO-A^{031}-X^{032}-A^{032}-X^{033}-A^{033}-X^{034}-R^{031}$ で示される基であるか、又は R^2 及び R^3 が一緒になって、オキシ基であり、 R^4 及び R^7 がメチル基であり、 R^5 及び R^6 の一方が水素原子であって、他方が水酸基であり、 R^{10} 及び R^{11} の一方が水素原子であって、他方がエチル基、又は

式 $-A^{101}-X^{102}-R^{101}$ で示される基である請求項 2 に記載の 10 a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

【請求項 7】

【請求項 7】

10

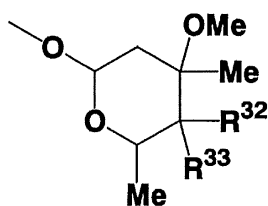
20

30

40

50

R^8 及び R^9 が水素原子であり、 R^2 及び R^3 の一方が水素原子であって、他方が式【化42】



で示される基であり、 R^{32} 及び R^{33} の一方が水素原子であって、他方が水酸基、アミノ基、

式 $-X^{331}-A^{331}-X^{332}-R^{331}$ で示される基、若しくは

式 $-X^{331}-A^{331}-X^{332}-A^{332}-X^{333}-R^{331}$ で示される基であり、

X^{331} が

式 $-O-C-O-$ で示される基、若しくは

式 $-O-C-O-NH-$ で示される基であり、又は R^{32} 及び R^{33} の一方が水酸基であって、他方がメチル基、若しくは

式 $-X^{335}-A^{334}-X^{336}-R^{332}$ で示される基であり、 X^{335} が

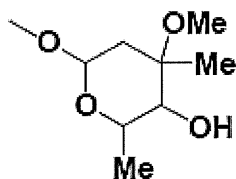
式 $-CH_2-NH-$ で示される基、若しくは

式 $-CH_2-NH-CO-$ で示される基であり、あるいは R^{32} 及び R^{33} が一緒になって、オキソ基、若しくはオキシム基であり、 R^4 が水素原子、又はメチル基であり、 R^7 がメチル基であり、 R^5 及び R^6 の一方が水素原子であって、他方が水酸基であるか、又は R^5 及び R^6 が一緒になって、オキソ基、若しくはオキシム基であり、 R^{10} 及び R^{11} の一方が水素原子であって、他方が水素原子、メチル基、エチル基、又はシアノプロピル基である請求項2に記載の10a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

【請求項8】

R^8 及び R^9 が水素原子であり、 R^2 及び R^3 の一方が水素原子であって、他方が式

【化43】



で示される基、又は

式 $-O-C-O-R^{031}$ で示される基であり、 R^4 及び R^7 がメチル基であり、 R^5 及び R^6 の一方が水素原子であって、他方がアミノ基、

式 $-O-C-O-NH_2$ で表される基、

式 $-X^{061}-R^{061}$ で示される基、若しくは

式 $-X^{061}-A^{061}-X^{062}-R^{061}$ で示される基であるか、又は R^5 及び R^6 が一緒になってオキソ基、オキシム基、

式 $=N-NH_2$ で示される基、

式 $=N-O-R^{062}$ で示される基、若しくは

式 $=N-O-A^{064}-X^{066}-R^{062}$ で示される基であり、 R^{10} 及び R^{11} の一方が水素原子であって、他方が水素原子、

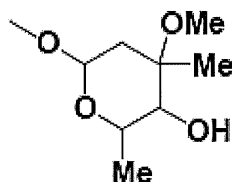
式 $-R^{101}$ で示される基、又は

式 $-A^{101}-X^{102}-R^{101}$ で示される基である請求項2に記載の10a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

【請求項9】

R^8 及び R^9 が水素原子であり、 R^2 及び R^3 が一緒になってオキソ基であるか又は、一方が水素原子であって、他方が式

【化 4 4】



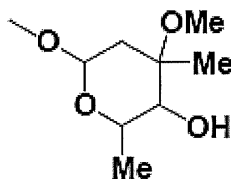
で示される基、若しくは、

式 $-O-C-O-R^{031}$ で示される基であり、 R^4 がメチル基であり、 R^5 及び R^6 の一方が水素原子であって、他方が R^7 と一緒になって環状カーバメート $[-O-C-O-]$ を形成し、 R^1 及び R^{11} の一方が水素原子であって、他方がエチル基、又は式 $-A^{101}-X^{102}-R^{101}$ で示される基である請求項 2 に記載の 10 a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

【請求項 10】

R^8 及び R^9 が水素原子であり、 R^2 及び R^3 が一緒になってオキシ基であるか又は、一方が水素原子であって、他方が式

【化 4 5】



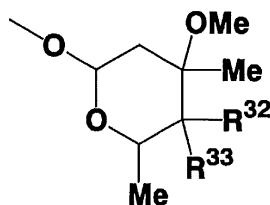
で示される基であり、 R^4 は、

式 $-R^{041}$ で示される基であり、 R^5 及び R^6 の一方が水素原子であって、他方が水酸基であり、 R^7 がメチル基であるか、又は R^5 及び R^6 の一方と一緒に環状カーバメート $[-O-C-O-]$ を形成してもよく、 R^{10} 及び R^{11} の一方が水素原子であって、他方がエチル基である請求項 2 に記載の 10 a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

【請求項 11】

R^8 及び R^9 が水素原子であり、 R^2 及び R^3 の一方が水素原子であって、他方が式

【化 4 6】



で示される基であり、 R^{32} 及び R^{33} の一方が水素原子であって、他方がアミノ基、水酸基、

式 $-O-C-O-N(R^{24})R^{25}$ (式中、 R^{24} 及び R^{25} は、共に水素原子を示すか、又は隣接する窒素原子と一緒に環状アミノ基を形成する基を示す。) で示される基、

式 $-X^{331}-R^{331}$ で示される基、

式 $-X^{331}-A^{331}-X^{332}-R^{331}$ で示される基、又は

式 $-X^{331}-A^{331}-X^{332}-A^{332}-X^{333}-A^{333}-X^{334}-R^{331}$ で示される基であり、 R^4 及び R^7 がメチル基であり、 R^5 及び R^6 の一方が水素原子であって、他方が水酸基であり、 R^{10} 及び R^{11} の一方が水素原子であって、他方がエチル基である請求項 2 に記載の 10 a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

【請求項 12】

R^8 及び R^9 が水素原子であり、 R^2 及び R^3 の一方が水素原子であって、他方が式

10

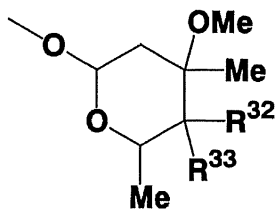
20

30

40

50

【化 4 7】



で示される基であり、 R^{32} 及び R^{33} の一方が水酸基であって、他方が

式 $-CH_2NH_2$ で示される基、

式 $-X^{335}-R^{332}$ で示される基、

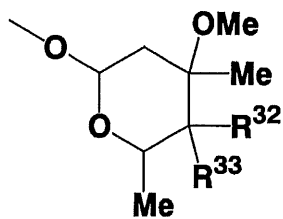
式 $-X^{335}-A^{334}-X^{336}-R^{332}$ で示される基、又は

式 $-X^{335}-A^{334}-X^{336}-A^{335}-X^{337}-R^{332}$ で示される基であり、 R^4 及び R^7 がメチル基であり、 R^5 及び R^6 の一方が水素原子であって、他方が水酸基であり、 R^{10} 及び R^{11} の一方が水素原子であって、他方がエチル基である請求項 2 に記載の 10a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

【請求項 1 3】

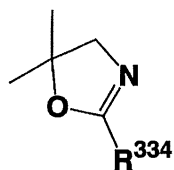
R^8 及び R^9 が水素原子であり、 R^2 及び R^3 の一方が水素原子であって、他方が式

【化 4 8】



で示される基であり、 R^{32} 及び R^{33} が、一緒になって式

【化 4 9】



で示される基であり、 R^{334} が

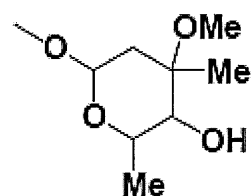
式 $-SH$ で示される基、又は

式 $-OH$ で示される基であり、 R^4 及び R^7 がメチル基であり、 R^5 及び R^6 の一方が水素原子であって、他方が水酸基であり、 R^{10} 及び R^{11} の一方が水素原子であって、他方がエチル基である請求項 2 に記載の 10a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

【請求項 1 4】

R^8 及び R^9 が水素原子であり、 R^2 及び R^3 の一方が水素原子であって、他方が式

【化 5 0】



で示される基であり、 R^4 がメチル基であり、 R^5 及び R^6 の一方が水素原子であって、他

10

20

30

40

50

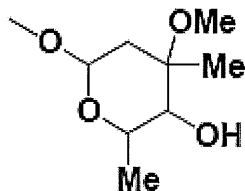
方が水酸基であり、 R^7 が

式－ R^{071} で示される基であり、 R^{10} 及び R^{11} の一方が水素原子であって、他方がエチル基である請求項2に記載の10a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

【請求項15】

R^8 及び R^9 が水素原子であり、 R^2 及び R^3 の一方が水素原子であって、他方が水酸基、又は式

【化51】



10

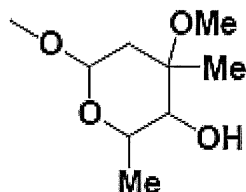
で示される基であり、 R^4 がメチル基であり、 R^5 及び R^6 の一方が水素原子であって、他方が水酸基であり、 R^7 が R^{10} と一緒に環状カーバメート $[-CO_2CH_2-]$ を形成し、 R^{11} が水素原子である請求項2に記載の10a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

【請求項16】

R^2 及び R^3 の一方が水素原子であって、他方が式

20

【化52】



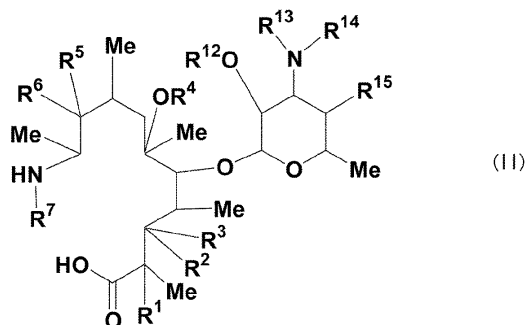
で示される基であり、 R^4 がメチル基であり、 R^5 及び R^6 の一方が水素原子であって、他方が水酸基であり、 R^7 がメチル基又は水酸基であり、 R^8 及び R^9 の一方が水素原子であって、他方がメチル基であり、 R^{10} 及び R^{11} の一方が水素原子であって、他方がメチル基、又はエチル基である請求項2に記載の10a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物。

30

【請求項17】

式(II)

【化53】



40

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は、それぞれ請求項1に記載された R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} と同意義である。但し、 R^6 は R^7 と一緒に環状カーバメート $[-OCO-]$ を形成する場合を除く。)で示される化合物。

【発明の詳細な説明】

50

【技術分野】

【0001】

本発明は、エリスロマイシン類似骨格を有する新規抗生物質に関する。

【背景技術】

【0002】

エリスロマイシンAは、抗生物質であり、グラム陽性菌、マイコプラズマなどに起因する感染症の治療薬として広く使用されている。しかし、エリスロマイシンは、胃酸で分解されるため、体内動態が一定しないという欠点があった。そこで酸に対する安定性を増したエリスロマイシンの誘導体が検討された。その結果、クラリスロマイシン、アジスロマイシン（下記特許文献1及び2）、及びロキシスロマイシンなどの体内動態の安定したマクロライド剤が開発されてきた。これらマクロライド剤は、外来の呼吸器感染症を治療領域としており、特に臨床分離頻度の高い肺炎球菌、連鎖球菌及びインフルエンザ菌に対して強い抗菌活性を有する必要がある。更に、市中肺炎からマクロライド耐性の肺炎球菌が高頻度に分離されている事から耐性肺炎球菌に有効である事も重要となっている。

10

【0003】

近年、広範な研究の結果、エリスロマイシン耐性肺炎球菌、エリスロマイシン耐性連鎖球菌のいずれに対しても有効なマクロライドとしてAgouridasらは1995年にHMR3647(テリスロマイシン、下記特許文献3)を、次いでOrらは1998年にABT-773(セスロマイシン、下記特許文献4)を相次いで見出した。その後、更に薬効増強が図られた2-フルオロケトライド(下記特許文献5)が報告されている。

20

【0004】

一方、市販のマクロライド剤をその構造上から分類すると、エリスロマイシン誘導体からなる14員環、15員環マクロライドの系統とロイコマイシン誘導体である16員環マクロライドの系統に大別される。エリスロマイシン誘導体のうち、15員環マクロライドとしては、前述のアジスロマイシンがある。これは他の14員環マクロライドとは異なりラクトン環内に窒素原子をもつという構造的な特徴を有していることからアザライドと呼ばれている。なお、アザライドはラクトンのカルボニル基を1位とした場合に窒素原子が導入された炭素原子の位置番号を元に命名され、前記アジスロマイシンの場合には、カルボニル基から9番目の炭素原子に窒素原子が導入されていることから9a-アザライドと呼ばれる。

30

【0005】

9a-アザライド以外に、14員環マクロライドを化学変換して得られるアザライドの報告例としては8a-アザライド（下記特許文献6）及び11a-アザライド（下記特許文献7）が知られている。

【0006】

一方、10a-アザライドについては、ロイコマイシン誘導体である16員環マクロライドから誘導されたもの（下記特許文献8）が最近報告されたが、14員環マクロライドから誘導された10a-アザライドは報告されていない。

【0007】

【特許文献1】 米国特許第4474768号

40

【特許文献2】 米国特許第4517359号

【特許文献3】 EP680967号

【特許文献4】 WO98/09978号

【特許文献5】 WO02/32919号

【特許文献6】 EP508726号

【特許文献7】 WO2003/014136

【特許文献8】 WO2005/019238

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0008】

50

本発明の目的は、従来のエリスロマイシン感受性菌のみならず、インフルエンザ菌及びエリスロマイシン耐性菌（例えば耐性肺炎球菌及びレンサ球菌）に対しても有効な新規構造を有する化合物を提供することにある。

【課題を解決するための手段】

【0009】

そこで、本発明者らはアザライド化合物の研究を鋭意行った結果、14員環マクロライドから誘導される新規アザライドの合成に成功した。

すなわち、本発明者らは14員環マクロライドを出発物質として、11位及び12位のジオール部分を酸化開裂した際に得られる10位オキソ体を酸化してカルボキシル体へと誘導した。続いて、このカルボキシル体を原料に転位反応を行うことにより、これまでに報告例のない10位アミノ基を持つ化合物を合成した。そして本化合物を部分構造変換した後に分子内環化を行うことで、新規な骨格である10a-アザライド化合物を供給することに成功した。

10

【0010】

さらに、これらの化合物の抗菌活性を評価した結果、10a-アザライド化合物は出発物質であるエリスロマイシン誘導体よりも優れた活性を有することを見出し、本発明を完成した。

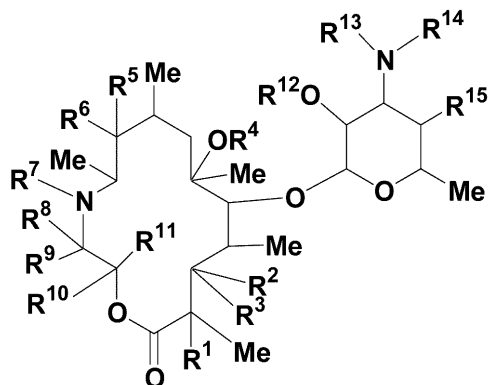
【0011】

すなわち本発明は、式(I)

【0012】

20

【化1】



(I)

30

【0013】

{式(I)中、R¹は、
水素原子、
ハロゲン原子又は
置換されてもよいC₁₋₁₀アルキル基であり、

【0014】

R²及びR³は、一緒になってオキソ基であるか又は
一方が水素原子であって、他方は、

40

水素原子、

水酸基、

保護された水酸基、

式-X⁰³¹-R⁰³¹で示される基、

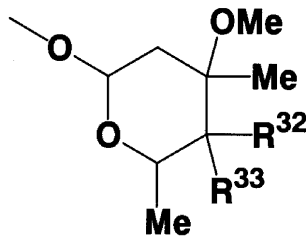
式-X⁰³¹-A⁰³¹-X⁰³²-R⁰³¹で示される基、

式-X⁰³¹-A⁰³¹-X⁰³²-A⁰³²-X⁰³³-R⁰³¹で示される基、

式-X⁰³¹-A⁰³¹-X⁰³²-A⁰³²-X⁰³³-A⁰³³-X⁰³⁴-R⁰³¹で示される基又は式

【0015】

【化 2】



【0016】

10

で示される基であり、
 ここで、 X^{031} は、
 式-O-で示される基、
 式-O-C-O-で示される基、
 式-O-C-O₂-で示される基又は
 式-O-C-O-N(R²⁰)-で示される基であり、
 R^{32} 及び R^{33} は、一方が水素原子であって、他方は
 水素原子、
 アミノ基、
 水酸基、
 保護された水酸基、
 式-O-C-O-N(R²⁴)-R²⁵（式中、 R^{24} 及び R^{25} は、共に水素原子を示すか、又は隣接する窒素原子と一緒になって環状アミノ基を形成する基を示す。）で示される基、
 式-X³³¹-R³³¹で示される基、
 式-X³³¹-A³³¹-X³³²-R³³¹で示される基、
 式-X³³¹-A³³¹-X³³²-A³³²-X³³³-R³³¹で示される基又は
 式-X³³¹-A³³¹-X³³²-A³³²-X³³³-A³³³-X³³⁴-R³³¹で示される基であり、
 ここで、 X^{331} は、
 単結合、
 式-O-で示される基、
 式-O-C-O-で示される基、
 式-O-C-O₂-で示される基、
 式-O-C-O-N(R²⁰)-で示される基、
 式-N(R²⁰)-で示される基、
 式-N(R²⁰)-C-O-で示される基、
 式-N(R²⁰)-C-O₂-で示される基、
 式-N(R²⁰)-C-O-N(R²¹)-で示される基又は
 式-N(R²⁰)-S-O₂-で示される基であり、

20

30

【0017】

又は、 R^{32} 及び R^{33} は、一方が水酸基であって、他方は、
 式-CH₂NH₂で示される基、
 式-X³³⁵-R³³²で示される基、
 式-X³³⁵-A³³⁴-X³³⁶-R³³²で示される基、
 式-X³³⁵-A³³⁴-X³³⁶-A³³⁵-X³³⁷-R³³²で示される基又は
 式-X³³⁵-A³³⁴-X³³⁶-A³³⁵-X³³⁷-A³³⁶-X³³⁸-R³³²で示される基であり、
 ここで、 X^{335} は
 単結合、
 式-(CH₂)_n-N(R²⁰)-で示される基、
 式-(CH₂)_n-N(R²⁰)-C-O-で示される基、
 式-(CH₂)_n-N(R²⁰)-C-O₂-で示される基、

40

50

式 $-(CH_2)_n-N(R^{20})CON(R^{21})-$ で示される基、
 式 $-(CH_2)_n-N(R^{20})O-$ で示される基、
 式 $-(CH_2)_n-OC ON(R^{20})-$ で示される基、
 式 $-(CH_2)_n-ON(R^{20})CO-$ で示される基、
 式 $-(CH_2)_n-O-$ で示される基、
 式 $-(CH_2)_n-OCO-$ で示される基、
 式 $-(CH_2)_n-OCO_2-$ で示される基又は
 式 $-(CH_2)_n-OC(NR^{20})-$ で示される基又は
 式 $-(CH_2)_n-S(O)_p-$ で示される基であり、

【0018】

10

又は R^{32} 及び R^{33} は、一緒になって
 オキソ基、

オキシム基、

式 $=N-X^{339}-R^{333}$ で示される基、

式 $=N-X^{339}-A^{337}-X^{340}-R^{333}$ で示される基、

式 $=N-X^{339}-A^{337}-X^{340}-A^{338}-X^{341}-R^{333}$ で示される基、

式 $=N-X^{339}-A^{337}-X^{340}-A^{338}-X^{341}-A^{339}-X^{342}-R^{333}$ で示される基若しくは式

【0019】

【化3】

20



【0020】

で示される基であり、

30

ここで、 X^{339} は、

単結合、

式 $-O-$ で示される基、

式 $-N(R^{20})-$ で示される基、

式 $-N(R^{20})CO-$ で示される基、

式 $-N(R^{20})CO_2-$ で示される基、

式 $-N(R^{20})CON(R^{21})-$ で示される基又は

式 $-N(R^{20})SO_2-$ で示される基であり、

R^{334} は、

式 $-SH$ で示される基、

40

式 $-OH$ で示される基、

式 $-X^{343}-R^{335}$ で示される基、

式 $-X^{343}-A^{340}-X^{344}-R^{335}$ で示される基、

式 $-X^{343}-A^{340}-X^{344}-A^{341}-X^{345}-R^{335}$ で示される基又は

式 $-X^{343}-A^{340}-X^{344}-A^{341}-X^{345}-A^{342}-X^{346}-R^{335}$ で示される基であり、

ここで、 X^{343} は、

単結合、

式 $-S-$ で示される基又は

式 $-(CH_2)_nCO-$ であり、

50

R^4 は、
 水素原子、
 式 $-CONHCO_2Me$ で示される基
 式 $-X^{041}-R^{041}$ で示される基、
 式 $-X^{041}-A^{041}-X^{042}-R^{041}$ で示される基、
 式 $-X^{041}-A^{041}-X^{042}-A^{042}-X^{043}-R^{041}$ で示される基又は
 式 $-X^{041}-A^{041}-X^{042}-A^{042}-X^{043}-A^{043}-X^{044}-R^{041}$ で示される基であり、
 ここで、 X^{041} は、
 単結合、
 式 $-CO-$ で示される基、
 式 $-CON(R^{20})-$ で示される基又は
 式 $-CO_2-$ で示される基であり、

10

又は R^4 は R^6 と一緒にって環状カーボネート $[-CO_2-]$ を形成してもよく、
 【0021】

R^5 及び R^6 は、一方が水素原子であって、他方は、
 水素原子、
 水酸基、
 保護された水酸基、
 アミノ基、
 保護されたアミノ基、
 ハロゲン原子、

20

式 $-OCONH_2$ で表される基、
 式 $-X^{061}-R^{061}$ で示される基、
 式 $-X^{061}-A^{061}-X^{062}-R^{061}$ で示される基、
 式 $-X^{061}-A^{061}-X^{062}-A^{062}-X^{063}-R^{061}$ で示される基若しくは
 式 $-X^{061}-A^{061}-X^{062}-A^{062}-X^{063}-A^{063}-X^{064}-R^{061}$ で示される基であるか、
 又は R^7 と一緒にって環状カーバメート $[-OCO-]$ を形成してもよく、
 ここで、 X^{061} は

単結合、
 式 $-O-$ で示される基、
 式 $-OCO-$ で示される基、
 式 $-OCO_2-$ で示される基、
 式 $-OCON(R^{20})-$ で示される基、
 式 $-N(R^{20})-$ で示される基、
 式 $-N(R^{20})CO-$ で示される基、
 式 $-N(R^{20})CO_2-$ で示される基、
 式 $-N(R^{20})CON(R^{21})-$ で示される基、
 式 $-N(R^{20})SO_2-$ で示される基又は
 式 $-CH_2N(R^{20})-$ で示される基であり、

30

又は R^5 及び R^6 は、一緒にって

40

オキシ基、
 オキシム基、
 式 $=N-NH_2$ で示される基、
 保護されたオキシム基、
 式 $=N-X^{065}-R^{062}$ で示される基、
 式 $=N-X^{065}-A^{064}-X^{066}-R^{062}$ で示される基、
 式 $=N-X^{065}-A^{064}-X^{066}-A^{065}-X^{067}-R^{062}$ で示される基又は
 式 $=N-X^{065}-A^{064}-X^{066}-A^{065}-X^{067}-A^{066}-X^{068}-R^{062}$ で示される基であり
 ここで、 X^{065} は、
 単結合、

50

式-O-で示される基、
 式-N(R²⁰)-で示される基、
 式-N(R²⁰)CO-で示される基、
 式-N(R²⁰)CO₂-で示される基、
 式-N(R²⁰)CON(R²¹)-で示される基又は
 式-N(R²⁰)SO₂-で示される基であり、

【0022】

R⁷は、
 水素原子、
 水酸基、
 アミノ基の保護基、
 式-X⁰⁷¹-R⁰⁷¹で示される基、
 式-X⁰⁷¹-A⁰⁷¹-X⁰⁷²-R⁰⁷¹で示される基若しくは
 式-X⁰⁷¹-A⁰⁷¹-X⁰⁷²-A⁰⁷²-X⁰⁷³-R⁰⁷¹で示される基であるか、
 又はR¹⁰と一緒に環状カーバメート [-CO₂CH₂-] を形成してもよく、
 ここで、X⁰⁷¹は、
 単結合、
 式-O-で示される基、
 式-CO-で示される基、
 式-CO₂-で示される基又は
 式-SO₂-で示される基であり、

【0023】

R⁸及びR⁹は、同一又は相異なって、
 水素原子、
 式-X⁰⁸¹-R⁰⁸¹で示される基、
 式-X⁰⁸¹-A⁰⁸¹-X⁰⁸²-R⁰⁸¹で示される基又は
 式-X⁰⁸¹-A⁰⁸¹-X⁰⁸²-A⁰⁸²-X⁰⁸³-R⁰⁸¹で示される基であり、
 ここで、X⁰⁸¹は
 単結合、
 式-CO-で示される基、
 式-CO₂-で示される基又は
 式-CON(R²⁰)-で示される基であり、

【0024】

R¹⁰及びR¹¹は、同一又は相異なって、
 水素原子、
 式-X¹⁰¹-R¹⁰¹で示される基、
 式-X¹⁰¹-A¹⁰¹-X¹⁰²-R¹⁰¹で示される基、
 式-X¹⁰¹-A¹⁰¹-X¹⁰²-A¹⁰²-X¹⁰³-R¹⁰¹で示される基又は
 式-X¹⁰¹-A¹⁰¹-X¹⁰²-A¹⁰²-X¹⁰³-A¹⁰³-X¹⁰⁴-R¹⁰¹で示される基であり、
 ここで、X¹⁰¹は、
 単結合、
 式-CO-で示される基、
 式-CO₂-で示される基又は
 式-CON(R²⁰)-で示される基であり、

【0025】

R¹²は、
 水素原子、
 水酸基の保護基、
 式-X¹²¹-R¹²¹で示される基、
 式-X¹²¹-A¹²¹-X¹²²-R¹²¹で示される基であり又は

10

20

30

40

50

式 $-X^{121}-A^{121}-X^{122}-A^{122}-X^{123}-R^{121}$ で示される基であり、
 ここで、 X^{121} は、
 単結合、
 式 $-CO-$ で示される基、
 式 $-CO_2-$ で示される基又は
 式 $-CON(R^{20})-$ で示される基であり、

【0026】

R^{13} 及び R^{14} は、同一又は相異なって、
 水素原子、
 アミノ基の保護基、

10

式 $-X^{131}-R^{131}$ で示される基、
 式 $-X^{131}-A^{131}-X^{132}-R^{131}$ で示される基又は
 式 $-X^{131}-A^{131}-X^{132}-A^{132}-X^{133}-R^{131}$ で示される基であり、
 ここで、 X^{131} は、
 単結合、
 式 $-CO-$ で示される基、
 式 $-CO_2-$ で示される基又は
 式 $-CON(R^{20})-$ で示される基であり、

【0027】

R^{15} は、
 水素原子、
 水酸基、
 保護された水酸基、

20

式 $-X^{151}-R^{151}$ で示される基、
 式 $-X^{151}-A^{151}-X^{152}-R^{151}$ で示される基又は
 式 $-X^{151}-A^{151}-X^{152}-A^{152}-X^{153}-R^{151}$ で示される基であり、
 ここで、 X^{151} は
 単結合、
 式 $-OCO-$ で示される基、
 式 $-OCO_2-$ で示される基又は
 式 $-OCON(R^{20})-$ で示される基であり、

30

【0028】

前記、 X^{032} 、 X^{033} 、 X^{034} 、 X^{332} 、 X^{333} 、 X^{334} 、 X^{336} 、 X^{337} 、 X^{338} 、 X^{340} 、 X^{341} 、 X^{342} 、 X^{344} 、 X^{345} 、 X^{346} 、 X^{042} 、 X^{043} 、 X^{044} 、 X^{062} 、 X^{063} 、 X^{064} 、 X^{066} 、 X^{067} 、 X^{068} 、 X^{072} 、 X^{073} 、 X^{082} 、 X^{083} 、 X^{102} 、 X^{103} 、 X^{104} 、 X^{122} 、 X^{123} 、 X^{132} 、 X^{133} 、 X^{152} 及び X^{153} は、同一又は相異なって、

単結合

式 $-O-$ で示される基、
 式 $-OCO-$ で示される基、
 式 $-OCO_2-$ で示される基、
 式 $-OCON(R^{20})-$ で示される基、
 式 $-S(O)_p-$ で示される基、
 式 $-SO_2N(R^{20})-$ で示される基、
 式 $-OCS-$ で示される基、
 式 $-CO-$ で示される基、
 式 $-CO_2-$ で示される基、
 式 $-CON(R^{20})-$ で示される基、
 式 $-CH=N-$ で示される基、
 式 $-CH=N-O-$ で示される基、
 式 $-CH=N(R^{20})-$ で示される基、

40

50

式-CH=N(R²⁰)O-で示される基、
 式-CH=N(R²⁰)N(R²¹)-で示される基、
 式-CH=N(OR²⁰)-で示される基、
 式-CH=N-N(R²⁰)R²¹-で示される基、
 式-CS-で示される基、
 式-C(S)O-で示される基、
 式-CSN(R²⁰)-で示される基、
 式-O-N=CH-で示される基、
 式-N=CH-で示される基、
 式-N(R²⁰)-で示される基、
 式-N(R²⁰)CO-で示される基、
 式-N(R²⁰)CS-で示される基、
 式-N(R²⁰)SO₂-で示される基、
 式-N(R²⁰)CO₂-で示される基又は
 式-N(R²⁰)CON(R²¹)-で示される基であり、

10

【0029】

前記A⁰³¹、A⁰³²、A⁰³³、A³³¹、A³³²、A³³³、A³³⁴、A³³⁵、A³³⁶、A³³⁷、A³³⁸、
 A³³⁹、A³⁴⁰、A³⁴¹、A³⁴²、A⁰⁴¹、A⁰⁴²、A⁰⁴³、A⁰⁶¹、A⁰⁶²、A⁰⁶³、A⁰⁶⁴、
 A⁰⁶⁵、A⁰⁶⁶、A⁰⁷¹、A⁰⁷²、A⁰⁸¹、A⁰⁸²、A¹⁰¹、A¹⁰²、A¹⁰³、A¹²¹、A¹²²、A¹³¹、
 A¹³²、A¹⁵¹及びA¹⁵²は、同一又は相異なって、

20

水酸基で置換されてもよい2価のC₁₋₁₀脂肪族炭化水素基、
 アリーレン基又は

2価のヘテロ環基であり、

【0030】

前記R⁰³¹、R³³¹、R³³²、R³³³、R³³⁵、R⁰⁴¹、R⁰⁶¹、R⁰⁶²、R⁰⁷¹、R⁰⁸¹、R¹⁰¹、
 R¹²¹、R¹³¹及びR¹⁵¹は、同一又は相異なって、

置換されてもよいC₁₋₁₀アルキル基、

置換されてもよいC₂₋₁₀アルケニル基、

置換されてもよいC₂₋₁₀アルキニル基、

置換されてもよいC₃₋₁₀シクロアルキル基、

30

置換されてもよい、アリール基が縮環したC₃₋₁₀シクロアルキル基、

置換されてもよいアリール基又は

置換されてもよいヘテロ環基であり、

【0031】

上記の「置換されてもよい」の置換基とは、以下の置換基群から選択される任意の1～5
 個の置換基であり、その置換基群は

- ・カルボキシル基、
- ・ハロゲン原子、
- ・オキシ基、
- ・水酸基、
- ・シアノ基、
- ・ニトロ基、
- ・オキシド基、
- ・スルホン酸基、
- ・チオール基、

40

並びに、A群で置換されてもよい、

- ・C₁₋₁₀アルキル基、
- ・C₂₋₁₂アルケニル基、
- ・C₂₋₁₂アルキニル基、
- ・C₃₋₁₀シクロアルキル基、

50

- ・ C_{1-10} アルコキシ基、
- ・ C_{1-10} ヒドロキシアルコキシ基、
- ・ C_{2-12} アルケニルオキシ基、
- ・ カルボキシル C_{1-6} アルキルオキシ基、
- ・ シアノ C_{1-6} アルキルオキシ基、
- ・ C_{1-10} アルキルチオ基、
- ・ C_{1-6} アルキルスルホニル基、
- ・ C_{1-6} アルキル基又はハロゲン原子で置換されてもよいアリールスルホニル基、
- ・ C_{1-10} ハロアルキルチオ基、
- ・ C_{2-10} アルケニルチオ基、
- ・ C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキル基、
- ・ C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ基、
- ・ C_{1-10} ハロアルキル基、
- ・ C_{2-12} アルカノイル基、
- ・ C_{2-12} アルカノイルオキシ基、
- ・ C_{2-12} アルカノイルオキシ C_{1-6} アルキル基、
- ・ 1～3個のハロゲン原子又はニトロ基で置換されてもよいベンゾイル基、
- ・ C_{2-6} アルカノイルアミノ基、
- ・ 1若しくは2個の C_{1-6} アルキル基で置換されてもよいアミノスルホニル基、
- ・ C_{1-6} アルキルスルホニル基、
- ・ C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基、
- ・ C_{1-6} アルキルで置換されてもよいベンゼンスルホニルアミノ基、
- ・ スクシンイミド基、
- ・ マレイミド基、
- ・ フタルイミド基、
- ・ C_{2-10} アルコキシカルボニル基、
- ・ C_{2-10} アルコキシカルボニルアルコキシ基、
- ・ トリ- C_{1-6} アルキルシリルオキシ基、
- ・ 式- $N(R^{22})R^{23}$ (式中、 R^{22} 及び R^{23} は、それぞれ水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル基、 C_{3-10} アルコキシカルボニルアルキル基若しくはシアノ C_{1-6} アルキル基を示すか隣接する窒素原子と一緒にあって「 C_{1-6} アルキル基、シアノ C_{1-6} アルキル基、 C_{3-10} シクロアルキル基、 C_{2-6} アルカノイル基、ベンゾイル基、「 C_{1-6} アルキル基若しくは C_{1-6} アルコキシ基」で置換されてもよいアリールオキシ C_{2-6} アルカノイル基、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルコキシカルボニル基、オキソ基若しくは水酸基」で置換されてもよい環状アミノ基を形成する基を示す。)で表される基、
- ・ 式- $CON(R^{22})R^{23}$ (式中、 R^{22} 及び R^{23} は前記と同意義である。)で表される基、
- ・ 式- $OCN(R^{22})R^{23}$ (式中、 R^{22} 及び R^{23} は前記と同意義である。)で表される基、
- ・ 式- $CH_2N(R^{22})R^{23}$ (式中、 R^{22} 及び R^{23} は前記と同意義である。)で表される基、
- ・ 式- $O(CH_2)_mN(R^{22})R^{23}$ (式中、 R^{22} 及び R^{23} は前記と同意義である。)で表される基、及び
- ・ 「 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ基、1若しくは2個の C_{1-6} アルキル基で置換されてもよいアミノスルホニル基、1若しくは2個の C_{1-6} アルキル基で置換されてもよいアミノスルホニルアミノ基、1若しくは2個の C_{1-6} アルキル基で置換されてもよいアミノ C_{1-6} アルキル基、飽和複素環基、飽和複素環基で置換された C_{1-6} アルキル基、カルボキシル基、 C_{2-10} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル基、シアノ基、シアノ C_{1-6} アルキル基、1若しくは2個の C_{1-6} アルキル基で置換されてもよいアミノ基、水酸基、 C_{1-10} アルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基及びニトロ基」からなる群から任意に選択される1～5個の基で置換されてもよい「アリール基、ヘテロ環基、アリールオキシ基、アリールチオ基、ヘテロシリルオキシ基若しくはヘテロシリルチオ基」からなる群

10

20

30

40

50

であって、

前記A群は、「ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル基、水酸基若しくはニトロ基」で置換されてもよい「アリール基、ヘテロ環基、ヘテロシクリルチオ基若しくはアリールオキシ基」、シアノ基、シアノチオ基、カルボキシル基、水酸基、 C_{2-10} アルコキシカルボニル基又は C_{1-10} アルコキシ基であり、

【0032】

前記 R^{20} 及び R^{21} は、同一又は相異なって、水素原子又は上記置換基で置換されてもよい C_{1-10} アルキル基から適宜選択される基であり、

【0033】

前記pは0から2の整数であり、

前記nは1又は2であり、

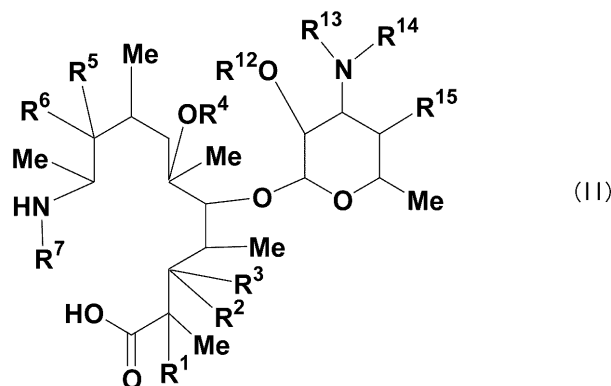
前記mは2から4の整数である。} で表される10a-アザライド化合物、その医薬上許容される塩又はその溶媒和物に関する。

【0034】

また、本発明は、優れた抗菌活性を有する10a-アザライド化合物を合成するための中間体である式(II)

【0035】

【化4】



【0036】

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は、前記と同意義である。但し、 R^6 は R^7 と一緒に環状カーバメート $[-OCO-]$ を形成する場合を除く。)で示される化合物に関する。

【0037】

本発明において、「 C_{x-y} 」とは、その後続く基がx～y個の炭素原子を有することを意味する。

「ハロゲン原子」とは、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素が挙げられる。

「 C_{1-6} アルキル基」とは、直鎖状又は分枝鎖状の炭素原子数1～6個のアルキル基であり、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、s-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、イソペンチル基、1,1-ジメチルプロピル基、及びn-ヘキシル基等が挙げられる。

【0038】

「 C_{1-10} アルキル基」とは、直鎖状又は分枝鎖状の炭素原子数1～10個のアルキル基であり、例えば、上記「 C_{1-6} アルキル基」の具体例に加えて、例えば、1,1,3,3-テトラメチルブチル基、n-ノナニル基、及びn-デカニル基等が挙げられる。

【0039】

「 C_{2-10} アルケニル基」とは、前記「アルキル基」の任意の位置に1個以上の二重結合を有する直鎖状又は分枝鎖状の炭素原子数2～10個のアルケニル基であり、例えば、ビ

10

20

30

40

50

ニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、イソプロペニル基、2-ブテニル基、1,3-ブタジエニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、及び2-ヘキセニル基等が挙げられる。

【0040】

「C₂₋₁₀アルキニル基」とは、前記「アルキル基」の任意の位置に1個以上の三重結合を有し、炭素原子数2～10個を有する直鎖又は分岐鎖状のアルキニル基を意味し、例えば、エチニル基、1-プロピニル基、及び2-プロピニル基等が挙げられる。

【0041】

「C₁₋₁₀ハロアルキル基」とは、前記「C₁₋₁₀アルキル基」が1つ又は複数のハロゲン原子で置換されたアルキル基であり、例えば、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、2,2,2-トリクロロエチル基、ペンタフルオロエチル基、3,3,3-トリフルオロプロピル基、パーフルオロプロピル基、4-フルオロブチル基、4-クロロブチル基、4-ブロモブチル基、及びパーフルオロヘキシル基等が挙げられる。

10

【0042】

「C₁₋₆アルコキシ基」とは、直鎖状又は分枝鎖状の炭素原子数1個～6個のアルコキシ基であり、例えば、メトキシ基、エトキシ基、1-プロポキシ基、イソプロポキシ基、1-ブトキシ基、1-メチルー1-プロポキシ基、t-ブトキシ基、及び1-ペンチルオキシ基等が挙げられる。

【0043】

「C₁₋₁₀アルコキシ基」とは、直鎖状又は分枝鎖状の炭素原子数1～10個のアルコキシ基であり、例えば、上記「C₁₋₆アルコキシ基」の具体例に加えて、例えば、1,1,3,3-テトラメチルブトキシ基、n-デシルオキシ基等が挙げられる。

20

【0044】

「C₂₋₁₀アルコキシカルボニル基」とは、前記アルコキシ基とカルボニル基が結合した炭素原子数2～10個を有する基を意味し、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、及びt-ブトキシカルボニル基等が挙げられる。

【0045】

「アリール基」とは、炭素原子数6～18個の単環～4環式の芳香族炭素環式基であり、例えば、フェニル基、ナフチル基、アントリル基、フェナントレニル基、テトラセニル基、及びピレニル基等が挙げられる。

30

【0046】

「ヘテロ環基」とは、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から任意に選ばれた1～5個の原子を環構成原子として含む単環式複素環基又は縮合環式複素環基であり、飽和複素環基、芳香族複素環基、部分的に飽和された単環式芳香族複素環基及び芳香族複素環基が部分的に飽和された単環を有する縮合環式複素環基も含まれる。また、部分的に飽和された単環を有する縮合環式複素環基は、オキシ基で置換されることができる。ヘテロ原子が硫黄原子の場合はジオキシド体も本発明においては包含する。

当該ヘテロ環基は、その環系に2～10個の炭素原子を有するヘテロ環基が好ましい。

なお、本願明細書中では、「ヘテロ環基」を便宜上「ヘテロシクリル基」と称することがあるが、これらは同義である。

40

【0047】

「飽和複素環基」としては、例えば、アジリジニル基、アゼチジニル基、ピロリジニル基、イミダゾリジニル基、ピラゾリジニル基、オキサゾリジニル基、チオラニル基、ピペリジニル基、オキサゾリジニル基、イソオキサゾリジニル基、ピペラジニル基、オキサニル基、チアニル基、モルホリニル基、及びチオモルホリニル基等が挙げられる。

【0048】

「芳香族複素環基」としては、例えば、ピリジニル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、キノリル基、イソキノリル基、チエニル基(例えば、2-チエニル基、3-チエニル基)、ピロリル基(例えば、1-ピロリル基、2-ピロリル基、3-ピロリル

50

基)、チアゾリル基(例えば、2-チアゾリル基、4-チアゾリル基、5-チアゾリル基)、イソチアゾリル基(例えば、3-イソチアゾリル基、4-イソチアゾリル基、5-イソチアゾリル基)、ピラゾリル基(例えば、1-ピラゾリル基、3-ピラゾリル基、4-ピラゾリル基)、イミダゾリル基(例えば、1-イミダゾリル基、2-イミダゾリル基、3-イミダゾリル基)、フリル基(例えば、2-フリル基、3-フリル基)、オキサゾリル基(例えば、2-オキサゾリル基、4-オキサゾリル基、5-オキサゾリル基)、イソキサゾリル基(例えば、3-イソキサゾリル基、4-イソキサゾリル基、5-イソキサゾリル基)、オキサジアゾリル基(例えば、1,2,3-オキサジアゾリル基、1,3,4-オキサジアゾリル基)、チアジアゾリル基(例えば、1,2,3-チアジアゾリル基、1,3,4-チアジアゾリル基)、トリアゾリル基(例えば、1,2,4-トリアゾリル基)、ベンゾフラニル基(例えば、2-ベンゾフラニル基、3-ベンゾフラニル基、4-ベンゾフラニル基、5-ベンゾフラニル基)、ベンゾチエニル基(例えば、2-ベンゾチエニル基、3-ベンゾチエニル基、4-ベンゾチエニル基、5-ベンゾチエニル基)、インドリル基(例えば、2-インドリル基、3-インドリル基、4-インドリル基、5-インドリル基)、ベンゾオキサゾリル基(例えば、2-ベンゾオキサゾリル基、4-ベンゾオキサゾリル基、5-ベンゾオキサゾリル基、6-ベンゾオキサゾリル基)、ベンゾイソキサゾリル基(例えば、3-ベンゾ[*c*]イソオキサゾリル基、4-ベンゾ[*c*]イソオキサゾリル基、5-ベンゾ[*c*]イソオキサゾリル基、6-ベンゾ[*c*]イソオキサゾリル基、3-ベンゾ[*d*]イソオキサゾリル基、4-ベンゾ[*d*]イソオキサゾリル基、5-ベンゾ[*d*]イソオキサゾリル基、6-ベンゾ[*d*]イソオキサゾリル基)、インダゾリル基(例えば、3-インダゾリル基、4-インダゾリル基、5-インダゾリル基、6-インダゾリル基)、ベンズイミダゾリル基(例えば、2-ベンズイミダゾリル基、4-ベンズイミダゾリル基、5-ベンズイミダゾリル基、6-ベンズイミダゾリル基)、ベンゾオキサジアゾリル基(例えば、4-ベンゾ[1,2,5]オキサジアゾリル基、5-ベンゾ[1,2,5]オキサジアゾリル基、4-ベンゾ[1,2,3]オキサジアゾリル基、5-ベンゾ[1,2,3]オキサジアゾリル基)、ベンゾチアジアゾリル基(例えば、4-ベンゾ[1,2,5]チアジアゾリル基、5-ベンゾ[1,2,5]チアジアゾリル基、4-ベンゾ[1,2,3]チアジアゾリル基、5-ベンゾ[1,2,3]チアジアゾリル基)、インドリジニル基(例えば、1-インドリジニル基、2-インドリジニル基、3-インドリジニル基、5-インドリジニル基)、チエノピリジル基(例えば、2-チエノ[2,3-*b*]ピリジル基、3-チエノ[2,3-*b*]ピリジル基、5-チエノ[2,3-*b*]ピリジル基、6-チエノ[2,3-*b*]ピリジル基、2-チエノ[3,2-*b*]ピリジル基、3-チエノ[3,2-*b*]ピリジル基、5-チエノ[3,2-*b*]ピリジル基、6-チエノ[3,2-*b*]ピリジル基)、ピラゾロピリジル基(例えば、2-ピラゾロピリジル基、3-ピラゾロピリジル基、5-ピラゾロピリジル基、6-ピラゾロピリジル基)、イミダゾピリジル基(例えば、1-イミダゾ[1,5-*a*]ピリジル基、3-イミダゾ[1,5-*a*]ピリジル基、5-イミダゾ[1,5-*a*]ピリジル基、7-イミダゾ[1,5-*a*]ピリジル基、2-イミダゾ[1,2-*a*]ピリジル基、3-イミダゾ[1,2-*a*]ピリジル基、5-イミダゾ[1,2-*a*]ピリジル基、7-イミダゾ[1,2-*a*]ピリジル基)、イミダゾピラジル基(例えば、1-イミダゾ[1,5-*a*]ピラジル基、3-イミダゾ[1,5-*a*]ピラジル基、5-イミダゾ[1,5-*a*]ピラジル基、8-イミダゾ[1,5-*a*]ピラジル基、2-イミダゾ[1,2-*a*]ピラジル基、3-イミダゾ[1,2-*a*]ピラジル基、5-イミダゾ[1,2-*a*]ピラジル基、8-イミダゾ[1,2-*a*]ピラジル基)、ピラゾロピリミジル基(例えば、2-ピラゾロ[1,5-*a*]ピリミジル基、3-ピラゾロ[1,5-*a*]ピリミジル基、5-ピラゾロ[1,5-*a*]ピリミジル基、6-ピラゾロ[1,5-*a*]ピリミジル基、2-ピラゾロ[1,5-*c*]ピリミジル基、3-ピラゾロ[1,5-*c*]ピリミジル基、4-ピラゾロ[1,5-*c*]ピリミジル基、5-ピラゾロ[1,5-*c*]ピリミジル基)、トリアゾロピリミジル基(例えば、3-[1,2,3]トリアゾロ[1,5-*a*]ピリミジル基、5-[1,2,3]トリアゾロ[1,5-*a*]ピリミジル基、6-[1,2,3]トリアゾロ[1,5-*a*]ピリミジル基、3-[1,2,3]トリアゾロ[1,5-*c*]ピリミジル基、4-[1,2,3]トリアゾロ[1,5-*c*]ピリミジル基、5-[1,2,3]トリアゾロ[1,5-*c*]ピリミジル基、2-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-

10

20

30

40

50

－a]ピリミジル基、5－[1,2,4]トリアゾロ[1,5－a]ピリミジル基、6－[1,2,4]トリアゾロ[1,5－a]ピリミジル基、7－[1,2,4]トリアゾロ[1,5－a]ピリミジル基、2－[1,2,4]トリアゾロ[1,5－c]ピリミジル基、5－[1,2,4]トリアゾロ[1,5－c]ピリミジル基、7－[1,2,4]トリアゾロ[1,5－c]ピリミジル基、8－[1,2,4]トリアゾロ[1,5－c]ピリミジル基)、チエノチエニル基(例えば、2－チエノ[2,3－b]チエニル基、3－チエノ[2,3－b]チエニル基、2－チエノ[3,2－b]チエニル基、3－チエノ[3,2－b]チエニル基)、イミダゾチアゾリル基(例えば、2－イミダゾ[2,1－b]チアゾリル基、3－イミダゾ[2,1－b]チアゾリル基、5－イミダゾ[2,1－b]チアゾリル基、2－イミダゾ[5,1－b]チアゾリル基、3－イミダゾ[5,1－b]チアゾリル基、5－イミダゾ[5,1－b]チアゾリル基)等が挙げられる。

10

【0049】

「部分的に飽和された単環式芳香族複素環基及び芳香族複素環基が部分的に飽和された単環を有する縮合環式複素環基」としては、例えば、マレイミド基、テトラヒドロベンゾフラニル基、テトラヒドロベンゾチエニル基、テトラヒドロベンゾピロリル基、2,3－ジヒドロ－1H－ベンゾフラニル基、2,3－ジヒドロ－1H－ベンゾチエニル基、2,3－ジヒドロ－1H－インドリル基、2,3－ジヒドロ－1H－インダゾリル基、2,3－ジヒドロ－1H－ベンゾトリアゾリル基、2,3－ジヒドロ－1H－ベンゾオキサゾリル基、2,3－ジヒドロ－1H－ベンゾチアゾリル基、ベンゾ[1,3]オキサチオリル基、ベンゾ[1,3]ジオキサリル基、2H－クロメニル基、クロマニル基、インドリニル基、及びイソインドリニル基等が挙げられる。

20

【0050】

「部分的に飽和された単環を有し、オキソ基で置換された縮合環式複素環基」は、例えば、2－オキソ－1,3－ジヒドロ－1H－インドリル環、3－オキソ－1,2－ジヒドロ－1H－インダゾリル環、2－オキソ－3H－ベンゾオキサゾリル環、2－オキソ－3H－ベンゾチアゾリル環、2－オキソ－ベンゾ[1,3]オキサチオリル環、2－オキソ－ベンゾ[1,3]ジオキサリル環、及び2－オキソ－クロメニル環等が挙げられる。

【0051】

「 C_{3-10} シクロアルキル基」とは、炭素原子数3～10個のシクロアルキル基であり、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、及びアダマンチル基等が挙げられる。

30

【0052】

「 C_{2-12} アルカノイル基」とは、直鎖状又は分枝鎖状の炭素原子数2～12個のアルカノイル基であり、例えば、アセチル基、プロピオニル基、イソプロピオニル基、ブチリル基、及びピバロイル基等が挙げられる。

「 C_{2-12} アルカノイルオキシ基」とは、前記 C_{2-12} アルカノイル基とオキシ基が結合した基を意味し、例えば、アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、及びピバロイルオキシ基等が挙げられる。

【0053】

「 C_{2-12} アルカノイルオキシ C_{1-6} アルキル基」とは、前記 C_{2-12} アルカノイルオキシ基と C_{1-6} アルキル基が結合した基を意味し、例えば、アセチルオキシエチル基、プロピ

40

オニルオキシメチル基、及びピバロイルオキシメチル基等が挙げられる。

「 C_{2-6} アルカノイルアミノ基」とは、前記 C_{2-6} アルカノイル基とアミノ基が結合した基を意味し、例えば、アセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、及びピバロイルアミノ基等が挙げられる。

【0054】

「 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ基」とは、前記 C_{1-6} アルコキシ基が2個結合した基を意味し、例えば、メトキシメトキシ基、メトキシプロポキシ基、エトキシプロポキシ基、及びヘプチルオキシエトキシ基等が挙げられる。

「 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキル基」とは、前記 C_{1-6} アルコキシ基と前記 C_{1-6} アルキル基が結合したものを意味し、例えば、メトキシメチル基、メトキシプロピル基、エトキ

50

シプロピル基、ヘプチルオキシエチル基等が挙げられる。

【0055】

「アリールオキシ基」とは、前記「アリール基」が酸素原子を介して置換する基であり、例えば、フェノキシ基、及びナフトキシ基等が挙げられる。

「 C_{1-6} ヒドロキシアルキル基」とは、1～2個の水酸基が置換した前記 C_{1-6} アルキル基を意味し、例えば、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、及び4-ヒドロキシブチル基等が挙げられる。

【0056】

「 C_{1-10} アルキルチオ基」とは、直鎖状又は分枝鎖状の炭素原子数1～10個のアルキルチオ基であり、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、 n -プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、 n -ブチルチオ基、2-ブチルチオ基、 t -ブチルチオ基、1,1-ジメチルエチルチオ基、 n -ペンチルチオ基、イソペンチルチオ基、1,1-ジメチルプロピルチオ基、及び n -ヘキシルチオ基等が挙げられる。

10

【0057】

「 C_{1-10} ハロアルキルチオ基」とは、前記「 C_{1-10} アルキルチオ基」が1つ又は複数のハロゲン原子で置換されたアルキルチオ基であり、例えば、フルオロメチルチオ基、ジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、2,2,2-トリフルオロエチルチオ基、2,2,2-トリクロロエチルチオ基、ペンタフルオロエチルチオ基、4-フルオロブチルチオ基、4-クロロブチルチオ基、4-ブロモブチルチオ基、及びパーフルオロヘキシルチオ基等が挙げられる。

20

【0058】

「 C_{2-10} アルケニルチオ基」とは、直鎖状又は分枝鎖状の炭素原子数2～10個のアルケニルチオ基であり、例えば、ビニルチオ基、アリルチオ基、 n -プロペニルチオ基、イソプロペニルチオ基、 n -ブテニルチオ基、2-ブテニルチオ基、 n -ペンテニルチオ基、及び n -ヘキセニルチオ基等が挙げられる。

「アリールチオ基」とは、前記「アリール基」が硫黄原子を介して置換する基であり、例えば、フェニルチオ基、及びナフチルチオ基等が挙げられる。

「 C_{2-6} アルケニルチオ基」とは、直鎖状又は分枝鎖状の炭素原子数2～6個のアルケニルチオ基であり、例えば、ビニルチオ基、1-プロペニルチオ基、2-プロペニルチオ基、2-ブテニルチオ基、1,3-ブタジエニルチオ基、2-ペンテニルチオ基、3-ペンテニルチオ基、及び2-ヘキセニルチオ基等が挙げられる。

30

【0059】

「ハロゲン原子で置換されていてもよいアリールスルホニル基」とは、前記アリール基が1つ又は複数のハロゲン原子で置換されていてもよいスルホニル基であり、例えば、フェニルスルホニル基、4-クロロフェニルスルホニル基、4-フルオロフェニルスルホニル基、2,4-ジブロモフェニルスルホニル基、2,4-ジフルオロフェニルスルホニル基、ナフチルスルホニル基、及び6-ブロモナフチルスルホニル基等が挙げられる。

【0060】

「2価の C_{1-10} 脂肪族炭化水素基」とは、 C_{1-10} アルキレン基、 C_{2-10} アルケニレン基、 C_{2-10} アルキニレン基、及び C_{3-10} シクロアルキレン基又は C_{3-10} シクロアルケニレン基を意味する。

40

「 C_{1-10} アルキレン基」とは、直鎖状又は分枝鎖状の炭素原子数1～10個のアルキレン基であり、例えば、 $-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_2-$ 、 $-(CH_2)_3-$ 、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-(CH_2)_3-$ 、 $-(CH(CH_3))_2-$ 、 $-(CH_2)_2-CH(CH_3)-$ 、 $-(CH_2)_3-CH(CH_3)-$ 、 $-(CH_2)_2-CH(C_2H_5)-$ 、 $-(CH_2)_6-$ 、 $-(CH_2)_2-C(C_2H_5)_2-$ 、 $-(CH_2)_3-C(CH_3)_2-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_8-$ 、 $-(CH_2)_3-C(CH_3)_2(CH_2)_3-$ 、及び $-(CH_2)_{10}-$ などが挙げられる。

【0061】

「 C_{2-10} アルケニレン基」とは、鎖中に1個若しくは2個以上の二重結合を有する直鎖状又は分枝鎖状の炭素原子数2～10個のアルケニレン基であり、例えば、前記アルキレ

50

ン基から隣り合った炭素原子の水素原子の2～6個を除いてできる二重結合を有する2価基が挙げられる。

【0062】

「 C_{2-10} アルキニレン基」とは、鎖中に1個若しくは2個以上の三重結合を有する直鎖状又は分枝鎖状の炭素原子数2～10個のアルキニレン基であり、例えば、前記アルケニレン基の二重結合部分の炭素原子から更に水素原子を除いてできる三重結合を有する2価基が挙げられる。

また、「2価の C_{1-10} 脂肪族炭化水素基」には、二重結合及び三重結合が混在することもある。

【0063】

「 C_{3-10} シクロアルキレン基」とは、炭素原子数3～10個のシクロアルカンから任意の2個の水素原子を除いてできる2価基であり、例えば、1,2-シクロペンチレン基、1,2-シクロヘキシレン基、1,3-シクロヘキシレン基、1,4-シクロヘキシレン基、及び1,3-シクロヘプチレン基などが挙げられる。

【0064】

「 C_{3-10} シクロアルケニレン基」とは、炭素原子数3～10個のシクロアルケンから任意の2個の水素原子を除いてできる2価基であり、例えば、3-シクロヘキセン基-1,2-イレン基、及び2,5-シクロヘキサジエン-1,4-イレン基などが挙げられる。

【0065】

「アリーレン基」とは、炭素原子数6～18個の単環～4環式の芳香族炭化水素から任意の2個の水素原子を除いてできる2価基であり、例えば、ベンゼン、ナフタレン、アズレン、フルオレン、フェナントレン、アントラセン、及びピレンから任意の2個の水素原子を除いてできる2価基等が挙げられる。

【0066】

「2価のヘテロ環基」とは、前記の「ヘテロ環基」から更に任意の1個の水素原子を除いてできる2価基であり、例えば、ピラゾリジニル基、オキサニル基、チオラニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、キノリル基、イソキノリル基、チエニル基、ピロリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、フリル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、インドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾイソキサゾリル基、インダゾリル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサジアゾリル基、ベンゾチアジアゾリル基、インドリジニル基、及びチエノピリジル基から任意の1個の水素原子を除いてできる2価基等が挙げられる。

【0067】

「保護された水酸基」とは「水酸基の保護基」で保護された水酸基を意味する。

「保護されたアミノ基」とは「アミノ基の保護基」で保護されたアミノ基を意味する。

「保護されたオキシム基」とは「オキシム基の保護基」で保護されたオキシム基を意味する。

「水酸基の保護基」、「アミノ基の保護基」及び「オキシム基の保護基」とは、トリメチルシリル基、トリエチルシリル基、tert-ブチルジメチルシリル基などのシリル系保護基、若しくはアセチル基、ベンゾイル基などのアシル系保護基、若しくはベンジル基、p-メトキシベンジル基、2-クロロベンジル基などのエーテル系保護基、若しくはベンジルオキシカルボニル基、tert-ブチルオキシカルボニル基などのカーボネート系保護基などが挙げられる。

【0068】

R^{22} 及び R^{23} 、又は R^{24} 及び R^{25} における、「隣接する窒素原子と一緒に環状アミノ基を形成する基」とは、3～8員の飽和環状アミノ基であって、1個の環内メチレン基が酸素原子又はNH基で置換されても良い基であり、例えば、ピペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリノ基等が挙げられる。

【0069】

「アリール基が縮環した C_{3-10} シクロアルキル基」とは、前記 C_{3-10} シクロアルキル基に前記アリール基が縮環した基であり、例えば、インダニル基等が挙げられる。

【0070】

本発明において、医薬上許容される塩とは、細菌感染症の化学療法及び予防において使用される塩を意味する。それらは、たとえば酢酸、プロピオン酸、酪酸、ギ酸、トリフルオロ酢酸、マレイン酸、酒石酸、クエン酸、ステアリン酸、コハク酸、エチルコハク酸、ラクトビオン酸、グルコン酸、グルコヘプトン酸、安息香酸、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、2-ヒドロキシエタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、パラトルエンスルホン酸、ラウリル硫酸、リンゴ酸、アスパラギン酸、グルタミン酸、アジピン酸、システイン、N-アセチルシステイン、塩酸、臭化水素酸、リン酸、硫酸、ヨウ化水素酸、ニコチン酸、シュウ酸、ピクリン酸、チオシアン酸、ウンデカン酸、アクリル酸ポリマー、カルボキシビニルポリマーなどの酸との塩、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩などの無機塩基との塩、モルホリン、ピペリジンなどの有機アミン、アミノ酸との塩を挙げることができる。

10

【0071】

また本発明に係る化合物及びその薬理学的に許容される塩は、水あるいは各種溶媒との付加物の形で存在することもあるが、これらの付加物又は溶媒和物も本発明の塩に含まれる。すなわち、溶媒和物であり、かつ塩である化合物も本発明の塩に含まれる。溶媒和物として、水和物があげられる。また化合物(1)の中には、異性体が存在しうるものがあるが、本発明はこれらを含めて全て可能な異性体及びそれらの混合物を含む。これらの異性体は、公知の方法に従って分離精製できる。

20

【発明の効果】

【0072】

本発明の化合物は、幅広い抗菌活性を示し、特にインフルエンザ菌、エリスロマイシン耐性肺炎球菌などに対しても有効である。

【発明を実施するための最良の形態】

【0073】

本発明の化合物は、例えば以下の方法によって合成することができるが、本発明の化合物の製造方法はこれらに限定されるものではないことはいうまでもない。

30

【0074】

本発明の化合物は、いずれも文献未記載の新規化合物であるが、文献記載の公知の方法又はそれと類似した方法で製造することができる。文献の例として、オーガニック・ファンクショナル・グループ・プレパレーションズ(Organic Functional Group Preparations), S. R. サンドラーら著、アカデミック・プレス・インコーポレイテッド(Academic Press Inc.) (New York and London) (1968)、シンセティック・オーガニック・ケミストリー(Synthetic Organic Chemistry), S. R. ワーグナーら著, (John Wiley) (1961)、コンプリヘンシブ・オーガニック・トランスフォーメーションズ(Comprehensive Organic Transformations), R. C. ラロック著 (1989)、エンサイクロペディア・オブ・レージェント・フォー・オーガニック・シンセシス(Encyclopedia of Reagents for Organic Synthesis), L. A. パケットら著 (1995)、コンペンジウム・オブ・オーガニック・シンセシス・メソッド(Compendium of Organic Synthetic Methods)等があげられる。

40

【0075】

以下に製法の例を示す。

本文中、塩基とは特に示さない限り、有機塩基(例えば、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン若しくは4-ジメチルアミノピリジン等のアミン類、又はナトリウムメトキシド等の金属アルコキシド等)、又は無機塩基(例えば、炭酸ナトリウム若しくは炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、炭酸カルシウム等のアルカリ土類金属炭酸塩、又は水酸化ナトリウム若しくは水酸化カリウム等の金属水酸化物等)のことをいう

50

。

【0076】

溶媒とは特に示さない限り、極性溶媒（例えば、水、メタノール等のアルコール系の溶媒等）、不活性な溶媒（例えば、クロロホルム若しくは塩化メチレン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン若しくは1,4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アセトニトリル等の非プロトン性溶媒、トルエン等の芳香族炭化水素類、又はシクロヘキサン等の炭化水素類等）、又はこれらの混合溶媒をいう。

【0077】

縮合剤とは特に示さない限り、例えば、クロロギ酸エステル(例えば、クロロギ酸イソブチル、クロロギ酸エチル、クロロギ酸メチル等)、酸クロライド(例えば、ピバロイルクロリド、オキサリルクロリド、若しくは2,4,6-トリクロロベンゾイルクロリド等)、又は脱水縮合剤(例えば1-エチル-3-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]カルボジイミド・塩酸塩、ジシクロヘキシルカルボジイミド等のカルボジイミド試薬、カルボニルジイミダゾール、若しくは2-クロロ-1-メチルピリジニウムヨウ化物塩等)等をいう

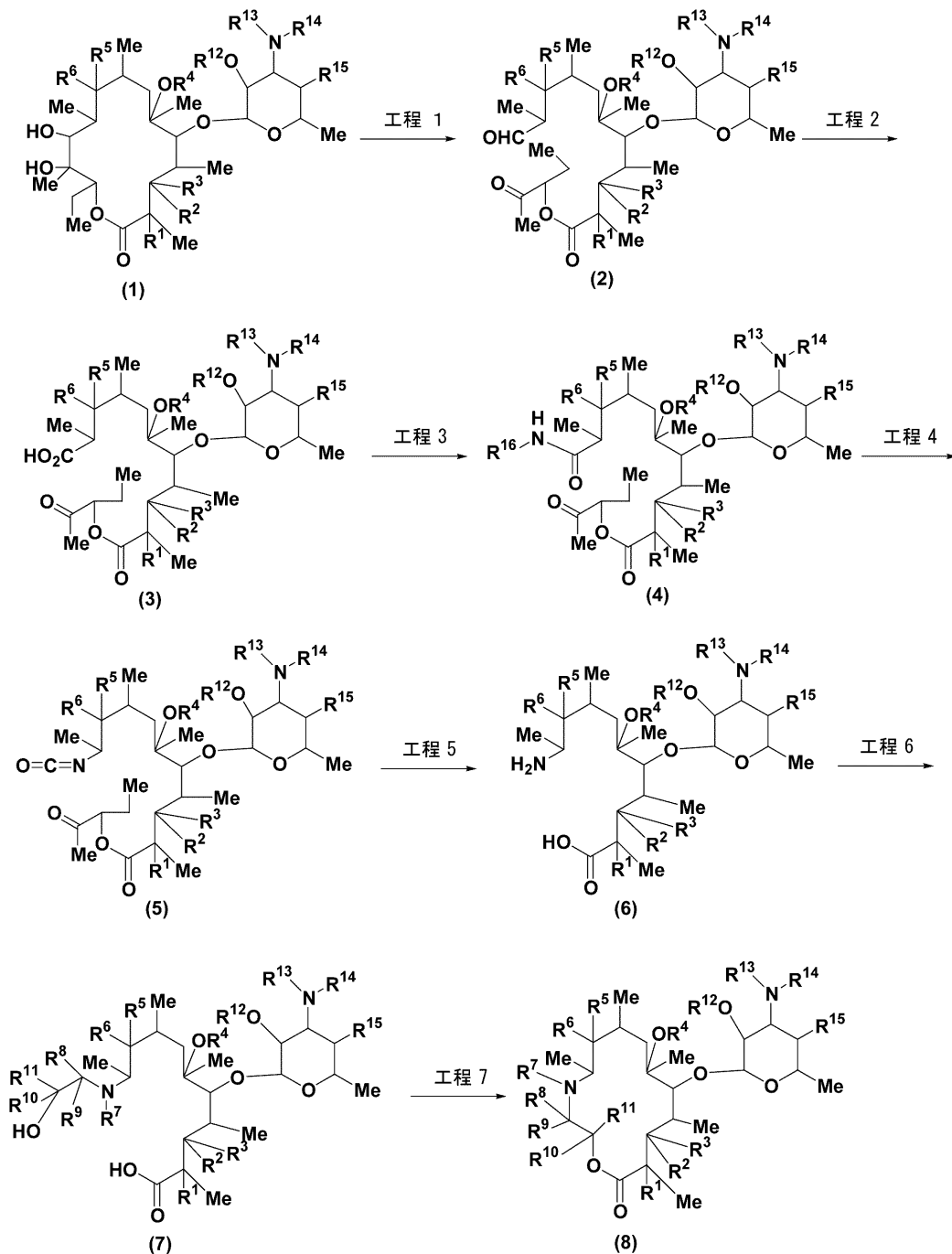
10

。

<スキーム1>

【0078】

【化 5】



【 0 0 7 9 】

(式中、 R^{16} は水素原子又は水酸基を示し、その他の記号は前記と同意義である。)

【 0 0 8 0 】

[工程 1]

式(1)で示されるエリスロマイシン類縁体は、例えば、特許文献(W099/28332、W002/096922、米国特許6420535号明細書、W001/077134、W000/069875、W005/030786及びW004/078770等)に記載された方法によって合成することができる。式(1)で示されるエリスロマイシン類縁体は、 R^5 と R^6 が一緒になってカルボニル基である化合物をヒドリド還元剤などで還元した後に、水酸基を一般的に用いられる官能基変換方法によって他の R^5 及び R^6 で定義される置換基に変換することによっても得ることができる。なお、前記還元剤として、例えばヒドロホウ酸ナトリウム、リチウムトリエチルボロハイドライドが好ましい。式(2)で示される化合物は、式(1)で示される化合物を原料に用いW003/014136号に記載された方法に準拠して、製造することができる。具体的には、酸化剤(例えば

10

20

30

40

50

四酢酸鉛、過ヨウ素酸塩等が挙げられ、この中でも四酢酸鉛が好ましい)を用い、溶媒(この中でもクロロホルムが好ましい)中、室温にて攪拌することにより式(2)で示される化合物を得ることができる。式(1)で示される化合物として、 R^5 が保護された水酸基であり R^6 が水素原子である化合物が好ましい。なお、式(2)で示される化合物は、反応系から単離することなく以下の工程2に用いることが可能である。

【0081】

[工程2]

式(3)で示される化合物は、式(2)で示される化合物を酸化剤の存在下、溶媒中で攪拌することで得ることができる。この反応において酸化剤として、例えば亜塩素酸ナトリウム、過塩素酸ナトリウム、過マンガン酸カリウム等が挙げられ、この中でも亜塩素酸ナトリウムが好ましい。また、溶媒として、クロロホルム、テトラヒドロフラン、tert-ブチルアルコール及び水の混合溶媒が好ましい。反応温度は、例えば、 -20°C から溶媒の沸点の範囲から選択され、この中でも 0°C から室温が好ましい。

10

【0082】

[工程3]

式(4)で示される化合物は、式(3)で示される化合物を有機塩基(トリエチルアミン等のアミン類が好ましい。)の存在下若しくは非存在下、縮合剤(クロロギ酸エステル類が好ましい。)と溶媒(クロロホルムが好ましい。)中で攪拌した後に、 R^{16} が水素原子の場合には例えばアンモニアを加えた後攪拌することによって、 R^{16} が水酸基の場合には例えばヒドロキシルアミンを加えた後攪拌することによって得ることができる。また、アンモニアはアンモニアガスの状態で加えることが好ましいが、溶媒(例えば水、アルコール、ジオキサン等)に溶解した状態で加えても良い。ヒドロキシルアミンは、溶媒(例えば水、アルコール、ジオキサン等が挙げられ、この中でも水が好ましい。)に溶解した状態で用いることができる。反応温度は、例えば、 -20°C から室温の範囲から選択され、この中でも -5°C から 5°C が好ましい。

20

【0083】

[工程4]

式(5)で示される化合物は、 R^{16} が水素原子である式(4)で示される化合物を、ヨードベンゼンジアセテートやヨードベンゼンビストリフルオロアセテート等の存在下に、溶媒中(例えば、酢酸エチル等)で攪拌することで得ることができる。また、式(5)で示される化合物は、 R^{16} が水酸基である式(4)で示される化合物を、スルホニルクロリド(例えば、p-トルエンスルホニルクロリド、メタンスルホニルクロリド等が挙げられ、この中でもp-トルエンスルホニルクロリドが好ましい。)の存在下、溶媒(この中でもテトラヒドロフランが好ましい。)中攪拌することにより得ることもできる。なお化合物(5)は反応系中から単離することなく以下の工程5に用いることが可能である。

30

【0084】

[工程5]

式(6)で示される化合物は、式(5)で示される化合物を金属水酸化物(例えば、水酸化リチウムや水酸化ナトリウム等が挙げられ、この中でも水酸化リチウムが好ましい。)の水溶液中、又はその水溶液とメタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、若しくはテトラヒドロフラン等との混合溶媒中で攪拌することで得ることができる。反応温度は、例えば、 0°C から溶媒の沸点の範囲から選択され、この中でも 0°C から室温が好ましい。

40

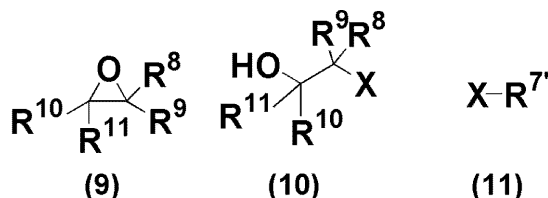
【0085】

[工程6]

工程6では、式(9)～(11)

【0086】

【化 6】



【0087】

(式中Xは脱離基（例えばクロル基、ブロム基、ヨード基、メタンスルホニルオキシ基等）を示し、 $R^{7'}$ は水素原子以外の R^7 で定義される基を示し、その他の記号は前記と同意義である。）で示される化合物を反応に用いることが好ましい。

10

【0088】

R^7 が水素原子である式(7)で示される化合物は、式(6)で示される化合物に、式(9)で示されるエポキシドをルイス酸（例えばイッテルビウムトリフラート）の存在下若しくは非存在下に、溶媒中（この中でもテトラヒドロフランが好ましい。）で加熱下反応させること又は、式(6)で示される化合物と、式(10)で示される化合物を塩基の存在下、不活性な溶媒中で加熱下反応することで得ることができる。

【0089】

R^7 が水素原子以外である式(7)で示される化合物は、上記方法により得た R^7 が水素原子である式(7)で示される化合物と、対応するアルデヒド及びヒドリド還元剤（例えば、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム、若しくはシアノ化ホウ素ナトリウム等）を溶媒中攪拌する方法、又は、塩基の存在下で、式(11)で示される化合物と不活性な溶媒中反応する方法で得ることができる。上記の反応の反応温度は、例えば、 0°C から溶媒の沸点の範囲から選択される。

20

【0090】

[工程7]

R^7 が水素原子である式(7)で示される化合物を原料として用いて、ホスフィン試薬（例えばトリフェニルホスフィン等）の存在下に、光延試薬（例えばジエチルアゾジカルボキシラート、ジイソプロピルアゾジカルボキシラート等）と不活性な溶媒（この中でもテトラヒドロフランが好ましい。）中で反応させることによって、 R^7 が水素原子である式(8)で示される化合物を得ることができる。この場合、反応温度は、例えば、 0°C から室温の範囲から選択され、室温が好ましい。

30

【0091】

R^7 が水素原子である式(8)で示される化合物を対応するアルデヒド及びヒドリド還元剤（例えば、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム、シアノ化ホウ素ナトリウム等）と溶媒中で反応させる方法、又は塩基存在下、式(11)で示される化合物と不活性な溶媒中で反応させる方法によって R^7 が水素原子以外である式(8)の化合物を得ることができる。

【0092】

R^7 が水素原子以外である式(7)で示される化合物を有機塩基（トリエチルアミン等のアミン類が好ましい。）の存在下、縮合剤（2, 4, 6-トリクロロベンゾイルクロリドが好ましい。）と溶媒（テトラヒドロフランが好ましい。）中で反応させて得た反応溶液を塩基（4-ジメチルアミノピリジンが好ましい。）の溶媒（この中でもアセトニトリルが好ましい。）溶液と反応させることにより R^7 が水素原子以外である式(8)で示される化合物を得ることができる。反応温度は、例えば、 0°C から溶媒の沸点の範囲から選択される。

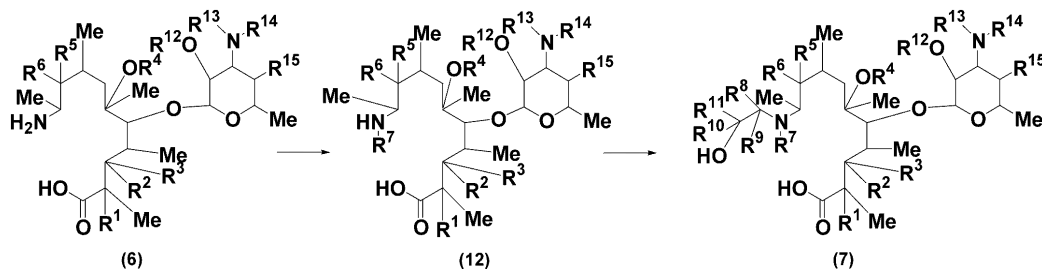
40

【0093】

<スキーム2>

【0094】

【化 7】



【 0 0 9 5 】

(式中、各記号は前記と同意義である。)

10

スキーム 1 の式 (7) で示される化合物は、スキーム 2 に示すように式 (6) で示される化合物を、対応するアルデヒド及びヒドリド還元剤（例えば、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム、若しくはシアノ化ホウ素ナトリウム等）と溶媒中攪拌する方法、塩基の存在下、式 (11) で示される化合物と不活性な溶媒中反応させる方法によって式 (12) で示される化合物とした後に、式 (9) で示されるエポキシドと、ルイス酸（例えばイッテルビウムトリフラート）の存在下に、溶媒中（この中でもテトラヒドロフランが好ましい。）で加熱下反応させる方法、又は塩基存在下、式 (10) で示される化合物と不活性な溶媒中で加熱下反応させることで得ることもできる。

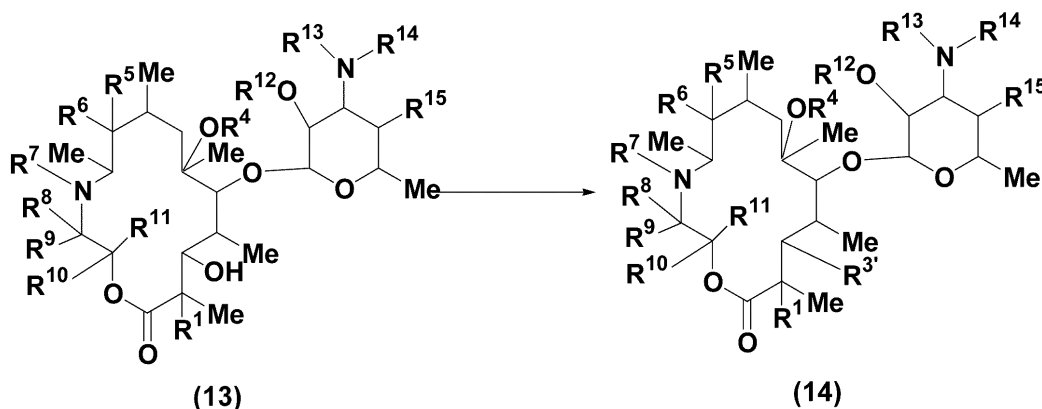
【 0 0 9 6 】

<スキーム 3>

20

【 0 0 9 7 】

【化 8】



【 0 0 9 8 】

(式中、 $R^{3'}$ は式 $-X^{031'}-R^{031}$ で示される基、式 $-X^{031'}-A^{031}-X^{032}-R^{031}$ で示される基、式 $-X^{031'}-A^{031}-X^{032}-A^{032}-X^{033}-R^{031}$ で示される基又は式 $-X^{031'}-A^{031}-X^{032}-A^{032}-X^{033}-A^{033}-X^{034}-R^{031}$ で示される基であり、ここで、 $X^{031'}$ は、式 $-OCO-$ で示される基、式 $-OCO_2-$ で示される基又は式 $-OCON(R^{20})-$ で示される基であり、 A^{031} 、 X^{032} 、 A^{032} 、 X^{033} 、 A^{033} 、 X^{034} 、 R^{031} は前記と同意義である。

その他の式中の各記号は前記と同意義である。)

40

【 0 0 9 9 】

$X^{031'}$ が式 $-OCO-$ である式 (14) で示される化合物は、特許文献（米国特許6191118号明細書、WO04/101584、及びWO05/030786等）に記載された方法に準拠した方法により得ることができる。すなわち、 $X^{031'}$ が式 $-OCO-$ である式 (14) で示される化合物は、式 (13) で示される化合物を、対応するカルボン酸及び縮合剤の存在下、又

50

は、対応する酸無水物若しくは対応する酸クロリドと塩基存在下、もしくは非存在下に、不活性な溶媒中で反応させる方法で得ることができる。反応温度は、例えば、0℃から溶媒の沸点の範囲から選択される。また、 $X^{031'}$ が式 $-OCON(R^{20})-$ である式 (14) で示される化合物は、米国特許523399号明細書に記載の方法に準拠した方法で得ることができる。すなわち、式 (13) で示される化合物とカルボニルジイミダゾールを不活性溶媒中、0℃から溶媒の沸点の温度で反応させた後に対応するアミンを加える方法、又はトリホスゲンと塩基存在下に、不活性溶媒中で反応させた後に、対応するアミンを加える方法、又は式 (13) で示される化合物と対応するイソシアネートを不活性溶媒中で反応させる方法により、 $X^{031'}$ が式 $-OCON(R^{20})-$ である式 (14) で示される化合物を得ることができる。また、 $X^{031'}$ が式 $-OCO_2-$ である式 (14) で示される化合物は、特許文献WO93/013116号、WO93/021200号又はWO93/021199号等に記載の方法に準拠した方法により得ることができる。すなわち、式 (13) で示される化合物とトリホスゲンを塩基存在下に不活性溶媒中で反応させた後に、対応するアルコールと反応させる方法により $X^{031'}$ が式 $-OCO_2-$ である式 (14) で示される化合物を得ることができる。反応温度は、例えば、0℃から溶媒の沸点の範囲から選択される。

【0100】

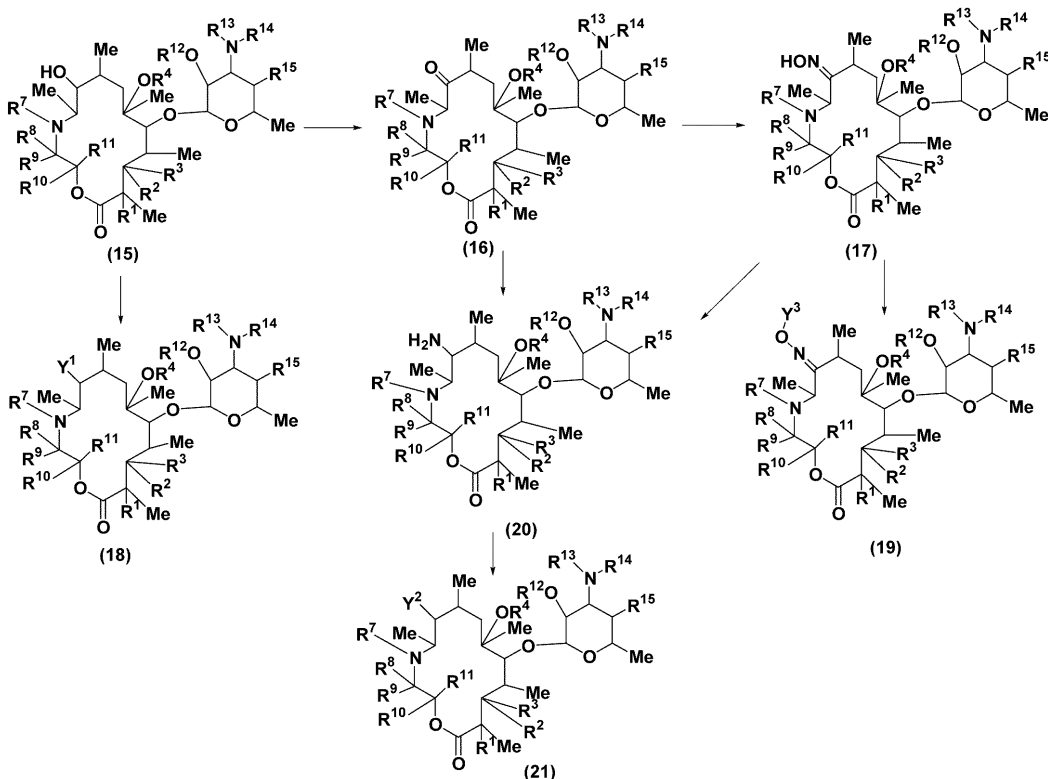
また、スキーム1の式(8)で示される化合物のうちスキーム4中に示される化合物は、スキーム1で示す工程だけでなくスキーム4で示す工程によってでも得ることができる。

【0101】

<スキーム4>

【0102】

【化9】



【0103】

(式中、 Y^1 は、

式 $-X^{061'}-R^{061}$ で示される基、

式 $-X^{061'}-A^{061}-X^{062}-R^{061}$ で示される基、

式 $-X^{061'}-A^{061}-X^{062}-A^{062}-X^{063}-R^{061}$ で示される基又は

式 $-X^{061'}-A^{061}-X^{062}-A^{062}-X^{063}-A^{063}-X^{064}-R^{061}$ で示される基であり、

ここで $X^{061'}$ は、

式-O-で示される基、
 式-O-C-O-で示される基、
 式-O-C-O₂-で示される基又は
 式-O-C-O-N(R²⁰)-で示される基であり、
 A⁰⁶¹、X⁰⁶²、A⁰⁶²、X⁰⁶³、A⁰⁶³、X⁰⁶⁴、R⁰⁶¹、R²⁰は前記と同意義である。

Y²は、

式-X⁰⁶¹'-'-R⁰⁶¹で示される基、
 式-X⁰⁶¹'-'-A⁰⁶¹-X⁰⁶²-R⁰⁶¹で示される基、
 式-X⁰⁶¹'-'-A⁰⁶¹-X⁰⁶²-A⁰⁶²-X⁰⁶³-R⁰⁶¹で示される基又は
 式-X⁰⁶¹'-'-A⁰⁶¹-X⁰⁶²-A⁰⁶²-X⁰⁶³-A⁰⁶³-X⁰⁶⁴-R⁰⁶¹で示される基であり 10

、

ここで X⁰⁶¹'-'は、
 式-N(R²⁰)-で示される基、
 式-N(R²⁰)-C-O-で示される基、
 式-N(R²⁰)-C-O₂-で示される基、
 式-N(R²⁰)-C-O-N(R²¹)-で示される基又は
 式-N(R²⁰)-S-O₂-で示される基であり、
 A⁰⁶¹、X⁰⁶²、A⁰⁶²、X⁰⁶³、A⁰⁶³、X⁰⁶⁴、R⁰⁶¹、R²⁰、R²¹は前記と同意義である。

る。

Y³は、

R⁰⁶²で示される基、
 式-A⁰⁶⁴-X⁰⁶⁶-R⁰⁶²で示される基、
 式-A⁰⁶⁴-X⁰⁶⁶-A⁰⁶⁵-X⁰⁶⁷-R⁰⁶²で示される基又は
 式-A⁰⁶⁴-X⁰⁶⁶-A⁰⁶⁵-X⁰⁶⁷-A⁰⁶⁶-X⁰⁶⁸-R⁰⁶²で示される基であり、
 A⁰⁶⁴、X⁰⁶⁶、A⁰⁶⁵、X⁰⁶⁷、A⁰⁶⁶、X⁰⁶⁸、R⁰⁶²は前記と同意義である。
 その他の各記号は前記と同意義である。)

【0104】

式(16)で示される化合物は式(15)で示される化合物を例えばスワン酸化、コーリー-キム酸化等によって酸化することによって得られる。

【0105】

式(17)で示される化合物は式(16)で示される化合物とヒドロキシルアミン塩酸塩等のヒドロキシルアミンの塩若しくはヒドロキシルアミンを塩基の(この中でもイミダゾールが好ましい。)存在下若しくは非存在下に溶媒(メタノールが好ましい。)中反応させることで得られる。

【0106】

式(20)で示される化合物は式(16)で示される化合物を原料として用い、文献(Tetrahedron Letters, 1971年, 2巻, 195ページ、Tetrahedron Letters, 1972年, 1巻, 29ページ)に記載された方法に準拠した方法、すなわちカルボニル基を極性溶媒中ヒドラジンと反応させてヒドラゾノ基にした後、亜硝酸ナトリウム等と反応させることによって、又は溶媒中ヒドロシアミンと反応させオキシム基にした後、塩化チタン等と反応させることによって得られたイミノ体をヒドリド還元剤などで還元することによって得られる。

【0107】

式(19)で示される化合物は式(17)で示される化合物を原料として用い、クラウンエーテル(例えば18-クラウン-6-エーテル等)の存在、又は非存在下、欧州特許284203号公報、又はW093/13116に記載された方法に準拠した方法、すなわち、対応するアルキルハライド等と塩基の存在、又は非存在下に不活性な溶媒中で反応させることで得られる。

【0108】

式(21)で示される化合物は式(20)で示される化合物と対応する酸クロライド、対応 50

する酸無水物、対応するスルホニルクロリド、対応するイソシアネート、対応するクロロホルメート等を塩基存在、又は非存在下、不活性な溶媒中反応させることで得られる。

【0109】

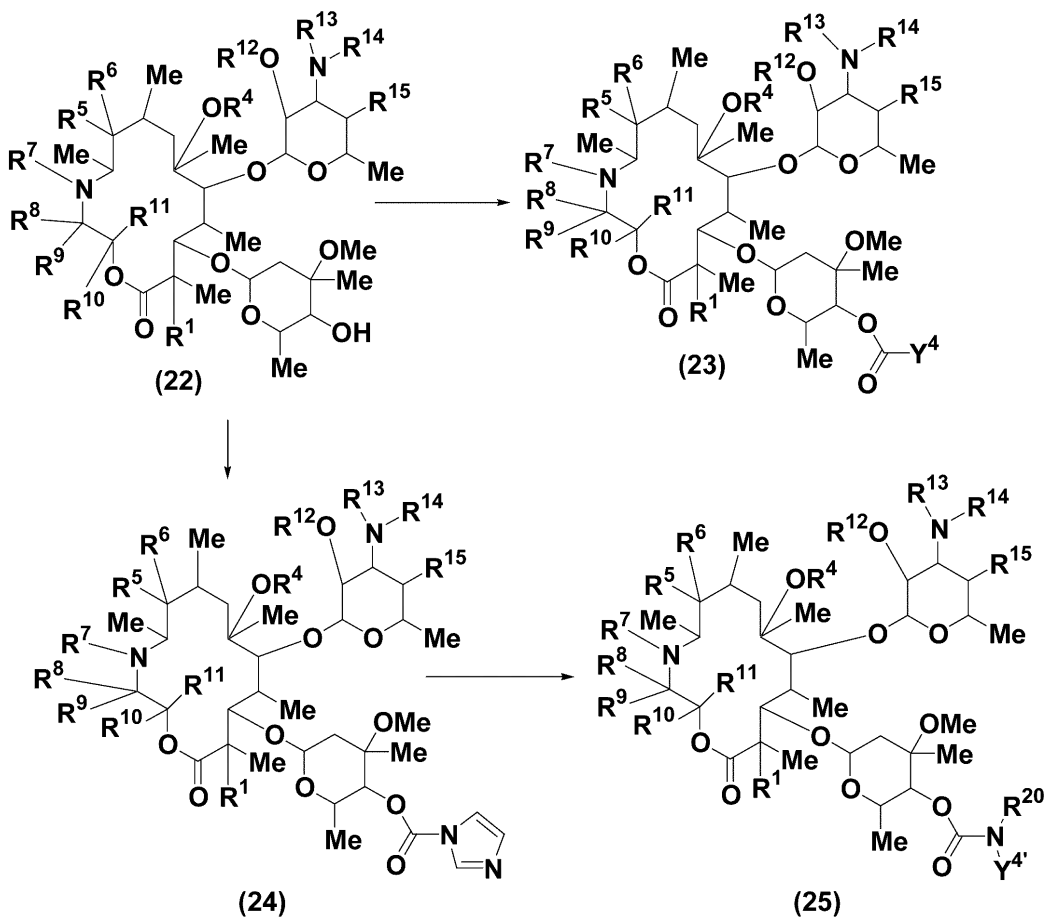
式(18)で示される化合物は式(15)で示される化合物と対応するアルキルハライド、対応する酸クロライド、対応する酸無水物、対応するイソシアネート、対応するクロロホルメート等を塩基存在、又は非存在下、不活性な溶媒中反応させることで得られる。

【0110】

<スキーム5>

【0111】

【化10】



【0112】

(式中、 Y^4 及び $Y^{4'}$ は、

R^{331} で示される基、

式 $-A^{331}-X^{332}-R^{331}$ で示される基、

式 $-A^{331}-X^{332}-A^{332}-X^{333}-R^{331}$ で示される基又は

式 $-A^{331}-X^{332}-A^{332}-X^{333}-A^{333}-X^{334}-R^{331}$ で示される基であり、

A^{331} 、 X^{332} 、 A^{332} 、 X^{333} 、 A^{333} 、 X^{334} 、及び R^{331} は前記と同意義である。

その他の各記号は前記と同意義である。)

【0113】

式(23)で示される化合物は式(22)で示される化合物を原料に用い、欧州特許895999号公報に記載された方法に準拠した方法、すなわち対応するカルボン酸と一般的に用いられる方法によって縮合することで得られる。

【0114】

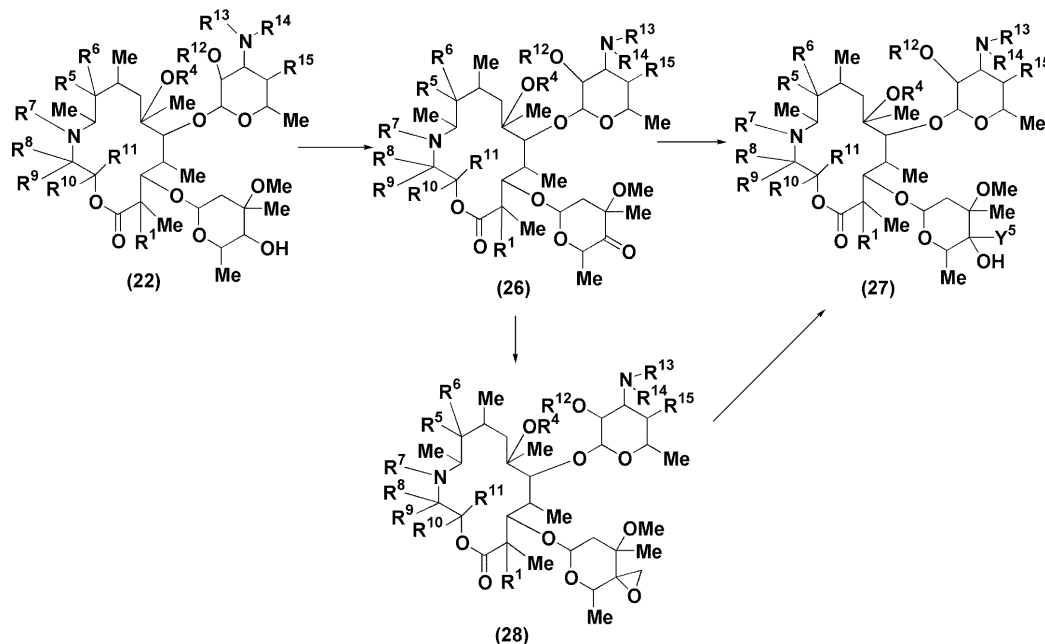
また式(25)で示される化合物は式(22)で示される化合物を原料に用い、欧州特許895999号公報に記載された方法に準拠した方法、すなわち、式(24)で示されるイミダゾカルボニル体を経由して対応するアミンと反応させることで得られる。

【0115】

<スキーム6>

【0116】

【化11】



10

20

【0117】

(式中、 Y^5 は、式- $X^{335}-R^{332}$ で示される基、式- $X^{335}-A^{334}-X^{336}-R^{332}$ で示される基、式- $X^{335}-A^{334}-X^{336}-A^{335}-X^{337}-R^{332}$ で示される基又は式- $X^{335}-A^{334}-X^{336}-A^{335}-X^{337}-A^{336}-X^{338}-R^{332}$ で示される基であり、 X^{335} 、 A^{334} 、 X^{336} 、 A^{335} 、 X^{337} 、 A^{336} 、 X^{338} 、 R^{332} は前記と同意義である。

その他の各記号は前記と同意義である。)

式(27)で示される化合物は、式(22)で示される化合物を例えばスワン酸化、コーリー-キム酸化等で酸化することによって得られる式(26)で示される化合物を経由して、特表2000-514097号公報に記載された方法に準拠した方法、すなわち対応するグリニヤール試薬等と当業者に周知の方法で反応することで、あるいは、式(28)で示されるエポキシ体を経由して対応するアミン等と反応させることで得られる。

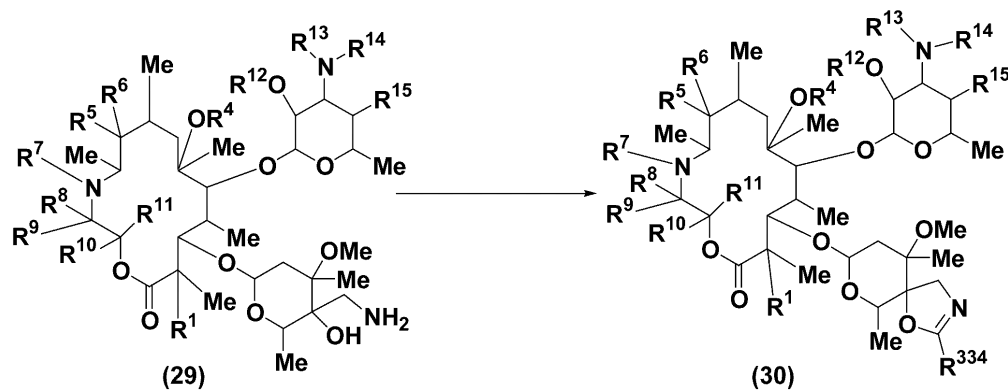
30

【0118】

<スキーム7>

【0119】

【化12】



40

【0120】

(式中、各記号は前記と同意義である。)

50

【0121】

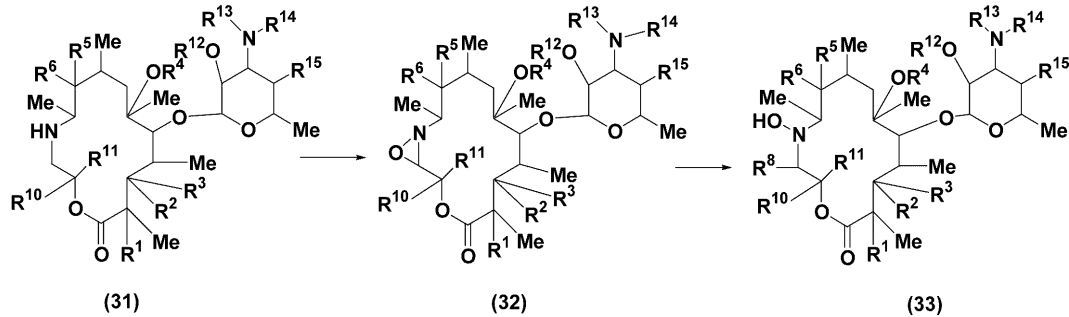
式(30)で示される化合物は、式(29)で示される化合物を、特表2000-514097号公報に記載された方法に準拠した方法、すなわち、塩基、酸若しくはルイス酸の存在下に溶媒中で、式 $R^{334}-CN$ 、 $R^{334}-CO_2H$ 、又は $R^{334}-C=NH(OCH_3)$ 等の試薬と室温から溶媒の沸点の温度で反応させることで得ることができる。

【0122】

<スキーム8>

【0123】

【化13】



10

【0124】

(式中、各記号は前記と同意義である。)

20

【0125】

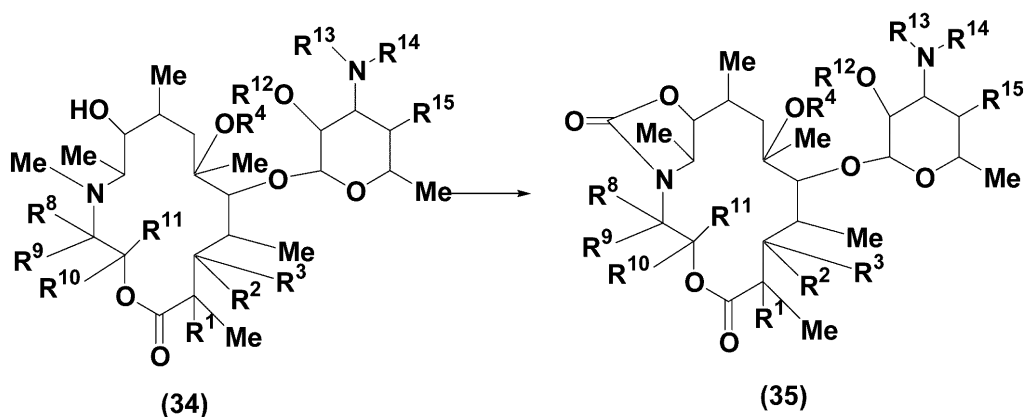
式(33)で示される化合物は、式(31)で示される化合物を文献(The Journal of Antibiotics, 1998年, 8巻, 1029頁)に記載された方法に準拠した方法、すなわち、酸化後、トリフェニルホスフィンで処理することによって式(32)で示される化合物に導いた後、W001/074792号に記載された方法に準拠した方法、すなわち、対応するグリニヤール試薬等と反応させることによって得ることができる。

【0126】

<スキーム9>

【0127】

【化14】



30

40

【0128】

(式中、各記号は前記と同意義である。)

式(35)で示される化合物は、式(34)で示される化合物をクロロギ酸エステル、トリホスゲン等と塩基(ピリジンが好ましい。)の存在下で、溶媒(この中でもクロロホルムが好ましい。)中反応させることによって得ることができる。

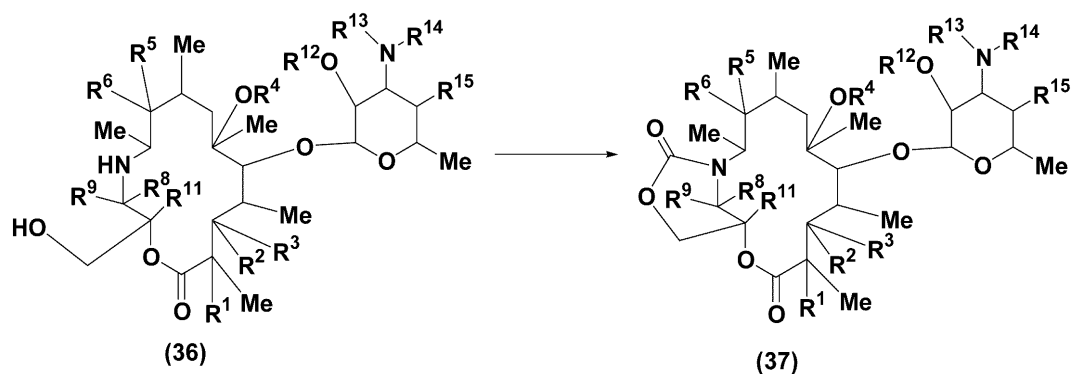
【0129】

<スキーム10>

50

【0130】

【化15】



10

【0131】

(式中、各記号は前記と同意義である。)

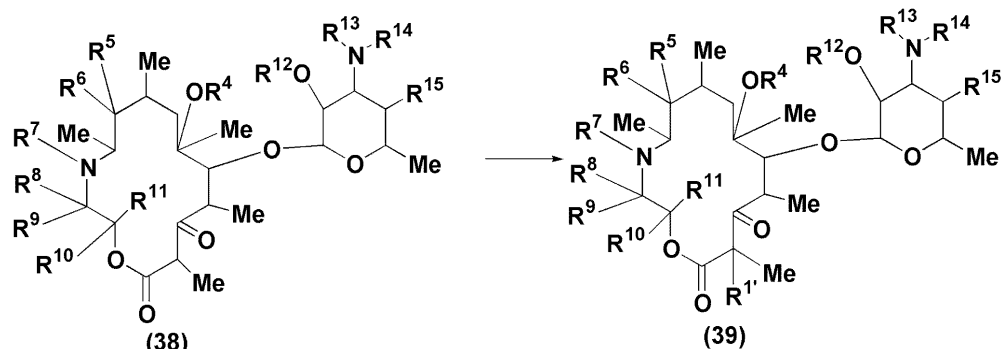
式(37)で示される化合物は、式(36)で示される化合物をトリホスゲン等と塩基(ピリジンが望ましい)存在下、不活性溶媒(クロロホルム又はジクロロメタンが望ましい)中反応させることによって得ることができる。

【0132】

<スキーム11>

【0133】

【化16】



30

【0134】

(式中、R^{1'}はハロゲン原子を示し、その他の各記号は前記と同意義である。)

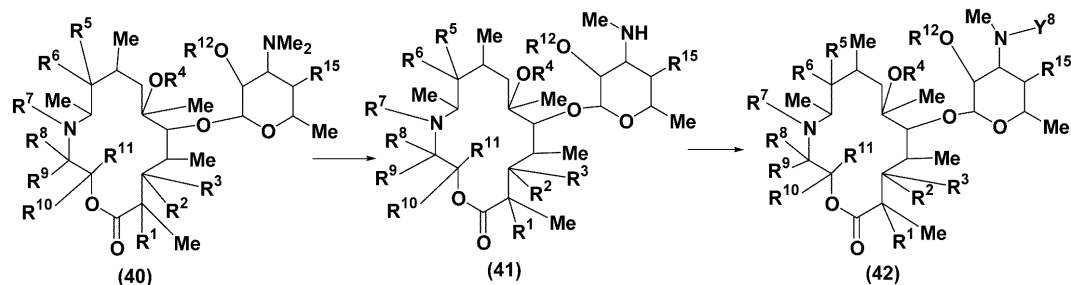
式(39)で示される化合物は、式(38)で示される化合物をW000/069875号に記載された方法に準拠した方法、すなわち、塩基の存在若しくは非存在下、対応するハロゲン化試薬等(例えばN-フルオロベンゼンスルホンイミド等)を不活性な溶媒中反応させることで得ることができる。

【0135】

<スキーム12>

【0136】

【化17】



40

【0137】

(式中、Y⁸は、

50

式 $-X^{131}-R^{131}$ で示される基、
 式 $-X^{131}-A^{131}-X^{132}-R^{131}$ で示される基、
 式 $-X^{131}-A^{131}-X^{132}-A^{132}-X^{133}-R^{131}$ で示される基又は
 アミノ基の保護基であり、
 X^{131} 、 A^{131} 、 X^{132} 、 A^{132} 、 X^{133} 、及び R^{131} は前記と同意義である。
 その他の各記号は前記と同意義である。)

【0138】

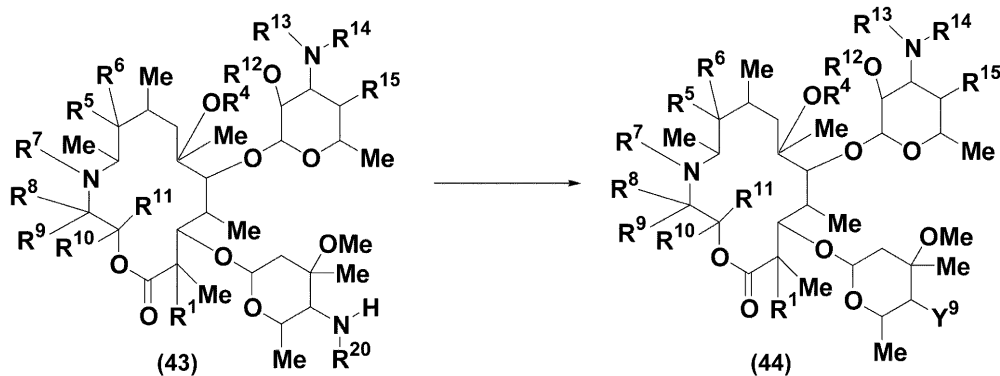
式(42)で示される化合物は、式(40)で示される化合物をW004/013153号に記載された方法に準拠した方法、すなわち、式(41)で示されるデメチル体に導いた後、対応する試薬を塩基存在、又は非存在下、不活性な溶媒中反応させることで得ることができる。

【0139】

<スキーム13>

【0140】

【化18】



【0141】

(式中、 Y^9 は、

式 $-X^{331'}-R^{331}$ で示される基、

式 $-X^{331'}-A^{331}-X^{332}-R^{331}$

式 $-X^{331'}-A^{331}-X^{332}-A^{332}-X^{333}-R^{331}$

式 $-X^{331'}-A^{331}-X^{332}-A^{332}-X^{333}-A^{333}-X^{334}-R^{331}$ で示される基であり、

ここで $X^{331'}$ は

式 $-N(R^{20})-$ で示される基、

式 $-N(R^{20})CO-$ で示される基、

式 $-N(R^{20})CO_2-$ で示される基、

式 $-N(R^{20})CON(R^{21})-$ で示される基又は

式 $-N(R^{20})SO_2-$ で示される基であり、

A^{331} 、 X^{332} 、 A^{332} 、 X^{333} 、 A^{333} 、 X^{334} 、及び R^{331} は前記と同意義である。その他の各記号は前記と同意義である。)

【0142】

式(43)で示される化合物は、欧州特許549040号公報に記載された方法に準拠した方法、すなわち式(26)で示される化合物を原料に用い、溶媒中対応するアンモニウム塩の存在下、酸存在下(例えば酢酸等)若しくは非存在下、生成するイミノ基をヒドリド還元剤(例えば、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム、若しくはシアノ化ホウ素ナトリウム等)によって還元することによって得ることができる。

R^{20} が水素原子の場合には、式(26)で示される化合物を溶媒中ヒドロキシアミンと反応させオキシム体にした後、酸化白金やラネーニッケルなどの還元剤にて水素添加反応すること、又は塩化チタン等と反応させることによって得られたイミノ体をヒドリド還元剤(例えば、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム、若しくはシアノ化ホウ素ナトリウム

ム等)で還元することによっても得ることができる。

【0143】

式(44)で示される化合物のうち $X^{331'}$ が式-NH-の化合物は、式(43)で示される化合物を原料に用い、対応するアルデヒド及びヒドリド還元剤(例えば、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム、若しくはシアノ化ホウ素ナトリウム等)と溶媒中攪拌する方法、対応するハライド、スルホニルオキシ体などと塩基の存在下、不活性な溶媒中(N,N'-ジメチルホルムアミドが好ましい)反応させることで得ることができる。また、式(44)で示される化合物のうち $X^{331'}$ が式-N(R²⁰)-の化合物は、上記 $X^{331'}$ が式-NH-の化合物を原料に用い、対応するアルデヒド及びヒドリド還元剤(例えば、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム、若しくはシアノ化ホウ素ナトリウム等)と溶媒中攪拌する方法でも得ることができる。また、式(44)で示される化合物のうち $X^{331'}$ が式-N(R²⁰)-CO-である化合物は、式(44)で示される化合物を、対応するカルボン酸及び縮合剤の存在下、又は、対応する酸無水物若しくは対応する酸クロリドと塩基存在下、もしくは非存在下に、不活性な溶媒中で反応させる方法で得ることができる。また、式(44)で示される化合物のうち $X^{331'}$ が式-N(R²⁰)-CO₂-の化合物は式(43)で示される化合物を原料に用い、不活性な溶媒中で対応するクロロホルメート試薬を反応することで得ることができる。また、式(44)で示される化合物のうち $X^{031'}$ が式-N(R²⁰)-CON(R²¹)-の化合物は式(43)で示される化合物を原料に用い、不活性な溶媒中(N,N'-ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン若しくはクロロホルム、ジクロロメタンが好ましい)でN,N'-カルボニルジイミダゾール若しくはトリホスゲンと反応させた後に対応するアミン試薬と反応させる方法、不活性な溶媒中で、式(29)で示される化合物に対応するイソシアネート試薬を反応させる方法でも得ることができる。また、式(44)で示される化合物のうち $X^{331'}$ が式-N(R²⁰)-SO₂-である化合物は式(43)で示される化合物を原料に用い、不活性な溶媒中(クロロホルムやジクロロメタンが好ましい)で塩基存在下(トリエチルアミン、若しくはピリジンが好ましい)若しくは非存在下対応するクロロスルホニル試薬を反応することで得ることができる。

【0144】

本合成法の式(1)~(44)で示される化合物中の水酸基、アミノ基、カルボキシル基、オキシム基は選択的に除去可能な当該分野において公知の保護基により保護されても良く、所望の段階で脱保護することで、式(I)で表される10a-アザライド化合物、及び式(II)で表される10a-アザライドを合成するための中間体を供給することができる。公知の保護基としては、トリメチルシリル基、トリエチルシリル基、及びtert-ブチルジメチルシリル基等のシリル系保護基、アセチル基、及びベンゾイル基等のアシル系保護基、若しくはベンジル基、p-メトキシベンジル基、及び2-クロロベンジル基等のエーテル系保護基、若しくはベンジルオキシカルボニル基、tert-ブチルオキシカルボニル基等のカーボネート系保護基等があげられるが、その他にもProtective Groups in Organic Syntheses(第3版, 1999年, P.G.M.Wuts, T.Green 編)等に記載の保護基を用いることが可能である。また、本合成法の式(1)~(44)で示される化合物の置換基は公知の方法により、相互に変換可能である。

【0145】

本発明の化合物の製造方法は上記の方法又は実施例に具体的に示した方法によって限定されることは無く、本発明化合物を中間体として、公知の手段により、置換基を相互に変換することも可能である。

【0146】

上記各製造方法における中間体及び目的化合物は、有機合成化学で常用される生成法、例えば中和、濾過、抽出、洗浄、乾燥、濃縮、酢酸エチル、酢酸エチルーヘキサン、イソプロピルアルコール、エタノール、含水エタノール、アセトン、又は含水アセトン等の溶媒を用いた再結晶、各種クロマトグラフィー等に付して単離精製することができる。また、中間体においては、特に精製することなく、次の反応に供することも可能である。

【0147】

また化合物(I)及び化合物(II)の中には、異性体が存在しうるものがあるが、本発明はこれらを含めて全て可能な異性体及びそれらの混合物を含む。

【0148】

また本発明に係る化合物及びその薬理学的に許容される塩は、水あるいは各種溶媒との付加物の形で存在することもあるが、これらの付加物も本発明の塩に含まれる。

【実施例】

【0149】

次に、参考例、実施例及び試験例にて本発明を更に詳細に説明する。

参考例1 ベンジル(オキシラン-2-イルメチル)カルバミン酸の合成

10

特許文献(W002/072068)に記載の方法にて得られたN-ベンジルオキシカルボニル-3-アミノ-1,2-プロパンジオール5gをピリジン20mlに溶解し、p-トルエンスルホニルクロリド4.66gを加えた。室温にて3時間攪拌後、さらにp-トルエンスルホニルクロリド2.3gを加えて室温にて2.5日間攪拌した。反応液に2規定塩酸と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をメタノール100mlに溶解し、炭酸カリウム8.32gを加えて室温にて2.5時間攪拌した。反応液に蒸留水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=2:1)にて精製して標記化合物4.35gを得た。

20

MS(ESI)m/z=230.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ(ppm): 2.60(dd, J=4.66, 2.64Hz, 1H) 2.79(t, J=4.35Hz, 1H) 3.07-3.16(m, 1H) 3.22-3.34(m, 1H) 3.57-3.69(m, 1H) 4.93(s, 1H) 5.12(s, 2H) 7.27-7.46(m, 5H)

【0150】

参考例2 2-(3-ブロモフェニル)-N-{2-[(2R)-オキシラン-2-イル]エチル}アセトアミドの合成

(1) 4-ブロモ-1-ブテン25gをジメチルスルホキシド160mlに溶解し、アジ化ナトリウム18.1gを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液に蒸留水とジエチルエーテルを加えて分液し、有機層を蒸留水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を常圧濃縮して4-アジド-1-ブテン8.43gを得た。

30

【0151】

(2) 上記(1)で得られた化合物1.00gをテトラヒドロフラン20mlに溶解し、トリフェニルホスフィン2.94gを加えて室温にて45分間攪拌した。蒸留水0.93mlを加えて18時間攪拌後、氷冷下、3-ブロモフェニル酢酸2.77g、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール1.98g、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩3.55gを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えて酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=2:1から1:1)にて精製してアミド体1.90gを得た。

【0152】

40

(3) ヘキサシアノ鉄(III)酸カリウム57.1g、炭酸カリウム24.0g、ヒドロキニジン1,4-フタラジンジイルジエーテル450mg、オスミウム(VI)酸カリウム二水和物42.6mgをt-ブチルアルコール270mlと蒸留水300mlの混合溶媒に溶解し、氷冷下、上記(2)で得られた化合物15.5gのt-ブチルアルコール溶液30mlを加えた。氷冷下4時間攪拌した後、亜硫酸水素ナトリウムを発泡しなくなるまで加えた。クロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルムからクロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)にて精製してジオール体17.6gを得た。

【0153】

(4) 上記(3)で得られた化合物17.5gを原料として参考例1と同様の方法にて標記化

50

合物8.43gを得た。

MS(ESI) $m/z=306.1[M+Na]^+$

^1H -NMR(600MHz, $CDCl_3$) δ (ppm): 1.42-1.58(m, 1H) 1.86-1.97(m, 1H) 2.36-2.49(m, 1H) 2.67-2.76(m, 1H) 2.86-2.95(m, 1H) 3.39(q, $J=6.11$ Hz, 2H) 3.49(s, 2H) 5.80-5.95(m, 1H) 7.07-7.44(m, 4H)

【0154】

参考例3 2-(3-ブロモフェニル)-N-[2-(2-オキシラン-2-イル)エチル]アセトアミドの合成

(1) 文献(Heterocycles, 2003年, 61巻, 481ページ)に記載の方法にて得られた4-アジドブタン-1,2-ジオール2.0gをメタノール10mlに溶解し、5%パラジウム-炭素0.4g、2規定塩酸2mlを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて4時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して4-アミノブタン-1,2-ジオール塩酸塩1.8gを得た。

【0155】

(2) 3-ブロモフェニル酢酸3.05gをクロロホルム30mlに溶解し、氷冷下、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩2.72gを加えてそのまま30分間攪拌した。上記(1)で得られた化合物1.67gのメタノール溶液10mlを反応液に滴下し、室温にて5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1)にて精製してアミド体2.58gを得た。

【0156】

(3) 上記(2)で得られた化合物2.48gを原料として参考例1と同様の方法にて標記化合物0.97gを得た。

^1H -NMR(300MHz, $CDCl_3$) δ (ppm): 1.45-1.58(m, 1H) 1.90-2.02(m, 1H) 2.46(dd, $J=4.74, 2.56$ Hz, 1H) 2.71-2.76(m, 1H) 2.89-2.97(m, 1H) 3.41(q, $J=6.22$ Hz, 2H) 3.52(s, 2H) 5.79(s, 1H) 7.19-7.25(m, 2H) 7.38-7.49(m, 2H)

【0157】

参考例4 (2R)-4-アミノブタン-1,2-ジオールの合成

文献(Heterocycles, 2003年, 61巻, 481ページ)に記載の方法にて得られた(2R)-4-アジドブタン-1,2-ジオール12gをメタノール60mlに溶解し、5%パラジウム-炭素2.4gを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて7時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をメタノール60mlに溶解し、5%パラジウム-炭素2.4gを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて1.5日間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮して標記化合物9.56gを得た。

MS(ESI) $m/z=105.9[M+H]^+$

^1H -NMR(300MHz, CD_3OD) δ (ppm): 1.52-1.68(m, 1H) 1.67-1.83(m, 1H) 2.79-3.00(m, 2H) 3.27-3.34(m, 1H) 3.42-3.53(m, 1H) 3.63-3.75(m, 1H)

【0158】

参考例5 2-(2-ブロモフェニル)-N-{2-[(2R)-オキシラン-2-イル]エチル}アセトアミドの合成

参考例4で得られた化合物3.45gと2-ブロモフェニル酢酸8.46gを原料として参考例3(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物2.20gを得た。

MS(ESI) $m/z=306.0[M+Na]^+$

^1H -NMR(300MHz, $CDCl_3$) δ (ppm): 1.47-1.62(m, 1H) 1.86-1.99(m, 1H) 2.44(dd, $J=4.82, 2.64$ Hz, 1H) 2.71(dd, $J=4.66, 4.20$ Hz, 1H) 2.88-2.97(m, 1H) 3.34-3.48(m, 2H) 3.71(s, 2H) 5.75(s, 1H) 7.13-7.22(m, 1H) 7.28-7.39(m, 2H) 7.57-7.63(m, 1H)

【0159】

参考例6 2-(4-ブロモフェニル)-N-{2-[(2R)-オキシラン-2-イル]エチル}アセトアミドの合成

参考例4で得られた化合物3.25g、4-ブロモフェニル酢酸7.31gを原料として参考例3(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物2.24gを得た。

MS(ESI) m/z =306.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(300MHz,CDCl₃) δ (ppm):1.42-1.56(m,1H)1.89-2.03(m,1H)2.45(dd,J=4.82,2.64Hz,1H)2.70-2.76(m,1H)2.88-2.97(m,1H)3.40(q,J=6.22Hz,2H)3.50(s,2H)5.66-5.86(m,1H)7.12-7.19(m,2H)7.44-7.51(m,2H)

【0160】

参考例7 2-(3-ブロモフェニル)-N-メチル-N-{2-[(2R)-オキシラン-2-イル]エチル}アセトアミドの合成

(1) 4-ブロモ-1-ブテン6.65gをジメチルホルムアミド50mlに溶解し、N-メチルベンジルアミン5.97gを加えて60℃にて2時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと蒸留水を加えて分液し、有機層を蒸留水、食塩水にて順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=2:1）にて精製してカップリング体2.54gを得た。

10

【0161】

(2) AD-mix-β 19.97gをt-ブチルアルコール70mlと蒸留水70mlの混合溶媒に溶解し、氷冷下、上記(1)で得られた化合物2.50gを加えた。氷冷下、6時間攪拌した後、亜硫酸水素ナトリウムを発泡しなくなるまで加えた。そこにクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製してジオール体2.45gを得た。

【0162】

20

(3) 上記(2)で得られた化合物2.40gをメタノールに溶解し、20%水酸化パラジウム-炭素1gを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて6時間攪拌した。濾過後、濾液を減圧濃縮してアミン体1.49gを得た。

【0163】

(4) 3-ブロモフェニル酢酸3.23gをクロロホルム30mlに溶解し、氷冷下、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩2.88gを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液に上記(3)で得られた化合物1.49gのメタノール溶液10mlを加えて室温にて72時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=20:1:0.1から10:1:0.1）にて精製してアミド体843mgを得た。

30

【0164】

(5) 上記(4)で得られた化合物843mgを原料として参考例1と同様の方法にて標記化合物393mgを得た。

MS(ESI) m/z =298.0[M+H]⁺

【0165】

参考例8 2-(3-ブロモフェニル)-N-[(2R)-オキシラン-2-イルメチル]アセトアミドの合成

(1) 3-ブロモフェニル酢酸10g、アリルアミン4.18mlを原料として参考例3(2)と同様の方法にてアミド体10.58gを得た。

【0166】

40

(2) 上記(1)で得られた化合物5gを原料として参考例7(2)と同様の方法にてジオール体6.48gを得た。

【0167】

(3) 上記(2)で得られた化合物6.3gを原料として参考例1と同様の方法にて標記化合物1.73gを得た。

MS(ESI) m/z =292.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(300MHz,CDCl₃) δ (ppm):2.51(dd,J=4.59,2.56Hz,1H)2.74-2.79(m,1H)3.05-3.12(m,1H)3.21-3.33(m,1H)3.54(s,2H)3.68-3.78(m,1H)5.53-5.68(m,1H)7.18-7.25(m,2H)7.40-7.47(m,2H)

【0168】

50

参考例 9 2-(3-ブロモフェニル)-N-{3-[(2R)-オキシラン-2-イル]プロピル}アセトアミドの合成

(1) 5-ブロモ-1-ペンテン6.65gをジメチルホルムアミド50mlに溶解し、氷冷下、フタルイミドカリウム13.7gを加えて60℃にて2時間攪拌した。析出してきた固体を濾別し、濾液にジエチルエーテルを加えて蒸留水、飽和食塩水にて順次洗浄後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してフタルイミド体15.7gを得た。

【0169】

(2) 上記(1)で得られた化合物15.7gをエタノール100mlに溶解し、氷冷下、ヒドラジン-水混合物7.7mlを加えて60℃にて20分間攪拌した。氷冷下、反応液に希塩酸を加えて酸性にして、析出してきた固体を濾別した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣に氷冷下、水酸化カリウムを加えて塩基性にして、ジエチルエーテルを加えて抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してアミン体5.14gを得た。

【0170】

(3) 上記(2)で得られた化合物2.5gを原料として参考例3(2)、参考例7(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物1.39gを得た。

MS(ESI) m/z =298.0[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.26-1.39(m, 1H) 1.55-1.77(m, 3H) 2.44(dd, J=4.90, 2.72Hz, 1H) 2.75(dd, J=4.82, 4.04Hz, 1H) 2.83-2.91(m, 1H) 3.29(q, J=6.63Hz, 2H) 3.51(s, 2H) 5.71(br. s., 1H) 7.18-7.24(m, 2H) 7.39-7.46(m, 2H)

【0171】

参考例 10 N-(3-ブロモベンジル)-3-[(2R)-オキシラン-2-イル]プロパンアミドの合成

(1) 4-ペンテン酸2.96gに塩化チオニル1.96mlを加えて70℃にて2時間攪拌した。反応液を氷冷下、3-ブロモベンジルアミン5.0g、トリエチルアミン11.2mlのクロロホルム50ml溶液に加えて室温にて1時間攪拌した。反応液に飽和食塩水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=5:1)にて精製してアミド体2.01gを得た。

【0172】

(2) 上記(1)で得られた化合物2.01gを原料として参考例7(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物1.36gを得た。

MS(ESI) m/z =284.0[M+H]⁺

【0173】

参考例 11 3-(3-ブロモフェニル)-N-[(2R)-オキシラン-2-イルメチル]プロパンアミドの合成

3-(3-ブロモフェニル)プロピオン酸2.5gとアリルアミン0.80mlを原料として参考例3(2)、参考例7(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物1.01gを得た。

MS(ESI) m/z =306.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.41-2.52(m, 3H) 2.75(t, J=4.27Hz, 1H) 2.95(t, J=7.54Hz, 2H) 3.02-3.10(m, 1H) 3.24-3.37(m, 1H) 3.63-3.75(m, 1H) 5.54(s, 1H) 7.09-7.20(m, 2H) 7.30-7.40(m, 2H)

【0174】

参考例 12 N-(3-ブロモフェニル)-4-[(2R)-オキシラン-2-イル]ブタンアミドの合成

5-ヘキセン酸3.65gと3-ブロモアニリン5.0gを原料として参考例10(1)、参考例7(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物690mgを得た。

MS(ESI) m/z =284.0[M+H]⁺

【0175】

参考例 13 2-(1-ナフチル)-N-{2-[(2R)-オキシラン-2-イル]エチル}アセトアミドの合成

参考例4で得られた化合物1.24g、1-ナフチル酢酸2.64gを原料として参考例3(2)、参

10

20

30

40

50

考例 1 と同様の方法にて標記化合物0.51gを得た。

MS(ESI) m/z =256.1[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.35-1.50(m, 1H) 1.65-1.80(m, 1H) 2.18(dd, J=4.82, 2.64Hz, 1H) 2.42-2.47(m, 1H) 2.49-2.55(m, 1H) 2.66-2.76(m, 1H) 3.20-3.40(m, 1H) 4.03(s, 2H) 5.57(s, 1H) 7.27-7.61(m, 4H) 7.79-8.00(m, 3H)

【0176】

参考例 14 2-(5-ブロモピリジン-3-イル)-N-{2-[(2R)-オキシラン-2-イル]エチル}アセトアミドの合成

参考例 4 で得られた化合物1.29g、5-ブロモ-3-ピリジル酢酸2.21gを原料として参考例 3 (2)、参考例 1 と同様の方法にて標記化合物0.45gを得た。

10

MS(ESI) m/z =307.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.43-1.57(m, 1H) 2.01-2.13(m, 1H) 2.51(dd, J=4.66, 2.80Hz, 1H) 2.75-2.79(m, 1H) 2.95-3.02(m, 1H) 3.41-3.49(m, 2H) 3.50(s, 2H) 5.94(s, 1H) 7.85(t, J=2.10Hz, 1H) 8.44(d, J=1.87Hz, 1H) 8.60(d, J=2.18Hz, 1H)

【0177】

参考例 15 3-ブロモ-N-{3-[(2R)-オキシラン-2-イル]プロピル}ベンズアミドの合成

(1) 参考例 9 (2) で得られた化合物5.08gをクロロホルム50mlに溶解し、3-ブロモ安息香酸7gと1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩8.01gを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に飽和塩化アンモニウム水溶液とクロロホルムを加えて分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール=30:1) にて精製してアミド体6.95gを得た。

20

【0178】

(2) 上記 (1) で得られた化合物3gを原料として参考例 7 (2)、参考例 1 と同様の方法にて標記化合物2.54gを得た。

MS(ESI) m/z =306.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.38-1.53(m, 1H) 1.69-1.97(m, 3H) 2.56(dd, J=4.82, 2.80Hz, 1H) 2.80-2.86(m, 1H) 2.94-3.03(m, 1H) 3.41-3.65(m, 2H) 6.50(s, 1H) 7.31(t, J=7.93Hz, 1H) 7.60-7.65(m, 1H) 7.68-7.73(m, 1H) 7.94(t, J=1.87Hz, 1H)

【0179】

参考例 16 2-(3-ブロモフェニル)フランの合成

1,3-ジブロモベンゼン1.0gをトルエン20mlに溶解し、トリ-n-ブチル-(2-フェニル)スズ1.59gとテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム0.25gを加えて加熱還流下30分間攪拌した。反応液を減圧濃縮した後、残渣をヘキサンに溶かしてシリカゲル濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をジエチルエーテルに溶解し、フッ化セシウム1.01gを加えて室温にて30分間攪拌した。反応液にヘキサン:酢酸エチル=10:1の混合溶媒を加えて濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサンのみ) で精製して標記化合物0.59gを得た。

MS(TOF) m/z =222.0[M]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 6.48(dd, J=3.42, 1.71Hz, 1H) 6.67(dd, J=3.42, 0.62Hz, 1H) 7.24(t, J=7.85Hz, 1H) 7.35-7.41(m, 1H) 7.48(dd, J=1.79, 0.70Hz, 1H) 7.55-7.62(m, 1H) 7.82(t, J=1.79Hz, 1H)

40

【0180】

参考例 17 3-ブロモ-N-{5-[(2R)-オキシラン-2-イル]ペンチル}ベンズアミドの合成

(1) 7-ブロモ-1-ヘプテン5gを原料として参考例 9 (1)、(2) と同様の方法にてアミン体2.87gを得た。

【0181】

(2) 上記 (1) で得られた化合物1.50g、3-ブロモ安息香酸4.01gを原料として参考例 3 (2)、参考例 7 (2)、参考例 1 と同様の方法にて標記化合物1.55gを得た。

MS(ESI) m/z =312.2[M+H]⁺

50

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.32-1.74(m, 8H) 2.47(dd, $J=5.05, 2.86\text{Hz}$, 1H) 2.71-2.80(m, 1H) 2.84-2.98(m, 1H) 3.37-3.51(m, 2H) 6.24-6.43(m, 1H) 7.24-7.37(m, 1H) 7.55-7.76(m, 2H) 7.86-7.96(m, 1H)

【0182】

参考例 18 3-ブロモ-N-[(2R)-オキシラン-2-イルメチル]ベンズアミドの合成

3-ブロモ安息香酸5gとアリルアミン1.86mlを原料として参考例3(2)、参考例7(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物0.75gを得た。

MS(ESI) $m/z=277.9[M+\text{Na}]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 2.66(dd, $J=4.43, 2.88\text{Hz}$, 1H) 2.83-2.88(m, 1H) 3.19-3.27(m, 1H) 3.45-3.59(m, 1H) 3.90-4.00(m, 1H) 6.23-6.36(m, 1H) 7.31-7.38(m, 1H) 7.58-7.71(m, 2H) 7.91-7.97(m, 1H)

10

【0183】

参考例 19 3-ブロモ-N-{2-[(2R)-オキシラン-2-イル]エチル}ベンズアミドの合成

参考例4で得られた化合物1.40g、3-ブロモ安息香酸2.94gを原料として参考例3(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物0.61gを得た。

MS(ESI) $m/z=291.9[M+\text{Na}]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.56-1.71(m, 1H) 2.14-2.27(m, 1H) 2.61(dd, $J=4.74, 2.72\text{Hz}$, 1H) 2.81-2.87(m, 1H) 3.06-3.14(m, 1H) 3.60-3.69(m, 2H) 6.61(s, 1H) 7.31(t, $J=7.93\text{Hz}$, 1H) 7.60-7.65(m, 1H) 7.67-7.72(m, 1H) 7.94(t, $J=1.79\text{Hz}$, 1H)

20

【0184】

参考例 20 N-(3-ブロモフェニル)-N'-{3-[(2R)-オキシラン-2-イル]プロピル}尿素の合成

(1) 参考例9(2)で得られた化合物0.37gをテトラヒドロフラン3mlに溶解し、トリエチルアミン0.42ml、3-ブロモフェニルイソシアネート0.315mlを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に蒸留水とクロロホルムを加えて分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール=30:1)にて精製してウレア体0.95gを得た。

【0185】

(2) 上記(1)で得られた化合物0.9gを原料として参考例7(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物0.33gを得た。

30

MS(ESI) $m/z=321.1[M+\text{Na}]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.33-1.52(m, 1H) 1.60-1.92(m, 3H) 2.52(dd, $J=4.83, 2.64\text{Hz}$, 1H) 2.80(t, $J=4.40\text{Hz}$, 1H) 2.87-3.03(m, 1H) 3.25-3.40(m, 2H) 4.96(s, 1H) 6.48(s, 1H) 7.06-7.30(m, 3H) 7.53-7.60(m, 1H)

【0186】

参考例 21 2-(3-アジドプロピル)オキシランの合成

(1) 4-ペンテン-1-オール20.0gをピリジンに溶解し、氷冷下、p-トルエンスルホニルクロリド48.7gを加えて2時間攪拌した。反応液にヘキサンと蒸留水を加えて分液し、有機層を1規定塩酸で4回洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過し、濾液を減圧濃縮してトシル体54.1gを得た。

40

【0187】

(2) 上記(1)で得られた化合物54.0gをジメチルスルホキシド500mlに溶解し、アジ化ナトリウム14.6gを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液にペントンを加えて分液した後、有機層を常圧濃縮してアジド体11.8gを得た。

【0188】

(3) 上記(2)で得られた化合物20.7gをジクロロメタン250mlに溶解し、氷冷下、m-クロロ過安息香酸28.2gを少量ずつ加えた。室温にて18時間攪拌した後濾過し、濾液を10%水酸化ナトリウム水溶液、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を常圧濃縮して標記化合物23.7gを得た。

50

MS(ESI) m/z =150.9[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.66(m, 4H) 2.50(dd, J=4.83, 2.64Hz, 1H) 2.73-2.81(m, 1H) 2.89-2.97(m, 1H) 3.36(t, J=6.15Hz, 2H)

【0189】

参考例 22 2-(5-ブロモペンチル)オキシランの合成

7-ブロモ-1-ヘプテン5.10gをクロロホルム29mlに溶解し、氷冷下、*m*-クロロ過安息香酸6.21gを加えて室温にて3時間攪拌した。反応液にジエチルエーテルと飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えて分液し、有機層を飽和重曹水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を常圧濃縮して標記化合物5.27gを得た。

MS(TOF)=193.0[M+H]⁺

10

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.36-1.63(m, 6H) 1.82-1.91(m, 2H) 2.46(dd, J=5.04, 2.75Hz, 1H) 2.74(dd, J=5.04, 3.67Hz, 1H) 2.87-2.93(m, 1H) 3.40(t, J=6.88Hz, 2H)

【0190】

参考例 23 3-ブロモ-N-{4-[(2R)-オキシラン-2-イル]ブチル}ベンズアミドの合成

(1) 6-ブロモ-1-ヘキセン5gを原料として参考例9(1)、(2)と同様の方法にてアミン体3.16gを得た。

【0191】

(2) 上記(1)で得られた化合物3.16g、3-ブロモ安息香酸5.5gを原料として参考例3(2)、参考例7(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物2.58gを得た。

MS(ESI) m/z =298.1[M+H]⁺

20

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.48-1.80(m, 6H) 2.48(dd, J=5.05, 2.86Hz, 1H) 2.76(dd, J=5.05, 4.18Hz, 1H) 2.85-2.99(m, 1H) 3.30-3.55(m, 2H) 6.32-6.55(m, 1H) 7.22-7.38(m, 1H) 7.56-7.76(m, 2H) 7.86-7.99(m, 1H)

【0192】

参考例 24 N-{3-[(2R)-オキシラン-2-イル]プロピル}-1-ナフトアミドの合成

(1) 参考例9(2)で得られた化合物1.0gをクロロホルム10mlに溶解し、氷冷下、トリエチルアミン4.9ml、1-ナフチルクロリド1.8mlを加えて室温にて40分間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えてクロロホルムで抽出し、有機層を0.5規定塩酸で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=2:1)にて精製してアミド体2.27gを得た。

30

【0193】

(2) 上記(1)で得られた化合物2.04gを原料として参考例7(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物1.06gを得た。

MS(ESI) m/z =256.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.45-1.94(m, 4H) 2.50(dd, J=5.05, 2.86Hz, 1H) 2.74-2.81(m, 1H) 2.89-3.03(m, 1H) 3.58(q, J=6.59Hz, 2H) 6.15-6.36(m, 1H) 7.35-7.61(m, 4H) 7.79-7.97(m, 2H) 8.19-8.36(m, 1H)

【0194】

参考例 25 4-[(2R)-オキシラン-2-イル]ブタン酸メチルの合成

(1) 5-ヘキセン酸6.5gをトルエン65mlに溶解して、氷冷下、*p*-トルエンスルホン酸一水和物490mg、ベンジルアルコール30mlを加えて加熱還流下3.5時間攪拌した。放冷後、反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=30:1から20:1)にて精製してエステル体13.7gを得た。

40

【0195】

(2) 上記(1)で得られた化合物11.2gを原料として参考例2(3)、参考例1と同様の方法にて標記化合物7.04gを得た。

MS(ESI) m/z =167.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.40-1.90(m, 4H) 2.25-2.96(m, 5H) 3.66(s, 3H)

【0196】

参考例 26 オキシラン-2-イル酢酸ベンジルの合成

50

(1) ビニル酢酸15gを原料として参考例25(1)と同様の方法にてエステル体42.4gを得た。

【0197】

(2) 上記(1)で得られた化合物22.1gをクロロホルム90mlに溶解し、氷冷下、m-クロロ過安息香酸19.6gを加えて室温にて48時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えて分液し、有機層を飽和重曹水、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=10:1から5:1)にて精製して標記化合物10.7gを得た。

MS(ESI)m/z=215.0[M+Na]⁺

10

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ(ppm): 2.56(dd, J=4.81, 2.52Hz, 1H) 2.61(t, J=5.50Hz, 2H) 2.80-2.86(m, 1H) 3.26-3.36(m, 1H) 5.16(s, 2H) 7.29-7.46(m, 5H)

【0198】

参考例27 5-オキシラン-2-イルペンタン酸ベンジルの合成

(1) 6-ヘプテン酸5.18gを原料として参考例25(1)と同様の方法にてエステル体9.67gを得た。

【0199】

(2) 上記(1)で得られた化合物4.72gを原料として参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物4.56gを得た。

MS(ESI)m/z=257.1[M+Na]⁺

20

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ(ppm): 1.39-1.60(m, 4H) 1.66-1.75(m, 2H) 2.37(t, J=7.57Hz, 2H) 2.44(dd, J=5.04, 2.75Hz, 1H) 2.72-2.74(m, 1H) 2.85-2.91(m, 1H) 5.11(s, 2H) 7.28-7.41(m, 5H)

【0200】

参考例28 (3-プロモベンジル)カルバミン酸オキシラン-2-イルメチルの合成

(1) 3-プロモベンジルアミン1gをクロロホルム30mlに溶解し、アリルクロロホルメート0.57ml、トリエチルアミン3.75mlを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液に蒸留水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール=20:1)にて精製してカーバメート体0.65gを得た。

【0201】

30

(2) 上記(1)で得られた化合物0.64gを原料として参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物0.43gを得た。

MS(ESI)m/z=308.1[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ(ppm): 2.60-2.71(m, 1H) 2.85(t, J=4.61Hz, 1H) 3.17-3.29(m, 1H) 3.93(dd, J=12.31, 6.59Hz, 1H) 4.36(d, J=6.15Hz, 2H) 4.48(dd, J=12.09, 2.86Hz, 1H) 5.12(s, 1H) 7.17-7.25(m, 2H) 7.32-7.49(m, 2H)

【0202】

参考例29 (オキシラン-2-イルメチル)カルバミン酸3-プロモベンジルの合成

(1) アリルイソシアネート0.78mlをトルエン10mlに溶解し、3-プロモベンジルアルコール1.5gを加えて加熱還流下9時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール=50:1)にて精製してカーバメート体1.66gを得た。

40

【0203】

(2) 上記(1)で得られた化合物0.65gを原料として参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物0.55gを得た。

MS(ESI)m/z=308.1[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ(ppm): 2.60(dd, J=4.40, 2.64Hz, 1H) 2.74-2.85(m, 1H) 3.05-3.17(m, 1H) 3.18-3.39(m, 1H) 3.55-3.73(m, 1H) 4.96(s, 1H) 5.08(s, 2H) 7.15-7.35(m, 2H) 7.39-7.55(m, 2H)

【0204】

50

参考例 30 (オキシラン-2-イルメチル)カルバミン酸アリルの合成

(1) 3-アミノ-1,2-プロパンジオール5gを蒸留水280mlに溶解し、氷冷下、アリルクロロホルメート6.4mlを滴下した。さらに0.4規定水酸化ナトリウム水溶液140mlを滴下した。滴下後、室温にて36時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に3規定塩酸を加えて酸性にして、クロロホルム、酢酸エチルにて順次抽出後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してカーバメート体3.40gを得た。

【0205】

(2) 上記(1)で得られた化合物3.0gを原料として参考例1と同様の方法にて標記化合物1.72gを得た。

MS(ESI) m/z =180.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.56-2.65(m, 1H) 2.75-2.82(m, 1H) 3.06-3.13(m, 1H) 3.40-3.51(m, 1H) 3.56-3.66(m, 1H) 4.06-4.10(m, 2H) 5.18-5.24(m, 2H) 5.85-5.97(m, 1H)

【0206】

参考例 31 (2R)-2-[4-(ベンジルオキシ)ブチル]オキシランの合成

(1) 5-ヘキセン-1-オール25.08gをジメチルホルムアミド250mlに溶解し、氷浴下、水素化ナトリウム7.22gをゆっくり加えて発泡が消失後、ベンジルアルコール38.04gのジメチルホルムアミド溶液30mlを滴下した。滴下後、室温に昇温して3時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えてジエチルエーテル抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=20:1)にて精製してベンジルエーテル体48.33gを得た。

【0207】

(2) 上記(1)で得られた化合物を原料として参考例7(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物8.00gを得た。

MS(ESI) m/z =229.1[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.43-1.81(m, 6H) 2.46(dd, J=4.83, 2.64Hz, 1H) 2.75(dd, J=4.83, 3.96Hz, 1H) 2.83-2.96(m, 1H) 3.49(t, J=6.15Hz, 2H) 4.51(s, 2H) 7.19-7.44(m, 5H)

【0208】

参考例 32 (2R)-2-[2-(ベンジルオキシ)エチル]オキシランの合成

(1) (S)-アスパラギン酸25.04g、臭化カリウム102.98gを2.5M硫酸に溶解し、食塩-氷浴下、内温-5℃から0℃の範囲で亜硝酸ナトリウム23.23gの水溶液45mlを1時間かけて滴下した。滴下後、内温を-5℃に保持して2時間半攪拌した。反応液を酢酸エチルで抽出し、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してプロモ体33.18gを得た。

【0209】

(2) 上記(1)で得られた化合物12.92gをテトラヒドロフラン100mlに溶解し、氷浴下、ボラン-テトラヒドロフラン錯体1.01Mテトラヒドロフラン溶液200mlを加えてそのまま3時間攪拌した。その後、氷浴下、蒸留水-テトラヒドロフラン(1:1)の混合溶媒25mlを加えて発泡終了後、炭酸カリウム45.1gを加えて室温に昇温し1時間攪拌した。反応液を濾過後、濾物をジエチルエーテルで洗浄し、洗液と濾液を合わせて減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=4:1から1:1)にて精製してジオール体9.16gを得た。

【0210】

(3) 水素化ナトリウム3.90gをテトラヒドロフラン108mlに加えた後、氷-エタノール浴下、内温-10℃から-5℃の範囲内にて上記(2)で得られた化合物9.16gのテトラヒドロフラン20ml溶液をゆっくりと滴下した。そのまま30分間攪拌後、ベンジルブロミド7.1ml、ヨウ化テトラ-n-ブチルアンモニウム2.00gを加えて、さらに内温-10℃にて30分間攪拌した。その後、室温にて2時間攪拌後、反応液を飽和塩化アンモニウム水溶液に加えてクロロホルムにて抽出した。有機層を蒸留水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグ

10

20

30

40

50

ラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=10:1から4:1）にて精製して標記化合物5.22gを得た。

MS(ESI) m/z =201.1[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.70-2.00(m, 2H) 2.53(dd, J=4.83, 2.64Hz, 1H) 2.79(dd, J=5.05, 3.74Hz, 1H) 2.96-3.17(m, 1H) 3.63(t, J=6.59Hz, 2H) 4.54(s, 2H) 7.29-7.39(m, 5H)

【0211】

参考例33 1-(オキシラン-2-イルメチル)ピペリジンの合成

ピペリジン3mlをt-ブチルアルコール1.2mlに溶解し、氷浴下、(±)-エピクロロヒドリン2.45mlを滴下した。そのままゆっくりと室温に昇温して18時間攪拌した。その後、氷冷下にて内温が15℃を超えないようにt-ブトキシカリウム3.39gのテトラヒドロフラン18ml溶液を滴下した。滴下後、室温にて2時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を蒸留水に加えてクロロホルムにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール=50：1）にて精製して標記化合物1.55gを得た。

MS(ESI) m/z =142.0[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.36-1.52(m, 2H) 1.53-1.70(m, 4H) 2.29(dd, J=13.19, 6.59Hz, 1H) 2.36-2.61(m, 5H) 2.67(m, 1H) 2.78(dd, J=5.05, 4.18Hz, 1H) 3.05-3.16(m, 1H)

【0212】

参考例34 4-(オキシラン-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルの合成

1-ベンジルオキシカルボニルピペラジン6ml、(±)-エピクロロヒドリン2.4mlを原料として参考例33と同様の方法にて標記化合物7.80gを得た。

MS(ESI) m/z =299.2[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.27(dd, J=13.40, 6.81Hz, 1H) 2.40-2.67(m, 4H) 2.49(dd, J=5.27, 2.64Hz, 1H) 2.72-2.86(m, 2H) 3.04-3.17(m, 1H) 3.56(t, J=5.05Hz, 4H) 5.13(s, 2H) 7.30-7.42(m, 5H)

【0213】

参考例35 1-(オキシラン-2-イルメチル)ピロリジンの合成

ピロリジン3ml、(±)-エピクロロヒドリン2.9mlを原料として参考例33と同様の方法にて標記化合物2.10gを得た。

MS(ESI) m/z =127.9[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.76-1.87(m, 4H) 2.43(dd, J=12.75, 6.59Hz, 1H) 2.49-2.56(m, 1H) 2.55-2.69(m, 4H) 2.73-2.86(m, 2H) 3.06-3.19(m, 1H)

【0214】

参考例36 [(2R)-(4-アジドブチル)オキシラン]の合成

(1) 6-ブロモ-1-ヘキセン5.06gをジメチルスルホキシド120mlに溶解し、アジ化ナトリウム2.42gを加えて室温にて16時間攪拌した。反応液を蒸留水に加えてジエチルエーテルにて抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を常圧濃縮してアジド体14.01gを得た。

【0215】

(2) 上記(1)で得られた化合物14.01gを原料として参考例7(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物6.26gを得た。

MS(TOF)=142.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.43-1.79(m, 6H) 2.48(dd, J=4.83, 2.64Hz, 1H) 2.76(dd, J=4.83, 3.96Hz, 1H) 2.85-2.99(m, 1H) 3.30(t, J=6.59Hz, 2H)

【0216】

参考例37 [(2R)-オキシラン-2-イルメチル]カルバミン酸3-ニトロベンジルの合成

アリルイソシアネート0.7g、3-ニトロベンジルアルコール1.17gを原料として参考例29(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物1.7gを得た。

MS(ESI) m/z =275.1[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.62(dd, J=4.61, 2.42Hz, 1H) 2.73-2.90(m, 1H) 3.05-3.20(m,

10

20

30

40

50

¹H)3.18-3.41(m, 1H)3.53-3.77(m, 1H)5.04(s, 1H)5.21(s, 2H)7.54(t, J=7.69Hz, 1H)7.63-7.74(m, 1H)8.12-8.28(m, 2H)

【0217】

参考例38 [(2R)-オキシラン-2-イルメチル]カルバミン酸3-シアノベンジル
アリルイソシアネート0.7gと3-シアノベンジルアルコール1.02gを原料として参考例29
(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物1.34gを得た。

MS(ESI)*m/z*=255.1[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.61(dd, J=4.40, 2.64Hz, 1H)2.76-2.85(m, 1H)3.06-3.18(m, 1H)3.19-3.35(m, 1H)3.55-3.76(m, 1H)4.91-5.08(m, 1H)5.14(s, 2H)7.39-7.71(m, 4H)

【0218】

参考例39 ベンジルカルバミン酸オキシラン-2-イルメチルの合成

(1) ベンジルアミン5.0gをクロロホルム80mlに溶解し、室温にて飽和重曹水80mlを加えた後、氷冷下、アリルクロロホルメート6.75gを加えて室温にて30分間攪拌した。反応液にクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル:トリエチルアミン=10:10:0.2)にて精製してカーバメート体8.86gを得た。

【0219】

(2) 上記(1)で得られた化合物8.86gを原料として参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物7.64gを得た。

MS(ESI)*m/z*=230.1[M+Na]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.56-2.68(m, 1H)2.76-2.91(m, 1H)3.10-3.29(m, 1H)3.90(dd, J=12.15, 6.19Hz, 1H)4.36(d, J=5.96Hz, 2H)4.45(dd, J=12.15, 2.98Hz, 1H)5.08-5.22(m, 1H)7.15-7.42(m, 5H)

【0220】

参考例40 [(2R)-オキシラン-2-イルメチル]カルバミン酸ピリジン-3-イルメチルの合成

(1) アリルイソシアネート1.0g、3-ピリジンメタノール1.19gを原料として参考例29(1)と同様の方法にてカーバメート体2.13gを得た。

【0221】

(2) 上記(1)で得られた化合物1.0gを原料として参考例7(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物0.40gを得た。

MS(ESI)*m/z*=209.1[M+H]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.56-2.60(m, 1H)2.78(t, J=4.36Hz, 1H)3.10(s, 1H)3.22-3.29(m, 1H)3.59-3.66(m, 1H)5.00(s, 1H)5.12(s, 2H)7.29(dd, J=7.79, 5.04Hz, 1H)7.68(d, J=7.79Hz, 1H)8.55-8.58(m, 1H)8.61(s, 1H)

【0222】

参考例41 4-({3-[(2R)-オキシラン-2-イル]プロポキシ}メチル)キノリンの合成

(1) 参考例21(1)で得られた化合物1.5gをテトラヒドロフラン50mlに溶解し、文献(Synthesis, 1994年, 1278ページ)に記載の方法にて得られた4-(ヒドロキシメチル)キノリン0.99g、水酸化カリウム0.385g、18-クラウン-6-エーテル1.81gを加えて室温にて6時間攪拌した。反応液に蒸留水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール=30:1)にて精製してエーテル体1.08gを得た。

【0223】

(2) 上記(1)で得られた化合物1.05gを原料として参考例7(2)、参考例1と同様の方法にて標記化合物0.46gを得た。

MS(ESI)*m/z*=244.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.51-1.96(m, 4H)2.48(dd, J=5.05, 2.86Hz, 1H)2.72-2.80(m, 1H)2.90-3.02(m, 1H)3.63-3.73(m, 2H)4.98-5.01(m, 2H)7.49(d, J=4.40Hz, 1H)7.52-7.64(m, 1

10

20

30

40

50

H)7.67-7.79(m, 1H)7.94-8.03(m, 1H)8.10-8.20(m, 1H)8.90(d, J=4.40Hz, 1H)

【0224】

参考例42 4-オキシラン-2-イルブタンニトリルの合成

5-ヘキセンニトリル3.0gを原料として参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物5.03gを得た。

MS(ESI)m/z=134.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.45-1.69(m, 1H) 1.74-1.97(m, 3H) 2.33-2.56(m, 3H) 2.74-2.82(m, 1H) 2.87-3.02(m, 1H)

【0225】

参考例43 (オキシラン-2-イルメチル)カルバミン酸メチルの合成

10

(1) アリルアミン4.5mlをクロロホルム50mlに溶解し、氷冷下、メチルクロロホルメート2.32mlを滴下して、室温にて2時間攪拌した。反応液を2規定塩酸、飽和重曹水にて順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してカーバメート体3.93gを得た。

【0226】

(2) 上記(1)で得られた化合物3.90gを原料として参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物3.32gを得た。

MS(ESI)m/z=154.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.61(dd, J=4.83, 2.64Hz, 1H) 2.75-2.83(m, 1H) 3.07-3.15(m, 1H) 3.18-3.34(m, 1H) 3.54-3.69(m, 1H) 3.69(s, 3H) 4.90(br. s., 1H)

20

【0227】

参考例44 (オキシラン-2-イルメチル)カルバミン酸エチルの合成

(1) アリルアミン4.5ml、エチルクロロホルメート2.87mlを原料として参考例43(1)と同様の方法にてカーバメート体5.84gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物3.84gを原料として参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物2.43gを得た。

MS(ESI)m/z=168.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.25(t, J=7.03Hz, 3H) 2.61(dd, J=4.40, 2.64Hz, 1H) 2.73-2.86(m, 1H) 3.06-3.15(m, 1H) 3.18-3.34(m, 1H) 3.52-3.68(m, 1H) 4.13(q, J=7.33Hz, 2H) 4.85(br. s., 1H)

30

【0228】

参考例45 メチルカルバミン酸オキシラン-2-イルメチルの合成

40%メチルアミン水溶液7.3ml、アリルクロロホルメート3mlを原料として参考例43(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物989mgを得た。

MS(ESI)m/z=154.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.61-2.67(m, 1H) 2.78-2.87(m, 1H) 2.81(d, J=4.83Hz, 3H) 3.16-3.27(m, 1H) 3.89(dd, J=12.31, 6.59Hz, 1H) 4.44(dd, J=12.31, 2.64Hz, 1H) 4.78(br. s., 1H)

【0229】

参考例46 ジメチルカルバミン酸オキシラン-2-イルメチルの合成

50%ジメチルアミン水溶液9.03ml、アリルクロロホルメート3mlを原料として参考例43(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物1.10gを得た。

40

MS(ESI)m/z=168.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.65(dd, J=4.83, 2.64Hz, 1H) 2.84(dd, J=4.83, 3.96Hz, 1H) 2.94(s, 6H) 3.19-3.28(m, 1H) 3.91(dd, J=12.31, 6.15Hz, 1H) 4.44(dd, J=12.31, 3.08Hz, 1H)

【0230】

参考例47 [3-(1,1-ジメチル-3,5-ジオキサシクロヘキサ-4-イル)フェニル]酢酸

(1) 文献(Tetrahedron, 1997年, 53巻, 6755ページ)に記載の方法にて得られた(1,1-ジメチル-3,5-ジオキサシクロヘキサ-4-イル)-3-ブロモメチルベンゼン0.90gをジメチルスルホキシド3mlに溶解し、シアン化ナトリウム0.17gを加えて30℃にて2時間攪拌した。さらにシアン化ナトリウム0.34gを加えて30℃にて1時間攪拌した。反応液に1規定水酸化ナ

50

トリウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してシアノ体0.78gを得た。

【0231】

(2) 上記(1)で得られた化合物0.78gをエタノール10mlに溶解し、5規定水酸化ナトリウム水溶液を加えて加熱還流下3時間攪拌した。反応液に3規定塩酸を加えて酸性にし、反応液を減圧濃縮して得られた残渣に蒸留水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して標記化合物0.71gを得た。

MS(ESI) $m/z=273.0[M+Na]^+$

^1H -NMR(300MHz, $CDCl_3$) δ (ppm): 0.80(s, 3H) 1.29(s, 3H) 3.60-3.69(m, 4H) 3.73-3.81(m, 2H) 5.39(s, 1H) 7.29(t, $J=1.63$ Hz, 1H) 7.34(t, $J=7.77$ Hz, 1H) 7.39-7.46(m, 2H)

10

【0232】

参考例48 8-(2-アミノエトキシ)-1-エチルキノリン-4(1H)-オン塩酸塩の合成

(1) 特許文献(W004/101584)に記載の方法にて得られた8-ベンジルオキシ-1-エチル-4-オキソ-1,4-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸エチルエステル0.6gをテトラヒドロフラン5mlに溶解して、2規定水酸化ナトリウム水溶液5mlを加えて85℃にて2.5時間攪拌した。さらに反応液にエタノール6ml、2規定水酸化ナトリウム水溶液6mlを加えて85℃にて0.5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して、濃縮液に濃塩酸2.5mlを加えた。析出してきた固体を濾別し、得られた固体を蒸留水で洗浄後、トルエンに溶解して濾過した。濾液を減圧濃縮してカルボン酸0.5gを得た。

【0233】

20

(2) 上記(1)で得られた化合物0.5gをジメチルホルムアミド10mlに溶解し、シアン化ナトリウム0.76gを加えて120℃にて1時間攪拌した。ジメチルスルホキシド10mlを加えて120℃にて8時間攪拌後、反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液とジエチルエーテルを加えて分液した。有機層を2規定水酸化ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して8-ベンジルオキシ-1-エチル-4-オキソ-1,4-ジヒドロキノリン20mgを得た。水層に濃塩酸を加えて酸性にし、析出してきた固体を濾別した。得られた固体をジメチルスルホキシド10mlに溶解して、シアン化ナトリウム0.5gを加えて150℃にて12時間、140℃にて11時間攪拌した。放冷後、反応液に飽和重曹水を加えてジエチルエーテルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して8-ベンジルオキシ-1-エチル-4-オキソ-1,4-ジヒドロキノリン0.17gをさらに得た。

30

【0234】

(3) 上記(2)で得られた化合物0.19gを原料として、特許文献(W004/101584)に記載の方法にて標記化合物0.1gを得た。

MS(ESI) $m/z=233.0[M+H]^+$

^1H -NMR(200MHz, $DMSO-d_6$) δ (ppm): 1.21-1.40(m, 3H) 3.19-3.43(m, 2H) 4.39(t, $J=5.27$ Hz, 2H) 4.52(q, $J=7.03$ Hz, 2H) 6.06(d, $J=7.47$ Hz, 1H) 7.22-7.45(m, 2H) 7.77-8.01(m, 2H)

【0235】

参考例49 2-(1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-8-イルオキシ)エタンアミン塩酸塩の合成

40

(1) 8-ヒドロキシキノリン2gをアセトニトリル50mlに溶解し、炭酸カリウム5.7g、N-(2-クロロエチル)ジベンジルアミン塩酸塩4.1gを加えて加熱還流下6時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をクロロホルムで希釈して2規定水酸化ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル:=3:1から0:1)にて精製してジベンジルアミン体2.1gを得た。

【0236】

(2) 上記(1)で得られた化合物1gをメタノール20mlに溶解して、10%パラジウム-炭素0.5gを、濃塩酸0.23mlを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて12時間攪拌した。セライト濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をメタノール20mlに溶解して、10%パラジウ

50

ム-炭素0.5g、濃塩酸0.23mlを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて60時間攪拌した。
セライト濾過後、濾液を減圧濃縮して標記化合物0.52gを得た。

MS(ESI) m/z =193.0[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CD₃OD) δ (ppm): 1.94-2.16(m, 2H) 2.86(t, J=6.37Hz, 2H) 3.24-3.38(m, 2H) 3.38-3.50(m, 2H) 4.20-4.38(m, 2H) 6.58-7.22(m, 3H)

【0237】

参考例50 2-フェノキシエチルアミン塩酸塩の合成

フェノールを原料として参考例49と同様の方法にて標記化合物を得た。

MS(ESI) m/z =137.9[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, DMSO-d₆) δ (ppm): 3.19(t, J=5.27Hz, 2H) 4.05-4.25(m, 2H) 6.88-7.11(m, 3H) 7.18-7.44(m, 2H)

【0238】

参考例51 8-(4-アミノブトキシ)-1-エチル-4-オキソ-1,4-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸塩酸塩の合成

(1) 特許文献(WO04/101584)に記載の方法にて得られた8-ヒドロキシ-1-エチル-4-オキソ-1,4-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸エチルエステル300mgをジメチルホルムアミド2mlに溶解し、1,4-ジブromobutan737mg、炭酸カリウム159mgを加えて100℃にて3時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと蒸留水を加えて分液し、有機層を蒸留水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をジメチルホルムアミド2mlに溶解し、ジベンジルアミン343mg、炭酸カリウム238mgを加えて100℃にて3時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと蒸留水を加えて分液し、有機層を蒸留水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)により精製してジベンジル体343mgを得た。

【0239】

(2) 上記(1)で得られた化合物400mgをテトラヒドロフラン4mlに溶解し、2規定水酸化ナトリウム水溶液2mlを加えて室温にて18時間、さらに50℃にて2時間攪拌した。反応液にドライアイスを加えて酢酸エチルと分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を4規定塩酸-ジオキサン溶液5mlとメタノール5mlに溶解し、5%パラジウム-炭素400mgを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて18時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をメタノールに溶解し、そこにヘキサン:酢酸エチル=1:1の混合溶媒を加えることで析出した固体を濾別して標記化合物71mgを得た。

¹H-NMR(300MHz, DMSO-d₆) δ (ppm): 1.43(t, J=6.92Hz, 3H) 1.70-2.01(m, 2H) 3.27-3.52(m, 2H) 4.24(t, J=6.06Hz, 2H) 4.77-4.89(m, 2H) 7.57-7.63(m, 2H) 7.98-8.04(m, 1H) 8.93(s, 1H)

【0240】

参考例52 2-(キノリン-8-イルオキシ)エタンアミン

(1) 8-キノリノール1.0g、N-(2-ブromoエチル)フタルイミド1.75gを原料として、参考例49(1)と同様の方法にてフタルイミド体230mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物220mgをエタノール3mlに溶解し、ヒドラジン-水合物50.4μlを加えて加熱還流下4時間、さらに室温にて18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に1規定塩酸を加えて濾過した後、濾液に5規定水酸化ナトリウム水溶液を加えてアルカリ性にした。そこにクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して標記化合物83mgを得た。

MS(ESI) m/z =188.9[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 3.24-3.42(m, 2H) 4.23-4.38(m, 2H) 7.09(dd, J=6.81, 1.98Hz, 1H) 7.33-7.54(m, 3H) 8.05-8.24(m, 1H) 8.96(dd, J=4.18, 1.54Hz, 1H)

【0241】

参考例53 1-エチル-4-オキソ-8-(3-オキソプロポキシ)-1,4-ジヒドロキノリン-3-カル

ボン酸エチルの合成

(1) 特許文献(W004/101584)に記載の方法にて得られた8-ヒドロキシ-1-エチル-4-オキソ-1,4-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸エチルエステル0.2gと3-ブロモ-1-プロパノール0.13gを原料として、参考例49(1)と同様の方法にてアルコール体223mgを得た。

【0242】

(2) 上記(1)で得られた化合物46mgをクロロホルム3mlに溶解し、デスマーチン試薬90mgを加えて室温にて30分間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して未精製の標記化合物140mgを得た。

【0243】

参考例54 N-エチル-N-[(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(1) 特許文献(特開昭54-154724号公報)に記載の方法にて得られた(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エタンアミン8.86gをクロロホルム100mlに溶解し、無水酢酸12.0g、4-ジメチルアミノピリジン14.3gを加えて70℃にて30分間攪拌した。放冷後、1規定塩酸、10%水酸化ナトリウム水溶液で反応液を順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してアセチル体11.23gを得た。

【0244】

(2) 水素化リチウムアルミニウム3.3gをテトラヒドロフラン200mlに加えた。加熱還流下、上記(1)で得られた化合物11.2gを15分間かけて加えた。加熱還流下3時間攪拌後、放冷し、蒸留水3.3ml、15%水酸化ナトリウム水溶液3.3ml、蒸留水3.3mlを順次加えて2時間攪拌した。反応液を濾過し、得られた濾物をさらにテトラヒドロフランで洗浄した。濾液及び洗液を減圧濃縮してN-エチル体10.86gを得た。

【0245】

(3) 文献(Tetrahedron Letters, 2001年, 42巻, 315ページ)に記載の方法にて得られたフタルイミドアセトアルデヒド633mgをクロロホルム20mlに溶解し、上記(2)で得られた化合物0.6g、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム1.06gを加えて室温にて2時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=2:1)により精製してフタルイミド体0.93gを得た。

【0246】

(4) 上記(3)で得られた化合物0.93gをエタノール20mlに溶解し、ヒドラジン-水和物0.38mlを加えて加熱還流下3時間、さらに室温にて18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に1規定塩酸を加えて酸性にし、析出してきた固体を濾別した。濾液を炭酸カリウムで中和後、クロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)にて精製して標記化合物484mgを得た。

MS(ESI) m/z =223.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ(ppm): 0.98(t, J=7.03Hz, 3H) 1.29(d, J=7.03Hz, 3H) 2.38-2.72(m, 6H) 3.82(s, 3H) 4.37(q, J=7.03Hz, 1H) 6.83-6.97(m, 2H) 7.15-7.25(m, 1H) 7.36(dd, J=7.47, 1.76Hz, 1H)

【0247】

参考例55 5-{エチル[(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エチル]アミノ}ペンタン酸の合成

(1) 参考例54(2)で得られた化合物1.0gをジメチルホルムアミド5mlに溶解し、5-ブロモペンタン酸エチル1.21gを加えて100℃にて2時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと蒸留水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してエチルエステル1.07gを得た。

【0248】

(2) 上記(1)で得られた化合物1.07gを3規定塩酸15mlに溶解し、80℃にて5時間攪拌

10

20

30

40

50

した。反応液に酢酸エチルを加えて分液し、有機層を減圧濃縮した。得られた残渣に10%水酸化ナトリウム水溶液を加えて水層を酢酸エチルで抽出した。水層をドライアイスにて中和し、クロロホルムを加えて分液した。有機層を減圧濃縮して標記化合物201mgを得た。

MS(ESI) $m/z=280.1 [M+Na]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.15(t, $J=7.15\text{Hz}$, 3H) 1.55(d, $J=6.68\text{Hz}$, 3H) 1.53-1.80(m, 4H) 2.08-2.31(m, 2H) 2.68-2.86(m, 3H) 2.91-3.04(m, 1H) 3.83(s, 3H) 4.65-4.79(m, 1H) 6.88(d, $J=8.08\text{Hz}$, 1H) 6.99(t, $J=7.54\text{Hz}$, 1H) 7.28(t, $J=7.77\text{Hz}$, 1H) 7.59(d, $J=7.31\text{Hz}$, 1H)

【0249】

参考例56 6-{エチル[(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エチル]アミノ}ヘキサン酸の合成
参考例54(2)で得られた化合物1.0gと6-ブロモヘキサン酸エチル1.31gを原料として参考例55と同様の方法にて標記化合物400mgを得た。

10

MS(ESI) $m/z=294.1 [M+Na]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, CDCl_3) δ (ppm):

1.11(t, $J=7.15\text{Hz}$, 3H) 1.21-1.35(m, 2H) 1.49-1.68(m, 4H) 1.52(d, $J=6.84\text{Hz}$, 3H) 2.17-2.31(m, 2H) 2.66-2.97(m, 4H) 3.82(s, 3H) 4.60(q, $J=6.42\text{Hz}$, 1H) 6.87(d, $J=7.46\text{Hz}$, 1H) 6.98(t, $J=7.31\text{Hz}$, 1H) 7.22-7.29(m, 1H) 7.61(dd, $J=7.69, 1.48\text{Hz}$, 1H)

【0250】

参考例57 N-エチル-N-[(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エチル]プロパン-1,3-ジアミンの合成

20

(1) 参考例54(2)で得られた化合物1.0gをジメチルホルムアミド10mlに溶解し、N-(3-ブロモプロピル)フタルイミド1.65g、炭酸カリウム0.85gを加えて100℃にて2.5時間攪拌した。反応液に蒸留水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルムのみからクロロホルム:メタノール=100:1から20:1)で精製してフタルイミド体1.58gを得た。

【0251】

(2) 上記(1)で得られた化合物1.73gを原料として参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物0.99gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.01(t, $J=7.07\text{Hz}$, 3H) 1.28(d, $J=6.68\text{Hz}$, 3H) 1.49-1.61(m, 2H) 2.42-2.74(m, 6H) 3.81(s, 3H) 4.32(q, $J=6.84\text{Hz}$, 1H) 6.86(dd, $J=8.24, 1.09\text{Hz}$, 1H) 6.89-6.98(m, 1H) 7.16-7.23(m, 1H) 7.40(dd, $J=7.62, 1.71\text{Hz}$, 1H)

30

【0252】

参考例58 N-エチル-N-[(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エチル]ブタン-1,4-ジアミンの合成

参考例54(2)で得られた化合物1.0g、N-(4-ブロモブチル)フタルイミド1.73gを原料として参考例57(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物0.98gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 0.99(t, $J=7.07\text{Hz}$, 3H) 1.28(d, $J=6.68\text{Hz}$, 3H) 1.30-1.58(m, 4H) 2.35-2.72(m, 6H) 3.81(s, 3H) 4.30(q, $J=6.74\text{Hz}$, 1H) 6.85(dd, $J=8.24, 1.09\text{Hz}$, 1H) 6.90-6.97(m, 1H) 7.15-7.22(m, 1H) 7.42(dd, $J=7.69, 1.79\text{Hz}$, 1H)

40

【0253】

参考例59 4-{エチル[(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エチル]アミノ}ブタン酸の合成

(1) 4-ブロモブタン酸エチル5.0gをトルエン100mlに溶解し、ベンジルアルコール51.3ml、濃塩酸1mlを加えてトルエンを留去させながら加熱した。放冷後、反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン=10:1)により精製した。得られた化合物にベンジルアルコール250ml、p-トルエンスルホン酸一水和物100mgを加えて100℃にて攪拌した。反応液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン=10:1)により精製して4-ブロモブタン酸ベンジル3.9gを得た。

【0254】

50

(2) 上記(1)で得られた化合物1.72g、参考例54(2)で得られた化合物1.0gを原料として参考例55(1)と同様の方法にてベンジルエステル体91mgを得た。

【0255】

(3) 上記(2)で得られた化合物550mgをテトラヒドロフラン10mlに溶解し、5%パラジウム-炭素200mgを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて18時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)にて精製して標記化合物560mgを得た。

MS(ESI)m/z=266.1[M+Na]⁺

¹H-NMR(300MHz, DMSO-d₆) δ (ppm): 0.93(t, J=6.99Hz, 3H) 1.22(d, J=6.99Hz, 3H) 1.59(t, 2H) 2.11(t, J=7.23Hz, 2H) 2.31-2.64(m, 4H) 3.76(s, 3H) 4.28(q, J=6.74Hz, 1H) 6.88-6.98(m, 2H) 7.16-7.25(m, 1H) 7.35(dd, J=7.54, 1.63Hz, 1H)

10

【0256】

参考例60 N-(2-メトキシフェニル)プロパン-1,3-ジアミンの合成

3-ブロモプロピルフタルイミド25.0g、o-アニシジン10gを原料として参考例57(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物4.9gを得た。

MS(ESI)m/z=180.9[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.74-1.95(m, 2H) 2.87(t, J=6.81Hz, 2H) 3.21(t, J=6.81Hz, 2H) 3.84(s, 3H) 6.56-6.92(m, 4H)

【0257】

参考例61 N-ベンジル-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

20

2-ブロモエチルフタルイミドとエチルベンジルアミンを原料として参考例57(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物5.1gを得た。

MS(ESI)m/z=179.0[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.05(t, J=7.15Hz, 3H) 2.46-2.59(m, 4H) 2.73(t, J=5.98Hz, 2H) 3.57(s, 2H) 7.18-7.37(m, 5H)

【0258】

参考例62 N-[(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エチル]-N-メチルエタン-1,2-ジアミンの合成

(1) (1S)-1-(2-メトキシフェニル)エタンアミン100mgをクロロホルム10mlに溶解し、フタルイミドアセトアルデヒド125mg、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム210mgを加えて室温にて1時間攪拌した。さらに37%ホルムアルデヒド水溶液340ml、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム210mgを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してフタルイミド体244mgを得た。

30

【0259】

(2) 上記(1)で得られた化合物を原料として参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物114mgを得た。

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.29(d, J=6.88Hz, 3H) 2.17(s, 3H) 2.34-2.40(m, 1H) 2.44-2.51(m, 1H) 2.70-2.79(m, 2H) 3.81(s, 3H) 4.15(q, J=6.88Hz, 1H) 6.86(d, J=7.79Hz, 1H) 6.94(m, 1H) 7.20(m, 1H) 7.35(dd, J=7.57, 1.60Hz, 1H)

40

【0260】

参考例63 N-エチル-N-(1-ピラジン-2-イルエチル)エタン-1,2-ジアミンの合成

(1) 特許文献(WO0/100213)に記載の方法にて得られた1-(ピラジン-2-イル)エチルアミン0.45gをクロロホルム20mlに溶解し、フタルイミドアセトアルデヒド0.76g、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム1.16gを加えて室温にて2時間攪拌した。さらにアセトアルデヒド0.342ml、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム1.16gを加えて室温にて3.5時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してN-エチル体を得た。

【0261】

50

(2) 上記(1)で得られた化合物を原料として参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物0.66gを得た。

MS(ESI) m/z =195.1[M+H]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.04(t, J=7.11Hz, 3H) 1.41(d, J=6.88Hz, 3H) 2.45-2.52(m, 2H) 2.55-2.64(m, 2H) 2.65-2.74(m, 2H) 4.09(q, J=6.88Hz, 1H) 8.40(d, J=2.29Hz, 1H) 8.47-8.50(m, 1H) 8.72(d, J=1.38Hz, 1H)

【0262】

参考例64 N-エチル-N-[1-(2-メトキシピラジン-3-イル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(1) 文献(Journal of Organic Chemistry, 1989年, 54巻, 640ページ)に記載の方法にて得られた1-(2-メトキシ-3-ピラジニル)-1-エタノン0.5gをメタノールに溶解し、酢酸アンモニウム2.53g、シアノ水素化ホウ素ナトリウム0.145gを加えて室温にて3日間攪拌した。反応液に2規定塩酸を加えて減圧濃縮した後、5規定水酸化ナトリウム水溶液を加えてアルカリ性にした。そこにクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)にて精製してアミン体245mgを得た。

【0263】

(2) 上記(1)で得られた化合物245mgを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物53mgを得た。

MS(ESI) m/z =225.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.97(t, J=7.25Hz, 3H) 1.35(d, J=7.03Hz, 3H) 2.40-2.92(m, 6H) 3.98(s, 3H) 4.34-4.47(m, 1H) 7.98(d, J=2.64Hz, 1H) 8.07(d, J=3.08Hz, 1H)

【0264】

参考例65 N-エチル-N-(1-ピリジン-3-イルエチル)エタン-1,2-ジアミンの合成

3-アセチルピリジン1.0gを原料として参考例64(1)、参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物146mgを得た。

MS(ESI) m/z =194.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.03(t, J=7.03Hz, 3H) 1.33-1.42(m, 3H) 2.35-2.60(m, 4H) 2.63-2.73(m, 2H) 3.93(q, J=6.59Hz, 1H) 7.21-7.28(m, 1H) 7.63-7.73(m, 1H) 8.48(dd, J=4.83, 1.76 Hz, 1H) 8.60(d, J=2.20Hz, 1H)

【0265】

参考例66 N-エチル-N-[1-(4-メトキシピリジン-3-イル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

特許文献(特開平10-287678号公報)に記載の方法にて得られた3-アセチル-4-メトキシピリジン500mgを原料として参考例64(1)、参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物97mgを得た。

MS(ESI) m/z =224.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.98(t, J=7.03Hz, 3H) 1.34(d, J=7.03Hz, 3H) 2.39-2.74(m, 6H) 3.87(s, 3H) 4.32(q, J=7.03Hz, 1H) 6.77(d, J=5.71Hz, 1H) 8.39(d, J=5.71Hz, 1H) 8.46(s, 1H)

【0266】

参考例67 N,N-ジメチル-1,4-ブタンジアミンの合成

(1) N-ベンジルオキシカルボニル-1,4-ブタンジアミン1.0gをメタノール15mlに溶解し、37%ホルムアルデヒド水溶液3.1ml、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム1.23gを加えた。室温にて2時間攪拌した後、さらにトリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム820mgを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液に飽和重曹水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を蒸留水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。得られた濾液を減圧濃縮してジメチルアミノ体950mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物280mgを原料として参考例4と同様の方法にて標記化合物80mgを得た。

MS(GC)m/z=293[M-15]⁺

¹H-NMR(400MHz,CDCl₃) δ (ppm):1.65(quint,J=7.20Hz,2H)1.75(quint,J=7.20Hz,2H)2.29(s,6H)2.38(t,J=7.20Hz,2H)2.87(t,J=7.20Hz,2H)

【0267】

参考例68 N-(2-アミノメチル)メタンスルホンアミドの合成

(1) N-ベンジルオキシカルボニル-1,2-ジアミノエタン塩酸塩1.0gをジクロロメタン15mlに懸濁し、氷冷下トリエチルアミン1.45ml、メタンスルホンクロリド0.4mlを加え、氷冷下20分間攪拌した。反応液に蒸留水を加えて分液し、有機層を飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した後、濾液を減圧濃縮してメタンスルホン体1.0gを得た。

10

(2) 上記(1)で得られた化合物1.0gを原料として参考例4と同様の方法にて標記化合物530mgを得た。

MS(GC)m/z=139[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz,CDCl₃) δ (ppm):2.91(t,J=5.60Hz,2H)2.99(s,3H)3.16(t,J=5.60Hz,2H)

【0268】

参考例69 N-(2-アミノメチル)アセトアミドの合成

N-ベンジルオキシカルボニル-1,2-ジアミノエタン塩酸塩1.0gと塩化アセチル370μlを原料として参考例68(1)、参考例4と同様の方法にて標記化合物440mgを得た。

MS(GC)m/z=103[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz,CDCl₃) δ (ppm):2.01(s,3H)2.84(t,J=6.00Hz,2H)3.16(q,J=5.6Hz,2H)6.01(brs,1H)

20

【0269】

参考例70 1-[1-(2-メトキシフェニル)エチル]ピロリジン-3-アミンの合成

3-t-ブトキシカルボニルアミノピロリジン560mgをメタノール5mlに溶解し、酢酸170μl、2-メトキシアセトフェノン140μl、水素化シアノホウ素ナトリウム45mgを加え、50℃にて20時間攪拌した。反応液に5規定塩酸10mlを加え、室温にて2時間攪拌した後、炭酸カリウムで塩基性とし、メタノールを減圧留去した。クロロホルムで分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した後、濾液を減圧濃縮して標記化合物83mgを得た。

MS(ESI)m/z=221[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz,CDCl₃) δ (ppm):1.30-1.33(m,3H)1.38-1.52(m,1H)2.12-2.21(m,1H)2.26-2.35(m,1H)2.37-2.56(m,1H)2.60-2.81(m,2H)3.44-3.50(m,1H)3.78-3.84(m,4H)6.86(d,J=8.28Hz,1H)6.94-6.99(m,1H)7.17-7.21(m,1H)7.49-7.52(m,1H)

30

【0270】

参考例71 1-[1-(2-メトキシフェニル)エチル]ピペラジンの合成

N-t-ブトキシカルボニルピペラジン560mgを原料として参考例70と同様の方法にて標記化合物149mgを得た。

MS(ESI)m/z=221[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz,CDCl₃) δ (ppm):1.30(d,J=6.80Hz,3H)2.32-2.56(m,4H)2.86(t,J=4.80Hz,4H)3.81(s,3H)3.93(q,J=6.80Hz,1H)6.84-6.89(m,1H)6.92-6.98(m,1H)7.17-7.22(m,1H)7.40-7.45(m,1H)

40

【0271】

参考例72 N-エチル-N-[(1S)-1-(3-メトキシフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(S)-1-(3-メトキシフェニル)エチルアミン200mgを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物135mgを得た。

MS(ESI)m/z=223.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ (ppm):1.02(t,J=7.25Hz,3H)1.33(d,J=6.59Hz,3H)2.35-2.76(m,6H)3.77-3.92(m,1H)3.81(s,3H)6.72-6.82(m,1H)6.89-7.01(m,2H)7.16-7.28(m,1H)

【0272】

参考例73 N-エチル-N-[(1S)-1-(4-メトキシフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの

50

合成

(S)-1-(4-メトキシフェニル)エチルアミン200mgを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物167mgを得た。

MS(ESI) m/z =223.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.02(t, J=7.25Hz, 3H) 1.32(d, J=6.59Hz, 3H) 2.31-2.77(m, 6H) 3.75-3.94(m, 1H) 3.80(s, 3H) 6.85(d, J=8.79Hz, 2H) 7.27(d, J=8.79Hz, 2H)

【0273】

参考例74 N-エチル-N-[(1S)-1-(4-フルオロフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(S)-1-(4-フルオロフェニル)エチルアミン200mgを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物186mgを得た。

10

MS(ESI) m/z =211.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.02(t, J=7.03Hz, 3H) 1.32(d, J=6.59Hz, 3H) 2.33-2.73(m, 6H) 3.80-3.93(m, 1H) 6.99(t, J=8.79Hz, 2H) 7.27-7.36(m, 2H)

【0274】

参考例75 N-[(1S)-1-(4-クロロフェニル)エチル]-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

(S)-4-クロロ-α-メチルベンジルアミン200mgを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物179mgを得た。

MS(ESI) m/z =227.1[M+H]⁺

20

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.01(t, J=7.25Hz, 3H) 1.32(d, J=7.03Hz, 3H) 2.33-2.74(m, 6H) 3.85(q, J=6.59Hz, 1H) 7.24-7.34(m, 4H)

【0275】

参考例76 N-エチル-N-[(1S)-1-(4-メチルフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(S)-1-(p-トリル)-エチルアミン200mgを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物219mgを得た。

MS(ESI) m/z =207.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.02(t, J=7.03Hz, 3H) 1.33(d, J=7.03Hz, 3H) 2.33(s, 3H) 2.34-2.72(m, 6H) 3.77-3.93(m, 1H) 7.06-7.26(m, 4H)

30

【0276】

参考例77 N-エチル-N-[(1S)-1-(2-フルオロフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(S)-1-(2-フルオロフェニル)エチルアミン200mgを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物236mgを得た。

MS(ESI) m/z =211.1[M+H]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.99(t, J=7.11Hz, 3H) 1.34(d, J=6.88Hz, 3H) 2.38-2.69(m, 6H) 4.26(q, J=6.88Hz, 1H) 6.96-7.02(m, 1H) 7.05-7.12(m, 1H) 7.15-7.21(m, 1H) 7.32-7.39(m, 1H)

【0277】

参考例78 N-[1-[4-(ベンジルオキシ)フェニル]エチル]-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

40

(1) 4'-ヒドロキシアセトフェノン3.0gをアセトン50mlに溶解し、ベンジルブロミド2.88mlと炭酸カリウム4.57gを加えて加熱還流下4時間攪拌した。反応液に蒸留水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してベンジルエーテル体5.0gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物1.0gを原料として参考例64(1)、参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物161mgを得た。

MS(ESI) m/z =298.9[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.02(t, J=7.25Hz, 3H) 1.33(d, J=7.03Hz, 3H) 2.31-2.73(m, 6H) 3.85(q, J=6.74Hz, 1H) 5.05(s, 2H) 6.93(d, J=8.79Hz, 2H) 7.19-7.50(m, 7H)

50

【0278】

参考例79 N-エチル-N-[1-(3-フルオロフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(1) 3'-フルオロアセトフェノン5.0gを原料として参考例64(1)と同様の方法にてアミン体2.77gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物1.0gを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物525mgを得た。

MS(ESI)m/z=211.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.02(t, J=7.03Hz, 3H) 1.33(d, J=7.03Hz, 3H) 2.32-2.78(m, 6H) 3.87(q, J=6.89Hz, 1H) 6.82-7.00(m, 1H) 7.02-7.17(m, 2H) 7.19-7.33(m, 1H)

【0279】

10

参考例80 N-[1-(3-クロロフェニル)エチル]-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

(1) 3'-クロロアセトフェノン5.0gを原料として参考例64(1)と同様の方法にてアミン体2.62gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物1.0gを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物474mgを得た。

MS(ESI)m/z=227.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.02(t, J=7.03Hz, 3H) 1.33(d, J=7.03Hz, 3H) 2.36-2.73(m, 6H) 3.85(q, J=6.74Hz, 1H) 7.14-7.40(m, 4H)

【0280】

参考例81 N-[1-(4-エトキシフェニル)エチル]-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

20

(1) 4'-エトキシアセトフェノン5.0gを原料として参考例64(1)と同様の方法にてアミン体3.58gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物1.0gを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物532mgを得た。

MS(ESI)m/z=237.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.02(t, J=7.03Hz, 3H) 1.32(d, J=7.03Hz, 3H) 1.41(t, J=7.03Hz, 3H) 2.32-2.71(m, 6H) 3.84(q, J=6.59Hz, 1H) 4.02(q, J=7.03Hz, 2H) 6.84(d, J=8.79Hz, 2H) 7.25(d, J=8.35Hz, 2H)

【0281】

参考例82 N-[1-(1-メチル-1H-ピロール-3-イル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

30

3-アセチル-1-メチルピロール1.0gとエチレンジアミン1.46gをトルエン10mlに溶解し、p-トルエンスルホン酸一水和物154mgを加えて2時間加熱還流した。反応液を水素化ホウ素ナトリウム307mgのテトラヒドロフラン懸濁液に加えた後にメタノールを加えて、室温にて16時間攪拌した。反応液を1規定塩酸で酸性にした後に溶媒を減圧留去した。蒸留水と炭酸カリウムを加えて中和後、クロロホルムで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)にて精製して標記化合物1.14gを得た。

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.37(d, J=6.59Hz, 3H) 2.35-2.67(m, 2H) 2.72-2.83(m, 2H) 3.06(s, 3H) 3.87(q, J=6.59Hz, 1H) 7.55(d, J=8.35Hz, 2H) 7.89(d, J=8.79Hz, 2H)

40

【0282】

参考例83 N-エチル-N-[1-(2-メチルフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(1) 2'-メチルアセトフェノン5.0gを原料として参考例64(1)と同様の方法にてアミン体2.05gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物1.0gを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物514mgを得た。

MS(ESI)m/z=207.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.02(t, J=7.25Hz, 3H) 1.30(d, J=7.03Hz, 3H) 2.27-2.74(m, 6H) 2.41(s, 3H) 4.08(q, J=6.59Hz, 1H) 7.07-7.23(m, 3H) 7.32-7.43(m, 1H)

【0283】

50

参考例 8 4 N-エチル-N-[1-(3-メチルフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(1) 3'-メチルアセトフェノン5.0gを原料として参考例 6 4 (1) と同様の方法にてアミン体3.06gを得た。

(2) 上記(1) で得られた化合物1.0gを原料として参考例 6 3 (1)、参考例 5 4 (4) と同様の方法にて標記化合物550mgを得た。

MS(ESI)m/z=207.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.03(t, J=7.03Hz, 3H) 1.34(d, J=7.03Hz, 3H) 2.35(s, 3H) 2.37-2.73(m, 6H) 3.84(q, J=6.74Hz, 1H) 6.99-7.25(m, 4H)

【0284】

参考例 8 5 N-エチル-N-[1-(4-エチルフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

10

(1) 4'-エチルアセトフェノン5.0gを原料として参考例 6 4 (1) と同様の方法にてアミン体3.10gを得た。

(2) 上記(1) で得られた化合物1.0gを原料として参考例 6 3 (1)、参考例 5 4 (4) と同様の方法にて標記化合物675mgを得た。

MS(ESI)m/z=221.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.03(t, J=7.03Hz, 3H) 1.24(t, J=7.69Hz, 3H) 1.34(d, J=6.59Hz, 3H) 2.33-2.71(m, 8H) 3.80-3.92(m, 1H) 7.10-7.18(m, 2H) 7.21-7.30(m, 2H)

【0285】

参考例 8 6 N-[1-[3-(ジメチルアミノ)フェニル]エチル]-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

20

(1) 3'-ジメチルアミノアセトフェノン5.0gを原料として参考例 6 4 (1) と同様の方法にてアミン体2.46gを得た。

(2) 上記(1) で得られた化合物1.0gを原料として参考例 6 3 (1)、参考例 5 4 (4) と同様の方法にて標記化合物396mgを得た。

MS(ESI)m/z=236.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.03(t, J=7.03Hz, 3H) 1.35(d, J=6.59Hz, 3H) 2.37-2.74(m, 6H) 2.94(s, 6H) 3.81(q, J=6.89Hz, 1H) 6.56-6.81(m, 3H) 7.18(t, J=7.91Hz, 1H)

【0286】

参考例 8 7 N-エチル-N-[1-(3-ニトロフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

3'-ニトロアセトフェノン500mgを原料として参考例 6 4 (1)、参考例 6 3 (1)、参考例 5 4 (4) と同様の方法にて標記化合物71mgを得た。

30

MS(ESI)m/z=238.1[M+H]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.03(t, J=7.11Hz, 3H) 1.38(d, J=6.42Hz, 3H) 2.42-2.62(m, 4H) 2.66-2.75(m, 2H) 3.97(q, J=6.57Hz, 1H) 7.47(t, J=8.02Hz, 1H) 7.72(d, J=7.34Hz, 1H) 8.06-8.11(m, 1H) 8.21-8.25(m, 1H)

【0287】

参考例 8 8 N-エチル-N-[(1S)-1-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(S)-1-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチルアミン200mgを原料として参考例 6 3 (1)、参考例 5 4 (4) と同様の方法にて標記化合物115mgを得た。

40

MS(ESI)m/z=261.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.97(t, J=7.03Hz, 3H) 1.31(d, J=6.59Hz, 3H) 2.28-2.51(m, 1H) 2.52-2.86(m, 5H) 4.01-4.23(m, 1H) 7.23-7.36(m, 1H) 7.44-7.65(m, 2H) 7.85(d, J=7.91Hz, 1H)

【0288】

参考例 8 9 N-エチル-N-[(1S)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(S)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチルアミン200mgを原料として参考例 6 3 (1)、参考例 5 4 (4) と同様の方法にて標記化合物98mgを得た。

MS(ESI)m/z=261.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.03(t, J=7.03Hz, 3H) 1.36(d, J=6.59Hz, 3H) 2.32-2.78(m, 6H)

50

)3.86-3.99(m, 1H)7.33-7.67(m, 4H)

【0289】

参考例90 N-エチル-N-[(1S)-1-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(S)-1-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチルアミン200mgを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物108mgを得た。

MS(ESI)m/z=261.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ(ppm): 1.03(t, J=7.03Hz, 3H) 1.36(d, J=7.03Hz, 3H) 2.32-2.77(m, 6H) 3.92(q, J=6.74Hz, 1H) 7.42-7.61(m, 4H)

【0290】

参考例91 N-[(1S)-1-(4-ブロモフェニル)エチル]-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

(S)-1-(4-ブロモフェニル)エチルアミン200mgを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物61mgを得た。

MS(ESI)m/z=271.0[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ(ppm): 1.01(t, J=7.25Hz, 3H) 1.31(d, J=7.03Hz, 3H) 2.32-2.76(m, 6H) 3.83(q, J=6.74Hz, 1H) 7.18-7.29(m, 2H) 7.37-7.48(m, 2H)

【0291】

参考例92 N-エチル-N-[(1S)-1-フェニルエチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(1)(S)-(-)-1-フェニルエチルアミン210mgを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物230mgを得た。

MS(ESI)m/z=193.1[M+H]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ(ppm): 0.96(t, J=7.11Hz, 3H) 1.28(d, J=6.88Hz, 3H) 1.50(brs, 2H) 2.33-2.63(m, 6H) 3.81(q, J=6.72Hz, 1H) 7.13-7.18(m, 1H) 7.22-7.26(m, 2H) 7.27-7.30(m, 2H)

【0292】

参考例93 N-エチル-N-[(1S)-1-(1-ナフチル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(1)(S)-(-)-1-(1-ナフチル)エチルアミン240mgを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物220mgを得た。

MS(ESI)m/z=243.1[M+H]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ(ppm): 1.06(t, J=7.11Hz, 3H) 1.25(brs, 2H) 1.44(d, J=6.42Hz, 3H) 2.36-2.56(m, 4H) 2.69(q, J=7.18Hz, 2H) 4.65(q, J=6.57Hz, 1H) 7.33-7.55(m, 4H) 7.71(d, J=8.25Hz, 1H) 7.80(d, J=7.79Hz, 1H) 8.42(d, J=8.25Hz, 1H)

【0293】

参考例94 N-エチル-N-[(1S)-1-(2-ナフチル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(1)(S)-(-)-1-(2-ナフチル)エチルアミン240mgを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物160mgを得た。

MS(ESI)m/z=243.1[M+H]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ(ppm): 1.04(t, J=7.11Hz, 3H) 1.43(brs, 2H) 1.39-1.46(d, J=6.88Hz, 3H) 2.43-2.72(m, 6H) 4.02(q, J=6.72Hz, 1H) 7.41-7.49(m, 2H) 7.54-7.60(m, 2H) 7.70(s, 1H) 7.75-7.83(m, 2H)

【0294】

参考例95 N-[1-(1-メチル-1H-ピロール-2-イル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

2-アセチル-1-メチルピロール1.0gを原料として参考例82と同様の方法にて標記化合物424mgを得た。

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ(ppm): 1.43(d, J=6.59Hz, 3H) 2.51-2.80(m, 4H) 3.66(s, 3H) 3.87(q, J=6.59Hz, 1H) 5.99-6.08(m, 2H) 6.52-6.56(m, 1H)

【0295】

参考例96 N-[1-[4-(メチルスルホニル)フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

4'-(メチルスルホニル)アセトフェノン1.0gとエチレンジアミン908mgをメタノール10mlに溶解し、50℃にて3時間加熱した。反応液を水素化ホウ素ナトリウム286mgのテトラヒ

10

20

30

40

50

ドロフラン懸濁液50mlに加えた後にメタノール6mlを加えて室温にて16時間攪拌した。反応液を1規定塩酸で酸性にした後に溶媒を減圧留去した。蒸留水と炭酸カリウムを加えて中和後、クロロホルムで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して標記化合物553mgを得た。

MS(ESI) m/z =243.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.37(d, J=6.59Hz, 3H) 2.35-2.67(m, 2H) 2.72-2.83(m, 2H) 3.06(s, 3H) 3.87(q, J=6.59Hz, 1H) 7.55(d, J=8.35Hz, 2H) 7.89(d, J=8.79Hz, 2H)

【0296】

参考例97 N-[1-(1-エチル-1H-ピラゾール-5-イル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成
1-(2-エチル-2H-ピラゾール-3-イル)-エタノン250mgを原料として参考例82と同様の方法にて標記化合物72mgを得た。

10

MS(ESI) m/z =183.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.40-1.49(m, 6H) 2.47-2.82(m, 4H) 3.95(q, J=6.59Hz, 1H) 4.21(q, J=7.03Hz, 2H) 6.12(d, J=1.76Hz, 1H) 7.43(d, J=1.76Hz, 1H)

【0297】

参考例98 3-[1-[(2-アミノエチル)アミノ]エチル]-N-メチルチオフエン-2-スルホンアミドの合成

3-アセチル-2-(メチルアミノスルホニル)チオフエン1.0gを原料として参考例82と同様の方法にて標記化合物762mgを得た。

20

MS(ESI) m/z =264.1[M+H]⁺

【0298】

参考例99 N-[1-(1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成
1-(2-メチル-2H-ピラゾール-3-イル)-エタノン250mgを原料として参考例82と同様の方法にて標記化合物34mgを得た。

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.42(d, J=6.59Hz, 3H) 2.50-2.88(m, 4H) 3.90-4.02(m, 1H) 4.14(s, 3H) 6.45-6.52(m, 1H) 7.37-7.45(m, 1H)

【0299】

参考例100 N-[1-(1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

30

1-(2,5-ジメチル-2H-ピラゾール-3-イル)-エタノン250mgを原料として参考例82と同様の方法にて標記化合物57mgを得た。

MS(ESI) m/z =183.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.39(d, J=6.59Hz, 3H) 2.23(s, 3H) 2.49-2.68(m, 2H) 2.73-2.83(m, 2H) 3.81(s, 3H) 3.88(q, J=6.59Hz, 1H) 5.91(s, 1H)

【0300】

参考例101 N-(1-[3-[(ジエチルアミノ)メチル]-4-メトキシフェニル]エチル)エタン-1,2-ジアミンの合成

1-(3-[(ジエチルアミノ)メチル]-4-メトキシフェニル)エタノン250mgを原料として参考例82と同様の方法にて標記化合物130mgを得た。

40

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.97-1.15(m, 6H) 1.31-1.38(m, 3H) 2.43-2.80(m, 8H) 3.53-3.62(m, 2H) 3.64-3.78(m, 1H) 3.78-3.84(m, 3H) 6.75-6.86(m, 1H) 7.09-7.19(m, 1H) 7.27-7.37(m, 1H)

【0301】

参考例102 N-[1-[4-メトキシ-3-(ピロリジン-1-イルメチル)フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-[4-メトキシ-3-(ピロリジン-1-イルメチル)フェニル]エタノン250mgを原料として参考例82と同様の方法にて標記化合物70mgを得た。

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.34(d, J=6.59Hz, 3H) 1.73-1.86(m, 4H) 2.40-2.79(m, 8H) 3.63-3.78(m, 3H) 3.81(s, 3H) 6.77-6.87(m, 1H) 7.11-7.30(m, 2H)

50

【0302】

参考例103 2-[1-[(2-アミノエチル)アミノ]エチル]フェノールの合成

2'-ヒドロキシアセトフェノン1.0gを原料として参考例82と同様の方法にて標記化合物303mgを得た。

MS(ESI)m/z=181.0[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.47(d, J=6.59Hz, 3H) 2.61-2.71(m, 2H) 2.74-3.03(m, 2H) 3.92(q, J=6.74Hz, 1H) 6.71-6.84(m, 2H) 6.91-7.00(m, 1H) 7.08-7.19(m, 1H)

【0303】

参考例104 N-[1-(2-ニトロフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

2'-ニトロアセトフェノン1.0gを原料として参考例82と同様の方法にて標記化合物110mgを得た。 10

MS(ESI)m/z=210.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.44(d, J=6.59Hz, 3H) 2.30-2.47(m, 1H) 2.50-2.65(m, 1H) 2.69-2.81(m, 2H) 4.28(q, J=6.59Hz, 1H) 7.29-7.42(m, 1H) 7.52-7.65(m, 1H) 7.70-7.84(m, 2H)

【0304】

参考例105 N-[1-(2-クロロフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

2'-クロロアセトフェノン1.0gを原料として参考例82と同様の方法にて標記化合物529mgを得た。

MS(ESI)m/z=199.0[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.35(d, J=6.59Hz, 3H) 2.41-2.66(m, 2H) 2.73-2.83(m, 2H) 4.29(q, J=6.59Hz, 1H) 7.09-7.37(m, 3H) 7.47-7.54(m, 1H) 20

【0305】

参考例106 3-[1-[(2-アミノエチル)アミノ]エチル]フェノールの合成

3'-ヒドロキシアセトフェノン1.0g、エチレンジアミン1.47mlをメタノール10mlに溶解し、室温にて16時間攪拌した。水素化ホウ素ナトリウム277.9mgを加えて室温にて5時間攪拌した。反応液に1規定塩酸を加えた後に溶媒を留去した。炭酸カリウムと蒸留水を加えてアルカリ性とした後、クロロホルム-エタノール(10:1)の混合溶媒で抽出し、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1から5:1:0.1)により精製して標記化合物59.1mgを得た。 30

MS(ESI)m/z=181.0[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.36(d, J=6.59Hz, 3H) 2.44-2.85(m, 4H) 3.72(q, J=6.45Hz, 1H) 6.63-6.91(m, 3H) 7.09-7.21(m, 1H)

【0306】

参考例107 N-[1-(2-エトキシフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

2'-エトキシアセトフェノン1.0gを原料として参考例106と同様の方法にて標記化合物882mgを得た。

MS(ESI)m/z=209.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.33-1.48(m, 6H) 2.46-2.59(m, 2H) 2.70-2.84(m, 2H) 3.97-4.20(m, 3H) 6.80-6.98(m, 2H) 7.11-7.34(m, 2H) 40

【0307】

参考例108 N-[1-(4-ニトロフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

4'-ニトロアセトフェノン1.0gを原料として参考例82と同様の方法にて標記化合物639mgを得た。

MS(ESI)m/z=210.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.37(d, J=6.59Hz, 3H) 2.35-2.49(m, 1H) 2.52-2.67(m, 1H) 2.73-2.82(m, 2H) 3.89(q, J=6.59Hz, 1H) 7.51(d, J=8.79Hz, 2H) 8.19(d, J=8.79Hz, 2H)

【0308】

参考例109 N-[1-(3-メトキシフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成 50

3'-メトキシアセトフェノン1.0gを原料として参考例106と同様の方法にて標記化合物1.16gを得た。

MS(ESI) m/z =195.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.36(d, J=6.59Hz, 3H) 2.41-2.65(m, 2H) 2.72-2.81(m, 2H) 3.74(q, J=6.30Hz, 1H) 3.81(s, 3H) 6.73-6.82(m, 1H) 6.86-6.95(m, 2H) 7.17-7.31(m, 1H)

【0309】

参考例110 4-[1-[(2-アミノエチル)アミノ]エチル]フェノールの合成

4'-ヒドロキシアセトフェノン1.0gを原料として参考例106と同様の方法にて標記化合物59.1mgを得た。

MS(ESI) m/z =181.0[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.35(d, J=6.59Hz, 3H) 2.42-2.86(m, 4H) 3.62-3.79(m, 1H) 6.65(d, J=8.79Hz, 2H) 7.11(d, J=8.35Hz, 2H)

【0310】

参考例111 N-[1-[4-(ジメチルアミノ)フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

4'-ジメチルアミノアセトフェノン1.0gを原料として参考例82と同様の方法にて標記化合物370mgを得た。

MS(ESI) m/z =208.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.35(d, J=6.59Hz, 3H) 2.41-2.65(m, 2H) 2.70-2.81(m, 2H) 2.93(s, 6H) 3.62-3.76(m, 1H) 6.72(d, J=8.79Hz, 2H) 7.18(d, J=8.79Hz, 2H)

【0311】

参考例112 N-[(1S)-1-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチル]-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

(S)-1-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチルアミン210mgを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物210mgを得た。

MS(ESI) m/z =329.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.04(t, J=7.03Hz, 3H) 1.39(d, J=6.59Hz, 3H) 1.51(br. s., 2H) 2.38-2.78(m, 6H) 3.98(q, 1H) 7.75(s, 1H) 7.85(s, 2H)

【0312】

参考例113 N-エチル-N-[(1R)-1-(3-メトキシフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(R)-1-(3-メトキシフェニル)エチルアミン500mgを原料として参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物390mgを得た。

MS(ESI) m/z =223.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.03(t, J=7.03Hz, 3H) 1.34(d, J=7.03Hz, 3H) 2.36-2.75(m, 6H) 3.78-3.91(m, 1H) 3.81(s, 3H) 6.72-6.82(m, 1H) 6.84-6.99(m, 2H) 7.16-7.28(m, 1H)

【0313】

参考例114 4-[1-[(2-アミノエチル)アミノ]エチル]-2-[(ジエチルアミノ)メチル]フェノールの合成

1-(3-[(ジエチルアミノ)メチル]-4-ヒドロキシフェニル)エタノン250mgを原料として参考例82と同様の方法にて標記化合物89mgを得た。

MS(ESI) m/z =266.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.10(t, J=7.03Hz, 6H) 1.33(d, J=6.59Hz, 3H) 2.41-2.79(m, 8H) 3.66(q, J=6.59Hz, 1H) 3.75(s, 2H) 6.74(d, J=7.91Hz, 1H) 6.89-6.94(m, 1H) 7.03-7.11(m, 1H)

【0314】

参考例115 4-[1-[(2-アミノエチル)アミノ]エチル]-2-(ピペリジン-1-イルメチル)フェノールの合成

1-(4-ヒドロキシ-3-ピペリジン-1-イルメチル-フェニル)-エタノン250mgを原料として参考例82と同様の方法にて標記化合物137mgを得た。

MS(ESI) m/z =300.2[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.42-1.70(m, 6H) 2.37-2.82(m, 8H) 3.59-3.73(m, 3H) 6.75(d,

10

20

30

40

50

J=8.35Hz, 1H) 6.87-6.95(m, 3H) 7.03-7.11(m, 3H)

【0315】

参考例 116 N-[1-[4-メトキシ-3-(ピペリジン-1-イルメチル)フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-[4-メトキシ-3-(ピペリジン-1-イルメチル)フェニル]エタノン250mgを原料として参考例 96 と同様の方法にて標記化合物69mgを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.35(d, J=6.59Hz, 3H) 1.39-1.67(m, 6H) 2.39-2.79(m, 8H) 3.54(s, 2H) 3.72(q, J=6.59Hz, 1H) 3.80(s, 3H) 6.82(d, J=8.35Hz, 1H) 7.12-7.20(m, 1H) 7.24-7.32(m, 1H)

【0316】

参考例 117 N-[1-[4-メトキシ-3-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-[4-メトキシ-3-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]エタノン250mgを原料として参考例 96 と同様の方法にて標記化合物181mgを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.35(d, J=6.59Hz, 3H) 2.41-2.80(m, 8H) 3.56(s, 2H) 3.66-3.76(m, 5H) 3.81(s, 3H) 6.83(d, J=8.35Hz, 1H) 7.13-7.30(m, 2H)

【0317】

参考例 118 2-(4-[1-[(2-アミノエチル)アミノ]エチル]フェノキシ)-N,N-ジメチルアセトアミドの合成

2-(4-アセチルフェノキシ)-N,N-ジメチルアセトアミド250mgを原料として参考例 96 と同様の方法にて標記化合物162mgを得た。

MS(ESI)m/z=266.2[M+H]⁺

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.33(d, J=6.59Hz, 3H) 2.36-2.65(m, 2H) 2.69-2.82(m, 2H) 2.99(s, 3H) 3.10(s, 3H) 3.72(q, J=6.59Hz, 1H) 4.67(s, 2H) 6.86-6.94(m, 2H) 7.18-7.29(m, 2H)

【0318】

参考例 119 N-[1-[4-(2-モルホリン-4-イル-2-オキソエトキシ)フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-[4-(2-モルホリン-4-イル-2-オキソエトキシ)フェニル]エタノン250mgを原料として参考例 96 と同様の方法にて標記化合物168mgを得た。

MS(ESI)m/z=308.2[M+H]⁺

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.34(d, J=6.59Hz, 3H) 2.39-2.82(m, 4H) 3.56-3.78(m, 9H) 4.68(s, 2H) 6.90(d, J=8.79Hz, 2H) 7.17-7.30(m, 2H)

【0319】

参考例 120 N-[1-[4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-[4-(4-メチルピペラジノ)フェニル]-1-エタノン250mgを原料として参考例 96 と同様の方法にて標記化合物62mgを得た。

MS(ESI)m/z=263.2[M+H]⁺

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.34(d, J=6.59Hz, 3H) 2.35(s, 3H) 2.41-2.80(m, 8H) 3.15-3.24(m, 4H) 3.70(q, J=6.59Hz, 1H) 6.89(d, J=8.79Hz, 2H) 7.20(d, J=8.35Hz, 2H)

【0320】

参考例 121 N-(3-[1-[(2-アミノエチル)アミノ]エチル]フェニル)メタンスルホンアミドの合成

N-(3-アセチルフェニル)メタンスルホンアミド250mgを原料として参考例 96 と同様の方法にて標記化合物189mgを得た。

MS(ESI)m/z=258.1[M+H]⁺

$^1\text{H-NMR}$ (200MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.35(d, J=6.59Hz, 3H) 2.37-2.87(m, 4H) 3.02(s, 3H) 3.70-3.85(m, 1H) 7.05-7.39(m, 4H)

【0321】

参考例 122 1-(4-[1-[(2-アミノエチル)アミノ]エチル]フェニル)ピリジン-4(1H)-オ

10

20

30

40

50

ンの合成

1-(4-アセチルフェニル)ピリジン-4(1H)-オン250mgを原料として参考例96と同様の方法にて標記化合物287mgを得た。

MS(ESI) m/z =258.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.38(d, J=6.59Hz, 3H) 2.36-2.71(m, 2H) 2.72-2.87(m, 2H) 3.85(q, J=6.74Hz, 1H) 6.50(d, J=7.47Hz, 2H) 7.21-7.35(m, 2H) 7.40-7.65(m, 4H)

【0322】

参考例123 1-[4-[1-[(2-アミノエチル)アミノ]エチル]フェニル]ピペリジン-4-オールの合成

1-[4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)フェニル]エタノン250mgを原料として参考例96と同様の方法にて標記化合物146mgを得た。 10

MS(ESI) m/z =264.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.36(d, J=6.59Hz, 3H) 1.57-1.82(m, 2H) 1.92-2.11(m, 2H) 2.39-2.66(m, 2H) 2.69-3.03(m, 4H) 3.42-3.95(m, 4H) 6.90(d, J=8.35Hz, 2H) 7.19(d, J=8.35Hz, 2H)

【0323】

参考例124 N'-[3-[1-[(2-アミノエチル)アミノ]エチル]フェニル]-N,N-ジメチルスルファミドの合成

N'-[3-アセチルフェニル]-N,N-ジメチルスルファミド250mgを原料として参考例96と同様の方法にて標記化合物299mgを得た。

MS(ESI) m/z =287.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.35(d, J=6.59Hz, 3H) 2.33-2.82(m, 4H) 2.85(s, 6H) 3.69-3.83(m, 1H) 7.00-7.33(m, 4H) 20

【0324】

参考例125 N-[1-[4-(2-ピリジン-4-イルアジリジン-1-イル)フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-[4-(2-ピリジン-4-イルアジリジン-1-イル)フェニル]エタノン250mgを原料として参考例96と同様の方法にて標記化合物272mgを得た。

MS(ESI) m/z =283.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.35(d, J=6.59Hz, 3H) 2.32-2.66(m, 4H) 2.69-2.83(m, 2H) 3.05(dd, J=6.37, 3.30Hz, 1H) 3.73(q, J=6.30Hz, 1H) 6.98(d, J=8.35Hz, 2H) 7.22(d, J=8.35Hz, 2H) 7.30(d, J=6.15Hz, 2H) 8.57(d, J=6.15Hz, 2H) 30

【0325】

参考例126 N-[1-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-エタノン250mgとエチレンジアミン362mgをメタノール10mlに溶解し、酢酸1.21g、シアノ水素化ホウ素ナトリウム189mgを加えて室温にて48時間攪拌した。反応液に飽和重曹水、テトラヒドロフランを加えて分液後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して標記化合物163mgを得た。 40

MS(ESI) m/z =169.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.26(d, J=6.59Hz, 3H) 2.53-2.80(m, 4H) 3.69(q, J=6.59Hz, 1H) 3.77(s, 3H) 7.34(s, 1H) 7.53(s, 1H)

【0326】

参考例127 4-[1-[(2-アミノエチル)アミノ]エチル]ベンゼンスルホンアミドの合成

4-アセチル-ベンゼンスルホンアミド250mgを原料として参考例96と同様の方法にて標記化合物49mgを得た。

MS(ESI) m/z =244.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.22(d, J=6.15Hz, 3H) 2.36-2.68(m, 4H) 3.64-3.83(m, 1H) 7.45-7.56(m, 2H) 7.70-7.82(m, 2H) 50

【0327】

参考例128 N-[(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成
(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エチルアミン70mgを原料として参考例54(3)、(4)
と同様の方法にて標記化合物71mgを得た。

MS(ESI)m/z=195.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.36(d, J=6.59Hz, 3H) 2.47-2.58(m, 2H) 2.71-2.82(m, 2H) 3.83(s, 3H) 4.12(q, J=6.59Hz, 1H) 6.82-7.01(m, 2H) 7.13-7.36(m, 2H)

【0328】

参考例129 N-[1-(3-エチルフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成
3'-エチルアセトフェノン500mgを原料として参考例96と同様の方法にて標記化合物571
mgを得た。

MS(ESI)m/z=193.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.24(t, J=7.47Hz, 3H) 1.37(d, J=6.59Hz, 3H) 2.38-2.85(m, 6H) 3.74(q, J=6.89Hz, 1H) 7.02-7.31(m, 4H)

【0329】

参考例130 N-[1-[4-(4,5-ビス[(トリエチルシリル)オキシ]メチル]-1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(1) 1-[4-(4,5-ビス[(トリエチルシリル)オキシ]メチル)-1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)フェニル]エタノン100mgをジメチルホルムアミド2mlに溶解し、t-ブチルジメチルクロロシラン134.1mgとイミダゾール165.2mgを加えて室温で16時間、50℃で6時間攪拌した。
さらにt-ブチルジメチルクロロシラン134.1mgとイミダゾール165.2mgを加えて室温で16時間攪拌した。蒸留水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム)にて精製して保護体199mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物195mgを原料として参考例96と同様の方法にて標記化合物138mgを得た。

MS(ESI)m/z=520.4[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.00(s, 6H) 0.13(s, 6H) 0.82(s, 9H) 0.92(s, 9H) 1.39(d, J=6.59Hz, 3H) 2.42-2.69(m, 2H) 2.73-2.85(m, 2H) 3.78-3.95(m, 1H) 4.77(s, 2H) 4.92(s, 2H) 7.41-7.66(m, 4H)

【0330】

参考例131 3-[(1S)-1-[(2-アミノエチル)アミノ]エチル]フェノールの合成

文献(Journal Medicinal Chemistry, 2004年, 47巻, 2887ページ)に記載の方法にて得られた(S)-1-(3-ヒドロキシフェニル)エチルアミン 400mgを原料として参考例54(3)、(4)と同様の方法にて標記化合物71mgを得た。

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.34(d, J=6.42Hz, 3H) 2.49-2.55(m, 1H) 2.59-2.64(m, 1H) 2.72-2.80(m, 2H) 3.70(q, J=6.57Hz, 1H) 6.68(dd, J=8.02, 2.52Hz, 1H) 6.80(d, J=7.34Hz, 1H) 6.82-6.85(m, 1H) 7.15(t, J=7.79Hz, 1H)

【0331】

参考例132 N-[1-[4-[[t-ブチル(ジメチル)シリル]オキシ]-3,5-ジメトキシフェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

3',5'-ジメトキシ-4'-ヒドロキシアセトフェノン1.00gをジメチルホルムアミド4mlに溶解し、イミダゾール1.04g、t-ブチルジメチルクロロシラン769mgを加えて室温にて10時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液し、有機層を蒸留水で3回洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して粗生成物を得た。これをメタノール20mlに溶解し、エチレンジアミン289mgを加えて室温にて15時間攪拌した。反応液を水素化ホウ素ナトリウム289mgのテトラヒドロフラン懸濁液30mlに加えた後にメタノール6mlを加えて室温にて1.5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、クロロホルムと飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグ

10

20

30

40

50

ラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）により精製して標記化合物417mgを得た。

MS(ESI) m/z =355.3[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.12(s, 6H) 1.01(s, 9H) 1.34(d, J=6.59Hz, 3H) 2.40-2.66(m, 2H) 2.71-2.81(m, 2H) 3.60-3.73(m, 1H) 3.79(s, 6H) 6.50(s, 2H)

【0332】

参考例133 2-アミノ-3-(ジメチルアミノ)プロパン-1-オールの合成

水素化アルミニウムリチウム555mgをテトラヒドロフラン30mlに懸濁させ、加熱還流下4-アザ-DL-ロイシン二塩酸塩2.0gを加えて3時間攪拌した。反応液に蒸留水、15%水酸化ナトリウム水溶液、蒸留水を順に加えて12時間攪拌した。反応液を濾過して得られた濾液を減圧濃縮して標記化合物140mgを得た。

MS(ESI) m/z =119.0[M+H]⁺

¹H-NMR(600MHz, DMSO-d₆) δ (ppm): 2.08-2.16(m, 1H) 2.11(s, 6H) 3.20-3.39(m, 4H)

【0333】

参考例134 1-メチルピロリジン-3-アミンの合成

3-アミノ-1-N-t-ブトキシカルボニル-ピロリジン2.0gを原料として参考例133と同様の方法にて標記化合物240mgを得た。

MS(ESI) m/z =101.0[M+H]⁺

【0334】

参考例135 2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エタンアミンの合成

(1) 1-メチルピペラジン873μlをジメチルホルムアミド20mlに溶解し、N-(2-ブロモエチル)フタルイミド1.0gを加えて室温にて52時間攪拌した。反応液に酢酸エチル、蒸留水を加えて分液し、有機層を蒸留水で2回洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン=100:10:0.2）にて精製してフタルイミド体580mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物580mgをエタノール20mlに溶解し、ヒドラジーン水和物515μlを加えて室温にて24時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して標記化合物90mgを得た。

MS(ESI) m/z =144.0[M+H]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.27(s, 3H) 2.36-2.61(m, 10H) 2.78(t, J=6.19Hz, 2H)

【0335】

参考例136 4-(2-アミノエチル)ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルの合成

N-(2-アミノエチル)ピペラジン4.93gをテトラヒドロフラン40mlに溶解し、トリエチルアミン10.6mlを加えた。氷冷下、クロロギ酸ベンジル4.9mlのテトラヒドロフラン40ml溶液を加えて室温にて1時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと飽和重曹水を加えて分液後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して標記化合物400mgを得た。

MS(ESI) m/z =264.0[M+H]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.37-2.45(m, 6H) 2.79(t, J=6.19Hz, 2H) 3.49-3.53(m, 4H) 5.12(s, 2H) 7.28-7.37(m, 5H)

【0336】

参考例137 (1R,2R)-2-[(5-アミノペンチル)アミノ]-1-(4-ニトロフェニル)プロパン-1,3-ジオールの合成

(1) (1S,2S)-(+)-2-アミノ-1-(4-ニトロフェニル)-1,3-プロパンジオール5.0gをジメチルホルムアミド50mlに溶解し、N-(5-ブロモペンチル)フタルイミド7.8gを加えて70℃にて6時間攪拌した。反応液に酢酸エチル、蒸留水を加えて分液後、有機層を蒸留水で2回洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=40:1:0.1

10

20

30

40

50

）にて精製してフタルイミド体3.0gを得た。

（２）上記（１）で得られた化合物1.0gをエタノール10mlに溶解し、ヒドラジン－水和物340 μ lを加えて4時間加熱攪拌した。反応液を減圧濃縮後、1規定塩酸を加えて攪拌後、濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（NH型、クロロホルム：メタノール＝9：1）により精製して標記化合物130mgを得た。

MS(ESI) m/z =298.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.20-1.56(m, 4H) 2.32-2.77(m, 7H) 3.35(dd, J=11.21, 3.74Hz, 1H) 3.60-3.75(m, 1H) 4.69(d, J=7.03Hz, 1H) 7.59(d, J=8.79Hz, 2H) 8.19(d, J=8.79Hz, 2H)

【0337】

参考例138 (1R,2R)-2-[(6-アミノヘキシル)アミノ]-1-(4-ニトロフェニル)プロパン-1,3-ジオールの合成

（１）(1S,2S)-(+)-2-アミノ-1-(4-ニトロフェニル)-1,3-プロパンジオール5.0g、N-(6-ブロモヘキシル)フタルイミド8.16gを原料として参考例137（１）と同様の方法にてフタルイミド体6.1gを得た。

（２）上記（１）で得られた化合物3.0gを原料として参考例137（２）と同様の方法にて標記化合物1.05gを得た。

MS(ESI) m/z =312.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.19-1.55(m, 6H) 2.25-2.73(m, 7H) 3.37(dd, J=11.21, 3.74Hz, 1H) 3.70(dd, J=11.21, 3.74Hz, 1H) 4.69(d, J=6.59Hz, 1H) 7.59(d, J=8.35Hz, 2H) 8.20(d, J=8.79Hz, 2H)

【0338】

参考例139 (1R,2R)-2-[(2-アミノエチル)アミノ]-1-(4-ニトロフェニル)プロパン-1,3-ジオールの合成

（１）(1S,2S)-(+)-2-アミノ-1-(4-ニトロフェニル)-1,3-プロパンジオール3.0gをジメチルホルムアミド30mlに溶解し、N-(2-ブロモエチル)フタルイミド4.30g、トリエチルアミン2.85gを加えて70℃にて10時間攪拌した。反応液に酢酸エチル、蒸留水を加えて分液後、有機層を蒸留水で2回洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水＝40：1：0.1）にて精製してフタルイミド体1.94gを得た。

（２）上記（１）で得られた化合物1.94gをエタノール100mlに溶解し、ヒドラジン－水和物755mgを加えて10時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮後、1規定塩酸を加えて攪拌後、濾過した。濾液を10%水酸化ナトリウム水溶液で塩基性にしてクロロホルムで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水＝10：1：0.1）により精製して標記化合物1.35gを得た。

MS(ESI) m/z =256.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.64-2.92(m, 5H) 3.33-3.47(m, 1H) 3.67(dd, J=11.65, 3.74Hz, 1H) 4.63(d, J=7.03Hz, 1H) 7.58(d, J=8.35Hz, 2H) 8.21(d, J=9.23Hz, 2H)

【0339】

参考例140 (1R,2R)-2-[(3-アミノプロピル)アミノ]-1-(4-ニトロフェニル)プロパン-1,3-ジオールの合成

(1S,2S)-(+)-2-アミノ-1-(4-ニトロフェニル)-1,3-プロパンジオール3.0gとN-(3-ブロモプロピル)フタルイミド4.53gを原料として参考例139と同様の方法にて標記化合物2.54gを得た。

MS(ESI) m/z =270.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.55-1.74(m, 2H) 2.48-2.90(m, 5H) 3.39(dd, J=11.43, 3.96Hz, 1H) 3.61-3.83(m, 1H) 4.69(d, J=7.03Hz, 1H) 7.59(d, J=8.35Hz, 2H) 8.20(d, J=8.79Hz, 2H)

【0340】

参考例141 (1R,2R)-2-[(4-アミノブチル)アミノ]-1-(4-ニトロフェニル)プロパン-1,3-ジオールの合成

10

20

30

40

50

(1S,2S)-(+)-2-アミノ-1-(4-ニトロフェニル)-1,3-プロパンジオール3.0gとN-(4-ブロモブチル)フタルイミド4.77gを原料として参考例139と同様の方法にて標記化合物2.76gを得た。

MS(ESI) m/z =284.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ (ppm):1.41-1.56(m,4H)2.33-2.76(m,5H)3.37(dd,J=11.43,3.96Hz,1H)3.63-3.76(m,1H)4.69(d,J=7.03Hz,1H)7.59(d,J=8.35Hz,2H)8.20(d,J=8.79Hz,2H)

【0341】

参考例142 N-(2-[[t-ブチル(ジメチル)シリル]オキシ]エチル)-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

(1) 2-エチルアミノエタノール5.0gをジメチルホルムアミド100mlに溶解してイミダゾール22.9g、t-ブチルジメチルクロロシラン16.9gを加えて室温にて16時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液後、有機層を蒸留水で3回洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)にて精製して保護体786mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物410mgとフタルイミドアセトアルデヒド419mgをクロロホルム5mlに溶解し、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム642mgを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=5:1)により精製してフタルイミド体を得た。このフタルイミド体をエタノールに溶解し、ヒドラジン-水和物0.29mlを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して析出した固体を濾別してエタノールで洗浄した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)にて精製して標記化合物294mgを得た。

MS(ESI) m/z =247.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ (ppm):0.06(s,6H)0.90(s,9H)0.94-1.10(m,3H)2.47-2.77(m,8H)3.66(t,J=6.59Hz,2H)

【0342】

参考例143 2-アミノ-1-(4-ニトロフェニル)エタノールの合成

(1) 4-ニトロスクシンイミド2.0gをアセトニトリル-蒸留水(3:2)の混合溶媒50mlに溶解し、N-ブロモスクシンイミド2.63gを加えて室温にて3時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、ジエチルエーテルで抽出し、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をメタノール130mlに溶解し、炭酸カリウム1.5gを加えて室温で4時間攪拌した。蒸留水を加えて減圧濃縮し、酢酸エチルで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してエポキシ体2.67gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物500mgに8規定アンモニアメタノール溶液5mlを加えて室温にて1日間攪拌した。反応液を減圧留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1から10:1:0.1)にて精製して標記化合物221mgを得た。

MS(ESI) m/z =183.0[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz,DMSO-d₆) δ (ppm):2.52-2.80(m,2H)4.51-4.68(m,1H)5.46-5.68(m,1H)7.60(d,J=8.35Hz,2H)8.19(d,J=8.79Hz,2H)

【0343】

参考例144 2-アミノ-3-(4-ニトロフェニル)プロパン-1-オールの合成

水素化アルミニウムリチウム271mgをテトラヒドロフランに懸濁させ、氷冷下、4-ニトロ-DL-フェニルアラニン1.0gを加えて1時間攪拌した。反応液に蒸留水、15%水酸化ナトリウム水溶液、蒸留水を順に加えて12時間攪拌した。反応液を濾過して得られた濾液を減圧濃縮して標記化合物516mgを得た。

MS(ESI) m/z =197.0[M+H]⁺

¹H-NMR(600MHz,DMSO-d₆) δ (ppm):2.50-2.54(m,1H)2.79-2.89(m,2H)3.16-3.27(m,2H)4.64-

4.69(m, 1H)7.47(d, J=8.71Hz, 2H)8.12(d, J=8.71Hz, 2H)

【0344】

参考例145 N-(2-[[t-ブチル(ジメチル)シリル]オキシ]エチル)-N-[(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

(1) (R)-1-(2-メトキシフェニル)エチルアミン250mg、(2-ブロモエトキシ)-t-ブチルジメチルシラン396mgをジメチルホルムアミド5mlに溶解し、100℃にて4時間攪拌した。反応液に飽和重曹水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=60:1:0.1）にて精製して付加体407mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物400mgを原料として参考例54(3)、(4)と同様の方法にて標記化合物268mgを得た。

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.00(s, 6H)0.86(s, 9H)1.31(d, J=7.03Hz, 3H)2.38-2.86(m, 6H)3.40-3.69(m, 2H)3.81(s, 3H)4.38(q, J=6.89Hz, 1H)6.80-6.99(m, 2H)7.11-7.39(m, 2H)

【0345】

参考例146 4-[[2-[[t-ブチル(ジメチル)シリル]オキシ]エチル](エチル)アミノ]ブタン-1-オール

参考例142(1)で得られた化合物1.0gをジメチルホルムアミド50mlに溶解し、炭酸カリウム3.3g、4-ブロモ-1-ブタノール1.13gを加えて100℃にて2時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと蒸留水を加えて分液後、有機層を蒸留水で2回洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=30:1:0.1）にて精製して標記化合物77mgを得た。

MS(ESI)m/z=276.3[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.06(s, 6H)0.89(s, 9H)1.01(t, J=7.03Hz, 3H)1.44-1.72(m, 4H)2.41-2.64(m, 6H)3.40-3.49(m, 2H)3.59-3.72(m, 2H)

【0346】

参考例147 1-アミノ-3-[(2-メトキシフェニル)アミノ]プロパン-2-オール

(1) N-(2,3-エポキシプロピル)フタルイミド800mg、o-アニシジン485mgをエタノール10mlに溶解して加熱還流下6時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=1:1から1:3）にて精製して付加体831mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物816mgを原料として参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物170mgを得た。

MS(ESI)m/z=197.1[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.96-3.44(m, 4H)3.84(s, 3H)4.11-4.30(m, 1H)4.36-4.56(m, 1H)6.56-6.95(m, 4H)

【0347】

参考例148 1-アミノ-3-[エチル[(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エチル]アミノ]プロパン-2-オール

(1) N-(2,3-エポキシプロピル)フタルイミド470mg、特許文献（特開昭54-154724号公報）に記載の方法にて得られた(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エタンアミン350mgを原料として参考例147(1)と同様の方法にて付加体495mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物485mg、アセトアルデヒド334mgを原料として参考例54(3)と同様の方法にてN-エチル体452mgを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物441mgを原料として参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物296mgを得た。

MS(ESI)m/z=253.2[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.86-1.07(m, 3H)1.23-1.38(m, 3H)2.33-2.80(m, 6H)3.45-3.72(m, 1H)3.79-3.90(m, 3H)4.33-4.50(m, 1H)6.82-7.39(m, 4H)

【0348】

10

20

30

40

50

参考例 149 N-(5-アミノペンチル)-2,2-ジクロロアセトアミドの合成

(1) 5-アミノ-1-ペンタノール1.0gをテトラヒドロフラン10mlに溶解し、氷冷下、塩化ジクロロアセチル1.0mlのテトラヒドロフラン溶液10mlを加えて、室温にて1時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=40:1:0.1）にて精製してジクロロアセチル体446mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物445mgをクロロホルム10mlに溶解し、氷冷下、ピリジン10ml、p-トルエンスルホニルクロリド5.94gのクロロホルム溶液20mlを加えて室温にて12時間攪拌した。飽和食塩水、クロロホルムを加えて分液した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン:酢酸エチル=6:1）にて精製してp-トルエンスルホニル体204mgを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物204mgをジメチルホルムアミド2mlに溶解し、カリウムフタルイミド154mgを加えて70℃にて2時間、100℃にて2時間攪拌した。反応液に酢酸エチル、飽和重曹水を加えて分液後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン:酢酸エチル=10:1）にて精製してフタルイミド体160mgを得た。

(4) 上記(3)で得られた化合物160mgをエタノール3mlに溶解し、ヒドラジーン水和物67.8μlを加えて80℃にて4時間加熱攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して標記化合物47mgを得た。

MS(ESI)m/z=213.0[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ (ppm):1.29-1.87(m,6H)2.71(t,J=6.59Hz,2H)3.25-3.42(m,2H)5.95(s,1H)6.85-7.10(m,1H)

【0349】

参考例 150 N-(3-[[t-ブチル(ジメチル)シリル]オキシ]プロピル)-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

(1) N-(2-ブロモエチル)フタルイミド9gをジメチルホルムアミド25mlに溶解し、エチルベンジルアミン5.27g、炭酸カリウム5.39gを加えて100℃にて6時間攪拌した。反応液に2規定塩酸とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液に酢酸エチル-ヘキサン(1:1)の混合溶媒を加えて析出した結晶を減圧乾燥してフタルイミド体8.43gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物485mgを原料として参考例7(3)と同様の方法にて脱ベンジル体1.50gを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物500mgをジメチルホルムアミド10mlに溶解し、(3-ブロモプロポキシ)-t-ブチルジメチルシラン796μl、炭酸カリウム475mgを加えて100℃にて2時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液、酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン:アセトン=10:1）にて精製して付加体387mgを得た。

(4) 上記(3)で得られた化合物387mgを原料として参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物191mgを得た。

MS(ESI)m/z=261.3[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ (ppm):0.01-0.10(m,6H)0.89(s,9H)0.95-1.11(m,3H)1.52-1.75(m,3H)2.40-2.65(m,5H)2.66-2.77(m,2H)3.54-3.73(m,2H)

【0350】

参考例 151 6-(ジメチルアミノ)ヘキサナールの合成

6-ジメチルアミノ-1-ヘキサノール100mgを原料として参考例53(2)と同様の方法にて標記化合物37.8mgを得た。

¹H-NMR(200MHz,CDCl₃) δ (ppm):1.28-1.79(m,6H)2.25-2.61(m,4H)2.36(s,6H)9.72-9.80(m,1H)

【0351】

参考例 152 t-ブチル(ジメチル)[[(1R)-1-メチル-3-オキシラン-2-イルプロピル]オキシ]シランの合成

(1) (R)-(-)-5-ヘキセン-2-オール1gをジメチルホルムアミド10mlに溶解し、氷冷下イミダゾール2.04g、t-ブチルジメチルクロロシラン2.26gを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン:酢酸エチル=40:1）にて精製して保護体1.7gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物1.7gを原料として参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物1.58gを得た。

10

MS(ESI)m/z=253.1[M+Na]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.02-0.05(m, 6H) 0.85-0.88(m, 9H) 1.10-1.15(m, 3H) 1.44-1.68(m, 4H) 2.44-2.47(m, 1H) 2.72-2.75(m, 1H) 2.88-2.93(m, 1H) 3.75-3.87(m, 1H)

【0352】

参考例 153 t-ブチル(ジメチル)[[(1S)-1-メチル-3-オキシラン-2-イルプロピル]オキシ]シランの合成

(S)-(+)-5-ヘキセン-2-オール1gを原料として参考例152(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物1.48gを得た。

MS(ESI)m/z=253.1[M+Na]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.01-0.05(m, 6H) 0.85-0.89(m, 9H) 1.10-1.14(m, 3H) 1.44-1.68(m, 4H) 2.43-2.47(m, 1H) 2.72-2.75(m, 1H) 2.88-2.93(m, 1H) 3.77-3.87(m, 1H)

20

【0353】

参考例 154 3-(オキシラン-2-イルメチル)-1,3-オキサゾリジン-2-オンの合成

(1) 2-オキサゾリジノン3gをアセトン130mlに溶解し、アリルブロミド5.8ml、炭酸セシウム33.7gを加えて60℃にて24時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン:酢酸エチル=1:1）にて精製して付加体4.18gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物4.10gを原料として参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物511mgを得た。

MS(ESI)m/z=143.8[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.54-2.65(m, 1H) 2.79-2.86(m, 1H) 2.97-3.19(m, 2H) 3.55-3.93(m, 3H) 4.29-4.44(m, 2H)

30

【0354】

参考例 155 3-(2-オキシラン-2-イルエチル)-1,3-オキサゾリジン-2-オンの合成

2-オキサゾリジノン2.20g、4-ブロモ-1-ブテン4.42gを原料として参考例154(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物389mgを得た。

MS(ESI)m/z=157.9[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.56-1.82(m, 1H) 1.85-2.09(m, 1H) 2.47-2.61(m, 1H) 2.73-2.86(m, 1H) 2.91-3.06(m, 1H) 3.38-3.54(m, 2H) 3.55-3.74(m, 2H) 4.25-4.47(m, 2H)

【0355】

参考例 156 3-(3-オキシラン-2-イルプロピル)-1,3-オキサゾリジン-2-オンの合成

2-オキサゾリジノン3g、5-ブロモ-1-ペンテン5.3mlを原料として参考例154(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物1.22gを得た。

MS(ESI)m/z=171.8[M+H]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.37-1.59(m, 1H) 1.60-1.84(m, 3H) 2.50(dd, J=4.83, 2.64Hz, 1H) 2.78(d, J=4.83Hz, 1H) 2.89-3.02(m, 1H) 3.27-3.38(m, 2H) 3.51-3.64(m, 2H) 4.24-4.41(m, 2H)

40

【0356】

参考例 157 3-オキシラン-2-イルプロピオン酸ベンジルの合成

(1) 4-ペンテン酸15gをトルエン100mlに溶解して、氷冷下、p-トルエンスルホン酸一水

50

和物1.29g、ベンジルアルコール78mlを加えて加熱還流下3.5時間攪拌した。放冷後、反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=30:1から20:1）にて精製してエステル体37.5gを得た。

（２）上記（１）で得られた化合物6.0gを原料として参考例 2 6 （２）と同様の方法にて標記化合物6.3gを得た。

MS(ESI) m/z =229.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.67-2.11(m, 2H) 2.41-2.61(m, 3H) 2.68-2.79(m, 1H) 2.89-3.06(m, 1H) 5.13(s, 2H) 7.28-7.43(m, 5H)

【 0 3 5 7 】

参考例 1 5 8 5-オキシラン-2-イルペンタンニトリルの合成

10

6-ヘプテンニトリル2.5gを原料として参考例 2 6 （２）と同様の方法にて標記化合物2.91gを得た。

MS(ESI) m/z =148.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.42-1.86(m, 6H) 2.32-2.44(m, 2H) 2.48(dd, J=5.05, 2.86Hz, 1H) 2.77(dd, J=5.27, 3.96Hz, 1H) 2.85-3.01(m, 1H)

【 0 3 5 8 】

参考例 1 5 9 2-[3-(ベンジルオキシ)ブチル]オキシランの合成

（１）5ヘキセン-2-オール2.9gをジメチルホルムアミド55mlに溶解し、氷冷下、水素化ナトリウム1.06gを少しずつ加えて室温にて1時間攪拌した。反応液にベンジルククロライド4.0mを加えて室温にて5時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えてジエチルエーテルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=20:1から10:1）にて精製してベンジルエーテル体5.16gを得た。

20

（２）上記（１）で得られた化合物5.09gを原料として参考例 2 6 （２）と同様の方法にて標記化合物3.21gを得た。

MS(ESI) m/z =229.1[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.17-1.25(m, 3H) 1.46-1.82(m, 4H) 2.37-2.51(m, 1H) 2.68-2.78(m, 1H) 2.84-2.97(m, 1H) 3.47-3.65(m, 1H) 4.37-4.65(m, 2H) 7.16-7.47(m, 5H)

【 0 3 5 9 】

参考例 1 6 0 [3-[(2R)-オキシラン-2-イル]プロピル]カルバミン酸ベンジルの合成

30

（１）5-ブロモ-1-ペンテン25gをジメチルホルムアミド120mlに溶解し、氷冷下、フタルイミドカリウム34.2gを加えて60℃にて2時間攪拌した。析出してきた固体を濾別し、濾液にジエチルエーテルを加えて蒸留水、飽和食塩水にて順次洗浄後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をエタノール200mlに溶解し、氷冷下、ヒドラジン-水和物24.4mlを加えて60℃にて20分間攪拌した。氷冷下、反応液に希塩酸を加えて酸性にして、析出してきた固体を濾別した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣に氷冷下、水酸化カリウムを加えて塩基性にして、クロロホルムで抽出し、有機層を濾過した。濾液に飽和重曹水200mlを加えて氷浴下、ベンジルククロホルメート31.5gを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液をクロロホルムで抽出して、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=1:1）にて精製してカーバメート体9.13gを得た。

40

（２）上記（１）で得られた化合物9.10gを原料として参考例 2 （３）と同様の方法にてジオール体9.39gを得た。

（３）上記（２）で得られた化合物9.39gを原料として参考例 1 と同様の方法にて標記化合物9.38gを得た。

MS(ESI) m/z =258.1[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.39-1.82(m, 3H) 2.35-2.56(m, 2H) 2.65-2.80(m, 1H) 2.84-2.98(m, 1H) 3.14-3.34(m, 2H) 5.01-5.17(m, 2H) 7.14-7.47(m, 5H)

【 0 3 6 0 】

50

参考例 1 6 1 1-(2-オキシラン-2-イルエチル)ピリジン-2(1H)-オンの合成

(1) 2-ヒドロキシピリジン5gを1,4-ジオキサン70mlに溶解し、4-ブromo-1-ブテン5.87ml、炭酸セシウム17.1gを加えて室温にて48時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=1:1）にて精製して付加体5.18gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物3.0gを原料として参考例 2 6 (2)と同様の方法にて標記化合物479mgを得た。

MS(ESI) m/z =188.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.66-1.85(m, 1H) 2.15-2.36(m, 1H) 2.49(dd, J=4.83, 2.64Hz, 1H) 2.79(dd, J=4.83, 3.96Hz, 1H) 2.89-3.04(m, 1H) 4.05-4.16(m, 2H) 6.11-6.22(m, 1H) 6.51-6.62(m, 1H) 7.25-7.40(m, 2H)

10

【0 3 6 1】

参考例 1 6 2 1-(3-オキシラン-2-イルプロピル)ピリジン-2(1H)-オンの合成

(1) 5-ブromo-1-ペンテン5.07mlを原料として参考例 1 6 1 (1)と同様の方法にて付加体3.79gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物3.79gを原料として参考例 2 6 (2)と同様の方法にて標記化合物4.06gを得た。

MS(ESI) m/z =202.0[M+Na]⁺

¹H-NMR(200MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.37-1.58(m, 1H) 1.64-2.04(m, 3H) 2.50(dd, J=5.27, 2.64Hz, 1H) 2.76(dd, J=4.83, 3.96Hz, 1H) 2.91-3.02(m, 1H) 3.86-4.13(m, 2H) 6.10-6.20(m, 1H) 6.52-6.61(m, 1H) 7.29-7.37(m, 2H)

20

【0 3 6 2】

参考例 1 6 3 N-[1-(4-ベンジルオキシ-3-メトキシフェニル)-エチル]-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

(1) 1-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)エタノン1.66gをアセトン100mlに溶解し、炭酸カリウム1.66g、ベンジルブロミド1.4mlを順次加え、室温で21時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、得られた残渣に酢酸エチルと蒸留水を加え分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後濾過した。濾液を減圧濃縮し得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=2:1）にて精製してベンジルエーテル体1.74gを得た。

30

(2) 上記(1)で得られた化合物1.74gを原料として参考例 6 4 (1)、参考例 6 3 (1)、参考例 5 4 (4)と同様の方法にて標記化合物320mgを得た。

MS(ESI) m/z =329[M+H]⁺

【0 3 6 3】

参考例 1 6 4 N-[1-(2,6-ビスベンジルオキシフェニル)-エチル]-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

1-(2,6-ジヒドロキシフェニル)エタノン1.53gを原料として参考例 1 6 3 (1)、参考例 6 4 (1)、参考例 6 3 (1)、参考例 5 4 (4)と同様の方法にて標記化合物325mgを得た。

MS(ESI) m/z =405[M+H]⁺

40

¹H-NMR(400MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.89(t, J=7.30Hz, 3H) 1.46(d, J=7.07Hz, 3H) 2.45-2.60(m, 4H) 2.63-2.73(m, 2H) 4.67(q, J=7.06Hz, 1H) 5.07(s, 4H) 6.62(d, J=8.28Hz, 2H) 7.13(t, J=8.28Hz, 1H) 7.31-7.47(m, 10H)

【0 3 6 4】

参考例 1 6 5 N-[1-(4-エトキシ-3-ピペリジン-1-イルメチルフェニル)-エチル]-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

1-[4-エトキシ-3-(ピペリジン-1-イルメチル)フェニル]エタノン520mgを原料として参考例 6 4 (1)、参考例 6 3 (1)、参考例 5 4 (4)と同様の方法にて標記化合物44.3mgを得た。

MS(FAB) m/z =334[M+H]⁺

50

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.02(t, $J=7.06\text{Hz}$, 3H) 1.32(d, $J=6.58\text{Hz}$, 3H) 1.40(t, $J=7.06\text{Hz}$, 3H) 1.54-1.65(m, 6H) 2.35-2.67(m, 10H) 3.65(s, 2H) 3.84(q, $J=6.82\text{Hz}$, 1H) 4.01(q, $J=6.82\text{Hz}$, 2H) 6.78(d, $J=8.28\text{Hz}$, 1H) 7.15(dd, $J=2.19, 8.52\text{Hz}$, 1H) 7.34(d, $J=1.95\text{Hz}$, 1H)

【0365】

参考例 166 2-[5-[1-[(2-アミノエチル)エチルアミノ]エチル]-2-メトキシフェニル]アセトニトリルの合成

2-(5-アセチル-2-メトキシフェニル)アセトニトリル420mgを原料として参考例64(1)、参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物137mgを得た。

MS(ESI) $m/z=262[\text{M}+\text{H}]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.02(t, $J=7.07\text{Hz}$, 3H) 1.32(d, $J=6.82\text{Hz}$, 3H) 2.37-2.69(m, 6H) 3.68(s, 2H) 3.83(q, $J=6.82\text{Hz}$, 1H) 3.85(s, 3H) 6.83(d, $J=5.12\text{Hz}$, 1H) 7.28(dd, $J=2.19, 8.52\text{Hz}$, 1H) 7.34(d, $J=1.95\text{Hz}$, 1H)

10

【0366】

参考例 167 N-エチル-N-[1-(5-メチルイソオキサゾール-4-イル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-(5-メチルイソオキサゾール-4-イル)エタノン1.0gを原料として参考例64(1)、参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物412mgを得た。

MS(ESI) $m/z=198[\text{M}+\text{H}]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.03(t, $J=7.14\text{Hz}$, 3H) 1.31(d, $J=6.87\text{Hz}$, 3H) 2.28-2.60(m, 4H) 2.42(s, 3H) 2.62-2.75(m, 2H) 2.85(q, $J=6.86\text{Hz}$, 1H) 8.12(s, 1H)

20

【0367】

参考例 168 N-[1-(4-エトキシ-3-モルホリン-4-イルメチルフェニル)エチル]-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

1-[4-エトキシ-3-(モルホリノメチル)フェニル]エタノン527mgを原料として参考例64(1)、参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物177mgを得た。

MS(FAB) $m/z=336[\text{M}+\text{H}]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.01(t, $J=7.14\text{Hz}$, 3H) 1.32(d, $J=6.59\text{Hz}$, 3H) 1.41(t, $J=7.14\text{Hz}$, 3H) 2.32-2.68(m, 10H) 3.57(s, 2H) 3.72(t, $J=4.67\text{Hz}$, 4H) 3.83(q, $J=6.86\text{Hz}$, 1H) 4.02(q, $J=6.86\text{Hz}$, 2H) 6.79(d, $J=8.24\text{Hz}$, 1H) 7.16(dd, $J=2.20, 8.24\text{Hz}$, 1H) 7.32(d, $J=1.92\text{Hz}$, 1H)

30

【0368】

参考例 169 [5-[1-[(2-アミノエチル)エチルアミノ]エチル]チオフエン-2-イル]アセトニトリルの合成

2-(5-アセチルチオフエン-2-イル)アセトニトリル826mgを原料として参考例64(1)、参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物291mgを得た。

MS(FAB) $m/z=238[\text{M}+\text{H}]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.06(t, $J=7.42\text{Hz}$, 3H) 1.36(d, $J=6.87\text{Hz}$, 3H) 2.37-2.60(m, 4H) 2.64-2.82(m, 2H) 3.85(s, 2H) 4.08(q, $J=6.32\text{Hz}$, 1H) 6.70(dd, $J=1.37, 3.57\text{Hz}$, 1H) 6.86-6.89(m, 1H)

【0369】

参考例 170 N-エチル-N-[1-(3-メチルピラジン-2-イル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

40

1-(3-メチルピラジン-2-イル)エタノン0.5gを原料として参考例64(1)、参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物245mgを得た。

MS(ESI) $m/z=209[\text{M}+\text{H}]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.04(t, $J=7.14\text{Hz}$, 3H) 1.38(d, $J=6.59\text{Hz}$, 3H) 2.39-2.71(m, 6H) 2.71(s, 3H) 4.28(q, $J=6.59\text{Hz}$, 1H) 8.34(dd, $J=2.20, 4.89\text{Hz}$, 2H)

【0370】

参考例 171 N-エチル-N-(1-ピリジン-4-イルエチル)エタン-1,2-ジアミンの合成

1-(ピリジン-4-イル)エタノン2.0gを原料として参考例64(1)、参考例63(1)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物439mgを得た。

50

MS(FAB) m/z =194[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.03(t, J=7.14Hz, 3H) 1.34(d, J=6.87Hz, 3H) 2.37-2.61(m, 4H) 2.65-2.74(m, 2H) 3.86(q, J=6.87Hz, 1H) 7.30(d, J=5.77Hz, 2H) 8.53(dd, J=3.02, 4.67Hz, 2H)

【0371】

参考例 172 N-エチル-N-[1-(1-エチル-3-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-(1-エチル-3-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)エタノン0.5gを原料として参考例 64 (1)、参考例 63 (1)、参考例 54 (4)と同様の方法にて標記化合物205mgを得た。

MS(FAB) m/z =225[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.03(t, J=7.15Hz, 3H) 1.25(d, J=6.86Hz, 3H) 1.45(t, J=7.14Hz, 3H) 2.27(s, 3H) 2.35-2.51(m, 4H) 2.59-2.72(m, 2H) 3.89(q, J=6.87Hz, 1H) 4.07(q, J=7.14Hz, 2H) 7.17(s, 1H)

【0372】

参考例 173 N-[1-(2,4-ジメチルオキサゾール-5-イル)エチル]-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

1-(2,4-ジメチルオキサゾール-5-イル)エタノン500mgを原料として参考例 64 (1)、参考例 63 (1)、参考例 54 (4)と同様の方法にて標記化合物260mgを得た。

MS(ESI) m/z =212[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.04(t, J=7.1Hz, 3H) 1.37(d, J=6.9Hz, 3H) 2.11(s, 3H) 2.27-2.41(m, 5H) 2.59-2.74(m, 4H) 3.93(q, J=6.9Hz, 1H)

【0373】

参考例 174 N-[1-[3-(1H-テトラゾール-1-イル)フェニル]エチル]-N-エチルエタン-1,2-ジアミンの合成

1-[3-(1H-テトラゾール-1-イル)フェニル]エタノン565mgを原料として参考例 64 (1)、参考例 63 (1)、参考例 54 (4)と同様の方法にて標記化合物190mgを得た。

MS(FAB) m/z =261[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.05(t, J=7.0Hz, 3H) 1.38(d, J=6.6Hz, 3H) 2.46-2.75(m, 6H) 3.97(q, J=6.6Hz, 1H) 7.49-7.58(m, 3H) 7.79(s, 1H) 9.05(s, 1H)

【0374】

参考例 175 N-エチル-N-[1-(1,3,5-トリメチル-1H-ピラゾール-4-イル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-(1,3,5-トリメチル-1H-ピラゾール-4-イル)エタノン500mgを原料として参考例 64 (1)、参考例 63 (1)、参考例 54 (4)と同様の方法にて標記化合物228mgを得た。

MS(ESI) m/z =225[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.95(t, J=7.0Hz, 3H) 1.30(d, J=6.9Hz, 3H) 2.23(m, 6H) 2.46-2.71(m, 6H) 3.66-3.71(m, 4H)

【0375】

参考例 176 N-エチル-N-[1-(4-モルフォリノフェニル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-(4-モルフォリノフェニル)エタノン1.0gを原料として参考例 64 (1)、参考例 63 (1)、参考例 54 (4)と同様の方法にて標記化合物178mgを得た。

MS(FAB) m/z =278[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.01(t, J=7.1Hz, 3H) 1.30-1.38(m, 3H) 2.34-2.67(m, 6H) 3.13-3.17(m, 4H) 3.79-3.88(m, 5H) 6.86(d, J=8.6Hz, 2H) 7.25(d, J=8.6Hz, 2H)

【0376】

参考例 177 N-エチル-N-[1-[4-(モルフォリノスルフォニル)フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-[4-(モルフォリノスルフォニル)フェニル]エタノン539mgを原料として参考例 64 (1)、参考例 63 (1)、参考例 54 (4)と同様の方法にて標記化合物187mgを得た。

MS(ESI) m/z =342[M+H]⁺

10

20

30

40

50

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.03(t, $J=7.1\text{Hz}$, 3H) 1.36(d, $J=6.6\text{Hz}$, 3H) 2.41-2.62(m, 4H) 2.68(t, $J=6.0\text{Hz}$, 2H) 2.99-3.02(m, 4H) 3.74-3.77(m, 4H) 3.93(q, $J=6.6\text{Hz}$, 1H) 7.55(d, $J=8.2\text{Hz}$, 2H) 7.69(d, $J=8.2\text{Hz}$, 2H)

【0377】

参考例 178 N-エチル-N-[1-(1-エチル-5-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-(1-エチル-5-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)エタノン500mgを原料として参考例 64 (1)、参考例 63 (1)、参考例 54 (4)と同様の方法にて標記化合物73mgを得た。

MS(FAB)m/z=225[M+H] $^+$

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.03(t, $J=7.1\text{Hz}$, 3H) 1.28(d, $J=6.9\text{Hz}$, 3H) 1.39(t, $J=7.2\text{Hz}$, 3H) 2.26(s, 3H) 2.36-2.52(m, 4H) 2.63(t, $J=6.3\text{Hz}$, 2H) 3.87(q, $J=6.9\text{Hz}$, 1H) 4.09(q, $J=7.2\text{Hz}$, 2H) 7.27(s, 1H)

10

【0378】

参考例 179 N-エチル-N-[1-[4-メトキシ-3-[(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イルチオ)メチル]フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-[4-メトキシ-3-[(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イルチオ)メチル]フェニル]エタノン500mgを原料として参考例 64 (1)、参考例 63 (1)、参考例 54 (4)と同様の方法にて標記化合物267mgを得た。

MS(ESI)m/z=351[M+H] $^+$

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 1.00(t, $J=7.1\text{Hz}$, 3H) 1.26(d, $J=6.6\text{Hz}$, 3H) 2.33-2.65(m, 6H) 3.77-3.82(m, 4H) 3.85(s, 3H) 4.53(s, 2H) 6.82(d, $J=8.5\text{Hz}$, 1H) 7.26-7.27(m, 1H) 7.31(d, $J=1.9\text{Hz}$, 1H)

20

【0379】

参考例 180 2-[4-[1-(2-アミノエチルアミノ)エチル]フェノキシ]-N,N-ジエチルアセトアミドの合成

2-(4-アセチルフェノキシ)-N,N-ジエチルアセトアミド250mg、エチレンジアミン400 μl 、酢酸700 μl を原料として、参考例 64 (1)と同様の方法にて標記化合物52.9mgを得た。

MS(FAB)m/z=294[M+H] $^+$

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CD_3OD) δ (ppm): 1.14(t, $J=7.1\text{Hz}$, 3H) 1.24(t, $J=7.1\text{Hz}$, 3H) 1.34(d, $J=6.6\text{Hz}$, 3H) 2.42-2.56(m, 2H) 2.71(t, $J=6.1\text{Hz}$, 2H) 3.38-3.46(m, 4H) 3.70(q, $J=6.6\text{Hz}$, 1H) 4.88(s, 2H) 6.92(d, $J=8.7\text{Hz}$, 2H) 7.26(d, $J=8.7\text{Hz}$, 2H)

30

【0380】

参考例 181 2-[4-[1-(2-アミノエチルアミノ)エチル]フェノキシ]-1-(ピロリジン-1-イル)エタノンの合成

2-(4-アセチルフェノキシ)-1-(ピロリジン-1-イル)エタノン250mg、エチレンジアミン400 μl 、酢酸700 μl を原料として、参考例 64 (1)と同様の方法にて標記化合物163.8mgを得た。

MS(FAB)m/z=292[M+H] $^+$

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CD_3OD) δ (ppm): 1.34(d, $J=6.6\text{Hz}$, 3H) 1.86-2.04(m, 4H) 2.42-2.55(m, 2H) 2.70(t, $J=6.3\text{Hz}$, 2H) 3.45-3.73(m, 5H) 4.70(s, 2H) 6.92(d, $J=8.7\text{Hz}$, 2H) 7.25(d, $J=8.7\text{Hz}$, 2H)

40

【0381】

参考例 182 N-[1-[4-(1H-テトラゾール-1-イル)フェニル]エチル]エタン-1,2-ジアミンの合成

1-[4-(1H-テトラゾール-1-イル)フェニル]エタノン250mg、エチレンジアミン400 μl 、酢酸700 μl を原料として、参考例 64 (1)と同様の方法にて標記化合物60.5mgを得た。

MS(FAB)m/z=233[M+H] $^+$

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CD_3OD) δ (ppm): 1.42(d, $J=6.5\text{Hz}$, 3H) 2.55-2.72(m, 2H) 2.83-2.92(m, 2H) 3.90(q, $J=6.5\text{Hz}$, 1H) 7.64(d, $J=8.5\text{Hz}$, 2H) 7.84(d, $J=8.5\text{Hz}$, 2H) 9.76(s, 1H)

【0382】

参考例 183 4-[1-(2-アミノエチルアミノ)エチル]-2-メトキシフェノールの合成

50

(1) 1-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)エタノン1gをジメチルホルムアミド5mlに溶解し、イミダゾール1.3g、t-ブチルジメチルクロロシラン1gを加え、室温にて4.5時間した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を蒸留水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン:酢酸エチル=10:1）にて精製して1-(4-t-ブチルジメチルシリルオキシ-3-メトキシフェニル)エタノン1.6gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物560mgを原料として参考例96と同様の方法にて標記化合物90.3mgを得た。

MS(ESI)m/z=211[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz, CD₃OD) δ (ppm): 1.35(d, J=6.82Hz, 3H) 2.42-2.57(m, 2H) 2.70(J=6.57Hz, 2H) 3.66(q, J=6.82Hz, 1H) 3.85(s, 3H) 6.73(d, J=0.93Hz, 2H) 6.93(s, 1H)

【0383】

参考例184 6-[1-(2-アミノエチルアミノ)エチル]-3-(t-ブチルジメチルシリルオキシ)-2-メチルフェノールの合成

1-(2,4-ジヒドロキシ-3-メチルフェニル)エタノン1.0gを原料として参考例183(1)、参考例96と同様の方法にて標記化合物103mgを得た。

MS(ESI)m/z=325[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz, CD₃OD) δ (ppm): 0.08(s, 6H) 1.02(s, 9H) 1.38(d, J=6.58Hz, 3H) 2.01(s, 3H) 2.53-2.82(m, 4H) 3.85(q, J=6.82Hz, 1H) 6.25(d, J=8.03Hz, 1H) 6.66(d, J=8.04Hz, 1H)

【0384】

参考例185 6-[1-(2-アミノエチルアミノ)エチル]-2,3-ジメトキシフェノールの合成
1-(2-ヒドロキシ-3,4-ジメトキシフェニル)エタノン200mgを原料として参考例183(1)、参考例96と同様の方法にて標記化合物23.5mgを得た。

MS(ESI)m/z=241[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz, CD₃OD) δ (ppm): 1.40(d, J=6.82Hz, 3H) 2.54-2.82(m, 4H) 3.77(s, 3H) 3.79(s, 3H) 3.94(q, J=6.82Hz, 1H) 6.44(d, J=8.52Hz, 1H) 6.75(d, J=8.76Hz, 1H)

【0385】

参考例186 4-[1-(2-アミノエチルアミノ)エチル]-2-メトキシメチルフェノールの合成

1-[4-ヒドロキシ-3-(メトキシメチル)フェニル]エタノン250mgを原料として参考例183(1)、参考例96と同様の方法にて標記化合物72.9mgを得た。

MS(ESI)m/z=225[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz, CD₃OD) δ (ppm): 1.34(d, J=6.57Hz, 3H) 2.40-2.54(m, 2H) 2.68(t, J=6.58Hz, 2H) 3.39(s, 3H) 3.66(q, J=6.58Hz, 1H) 4.48(s, 2H) 6.75(d, J=8.28Hz, 1H) 7.08(dd, J=2.19, 8.28Hz, 1H) 7.19(d, J=2.20Hz, 1H)

【0386】

参考例187 2-[1-(2-アミノエチルアミノ)エチル]-4-メトキシフェノールの合成

1-(2-ヒドロキシ-5-メトキシフェニル)エタノン363mgを原料として参考例183(1)、参考例96と同様の方法にて標記化合物224mgを得た。

MS(ESI)m/z=325[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz, CD₃OD) δ (ppm): 1.39(d, J=6.82Hz, 3H) 2.51-2.58(m, 2H) 2.62-2.79(m, 2H) 3.70(s, 3H) 3.89(q, J=6.82Hz, 1H) 6.61-6.68(m, 3H)

【0387】

参考例188 2-[1-(2-アミノエチルアミノ)エチル]ベンゼン-1,3-ジオールの合成

1-(2,6-ジヒドロキシフェニル)エタノン329mgを原料として参考例183(1)、参考例96と同様の方法にて標記化合物93.6mgを得た。

MS(ESI)m/z=197[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz, CD₃OD) δ (ppm): 1.37(d, J=6.57Hz, 3H) 2.56-2.82(m, 4H) 4.41(q, J=6.82Hz, 1H) 6.20(d, J=8.04Hz, 2H) 6.84(t, J=8.04Hz, 1H)

【0388】

参考例189 2-(3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)エチルアミンの合成

1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン335mgを原料として参考例54(3)、参考例54(4)と同様の方法にて標記化合物458mgを得た。

MS(FAB)m/z=177[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.60(t, J=5.86Hz, 2H) 2.75(t, J=5.86Hz, 2H) 2.96(q, J=6.35Hz, 4H) 3.64(s, 2H) 6.99-7.04(m, 1H) 7.07-7.15(m, 3H)

【0389】

参考例190 (S)-N-[1-(2-メトキシフェニル)エチル]-2-ニトロ-N-(4-オキソブチル)ベンゼンスルホンアミドの合成

(1) 特許文献(特開昭54-154724号公報)に記載の方法で得られた(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エタンアミン2.45gをジクロロメタン20mlに溶解し、氷冷下オルトニトロベンゼンスルホンクロリド3.52g、トリエチルアミン2.64mlを加えて氷冷にて1時間攪拌した。反応液に1規定塩酸、クロロホルムを加え分液後、有機層を飽和食塩水にて洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過した。濾液を減圧濃縮し、保護体4.91gを粗生成物として得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物3.00gをジメチルホルムアミド45mlに溶解し、5-ブromo-1-ペンタン1.58ml、ヨウ化ナトリウム0.266g、炭酸カリウム2.46gを加えて80℃にて4時間、さらに100℃にて3時間攪拌した。放冷後、反応液に蒸留水、クロロホルム、飽和食塩水を加え分液後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル)にて精製してN-ペンテニル体2.32gを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物567mgをアセトン/蒸留水=3/111mlに溶解し、4wt%四酸化オスミウム水溶液445μl、過ヨウ素酸ナトリウム1.05gを加えて室温にて30分間攪拌した。反応液に飽和食塩水、クロロホルムを加え分液後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル)にて精製して標記化合物293mgを得た。

MS(ESI)m/z=407[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.67-1.92(m, 5H) 2.34-2.51(m, 2H) 3.19-3.41(m, 2H) 3.45(s, 3H) 5.30(q, J=7.2Hz, 1H) 6.67(d, J=8.1Hz, 1H) 6.92(t, J=7.5Hz, 1H) 7.19-7.25(m, 1H) 7.37(d, J=7.5Hz, 1H) 7.43-7.60(m, 3H) 7.66(d, J=8.1Hz, 1H) 9.64(s, 1H)

【0390】

参考例191 (S)-4-[エチル[1-(2-メトキシフェニル)エチル]アミノ]ブタン酸の合成

参考例190で得られた化合物100mgをt-ブタノール-蒸留水-テトラヒドロフラン(2.4:0.6:0.4)3.4mlに溶解し2-メチル-2-ブテン115μl、リン酸二水素ナトリウム38.4mg、80%亜塩素酸ナトリウム94.5mgを順次加え、室温で1.5時間攪拌した。反応液に1規定塩酸を加え、pHを2に調節し、酢酸エチルで抽出した。有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液で洗浄し有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後濾過した。濾液を減圧濃縮し得られた残渣を分取薄層クロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール=10:1)にて精製して標記化合物93.9mgを得た。

MS(ESI)m/z=423[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.71(d, J=7.14Hz, 3H) 1.73-1.96(m, 2H) 2.21-2.48(m, 2H) 3.20-3.49(m, 2H) 3.45(s, 3H) 5.32(q, J=7.14Hz, 1H) 6.67(d, J=8.25Hz, 1H) 6.87-6.94(m, 1H) 7.18-7.26(m, 1H) 7.34-7.40(m, 1H) 7.41-7.62(m, 3H) 7.67(dd, J=1.38, 7.97Hz, 1H)

【0391】

参考例192 2-[エチル(4-ヒドロキシブチル)アミノ]-N,N-ジメチルプロパンアミドの合成

(1) 4-(t-ブチルジメチルシリルオキシ)-1-ブタノール12.5gをジクロロメタン250mlに溶解しモレキュラシーブス4A79g、ピリジニウムクロロクロメート15.8gを加え、室温で2時間攪拌した。反応液にジエチルエーテル250mlを加えフロリジル79gを加えた後、反応液

10

20

30

40

50

をセライト濾過した。濾液を減圧濃縮し得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=50：1）にて精製してアルデヒド体2.98gを得た。

（2）アラニンメチルエステル塩酸塩350mgをクロロホルムに加え、トリエチルアミン350 μ l、上記（1）で得られた化合物1.01g、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム0.5gを順次加え、室温で19時間攪拌した後、反応液にアセトアルデヒド710 μ l、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム638mgを加え室温で2.5時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過した。濾液を減圧濃縮し得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=50:1から15:1）にて精製してアミン体233mgを得た。

（3）上記（2）で得られた化合物233mgをメタノール4.7mlに溶解し、1規定水酸化カリウム水溶液1.47mlを加え室温で13時間攪拌した後、さらに40℃で3.5時間攪拌した。反応液を室温まで放冷し、1規定塩酸を加えpHを7に調節後反応液を減圧濃縮した。得られた残渣をテトラヒドロフラン-蒸留水（1：1）4.48mlに溶解し、氷冷下トリエチルアミン206 μ l、クロロギ酸イソブチル107 μ lを加え20分攪拌した。反応液に50%ジメチルアミン水溶液773 μ lを加え室温まで昇温し、1時間攪拌した。反応液に飽和重曹水、クロロホルムを加えて分液し、有機層を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール=100：1から20:1）にて精製してジメチルアミド体50.4mgを得た。

（4）上記（3）で得られた化合物50.4mgをテトラヒドロフラン1.0mlに溶解し、フッ化水素-ピリジン錯体11.9 μ lを加えて室温にて8.5時間攪拌した。反応液に飽和重曹水及びクロロホルムを加えて分液し、有機層を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール=100:1から5:1）にて精製して標記化合物31.1mgを得た。

MS(CI) m/z =217[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.07(t, J=7.14Hz, 3H) 1.18(d, J=6.87Hz, 3H) 1.48-1.64(m, 4H) 2.42-2.70(m, 4H) 2.95(s, 3H) 3.13(s, 3H) 3.56-3.62(m, 2H) 3.85(q, J=6.60Hz, 1H)

【0392】

参考例193 (S)-2-[エチル[1-(2-メトキシフェニル)エチル]アミノ]エタノールの合成

（1）特許文献（特開昭54-154724号公報）に記載の方法で得られた(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エタンアミン0.25gをクロロホルムに溶解し、氷冷下2-(*t*-ブチルジメチルシリルオキシ)アセトアルデヒド0.35ml、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム0.42gを加えて氷冷にて1時間攪拌した後、室温にて2時間攪拌した。反応液にアセトアルデヒド0.173ml、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム0.79gを加えて室温にて終夜攪拌した。反応液に飽和重曹水、クロロホルムを加え分液後、有機層を飽和食塩水にて洗浄した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール=8:1）にて精製して3級アミン体73.5mgを得た。

【0393】

（2）上記（1）で得られた化合物73.5mgをテトラヒドロフラン1.5mlに溶解し、フッ化水素-ピリジン錯体55 μ lを加え、室温にて1.5時間攪拌した。反応液に飽和重曹水、クロロホルムを加え分液後、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール=5:1）にて精製して標記化合物44.2mgを得た。

MS(ESI) m/z =224[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.95(t, J=7.2Hz, 3H) 1.32(d, J=6.9Hz, 3H) 2.53(q, J=7.2Hz, 2H) 2.58-2.73(m, 2H) 2.94(br, 1H) 3.43-3.60(m, 2H) 3.84(s, 3H) 4.42(q, J=6.9Hz, 1H) 6.87-6.96(m, 2H) 7.21-7.30(m, 2H)

【0394】

参考例194 (S)-N-(1-(2-メトキシフェニル)エチル)-1H-イミダゾール-1-カルボキサミドの合成

10

20

30

40

50

特許文献（特開昭54-154724号公報）に記載の方法にて得られた(S)-1-(2-メトキシフェニル)エタンアミン100mgをジメチルホルムアミド0.65mlに溶解し、N,N'-カルボニルジイミダゾール321mgを加え、室温にて1時間攪拌した。反応液に蒸留水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を蒸留水、飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した後、濾液を減圧濃縮して標記化合物147mgを得た。

MS(ESI) m/z =246[M+H]⁺

【0395】

参考例195 (S)-2-[エチル[1-(2-メトキシフェニル)エチル]アミノ]酢酸2,2,2-トリフルオロ酢酸塩の合成

(1) 参考例190(1)で得られた化合物101mgをジメチルホルムアミド2mlに溶解し、
10
ブromo酢酸t-ブチル70.2mg、ヨウ化カリウム59.8mg、炭酸カリウム62.2mgを加え、アルゴン雰囲気下、80℃にて20時間攪拌した後、さらに100℃にて2日間攪拌した。反応液に蒸留水、酢酸エチルを加え分液後、有機層を飽和食塩水にて洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=4:1）にて精製してエステル体65.1mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物152mgをジメチルホルムアミド2mlに溶解し、チオフェノール172μl、炭酸カリウム233mgを加え、アルゴン雰囲気下、室温にて22時間攪拌した。
20
。反応液に蒸留水、酢酸エチルを加え分液後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=4:1）にて精製して脱保護体86mgを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物26.5mgを原料として、参考例193(1)と同様の方法にて、3級アミン体を粗生成物として得た。得られた化合物を、ジクロロメタン1mlに溶解し、トリフルオロ酢酸0.5mlを加え、室温にて20時間攪拌した後、反応液を減圧濃縮して標記化合物24.9mgを得た。

¹H-NMR(400MHz,CDCl₃) δ(ppm):1.48(t,J=7.3Hz,3H)1.71(d,J=7.1Hz,3H)3.31(q,J=7.3Hz,2H)3.79(d,J=16.8Hz,1H)3.91(d,J=16.8Hz,1H)4.03(s,3H)4.85(q,J=7.1Hz,1H)7.03(d,J=8.5Hz,1H)7.10-7.13(m,1H)7.24-7.26(m,1H)7.46-7.52(m,1H)

【0396】

参考例196 (S)-N-[1-(2-メトキシフェニル)エチル]-2-ニトロ-N-(4-オキシプロピル)ベンゼンスルホンアミドの合成

参考例190(1)で得られた化合物336mgと4-ブromo-1-ブテン504μlを原料として参考例190(2)、(3)と同様の方法にて標記化合物104mgを得た。

MS(ESI) m/z =393[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz,CDCl₃) δ(ppm):1.61(t,J=7.2Hz,3H)2.36-2.47(m,1H)2.68-2.79(m,1H)3.52(s,3H)3.61-3.67(m,2H)5.41(q,J=7.2Hz,1H)6.73(d,J=8.1Hz,1H)6.91(dt,J=7.5,0.9Hz,1H)7.22-7.33(m,2H)7.48-7.61(m,3H)7.70(dd,J=7.8,1.2Hz,1H)9.57(s,1H)

【0397】

参考例197 (S)-2-アミノ-3-(4-メトキシフェニル)プロパン-1-オール

(1) アルゴン雰囲気下で氷冷したテトラヒドロフラン15mlに水素化リチウムアルミニウム512mgを懸濁させ(S)-2-t-ブトキシカルボニルアミノ-3-(4-メトキシフェニル)プロパン酸1.0gを加え30分間攪拌した後、室温まで昇温し3時間攪拌した。反応液を再び氷冷し、蒸留水512μl、15%水酸化ナトリウム水溶液512μl、蒸留水1.54mlを順次加え30分攪拌し反応液をセライト濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=4:1から3:2）にて精製してアルコール体718mgを得た。
40

(2) 上記(1)で得られた化合物718mgをジオキサン-メタノール(3.5:1)4.5mlに溶解し、氷冷下4規定塩酸ジオキサン溶液3.59mlを加え1.5時間攪拌した後、室温まで昇温して2時間攪拌した。反応液にジエチルエーテル-ヘキサン(1:1)14mlを加え析出した固体を濾取した。得られた濾物をクロロホルム-メタノール(10:1)20mlに懸濁させ、NHシリカゲル濾過した後、濾液を減圧濃縮して標記化合物315mgを得た。
50

MS(CI) $m/z=182[M+H]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ (ppm): 2.47(dd, $J=8.49, 13.64\text{Hz}$, 1H) 2.70(dd, $J=5.36, 13.64\text{Hz}$, 1H) 3.04-3.12(m, 1H) 3.37(dd, $J=7.31, 10.72\text{Hz}$, 1H) 3.63(dd, $J=3.90, 10.47\text{Hz}$, 1H) 3.80(s, 3H) 6.8 4-6.88(m, 2H) 7.04-7.14(m, 2H)

【0398】

参考例 198 2-ヒドロキシ-2-(4-メトキシフェニル)エチルアミンの合成

2-アミノ-4'-メトキシアセトフェノン塩酸塩500mgをメタノール10mlに溶解し、水素化ホウ素ナトリウム188mgを加え室温にて2時間攪拌した。反応液に水素化ホウ素ナトリウム18 8mgを加え、さらに30分間攪拌した。反応液に5規定水酸化ナトリウム水溶液1mlを加え、1 0分間攪拌した後、クロロホルムを加えて分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水 10 硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した後、濾液を減圧濃縮して標記化合物240mgを得た。

MS(FAB) $m/z=168[M+H]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ (ppm): 2.80(dd, $J=7.8, 12.7\text{Hz}$, 1H) 2.98(dd, $J=4.1, 7.8\text{Hz}$, 1H) 3.81(s, 3H) 4.59(dd, $J=4.1, 7.8\text{Hz}$, 1H) 6.89(m, 2H) 7.28(m, 2H)

【0399】

参考例 199 2-(ベンジルオキシ)エチルオキシラン-2-イルエチルカーバメートの合成

(1) アリルイソシアネート2.38gをトルエン29mlに溶解し、ベンジルオキシエタノール4 .1ml、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン963mgを加え、室温にて5時間攪拌した。反応 液に蒸留水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を蒸留水、飽和食塩水で順次洗浄後、無 水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカ 20 ラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=10:1から5:1)にて精製して2-(ベンジル オキシ)エチルアリルカーバメート5.1gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物5.1gを原料として参考例 26(2)と同様の方法にて 標記化合物4.86gを得た。

MS(FAB) $m/z=252[M+H]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 2.60(dd, $J=2.47, 4.67\text{Hz}$, 1H) 2.78(t, $J=4.40\text{Hz}$, 1H) 3.07-3.1 4(m, 1H) 3.26(ddd, $J=5.22, 6.32, 4.8\text{Hz}$, 1H) 3.55-3.65(m, 1H) 3.66(t, $J=4.67\text{Hz}$, 2H) 4.26(t, $J= 4.67\text{Hz}$, 2H) 4.56(s, 2H) 7.22-7.40(m, 5H)

【0400】

参考例 200 プロパルギルオキシラン-2-イルメチルカーバメートの合成 30

アリルイソシアネート2.40gとプロパルギルアルコール1.7mlを原料として参考例 199 (1)、参考例 26(2)と同様の方法にて標記化合物3.35gを得た。

MS(FAB) $m/z=155[M+H]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 2.49(t, $J=2.47\text{Hz}$, 1H) 2.62(dd, $J=2.75, 4.67\text{Hz}$, 1H) 2.81(t, $J= 4.67\text{Hz}$, 1H) 3.09-3.17(m, 1H) 3.23-3.35(m, 1H) 3.58-3.70(m, 1H) 4.69(d, $J=2.20\text{Hz}$, 2H) 5.00- 5.20(m, 1H)

【0401】

参考例 201 2-(6-t-ブチルジメチルシリルオキシヘキシル)オキシランの合成

7-オクテン-1-オール5.0gを原料として参考例 183(1)、参考例 26(2)と同様の 方法にて標記化合物7.9gを得た。 40

MS(CI) $m/z=259[M+H]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ (ppm): 0.05(s, 6H) 0.89(s, 9H) 1.29-1.58(m, 10H) 2.46(dd, $J=2.68, 5 .12\text{Hz}$, 1H) 2.75(dd, $J=4.14, 5.11\text{Hz}$, 1H) 2.87-2.95(m, 1H) 3.60(t, $J=6.82\text{Hz}$, 2H)

【0402】

参考例 202 2-(5-t-ブチルジメチルシリルオキシペンチル)オキシランの合成

6-ヘプテン-1-オール5.0gを原料として参考例 183(1)、参考例 26(2)と同様の 方法にて標記化合物8.74gを得た。

MS(CI) $m/z=245[M+H]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ (ppm): 0.05(s, 6H) 0.89(s, 9H) 1.34-1.58(m, 8H) 2.47(dd, $J=2.68, 5 .11\text{Hz}$, 1H) 2.75(dd, $J=4.14, 5.11\text{Hz}$, 1H) 2.87-2.94(m, 1H) 3.61(t, $J=6.58\text{Hz}$, 2H) 50

【0403】

参考例203 2-[(1-トリエチルシリルオキシシクロヘキシル)メチル]オキシランの合成
 (1) 1-アリルシクロヘキサノール5.0gをジクロロメタン50mlに溶解し、氷冷下2,6-ルチジン4.98ml、トリフルオロメタンスルホン酸トリエチルシリル8.06mlを加え、2時間攪拌した後、室温にて12時間攪拌した。反応液に10%クエン酸水溶液とヘキサンを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した後、濾液を減圧濃縮してトリエチルシリル体8.9gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物8.9gを原料として参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物8.52gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ (ppm): 0.61(q, $J=7.80\text{Hz}$, 6H) 0.96(t, $J=7.04\text{Hz}$, 9H) 1.29-1.45(m, 4H) 1.49-1.83(m, 8H) 2.46(dd, $J=2.68, 5.11\text{Hz}$, 1H) 2.78(t, $J=4.14\text{Hz}$, 1H) 3.08-3.14(m, 1H)

10

【0404】

参考例204 2-(2-トリエチルシリルオキシ-2-フェニルプロピル)オキシランの合成
 2-フェニル-4-ペンテン-2-オール2.5gを原料として参考例203(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物1.63gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ (ppm): 0.54-0.66(m, 6H) 0.90-0.98(m, 9H) 1.70-1.76(m, 3H) 1.81-1.91(m, 1H) 1.94-2.10(m, 1H) 2.13-2.41(m, 1H) 2.53-2.65(m, 1H) 2.71-3.07(m, 1H) 7.20-7.49(m, 5H)

【0405】

参考例205 2-(2-トリエチルシリルオキシ-2-メチルブチル)オキシランの合成
 3-メチル-5-ヘキセン-3-オール2.5gを原料として参考例203(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物4.23gを得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) δ (ppm): 0.05-0.63(m, 6H) 0.85-0.99(m, 12H) 1.23-1.31(m, 3H) 1.51-1.72(m, 4H) 2.43-2.47(m, 1H) 2.75-2.80(m, 1H) 3.03-3.12(m, 1H)

【0406】

参考例206 2-O-t-ブチルジメチルシリル-1-(オキシラン-2-イル)プロパン-2-オールの合成

(1) 4-ペンテン-2-オール5.0gを原料として参考例183(1)と同様の方法にて2-O-t-ブチルジメチルシリル-4-ペンテン-2-オール8.4gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物6.0gを原料として参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物6.13gを得た。

30

MS(FAB)m/z=252[M+H]⁺

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 0.06-0.14(m, 6H) 0.90and0.91(s, 9H) 1.19and1.23(d, $J=6.04\text{Hz}$, 3H) 1.45-1.61(m, 1H) 1.65-1.81(m, 1H) 2.45-2.54(m, 1H) 2.74-2.84(m, 1H) 2.89-3.08(m, 1H) 3.88-4.12(m, 1H)

【0407】

参考例207 1,2-ジ-O-t-ブチルジメチルシリル-4-(オキシラン-2-イル)ブタン-1,2-ジオールの合成

5-ヘキセン-1,2-ジオール5.0gを原料として参考例183(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物8.00gを得た。

40

MS(ESI)m/z=361[M+H]⁺

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 0.07(s, 6H) 0.08(s, 6H) 0.89(s, 9H) 0.91(s, 9H) 1.45-1.85(m, 4H) 2.45-2.51(m, 1H) 2.76(t, $J=4.40\text{Hz}$, 1H) 2.89-2.97(m, 1H) 3.36-3.45(m, 1H) 3.50-3.58(m, 1H) 3.65-3.76(m, 1H)

【0408】

参考例208 (S)-(オキシラン-2-イルメチル)カルバミン酸アリルの合成

(1) (S)-3-アミノ-1,2-プロパンジオール2.9gを原料として参考例30(1)と同様の方法にてカーバメート体1.15gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物1.15gをクロロホルムに溶解し、ピリジン1.9ml、p-トルエンスルホンクロリド1.50gを加え、室温にて4.5時間攪拌した。反応液にp-トルエン

50

スルホニルクロリド125mgを加えてさらに室温にて1.5時間攪拌した。反応液に2規定塩酸を加えて分液し、有機層を飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をメタノール15mlに溶解し、1規定ナトリウムメトキシドのメタノール溶液15.2mlを加えて氷冷下1.5時間攪拌した。反応液に20%塩化アンモニウム水溶液を加えてメタノールを減圧留去した。濃縮液に酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=4:1から3:1）にて精製して標記化合物670mgを得た。

MS(FAB)m/z=158[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.62(dd, J=2.75, 4.67Hz, 1H) 2.80(dd, J=3.85, 4.67Hz, 1H) 3.05-3.20(m, 1H) 3.20-3.35(m, 1H) 3.50-3.70(m, 1H) 4.58(d, J=5.77Hz, 2H) 4.82-5.07(m, 1H) 5.17-5.40(m, 2H) 5.83-6.02(m, 1H)

【0409】

参考例209 (S)-2-アシルオキシランの合成

(S)-エピクロロヒドリン5.0gを原料として文献(Journal of American Chemical Society, 2004年, 126巻, 2495ページ)記載の方法にて標記化合物1.05gを得た。

MS(EI)m/z=84[M]⁺

¹H-NMR(400MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.27-2.40(m, 2H) 2.52(dd, J=2.68, 4.87Hz, 1H) 2.77(dd, J=4.14, 4.87Hz, 1H) 2.97-3.03(m, 1H) 5.09-5.21(m, 2H) 5.78-5.89(m, 1H)

【0410】

参考例210 2-(2-t-ブチルジメチルシリルオキシベンジル)オキシランの合成

2-アシルフェノール4.0gを原料として参考例183(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物6.3gを得た。

MS(EI)m/z=265[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.25(s, 3H) 0.26(s, 3H) 1.02(s, 9H) 2.53(dd, J=2.68, 4.87Hz, 1H) 2.72-2.79(m, 2H) 2.98(dd, J=5.36, 14.37Hz, 1H) 3.17-3.23(m, 1H) 6.81(dd, J=1.22, 8.28Hz, 1H) 6.88-6.94(m, 1H) 7.09-7.15(m, 1H) 7.21(dd, J=1.71, 7.55Hz, 1H)

【0411】

参考例211 2-[(オキシラン-2-イル)エチル]カルバミン酸アシルの合成

(1) 氷冷下メタノール240ml中にアセチルクロリド2.6mlを加え10分間攪拌した後、(S)-4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-ヒドロキシブタン酸30gを加え、氷冷から徐々に室温に昇温して16.5時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えてメタノールを減圧留去した。濃縮液に酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣にジクロロメタンを加え溶解し、モレキュラシープス4A140g、ピリジニウムクロクロメート30.7gを加えた。室温にて2.5時間攪拌後、さらにピリジニウムクロクロメート21.1gを加えて室温にて3.5時間攪拌した。反応液にジエチルエーテル、フロリジルを加え、減圧下セライト濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=3:1から1:2）にて精製して4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-オキソブタン酸メチルエステル17gを得た。

(2) 水素化ホウ素リチウム4.51gのジエチルエーテル350ml懸濁液に氷冷下、上記(1)で得られた化合物16.5gのジエチルエーテル150ml溶液を加えた後、室温にて20時間攪拌した。反応液に20%塩化アンモニウム水溶液、濃塩酸20mlを加え、室温にて20分間攪拌した後、炭酸水素ナトリウムでアルカリ性とした。有機層と水層を分離し、水層から酢酸エチルで2回抽出した。有機層を合わせて無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール=70:1から10:1）にて精製して1,2-ジオール体11.3gを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物11.6gをメタノール120mlに溶解し、10%パラジウム-炭素580mgを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて16時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮して4-アミノ-1,2-ブタンジオール6.10gを得た。

(4) 上記(3)で得られた化合物3.0gを原料として参考例30(1)と同様の方法にてカーバメート体3.40gを得た。

(5) 上記(4)で得られた化合物3.40gを原料として参考例208(2)と同様の方法にて標記化合物1.65gを得た。

MS(ESI)m/z=172[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 1.54-1.68(m, 1H) 1.88-2.04(m, 1H) 2.53(dd, J=2.75, 4.67Hz, 1H) 2.79(t, J=4.95Hz, 1H) 2.95-3.05(m, 1H) 3.28-3.46(m, 2H) 4.57(d, J=5.22Hz, 2H) 5.04(brs, 1H) 5.17-5.28(m, 2H) 5.84-6.01(m, 1H)

参考例212 2-メトキシ-4-(オキシラン-2-イルメチル)フェニルアセテートの合成

10

4-アリル-2-メトキシフェニルアセテート5.0gを原料として参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物5.2gを得た。

MS(GC)m/z=222[M]⁺

¹H-NMR(400MHz, CDCl₃) δ (ppm): 2.32(s, 3H) 2.56(dd, J=2.68, 4.88Hz, 1H) 2.81-2.90(m, 3H) 3.14-3.18(m, 1H) 3.84(s, 3H) 6.82-6.87(m, 2H) 6.97(d, J=8.08Hz, 1H)

【0412】

参考例213 2-(2-t-ブチルジメチルシリルオキシ-2-フェニルエチル)オキシランの合成

1-フェニル-3-ブテン-1-オール2.5gを原料として参考例183(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物4.43gを得た。

20

MS(CI)m/z=278[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz, CDCl₃) δ (ppm): -0.15-0.11(m, 3H) 0.02-0.08(m, 3H) 0.87-0.92(m, 9H) 1.61-1.81(m, 1H) 1.90-2.10(m, 1H) 2.41-2.48(m, 1H) 2.65-2.81(m, 1H) 2.82-3.19(m, 1H) 4.83-4.93(m, 1H) 7.21-7.37(m, 1H)

【0413】

参考例214 2-(2-t-ブチルジメチルシリルオキシヘキシル)オキシランの合成

1-オクテン-4-オール10.0gを原料として参考例183(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物18.25gを得た。

MS(CI)m/z=259[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.04-0.10(m, 6H) 0.86-0.94(m, 12H) 1.22-1.38(m, 4H) 1.45-1.76(m, 4H) 2.44-2.52(m, 1H) 2.74-2.82(m, 1H) 3.00-3.08(m, 1H) 3.82-3.92(m, 1H)

30

【0414】

参考例215 2-(2-t-ブチルジメチルシリルオキシ-3-メチルブチル)オキシランの合成

2-メチル-5-ヘキセン-3-オール10.0gを原料として参考例183(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物18.6gを得た。

MS(CI)m/z=244[M]⁺

¹H-NMR(400MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.04-0.11(m, 6H) 0.83-0.93(m, 15H) 1.45-1.66(m, 2H) 1.74-1.86(m, 1H) 2.43-2.54(m, 1H) 2.74-2.83(m, 1H) 2.98-3.06(m, 1H) 3.61-3.76(m, 1H)

【0415】

参考例216 2-(2-t-ブチルジメチルシリルオキシペンチル)オキシランの合成

40

1-ヘプテン-4-オール10.0gを原料として参考例183(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物16.1gを得た。

MS(CI)m/z=245[M+H]⁺

¹H-NMR(400MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.04-0.09(m, 6H) 0.86-0.94(m, 12H) 1.25-1.76(m, 6H) 2.43-2.52(m, 1H) 2.74-2.83(m, 1H) 2.99-3.08(m, 1H) 3.81-3.92(m, 1H)

【0416】

参考例217 1-O-t-ブチルジメチルシリル-4-メトキシ-2-(オキシラン-2-イルメチル)フェノールの合成

2-アリル-4-メトキシフェノール1.0gを原料として参考例183(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物600mgを得た。

50

MS(GC)m/z=294[M]⁺

¹H-NMR(400MHz,CDCl₃) δ (ppm):2.31-2.35(m,1H)2.48-2.58(m,2H)2.67-2.75(m,1H)2.95-3.01(m,1H)3.55(s,3H)6.46(dd,J=3.43,8.08Hz,1H)6.52(d,J=8.08Hz,1H)6.58(d,J=3.43Hz,1H)

【0417】

参考例218 1-0-t-ブチルジメチルシリル-1-(4-メトキシフェニル)-2-(オキシラン-2-イル)エタノールの合成

1-(4-メトキシフェニル)-3-ブテン-1-オール4.0gを原料として参考例183(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物5.4gを得た。

MS(GC)m/z=293[M-15]⁺

¹H-NMR(400MHz,CDCl₃) δ (ppm):2.31-2.35(m,1H)2.48-2.58(m,2H)2.67-2.75(m,1H)2.95-3.01(m,1H)3.55(s,3H)6.46(dd,J=3.43,8.08Hz,1H)6.52(d,J=8.08Hz,1H)6.58(d,J=3.43Hz,1H)

【0418】

参考例219 4-(オキシラン-2-イル)ブタン酸ベンジルの合成

5-ペンテン酸5.0gを原料として参考例25(1)、参考例26(2)と同様の方法にて標記化合物10.0gを得た。

MS(GC)m/z=220[M]⁺

【0419】

参考例220 2-(2-メトキシフェニル)プロパン-1-アミンの合成

(1) 2-(2-メトキシフェニル)アセトニトリル 2.0gを無水テトラヒドロフラン 40mlに溶解し、アルゴン雰囲気下、-78℃にてリチウムヘキサメチルジシラジドの1Mヘキサン溶液 14.3mlを加えた。-78℃にて1時間攪拌後、ヨードメタン 0.89mlを加え、-78℃にて1.5時間、室温まで昇温しながら終夜攪拌した。反応液に0.2規定塩酸を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=24:1から3:1)にて精製してメチル体 2.13gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物 1.00gを無水テトラヒドロフラン 30mlに溶解し、アルゴン雰囲気下、ボランジメチルスルフィド錯体の2Mテトラヒドロフラン溶液 4.31mlを加え、加熱還流下3時間攪拌した。反応液に濃塩酸を加え、減圧濃縮して得られた残渣をクロロホルムに溶解し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。濾液を減圧濃縮してアミン塩酸塩を 1.39g得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物636mgをジクロロメタン 10mlに溶解し、NHシリカゲル(フジシリシア製)に吸着させた後、酢酸エチルで溶出した。濾液を減圧濃縮して濃縮中に析出した沈殿物を濾取して標記化合物 99.5mgを得た。

MS(EI) m/z= 165 [M]⁺

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ (ppm) : 1.40 (d, J=7.06 Hz, 3 H) 3.08 (dd, J=7.79, 12.42 Hz, 1 H) 3.19 (dd, J=6.82, 12.66 Hz, 1 H) 3.48 Ó3.59 (m, 1 H) 3.85 (s, 3 H) 6.88 (d, J=8.28 Hz, 1 H) 6.89 Ó6.94 (m, 1 H) 7.17 Ó7.26 (m, 2 H)

【0420】

実施例1~6の合成 それぞれの実施例で規定したR、R'をもつ、式(A)で示される化合物の製造法を以下に示す。

【0421】

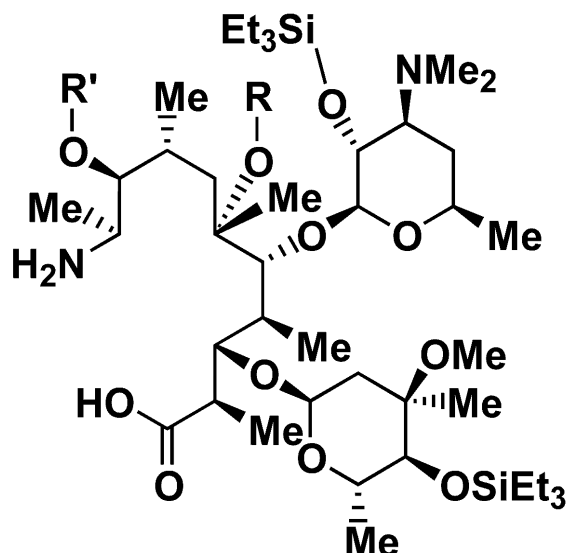
10

20

30

40

【化 1 9】



式 (A)

【 0 4 2 2 】

実施例 1 式 (A) で R=メチル、R'=トリエチルシリルの化合物の合成

(1) (9S)-9,2',4',4'-O-トリス(トリエチルシリル)-9-ジヒドロ-6-O-メチルエリスロマイシンA200gをクロロホルム400mlに溶解し、氷冷下、90%四酢酸鉛90.2gを加えて10分間攪拌した。さらに2-メチル-2-ブテン51.3gのテトラヒドロフラン溶液800ml、t-ブチルアルコール400ml、亜塩素酸ナトリウム33.1gの水溶液400mlを順次加えて室温にて18時間攪拌した。反応液に飽和重曹水700mlを加えて攪拌後、酢酸エチル1000mlを加えて分液した。有機層を飽和重曹水500ml、飽和食塩水500mlで順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して10-カルボキシ体218.9gを得た。

【 0 4 2 3 】

(2) 上記(1)で得られた化合物218.9gのトルエン溶液500mlを減圧濃縮して得られた残渣をクロロホルム500mlに溶解し、トリエチルアミン28.1mlを加えた。引き続き、氷冷下クロロギ酸イソブチル25.0gを滴下してそのまま30分間攪拌した。引き続き、氷冷下50%ヒドロキシルアミン水溶液12.1gを加えてそのまま1時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液500mlを加えて分液し、有機層を飽和食塩水500mlで洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して10-ヒドロキサム酸体219.9gを得た。

【 0 4 2 4 】

(3) 上記(2)で得られた化合物219.9gのトルエン溶液500mlを減圧濃縮して得られた残渣をテトラヒドロフラン800mlに溶解し、トリエチルアミン77.0ml、p-トルエンスルホンクロリド38.4gを順次加えて室温にて40分間攪拌後、さらに水酸化リチウム38.4gの水溶液260mlを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液500mlを加えて中和後、反応液を減圧濃縮して得られた残渣にクロロホルム1000mlを加えて分液した。有機層を飽和重曹水500mlで洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=40:1:0.1から15:1:0.1)にて精製して標記化合物44.3gを得た。

MS(ESI)m/z=993.8[M+H]⁺

¹H-NMR(500MHz,CDCl₃) δ(ppm):0.51-0.70(m,18H)0.84-1.00(m,J=7.84,7.84Hz,30H)1.06-1.12(m,6H)1.13-1.17(m,7H)1.22(d,J=6.50Hz,3H)1.24(d,J=6.88Hz,3H)1.30(s,3H)1.30-1.35(m,1H)1.42(dd,J=14.72,4.78Hz,1H)1.55-1.72(m,3H)2.15-2.19(m,1H)2.18(s,6H)2.31-2.38(m,1H)2.43-2.52(m,1H)2.52-2.60(m,1H)3.12(dd,J=9.75,7.07Hz,1H)3.18(d,J=9.17Hz,1H)3.28(s,3H)3.29(s,3H)3.32-3.43(m,2H)3.51-3.60(m,1H)3.72(d,J=7.65Hz,1H)3.83-3.88(m,1H)4.19-4.29(m,1H)4.43(d,J=7.26Hz,1H)4.85(d,J=4.59Hz,1H)

【0425】

実施例2 式(A)でR=水素原子、R'=トリエチルシリルの化合物の合成

(1) (9S)-9,2',4''-0-トリス(トリエチルシリル)-9-ジヒドロエリスロマイシンA100gを原料として実施例1(1)と同様の方法にて10-カルボキシ体53.4gを得た。

【0426】

(2) 上記(1)で得られた化合物53gをテトラヒドロフラン700mlに溶解し、トリエチルアミン8.0mlを加えた。引き続き、氷冷下、クロロギ酸イソブチル7.0mlを滴下した後30分間攪拌した。引き続き、氷冷下、反応液にアンモニアガスを1時間通気した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2)にて精製して10-アミド体36.1gを得た。

10

【0427】

(3) 上記(2)で得られた化合物17.3gを酢酸エチル340mlに溶解し、ヨードベンゼンジアセテート10.2gを加えて室温にて14時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えて分液し、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をテトラヒドロフラン90mlに溶解し、水酸化リチウム3.3gの水溶液30mlを加えて室温にて2.5時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウムを加えて反応液を減圧濃縮した。残渣に酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=9:1:0.1)にて精製して標記化合物6.8gを得た。

MS(ESI)m/z=979.9[M+H]⁺

20

¹H-NMR(300MHz,CDCl₃) δ(ppm): 0.49-0.76(m,18H)0.84-1.04(m,30H)1.03-1.37(m,23H)1.37-1.72(m,3H)1.77-1.93(m,1H)2.01-2.18(m,1H)2.19(s,6H)2.32(d,J=15.23Hz,1H)2.38-2.56(m,2H)3.13-3.29(m,3H)3.30(s,3H)3.37-3.54(m,1H)3.56(d,J=6.84Hz,1H)3.62(s,1H)3.64-3.80(m,1H)4.13(d,J=4.97Hz,1H)4.17-4.30(m,1H)4.60(d,J=6.68Hz,1H)4.64(d,J=4.35Hz,1H)

【0428】

実施例3 式(A)でR=水素原子、R'=ベンジルの化合物の合成

(1) 文献(Journal of Organic Chemistry, 1982年, 47巻, 5019ページ)に記載の方法にて得られた(9S)-2'-0-アセチル-9-ジヒドロエリスロマイシンA8.51gをテトラヒドロフラン85mlに溶解し、ベンジルブロミド1.37mlを加えて室温にて3分間攪拌後、水酸化カリウム3.1gを加えて室温にて1.5時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて、水層を酢酸エチルにて抽出した。得られた有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液、蒸留水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して9-0-ベンジル体8.6gを得た。

30

【0429】

(2) 上記(1)で得られた化合物8.6gをメタノール500mlに溶解し、加熱還流下8時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=40:1:0.1から30:1:0.1)にて精製して脱アセチル体5.54gを得た。

【0430】

40

(3) 上記(2)で得られた化合物5.54gをジメチルホルムアミド70mlに溶解し、イミダゾール3.4g、トリエチルクロロシラン2.8mlを順次加えた。室温にて63時間攪拌後、イミダゾール850mg、トリエチルクロロシラン0.7mlを順次加えて室温にて24時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液し、水層を酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液、蒸留水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(アセトン:ヘキサン=40:1から20:1)にて精製して(9S)-9-0-ベンジル-2',4''-0-ビス(トリエチルシリル)-9-ジヒドロエリスロマイシンA5.8gを得た。

【0431】

50

(4) 上記(3)で得られた化合物2.0gを原料として実施例1と同様の方法にて標記化合物264mgを得た。

MS(ESI) m/z =955.9[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.45-1.42(m, 60H) 1.49-1.90(m, 4H) 2.08-2.55(m, 3H) 2.18(s, 6H) 2.63-2.82(m, 1H) 3.10-3.34(m, 2H) 3.29(s, 3H) 3.34-3.50(m, 2H) 3.52-3.87(m, 3H) 4.04-4.35(m, 2H) 4.45-4.82(m, 3H) 7.12-7.45(m, 5H)

【0432】

実施例4 式(A)でR=水素原子、R'=2-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノエチルの化合物の合成

(1) (9S)-2'-O-アセチル-9-ジヒドロエリスロマイシンA10g、2-ブロモエチルアミン臭化水素酸塩3.95gを原料として実施例3(1)と同様の方法にて9-O-(2-アミノエチル)体4.8gを得た。

10

【0433】

(2) 上記(1)で得られた化合物4.7gをクロロホルムに溶解し、重曹961mgの水溶液25ml、ベンジルクロロホルメート0.9mlを順次加えて室温にて1時間攪拌した。反応液を分液し、水層を酢酸エチルにて抽出した。有機層を蒸留水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してN-ベンジルオキシカルボニル体4.9gを得た。

【0434】

(3) 上記(2)で得られた化合物4.9gを原料として実施例3(2)、(3)、実施例1と同様の方法にて標記化合物313mgを得た。

20

MS(ESI) m/z =1042.9[M+H]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.46-0.71(m, 18H) 0.80-1.88(m, 46H) 2.04-2.31(m, 2H) 2.17(s, 6H) 2.34-2.52(m, 2H) 2.55-2.69(m, 1H) 2.94-3.85(m, 10H) 3.27(s, 3H) 4.09-4.29(m, 2H) 4.45-4.76(m, 2H) 5.01-5.15(m, 2H) 7.18-7.40(m, 5H)

【0435】

実施例5 式(A)でR=水素原子、R'=2-ベンジルオキシエチルの化合物の合成

(9S)-2'-O-アセチル-9-ジヒドロエリスロマイシンA10g、ベンジル2-ブロモエチルエーテル4.73gを原料として実施例3(1)、(2)、(3)、実施例1と同様の方法にて標記化合物321mgを得た。

30

MS(ESI) m/z =1000.0[M+H]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.49-0.70(m, 18H) 0.79-1.86(m, 46H) 2.09-2.22(m, 1H) 2.17(s, 6H) 2.24-2.38(m, 1H) 2.38-2.55(m, 2H) 3.10-3.37(m, 4H) 3.31(s, 3H) 3.42-3.81(m, 5H) 3.85-3.94(m, 1H) 4.04-4.26(m, 2H) 4.46-4.60(m, 2H) 4.66-4.85(m, 2H) 7.13-7.41(m, 5H)

【0436】

実施例6 式(A)でR=プロパルギル、R'=トリエチルシリルの化合物の合成

(9S)-9,2',4''-O-トリス(トリエチルシリル)-9-ジヒドロ-6-O-プロパルギルエリスロマイシンA48.4gを原料として実施例1と同様の方法にて標記化合物13.8gを得た。

MS(ESI) m/z =1017.9[M+H]⁺

【0437】

40

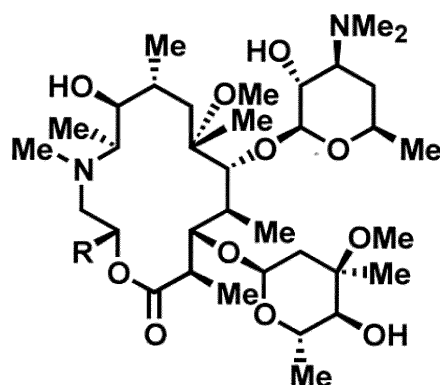
実施例7～108の合成

表1で規定したRをもつ、式(B)の化合物の製造法を以下に示す。

【0438】

【表 1 - 1】

表 1

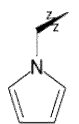


式 (B)

実施例	R	ESI MS (M+H)	¹ H-NMR, CDCl ₃ , δ (ppm)
7		719.2	(300 MHz) : 0.82 (d, J=6.99 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.38 Hz, 3 H) 1.06 - 1.28 (m, 5 H) 1.11 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.50 - 1.91 (m, 5 H) 2.11 - 2.54 (m, 7 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.76 - 2.95 (m, 2 H) 3.01 (t, J=8.63 Hz, 1 H) 3.18 - 3.23 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.39 - 3.52 (m, 2 H) 3.71 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 4.02 - 4.10 (m, 1 H) 4.17 (d, J=4.35 Hz, 1 H) 4.40 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.61 - 4.68 (m, 1 H) 4.95 (d, J=4.51 Hz, 1 H)
8	H	691.5	(500 MHz) : 0.81 - 0.89 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.10 - 1.29 (m, 5 H) 1.18 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.30 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.34 (s, 3 H) 1.53 - 1.58 (m, 1 H) 1.64 - 1.73 (m, 1 H) 1.85 - 1.94 (m, 1 H) 2.17 - 2.60 (m, 16 H) 2.76 - 2.83 (m, 1 H) 2.84 - 2.92 (m, 1 H) 3.02 (t, J=9.94 Hz, 1 H) 3.21 - 3.25 (m, 1 H) 3.26 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.46 - 3.55 (m, 2 H) 3.73 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 3.75 - 3.86 (m, 1 H) 4.03 - 4.09 (m, 1 H) 4.15 (d, J=3.82 Hz, 1 H) 4.36 - 4.40 (m, 1 H) 4.42 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.88 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
9		811.5	(300 MHz) : 0.80 - 0.88 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.10 - 1.22 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.20 - 1.26 (m, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.31, 4.90 Hz, 1 H) 1.63 - 1.72 (m, 1 H) 1.81 - 1.93 (m, 1 H) 2.17 - 2.55 (m, 7 H) 2.30 (s, 6 H) 2.33 (s, 3 H) 2.76 - 2.86 (m, 1 H) 2.90 (d, J=13.99 Hz, 1 H) 3.01 (t, J=9.71 Hz, 1 H) 3.17 - 3.25 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.40 - 3.52 (m, 2 H) 3.53 - 3.70 (m, 2 H) 3.71 (d, J=7.93 Hz, 1 H) 4.06 (dd, J=9.17, 6.37 Hz, 1 H) 4.15 (d, J=4.04 Hz, 1 H) 4.40 (d, J=6.84 Hz, 1 H) 4.53 (s, 2 H) 4.93 (d, J=4.82 Hz, 1 H) 4.98 (s, 1 H) 7.25 - 7.39 (m, 5 H)
10		719.3	

【 0 4 3 9 】

【表 1 - 2】

11		735.3	(500 MHz) : 0.85 (d, 6 H) 1.11 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.12 - 1.35 (m, 2 H) 1.18 (d, J=7.65 Hz, 2 H) 1.24 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.30 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.52 - 1.71 (m, 2 H) 1.84 - 1.91 (m, 1 H) 2.21 - 2.54 (m, 6 H) 2.30 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.79 - 2.91 (m, 2 H) 3.02 (t, J=9.94 Hz, 1 H) 3.20 - 3.24 (m, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 (s, 3 H) 3.43 - 3.52 (m, 3 H) 3.57 (dd, J=9.94, 6.12 Hz, 1 H) 3.72 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.03 - 4.10 (m, 1 H) 4.12 - 4.16 (m, 1 H) 4.41 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.90 - 4.95 (m, 2 H)
12		705.4	(300 MHz) : 0.81 - 0.91 (m, 6 H) 1.06 - 1.23 (m, 2 H) 1.11 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.19 - 1.27 (m, 9 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.55 (dd, J=15.15, 4.90 Hz, 1 H) 1.60 - 1.70 (m, 1 H) 1.90 (s, 1 H) 2.08 - 2.21 (m, 1 H) 2.21 - 2.42 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.45 - 2.54 (m, 2 H) 2.70 - 2.81 (m, 1 H) 2.89 (d, J=14.77 Hz, 1 H) 3.02 (t, J=8.39 Hz, 1 H) 3.17 - 3.25 (m, 1 H) 3.26 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.38 - 3.57 (m, 2 H) 3.72 (d, J=7.77 Hz, 1 H) 3.99 - 4.11 (m, 1 H) 4.13 (s, 1 H) 4.42 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.86 (s, 1 H) 4.90 (d, J=4.51 Hz, 1 H)
13		733.4	(300 MHz) : 0.82 (d, J=6.99 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.07 Hz, 3 H) 1.10 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.11 - 1.91 (m, 15 H) 1.16 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 2.06 - 2.54 (m, 7 H) 2.30 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.74 - 2.85 (m, 1 H) 2.88 - 2.96 (m, 1 H) 3.01 (t, J=9.87 Hz, 1 H) 3.18 - 3.25 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.37 - 3.53 (m, 2 H) 3.71 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 4.01 - 4.11 (m, 1 H) 4.17 (d, J=5.28 Hz, 1 H) 4.39 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.69 - 4.77 (m, 1 H) 4.95 (d, J=4.97 Hz, 1 H)
14		733.5	(300 MHz) : 0.92 (t, J=7.23 Hz, 3 H) 0.95 - 1.79 (m, 27 H) 1.13 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 2.06 - 2.39 (m, 6 H) 2.24 (s, 3 H) 2.31 (s, 6 H) 2.45 - 2.85 (m, 3 H) 3.01 (t, J=9.64 Hz, 1 H) 3.21 - 3.41 (m, 8 H) 3.48 - 3.60 (m, 1 H) 3.82 (d, J=6.84 Hz, 1 H) 3.96 - 4.07 (m, 1 H) 4.27 - 4.34 (m, 1 H) 4.53 (d, J=7.62 Hz, 1 H) 4.66 (d, J=4.97 Hz, 1 H) 4.86 - 5.00 (m, 1 H)
15		747.5	(300 MHz) : 0.82 (d, J=6.84 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=6.84 Hz, 3 H) 1.04 - 1.37 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.21 - 1.25 (m, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.37 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.48 - 1.59 (m, 1 H) 1.59 - 1.93 (m, 3 H) 2.07 - 2.20 (m, 1 H) 2.21 - 2.42 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.41 - 2.54 (m, 2 H) 2.80 (dd, J=7.46, 5.44 Hz, 1 H) 2.91 (d, J=16.16 Hz, 1 H) 3.01 (t, J=9.56 Hz, 1 H) 3.16 - 3.23 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.38 - 3.52 (m, 2 H) 3.71 (d, J=8.08 Hz, 1 H) 4.00 - 4.12 (m, 1 H) 4.17 (d, J=5.28 Hz, 1 H) 4.39 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.71 (s, 1 H) 4.95 (d, J=4.35 Hz, 1 H)
16		811.5	(300 MHz) : 0.95 (d, J=6.99 Hz, 3 H) 1.00 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.01 - 1.23 (m, 2 H) 1.08 - 1.18 (m, 6 H) 1.17 - 1.27 (m, 9 H) 1.29 (s, 3 H) 1.47 - 1.81 (m, 3 H) 1.92 - 2.99 (m, 9 H) 2.23 (s, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 3.19 - 3.29 (m, 1 H) 3.30 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.42 - 3.58 (m, 2 H) 3.64 (t, J=4.97 Hz, 2 H) 3.80 (d, J=6.68 Hz, 1 H) 3.89 - 4.09 (m, 1 H) 4.36 (s, 1 H) 4.45 - 4.52 (m, 2 H) 4.52 (s, 2 H) 5.20 (s, 1 H) 7.27 - 7.39 (m, 5 H)
17		854.6	(300 MHz) : 0.78 - 0.90 (m, 6 H) 1.05 - 1.16 (m, 6 H) 1.12 - 1.22 (m, 2 H) 1.20 - 1.24 (m, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.37 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.49 - 1.58 (m, 1 H) 1.60 - 1.71 (m, 1 H) 1.87 (s, 1 H) 2.18 - 2.39 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.40 - 2.54 (m, 2 H) 2.73 - 2.84 (m, 1 H) 2.91 - 3.01 (m, 1 H) 3.01 (t, J=9.87 Hz, 1 H) 3.16 - 3.23 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.34 - 3.56 (m, 4 H) 3.70 (d, J=8.08 Hz, 1 H) 3.98 - 4.14 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.85 (s, 1 H) 4.90 (d, J=4.82 Hz, 1 H) 5.05 (s, 1 H) 5.09 (s, 2 H) 7.28 - 7.39 (m, 5 H)
18		854.5	(300 MHz) : 0.88 - 0.99 (m, 6 H) 1.02 - 1.23 (m, 2 H) 1.07 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.13 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.18 - 1.30 (m, 12 H) 1.47 - 1.71 (m, 2 H) 1.80 - 2.63 (m, 7 H) 2.16 (s, 3 H) 2.27 (s, 6 H) 2.76 (t, J=10.26 Hz, 1 H) 2.93 - 3.10 (m, 2 H) 3.15 - 3.70 (m, 5 H) 3.27 (s, 3 H) 3.37 (s, 3 H) 3.77 (d, J=6.37 Hz, 1 H) 3.94 - 4.06 (m, 1 H) 4.39 (d, J=5.60 Hz, 1 H) 4.50 (s, 1 H) 4.56 (d, J=7.46 Hz, 1 H) 4.90 - 5.16 (m, 2 H) 5.37 - 5.50 (m, 1 H) 7.03 (s, 1 H) 7.27 - 7.40 (m, 5 H)
19		770.6	(300 MHz) : 0.80 - 0.87 (m, 6 H) 0.92 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.12 - 1.17 (m, 1 H) 1.18 - 1.25 (m, 1 H) 1.20 - 1.24 (m, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.49 (dd, J=15.39, 4.97 Hz, 1 H) 1.62 - 1.73 (m, 1 H) 1.86 (s, 1 H) 2.19 - 2.36 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.40 (s, 3 H) 2.42 - 2.54 (m, 2 H) 2.64 - 2.75 (m, 1 H) 2.93 - 3.08 (m, 2 H) 3.16 - 3.26 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.39 - 3.54 (m, 2 H) 3.68 (d, J=7.93 Hz, 1 H) 3.97 - 4.08 (m, 3 H) 4.09 - 4.21 (m, 1 H) 4.38 (d, J=6.99 Hz, 1 H) 4.85 (d, J=4.51 Hz, 1 H) 4.99 (s, 1 H) 6.10 (t, J=2.10 Hz, 2 H) 6.63 (t, J=2.10 Hz, 2 H)

【 0 4 4 0 】

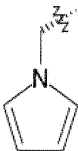
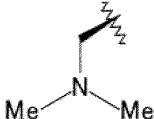
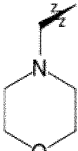
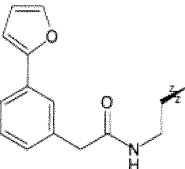
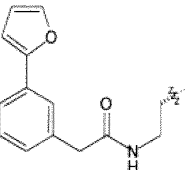
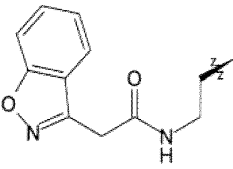
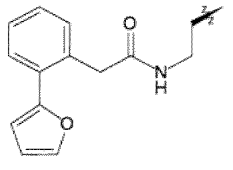
10

20

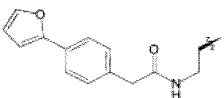
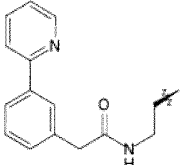
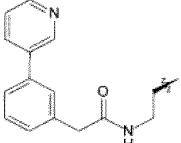
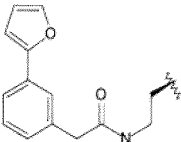
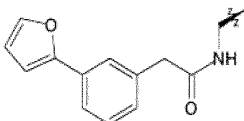
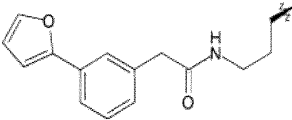
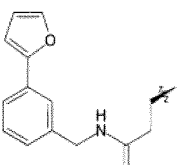
30

40

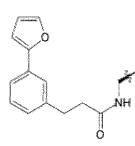
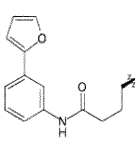
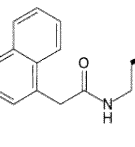
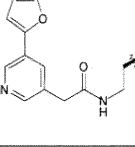
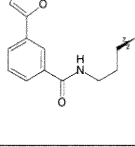
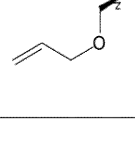
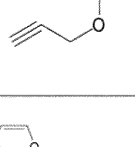
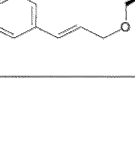
【表 1 - 3】

20		770.5	(300 MHz) : 0.79 - 0.88 (m, 6 H) 0.92 (d, J=5.91 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.12 - 1.18 (m, 1 H) 1.19 - 1.25 (m, 1 H) 1.19 - 1.25 (m, 6 H) 1.28 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.45 - 1.54 (m, 1 H) 1.61 - 1.73 (m, 1 H) 1.86 (s, 1 H) 2.19 - 2.36 (m, 5 H) 2.31 (s, 6 H) 2.40 (s, 3 H) 2.43 - 2.57 (m, 2 H) 2.66 - 2.75 (m, 1 H) 2.94 - 3.08 (m, 2 H) 3.16 - 3.26 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.39 - 3.51 (m, 2 H) 3.68 (d, J=7.93 Hz, 1 H) 3.97 - 4.19 (m, 4 H) 4.38 (d, J=6.99 Hz, 1 H) 4.85 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 5.00 (s, 1 H) 6.10 (t, J=2.41 Hz, 2 H) 6.63 (t, J=2.10 Hz, 2 H)
21		748.5	(300 MHz) : 0.80 - 0.90 (m, 6 H) 1.12 (d, 3 H) 1.11 - 1.24 (m, 2 H) 1.17 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.21 - 1.28 (m, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.30 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.34 (s, 3 H) 1.50 - 1.56 (m, 1 H) 1.60 - 1.72 (m, 1 H) 1.81 - 1.96 (m, 1 H) 2.13 - 2.57 (m, 9 H) 2.24 (s, 6 H) 2.30 (s, 6 H) 2.39 (s, 3 H) 2.80 (dd, J=6.61, 5.21 Hz, 1 H) 2.89 (d, J=15.39 Hz, 1 H) 3.02 (t, J=9.87 Hz, 1 H) 3.18 - 3.24 (m, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.38 - 3.56 (m, 2 H) 3.72 (d, J=7.62 Hz, 1 H) 4.07 (dd, J=9.71, 6.45 Hz, 1 H) 4.17 (d, J=5.60 Hz, 1 H) 4.41 (d, J=7.46 Hz, 1 H) 4.86 - 4.92 (m, 1 H) 4.94 (d, J=4.35 Hz, 1 H)
22		790.8	(300 MHz) : 0.79 - 0.87 (m, 6 H) 1.11 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.11 - 1.26 (m, 2 H) 1.18 (d, J=7.62 Hz, 3 H) 1.21 - 1.25 (m, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.49 - 1.56 (m, 1 H) 1.66 (d, J=13.21 Hz, 1 H) 1.87 (s, 1 H) 2.19 - 2.62 (m, 13 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.76 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 (d, J=15.39 Hz, 1 H) 2.96 - 3.07 (m, 1 H) 3.15 - 3.23 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.39 (t, 2 H) 3.65 (t, J=5.05 Hz, 4 H) 3.71 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 4.06 (dd, J=9.25, 6.14 Hz, 1 H) 4.12 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 4.39 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.93 (d, J=4.51 Hz, 1 H) 4.98 (s, 1 H)
23		918.8	(500 MHz) : 0.78 - 0.86 (m, 6 H) 1.04 - 1.11 (m, 6 H) 1.19 - 1.33 (m, 2 H) 1.22 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.47 - 1.91 (m, 5 H) 2.05 - 2.40 (m, 15 H) 2.40 - 2.56 (m, 2 H) 2.70 - 2.78 (m, 1 H) 2.82 - 2.92 (m, 1 H) 3.01 (t, J=9.94 Hz, 1 H) 3.18 - 3.25 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.33 - 3.52 (m, 3 H) 3.58 (s, 2 H) 3.69 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 3.98 - 4.12 (m, 2 H) 4.39 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.67 - 4.80 (m, 1 H) 4.86 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.64 - 5.87 (m, 1 H) 6.44 - 6.49 (m, 1 H) 6.67 (d, J=3.82 Hz, 1 H) 7.16 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 7.33 - 7.38 (m, 1 H) 7.44 - 7.47 (m, 1 H) 7.55 - 7.60 (m, 2 H)
24		918.7	(500 MHz) : 0.75 - 0.88 (m, 6 H) 1.03 - 1.11 (m, 6 H) 1.10 - 1.21 (m, 2 H) 1.22 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.52 (dd, 1 H) 1.58 - 1.91 (m, 4 H) 2.07 - 2.15 (m, 1 H) 2.18 - 2.37 (m, 4 H) 2.26 - 2.34 (m, 9 H) 2.38 - 2.54 (m, 2 H) 2.67 - 2.80 (m, 1 H) 2.82 - 2.92 (m, 1 H) 2.96 - 3.05 (m, 2 H) 3.22 (s, 3 H) 3.18 - 3.21 (m, 1 H) 3.26 - 3.42 (m, 2 H) 3.31 (s, 3 H) 3.42 - 3.52 (m, 1 H) 3.57 (s, 2 H) 3.69 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 3.97 - 4.12 (m, 2 H) 4.39 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.72 (s, 1 H) 4.86 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.64 - 5.97 (m, 1 H) 6.44 - 6.48 (m, 1 H) 6.67 (d, J=3.82 Hz, 1 H) 7.16 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 7.35 (t, J=8.03 Hz, 1 H) 7.46 (d, J=1.53 Hz, 1 H) 7.55 - 7.60 (m, 2 H)
25		893.5	(300 MHz) : 0.76 - 0.89 (m, 6 H) 1.05 - 1.16 (m, 6 H) 1.13 - 1.21 (m, 2 H) 1.23 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.26 (s, 3 H) 1.30 (d, J=6.37 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.46 - 1.97 (m, 5 H) 2.06 - 2.35 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.32 (s, 3 H) 2.38 (d, J=15.54 Hz, 1 H) 2.42 - 2.55 (m, 2 H) 2.71 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=13.99 Hz, 1 H) 2.96 - 3.12 (m, 2 H) 3.16 - 3.24 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.56 (m, 3 H) 3.71 (d, J=8.08 Hz, 1 H) 3.95 (s, 2 H) 3.99 - 4.17 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.75 (s, 1 H) 4.89 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 6.59 (s, 1 H) 7.29 - 7.40 (m, 1 H) 7.51 - 7.65 (m, 2 H) 7.79 (d, J=7.93 Hz, 1 H)
26		918.6	(300 MHz) : 0.75 - 0.88 (m, 6 H) 1.03 - 1.12 (m, 6 H) 1.10 - 1.22 (m, 2 H) 1.23 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.30 (d, J=6.37 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.23, 4.82 Hz, 1 H) 1.66 (d, J=11.19 Hz, 1 H) 1.71 - 1.93 (m, 3 H) 2.02 - 2.14 (m, 1 H) 2.16 - 2.29 (m, 3 H) 2.27 - 2.32 (m, 9 H) 2.36 (d, J=15.54 Hz, 1 H) 2.39 - 2.54 (m, 2 H) 2.71 (dd, J=7.38, 5.52 Hz, 1 H) 2.85 (d, J=14.61 Hz, 1 H) 2.94 - 3.10 (m, 2 H) 3.19 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.25 - 3.52 (m, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.69 (d, J=8.08 Hz, 1 H) 3.77 (s, 2 H) 3.95 - 4.13 (m, 2 H) 4.39 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.88 (d, J=4.51 Hz, 1 H) 5.78 (s, 1 H) 6.48 (dd, J=3.42, 1.87 Hz, 1 H) 6.57 (dd, J=3.34, 0.70 Hz, 1 H) 7.29 - 7.39 (m, 3 H) 7.52 - 7.56 (m, 1 H) 7.64 - 7.71 (m, 1 H)

【表 1 - 4】

27		918.6	(300 MHz) : 0.76 - 0.89 (m, 6 H) 1.04 - 1.11 (m, J=7.31 Hz, 6 H) 1.10 - 1.22 (m, 2 H) 1.18 - 1.26 (m, 6 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.49 (dd, J=15.31, 4.74 Hz, 1 H) 1.60 - 1.94 (m, 4 H) 2.04 - 2.40 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.33 (s, 3 H) 2.41 - 2.54 (m, 2 H) 2.70 - 2.79 (m, 1 H) 2.89 (d, J=14.46 Hz, 1 H) 2.94 - 3.10 (m, 2 H) 3.17 - 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.32 - 3.52 (m, 3 H) 3.56 (s, 2 H) 3.69 (d, J=7.93 Hz, 1 H) 3.97 - 4.13 (m, 2 H) 4.39 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.75 (s, 1 H) 4.86 (d, J=4.35 Hz, 1 H) 5.83 (s, 1 H) 6.47 (dd, J=3.34, 1.79 Hz, 1 H) 6.65 (d, J=3.42 Hz, 1 H) 7.27 - 7.34 (m, 2 H) 7.43 - 7.49 (m, 1 H) 7.65 (d, J=8.24 Hz, 2 H)
28		929.6	(300 MHz) : 0.76 - 0.91 (m, 6 H) 1.02 - 1.17 (m, 6 H) 1.11 - 1.22 (m, 2 H) 1.20 - 1.27 (m, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.30 (d, J=6.53 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.51 (dd, J=15.23, 4.66 Hz, 1 H) 1.59 - 1.97 (m, 4 H) 2.07 - 2.38 (m, 4 H) 2.30 (s, 6 H) 2.32 (s, 3 H) 2.38 - 2.56 (m, 2 H) 2.68 - 2.81 (m, 1 H) 2.88 (d, J=15.70 Hz, 1 H) 2.94 - 3.10 (m, 2 H) 3.13 - 3.22 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.27 - 3.55 (m, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.65 (s, 2 H) 3.70 (d, J=7.93 Hz, 1 H) 3.93 - 4.15 (m, 2 H) 4.39 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.75 (s, 1 H) 4.87 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 5.87 (s, 1 H) 7.20 - 7.27 (m, 1 H) 7.31 - 7.39 (m, 1 H) 7.47 (t, J=7.46 Hz, 1 H) 7.70 - 7.79 (m, 2 H) 7.85 - 7.98 (m, 2 H) 8.69 (d, J=4.66 Hz, 1 H)
29		929.6	(300 MHz) : 0.76 - 0.92 (m, 6 H) 1.04 - 1.13 (m, 6 H) 1.10 - 1.23 (m, 2 H) 1.20 - 1.26 (m, 3 H) 1.23 - 1.26 (m, 3 H) 1.30 (d, J=6.68 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.50 (dd, J=15.08, 4.82 Hz, 1 H) 1.60 - 1.96 (m, 4 H) 2.07 - 2.39 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.32 (s, 3 H) 2.39 - 2.55 (m, 2 H) 2.68 - 2.81 (m, 1 H) 2.87 (d, J=16.63 Hz, 1 H) 2.93 - 3.08 (m, 2 H) 3.15 - 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.30 - 3.55 (m, 3 H) 3.63 (s, 2 H) 3.70 (d, J=7.93 Hz, 1 H) 3.93 - 4.17 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.78 (s, 1 H) 4.86 (d, J=4.35 Hz, 1 H) 5.95 (s, 1 H) 7.29 - 7.41 (m, 2 H) 7.41 - 7.57 (m, 3 H) 7.84 - 7.95 (m, 1 H) 8.55 - 8.64 (m, 1 H) 8.85 (d, J=2.18 Hz, 1 H)
30		932.6	(300 MHz) : 0.78 - 0.85 (m, 6 H) 1.06 - 1.12 (m, 6 H) 1.11 - 1.35 (m, 8 H) 1.17 (d, J=7.62 Hz, 3 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.46 - 2.08 (m, 5 H) 2.08 - 2.52 (m, 7 H) 2.27 (s, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.34 - 2.37 (m, 3 H) 2.75 - 2.88 (m, 1 H) 2.91 - 3.05 (m, 2 H) 3.17 - 3.57 (m, 5 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.66 - 3.76 (m, 3 H) 4.00 - 4.09 (m, 1 H) 4.13 - 4.19 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.46 Hz, 1 H) 4.65 - 4.74 (m, 1 H) 4.90 - 4.94 (m, 1 H) 6.43 - 6.48 (m, 1 H) 6.66 (dd, J=3.34, 0.70 Hz, 1 H) 7.11 - 7.17 (m, 1 H) 7.33 (t, J=7.85 Hz, 1 H) 7.44 - 7.46 (m, 1 H) 7.53 - 7.59 (m, 2 H)
31		904.5	(300 MHz) : 0.74 - 0.87 (m, 6 H) 0.93 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.04 (d, J=8.08 Hz, 3 H) 1.04 - 1.21 (m, 2 H) 1.22 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.37 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.43 - 1.71 (m, 2 H) 1.76 - 1.92 (m, 1 H) 2.06 - 2.73 (m, 9 H) 2.25 - 2.33 (m, 9 H) 2.81 - 3.07 (m, 2 H) 3.14 - 3.26 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.27 - 3.37 (m, 1 H) 3.31 (s, 3 H) 3.38 - 3.52 (m, 1 H) 3.59 (s, 2 H) 3.67 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 3.95 - 4.13 (m, 2 H) 4.38 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.76 (s, 1 H) 4.82 (d, J=4.35 Hz, 1 H) 5.86 (s, 1 H) 6.47 (dd, J=3.42, 1.87 Hz, 1 H) 6.68 (d, J=3.89 Hz, 1 H) 7.14 (d, J=8.08 Hz, 1 H) 7.37 (t, J=7.54 Hz, 1 H) 7.43 - 7.48 (m, 1 H) 7.51 - 7.64 (m, 2 H)
32		932.6	(300 MHz) : 0.78 - 0.85 (m, 6 H) 1.06 - 1.34 (m, 14 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.36 - 1.73 (m, 6 H) 1.79 - 1.90 (m, 1 H) 2.04 - 2.13 (m, 1 H) 2.18 - 2.52 (m, 6 H) 2.29 (s, 9 H) 2.71 - 2.81 (m, 1 H) 2.83 - 2.92 (m, 1 H) 2.95 - 3.06 (m, 1 H) 3.16 - 3.52 (m, 5 H) 3.24 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.59 (s, 2 H) 3.70 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 4.00 - 4.15 (m, 2 H) 4.39 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.63 - 4.72 (m, 1 H) 4.91 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 5.46 - 5.54 (m, 1 H) 6.48 (dd, J=3.34, 1.79 Hz, 1 H) 6.68 (d, J=3.42 Hz, 1 H) 7.15 (d, J=7.77 Hz, 1 H) 7.37 (t, J=7.69 Hz, 1 H) 7.48 (d, J=1.09 Hz, 1 H) 7.56 - 7.63 (m, 2 H)
33		918.5	(300 MHz) : 0.83 (d, J=6.99 Hz, 6 H) 1.09 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.13 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.46 - 1.70 (m, 2 H) 1.81 - 2.52 (m, 12 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.74 - 2.84 (m, 1 H) 2.91 - 3.05 (m, 2 H) 3.18 - 3.24 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.32 - 3.51 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.93 Hz, 1 H) 3.99 - 4.09 (m, 1 H) 4.10 - 4.16 (m, 1 H) 4.39 (d, J=6.99 Hz, 1 H) 4.47 (d, J=5.60 Hz, 2 H) 4.74 - 4.82 (m, 1 H) 4.89 (d, J=4.35 Hz, 1 H) 5.88 - 5.96 (m, 1 H) 6.47 (dd, J=3.34, 1.79 Hz, 1 H) 6.67 (dd, J=3.42, 0.78 Hz, 1 H) 7.15 - 7.20 (m, 1 H) 7.32 - 7.38 (m, 1 H) 7.47 (dd, J=1.87, 0.78 Hz, 1 H) 7.56 - 7.60 (m, 2 H)

【表 1 - 5】

34		918.6	(300 MHz) : 0.79 - 0.91 (m, 6 H) 1.05 - 1.13 (m, 6 H) 1.11 - 1.27 (m, 2 H) 1.20 - 1.26 (m, 6 H) 1.29 (d, J=6.37 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.49 - 1.58 (m, 1 H) 1.62 - 1.73 (m, 1 H) 1.78 - 1.97 (m, 1 H) 2.12 - 2.39 (m, 4 H) 2.29 - 2.30 (m, 6 H) 2.32 - 2.34 (m, 3 H) 2.39 - 2.56 (m, 4 H) 2.71 - 2.84 (m, 1 H) 2.86 - 3.09 (m, 4 H) 3.15 - 3.24 (m, 1 H) 3.23 - 3.26 (m, 3 H) 3.25 - 3.41 (m, 3 H) 3.31 - 3.32 (m, 3 H) 3.40 - 3.53 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.77 Hz, 1 H) 3.94 - 4.12 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.77 Hz, 1 H) 4.70 - 4.94 (m, 2 H) 5.93 (s, 1 H) 6.47 (dd, J=3.42, 1.71 Hz, 1 H) 6.61 - 6.67 (m, 1 H) 7.09 (d, J=7.77 Hz, 1 H) 7.26 - 7.34 (m, 1 H) 7.43 - 7.47 (m, 1 H) 7.48 - 7.54 (m, 2 H)
35		918.6	(300 MHz) : 0.86 (d, J=6.84 Hz, 6 H) 1.10 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.11 - 1.27 (m, 2 H) 1.17 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.30 (d, J=6.37 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.48 - 1.93 (m, 7 H) 2.14 - 2.53 (m, 9 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.78 - 2.86 (m, 1 H) 2.88 - 2.97 (m, 1 H) 2.97 - 3.06 (m, 1 H) 3.21 (dd, J=10.26, 7.31 Hz, 1 H) 3.27 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.36 - 3.53 (m, 2 H) 3.72 (d, J=7.93 Hz, 1 H) 4.01 - 4.15 (m, 2 H) 4.41 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.86 - 4.92 (m, 1 H) 4.94 (d, J=4.51 Hz, 1 H) 6.46 (dd, J=3.34, 1.79 Hz, 1 H) 6.67 (dd, J=3.42, 0.78 Hz, 1 H) 7.32 (t, J=7.85 Hz, 1 H) 7.38 - 7.42 (m, 1 H) 7.46 (dd, J=1.79, 0.70 Hz, 1 H) 7.46 - 7.51 (m, 1 H) 7.84 (s, 1 H)
36		902.6	(300 MHz) : 0.73 - 0.86 (m, 6 H) 1.00 (d, 3 H) 1.06 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.08 - 1.21 (m, 2 H) 1.23 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.26 (s, 3 H) 1.28 - 1.35 (m, 6 H) 1.46 - 1.73 (m, 4 H) 1.75 - 1.91 (m, 1 H) 1.93 - 2.08 (m, 1 H) 2.10 - 2.54 (m, 5 H) 2.23 - 2.26 (m, 3 H) 2.27 - 2.30 (m, 6 H) 2.60 - 2.70 (m, 1 H) 2.78 (d, J=15.85 Hz, 1 H) 2.87 - 3.11 (m, 3 H) 3.12 - 3.40 (m, 2 H) 3.21 - 3.22 (m, 3 H) 3.30 - 3.33 (m, 3 H) 3.40 - 3.54 (m, 1 H) 3.68 (d, J=7.77 Hz, 1 H) 3.98 - 4.10 (m, 2 H) 4.01 (s, 2 H) 4.38 (d, J=7.46 Hz, 1 H) 4.50 (s, 1 H) 4.84 (d, J=4.35 Hz, 1 H) 5.67 (s, 1 H) 7.36 - 7.58 (m, 4 H) 7.77 - 7.90 (m, 2 H) 7.92 - 7.99 (m, 1 H)
37		919.5	(300 MHz) : 0.80 - 0.91 (m, 6 H) 1.04 - 1.17 (m, 6 H) 1.10 - 1.20 (m, 2 H) 1.23 (d, J=5.91 Hz, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.30 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.45 - 1.97 (m, 5 H) 2.02 - 2.56 (m, 6 H) 2.28 - 2.30 (m, 6 H) 2.32 - 2.35 (m, 3 H) 2.61 - 3.09 (m, 5 H) 3.15 - 3.23 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.53 (m, 2 H) 3.56 (s, 2 H) 3.71 (d, J=8.08 Hz, 1 H) 3.96 - 4.11 (m, 2 H) 4.41 (d, J=7.46 Hz, 1 H) 4.73 - 4.94 (m, 2 H) 6.08 (s, 1 H) 6.50 (dd, J=3.57, 2.02 Hz, 1 H) 6.78 (d, J=3.57 Hz, 1 H) 7.49 - 7.54 (m, 1 H) 7.89 - 7.95 (m, 1 H) 8.40 (d, J=2.18 Hz, 1 H) 8.84 (d, J=2.02 Hz, 1 H)
38		918.7	(500 MHz) : 0.84 (d, 6 H) 1.09 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.15 - 1.76 (m, 8 H) 1.21 - 1.23 (m, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.77 - 1.93 (m, 2 H) 2.14 - 2.58 (m, 14 H) 2.73 - 2.86 (m, 1 H) 2.86 - 2.97 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.74 Hz, 1 H) 3.17 - 3.27 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.34 - 3.60 (m, 4 H) 3.71 (d, J=7.68 Hz, 1 H) 3.99 - 4.08 (m, 1 H) 4.08 - 4.17 (m, 1 H) 4.40 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.77 - 4.88 (m, 1 H) 4.91 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 6.25 - 6.44 (m, 1 H) 6.49 (dd, J=3.29, 1.92 Hz, 1 H) 6.71 - 6.77 (m, 1 H) 7.44 (t, J=7.68 Hz, 1 H) 7.47 - 7.49 (m, 1 H) 7.60 - 7.67 (m, 1 H) 7.76 - 7.80 (m, 1 H) 8.03 - 8.09 (m, 1 H)
39		761.5	(300 MHz) : 0.78 - 0.89 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.62 Hz, 3 H) 1.18 - 1.27 (m, 2 H) 1.20 - 1.27 (m, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.47 - 1.65 (m, 2 H) 1.77 - 1.93 (m, 1 H) 2.18 - 2.58 (m, 6 H) 2.30 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.73 - 2.95 (m, 2 H) 2.96 - 3.08 (m, 1 H) 3.17 - 3.24 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.36 - 3.66 (m, 4 H) 3.71 (d, J=7.93 Hz, 1 H) 3.95 - 4.01 (m, 2 H) 4.01 - 4.10 (m, 1 H) 4.10 - 4.18 (m, 1 H) 4.40 (d, J=7.46 Hz, 1 H) 4.86 - 4.98 (m, 2 H) 5.10 - 5.34 (m, 2 H) 5.77 - 5.97 (m, 1 H)
40		759.5	(300 MHz) : 0.78 - 0.89 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.14 - 1.26 (m, J=7.46 Hz, 2 H) 1.20 - 1.26 (m, 6 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.48 - 1.62 (m, 2 H) 1.79 - 1.95 (m, 1 H) 2.30 (s, 3 H) 2.30 (s, 6 H) 2.33 - 2.40 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.41 - 2.55 (m, 2 H) 2.43 (t, J=2.41 Hz, 1 H) 2.76 - 2.85 (m, 1 H) 2.90 (d, J=14.14 Hz, 1 H) 3.02 (t, J=9.71 Hz, 1 H) 3.16 - 3.23 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.52 (m, 2 H) 3.55 - 3.64 (m, 1 H) 3.67 - 3.79 (m, 2 H) 4.01 - 4.16 (m, 2 H) 4.16 (dd, J=2.33, 1.71 Hz, 2 H) 4.41 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.88 - 5.01 (m, 2 H)
41			(300 MHz) : 0.77 - 0.90 (m, 6 H) 1.01 - 1.27 (m, 2 H) 1.03 - 1.17 (m, 6 H) 1.19 - 1.27 (m, 6 H) 1.29 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.44 - 1.75 (m, 2 H) 1.78 - 1.93 (m, 1 H) 2.15 - 2.58 (m, 6 H) 2.30 - 2.32 (m, 6 H) 2.35 - 2.37 (m, 3 H) 2.71 - 3.10 (m, 3 H) 3.16 - 3.34 (m, 1 H) 3.23 - 3.25 (m, 3 H) 3.30 - 3.32 (m, 3 H) 3.36 - 3.58 (m, 4 H) 3.71 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 3.78 - 4.19 (m, 4 H) 4.39 (d, J=7.46 Hz, 1 H) 4.81 - 5.06 (m, 3 H) 6.09 (d, J=5.28 Hz, 1 H) 6.41 - 6.50 (m, 1 H) 6.64 (d, J=3.42 Hz, 1 H) 7.04 - 7.15 (m, 1 H) 7.17 - 7.34 (m, 2 H) 7.40 - 7.55 (m, 2 H)

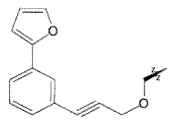
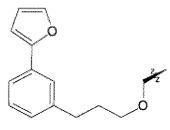
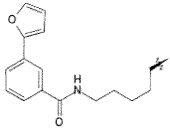
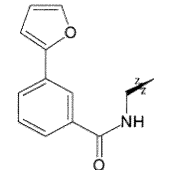
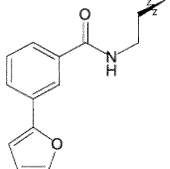
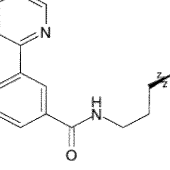
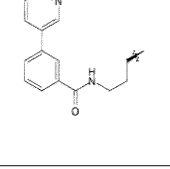
10

20

30

40

【表 1 - 6】

42		901.6	(300 MHz) : 0.78 - 0.90 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.09 - 1.22 (m, 2 H) 1.17 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.21 - 1.26 (m, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.46 - 1.70 (m, 2 H) 1.79 - 1.96 (m, 1 H) 2.18 - 2.58 (m, 6 H) 2.30 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.76 - 3.07 (m, 3 H) 3.17 - 3.24 (m, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.36 - 3.54 (m, 2 H) 3.60 - 3.89 (m, 3 H) 4.05 (dd, J=9.48, 6.37 Hz, 1 H) 4.09 - 4.19 (m, 1 H) 4.33 - 4.47 (m, 3 H) 4.92 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 4.99 (s, 1 H) 6.48 (dd, J=3.42, 1.71 Hz, 1 H) 6.69 (dd, J=3.42, 0.78 Hz, 1 H) 7.30 - 7.35 (m, 2 H) 7.45 - 7.49 (m, 1 H) 7.59 - 7.66 (m, 1 H) 7.73 - 7.77 (m, 1 H)
43		905.6	(300 MHz) : 0.79 - 0.90 (m, 6 H) 1.02 - 1.37 (m, 2 H) 1.06 - 1.13 (m, 3 H) 1.16 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.20 - 1.26 (m, 3 H) 1.23 - 1.24 (m, 3 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.62, 5.05 Hz, 1 H) 1.67 (d, J=13.21 Hz, 1 H) 1.78 - 1.95 (m, 3 H) 2.16 - 2.41 (m, 5 H) 2.29 - 2.31 (m, 6 H) 2.34 - 2.36 (m, 3 H) 2.42 - 2.55 (m, 2 H) 2.64 - 2.75 (m, 2 H) 2.76 - 2.86 (m, 1 H) 2.91 (d, J=15.39 Hz, 1 H) 2.96 - 3.07 (m, 1 H) 3.16 - 3.24 (m, 1 H) 3.23 - 3.26 (m, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.37 - 3.58 (m, 6 H) 3.71 (d, J=7.93 Hz, 1 H) 3.99 - 4.21 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.89 - 5.00 (m, 2 H) 6.44 - 6.49 (m, 1 H) 6.61 - 6.67 (m, 1 H) 7.03 - 7.11 (m, 1 H) 7.14 - 7.18 (m, 1 H) 7.19 - 7.34 (m, 1 H) 7.45 - 7.53 (m, 2 H)
44		946.8	(500 MHz) : 0.78 - 0.86 (m, 6 H) 1.04 - 1.88 (m, 16 H) 1.08 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.14 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=9.87 Hz, 3 H) 1.27 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 2.05 - 2.60 (m, 15 H) 2.75 - 2.82 (m, 1 H) 2.88 - 3.01 (m, 2 H) 3.17 - 3.52 (m, 5 H) 3.21 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.69 (d, J=7.68 Hz, 1 H) 4.00 - 4.07 (m, 1 H) 4.09 - 4.14 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.76 (d, 1 H) 4.89 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 6.24 - 6.32 (m, 1 H) 6.48 (dd, J=3.43, 1.78 Hz, 1 H) 6.73 (d, J=3.57 Hz, 1 H) 7.43 (t, J=7.82 Hz, 1 H) 7.48 (d, J=1.10 Hz, 1 H) 7.63 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 7.77 (ddd, J=7.95, 1.37, 1.10 Hz, 1 H) 8.05 (t, J=1.51 Hz, 1 H)
45		890.7	(600 MHz) : 0.82 - 0.94 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.14 - 1.27 (m, 2 H) 1.20 - 1.23 (m, 3 H) 1.22 - 1.22 (m, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.57 - 1.83 (m, J=11.92 Hz, 3 H) 1.90 (s, 1 H) 2.18 - 2.31 (m, 3 H) 2.28 - 2.30 (m, 6 H) 2.33 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.41 (s, 3 H) 2.43 - 2.51 (m, 1 H) 2.57 (s, 1 H) 2.79 - 2.89 (m, 1 H) 3.00 (s, 1 H) 3.04 - 3.14 (m, 1 H) 3.20 (dd, J=10.32, 7.11 Hz, 1 H) 3.26 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.42 - 3.51 (m, 1 H) 3.55 - 3.62 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.98 - 4.16 (m, 2 H) 4.40 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.88 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.04 (s, 1 H) 6.45 - 6.52 (m, 1 H) 6.75 (d, J=3.21 Hz, 1 H) 7.00 (s, 1 H) 7.43 (t, J=7.79 Hz, 1 H) 7.46 - 7.49 (m, 1 H) 7.62 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.78 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 8.06 (s, 1 H)
46		904.7	(600 MHz) : 0.79 - 0.90 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.12 - 1.25 (m, 2 H) 1.17 - 1.26 (m, J=7.34 Hz, 9 H) 1.29 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.57 - 1.78 (m, 2 H) 1.81 - 1.96 (m, 2 H) 2.14 - 2.42 (m, 4 H) 2.28 - 2.32 (m, 6 H) 2.37 - 2.38 (m, 3 H) 2.43 - 2.57 (m, 2 H) 2.79 - 2.89 (m, 1 H) 2.89 - 2.96 (m, 1 H) 2.97 - 3.04 (m, 1 H) 3.07 - 3.30 (m, 3 H) 3.24 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.42 - 3.52 (m, 2 H) 3.72 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.72 - 3.80 (m, 1 H) 4.00 - 4.08 (m, 1 H) 4.11 (s, 1 H) 4.41 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.99 (s, 1 H) 6.45 - 6.50 (m, 1 H) 6.76 (d, J=3.21 Hz, 1 H) 7.44 (t, J=7.79 Hz, 1 H) 7.46 - 7.50 (m, 1 H) 7.67 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 7.78 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.12 (s, 1 H)
47		929.7	(600 MHz) : 0.78 - 0.87 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.11 - 1.26 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.20 - 1.24 (m, 3 H) 1.22 - 1.23 (m, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.56 - 1.74 (m, 3 H) 1.77 - 1.92 (m, 3 H) 2.13 - 2.32 (m, 3 H) 2.28 - 2.31 (m, 6 H) 2.34 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.37 (s, 3 H) 2.40 - 2.54 (m, 2 H) 2.76 - 2.84 (m, 1 H) 2.87 - 3.03 (m, 2 H) 3.18 - 3.22 (m, 1 H) 3.23 - 3.25 (m, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.34 - 3.58 (m, 4 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.00 - 4.08 (m, 1 H) 4.12 (s, 1 H) 4.39 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.80 (s, 1 H) 4.91 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 6.49 (s, 1 H) 7.25 - 7.29 (m, 1 H) 7.54 (t, J=7.79 Hz, 1 H) 7.75 - 7.83 (m, 2 H) 7.86 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.11 (d, J=7.80 Hz, 1 H) 8.38 (s, 1 H) 8.68 - 8.72 (m, 1 H)
48			(600 MHz) : 0.77 - 0.86 (m, 6 H) 1.06 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 - 1.25 (m, 2 H) 1.20 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.21 (s, 3 H) 1.26 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.51 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.53 - 1.73 (m, 3 H) 1.73 - 1.92 (m, 3 H) 2.09 - 2.60 (m, 6 H) 2.30 - 2.32 (m, 6 H) 2.33 - 2.35 (m, 3 H) 2.73 - 2.83 (m, 1 H) 2.84 - 3.03 (m, 2 H) 3.15 - 3.21 (m, 1 H) 3.21 - 3.23 (m, 3 H) 3.28 - 3.30 (m, 3 H) 3.33 - 3.60 (m, 4 H) 3.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.96 - 4.13 (m, 2 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.68 - 4.91 (m, 2 H) 7.34 - 7.40 (m, 1 H) 7.52 (t, J=7.79 Hz, 1 H) 7.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.77 (s, 1 H) 7.92 (s, 1 H) 8.01 (s, 1 H) 8.59 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 8.82 - 8.88 (m, 1 H)

10

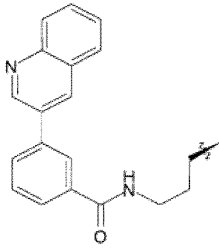
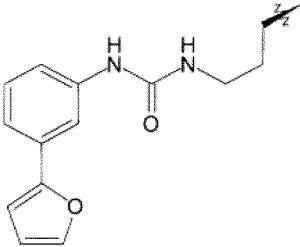
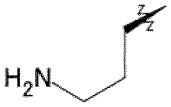
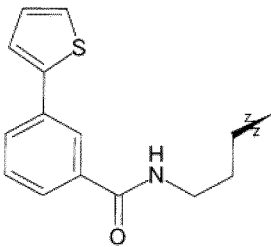
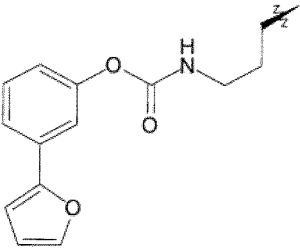
20

30

40

【 0 4 4 4 】

【表 1 - 7】

49		979.8	(600 MHz) : 0.76 - 0.90 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.14 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 - 1.25 (m, 2 H) 1.21 - 1.23 (m, 3 H) 1.22 - 1.22 (m, 3 H) 1.27 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.45 - 1.96 (m, 7 H) 2.10 - 2.66 (m, 6 H) 2.29 - 2.31 (m, 6 H) 2.32 - 2.34 (m, 3 H) 2.75 - 2.84 (m, 1 H) 2.86 - 3.04 (m, 2 H) 3.17 - 3.28 (m, 1 H) 3.23 - 3.24 (m, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.33 - 3.62 (m, 4 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.96 - 4.19 (m, 2 H) 4.39 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.80 - 4.96 (m, 2 H) 7.55 - 7.62 (m, 2 H) 7.74 (t, J=7.79 Hz, 1 H) 7.77 - 7.89 (m, 1 H) 7.84 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.91 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.14 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 8.19 (s, 1 H) 8.38 (s, 1 H) 9.20 (s, 1 H)
50		933.8	(600 MHz) : 0.80 - 0.93 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.14 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 - 1.26 (m, 2 H) 1.20 - 1.24 (m, 3 H) 1.21 - 1.23 (m, 3 H) 1.28 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.46 - 1.60 (m, 3 H) 1.64 (d, J=12.38 Hz, 1 H) 1.75 (s, 2 H) 1.93 (s, 1 H) 2.11 - 2.39 (m, 4 H) 2.26 - 2.28 (m, 6 H) 2.33 - 2.36 (m, 3 H) 2.39 - 2.59 (m, 2 H) 2.74 - 2.83 (m, 1 H) 2.91 (s, 1 H) 3.00 (t, J=9.86 Hz, 1 H) 3.19 (dd, J=10.09, 7.34 Hz, 1 H) 3.22 - 3.40 (m, 2 H) 3.23 - 3.25 (m, 3 H) 3.29 - 3.32 (m, 3 H) 3.41 - 3.52 (m, 2 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.96 - 4.09 (m, 2 H) 4.40 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.69 - 5.01 (m, 2 H) 6.41 - 6.46 (m, 1 H) 6.62 (d, J=3.21 Hz, 1 H) 7.23 - 7.29 (m, 2 H) 7.29 - 7.34 (m, 1 H) 7.42 (s, 1 H) 7.68 (s, 1 H)
51			(600 MHz) : 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.25 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.27 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.35 - 1.42 (m, 1 H) 1.45 - 1.60 (m, 3 H) 1.61 - 1.65 (m, 1 H) 1.73 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.86 (m, 1 H) 2.10 - 2.17 (m, 1 H) 2.22 - 2.43 (m, 4 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.43 - 2.49 (m, 1 H) 2.68 (t, J=6.88 Hz, 2 H) 2.76 - 2.81 (m, 1 H) 2.91 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 2.99 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 3.19 (dd, J=10.09, 7.34 Hz, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.37 - 3.41 (m, 1 H) 3.42 - 3.48 (m, 1 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.02 - 4.07 (m, 1 H) 4.12 - 4.16 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.69 - 4.74 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.58 Hz, 1 H)
52		739.6	(600 MHz) : 0.79 - 0.89 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.12 - 1.27 (m, 2 H) 1.18 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.66 (d, J=11.00 Hz, 1 H) 1.79 - 1.89 (m, 1 H) 2.21 - 2.42 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.43 - 2.52 (m, 2 H) 2.77 - 2.88 (m, 1 H) 2.96 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.00 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 3.17 - 3.23 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.38 - 3.50 (m, 2 H) 3.59 - 3.73 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.00 - 4.08 (m, 1 H) 4.08 - 4.16 (m, 1 H) 4.39 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.85 - 4.95 (m, 1 H) 4.90 (d, J=5.04 Hz, 1 H)
53		934.7	(600 MHz) : 0.78 - 0.88 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 - 1.26 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.20 - 1.23 (m, 3 H) 1.21 - 1.23 (m, 3 H) 1.28 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.55 - 1.72 (m, 3 H) 1.75 - 1.91 (m, 3 H) 2.12 - 2.32 (m, 4 H) 2.27 - 2.29 (m, 6 H) 2.34 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.42 - 2.51 (m, 2 H) 2.75 - 2.83 (m, 1 H) 2.93 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=8.25 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.32, 7.11 Hz, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.34 - 3.41 (m, 1 H) 3.41 - 3.50 (m, 2 H) 3.50 - 3.60 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.01 - 4.07 (m, 1 H) 4.11 (s, 1 H) 4.39 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.81 (s, 1 H) 4.91 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 6.39 (s, 1 H) 7.09 (dd, J=5.04, 3.67 Hz, 1 H) 7.30 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 7.38 (d, J=3.67 Hz, 1 H) 7.42 (t, J=7.79 Hz, 1 H) 7.63 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.71 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 7.98 - 8.06 (m, 1 H)
54		934.7	(600 MHz) : 0.77 - 0.90 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.12 - 1.26 (m, 2 H) 1.17 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.20 - 1.24 (m, 3 H) 1.22 - 1.23 (m, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.13, 4.59 Hz, 1 H) 1.55 - 1.74 (m, 3 H) 1.76 - 1.91 (m, 3 H) 2.08 - 2.58 (m, 7 H) 2.29 - 2.32 (m, 6 H) 2.37 - 2.40 (m, 3 H) 2.76 - 2.86 (m, 1 H) 2.88 - 3.05 (m, 2 H) 3.17 - 3.34 (m, 2 H) 3.22 - 3.25 (m, 3 H) 3.31 - 3.32 (m, 3 H) 3.34 - 3.52 (m, 3 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.01 - 4.08 (m, 1 H) 4.13 (s, 1 H) 4.39 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.77 (s, 1 H) 4.92 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.14 (s, 1 H) 6.43 - 6.47 (m, 1 H) 6.64 (d, J=3.21 Hz, 1 H) 7.01 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.34 (t, J=8.02 Hz, 1 H) 7.43 (d, J=14.67 Hz, 2 H) 7.49 (d, J=7.79 Hz, 1 H)

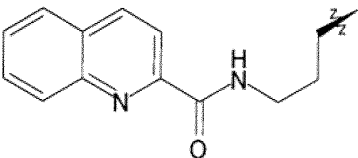
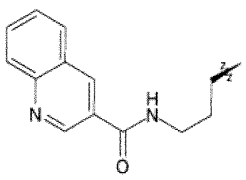
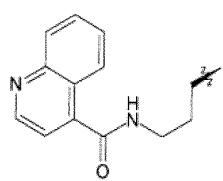
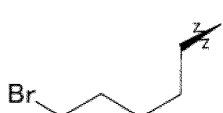
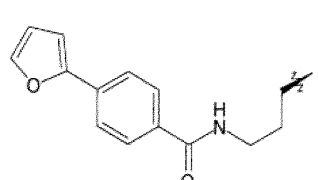
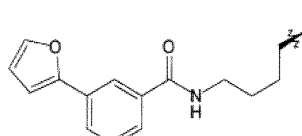
10

20

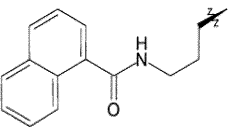
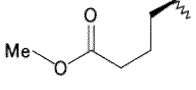
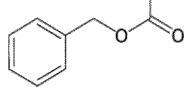
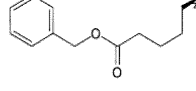
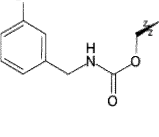
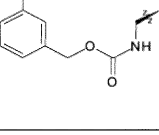
30

40

【表 1 - 8】

55		903.7	(600 MHz) : 0.76 - 0.86 (m, 6 H) 1.03 - 1.25 (m, 2 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.20 - 1.23 (m, 3 H) 1.21 - 1.22 (m, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.59 - 1.96 (m, 6 H) 2.10 - 2.32 (m, 4 H) 2.26 - 2.29 (m, 6 H) 2.35 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 2.37 (s, 3 H) 2.40 - 2.50 (m, 2 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.93 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.40 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.32, 7.11 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 - 3.49 (m, 2 H) 3.49 - 3.60 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.01 - 4.08 (m, 1 H) 4.15 (s, 1 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.79 (s, 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 7.58 - 7.64 (m, 1 H) 7.74 - 7.78 (m, 1 H) 7.87 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 8.11 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 8.25 - 8.36 (m, 2 H)
56		903.7	(600 MHz) : 0.78 - 0.90 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 - 1.25 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.19 - 1.23 (m, 3 H) 1.21 - 1.23 (m, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.61 - 1.66 (m, 1 H) 1.66 - 1.94 (m, 5 H) 2.15 - 2.31 (m, 4 H) 2.26 - 2.28 (m, 6 H) 2.34 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.41 - 2.53 (m, 2 H) 2.75 - 2.86 (m, 1 H) 2.93 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.40 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.32, 7.11 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.34 - 3.57 (m, 3 H) 3.58 - 3.68 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.00 - 4.08 (m, 1 H) 4.12 (s, 1 H) 4.40 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.84 (s, 1 H) 4.91 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 6.69 (s, 1 H) 7.60 (t, J=6.88 Hz, 1 H) 7.79 (t, J=6.88 Hz, 1 H) 7.92 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.14 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 8.62 (s, 1 H) 9.28 (s, 1 H)
57		903.7	(600 MHz) : 0.75 - 0.86 (m, 6 H) 1.05 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.23 (m, 2 H) 1.10 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.19 (s, 3 H) 1.25 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 1.49 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.54 - 1.91 (m, 6 H) 2.11 - 2.28 (m, 4 H) 2.24 - 2.26 (m, 6 H) 2.30 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.35 (s, 3 H) 2.38 - 2.49 (m, 2 H) 2.72 - 2.80 (m, 1 H) 2.92 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 2.97 (t, J=9.17 Hz, 1 H) 3.17 (dd, J=10.09, 7.34 Hz, 1 H) 3.19 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.31 - 3.39 (m, 1 H) 3.40 - 3.47 (m, 1 H) 3.47 - 3.63 (m, 2 H) 3.66 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.97 - 4.04 (m, 1 H) 4.08 (s, 1 H) 4.36 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.78 (s, 1 H) 4.86 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 6.29 (s, 1 H) 7.40 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 7.55 - 7.60 (m, 1 H) 7.70 - 7.75 (m, 1 H) 8.10 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 8.18 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.90 (d, J=4.13 Hz, 1 H)
58		839.5	(600 MHz) : 0.78 - 0.84 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.17 - 1.27 (m, 2 H) 1.22 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.33 - 1.89 (m, 7 H) 1.53 (dd, J=15.13, 4.59 Hz, 1 H) 1.61 - 1.71 (m, 1 H) 1.71 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.88 (m, 1 H) 2.08 - 2.19 (m, 1 H) 2.21 - 2.55 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.75 - 2.83 (m, 1 H) 2.91 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.40 Hz, 1 H) 3.18 - 3.24 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.36 - 3.43 (m, 2 H) 3.43 - 3.49 (m, 1 H) 3.51 (t, J=6.65 Hz, 2 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.02 - 4.09 (m, 1 H) 4.12 - 4.17 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.67 - 4.75 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
59		918.7	(600 MHz) : 0.79 - 0.88 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.25 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.20 - 1.23 (m, 3 H) 1.21 - 1.23 (m, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.13, 4.59 Hz, 1 H) 1.55 - 1.74 (m, 3 H) 1.75 - 1.95 (m, 3 H) 2.13 - 2.39 (m, 4 H) 2.27 - 2.29 (m, 6 H) 2.35 - 2.36 (m, 3 H) 2.41 - 2.52 (m, 2 H) 2.76 - 2.83 (m, 1 H) 2.92 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.40 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.09, 6.88 Hz, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.34 - 3.50 (m, 3 H) 3.50 - 3.58 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.01 - 4.08 (m, 1 H) 4.13 (s, 1 H) 4.39 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.80 (s, 1 H) 4.91 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.36 (s, 1 H) 6.49 (dd, J=3.44, 1.60 Hz, 1 H) 6.74 (d, J=2.75 Hz, 1 H) 7.50 (d, J=1.38 Hz, 1 H) 7.68 - 7.73 (m, 2 H) 7.79 (d, J=8.25 Hz, 2 H)
60		932.7	(500 MHz) : 0.74 - 0.93 (m, 6 H) 1.07 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.68 Hz, 3 H) 1.25 (dd, J=30.17, 6.03 Hz, 8 H) 1.18 - 1.25 (m, 6 H) 1.28 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.30 - 1.32 (m, 3 H) 1.75 - 1.90 (m, 3 H) 2.09 - 2.40 (m, 4 H) 2.32 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.40 - 2.58 (m, 2 H) 2.71 - 2.82 (m, 1 H) 2.87 - 2.96 (m, 1 H) 2.96 - 3.03 (m, 1 H) 3.18 - 3.27 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.33 - 3.54 (m, 4 H) 3.69 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.98 - 4.07 (m, 1 H) 4.07 - 4.16 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.64 - 4.83 (m, 1 H) 4.88 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 6.14 - 6.28 (m, 1 H) 6.48 (dd, J=3.43, 1.78 Hz, 1 H) 6.73 (d, J=3.02 Hz, 1 H) 7.43 (t, J=7.68 Hz, 1 H) 7.48 (d, J=1.10 Hz, 1 H) 7.62 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 7.75 - 7.81 (m, 1 H) 8.01 - 8.08 (m, 1 H)

【表 1 - 9】

61		902.7	(500 MHz) : 0.78 - 0.88 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.17 - 1.35 (m, 8 H) 1.28 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.08, 4.94 Hz, 1 H) 1.56 - 1.77 (m, 3 H) 1.78 - 1.97 (m, 3 H) 2.12 - 2.36 (m, 10 H) 2.38 (s, 3 H) 2.41 - 2.54 (m, 2 H) 2.73 - 2.85 (m, 1 H) 2.88 - 3.05 (m, 2 H) 3.15 - 3.27 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.29 - 3.33 (m, 3 H) 3.34 - 3.50 (m, 2 H) 3.50 - 3.65 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.98 - 4.09 (m, 1 H) 4.08 - 4.19 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.72 - 4.86 (m, 1 H) 4.91 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 6.03 - 6.16 (m, 1 H) 7.41 - 7.47 (m, 1 H) 7.48 - 7.56 (m, 2 H) 7.58 (dd, J=7.13, 1.10 Hz, 1 H) 7.85 (d, J=9.05 Hz, 1 H) 7.90 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 8.28 (d, J=8.23 Hz, 1 H)
62		791.6	(500 MHz) : 0.74 - 0.87 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.18 - 1.91 (m, 14 H) 1.28 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.22, 5.07 Hz, 1 H) 2.05 - 2.39 (m, 16 H) 2.38 - 2.54 (m, 2 H) 2.74 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 - 2.96 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.74 Hz, 1 H) 3.16 - 3.25 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 - 3.42 (m, 1 H) 3.43 - 3.51 (m, 1 H) 3.66 (s, 3 H) 3.69 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 4.00 - 4.09 (m, 1 H) 4.10 - 4.18 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.66 - 4.78 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.39 Hz, 1 H)
63		839.6	(500 MHz) : 0.77 - 0.83 (m, 6 H) 1.05 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.17 - 1.26 (m, 2 H) 1.22 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.49 - 1.55 (m, 1 H) 1.63 - 1.74 (m, 1 H) 1.76 - 1.90 (m, 1 H) 2.16 - 2.38 (m, 13 H) 2.38 - 2.53 (m, 2 H) 2.59 (dd, J=15.91, 4.66 Hz, 1 H) 2.65 - 2.73 (m, 1 H) 2.77 - 2.91 (m, 2 H) 2.98 - 3.07 (m, 2 H) 3.15 - 3.24 (m, 1 H) 3.21 - 3.22 (m, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.36 - 3.54 (m, 2 H) 3.68 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.99 - 4.07 (m, 1 H) 4.08 - 4.17 (m, 1 H) 4.37 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.89 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 5.07 - 5.15 (m, 3 H) 7.27 - 7.40 (m, 5 H)
64		749.6	(500 MHz) : 0.73 - 0.96 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.18 - 1.47 (m, 14 H) 1.50 - 1.77 (m, 2 H) 1.89 - 2.91 (m, 8 H) 2.35 (br. s., 6 H) 2.63 (s, 3 H) 3.01 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 3.17 - 3.25 (m, 1 H) 3.26 - 3.82 (m, 6 H) 3.32 (s, 3 H) 3.63 (s, 3 H) 3.83 - 3.96 (m, 1 H) 3.96 - 4.07 (m, 1 H) 4.41 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.85 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.06 - 5.15 (m, 1 H)
65		881.7	(500 MHz) : 0.78 - 0.85 (m, 6 H) 1.09 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.13 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.19 - 1.91 (m, 17 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 2.05 - 2.17 (m, 1 H) 2.16 - 2.62 (m, 17 H) 2.73 - 2.82 (m, 1 H) 2.86 - 2.95 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.94 Hz, 1 H) 3.16 - 3.30 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.39 (s, 1 H) 3.44 - 3.51 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 3.99 - 4.10 (m, 1 H) 4.11 - 4.19 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.63 - 4.75 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.10 (s, 2 H) 7.28 - 7.40 (m, 5 H)
66		723.6	(600 MHz) : 0.77 - 0.93 (m, 6 H) 1.04 - 1.37 (m, 20 H) 1.51 - 1.58 (m, 1 H) 1.61 - 1.71 (m, 1 H) 1.81 - 1.92 (m, 1 H) 2.18 - 2.57 (m, 6 H) 2.29 (s, 6 H) 2.32 (s, 3 H) 2.79 - 2.88 (m, 1 H) 2.90 - 3.06 (m, 2 H) 3.15 - 3.52 (m, 3 H) 3.24 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.99 - 4.15 (m, 2 H) 4.35 - 4.63 (m, 3 H) 4.86 - 4.94 (m, 1 H) 4.94 - 5.04 (m, 1 H)
67		717.5	(600 MHz) : 0.75 - 0.92 (m, 6 H) 1.05 - 1.38 (m, 20 H) 1.54 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.55 - 1.72 (m, 1 H) 1.81 - 1.94 (m, 1 H) 2.16 - 2.54 (m, J=34.85 Hz, 6 H) 2.29 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.77 - 3.05 (m, 3 H) 3.16 - 3.55 (m, 3 H) 3.25 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.72 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.00 - 4.09 (m, 1 H) 4.10 - 4.21 (m, 1 H) 4.41 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.87 - 4.93 (m, 1 H) 5.09 - 5.31 (m, 3 H) 5.81 - 5.96 (m, 1 H)
68		932.7	(600 MHz) : 0.78 - 0.91 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.17 - 1.26 (m, 2 H) 1.22 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.56 - 1.72 (m, 1 H) 1.76 - 1.92 (m, 1 H) 2.16 - 2.39 (m, 4 H) 2.29 - 2.32 (m, 6 H) 2.33 - 2.35 (m, 3 H) 2.40 - 2.54 (m, 2 H) 2.74 - 2.84 (m, 1 H) 2.93 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.40 Hz, 1 H) 3.17 - 3.25 (m, 1 H) 3.22 - 3.24 (m, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 - 3.51 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.01 - 4.07 (m, 1 H) 4.07 - 4.13 (m, 1 H) 4.18 - 4.37 (m, 4 H) 4.39 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.91 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 4.94 - 5.06 (m, 2 H) 7.15 - 7.22 (m, 2 H) 7.37 - 7.45 (m, 2 H)
69		932.7	(600 MHz) : 0.78 - 0.90 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.27 (m, 2 H) 1.12 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.57 - 1.71 (m, 1 H) 1.80 - 1.92 (m, 1 H) 2.12 - 2.39 (m, 13 H) 2.40 - 2.58 (m, 2 H) 2.73 - 2.83 (m, 1 H) 2.91 - 3.04 (m, 2 H) 3.17 - 3.26 (m, 1 H) 3.22 - 3.24 (m, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.33 - 3.43 (m, 2 H) 3.44 - 3.54 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.00 - 4.12 (m, 2 H) 4.40 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.84 (s, 1 H) 4.88 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.04 (s, 2 H) 5.07 (s, 1 H) 7.17 - 7.29 (m, 2 H) 7.42 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 7.48 (s, 1 H)

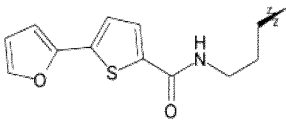
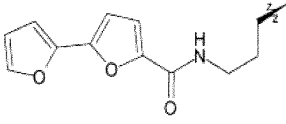
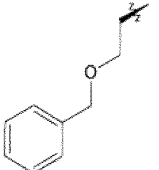
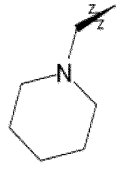
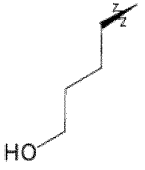
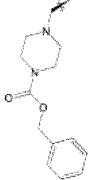
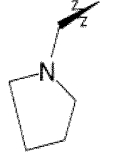
10

20

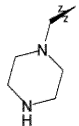
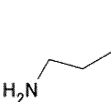
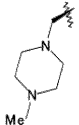
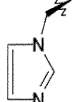
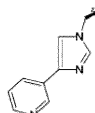
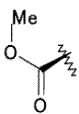
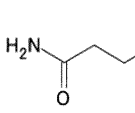
30

40

【表 1 - 1 1】

77		924.7	(600 MHz) : 0.83 - 0.94 (m, 6 H) 1.14 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 - 1.31 (m, 2 H) 1.21 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.26 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.27 (s, 3 H) 1.33 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.36 (s, 3 H) 1.54 - 1.73 (m, 4 H) 1.74 - 2.10 (m, 3 H) 2.16 - 2.45 (m, 4 H) 2.31 - 2.34 (m, 6 H) 2.40 - 2.41 (m, 3 H) 2.45 - 2.58 (m, 2 H) 2.79 - 2.89 (m, 1 H) 2.96 (d, J=13.30 Hz, 1 H) 3.01 - 3.09 (m, 1 H) 3.25 (dd, J=10.09, 7.34 Hz, 1 H) 3.28 (s, 3 H) 3.36 (s, 3 H) 3.38 - 3.61 (m, 4 H) 3.75 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.06 - 4.13 (m, 1 H) 4.17 (s, 1 H) 4.44 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.84 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.39 (s, 1 H) 6.48 - 6.52 (m, 1 H) 6.62 - 6.65 (m, 1 H) 7.21 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 7.45 - 7.52 (m, 2 H)
78		908.8	(600 MHz) : 0.77 - 0.88 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.25 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.55 - 1.71 (m, 3 H) 1.72 - 1.94 (m, 3 H) 1.72 - 2.20 (m, 1 H) 2.21 - 2.35 (m, 3 H) 2.26 - 2.28 (m, 6 H) 2.34 - 2.37 (m, 3 H) 2.39 - 2.51 (m, 2 H) 2.76 - 2.84 (m, 1 H) 2.92 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.63 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.09, 7.34 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.34 - 3.53 (m, 4 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.01 - 4.07 (m, 1 H) 4.12 (s, 1 H) 4.38 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.78 (s, 1 H) 4.91 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 6.44 - 6.51 (m, 2 H) 6.60 (d, J=3.21 Hz, 1 H) 6.70 (d, J=3.67 Hz, 1 H) 7.14 (d, J=3.67 Hz, 1 H) 7.43 - 7.47 (m, 1 H)
79		825.8	(600 MHz) : 0.73 - 0.80 (m, 6 H) 1.03 - 1.06 (m, 7 H) 1.19 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.19 - 1.20 (m, 3 H) 1.21 - 1.23 (m, 1 H) 1.25 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 1.50 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.62 (d, J=12.38 Hz, 1 H) 1.74 - 1.85 (m, 2 H) 1.97 - 2.17 (m, 2 H) 2.18 - 2.30 (m, 3 H) 2.26 (s, 6 H) 2.33 (s, 3 H) 2.34 - 2.49 (m, 3 H) 2.70 - 2.77 (m, 1 H) 2.92 - 3.00 (m, 2 H) 3.13 - 3.20 (m, 1 H) 3.19 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.34 - 3.46 (m, 3 H) 3.46 - 3.51 (m, 1 H) 3.66 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.98 - 4.05 (m, 1 H) 4.10 - 4.15 (m, 1 H) 4.34 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.42 (s, 2 H) 4.85 - 4.93 (m, 1 H) 4.90 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 7.20 - 7.32 (m, 5 H)
80		788.7	(600 MHz) : 0.74 - 0.79 (m, 6 H) 1.04 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.21 (m, 2 H) 1.11 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.18 (s, 3 H) 1.23 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.27 (s, 3 H) 1.31 - 1.36 (m, 2 H) 1.40 - 1.52 (m, 5 H) 1.60 (d, J=12.38 Hz, 1 H) 1.64 - 1.85 (m, 2 H) 2.13 - 2.48 (m, 12 H) 2.24 (s, 6 H) 2.31 (s, 3 H) 2.69 - 2.77 (m, 1 H) 2.81 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.95 (t, J=9.86 Hz, 1 H) 3.10 - 3.21 (m, 1 H) 3.17 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.36 - 3.46 (m, 2 H) 3.65 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.96 - 4.03 (m, 1 H) 4.06 - 4.12 (m, 1 H) 4.33 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.75 - 4.96 (m, 1 H) 4.88 (d, J=5.04 Hz, 1 H)
81		763.7	(600 MHz) : 0.77 - 0.85 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 - 1.26 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 2 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.36 - 1.91 (m, 10 H) 2.09 - 2.20 (m, 1 H) 2.20 - 2.32 (m, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.33 - 2.52 (m, 3 H) 2.36 (s, 3 H) 2.76 - 2.83 (m, 1 H) 2.92 (d, J=17.42 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.40 Hz, 1 H) 3.17 - 3.25 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 - 3.51 (m, 2 H) 3.59 - 3.65 (m, 2 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.01 - 4.08 (m, 1 H) 4.11 - 4.17 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.68 - 4.78 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
82		923.8	(600 MHz) : 0.80 - 0.85 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.17 - 1.26 (m, 2 H) 1.22 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.48 - 1.93 (m, 3 H) 2.18 - 2.60 (m, 13 H) 2.35 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.72 - 2.82 (m, 1 H) 2.87 (d, J=16.51 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.86 Hz, 1 H) 3.16 - 3.25 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.39 - 3.52 (m, 6 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.01 - 4.07 (m, 1 H) 4.07 - 4.13 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.91 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.94 - 4.98 (m, 1 H) 5.11 (s, 2 H) 7.27 - 7.38 (m, 5 H)
83		774.7	(600 MHz) : 0.78 - 0.87 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.11 - 1.27 (m, 8 H) 1.15 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.60 - 1.80 (m, 4 H) 1.65 (d, J=12.84 Hz, 1 H) 1.80 - 1.89 (m, 1 H) 2.21 - 2.40 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.42 - 2.53 (m, 6 H) 2.56 (dd, J=12.15, 7.11 Hz, 1 H) 2.66 - 2.75 (m, 1 H) 2.75 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 2.98 - 3.03 (m, 1 H) 3.17 - 3.25 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.41 - 3.51 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.01 - 4.09 (m, 1 H) 4.12 - 4.18 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.85 - 4.91 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H)

【表 1 - 1 2】

84		735.6	(600 MHz) : 0.83 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 0.85 (d, J=4.59 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.24 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.21 (s, 3 H) 1.25 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.58 - 1.70 (m, 1 H) 1.71 - 1.81 (m, 2 H) 1.81 - 1.91 (m, 1 H) 2.15 - 2.31 (m, 5 H) 2.26 (s, 6 H) 2.32 - 2.54 (m, 3 H) 2.35 (s, 3 H) 2.73 - 2.82 (m, 1 H) 2.90 - 3.01 (m, 1 H) 2.98 (t, J=9.86 Hz, 1 H) 3.16 - 3.21 (m, 2 H) 3.22 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.41 - 3.50 (m, 2 H) 3.60 - 3.67 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.98 - 4.06 (m, 1 H) 4.06 - 4.13 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.87 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 4.93 - 5.01 (m, 1 H)
85		789.8	(600 MHz) : 0.78 - 0.86 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.26 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.27 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.60 - 1.66 (m, 1 H) 1.79 - 1.90 (m, 1 H) 2.20 - 2.33 (m, 3 H) 2.27 (s, 6 H) 2.34 - 2.54 (m, 9 H) 2.35 (s, 3 H) 2.74 - 2.90 (m, 6 H) 2.99 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 3.16 - 3.23 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.41 - 3.49 (m, 2 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.01 - 4.07 (m, 1 H) 4.08 - 4.14 (m, 1 H) 4.37 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.92 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 4.93 - 4.98 (m, 1 H)
86			(600 MHz) : 0.78 - 0.85 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.34 Hz, 2 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.11 - 1.27 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.33 - 1.90 (m, 6 H) 1.53 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 2.10 - 2.53 (m, 6 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.68 (t, J=7.11 Hz, 2 H) 2.75 - 2.82 (m, 1 H) 2.91 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.00 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 3.17 - 3.24 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 - 3.43 (m, 1 H) 3.42 - 3.51 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.00 - 4.08 (m, 1 H) 4.10 - 4.17 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.67 - 4.78 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
87		803.8	(600 MHz) : 0.77 - 0.88 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.21 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.22 - 1.23 (m, 3 H) 1.27 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.66 - 1.73 (m, 1 H) 1.79 - 1.91 (m, 1 H) 2.15 - 2.65 (m, 16 H) 2.30 (s, 3 H) 2.33 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.74 - 2.81 (m, 1 H) 2.88 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.00 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 3.17 - 3.26 (m, 4 H) 3.32 (s, 3 H) 3.39 - 3.52 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.99 - 4.07 (m, 1 H) 4.08 - 4.14 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.92 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.93 - 4.99 (m, 1 H)
88		771.7	(600 MHz) : 0.82 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 0.85 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 0.88 - 0.99 (m, 3 H) 1.07 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 - 1.25 (m, 8 H) 1.27 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.49 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.65 (d, J=13.76 Hz, 1 H) 1.74 - 1.91 (m, 1 H) 2.18 - 2.36 (m, 4 H) 2.28 (s, 6 H) 2.39 (s, 3 H) 2.43 - 2.53 (m, 2 H) 2.65 - 2.74 (m, 1 H) 2.94 - 3.01 (m, 1 H) 3.06 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 3.15 - 3.21 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.35 - 3.49 (m, 2 H) 3.66 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.97 - 4.05 (m, 2 H) 4.08 (dd, J=14.21, 3.21 Hz, 1 H) 4.19 - 4.29 (m, 1 H) 4.37 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.82 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 4.91 - 5.02 (m, 1 H) 6.90 (s, 1 H) 7.02 (s, 1 H) 7.46 (s, 1 H)
89		847.5	(600 MHz) : 0.75 - 0.91 (m, 9 H) 1.03 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.28 (m, 11 H) 1.29 (s, 3 H) 1.43 (dd, J=15.13, 4.59 Hz, 1 H) 1.51 - 1.88 (m, 2 H) 2.15 - 2.34 (m, 11 H) 2.39 (s, 3 H) 2.42 - 2.54 (m, 2 H) 2.66 - 2.74 (m, 1 H) 2.94 (t, J=9.40 Hz, 1 H) 3.05 - 3.20 (m, 2 H) 3.17 (s, 3 H) 3.24 (s, 3 H) 3.25 - 3.47 (m, 2 H) 3.63 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.92 - 4.03 (m, 2 H) 4.11 (dd, J=14.21, 2.75 Hz, 1 H) 4.21 - 4.29 (m, 1 H) 4.33 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.77 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.93 - 5.04 (m, 1 H) 7.24 (s, 1 H) 7.26 (dd, J=8.02, 4.81 Hz, 1 H) 7.51 (s, 1 H) 8.03 (td, J=7.91, 2.06, 1.95 Hz, 1 H) 8.43 (dd, J=4.81, 1.60 Hz, 1 H) 8.90 (d, J=1.83 Hz, 1 H)
90		749.6	(500 MHz) : 0.85 - 0.96 (m, 6 H) 1.11 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.15 - 1.34 (m, 8 H) 1.18 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.26 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=14.91, 4.97 Hz, 1 H) 1.65 - 1.73 (m, 1 H) 1.89 - 2.00 (m, 1 H) 2.15 - 2.42 (m, 13 H) 2.44 - 2.54 (m, 1 H) 2.55 - 2.63 (m, 1 H) 2.64 - 2.76 (m, 1 H) 2.90 - 2.97 (m, 1 H) 2.97 - 3.03 (m, 1 H) 3.03 - 3.13 (m, 1 H) 3.19 - 3.29 (m, 1 H) 3.26 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.44 - 3.56 (m, 2 H) 3.70 - 3.77 (m, 1 H) 3.73 (s, 3 H) 3.99 - 4.08 (m, 1 H) 4.08 - 4.27 (m, 1 H) 4.44 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.72 - 4.78 (m, 1 H) 5.06 - 5.15 (m, 1 H)
91		790.7	(500 MHz) : 0.74 - 0.87 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.18 - 1.91 (m, 17 H) 1.28 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 2.09 - 2.58 (m, 9 H) 2.31 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.71 - 2.85 (m, 1 H) 2.86 - 2.96 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.60 Hz, 1 H) 3.18 - 3.25 (m, 4 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 - 3.43 (m, 1 H) 3.43 - 3.52 (m, 1 H) 3.66 - 3.73 (m, J=7.95 Hz, 1 H) 3.99 - 4.08 (m, 1 H) 4.09 - 4.19 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.65 - 4.80 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 5.17 - 5.32 (m, 1 H) 5.33 - 5.53 (m, 1 H)

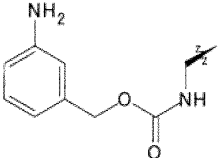
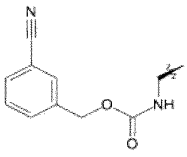
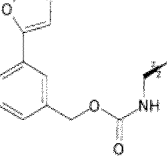
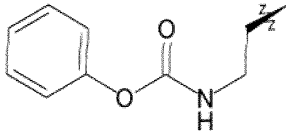
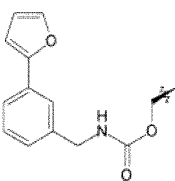
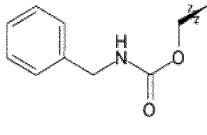
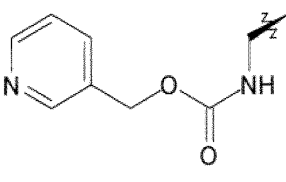
10

20

30

40

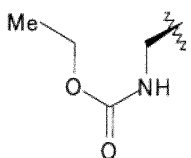
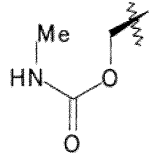
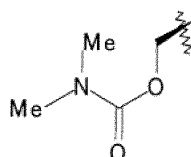
【表 1 - 1 3】

92		869.7	(600 MHz) : 0.78 - 0.88 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.17 - 1.30 (m, 2 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.13, 4.59 Hz, 1 H) 1.61 - 1.70 (m, 1 H) 1.79 - 1.92 (m, 1 H) 2.18 - 2.37 (m, 4 H) 2.27 - 2.30 (m, 6 H) 2.34 - 2.35 (m, 3 H) 2.42 - 2.52 (m, 2 H) 2.73 - 2.83 (m, 1 H) 2.93 - 3.04 (m, 2 H) 3.16 - 3.41 (m, 3 H) 3.22 - 3.24 (m, 3 H) 3.30 - 3.32 (m, 3 H) 3.42 - 3.58 (m, 3 H) 3.64 - 3.77 (m, 1 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.99 - 4.14 (m, 2 H) 4.39 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.85 (s, 1 H) 4.89 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.94 - 5.10 (m, 3 H) 6.60 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 6.63 (s, 1 H) 6.69 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 7.11 (t, J=7.79 Hz, 1 H)
93		879.7	(600 MHz) : 0.77 - 0.90 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 - 1.30 (m, 2 H) 1.22 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 - 1.24 (m, 3 H) 1.28 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.48 - 1.58 (m, 2 H) 1.79 - 1.93 (m, 1 H) 2.07 - 2.40 (m, 14 H) 2.39 - 2.56 (m, 2 H) 2.74 - 2.83 (m, 1 H) 2.93 - 3.05 (m, 2 H) 3.17 - 3.27 (m, 1 H) 3.22 - 3.24 (m, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.33 - 3.56 (m, 4 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.96 - 4.16 (m, 2 H) 4.40 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.79 - 4.91 (m, 2 H) 5.10 (s, 2 H) 5.16 (s, 1 H) 7.45 (t, J=7.79 Hz, 1 H) 7.52 - 7.69 (m, 3 H)
94		920.8	(600 MHz) : 0.77 - 0.91 (m, 6 H) 1.02 - 1.37 (m, 20 H) 1.47 - 1.56 (m, 1 H) 1.61 - 1.72 (m, 1 H) 1.80 - 1.93 (m, 1 H) 2.17 - 2.54 (m, 6 H) 2.30 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.72 - 2.82 (m, 1 H) 2.93 - 3.05 (m, 2 H) 3.15 - 3.56 (m, 5 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.99 - 4.13 (m, 2 H) 4.39 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.78 - 4.92 (m, 2 H) 5.03 - 5.16 (m, 3 H) 6.42 - 6.51 (m, 1 H) 6.62 - 6.71 (m, 1 H) 7.19 - 7.69 (m, 5 H)
95		854.7	(600 MHz) : 0.81 - 0.89 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 - 1.26 (m, 2 H) 1.19 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.55 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.62 - 1.72 (m, 1 H) 1.77 - 1.93 (m, 3 H) 2.19 - 2.42 (m, 7 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.44 - 2.52 (m, 2 H) 2.78 - 2.87 (m, 1 H) 2.90 - 3.15 (m, 4 H) 3.17 - 3.26 (m, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.38 - 3.51 (m, 3 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.00 - 4.08 (m, 1 H) 4.09 - 4.18 (m, 1 H) 4.40 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.86 - 4.98 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.34 - 5.50 (brs, 1 H) 7.11 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 7.18 (t, J=7.34 Hz, 1 H) 7.34 (t, J=8.02 Hz, 2 H)
96		920.8	(500 MHz) : 0.75 - 0.90 (m, 6 H) 1.06 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.11 - 1.39 (m, 2 H) 1.20 - 1.24 (m, 6 H) 1.27 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.41 - 2.06 (m, 3 H) 2.15 - 2.55 (m, 14 H) 2.55 - 2.69 (m, 1 H) 2.72 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 - 2.97 (m, 1 H) 3.00 (d, J=6.86 Hz, 1 H) 3.20 - 3.32 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.35 - 3.54 (m, 2 H) 3.69 (d, J=7.68 Hz, 1 H) 3.97 - 4.13 (m, 2 H) 4.16 - 4.47 (m, 5 H) 4.84 - 4.91 (m, 1 H) 4.93 - 5.08 (m, 2 H) 6.46 (dd, J=3.29, 1.92 Hz, 1 H) 6.66 (dd, J=3.43, 0.69 Hz, 1 H) 7.14 - 7.19 (m, 1 H) 7.34 (m, 1 H) 7.44 - 7.48 (m, 1 H) 7.53 - 7.61 (m, 2 H)
97		854.8	(500 MHz) : 0.74 - 0.88 (m, 6 H) 1.06 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.09 - 1.75 (m, 4 H) 1.13 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.21 - 1.25 (m, 6 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.81 - 1.90 (m, 1 H) 2.12 - 2.56 (m, 16 H) 2.73 - 2.85 (m, 1 H) 2.90 - 2.99 (m, 1 H) 3.01 (t, J=9.56 Hz, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.25 - 3.36 (m, 1 H) 3.31 (s, 3 H) 3.36 - 3.45 (m, 1 H) 3.46 - 3.57 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 3.98 - 4.05 (m, 1 H) 4.05 - 4.13 (m, 1 H) 4.17 - 4.38 (m, 4 H) 4.41 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.89 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.92 - 5.02 (m, 1 H) 7.26 - 7.36 (m, 5 H)
98		855.8	(600 MHz) : 0.78 - 0.89 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 - 1.28 (m, 2 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.65 (d, J=13.30 Hz, 1 H) 1.80 - 1.91 (m, 1 H) 2.18 - 2.38 (m, 4 H) 2.27 - 2.29 (m, 6 H) 2.33 - 2.35 (m, 3 H) 2.40 - 2.54 (m, 2 H) 2.71 - 2.83 (m, 1 H) 2.92 - 3.05 (m, 2 H) 3.19 (dd, J=10.09, 7.34 Hz, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.30 - 3.32 (m, 3 H) 3.30 - 3.54 (m, 4 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.97 - 4.13 (m, 2 H) 4.39 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.84 (s, 1 H) 4.88 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.09 (s, 2 H) 5.15 (s, 1 H) 7.26 - 7.30 (m, 1 H) 7.67 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.55 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 8.58 (s, 1 H)

40

99		889.7	(600 MHz) : 0.77 – 0.86 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 – 1.26 (m, 2 H) 1.13 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.46 – 1.69 (m, 6 H) 1.84 (s, 1 H) 2.08 – 2.20 (m, 1 H) 2.21 – 2.31 (m, 2 H) 2.27 – 2.29 (m, 6 H) 2.32 – 2.37 (m, 1 H) 2.35 – 2.36 (m, 3 H) 2.37 – 2.51 (m, 2 H) 2.74 (t, J=6.65 Hz, 2 H) 2.76 – 2.82 (m, 1 H) 2.92 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 3.00 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.09, 7.34 Hz, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.33 – 3.50 (m, 2 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.01 – 4.08 (m, 1 H) 4.14 (s, 1 H) 4.25 (s, 2 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.74 (s, 1 H) 4.92 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 7.43 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 7.53 – 7.59 (m, 1 H) 7.67 – 7.73 (m, 1 H) 8.07 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 8.11 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.86 (d, J=4.13 Hz, 1 H)
100			(600 MHz) : 0.72 – 0.85 (m, 6 H) 1.00 – 1.35 (m, 2 H) 1.06 (d, J=5.04 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.18 – 1.25 (m, 6 H) 1.27 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.29 – 1.31 (m, 3 H) 1.38 – 1.68 (m, 6 H) 1.74 – 1.86 (m, 1 H) 1.92 – 2.42 (m, 12 H) 2.21 – 2.22 (m, 6 H) 2.45 (t, J=6.88 Hz, 2 H) 2.71 – 2.81 (m, 1 H) 2.90 (none, 1 H) 2.85 – 2.92 (m, 1 H) 2.99 (t, J=9.63 Hz, 1 H) 3.16 – 3.23 (m, 1 H) 3.19 – 3.21 (m, 3 H) 3.28 – 3.30 (m, 3 H) 3.33 – 3.41 (m, 1 H) 3.42 – 3.56 (m, 1 H) 3.68 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.82 – 3.92 (m, 2 H) 3.95 – 4.07 (m, 1 H) 4.07 – 4.18 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.66 (s, 1 H) 4.90 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 7.38 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 7.49 – 7.55 (m, 1 H) 7.65 – 7.71 (m, 1 H) 8.09 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 8.21 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 8.83 (d, J=4.13 Hz, 1 H)
101		890.6	(600 MHz) : 0.78 – 0.84 (m, 6 H) 1.05 – 1.10 (m, 3 H) 1.06 – 1.29 (m, 2 H) 1.13 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.21 – 1.25 (m, 6 H) 1.28 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.57 – 1.91 (m, 7 H) 2.06 – 2.17 (m, 1 H) 2.18 – 2.47 (m, 12 H) 2.34 – 2.36 (m, 3 H) 2.75 – 2.83 (m, 1 H) 2.90 – 2.97 (m, 1 H) 3.01 (t, J=10.09 Hz, 1 H) 3.16 – 3.27 (m, 1 H) 3.21 – 3.22 (m, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.39 (s, 1 H) 3.47 (s, 1 H) 3.54 – 3.65 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.03 (s, 1 H) 4.14 (s, 1 H) 4.39 (s, 1 H) 4.74 (s, 1 H) 4.91 (s, 1 H) 4.96 (s, 2 H) 7.45 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 7.53 – 7.59 (m, 1 H) 7.69 – 7.74 (m, 1 H) 7.98 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 8.12 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 8.89 (d, J=4.13 Hz, 1 H)
102		730.5	(500 MHz) : 0.82 – 0.93 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.64 Hz, 3 H) 1.12 – 1.31 (m, 2 H) 1.18 – 1.23 (m, 6 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.51 – 1.71 (m, 2 H) 1.83 – 1.93 (m, 1 H) 2.18 – 2.41 (m, 4 H) 2.30 (s, 6 H) 2.37 (d, J=15.29 Hz, 1 H) 2.40 (s, 3 H) 2.44 – 2.61 (m, 2 H) 2.66 – 2.75 (m, 2 H) 2.82 – 2.87 (m, 1 H) 2.97 – 3.08 (m, 2 H) 3.16 – 3.23 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.29 – 3.38 (m, 1 H) 3.33 (s, 3 H) 3.43 – 3.52 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.64 Hz, 1 H) 3.92 – 4.10 (m, 2 H) 4.41 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.89 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.94 – 5.03 (m, 1 H)
103		744.5	(500 MHz) : 0.82 – 0.93 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.64 Hz, 3 H) 1.12 – 1.31 (m, 2 H) 1.18 – 1.23 (m, 6 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.51 – 1.71 (m, 2 H) 1.83 – 1.93 (m, 1 H) 2.18 – 2.41 (m, 4 H) 2.30 (s, 6 H) 2.37 (d, J=15.29 Hz, 1 H) 2.40 (s, 3 H) 2.44 – 2.61 (m, 2 H) 2.66 – 2.75 (m, 2 H) 2.82 – 2.87 (m, 1 H) 2.97 – 3.08 (m, 2 H) 3.16 – 3.23 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.29 – 3.38 (m, 1 H) 3.33 (s, 3 H) 3.43 – 3.52 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.64 Hz, 1 H) 3.92 – 4.10 (m, 2 H) 4.41 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.89 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.94 – 5.03 (m, 1 H)
104		758.6	(500 MHz) : 0.75 – 0.88 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.11 – 1.27 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.29, 4.97 Hz, 1 H) 1.57 – 1.98 (m, 7 H) 2.11 – 2.20 (m, 1 H) 2.19 – 2.52 (m, 7 H) 2.28 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.73 – 2.84 (m, 1 H) 2.94 (d, J=14.91 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.75 Hz, 1 H) 3.15 – 3.22 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.33 – 3.42 (m, 1 H) 3.42 – 3.50 (m, 1 H) 3.69 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 4.00 – 4.09 (m, 1 H) 4.09 – 4.18 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.69 – 4.81 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
105		778.5	(600 MHz) : 0.81 – 0.86 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 – 1.25 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.1

【表 1 - 1 5】

106		792.5	(600 MHz) : 0.80 - 0.87 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 - 1.26 (m, 5 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=14.90, 4.81 Hz, 1 H) 1.61 - 1.68 (m, 1 H) 1.82 - 1.89 (m, 1 H) 2.21 - 2.38 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.42 - 2.51 (m, 2 H) 2.78 - 2.82 (m, 1 H) 2.95 - 2.98 (m, 1 H) 3.00 (t, J=10.09 Hz, 1 H) 3.18 - 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.32 - 3.42 (m, 2 H) 3.42 - 3.51 (m, 2 H) 3.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.01 - 4.12 (m, 4 H) 4.39 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.79 - 4.84 (m, 1 H) 4.90 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 4.92 - 4.96 (m, 1 H)
107		778.5	(600 MHz) : 0.80 - 0.86 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.25 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.52 - 1.56 (m, 1 H) 1.61 - 1.68 (m, 1 H) 1.83 - 1.87 (m, 1 H) 2.21 - 2.38 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.43 - 2.50 (m, 2 H) 2.78 (d, J=4.59 Hz, 3 H) 2.79 - 2.83 (m, 1 H) 2.89 - 2.94 (m, 1 H) 3.00 (t, J=10.09 Hz, 1 H) 3.19 - 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.38 - 3.50 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.02 - 4.07 (m, 1 H) 4.08 - 4.13 (m, 1 H) 4.17 - 4.25 (m, 2 H) 4.39 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.55 - 4.60 (m, 1 H) 4.91 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.93 - 4.97 (m, 1 H)
108		792.6	(600 MHz) : 0.79 - 0.84 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.25 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.63 - 1.69 (m, 1 H) 1.80 - 1.87 (m, 1 H) 2.25 (d, J=10.55 Hz, 1 H) 2.24 - 2.38 (m, 4 H) 2.28 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.42 - 2.50 (m, 2 H) 2.79 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 (s, 3 H) 2.90 (s, 3 H) 2.95 (d, J=16.05 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.86 Hz, 1 H) 3.18 - 3.22 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.41 - 3.50 (m, 2 H) 3.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.02 - 4.07 (m, 1 H) 4.11 - 4.13 (m, 1 H) 4.15 - 4.19 (m, 1 H) 4.27 (dd, J=11.46, 4.13 Hz, 1 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.92 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.95 - 5.00 (m, 1 H)

10

20

【 0 4 5 3】

実施例 7

(1) 実施例 1 で得られた化合物10.0gをテトラヒドロフラン30mlに溶解し、(R)-1,2-エポキシブタン3.62g、イッテルビウムトリフレート一水和物624mgを加えて封管中90℃にて1.25時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=30:1:0.1）にて精製して10a-N-(2-ヒドロキシブチル)体4.62gを得た。

【 0 4 5 4】

(2) 上記(1)で得られた化合物4.62gをクロロホルム25mlに溶解し、37%ホルムアルデヒド水溶液2.2ml、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム1.38gを加えて室温にて30分間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して10a-N-メチル体4.55gを得た。

30

【 0 4 5 5】

(3) 上記(2)で得られた化合物4.55gをテトラヒドロフラン20mlに溶解し、トリエチルアミン469mg、2,4,6-トリクロロベンゾイルクロリド1.13gを加えて室温にて3時間攪拌した。この溶液を4-ジメチルアミノピリジン12.9gのアセトニトリル溶液420mlに加熱還流下滴下した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に酢酸エチルと飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液し、有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン=65:5:0.1）にて精製して環化体2.46gを得た。

40

【 0 4 5 6】

(4) 上記(3)で得られた化合物600mgをテトラヒドロフラン10mlに溶解し、フッ化水素-ピリジン錯体161mgを加えて室温にて15時間攪拌した。反応液を飽和重曹水で中和後、10%水酸化ナトリウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=20:1:0.1から10:1:0.1）にて精製して表 1 で示される化合物311mgを得た。

【 0 4 5 7】

50

実施例 8

(1) 実施例 1 で得られた化合物 1.06g をトルエン 10ml に溶解し、トリエチルアミン 866mg、2-ブロモエタノール 666mg を加えて加熱還流下 2 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=25:1:0.1) にて精製して 10a-(N-2-ヒドロキシエチル)体 1.49g を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 1.49g を原料として実施例 7 (2)、(3)、(4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 135mg を得た。

【0458】

実施例 9

実施例 1 で得られた化合物 1.0g とベンジル(S)-(+)-グリシジルエーテル 0.83g を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 89mg を得た。

10

【0459】

実施例 10

実施例 1 で得られた化合物 700mg、(S)-1,2-エポキシブタン 254mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 21.6mg を得た。

【0460】

実施例 11

実施例 1 で得られた化合物 1.0g、(S)-グリシジルメチルエーテル 266mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 80mg を得た。

20

【0461】

実施例 12

実施例 1 で得られた化合物 0.5g、(R)-(+)-プロピレンオキシド 0.18ml を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 10.9mg を得た。

【0462】

実施例 13

実施例 1 で得られた化合物 1.0g、1,2-エポキシペンタン 434mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 51mg を得た。

【0463】

実施例 14

実施例 1 で得られた化合物 1.0g、1,2-エポキシペンタン 434mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 5mg を得た。

30

【0464】

実施例 15

実施例 1 で得られた化合物 0.5g、(R)-(+)-1,2-エポキシヘキサン 0.303ml を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 32.8mg を得た。

【0465】

実施例 16

実施例 1 で得られた化合物 1.0g、ベンジル(R)-(-)-グリシジルエーテル 0.83g を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 12.5mg を得た。

40

【0466】

実施例 17

(1) 実施例 1 で得られた化合物 2.0g、参考例 1 で得られた化合物 2.78g を原料として実施例 7 (1)、(2) と同様の方法にて 10a-N-メチル体 406mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 200mg を原料として実施例 7 (3) と同様の方法にて環化体 78mg を得た。

(3) 上記 (2) で得られた化合物 78mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 52.3mg を得た。

【0467】

実施例 18

実施例 1 で得られた化合物 2.0g、参考例 1 で得られた化合物 2.78g を原料として実施例 7

50

と同様の方法にて表 1 で示される化合物31.3mgを得た。

【0468】

実施例 19

実施例 1 で得られた化合物1.5g、特許文献（特開昭49-017899号公報）に記載の方法にて得られたN-グリシジルピロール0.93gを原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物102.3mgを得た。

【0469】

実施例 20

実施例 1 で得られた化合物1.5g、特許文献（特開昭49-017899号公報）に記載の方法にて得られたN-グリシジルピロール0.93gを原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物2.7mgを得た。

10

【0470】

実施例 21

(1) 実施例 17 (1) で得られた化合物0.2gをメタノール5mlに溶解し、5%パラジウム-炭素50mgを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて1日間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をメタノール5mlに溶解し、5%パラジウム-炭素50mgを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて1時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して脱ベンジルオキシカルボニル体167mgを得た。

【0471】

(2) 上記 (1) で得られた化合物161mgをクロロホルム5mlに溶解し、37%ホルムアルデヒド水溶液0.12ml、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム95mgを加えて室温にて1.5時間攪拌した。さらに37%ホルムアルデヒド水溶液0.12ml、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム95mgを加えて室温にて30分間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。得られた濾液を減圧濃縮してジメチルアミノ体201mgを得た。

20

【0472】

(3) 上記 (2) で得られた化合物201mgを原料として実施例 7 (3)、(4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物25.3mgを得た。

【0473】

実施例 22

実施例 1 で得られた化合物1.0g、4-(2,3-エポキシプロピル)モルホリン0.43gを原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物42.0mgを得た。

30

【0474】

実施例 23

(1) 実施例 1 で得られた化合物2.33g、参考例 2 で得られた化合物2.0gを原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体859mgを得た。

(2) トリ-0-トリルホスフィン20.1mgをトルエン4mlに溶解し、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)30.2mg、トリ-n-ブチル(2-フリル)スズ236mg、上記 (1) で得られた化合物420mgのトルエン溶液13mlを順次加えて加熱還流下1.5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製してビアリアル体403mgを得た。

40

(3) 上記 (2) で得られた化合物403mgを原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物264mgを得た。

【0475】

実施例 24

実施例 1 で得られた化合物553mg、参考例 3 で得られた化合物950mgを原料として実施例 23 (実施例 7 (1)、(2)、(3)、実施例 23 (2)、実施例 7 (4)) と同様の方法にて表 1 で示される化合物4.5mgを得た。

【0476】

実施例 25

50

(1) 実施例 1 で得られた化合物 3.63g、文献 (Tetrahedron, 1987 年, 43 巻, 1799 ページ) に記載の方法にて得られた 2-(2-アジドエチル)オキシラン 4.14g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 468mg を得た。

【0477】

(2) 上記 (1) で得られた化合物 0.1g をクロロホルム 3ml に溶解し、氷冷下、1M トリメチルホスフィンテトラヒドロフラン溶液 0.18ml を加えて室温にて 1.5 時間攪拌した。室温にて別途 1.5 時間攪拌した 2-(1,2-ベンズイソキサゾ - 3-リル)酢酸 24.1mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 26.1mg、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物 20.8mg のクロロホルム溶液 3ml を反応液に加えて室温にて 18 時間攪拌した。さらに、別途室温にて 1.5 時間攪拌した 2-(1,2-ベンズイソキサゾ - 3-リル)酢酸 24.1mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 26.1mg、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物 20.8mg のクロロホルム溶液 2ml を反応液に加えて室温にて 2.5 日間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=30:1:0.1) にて精製してアミド体 20.0mg を得た。

10

【0478】

(3) 上記 (2) で得られた化合物 20.0mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 13.1mg を得た。

【0479】

20

実施例 26

(1) 実施例 1 で得られた化合物 0.5g、参考例 5 で得られた化合物 0.43g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 231mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 70mg を原料として実施例 23 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 25.0mg を得た。

【0480】

実施例 27

実施例 1 で得られた化合物 0.5g、参考例 6 で得られた化合物 0.43g を原料として実施例 23 (実施例 7 (1)、(2)、(3)、実施例 23 (2)、実施例 7 (4)) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 35.3mg を得た。

30

【0481】

実施例 28

実施例 23 (1) で得られた化合物 70mg、トリ-n-ブチル-(2-ピリジル)スズ 30.3mg を原料として実施例 23 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 23.2mg を得た。

【0482】

実施例 29

実施例 23 (1) で得られた化合物 70mg、トリ-n-ブチル-(3-ピリジル)スズ 30.3mg を原料として実施例 23 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 20.5mg を得た。

40

【0483】

実施例 30

実施例 1 で得られた化合物 433mg、参考例 7 で得られた化合物 390mg を原料として実施例 23 (実施例 7 (1)、(2)、(3)、実施例 23 (2)、実施例 7 (4)) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 44.2mg を得た。

【0484】

実施例 31

実施例 1 で得られた化合物 0.5g、参考例 8 で得られた化合物 0.41g を原料として実施例 23 (実施例 7 (1)、(2)、(3)、実施例 23 (2)、実施例 7 (4)) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 23.3mg を得た。

50

【0485】

実施例32

実施例1で得られた化合物866mg、参考例9で得られた化合物1.30gを原料として実施例23（実施例7（1）、（2）、（3）、実施例23（2）、実施例7（4））と同様の方法にて表1で示される化合物35.9mgを得た。

【0486】

実施例33

実施例1で得られた化合物909mg、参考例10で得られた化合物1.30gを原料として実施例23（実施例7（1）、（2）、（3）、実施例23（2）、実施例7（4））と同様の方法にて表1で示される化合物57.2mgを得た。

10

【0487】

実施例34

実施例1で得られた化合物0.5g、参考例11で得られた化合物0.43gを原料として実施例23（実施例7（1）、（2）、（3）、実施例23（2）、実施例7（4））と同様の方法にて表1で示される化合物24.0mgを得た。

【0488】

実施例35

実施例1で得られた化合物793mg、参考例12で得られた化合物680mgを原料として実施例23（実施例7（1）、（2）、（3）、実施例23（2）、実施例7（4））と同様の方法にて表1で示される化合物96.5mgを得た。

20

【0489】

実施例36

実施例1で得られた化合物0.5g、参考例13で得られた化合物0.39gを原料として実施例7と同様の方法にて表1で示される化合物104.6mgを得た。

【0490】

実施例37

実施例1で得られた化合物0.5g、参考例14で得られた0.43gを原料として実施例23（実施例7（1）、（2）、（3）、実施例23（2）、実施例7（4））と同様の方法にて表1で示される化合物29.8mgを得た。

【0491】

実施例38

実施例1で得られた化合物0.5g、参考例15で得られた化合物0.43gを原料として実施例23（実施例7（1）、（2）、（3）、実施例23（2）、実施例7（4））と同様の方法にて表1で示される化合物68.2mgを得た。

30

【0492】

実施例39

実施例1で得られた化合物1.0g、アリルグリシジルエーテル0.57gを原料として実施例7と同様の方法にて表1で示される化合物85.0mgを得た。

【0493】

実施例40

実施例1で得られた化合物1.0g、プロパルギルグリシジルエーテル0.54mlを原料として実施例7と同様の方法にて表1で示される化合物95.3mgを得た。

40

【0494】

実施例41

パラジウム(II)アセテート1.2mgを1,2-ジメトキシエタン2mlに溶解し、窒素雰囲気下、トリフェニルホスフィン5.5mg、参考例16で得られた化合物17.6mgを順次加えて室温にて15分間攪拌した。実施例39で得られた化合物40mg、テトラブチルアンモニウムブロミド33.9mg、ジイソプロピルエチルアミン18.8μlを窒素雰囲気下、順次加えて加熱還流下5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（酢酸エチル：メタノール：28%アンモニア水=5：1：0.1）にて精製して表1で示される化合物2.

50

3mgを得た。

【0495】

実施例42

実施例40で得られた化合物85mgをアセトニトリル3mlに溶解し、参考例16で得られた化合物37.5mg、トリエチルアミン1ml、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム6.5mgを順次加えて加熱還流下2.5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=20:1:0.1から10:1:0.1）にて精製して表1で示される化合物43.2mgを得た。

【0496】

実施例43

実施例42で得られた化合物30mgをメタノール1.5mlに溶解し、5%パラジウム-炭素6mgを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて18時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して表1で示される化合物22.9mgを得た。

【0497】

実施例44

実施例1で得られた化合物1.0g、参考例17で得られた化合物943mgを原料として実施例23（実施例7（1）、（2）、（3）、実施例23（2）、実施例7（4））と同様の方法にて表1で示される化合物19mgを得た。

【0498】

実施例45

実施例1で得られた化合物0.3g、参考例18で得られた化合物0.23gを原料として実施例23（実施例7（1）、（2）、（3）、実施例23（2）、実施例7（4））と同様の方法にて表1で示される化合物14mgを得た。

【0499】

実施例46

実施例1で得られた化合物0.3g、参考例19で得られた化合物0.245gを原料として実施例23（実施例7（1）、（2）、（3）、実施例23（2）、実施例7（4））と同様の方法にて表1で示される化合物12mgを得た。

【0500】

実施例47

（1）実施例1で得られた化合物2.33g、参考例15で得られた化合物2.0gを原料として実施例7（1）、（2）、（3）と同様の方法にて環化体0.37gを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物30mg、トリ-n-ブチル-(2-ピリジル)スズ13.0mgを原料として実施例23（2）、実施例7（4）と同様の方法にて表1で示される化合物6.1mgを得た。

【0501】

実施例48

実施例47（1）で得られた化合物30mg、トリ-n-ブチル-(3-ピリジル)スズ13.0mgを原料として実施例23（2）、実施例7（4）と同様の方法にて表1で示される化合物1.2mgを得た。

【0502】

実施例49

（1）パラジウム(II)アセテート0.5mgを1,2-ジメトキシエタン0.3mlに溶解し、窒素雰囲気下、トリフェニルホスフィン3.1mg、キノリン-3-ボロン酸6.1mgを順次加えた。炭酸ナトリウム5.0mg、蒸留水0.5ml、実施例47（1）で得られた化合物30mgの1,2-ジメトキシエタン溶液0.2mlを順次加えて窒素雰囲気下80℃にて2時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に蒸留水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン=30:10:0.2）にて精製してビアリアル体12.6

10

20

30

40

50

mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物12.6mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表1で示される化合物3.8mgを得た。

【0503】

実施例50

実施例1で得られた化合物0.33g、参考例20で得られた化合物0.30gを原料として実施例23(実施例7(1)、(2)、(3)、実施例23(2)、実施例7(4))と同様の方法にて表1で示される化合物19.2mgを得た。

【0504】

実施例51

(1) 実施例1で得られた化合物9.59g、参考例21で得られた化合物7.36gを原料として実施例7(1)、(2)、(3)と同様の方法にて環化体895mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物50mgを実施例7(4)と同様の方法にてアジド体37mgを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物32mgをメタノールに溶解し、5%パラジウム-炭素を30mg加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて3時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(NH型シリカゲル)(クロロホルム:メタノール=50:1)にて精製して表1で示される化合物21.5mgを得た。

【0505】

実施例52

(1) 実施例1で得られた化合物1.21g、(R)-エピクロロヒドリンを原料として実施例7(1)、(2)、(3)と同様の方法にてクロルメチル体130mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物25mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表1で示される化合物15mgを得た。

【0506】

実施例53

実施例47(1)で得られた化合物30mg、トリ-n-ブチル-(2-チエニル)スズ13.2mgを原料として実施例23(2)、実施例7(4)と同様の方法にて表1で示される化合物11.4mgを得た。

【0507】

実施例54

(1) 実施例51(1)で得られた化合物50mgをメタノール5mlに溶解し、5%パラジウム-炭素10mgを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて1日間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮してアミン体55mgを得た。

【0508】

(2) (方法A)

上記(1)で得られた化合物15mgをテトラヒドロフラン0.5mlに溶解し、4-ジメチルアミノピリジン1.7mg、N,N'-カルボニルジイミダゾール3.3mgを加えて室温にて30分間攪拌した。3-ブロモフェノール11.9mgを加えて加熱還流下5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣にトルエン5mlを加えて加熱還流下7時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2)にて精製してカーバメート体8.0mgを得た。

【0509】

(3) (方法B)

上記(1)で得られた化合物15mgをクロロホルム0.4mlに溶解し、飽和重曹水0.2mlを加えて、引き続き氷冷下、トリホスゲン4.1mgを加えて30分間攪拌した。反応液を分液し、有機層を減圧濃縮して得られた残渣をトルエン0.5mlに溶解し、3-ブロモフェノール11.9mgを加えて85℃にて3時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2)にて精製してカーバメート体6.8mgを得た。

10

20

30

40

50

【0510】

(4) 上記(2)又は(3)で得られた化合物15mgを原料として実施例23(2)、実施例7(4)と同様の方法にて表1で示される化合物3.9mgを得た。

【0511】

実施例55

(1) 実施例54(1)で得られた化合物20mgをクロロホルム0.5mlに溶解し、トリエチルアミン26 μ l、2-キノリンカルボニルクロリド17.6mgを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=50:10:0.2)にて精製してアミド体19.5mgを得た。

10

【0512】

(2) 上記(1)で得られた化合物19.5mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表1で示される化合物11.9mgを得た。

【0513】

実施例56

実施例54(1)で得られた化合物20mg、文献(Bioorganic & Medicinal Chemistry, 2005年,13巻,2031ページ)に記載の方法にて得られた3-キノリンカルボニルクロリド17.6mgを原料として実施例55(1)、実施例7(4)と同様の方法にて表1で示される化合物8.0mgを得た。

20

【0514】

実施例57

実施例54(1)で得られた化合物20mg、文献(Bioorganic & Medicinal Chemistry, 2005年,13巻,2031ページ)に記載の方法にて得られた4-キノリンカルボニルクロリド17.6mgを原料として実施例55(1)、実施例7(4)と同様の方法にて表1で示される化合物8.6mgを得た。

【0515】

実施例58

実施例1で得られた化合物2.82g、参考例22で得られた化合物を原料として実施例7と同様の方法にて表1で示される化合物14mgを得た。

30

【0516】

実施例59

(1) 実施例54(1)で得られた化合物35mg、4-ブロモベンゾイルクロリド21.2mgを原料として実施例55(1)と同様の方法にてアミド体44.5mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物27.6mgを原料として実施例23(2)、実施例7(4)と同様の方法にて表1で示される化合物8.1mgを得た。

【0517】

実施例60

実施例1で得られた化合物1.6g、参考例23で得られた化合物1.44gを原料として実施例23(実施例7(1)、(2)、(3)、実施例23(2)、実施例7(4))と同様の方法にて表1で示される化合物12.6mgを得た。

40

【0518】

実施例61

実施例1で得られた化合物1.0g、参考例24で得られた化合物771mgを原料として実施例7と同様の方法にて表1で示される化合物8.6mgを得た。

【0519】

実施例62

実施例1で得られた化合物4.89g、参考例25で得られた化合物3.25gを原料として実施例7と同様の方法にて表1で示される化合物8.7mgを得た。

【0520】

50

実施例 6 3

(1) 実施例 1 で得られた化合物 1.77g、参考例 2 6 で得られた化合物 2.05g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 205mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 32.1mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 15.5mg を得た。

【0 5 2 1】

実施例 6 4

実施例 6 3 で得られた化合物 8.3mg を酢酸エチル 1.5ml に溶解し、5% パラジウム-炭素 4.2mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 1 時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28% アンモニア水 = 10:1:0.1）にて精製して表 1 で示される化合物 8.2mg を得た。

【0 5 2 2】

実施例 6 5

(1) 実施例 1 で得られた化合物 2.12g、参考例 2 7 で得られた化合物 3.00g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 127mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 39.5mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 21.3mg を得た。

【0 5 2 3】

実施例 6 6

実施例 1 で得られた化合物 2.0g、エピフルオロヒドリン 919mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 51mg を得た。

【0 5 2 4】

実施例 6 7

実施例 1 で得られた化合物 2.0g、(R)-2-ビニルオキシラン 460mg を原料として実施例 7 と同様の反応にて表 1 で示される化合物 26mg を得た。

【0 5 2 5】

実施例 6 8

(1) 実施例 1 で得られた化合物 0.30g、参考例 2 8 で得られた化合物 0.43g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 95.3mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 10mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 7.6mg を得た。

【0 5 2 6】

実施例 6 9

(1) 実施例 1 で得られた化合物 0.38g、参考例 2 9 で得られた化合物 0.55g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 73mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 10mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 5.3mg を得た。

【0 5 2 7】

実施例 7 0

(1) 実施例 1 で得られた化合物 0.5g、参考例 3 0 で得られた化合物 0.76g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 45.2mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 10mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 6.6mg を得た。

【0 5 2 8】

実施例 7 1

(1) 実施例 1 で得られた化合物 0.98g、参考例 3 1 で得られた化合物を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 0.32g を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 130mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 69mg を得た。

【0 5 2 9】

10

20

30

40

50

実施例 7 2

実施例 1 で得られた化合物 375mg、文献(European Journal of Organic Chemistry, 2000年, 1219ページ) に記載の方法にて得られた 2-[3-(ベンジルオキシ)プロピル]オキシラン 435mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 32mg を得た。

【0530】

実施例 7 3

実施例 7 2 で得られた化合物 28mg をメタノールに溶解し、20%水酸化パラジウム-炭素 30mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 3 時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1) にて精製して表 1 で示される化合物 26.7mg を得た。

10

【0531】

実施例 7 4

(1) 実施例 5 1 (1) で得られた化合物 20mg を酢酸エチルに溶解し、5%パラジウム-炭素 20mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 3 時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をクロロホルム 1ml に溶解し、トリエチルアミン 9.1mg、3-ブロモベンゼンスルホニルクロリド 4.6mg を加えて室温にて 2 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2) にて精製してプロモ体 11.4mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 11.4mg を原料として実施例 2 3 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 2.0mg を得た。

20

【0532】

実施例 7 5

(1) 実施例 5 4 (1) で得られた化合物 50mg をクロロホルム-メタノール=2:1 混合溶媒 1.5ml に溶解し、6-ブロモピコリン酸 27.8mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 26.3mg、4-ジメチルアミノピリジン 5.6mg を加えて室温にて 18 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2) にて精製してアミド体 65.5mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 60mg を原料として実施例 2 3 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 38.0mg を得た。

30

【0533】

実施例 7 6

実施例 5 4 (1) で得られた化合物 50mg、5-ブロモニコチン酸 27.8mg を原料として実施例 7 5 (1)、実施例 2 3 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 16.9mg を得た。

【0534】

実施例 7 7

実施例 5 4 (1) で得られた化合物 50mg、5-ブロモ-2-チオフェンカルボン酸 28.6mg を原料として実施例 7 5 (1)、実施例 2 3 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 30.8mg を得た。

【0535】

40

実施例 7 8

実施例 5 4 (1) で得られた化合物 50mg、5-ブロモ-2-フランカルボン酸 26.1mg を原料として実施例 7 5 (1)、実施例 2 3 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 21.6mg を得た。

【0536】

実施例 7 9

(1) 実施例 1 で得られた化合物 4.00g、文献 (Synthesis, 1992年, 621ページ) に記載の方法 (参考例 3 2) にて得られた化合物 2.16g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 0.78g を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 130mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1

50

で示される化合物68mgを得た。

【0537】

実施例80

実施例1で得られた化合物1.20g、参考例33で得られた化合物を原料として実施例7と同様の方法にて表1で示される化合物73mgを得た。

【0538】

実施例81

実施例71で得られた化合物12mgをメタノール-酢酸エチル(1:1)の混合溶媒2mlに溶解し、20%水酸化パラジウム-炭素12mgを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて60時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=50:1:0.1から20:1:0.1）にて精製して表1で示される化合物8mgを得た。

10

【0539】

実施例82

(1) 実施例1で得られた化合物4.00g、参考例34で得られた化合物を原料として実施例7(1)、(2)、(3)と同様の方法にて環化体0.76gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物0.38gを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表1で示される化合物0.25gを得た。

【0540】

実施例83

20

実施例1で得られた化合物1.00g、参考例35で得られた化合物を原料として実施例7と同様の方法にて表1で示される化合物50mgを得た。

【0541】

実施例84

実施例79で得られた化合物40mgを原料として実施例81と同様の方法にて表1で示される化合物34mgを得た。

【0542】

実施例85

実施例82で得られた化合物160mgをメタノール20mlに溶解し、5%パラジウム-炭素160mgを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて18時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=50:1:0.1から10:1:0.1）にて精製して表1で示される化合物75mgを得た。

30

【0543】

実施例86

(1) 実施例1で得られた化合物4.00g、参考例36で得られた化合物を原料として実施例7(1)、(2)、(3)と同様の方法にて環化体0.51gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物96mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて脱保護体60mgを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物34mgを原料として実施例21(1)と同様の方法にて表1で示される化合物21mgを得た。

40

【0544】

実施例87

実施例85で得られた化合物10mgを原料として実施例7(2)と同様の方法にて表1で示される化合物6mgを得た。

【0545】

実施例88

(1) 実施例52(1)で得られた化合物68mgをジメチルホルムアミド2mlに溶解し、イミダゾール13mg、炭酸カリウム26mgを加えて70℃にて5時間、さらに120℃にて3時間攪拌した。反応液に蒸留水とクロロホルムを加えて分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、

50

無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=100:1:0.1）にて精製してイミダゾリル体18mgを得た。

（２）上記（１）で得られた化合物18mgを原料として実施例 7（４）と同様の方法にて表 1 で示される化合物11mgを得た。

【 0 5 4 6 】

実施例 8 9

実施例 5 2（１）で得られた化合物38mg、文献（Journal of Medicinal Chemistry, 2005年,48巻,224ページ）に記載の方法にて得られた3-(4,5-ジヒドロキシ-1H-イミダゾール-4-イル)-ピリジン25mgを原料として実施例 8 8（１）、実施例 7（４）と同様の方法にて表 1 で示される化合物6mgを得た。

【 0 5 4 7 】

実施例 9 0

（１）実施例 1 で得られた化合物3g、メチル-(S)-グリシデート925mgを原料として実施例 7（１）、（２）、（３）と同様の方法にて環化体910mgを得た。

（２）上記（１）で得られた化合物30.7mgを原料として実施例 7（４）と同様の方法にて表 1 で示される化合物16.2mgを得た。

【 0 5 4 8 】

実施例 9 1

（１）実施例 6 5（１）で得られた化合物36.5mgを原料として実施例 6 4と同様の方法にてカルボン酸体31.6mgを得た。

（２）上記（１）で得られた化合物10.1mgをクロロホルム1.0mlに溶解し、氷冷下、トリエチルアミン6.2μl、クロロギ酸イソブチル5.8μlを加えてそのまま1時間攪拌した。0.5規定アンモニア1,4-ジオキサン溶液を加えて室温にて1.5時間攪拌した。反応液を飽和塩化アンモニウム水溶液で中和後、酢酸エチルにて抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=10:10:0.2）にて精製してアミド体10.5mgを得た。

（３）上記（２）で得られた化合物10.1mgを原料として実施例 7（４）と同様の方法にて表 1 で示される化合物2.8mgを得た。

【 0 5 4 9 】

実施例 9 2

（１）実施例 1 で得られた化合物0.5g、参考例 3 7で得られた化合物0.64gを原料として実施例 7と同様の方法にてニトロ体24.0mgを得た。

（２）上記（１）で得られた化合物20mgを2-プロパノール-蒸留水（2:1）の混合溶媒3mlに溶解し、鉄12.4mg、塩化アンモニウム2.4mgを加えて90℃にて1時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して表 1 で示される化合物6.5mgを得た。

【 0 5 5 0 】

実施例 9 3

実施例 1 で得られた化合物0.5g、参考例 3 8で得られた化合物0.585gを原料として実施例 7と同様の方法にて表 1 で示される化合物47.2mgを得た。

【 0 5 5 1 】

実施例 9 4

実施例 6 9（１）で得られた化合物30mgを原料として実施例 2 3（２）、実施例 7（４）と同様の方法にて表 1 で示される化合物11mgを得た。

【 0 5 5 2 】

実施例 9 5

（１）実施例 1 で得られた化合物4.00g、文献（Tetrahedron,1987年,43巻,1799ページ）

10

20

30

40

50

に記載の方法にて得られた2-(2-アジドエチル)オキシランを原料として実施例7(1)、(2)、(3)と同様の方法にて環化体0.29gを得た。

【0553】

(2) 上記(1)で得られた化合物57mgをメタノール5mlに溶解し、5%パラジウム-炭素57mgを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて2時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をテトラヒドロフラン1mlに溶解し、フェニルクロロホルメート8μl、トリエチルアミン8μlを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=25:5:0.1)にて精製してカーバメート体35mgを得られた。

10

(3) 上記(2)で得られた化合物35mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表1で示される化合物13mgを得た。

【0554】

実施例96

実施例68(1)で得られた化合物20.6mgを原料として実施例23(2)、実施例7(4)と同様の方法にて表1で示される化合物9.1mgを得た。

【0555】

実施例97

(1) 実施例1で得られた化合物2.41g、参考例39で得られた化合物2.52gを原料として実施例7(1)、(2)、(3)と同様の方法にて環化体253mgを得た。

20

(2) 上記(1)で得られた化合物21.6mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表1で示される化合物5.6mgを得た。

【0556】

実施例98

実施例1で得られた化合物0.465g、参考例40で得られた化合物0.39gを原料として実施例7と同様の方法にて表1で示される化合物10.8mgを得た。

【0557】

実施例99

(1) 実施例54(1)で得られた化合物45mgをクロロホルム4mlに溶解し、4-キノリンカルボキシアルデヒド6.5mg、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム13.1mgを加えて室温にて2時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=10:10:0.2)で精製してN-(4-キノリルメチル)体40.8mgを得た。

30

(2) 上記(1)で得られた化合物40mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表1で示される化合物14.3mgを得た。

【0558】

実施例100

実施例99で得られた化合物6.0mgをクロロホルム0.5mlに溶解し、37%ホルムアルデヒド水溶液2.7μl、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム2.15mgを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)で精製して表1で示される化合物1.1mgを得た。

40

【0559】

実施例101

実施例1で得られた化合物0.37g、参考例41で得られた化合物0.45gを原料として実施例7と同様の方法にて表1で示される化合物47mgを得た。

【0560】

50

実施例 102

実施例 1 で得られた化合物 693mg、文献(Journal of Organic Chemistry, 2001 年, 66 巻, 6 号, 2171 ページ)に記載の方法にて得られたオキシラン-2-イルアセトニトリル 870mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 8.0mg を得た。

【0561】

実施例 103

(1) 実施例 1 で得られた化合物 700mg、文献(Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions II, 1987 年, 9 号, 1253 ページ)に記載の方法にて得られた 3-オキシラン-2-イルプロパンニトリル 2.05g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 122mg を得た。

10

(2) 上記 (1) で得られた化合物 83.0mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 44.0mg を得た。

【0562】

実施例 104

(1) 実施例 1 で得られた化合物 700mg、参考例 42 で得られた化合物 2.35g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 99.7mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 68.1mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 で示される化合物 33.0mg を得た。

【0563】

実施例 105

20

実施例 1 で得られた化合物 500mg、参考例 43 で得られた化合物 989mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 6.4mg を得た。

【0564】

実施例 106

実施例 1 で得られた化合物 500mg、参考例 44 で得られた化合物 1.1g を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 21.7mg を得た。

【0565】

実施例 107

実施例 1 で得られた化合物 500mg、参考例 45 で得られた化合物 989mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 2.75mg を得た。

30

【0566】

実施例 108

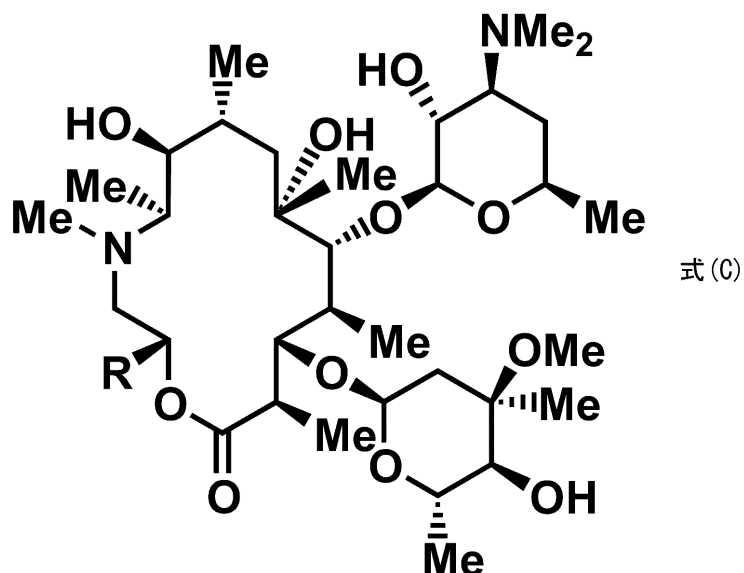
実施例 1 で得られた化合物 500mg、参考例 46 で得られた化合物 1.1g を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 で示される化合物 28.5mg を得た。

【0567】

実施例 109、110 の合成 それぞれの実施例で規定した R をもつ、式 (C) で示される化合物の製造法を以下に示す。

【0568】

【化 2 0】



10

【 0 5 6 9】

実施例 1 0 9 式 (C) で R=水素原子の化合物の合成

実施例 2 で得られた化合物 780mg を原料として実施例 8 (1)、実施例 7 (2)、(3)、(4) と同様の方法にて標記化合物 12mg を得た。

20

MS(ESI) $m/z=677.3[M+H]^+$

【 0 5 7 0】

実施例 1 1 0 式 (C) で R=エチルの化合物の合成

実施例 2 で得られた化合物 0.5g、(R)-1,2-エポキシブタンを原料として実施例 7 と同様の方法にて標記化合物 39mg を得た。

MS(ESI) $m/z=705.4[M+H]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm) : 0.90(t, $J=7.38\text{Hz}$, 3H) 0.93-1.01(m, 6H) 1.10(d, $J=7.31\text{Hz}$, 3H) 1.16-1.72(m, 15H) 1.19(d, $J=7.15\text{Hz}$, 3H) 1.29(d, $J=6.22\text{Hz}$, 3H) 2.03-2.40(m, 6H) 2.27(s, 3H) 2.31(s, 6H) 2.42-2.78(m, 4H) 3.02(t, $J=8.94\text{Hz}$, 1H) 3.19-3.27(m, 1H) 3.31(s, 1H) 3.31(s, 3H) 3.51-3.65(m, 2H) 3.99-4.11(m, 1H) 4.31-4.36(m, 1H) 4.50(d, $J=7.31\text{Hz}$, 1H) 4.73-4.80(m, 1H) 4.83(d, $J=4.51\text{Hz}$, 1H) 4.95(s, 1H)

30

【 0 5 7 1】

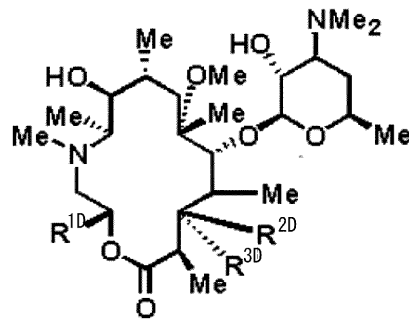
実施例 1 1 1 ~ 1 2 5 の合成

表 2 で規定した $\text{R}^{1\text{D}}$ 、 $\text{R}^{2\text{D}}$ 、及び $\text{R}^{3\text{D}}$ をもつ、式 (D) で示される化合物の製造法を以下に示す。

【 0 5 7 2】

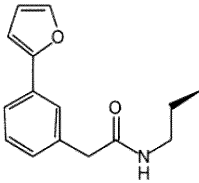
【表 2 - 1】

表 2



式 (D)

実施例 113 を除く、式 (D) で示される化合物の R^{1D} はエチル基である。実施例 113 の R^{1D} は式

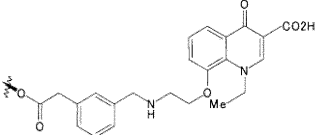
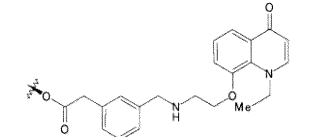
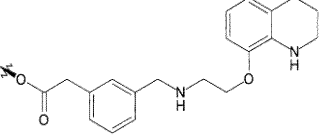
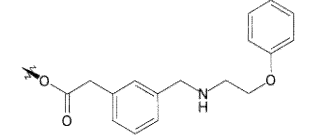
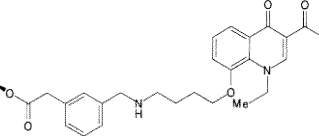


で示される基である。

実施例	R^{2D}	R^{3D}	ESI MS (M+H)	$^1\text{H-NMR}$, CDCl_3 , δ (ppm)
111		H	561.3	(500 MHz) : 0.90 (t, $J=7.26$ Hz, 3 H) 0.97 (d, $J=6.12$ Hz, 3 H) 1.04 (d, $J=6.88$ Hz, 6 H) 1.23 (d, $J=6.88$ Hz, 3 H) 1.22 - 1.75 (m, 6 H) 1.26 (d, $J=6.12$ Hz, 3 H) 1.26 - 1.29 (m, 3 H) 1.82 - 1.90 (m, 1 H) 2.06 - 2.13 (m, 1 H) 2.26 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.45 - 2.64 (m, 3 H) 2.86 - 2.92 (m, 1 H) 3.11 (s, 3 H) 3.26 (dd, $J=9.94, 7.65$ Hz, 1 H) 3.49 - 3.58 (m, 1 H) 3.84 - 3.94 (m, 2 H) 3.97 - 4.01 (m, 1 H) 4.36 - 4.42 (m, 1 H) 4.50 (d, $J=7.65$ Hz, 1 H) 4.84 - 4.91 (m, 1 H)
112		H	680.6	(300 MHz) : 0.82 - 0.95 (m, 9 H) 0.97 - 1.31 (m, 2 H) 1.02 (d, $J=6.84$ Hz, 3 H) 1.07 (d, $J=7.31$ Hz, 3 H) 1.17 (d, $J=6.06$ Hz, 3 H) 1.26 (s, 3 H) 1.45 - 1.99 (m, 4 H) 2.09 - 2.28 (m, 2 H) 2.30 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.43 - 2.64 (m, 3 H) 2.77 - 2.88 (m, 1 H) 2.97 - 3.07 (m, 1 H) 3.14 - 3.51 (m, 3 H) 3.21 (s, 3 H) 3.87 (d, $J=4.04$ Hz, 1 H) 3.89 - 3.98 (m, 2 H) 4.11 (d, $J=7.15$ Hz, 1 H) 4.69 - 4.78 (m, 1 H) 5.23 - 5.33 (m, 1 H) 7.19 (ddd, $J=7.54, 4.90, 1.09$ Hz, 1 H) 7.37 (dt, $J=7.81, 0.99$ Hz, 1 H) 7.67 (td, $J=7.69, 1.87$ Hz, 1 H) 8.53 (ddd, $J=4.90, 1.79, 0.93$ Hz, 1 H)

【 0 5 7 3 】

【表 2 - 2】

113			758.6	(300 MHz) : 0.77 (d, J=6.53 Hz, 3 H) 0.83 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.15 - 1.22 (m, 1 H) 1.22 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.22 - 1.27 (m, 1 H) 1.29 (s, 3 H) 1.30 - 1.38 (m, 6 H) 1.61 - 1.94 (m, 4 H) 2.00 (d, J=15.70 Hz, 1 H) 2.21 - 2.62 (m, 3 H) 2.30 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.75 - 2.83 (m, 1 H) 2.83 (s, 3 H) 2.86 - 3.03 (m, 1 H) 3.16 - 3.34 (m, 2 H) 3.36 - 3.57 (m, 3 H) 3.57 (s, 2 H) 3.84 - 4.01 (m, 2 H) 4.41 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.68 - 4.81 (m, 1 H) 5.88 (t, J=6.06 Hz, 1 H) 6.47 (dd, J=3.42, 1.87 Hz, 1 H) 6.69 (dd, J=3.42, 0.78 Hz, 1 H) 7.14 - 7.21 (m, 1 H) 7.37 (t, 1 H) 7.44 - 7.49 (m, 1 H) 7.55 - 7.63 (m, 2 H)
114		H		(600 MHz) : 0.79 - 0.99 (m, 12 H) 1.07 - 1.25 (m, 2 H) 1.12 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.28 (s, 3 H) 1.50 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.52 - 1.77 (m, 3 H) 1.85 - 1.99 (m, 1 H) 2.08 - 2.28 (m, 3 H) 2.30 (s, 6 H) 2.39 (s, 3 H) 2.44 - 2.62 (m, 2 H) 2.77 - 2.89 (m, 1 H) 2.99 - 3.10 (m, 1 H) 3.14 - 3.31 (m, 5 H) 3.22 - 3.24 (m, 3 H) 3.64 - 3.75 (m, 3 H) 3.87 (s, 1 H) 3.91 (s, 2 H) 4.02 (s, 1 H) 4.21 - 4.35 (m, 2 H) 4.60 - 4.83 (m, 3 H) 5.31 (s, 1 H) 7.26 (t, J=7.11 Hz, 2 H) 7.30 - 7.35 (m, 2 H) 7.37 (s, 1 H) 7.50 (t, J=8.02 Hz, 1 H) 8.20 (dd, J=8.25, 1.38 Hz, 1 H) 8.66 (s, 1 H)
115		H	923.5	(600 MHz) : 0.79 - 0.96 (m, 12 H) 1.04 - 1.30 (m, 2 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.36 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.45 - 1.75 (m, 3 H) 1.86 - 1.96 (m, 1 H) 2.05 - 2.23 (m, 3 H) 2.26 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.41 - 2.59 (m, 2 H) 2.76 - 2.86 (m, 1 H) 2.96 - 3.28 (m, 6 H) 3.19 (s, 3 H) 3.60 - 4.07 (m, 4 H) 3.65 - 3.70 (m, 2 H) 3.87 (s, 2 H) 4.17 - 4.24 (m, 2 H) 4.48 (q, J=6.88 Hz, 2 H) 6.26 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.09 - 7.16 (m, 1 H) 7.17 - 7.35 (m, 5 H) 7.44 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.10 (d, J=6.42 Hz, 1 H)
116		H	883.4	(600 MHz) : 0.76 - 0.96 (m, 12 H) 1.03 - 1.28 (m, 2 H) 1.06 - 1.11 (m, 3 H) 1.15 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.23 - 1.24 (m, 3 H) 1.46 - 1.72 (m, 3 H) 1.85 - 1.99 (m, 3 H) 2.10 - 2.40 (m, 3 H) 2.25 - 2.29 (m, 6 H) 2.34 - 2.37 (m, 3 H) 2.43 - 2.57 (m, 2 H) 2.76 (t, J=6.42 Hz, 2 H) 2.79 - 2.85 (m, 1 H) 2.98 - 3.24 (m, 4 H) 2.99 - 3.05 (m, 2 H) 3.20 (s, 3 H) 3.28 - 3.33 (m, 2 H) 3.60 - 4.01 (m, 4 H) 3.67 (s, 2 H) 3.84 (s, 2 H) 4.09 (t, J=5.27 Hz, 2 H) 6.49 - 6.64 (m, 2 H) 7.17 - 7.38 (m, 5 H)
117		H	828.4	(600 MHz) : 0.75 - 0.91 (m, 9 H) 0.92 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 - 1.19 (m, 2 H) 1.14 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.44 - 1.69 (m, 3 H) 1.85 - 1.95 (m, 1 H) 2.06 - 2.28 (m, 3 H) 2.25 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.43 - 2.57 (m, 2 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.99 - 3.02 (m, 2 H) 3.01 - 3.05 (m, 1 H) 3.11 - 3.24 (m, 3 H) 3.20 (s, 3 H) 3.62 - 3.70 (m, 3 H) 3.78 - 3.89 (m, 2 H) 3.85 (s, 2 H) 3.92 - 4.01 (m, 1 H) 4.06 - 4.09 (m, 2 H) 6.87 - 6.96 (m, 3 H) 7.17 - 7.36 (m, 6 H)
118		H	995.6	

10

20

30

【 0 5 7 4 】

【表 2 - 3】

119		H	879.4	(600 MHz) : 0.78 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 0.81 - 0.89 (m, 6 H) 0.95 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.02 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.22 (m, 2 H) 1.11 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.19 (s, 3 H) 1.44 - 1.53 (m, 2 H) 1.54 - 1.66 (m, 1 H) 1.79 - 1.90 (m, 1 H) 2.01 (s, 1 H) 2.12 - 2.46 (m, 4 H) 2.26 - 2.29 (m, 9 H) 2.73 - 2.83 (m, 1 H) 2.95 - 3.06 (m, 1 H) 3.13 - 3.23 (m, 3 H) 3.19 (s, 3 H) 3.23 - 3.33 (m, 2 H) 3.59 - 3.72 (m, 2 H) 3.73 - 3.85 (m, 2 H) 3.87 - 3.97 (m, 3 H) 4.28 - 4.41 (m, 3 H) 7.07 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 7.18 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 7.22 - 7.32 (m, 2 H) 7.35 - 7.42 (m, 2 H) 7.44 (t, J=8.02 Hz, 1 H) 7.49 (s, 1 H) 8.09 - 8.14 (m, 1 H) 8.86 - 8.92 (m, 1 H)
120		H		(600 MHz) : 0.80 - 0.90 (m, 12 H) 0.92 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 2 H) 1.15 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.49 - 1.69 (m, 5 H) 1.86 - 1.94 (m, 1 H) 2.07 - 2.42 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.43 - 2.56 (m, 2 H) 2.77 - 2.83 (m, 1 H) 2.99 - 3.08 (m, 1 H) 3.17 (dd, J=10.09, 7.34 Hz, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.35 - 3.41 (m, 2 H) 3.54 - 3.64 (m, 2 H) 3.77 - 3.91 (m, 2 H) 3.95 - 4.03 (m, 1 H) 4.30 (t, J=6.42 Hz, 2 H) 4.66 - 4.70 (m, 1 H) 4.72 (q, J=6.88 Hz, 2 H) 5.24 (br. s., 1 H) 6.52 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.64 - 6.68 (m, 2 H) 7.11 (t, J=7.57 Hz, 1 H) 7.31 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.48 (t, J=8.02 Hz, 1 H) 8.17 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 8.63 (s, 1 H)
121		H	893.6	(600 MHz) : 0.68 - 1.01 (m, 6 H) 0.75 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 0.95 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.12 - 1.32 (m, 8 H) 1.17 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.33 - 1.74 (m, 3 H) 1.83 - 2.27 (m, 3 H) 2.26 - 2.37 (m, 9 H) 2.37 - 2.56 (m, 3 H) 2.61 - 2.70 (m, 1 H) 2.98 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 3.16 - 3.28 (m, 2 H) 3.21 (s, 3 H) 3.43 - 3.51 (m, 1 H) 3.67 - 3.93 (m, 3 H) 4.15 - 4.30 (m, 3 H) 4.34 (td, J=9.40, 2.29 Hz, 2 H) 4.58 - 4.74 (m, 1 H) 5.08 - 5.28 (m, 1 H) 7.06 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.33 - 7.41 (m, 5 H) 7.46 (m, 1 H) 7.80 (s, 1 H) 7.86 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.14 (dd, J=8.25, 1.38 Hz, 1 H) 9.08 (br s, 1 H)
122		H	893.7	(600 MHz) : 0.79 - 0.86 (m, 6 H) 0.86 - 0.90 (m, 6 H) 0.87 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 0.99 - 1.18 (m, 2 H) 1.06 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.41 - 1.69 (m, 3 H) 1.75 - 1.94 (m, 1 H) 2.05 - 2.30 (m, 3 H) 2.23 - 2.28 (m, 6 H) 2.33 - 2.36 (m, 6 H) 2.41 - 2.56 (m, 2 H) 2.72 - 2.82 (m, 1 H) 2.94 - 3.04 (m, 1 H) 3.04 (t, J=6.88 Hz, 2 H) 3.10 - 3.23 (m, 4 H) 3.17 - 3.19 (m, 3 H) 3.59 - 3.69 (m, 4 H) 3.81 - 3.86 (m, 1 H) 3.98 (s, 1 H) 4.27 - 4.38 (m, 3 H) 7.00 - 7.05 (m, 1 H) 7.16 - 7.28 (m, 2 H) 7.31 (s, 1 H) 7.34 - 7.44 (m, 4 H) 8.08 - 8.12 (m, 1 H) 8.89 - 8.92 (m, 1 H)
123		H	921.7	(600 MHz) : 0.79 - 0.93 (m, 9 H) 1.04 - 1.11 (m, 3 H) 1.09 - 1.31 (m, 2 H) 1.12 - 1.20 (m, 6 H) 1.22 - 1.27 (m, 3 H) 1.43 - 1.63 (m, 3 H) 1.86 - 1.94 (m, 1 H) 2.14 (s, 3 H) 2.20 - 2.41 (m, 3 H) 2.21 - 2.31 (m, 6 H) 2.33 - 2.36 (m, 3 H) 2.42 - 2.59 (m, 2 H) 2.73 - 2.83 (m, 1 H) 2.95 - 3.06 (m, 1 H) 3.07 - 3.34 (m, 4 H) 3.19 - 3.20 (m, 3 H) 3.58 - 3.71 (m, 2 H) 3.80 - 3.92 (m, 5 H) 4.01 (s, 1 H) 4.42 - 4.50 (m, 2 H) 4.61 - 4.75 (m, 1 H) 7.09 - 7.15 (m, 1 H) 7.18 - 7.32 (m, 3 H) 7.35 - 7.48 (m, 4 H) 8.09 - 8.16 (m, 1 H) 8.89 - 8.96 (m, 1 H)

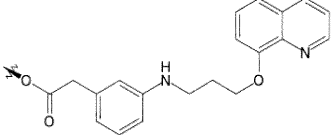
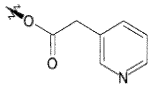
10

20

30

【 0 5 7 5 】

【表 2 - 4】

124		H	879.6	(600 MHz) : 0.81 - 0.91 (m, 9 H) 0.93 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.04 - 1.21 (m, 8 H) 1.23 (s, 3 H) 1.44 - 1.69 (m, 5 H) 1.87 - 1.93 (m, 1 H) 2.06 - 2.61 (m, 5 H) 2.24 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 3.00 - 3.26 (m, 3 H) 3.20 (s, 3 H) 3.42 (t, J=5.96 Hz, 2 H) 3.51 - 3.61 (m, 3 H) 3.85 - 4.00 (m, 2 H) 4.38 (t, J=5.96 Hz, 2 H) 4.68 - 4.79 (m, 1 H) 4.94 - 5.04 (m, 1 H) 5.15 - 5.27 (m, 1 H) 6.60 (t, J=6.65 Hz, 2 H) 6.71 (s, 1 H) 7.07 (t, J=7.79 Hz, 2 H) 7.38 - 7.41 (m, 1 H) 7.42 - 7.44 (m, 1 H) 7.45 (t, J=4.13 Hz, 1 H) 8.13 (dd, J=8.48, 1.60 Hz, 1 H) 9.01 (dd, J=4.13, 1.83 Hz, 1 H)
125		H	680.6	(600 MHz) : 0.78 - 0.92 (m, 9 H) 0.95 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.03 - 1.20 (m, 2 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.49 - 1.57 (m, 1 H) 1.57 - 1.72 (m, 2 H) 1.82 - 1.93 (m, 1 H) 2.09 - 2.23 (m, 2 H) 2.30 (s, 3 H) 2.37 (s, 6 H) 2.43 - 2.58 (m, 3 H) 2.80 - 2.88 (m, 1 H) 2.96 - 3.07 (m, 1 H) 3.10 - 3.26 (m, 3 H) 3.19 (s, 3 H) 3.70 (d, J=2.29 Hz, 2 H) 3.77 - 3.86 (m, 1 H) 3.94 - 4.09 (m, 1 H) 4.62 - 4.77 (m, 1 H) 5.18 - 5.46 (m, 1 H) 7.27 (dd, J=7.79, 5.04 Hz, 1 H) 7.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.52 (dd, J=4.81, 1.60 Hz, 1 H) 8.54 (d, J=2.29 Hz, 1 H)

10

【0576】

実施例 111

実施例 7 (3) で得られた化合物 5.35g をエタノール 20ml、1 規定塩酸 20ml に溶解し、室温にて 2 日間攪拌した。反応液を 10% 水酸化ナトリウム水溶液で中和後、酢酸エチルを加えて分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28% アンモニア水 = 20:1:0.1 から 10:1:0.1）にて精製して表 2 で示される化合物 3.87g を得た。

20

【0577】

実施例 112

(1) 実施例 111 で得られた化合物 3.86g をアセトン 20ml に溶解し、無水酢酸 617mg を加えて 18 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に酢酸エチルと飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して 2'-O-アセチル体 1.81g を粗生成物として得た。得られた粗生成物 1.81g をジメチルホルムアミドに溶解し、イミダゾール 714mg、トリエチルクロロシラン 543mg を加えて室温にて 15 時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと蒸留水を加えて分液し、有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液、蒸留水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン = 30:10:0.2）にて精製して 2'-O-アセチル-9-O-トリエチルシリル-3-ヒドロキシ体 1.09g を得た。

30

【0578】

(2) 上記 (1) で得られた化合物 46mg をトルエン 1ml に溶解し、2-ピリジル酢酸塩酸塩 6mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 74mg、4-ジメチルアミノピリジン 16mg を加えて室温にて 18 時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をメタノール 2ml に溶解し、室温にて 30 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して縮合体を得た。

40

【0579】

(3) 上記 (2) で得られた化合物を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 2 で示される化合物 19mg を得た。

【0580】

実施例 113

(1) 実施例 23 (2) で得られた化合物 0.7g を原料として実施例 111、実施例 112 (1) と同様の方法にて 2'-O-アセチル-9-O-トリエチルシリル-3-ヒドロキシ体 114mg を

50

得た。

【0581】

(2) N-クロロコハク酸イミド146mgをトルエン3mlに溶解し、-20℃にてジメチルスルフィド0.16mlを加えてそのまま10分間攪拌した。そこに上記(1)で得られた化合物100mgのトルエン溶液3mlを加えてそのまま10分間攪拌した。そこにトリエチルアミン0.30mlを加えてそのまま30分間攪拌した。反応液に飽和重曹水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1)にて精製して3-ケトン体105mgを得た

【0582】

(3) 上記(2)で得られた化合物93mgをメタノール5mlに溶解し、室温にて3日間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をエタノール1mlに溶解し、1規定塩酸1mlを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液に飽和重曹水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=30:1:0.1から10:1:0.1)と分取用薄層クロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)にて精製して表2で示される化合物34.2mgを得た。

【0583】

実施例114

(1) 実施例112(1)で得られた化合物250mgをトルエン1mlに溶解し、参考例47で得られた化合物262mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩201mg、4-ジメチルアミノピリジン43mgを加えて室温にて1日攪拌した。さらにジクロロメタン5mlを加えて室温にて2.5日間攪拌した。反応液に酢酸エチルと蒸留水を加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=50:10:0.2)にて精製して3-O-アシル体123mgを得た。

【0584】

(2) 上記(1)で得られた化合物120mgをエタノール2mlに溶解し、1規定塩酸2mlを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に1規定水酸化ナトリウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2)にて精製してアルデヒド体39mgを得た。

【0585】

(3) 上記(2)で得られた化合物38mgをクロロホルム-ジメチルホルムアミド(3:2)の混合溶媒2.5mlに溶解し、特許文献(W004/101584)に記載の方法にて得られた8-(2-アミノエトキシ)-1-エチル-4-オキソ-1,4-ジヒドロ-キノリン-3-カルボン酸塩酸塩48mgのジメチルホルムアミド溶液0.5ml、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム32mgを加えて室温にて18時間攪拌した。さらに8-(2-アミノエトキシ)-1-エチル-4-オキソ-1,4-ジヒドロ-キノリン-3-カルボン酸塩酸塩25mgのジメチルホルムアミド溶液0.5ml、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム16mgを加えて4時間攪拌した。反応液に飽和重曹水と1規定水酸化ナトリウム水溶液を加えて酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1から10:1:0.1)にて精製して2'-アセチル体17.3mgを得た。

【0586】

(4) 上記(3)で得られた化合物14.4mgをメタノール0.8mlに溶解し、室温にて3.5日間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール=10:1からクロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1から10:1:0.1)にて精製して表2で示される化合物6.8mgを得た。

10

20

30

40

50

【0587】

実施例115

(1) 実施例114(2)で得られた化合物0.34gをメタノール50mlに溶解し、70℃にて2時間、さらに室温にて9時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して脱保護体0.31gを得た。

【0588】

(2) 上記(1)で得られた化合物50mgをジメチルホルムアミド1.3ml、メタノール1.3mlに溶解し、参考例48で得られた化合物16.2mg、酢酸0.15mlを加えて室温にて40分間攪拌した。そこにシアノ水素化ホウ素ナトリウム13mgを加えて室温にて6時間攪拌した。クロロホルムと飽和重曹水を加えて分液し、飽和食塩水にて洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=9:1:0.1)にて精製して表2で示される化合物22mgを得た。

10

【0589】

実施例116

実施例115(1)で得られた化合物50mg、参考例49で得られた化合物19mgを原料として実施例115(2)と同様の方法にて表2で示される化合物26mgを得た。

【0590】

実施例117

実施例115(1)で得られた化合物50mg、参考例50で得られた化合物12.3mgを原料として実施例115(2)と同様の方法にて表2で示される化合物26mgを得た。

20

【0591】

実施例118

実施例115(1)で得られた化合物20mg、参考例51で得られた化合物8.6mgを原料として実施例115(2)と同様の方法にて表2で示される化合物1.9mgを得た。

【0592】

実施例119

実施例115(1)で得られた化合物14.9mg、参考例52で得られた化合物4.0mgを原料として実施例115(2)と同様の方法にて表2で示される化合物11.2mgを得た。

【0593】

実施例120

(1) 実施例112(1)で得られた化合物200mg、3-ニトロフェニル酢酸152mgを原料として実施例114(1)と同様の方法にてニトロフェニル酢酸エステル体266mgを得た。

30

【0594】

(2) 上記(1)で得られた化合物260mgをメタノールに溶解し、加熱還流下3時間攪拌した。放冷後、5%パラジウム-炭素100mgを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて5時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1から10:1:0.1)にて精製してアミン体180mgを得た。

【0595】

(3) 上記(2)で得られた化合物116mgをメタノール4mlに溶解し、参考例53で得られた化合物140mg、酢酸ナトリウム12mg、酢酸41μlを加えて室温にて15分間攪拌した。そこにシアノ水素化ホウ素ナトリウム18mgを加えて室温にて2時間攪拌した。反応液に飽和重曹水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1から10:1:0.1)にて精製して付加体106mgを得た。

40

【0596】

(4) 上記(3)で得られた化合物70mgを1規定塩酸1mlとエタノール0.1mlに溶解し、80℃にて3時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロ

50

マトグラフィー（クロロホルム：メタノール=10:1からクロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して表2で示される化合物7.8mgを得た。

【0597】

実施例121

(1) 実施例114(2)で得られた化合物63mg、スルファミン酸21mgをテトラヒドロフラン2mlに溶解し、亜塩素酸ナトリウム19mgの水溶液2mlを加えて室温にて3時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してカルボキシル体62mgを得た。

【0598】

(2) 上記(1)で得られた化合物62mg、参考例52で得られた化合物31mgをジクロロメタン5mlに溶解し、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩31mg、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物11mg、トリエチルアミン34μlを加えて室温にて15時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をメタノール50mlに溶解し、80℃にて3時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して表2で示される化合物12mgを得た。

10

【0599】

実施例122

実施例119で得られた化合物5.0mgを原料として実施例7(2)と同様の方法にて表2で示される化合物6.5mgを得た。

20

【0600】

実施例123

(1) 実施例114(2)で得られた化合物60mg、参考例52で得られた化合物15.1mgを原料として実施例115(2)と同様の方法にて2'-アセチル体9.0mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物6mgをクロロホルム0.5mlに溶解し、無水酢酸0.61μlを加えて室温にて2時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製してN-アシル体7.3mgを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物7.3mgをメタノール0.5mlに溶解し、室温にて3日間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して表2で示される化合物4.5mgを得た。

30

【0601】

実施例124

8-キノリノールから参考例53と同様の方法で得られた3-(キノリン-8-イルオキシ)プロパナール10mg、実施例120(2)で得られた化合物35mgを原料として実施例120(3)、(4)と同様の方法にて表2で示される化合物3.6mgを得た。

【0602】

実施例125

(1) 実施例112(1)で得られた化合物97mg、3-ピリジル酢酸塩酸塩を原料として実施例112(2)と同様の方法にてアシル体94mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物94mgをエタノール1mlに溶解し、1規定塩酸1mlを加えて室温にて15時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=30:1:0.1から10:1:0.1）にて精製して2'-O-アセチル体74mgを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物23mgをメタノール5mlに溶解し、室温にて15時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=20:1:0.1）にて精製して表2で示される化合物22

40

50

mgを得た。

【0603】

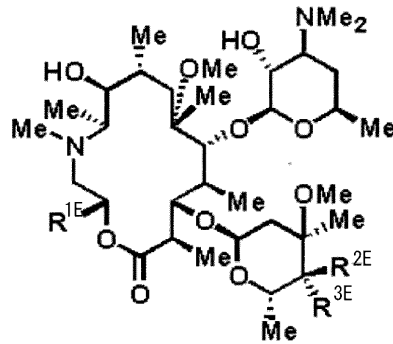
実施例126～171の合成

表3で規定した R^{1E} 、 R^{2E} 、及び R^{3E} をもつ、式(E)で示される化合物の製造法を以下に示す。

【0604】

【表3-1】

表3



式(E)

実施例	R^{1E}	R^{2E}	R^{3E}	ESI MS (M+H)	$^1\text{H-NMR}$, CDCl_3 , δ (ppm)
126	Et		H	968.0	(600 MHz): 0.78 – 0.85 (m, 6 H) 0.86 – 0.95 (m, 6 H) 1.08 – 1.35 (m, 20 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 – 1.88 (m, 5 H) 2.09 – 2.67 (m, 10 H) 2.24 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 – 2.83 (m, 1 H) 2.86 – 2.94 (m, 1 H) 3.15 – 3.46 (m, J=54.56 Hz, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.53 – 3.60 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.84 (s, 3 H) 4.18 – 4.25 (m, 1 H) 4.32 – 4.46 (m, 3 H) 4.54 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.60 – 4.67 (m, 1 H) 4.95 – 4.99 (m, 1 H) 5.56 (s, 1 H) 6.84 – 6.94 (m, 2 H) 7.18 – 7.30 (m, 2 H)
127	Et			717.3	(300 MHz): 0.84 (t, 6 H) 0.92 (t, J=7.46 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.12 – 1.32 (m, 2 H) 1.18 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.38 (d, J=6.84 Hz, 3 H) 1.43 (s, 3 H) 1.52 – 1.96 (m, 5 H) 2.08 – 2.56 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.32 (d, J=6.99 Hz, 1 H) 2.38 (s, 3 H) 2.76 – 2.96 (m, 2 H) 3.18 – 3.28 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.30 – 3.51 (m, 2 H) 3.71 (d, J=6.84 Hz, 1 H) 4.25 – 4.32 (m, 2 H) 4.49 – 4.60 (m, 1 H) 4.62 – 4.75 (m, 1 H) 5.26 (t, J=7.07 Hz, 1 H)
128	Et			732.5	(300 MHz): 0.80 – 0.95 (m, 9 H) 1.06 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.12 – 1.26 (m, 2 H) 1.18 (d, J=6.99 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 1.48 (d, J=6.99 Hz, 3 H) 1.52 (s, 3 H) 1.53 – 1.73 (m, 4 H) 1.85 – 1.97 (m, 1 H) 2.09 – 2.37 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.43 – 2.57 (m, 2 H) 2.81 – 2.89 (m, 1 H) 2.91 – 3.00 (m, 1 H) 3.16 – 3.29 (m, 2 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.43 – 3.59 (m, 1 H) 3.83 – 3.96 (m, 1 H) 3.97 – 4.05 (m, 1 H) 4.43 (d, J=7.62 Hz, 1 H) 4.66 – 4.79 (m, 1 H) 5.01 – 5.11 (m, 1 H) 5.16 – 5.28 (m, 1 H)
129	Et		H	718.4	ジステレオマーの混合物 (300 MHz): 0.73 – 0.97 (m, 9 H) 1.01 – 1.35 (m, 20 H) 1.44 – 1.94 (m, 3 H) 1.98 – 2.61 (m, 7 H) 2.30 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.72 – 2.97 (m, 3 H) 3.16 – 3.28 (m, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.28 – 3.36 (m, 3 H) 3.37 – 3.59 (m, 2 H) 3.68 – 3.77 (m, 1 H) 3.98 – 4.21 (m, 2 H) 4.35 – 4.51 (m, 1 H) 4.59 – 4.73 (m, 2 H) 4.90 – 5.01 (m, 1 H)
		H			

【0605】

【表 3 - 2】

130	Et		H	1096.5	(300 MHz): 0.79 - 0.99 (m, 9 H) 0.99 - 1.35 (m, 24 H) 1.39 - 1.93 (m, 5 H) 2.13 - 2.51 (m, J=16.32 Hz, 5 H) 2.31 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.52 - 2.93 (m, 5 H) 3.17 - 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.38 - 3.47 (m, 1 H) 3.55 - 3.74 (m, 3 H) 3.88 - 3.99 (m, 4 H) 4.14 - 4.20 (m, 1 H) 4.29 - 4.35 (m, 2 H) 4.36 - 4.47 (m, 1 H) 4.52 (d, J=6.06 Hz, 1 H) 4.66 - 4.72 (m, 1 H) 4.73 (d, J=9.64 Hz, 1 H) 5.00 (d, J=5.13 Hz, 1 H) 7.91 (s, 1 H) 8.15 (s, 1 H) 8.84 (s, 1 H)
131	Et		H	1095.5	(300 MHz): 0.83 (d, J=6.84 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.38 Hz, 3 H) 0.94 - 1.92 (m, 23 H) 1.11 (s, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 2.12 - 2.93 (m, J=15.23 Hz, 10 H) 2.31 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 3.16 - 3.60 (m, 6 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.69 (d, J=7.46 Hz, 1 H) 3.75 - 3.85 (m, 4 H) 4.16 - 4.20 (m, 1 H) 4.39 - 4.45 (m, 1 H) 4.50 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.64 - 4.70 (m, 1 H) 4.73 (d, J=9.95 Hz, 1 H) 4.97 - 5.06 (m, 2 H) 7.54 (s, 1 H) 8.05 (s, 1 H) 8.74 (s, 1 H)
132	Et		H	953.7	(600 MHz): 0.77 - 0.85 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.99 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.06 - 1.21 (m, 2 H) 1.10 - 1.18 (m, 15 H) 1.29 - 1.30 (m, 3 H) 1.48 - 1.65 (m, 3 H) 1.69 - 1.79 (m, 1 H) 1.79 - 1.89 (m, 1 H) 2.11 - 2.31 (m, 3 H) 2.25 - 2.27 (m, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.40 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.45 - 2.64 (m, 4 H) 2.66 - 2.77 (m, 2 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 - 2.92 (m, 1 H) 3.16 - 3.45 (m, 4 H) 3.22 - 3.23 (m, 3 H) 3.31 - 3.32 (m, 3 H) 3.55 - 3.60 (m, 1 H) 3.60 - 3.63 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.73 - 3.76 (m, 1 H) 3.83 (s, 3 H) 4.20 (s, 1 H) 4.34 - 4.42 (m, 1 H) 4.44 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 4.54 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.96 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.51 - 5.57 (m, 1 H) 6.85 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.89 (t, J=7.57 Hz, 1 H) 7.18 - 7.29 (m, 2 H)
133	Et		H	924.5	(300 MHz): 0.83 (d, J=6.84 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.31 Hz, 3 H) 1.01 - 1.37 (m, 17 H) 1.05 (t, J=7.15 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.46 - 1.92 (m, 5 H) 2.13 - 2.66 (m, 8 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.66 - 2.94 (m, 4 H) 3.19 - 3.23 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.37 - 3.45 (m, 1 H) 3.57 - 3.67 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 3.82 (s, 3 H) 4.09 - 4.22 (m, 2 H) 4.36 - 4.48 (m, 1 H) 4.49 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.63 - 4.73 (m, 2 H) 4.99 (d, J=4.82 Hz, 1 H) 6.86 (d, J=8.08 Hz, 1 H) 6.95 (t, J=7.46 Hz, 1 H) 7.17 - 7.24 (m, 1 H) 7.30 - 7.35 (m, 1 H)
134	Et		H	952.6	(300 MHz): 0.83 (d, J=6.84 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.46 Hz, 3 H) 0.99 (t, J=6.84 Hz, 3 H) 1.00 - 1.34 (m, 14 H) 1.10 (s, 3 H) 1.12 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.46 - 1.91 (m, 5 H) 2.13 - 2.68 (m, 10 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.72 - 3.02 (m, 4 H) 3.20 - 3.23 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.37 - 3.44 (m, 1 H) 3.59 - 3.74 (m, 2 H) 3.80 (s, 3 H) 4.13 - 4.19 (m, 1 H) 4.28 - 4.45 (m, 2 H) 4.50 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.61 - 4.72 (m, 2 H) 4.98 (d, J=4.35 Hz, 1 H) 6.85 (d, J=8.08 Hz, 1 H) 6.92 (t, J=7.54 Hz, 1 H) 7.15 - 7.23 (m, 1 H) 7.37 (d, J=7.31 Hz, 1 H)
135	Et		H	980.7	
136	Et		H	994.7	(300 MHz): 0.83 (d, J=7.15 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.31 Hz, 3 H) 0.97 (t, J=6.99 Hz, 3 H) 1.04 - 1.35 (m, 18 H) 1.09 (s, 3 H) 1.26 (d, J=6.53 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.35 - 1.93 (m, 7 H) 2.12 - 2.67 (m, 12 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.77 - 2.94 (m, 2 H) 3.18 - 3.23 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.36 - 3.45 (m, 1 H) 3.58 - 3.67 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.77 Hz, 1 H) 3.81 (s, 3 H) 4.17 (d, J=4.51 Hz, 1 H) 4.24 - 4.33 (m, 1 H) 4.36 - 4.47 (m, 1 H) 4.50 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.62 - 4.72 (m, 2 H) 4.99 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 6.85 (d, J=8.08 Hz, 1 H) 6.92 (t, J=7.38 Hz, 1 H) 7.18 (td, J=7.69, 1.40 Hz, 1 H) 7.40 (d, J=6.68 Hz, 1 H)

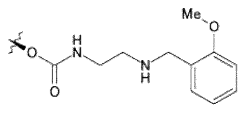
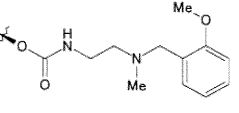
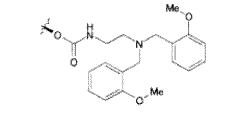
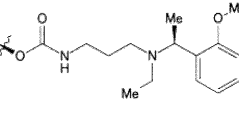
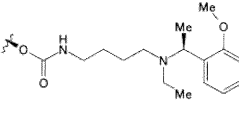
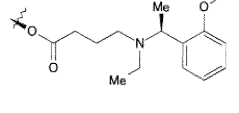
10

20

30

40

【表 3 - 3】

137	Et		H	(300 MHz) : 0.79 - 0.86 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.31 Hz, 3 H) 1.06 - 1.28 (m, 2 H) 1.06 - 1.21 (m, 15 H) 1.28 - 1.34 (m, 3 H) 1.45 - 1.95 (m, 5 H) 2.07 - 2.65 (m, 6 H) 2.28 - 2.31 (m, 6 H) 2.37 - 2.37 (m, 3 H) 2.68 - 2.77 (m, 2 H) 2.77 - 2.96 (m, 2 H) 3.13 - 3.35 (m, 3 H) 3.23 - 3.25 (m, 3 H) 3.32 - 3.34 (m, 3 H) 3.41 (d, J=8.70 Hz, 1 H) 3.51 - 3.63 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.93 Hz, 1 H) 3.76 (s, 2 H) 3.84 (s, 3 H) 4.14 - 4.23 (m, 1 H) 4.29 - 4.42 (m, 1 H) 4.45 (d, J=6.84 Hz, 1 H) 4.54 (d, J=9.79 Hz, 1 H) 4.65 (s, 1 H) 4.98 (d, J=4.51 Hz, 1 H) 5.39 (t, J=5.28 Hz, 1 H) 6.83 - 6.95 (m, 2 H) 7.15 - 7.30 (m, 2 H)
138	Et		H	939.6 (300 MHz) : 0.78 - 0.87 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.07 Hz, 3 H) 1.05 - 1.28 (m, 17 H) 1.31 - 1.33 (m, 3 H) 1.46 - 1.95 (m, 5 H) 2.11 - 2.48 (m, 6 H) 2.17 - 2.22 (m, 3 H) 2.27 - 2.29 (m, 6 H) 2.37 - 2.38 (m, 3 H) 2.56 (t, J=5.67 Hz, 2 H) 2.74 - 2.97 (m, 2 H) 3.14 - 3.50 (m, J=27.04 Hz, 4 H) 3.24 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.51 - 3.79 (m, 4 H) 3.86 (s, 3 H) 4.19 - 4.26 (m, 1 H) 4.33 - 4.50 (m, 2 H) 4.56 (d, J=9.79 Hz, 1 H) 4.66 (s, 1 H) 4.97 - 5.01 (m, 1 H) 5.55 - 5.64 (m, 1 H) 6.83 - 6.96 (m, 2 H) 7.19 - 7.30 (m, 2 H)
139	Et		H	1045.6 (600 MHz) : 0.76 - 0.85 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.03 - 1.22 (m, 2 H) 1.08 - 1.19 (m, 15 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 - 1.67 (m, 3 H) 1.69 - 1.80 (m, 1 H) 1.80 - 1.89 (m, 1 H) 2.09 - 2.20 (m, 1 H) 2.20 - 2.31 (m, 2 H) 2.24 - 2.30 (m, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.39 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.46 - 2.66 (m, 4 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.89 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.16 - 3.42 (m, 4 H) 3.21 - 3.24 (m, 3 H) 3.31 - 3.33 (m, 3 H) 3.56 - 3.68 (m, 1 H) 3.64 (d, J=8.25 Hz, 4 H) 3.73 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.81 (s, 6 H) 4.22 (s, 1 H) 4.35 - 4.43 (m, 1 H) 4.45 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.52 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.59 (s, 1 H) 6.83 (d, J=8.25 Hz, 2 H) 6.88 (t, J=7.57 Hz, 2 H) 7.19 (t, J=7.79 Hz, 2 H) 7.33 (d, J=6.42 Hz, 2 H)
140	Et		H	981.7 (600 MHz) : 0.78 - 0.85 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.01 (s, 3 H) 1.05 - 1.33 (m, 23 H) 1.46 - 1.94 (m, 7 H) 2.10 - 2.19 (m, 1 H) 2.20 - 2.69 (m, 9 H) 2.25 - 2.29 (m, 6 H) 2.35 - 2.37 (m, 3 H) 2.76 - 2.84 (m, 1 H) 2.89 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 3.13 - 3.25 (m, 3 H) 3.22 - 3.24 (m, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.39 (s, 1 H) 3.56 (s, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.81 (s, 3 H) 4.19 (s, 1 H) 4.33 - 4.42 (m, 2 H) 4.44 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.53 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.73 (s, 1 H) 6.86 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 6.90 - 6.97 (m, 1 H) 7.17 - 7.24 (m, 1 H) 7.28 - 7.35 (m, 1 H)
141	Et		H	995.7 (600 MHz) : 0.76 - 0.84 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.97 (s, 3 H) 1.06 - 1.23 (m, 2 H) 1.12 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 - 1.18 (m, 15 H) 1.26 (s, 2 H) 1.30 (s, 3 H) 1.42 (s, 2 H) 1.48 - 1.64 (m, 3 H) 1.75 (s, 1 H) 1.83 (s, 1 H) 2.09 - 2.19 (m, 1 H) 2.20 - 2.69 (m, 9 H) 2.26 - 2.28 (m, 6 H) 2.35 - 2.37 (m, 3 H) 2.76 - 2.84 (m, 1 H) 2.89 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 3.08 - 3.21 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 - 3.46 (m, 1 H) 3.48 - 3.57 (m, 1 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.80 (s, 3 H) 4.18 - 4.31 (m, 2 H) 4.32 - 4.44 (m, 2 H) 4.53 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.01 (s, 1 H) 6.84 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.89 - 6.96 (m, 1 H) 7.14 - 7.22 (m, 1 H) 7.34 - 7.43 (m, 1 H)
142	Et		H	(600 MHz) : 0.80 - 0.85 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.02 - 1.35 (m, 23 H) 1.30 (s, 3 H) 1.49 - 1.89 (m, 7 H) 2.14 - 2.64 (m, 12 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 - 2.91 (m, 1 H) 3.18 - 3.23 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.38 - 3.44 (m, 1 H) 3.59 - 3.65 (m, 1 H) 3.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.80 (s, 3 H) 4.14 - 4.18 (m, 1 H) 4.28 - 4.33 (m, 1 H) 4.37 - 4.43 (m, 1 H) 4.49 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.63 - 4.70 (m, 2 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 6.84 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.89 - 6.94 (m, 1 H) 7.16 - 7.21 (m, 1 H) 7.34 - 7.38 (m, 1 H)

【 0 6 0 7 】

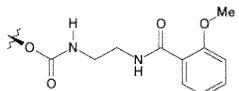
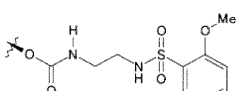
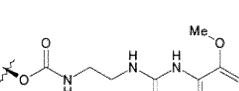
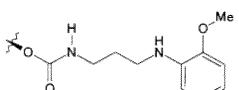
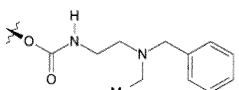
10

20

30

40

【表 3 - 4】

143	Et		H	939.6	(600 MHz) : 0.78 – 0.83 (m, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 – 1.20 (m, 8 H) 1.07 (s, 3 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.14 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.28 (s, 3 H) 1.49 – 1.59 (m, 2 H) 1.63 – 1.68 (m, 1 H) 1.69 – 1.77 (m, 1 H) 1.80 – 1.86 (m, 1 H) 2.11 – 2.46 (m, 5 H) 2.27 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.51 – 2.57 (m, 1 H) 2.76 – 2.83 (m, 1 H) 2.86 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 3.17 (dd, J=10.32, 7.11 Hz, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.34 – 3.49 (m, 3 H) 3.52 – 3.64 (m, 3 H) 3.67 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.95 (s, 3 H) 4.13 – 4.17 (m, 1 H) 4.31 – 4.37 (m, 1 H) 4.42 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.50 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.60 – 4.67 (m, 1 H) 4.95 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.35 (t, J=5.73 Hz, 1 H) 6.95 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.01 – 7.08 (m, 1 H) 7.41 – 7.45 (m, 1 H) 8.12 (t, J=5.50 Hz, 1 H) 8.16 (dd, J=8.25, 1.83 Hz, 1 H)
144	Et		H	975.6	(600 MHz) : 0.77 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.85 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 – 1.25 (m, 8 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 (s, 3 H) 1.17 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.27 (s, 3 H) 1.47 – 1.52 (m, 1 H) 1.55 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.65 – 1.75 (m, 2 H) 1.77 – 1.84 (m, 1 H) 2.08 – 2.42 (m, 5 H) 2.25 (s, 6 H) 2.31 (s, 3 H) 2.51 – 2.57 (m, 1 H) 2.74 – 2.80 (m, 1 H) 2.84 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 2.91 – 3.00 (m, 2 H) 3.15 (dd, J=10.32, 7.11 Hz, 1 H) 3.19 (s, 3 H) 3.25 – 3.41 (m, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.52 – 3.57 (m, 1 H) 3.65 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.93 (s, 3 H) 4.13 – 4.17 (m, 1 H) 4.33 – 4.37 (m, 1 H) 4.40 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.47 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.60 (d, 1 H) 4.93 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.11 – 5.15 (m, 1 H) 5.25 (t, J=5.73 Hz, 1 H) 6.99 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.02 (td, J=7.57, 0.92 Hz, 1 H) 7.50 (td, J=7.91, 1.61 Hz, 1 H) 7.82 (dd, J=7.79, 1.83 Hz, 1 H)
145	Et		H	954.6	(600 MHz) : 0.77 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.84 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.02 – 1.16 (m, 17 H) 1.24 (s, 3 H) 1.46 – 1.55 (m, 2 H) 1.58 – 1.62 (m, 1 H) 1.66 – 1.73 (m, 1 H) 1.76 – 1.83 (m, 1 H) 2.07 – 2.28 (m, 3 H) 2.22 (s, 6 H) 2.30 (s, 3 H) 2.33 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.36 – 2.44 (m, 1 H) 2.47 – 2.53 (m, 1 H) 2.73 – 2.78 (m, 1 H) 2.80 – 2.85 (m, 1 H) 3.14 (dd, J=10.32, 7.57 Hz, 1 H) 3.17 (s, 3 H) 3.24 (s, 3 H) 3.26 – 3.42 (m, 5 H) 3.49 – 3.54 (m, 1 H) 3.64 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.78 (s, 3 H) 4.09 – 4.13 (m, 1 H) 4.29 – 4.34 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.46 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.57 – 4.62 (m, 1 H) 4.91 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.27 (s, 1 H) 5.34 (t, J=4.81 Hz, 1 H) 6.77 – 6.82 (m, 1 H) 6.87 (td, J=7.57, 1.38 Hz, 1 H) 6.92 (td, J=7.79, 1.38 Hz, 1 H) 7.91 (dd, J=7.79, 1.38 Hz, 1 H)
146	Et		H	925.5	(600 MHz) : 0.76 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.84 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 (d, J=7.34 Hz, 14 H) 1.06 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.45 – 1.64 (m, 3 H) 1.65 – 1.73 (m, 1 H) 1.75 – 1.83 (m, 3 H) 2.07 – 2.12 (m, 1 H) 2.18 – 2.43 (m, 4 H) 2.23 (s, 6 H) 2.31 (s, 3 H) 2.47 – 2.53 (m, 1 H) 2.74 – 2.78 (m, 1 H) 2.84 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 3.10 – 3.17 (m, 3 H) 3.17 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.25 – 3.42 (m, 3 H) 3.45 – 3.51 (m, 1 H) 3.64 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 3.78 (s, 3 H) 4.15 – 4.20 (m, 1 H) 4.29 – 4.34 (m, 1 H) 4.36 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.50 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.55 – 4.61 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 6.52 (dd, J=7.79, 1.38 Hz, 1 H) 6.61 (td, J=7.79, 1.38 Hz, 1 H) 6.71 (dd, J=7.79, 1.38 Hz, 1 H) 6.80 (td, J=7.57, 1.38 Hz, 1 H)
147	Et		H	923.6	(300 MHz) : 0.83 (d, J=6.84 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.31 Hz, 3 H) 1.02 (t, J=7.23 Hz, 3 H) 1.06 – 1.27 (m, 17 H) 1.32 (s, 3 H) 1.45 – 1.91 (m, 5 H) 2.11 – 2.62 (m, 10 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.78 – 2.95 (m, 2 H) 3.15 – 3.48 (m, J=35.28 Hz, 4 H) 3.24 (s, 3 H) 3.36 (s, 3 H) 3.58 (d, J=3.57 Hz, 2 H) 3.59 – 3.67 (m, 1 H) 3.73 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 4.18 – 4.26 (m, 1 H) 4.36 – 4.44 (m, 1 H) 4.48 (d, J=7.46 Hz, 1 H) 4.52 – 4.58 (m, 1 H) 4.60 – 4.71 (m, 1 H) 4.98 (d, J=3.26 Hz, 1 H) 5.24 – 5.29 (m, 1 H) 7.21 – 7.32 (m, 5 H)

【 0 6 0 8 】

10

20

30

【表 3 - 5】

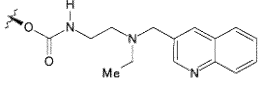
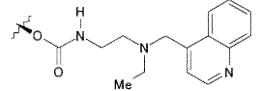
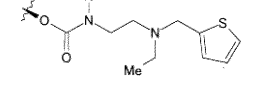
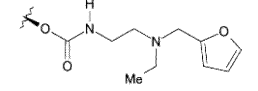
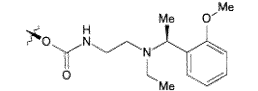
148	Et		H	(600 MHz) : 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.01 - 1.22 (m, 14 H) 1.12 (s, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.49 - 1.64 (m, 3 H) 1.69 - 1.78 (m, 1 H) 1.80 - 1.89 (m, 1 H) 2.10 - 2.46 (m, 4 H) 2.24 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.40 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.53 - 2.66 (m, 5 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.89 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.16 - 3.45 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.36 (s, 3 H) 3.61 - 3.66 (m, 1 H) 3.67 - 3.73 (m, 2 H) 3.76 - 3.80 (m, 1 H) 4.16 - 4.22 (m, 1 H) 4.35 - 4.43 (m, 1 H) 4.47 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.52 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.61 - 4.67 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.88 (t, J=4.59 Hz, 1 H) 7.14 (dd, J=7.34, 5.04 Hz, 1 H) 7.32 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.61 (td, J=7.57, 1.83 Hz, 1 H) 8.59 (d, J=4.58 Hz, 1 H)
149	Et		H	922.7 [M-H] (600 MHz) : 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.01 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.04 - 1.27 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.50 - 1.79 (m, 4 H) 1.80 - 1.87 (m, 1 H) 2.11 - 2.19 (m, 1 H) 2.22 - 2.61 (m, 6 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.41 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 2.58 (t, J=5.96 Hz, 2 H) 2.78 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 3.17 - 3.46 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.56 - 3.61 (m, 2 H) 3.66 - 3.71 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.20 - 4.26 (m, 1 H) 4.35 - 4.47 (m, 2 H) 4.54 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.59 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.18 - 5.21 (m, 1 H) 7.23 (dd, J=7.34, 5.04 Hz, 1 H) 7.62 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.47 - 8.51 (m, 2 H)
150	Et		H	924.9 (600 MHz) : 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.01 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.03 - 1.27 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.52 - 1.56 (m, 1 H) 1.57 - 1.62 (m, 1 H) 1.62 - 1.68 (m, 1 H) 1.70 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.88 (m, 1 H) 2.11 - 2.19 (m, 1 H) 2.22 - 2.65 (m, 7 H) 2.31 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.41 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 2.58 (t, J=5.96 Hz, 2 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=13.76 Hz, 1 H) 3.19 - 3.44 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.54 - 3.61 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.19 - 4.27 (m, 1 H) 4.36 - 4.41 (m, 1 H) 4.44 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.54 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.63 (d, 1 H) 4.97 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 5.22 (br. s., 1 H) 7.23 (d, J=5.50 Hz, 2 H) 8.51 (d, J=5.04 Hz, 2 H)
151	Et		H	(600 MHz) : 0.79 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.83 - 0.89 (m, 3 H) 1.00 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.03 - 1.23 (m, 17 H) 1.24 - 1.29 (m, 3 H) 1.46 - 1.76 (m, 4 H) 1.78 - 1.87 (m, 1 H) 2.09 - 2.44 (m, 5 H) 2.23 (s, 6 H) 2.33 (s, 3 H) 2.48 - 2.62 (m, 5 H) 2.75 - 2.81 (m, 1 H) 2.82 - 2.89 (m, 1 H) 3.14 - 3.42 (m, 3 H) 3.20 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.54 - 3.62 (m, 1 H) 3.65 - 3.73 (m, 2 H) 3.76 (s, 2 H) 4.16 - 4.22 (m, 1 H) 4.35 - 4.39 (m, 1 H) 4.43 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.51 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.61 (br. s., 1 H) 4.94 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.26 (t, J=4.59 Hz, 1 H) 7.38 - 7.48 (m, 3 H) 7.66 (s, 1 H) 7.72 - 7.83 (m, 3 H)
152	Et		H	(600 MHz) : 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.07 - 1.22 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.48 - 1.68 (m, 3 H) 1.70 - 1.79 (m, 1 H) 1.81 - 1.88 (m, 1 H) 2.11 - 2.45 (m, 5 H) 2.26 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.51 - 2.69 (m, 3 H) 2.65 (t, J=5.96 Hz, 2 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.17 - 3.45 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.52 - 3.58 (m, 1 H) 3.69 - 3.73 (m, 1 H) 3.97 - 4.04 (m, 2 H) 4.18 - 4.25 (m, 1 H) 4.34 - 4.39 (m, 1 H) 4.42 - 4.45 (m, 1 H) 4.50 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.61 - 4.66 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.12 - 5.15 (m, 1 H) 7.45 - 7.48 (m, 2 H) 7.49 - 7.53 (m, 2 H) 7.76 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.84 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.20 (d, J=8.71 Hz, 1 H)

10

20

30

【表 3 - 6】

153	Et		H	974.9	(600 MHz) : 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.05 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.17 (d, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.50 - 1.78 (m, 4 H) 1.81 - 1.87 (m, 1 H) 2.12 - 2.20 (m, 1 H) 2.20 - 2.46 (m, 3 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.40 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.52 - 2.61 (m, 3 H) 2.64 (t, J=5.96 Hz, 2 H) 2.78 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 (d, J=13.76 Hz, 1 H) 3.17 - 3.44 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.54 - 3.59 (m, 1 H) 3.66 - 3.72 (m, 2 H) 3.74 - 3.81 (m, 2 H) 4.21 - 4.26 (m, 1 H) 4.36 - 4.47 (m, 2 H) 4.54 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.61 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.22 (t, J=4.36 Hz, 1 H) 7.54 (t, J=7.57 Hz, 1 H) 7.68 (t, J=8.25 Hz, 1 H) 7.80 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.03 (s, 1 H) 8.08 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 8.83 (d, J=2.29 Hz, 1 H)
154	Et		H	974.9	(600 MHz) : 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.09 - 1.24 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.50 - 1.62 (m, 3 H) 1.71 - 1.78 (m, 1 H) 1.80 - 1.88 (m, 1 H) 2.11 - 2.18 (m, 1 H) 2.22 - 2.45 (m, 3 H) 2.26 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.40 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.52 - 2.58 (m, 1 H) 2.58 - 2.64 (m, 2 H) 2.68 (t, J=5.50 Hz, 2 H) 2.78 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 (d, J=13.30 Hz, 1 H) 3.17 - 3.21 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.21 - 3.47 (m, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.52 - 3.57 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.04 (s, 2 H) 4.22 - 4.26 (m, 1 H) 4.35 - 4.40 (m, 1 H) 4.43 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.52 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.60 - 4.66 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.14 (t, J=4.81 Hz, 1 H) 7.47 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 7.56 (t, J=7.11 Hz, 1 H) 7.70 (t, J=7.57 Hz, 1 H) 8.11 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 8.13 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 8.84 (d, J=4.58 Hz, 1 H)
155	Et		H		(600 MHz) : 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.06 - 1.28 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.50 - 1.69 (m, 3 H) 1.70 - 1.78 (m, 1 H) 1.81 - 1.88 (m, 1 H) 2.13 - 2.20 (m, 1 H) 2.21 - 2.46 (m, 3 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.40 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.52 - 2.63 (m, J=5.96, 5.96 Hz, 3 H) 2.58 (t, J=5.96 Hz, 2 H) 2.79 - 2.83 (m, 1 H) 2.86 - 2.92 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.19 - 3.23 (m, 1 H) 3.25 - 3.30 (m, 2 H) 3.34 (s, 3 H) 3.37 - 3.43 (m, 1 H) 3.60 - 3.66 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.77 - 3.84 (m, 2 H) 4.17 - 4.21 (m, 1 H) 4.36 - 4.42 (m, 1 H) 4.46 - 4.49 (m, 1 H) 4.54 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.62 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 5.33 (t, J=4.36 Hz, 1 H) 6.87 (d, J=3.67 Hz, 1 H) 6.93 (dd, J=5.04, 3.21 Hz, 1 H) 7.19 (d, J=5.04 Hz, 1 H)
156	Et		H		(600 MHz) : 0.78 - 0.84 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 0.95 - 1.33 (m, 17 H) 1.04 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.50 - 1.88 (m, 5 H) 2.12 - 2.62 (m, 10 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.79 - 2.93 (m, 2 H) 3.11 - 3.46 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.53 - 3.75 (m, 4 H) 4.17 - 4.20 (m, 1 H) 4.34 - 4.57 (m, 3 H) 4.60 - 4.69 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.40 (br. s., 1 H) 6.14 (d, J=3.21 Hz, 1 H) 6.28 - 6.31 (m, 1 H) 7.34 - 7.37 (m, 1 H)
157	H		H		(600 MHz) : 0.80 - 0.86 (m, 6 H) 0.92 (t, J=6.88 Hz, 3 H) 1.06 - 1.27 (m, 14 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.29 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.48 - 1.56 (m, 1 H) 1.60 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.82 - 1.93 (m, 1 H) 2.19 - 2.44 (m, 5 H) 2.24 (s, 6 H) 2.32 (s, 3 H) 2.46 - 2.65 (m, 5 H) 2.75 - 2.82 (m, 1 H) 2.82 - 2.90 (m, 1 H) 3.15 - 3.28 (m, 3 H) 3.24 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.44 - 3.52 (m, 1 H) 3.56 - 3.67 (m, 1 H) 3.72 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 3.81 - 3.89 (m, 1 H) 3.84 (s, 3 H) 4.17 (br. s., 1 H) 4.31 - 4.41 (m, 3 H) 4.45 (d, J=5.96 Hz, 1 H) 4.52 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.89 (br. s., 1 H) 5.51 (br. s., 1 H) 6.86 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.90 (t, J=7.34 Hz, 1 H) 7.20 (t, J=7.79 Hz, 1 H) 7.27 (d, J=6.88 Hz, 1 H)

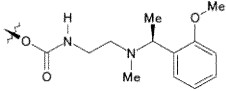
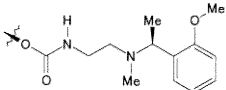
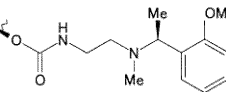
10

20

30

【 0 6 1 0 】

【表 3 - 7】

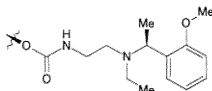
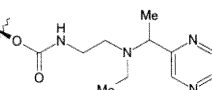
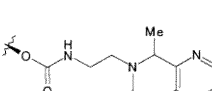
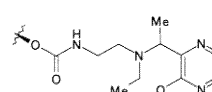
158	H		H	(600 MHz) : 0.80 - 0.86 (m, 6 H) 1.08 - 1.28 (m, 5 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 (s, 3 H) 1.17 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.29 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.55 - 1.65 (m, 2 H) 1.82 - 1.95 (m, 1 H) 2.11 (s, 3 H) 2.19 - 2.35 (m, 3 H) 2.25 (s, 6 H) 2.32 (s, 3 H) 2.39 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.42 - 2.61 (m, 4 H) 2.76 - 2.82 (m, 1 H) 2.82 - 2.92 (m, 1 H) 3.16 - 3.31 (m, 3 H) 3.25 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.42 - 3.55 (m, 1 H) 3.59 - 3.66 (m, 1 H) 3.72 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 3.84 (s, 3 H) 3.84 - 3.90 (m, 1 H) 4.14 - 4.21 (m, 2 H) 4.32 - 4.41 (m, 2 H) 4.46 (d, 1 H) 4.53 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.85 - 4.92 (m, 1 H) 5.49 (br. s., 1 H) 6.87 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 6.91 (t, J=7.34 Hz, 1 H) 7.20 (t, J=7.11 Hz, 1 H) 7.25 - 7.27 (m, 1 H)
159	Et		H	(600 MHz) : 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 - 1.25 (m, 14 H) 1.12 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.29 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 - 1.69 (m, 3 H) 1.71 - 1.78 (m, 1 H) 1.81 - 1.87 (m, 1 H) 2.08 - 2.57 (m, 6 H) 2.11 (s, 3 H) 2.24 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.87 - 2.92 (m, 1 H) 3.16 - 3.35 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.36 - 3.46 (m, 2 H) 3.55 - 3.60 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.84 (s, 3 H) 4.14 - 4.24 (m, 2 H) 4.37 - 4.42 (m, 1 H) 4.44 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.54 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.60 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.54 (br. s., 1 H) 6.87 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.91 (t, J=7.34 Hz, 1 H) 7.18 - 7.22 (m, 1 H) 7.26 (dd, J=7.57, 1.60 Hz, 1 H)
160	Me		H	939.9 (600 MHz) : 0.79 - 0.88 (m, 6 H) 1.09 - 1.13 (m, 3 H) 1.13 - 1.20 (m, 12 H) 1.20 - 1.33 (m, 2 H) 1.20 - 1.26 (m, 3 H) 1.26 - 1.32 (m, 6 H) 1.56 - 1.63 (m, 1 H) 1.64 - 1.80 (m, 1 H) 1.81 - 1.93 (m, 1 H) 2.05 - 2.31 (m, 3 H) 2.10 - 2.12 (m, 3 H) 2.24 - 2.26 (m, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.40 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.43 - 2.59 (m, 4 H) 2.71 - 2.79 (m, 1 H) 2.81 - 2.93 (m, 1 H) 3.17 - 3.30 (m, 3 H) 3.24 - 3.25 (m, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.34 - 3.48 (m, 1 H) 3.56 - 3.65 (m, 1 H) 3.72 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.84 (s, 3 H) 4.11 - 4.24 (m, 2 H) 4.34 - 4.42 (m, 1 H) 4.46 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 4.53 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.84 (s, 1 H) 4.91 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.50 (s, 1 H) 6.87 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.91 (t, J=7.34 Hz, 1 H) 7.20 (t, J=7.79 Hz, 1 H) 7.24 - 7.28 (m, 1 H)

【 0 6 1 1 】

10

20

【表 3 - 8】

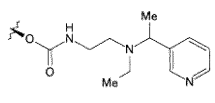
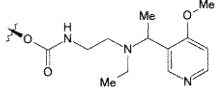
161	Me		H	953.9	(600 MHz) : 0.80 - 0.88 (m, 6 H) 0.93 (t, J=6.88 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 (s, 3 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 - 1.20 (m, 6 H) 1.18 - 1.27 (m, 2 H) 1.20 - 1.24 (m, 3 H) 1.26 - 1.33 (m, 6 H) 1.49 - 1.56 (m, 1 H) 1.60 (dd, J=15.13, 4.59 Hz, 1 H) 1.87 (s, 1 H) 2.09 - 2.18 (m, 1 H) 2.19 - 2.31 (m, 2 H) 2.24 - 2.26 (m, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.40 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.44 - 2.66 (m, 6 H) 2.71 - 2.79 (m, 1 H) 2.82 - 2.93 (m, 1 H) 3.16 - 3.23 (m, 3 H) 3.23 - 3.26 (m, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.36 - 3.45 (m, 1 H) 3.55 - 3.64 (m, 1 H) 3.72 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.84 (s, 3 H) 4.17 (s, 1 H) 4.32 - 4.42 (m, 2 H) 4.46 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.52 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.85 (s, 1 H) 4.91 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.53 (s, 1 H) 6.86 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.91 (t, J=7.11 Hz, 1 H) 7.20 (t, J=8.48 Hz, 1 H) 7.28 (d, J=6.88 Hz, 1 H)
162	Et		H	939.7	ジアステレオマーの混合物、(600 MHz) : 0.77 - 0.85 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.01 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.42 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.48 - 1.58 (m, 2 H) 1.60 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.75 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.08 - 2.60 (m, 8 H) 2.23 - 2.26 (m, 6 H) 2.35 - 2.37 (m, 3 H) 2.60 - 2.71 (m, 2 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.85 - 2.94 (m, 1 H) 3.15 - 3.26 (m, 1 H) 3.22 - 3.23 (m, 3 H) 3.31 - 3.46 (m, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.56 - 3.67 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.11 (s, 1 H) 4.20 (s, 1 H) 4.38 (s, 1 H) 4.48 (s, 1 H) 4.53 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.55 (s, 1 H) 8.42 (d, J=2.29 Hz, 1 H) 8.50 - 8.65 (m, 2 H)、及び (600 MHz) : 0.77 - 0.85 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.42 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.48 - 1.58 (m, 2 H) 1.60 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.75 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.08 - 2.60 (m, 8 H) 2.23 - 2.26 (m, 6 H) 2.35 - 2.37 (m, 3 H) 2.60 - 2.71 (m, 2 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.85 - 2.94 (m, 1 H) 3.15 - 3.26 (m, 1 H) 3.22 - 3.23 (m, 3 H) 3.31 - 3.46 (m, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.56 - 3.67 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.03 - 4.09 (m, 1 H) 4.20 (s, 1 H) 4.38 (s, 1 H) 4.48 (s, 1 H) 4.53 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.44 (s, 1 H) 8.42 (d, J=2.29 Hz, 1 H) 8.50 - 8.65 (m, 2 H)
163	Et		H	969.6	(500 MHz) : 0.78 - 0.85 (m, 6 H) 0.85 - 0.93 (m, 6 H) 1.06 - 1.35 (m, 2 H) 1.11 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.13 - 1.20 (m, 12 H) 1.29 (s, 3 H) 1.32 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.48 - 1.65 (m, 3 H) 1.73 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.09 - 2.46 (m, 5 H) 2.22 - 2.23 (m, 6 H) 2.35 - 2.36 (m, 3 H) 2.47 - 2.70 (m, 5 H) 2.76 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=13.44 Hz, 1 H) 3.14 - 3.35 (m, 3 H) 3.22 - 3.23 (m, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.36 - 3.43 (m, 1 H) 3.59 - 3.68 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 4.00 (s, 3 H) 4.16 (s, 1 H) 4.33 - 4.43 (m, 2 H) 4.47 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.53 (d, J=9.60 Hz, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 6.00 (t, J=4.80 Hz, 1 H) 7.96 (d, J=2.47 Hz, 1 H) 8.14 (d, J=2.74 Hz, 1 H)
164	Et		H	969.8	(500 MHz) : 0.76 - 0.84 (m, 6 H) 0.85 - 0.93 (m, 6 H) 1.05 - 1.20 (m, 2 H) 1.10 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.11 - 1.19 (m, 12 H) 1.29 (s, 3 H) 1.33 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.45 (d, J=11.52 Hz, 1 H) 1.48 - 1.56 (m, 1 H) 1.59 (dd, J=15.08, 4.94 Hz, 1 H) 1.68 - 1.78 (m, 1 H) 1.78 - 1.87 (m, 1 H) 2.18 - 2.31 (m, 3 H) 2.22 - 2.23 (m, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.35 - 2.76 (m, 7 H) 2.76 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 (d, J=13.99 Hz, 1 H) 3.12 - 3.33 (m, 3 H) 3.21 - 3.22 (m, 3 H) 3.30 - 3.31 (m, 3 H) 3.33 - 3.44 (m, 1 H) 3.48 - 3.57 (m, 1 H) 3.69 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.99 (s, 3 H) 4.18 (s, 1 H) 4.31 - 4.40 (m, 2 H) 4.42 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.52 (d, J=9.87 Hz, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.95 (d, J=4.94 Hz, 1 H) 5.81 (t, J=4.94 Hz, 1 H) 7.96 (d, J=2.74 Hz, 1 H) 8.08 (d, J=2.74 Hz, 1 H)

10

20

30

【表 3 - 9】

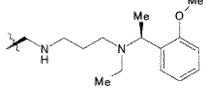
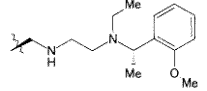
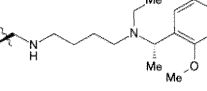
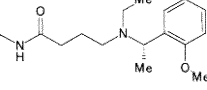
165	Et		H	938.7	ジアステレオマーの混合物、(600 MHz) : 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.00 (t, J=6.19 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.35 - 1.38 (m, 3 H) 1.50 - 1.68 (m, 3 H) 1.71 - 1.78 (m, 1 H) 1.81 - 1.87 (m, 1 H) 2.11 - 2.19 (m, 1 H) 2.21 - 2.51 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.40 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.52 - 2.65 (m, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=12.84 Hz, 1 H) 3.18 - 3.25 (m, 2 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.35 - 3.48 (m, 2 H) 3.54 - 3.60 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.87 - 3.94 (m, 1 H) 4.21 - 4.25 (m, 1 H) 4.36 - 4.42 (m, 1 H) 4.42 - 4.47 (m, 1 H) 4.52 - 4.56 (m, 1 H) 4.60 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 5.12 - 5.17 (m, 1 H) 7.23 (dd, J=7.57, 4.81 Hz, 1 H) 7.63 (dd, J=7.79, 1.83 Hz, 1 H) 8.48 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 8.53 (s, 1 H)、及び (600 MHz) : 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.98 (t, J=6.19 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.35 - 1.38 (m, 3 H) 1.50 - 1.68 (m, 3 H) 1.71 - 1.78 (m, 1 H) 1.81 - 1.87 (m, 1 H) 2.11 - 2.19 (m, 1 H) 2.21 - 2.51 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.40 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.52 - 2.65 (m, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=12.84 Hz, 1 H) 3.18 - 3.25 (m, 2 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.35 - 3.48 (m, 2 H) 3.54 - 3.60 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.87 - 3.94 (m, 1 H) 4.21 - 4.25 (m, 1 H) 4.36 - 4.42 (m, 1 H) 4.42 - 4.47 (m, 1 H) 4.52 - 4.56 (m, 1 H) 4.60 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 5.12 - 5.17 (m, 1 H) 7.23 (dd, J=7.57, 4.81 Hz, 1 H) 7.63 (dd, J=7.79, 1.83 Hz, 1 H) 8.48 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 8.53 (s, 1 H)
166	Et		H	968.8	ジアステレオマーの混合物、(600 MHz) : 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 0.89 - 0.96 (m, 3 H) 1.05 - 1.26 (m, 17 H) 1.29 - 1.32 (m, 3 H) 1.33 - 1.36 (m, 3 H) 1.50 - 1.87 (m, 5 H) 2.14 - 2.18 (m, 1 H) 2.23 - 2.68 (m, 9 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.87 - 2.93 (m, 1 H) 3.18 - 3.49 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.51 - 3.58 (m, 1 H) 3.69 - 3.73 (m, 1 H) 3.90 (s, 3 H) 4.20 - 4.25 (m, 1 H) 4.30 - 4.34 (m, 1 H) 4.36 - 4.40 (m, 1 H) 4.41 - 4.45 (m, 1 H) 4.52 - 4.56 (m, 1 H) 4.60 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.46 - 5.51 (m, 1 H) 6.78 (d, J=5.50 Hz, 1 H) 8.38 - 8.41 (m, 2 H)、及び (600 MHz) : (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 0.89 - 0.96 (m, 3 H) 1.05 - 1.26 (m, 17 H) 1.29 - 1.32 (m, 3 H) 1.33 - 1.36 (m, 3 H) 1.50 - 1.87 (m, 5 H) 2.14 - 2.18 (m, 1 H) 2.23 - 2.68 (m, 9 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.87 - 2.93 (m, 1 H) 3.18 - 3.49 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.51 - 3.58 (m, 1 H) 3.69 - 3.73 (m, 1 H) 3.90 (s, 3 H) 4.20 - 4.25 (m, 1 H) 4.30 - 4.34 (m, 1 H) 4.36 - 4.40 (m, 1 H) 4.41 - 4.45 (m, 1 H) 4.52 - 4.56 (m, 1 H) 4.60 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.46 - 5.51 (m, 1 H) 6.78 (d, J=5.50 Hz, 1 H) 8.38 - 8.41 (m, 2 H)

10

20

30

【表 3 - 1 0】

167	Et	OH	Me	733.6	(600 MHz) : 0.75 - 0.81 (m, 6 H) 0.86 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.03 (s, 3 H) 1.07 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 - 1.23 (m, 8 H) 1.11 (s, 3 H) 1.17 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.28 (s, 3 H) 1.44 - 1.68 (m, 3 H) 1.71 (dd, J=15.36, 5.27 Hz, 1 H) 1.77 - 1.85 (m, 1 H) 2.05 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 2.09 - 2.16 (m, 1 H) 2.15 - 2.25 (m, 2 H) 2.26 (s, 6 H) 2.32 (s, 3 H) 2.36 - 2.43 (m, 1 H) 2.43 - 2.52 (m, 1 H) 2.73 - 2.80 (m, 1 H) 2.81 - 2.88 (m, 1 H) 3.14 - 3.20 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.25 (s, 3 H) 3.35 - 3.42 (m, 1 H) 3.42 - 3.49 (m, 1 H) 3.64 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.12 - 4.18 (m, 1 H) 4.37 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.47 (q, J=6.42 Hz, 1 H) 4.58 - 4.64 (m, 1 H) 4.93 (d, J=5.04 Hz, 1 H)
168	Et		OH		(600 MHz) : 0.78 - 0.83 (m, 6 H) 0.87 - 0.94 (m, 3 H) 0.96 - 1.34 (m, 28 H) 1.36 - 1.70 (m, 7 H) 1.80 - 1.91 (m, 2 H) 2.02 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.12 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.29 (m, 2 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.40 - 2.68 (m, 5 H) 2.73 - 2.81 (m, 1 H) 2.83 - 2.91 (m, 1 H) 2.94 - 3.02 (m, 1 H) 3.18 - 3.21 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.32 - 3.38 (m, 1 H) 3.47 - 3.56 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.81 (s, 3 H) 4.16 - 4.34 (m, 2 H) 4.37 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.39 - 4.47 (m, 1 H) 4.56 - 4.67 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 6.86 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 6.94 (t, J=5.96 Hz, 1 H) 7.19 (t, 1 H) 7.44 - 7.49 (m, 1 H)
169	Et		OH	953.7	(600 MHz) : 0.79 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.87 (t, 3 H) 0.92 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 0.95 - 0.99 (m, 3 H) 1.03 - 1.24 (m, 14 H) 1.25 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 1.35 - 1.83 (m, 8 H) 1.86 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 2.02 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.10 - 2.27 (m, 3 H) 2.25 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.36 - 2.65 (m, 6 H) 2.71 - 2.80 (m, 1 H) 2.88 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.13 - 3.20 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.25 (s, 3 H) 3.33 - 3.48 (m, 2 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.78 (s, 3 H) 4.13 - 4.44 (m, 4 H) 4.54 - 4.65 (m, 1 H) 4.95 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 6.82 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.90 (t, J=7.57 Hz, 1 H) 7.17 (t, J=7.79 Hz, 1 H) 7.29 (d, J=7.79 Hz, 1 H)
170	Et		OH	981.9 FAB MASS	(600 MHz) : 0.81 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 0.84 - 0.93 (m, 6 H) 0.97 (t, J=6.65 Hz, 3 H) 1.04 - 1.33 (m, 12 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.34 - 1.83 (m, 8 H) 1.86 (dd, J=14.90, 5.27 Hz, 1 H) 2.03 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.10 - 2.21 (m, 1 H) 2.23 - 2.29 (m, 2 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.56 (m, 5 H) 2.59 - 2.67 (m, 1 H) 2.73 - 2.81 (m, 1 H) 2.89 (d, J=11.46 Hz, 1 H) 3.17 - 3.23 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.36 - 3.44 (m, 1 H) 3.51 - 3.57 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.80 (s, 3 H) 4.13 - 4.40 (m, 2 H) 4.25 - 4.31 (m, 1 H) 4.36 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.58 - 4.69 (m, 1 H) 4.96 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 6.84 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 6.92 (t, J=7.57 Hz, 1 H) 7.18 (t, J=7.11 Hz, 1 H) 7.39 (d, J=5.96 Hz, 1 H)
171	Et		OH	995.9 FAB MASS	(600 MHz) : 0.77 - 0.90 (m, 9 H) 0.93 - 1.36 (m, 23 H) 1.31 (s, 3 H) 1.36 - 1.88 (m, 7 H) 2.05 - 2.17 (m, 2 H) 2.25 (s, 6 H) 2.23 - 2.54 (m, 8 H) 2.37 (s, 3 H) 2.58 - 2.66 (m, 1 H) 2.69 - 2.75 (m, 1 H) 2.79 - 2.91 (m, 2 H) 3.13 - 3.21 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.30 (s, 1 H) 3.30 (s, 3 H) 3.37 - 3.45 (m, 1 H) 3.55 (dd, J=14.44, 6.19 Hz, 1 H) 3.67 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 3.76 - 3.82 (m, 1 H) 3.80 (s, 3 H) 4.29 - 4.37 (m, 3 H) 4.55 - 4.65 (m, 2 H) 4.98 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.51 (br s, 1 H) 6.84 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.92 (t, J=7.57 Hz, 1 H) 7.18 (t, J=7.34 Hz, 1 H) 7.33 - 7.41 (m, 1 H)

【 0 6 1 4】

実施例 1 2 6

(1) 実施例 7 (3) で得られた化合物 5.78g をエタノール 75ml に溶解し、氷冷した 1 規定塩酸 30ml を加えて 30 分間攪拌した。反応液を 10% 水酸化ナトリウム水溶液で中和後、酢酸エチルを加えて分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:アセトン=20:1 から 10:1) にて精製して 4'' -ヒドロキシ体 3.97g を得た。

【 0 6 1 5】

(2) 上記 (1) で得られた化合物 3.00g をテトラヒドロフラン 20ml、ジメチルホルムアミド 10ml に溶解し、N,N' -カルボニルジイミダゾール 1.54g を加えて、氷冷下、水素化ナトリウム 228mg を加えて 1 時間攪拌した。蒸留水、酢酸エチル、飽和塩化アンモニウム水溶液を順次加えて分液して、有機層を蒸留水で 3 回洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=50:10:0.2) にて精製して 4'' -O-イミダゾリルカルボニル体 3.11g を得た。

【 0 6 1 6】

(3) 上記 (2) で得られた化合物 530mg をテトラヒドロフラン 3ml に溶解し、参考例 5 4 で得られた化合物 170mg を加えた後に、反応液を約 1ml まで減圧濃縮した。2 日間放置後、

10

20

30

40

50

反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=30:1:0.1）にて精製してカーバメート体621mgを得た。

【0617】

（4）上記（3）で得られた化合物621mgを原料として実施例7（4）と同様の方法にて表3で示される化合物393mgを得た。

【0618】

実施例127

実施例126（1）で得られた化合物0.28gを原料として実施例113（2）、実施例7（4）と同様の方法にて表3で示される化合物0.18gを得た。

【0619】

実施例128

実施例127で得られた化合物0.17gをメタノール5mlに溶解し、ヒドロキシルアミン塩酸塩49mgを加えて室温にて14時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をクロロホルムと0.1規定水酸化ナトリウム水溶液を加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して表3で示される化合物0.177gを得た。

【0620】

実施例129

実施例128で得られた化合物0.15gをエタノール15mlに溶解し、ラネーニッケル0.7gを加えて3.5kgf/cm²の水素雰囲気下、室温にて31時間攪拌した。セライト濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=9:1:0.1）、分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=9:1:0.1）にて精製して表3で示される化合物2mgを得た。

【0621】

実施例130

（1）特許文献（W004/101585）に記載の方法にて得られた6-[2-(2-カルボキシエトキシ)エトキシ]-7-クロロ-1-シクロプロピル-4-オキソ-1,4-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸84mgをジクロロメタン2mlに溶解し、氷冷下、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩61mgを加えて30分間攪拌した。さらに実施例126（1）で得られた化合物100mg、4-ジメチルアミノピリジン130mgを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと飽和重曹水を加えて分液し、有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=20:1:0.1）にて精製してカップリング体38.9mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物38.9mgを原料として実施例7（4）と同様の方法にて表3で示される化合物7.1mgを得た。

【0622】

実施例131

（1）特許文献（W004/101585）に記載の方法にて得られた6-{[2-(2-カルボキシエトキシ)エチル]アミノ}-7-クロロ-1-シクロプロピル-4-オキソ-1,4-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸84mgをジクロロメタン1mlに溶解し、氷冷下、トリエチルアミン19mg、ピバロイルクロリド23mgを加えて30分間攪拌した。さらに実施例126（1）で得られた化合物100mg、4-ジメチルアミノピリジン9.5mgを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液をカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=20:1:0.1）にて精製してカップリング体97mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物97mgを原料として実施例7（4）と同様の方法にて表3で示される化合物10.9mgを得た。

【0623】

実施例132

（1）実施例126（2）で得られた化合物650mg、エチレンジアミン78.1μlを原料とし

10

20

30

40

50

て実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にてアミン体 420mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 100mg、2-メトキシベンズアルデヒド 17mg を原料として実施例 7 (2) と同様の方法にて N-ベンジル体 70mg を得た。

(3) 上記 (2) で得られた化合物 10mg とアセトアルデヒド 3.0 μ l を原料として実施例 7 (2) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 5.8mg を得た。

【0624】

実施例 1 3 3

(1) 実施例 1 2 6 (1) で得られた化合物 100mg をトルエン 10ml に溶解し、トリエチルアミン 200 μ l、3-クロロプロペニルクロリド 50 μ l を加えて室温にて 20 分間攪拌した。反応液に酢酸エチルと飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン=50:1:0.1）にて精製してカップリング体 125mg を得た。得られたカップリング体 125mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて 4'-O-ビニルエステル体 78.7mg を得た。

10

【0625】

(2) 上記 (1) で得られた化合物 32mg をアセトニトリル 1ml に溶解し、特許文献（特開昭 54-154724 号公報）に記載の方法にて得られた (1S)-1-(2-メトキシフェニル)エタンアミン 63mg、ジイソプロピルエチルアミン 50 μ l を加えて封管中 100℃ にて 3 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=20:1:0.1）にて精製して表 3 で示される化合物 37mg を得た。

20

【0626】

実施例 1 3 4

実施例 1 3 3 で得られた化合物 37mg をクロロホルム 5ml に溶解して、アセトアルデヒド 11 μ l、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム 13mg を加えて室温にて 1 時間攪拌した。反応液にクロロホルムと飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して表 3 で示される化合物 2.8mg を得た。

【0627】

30

実施例 1 3 5

実施例 1 2 6 (1) で得られた化合物 50mg をトルエン 1ml に溶解し、参考例 5 5 で得られた化合物 30mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 30mg、4-ジメチルアミノピリジン 65mg を加えて 80℃ にて 5 時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン=50:1:0.1）にて精製してカップリング体 11.3mg を得た。得られたカップリング体 11.3mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 2.5mg を得た。

【0628】

40

実施例 1 3 6

実施例 1 2 6 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 5 6 で得られた化合物 31mg を原料として実施例 1 3 5 と同様の方法にて表 3 で示される化合物 17.8mg を得た。

【0629】

実施例 1 3 7

実施例 1 3 2 (1) で得られた化合物 20mg、2-メトキシベンズアルデヒド 3.4mg を原料として実施例 7 (2) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 10mg を得た。

【0630】

実施例 1 3 8

実施例 1 3 2 (1) で得られた化合物 20mg、2-メトキシベンズアルデヒド 3.4mg を原料と

50

して実施例 7 (2)、引き続き37%ホルムアルデヒド水溶液10.1mgを原料として実施例 7 (2)と同様の方法にて表 3 で示される化合物5.3mgを得た。

【0631】

実施例 139

実施例 132 (1) で得られた化合物20mg、2-メトキシベンズアルデヒド3.4mgを原料として実施例 7 (2)と同様の方法にて表 3 で示される化合物19.1mgを得た。

【0632】

実施例 140

実施例 126 (2) で得られた化合物20mg、参考例 57 で得られた化合物9.1mgを原料として実施例 126 (3)、実施例 7 (4)と同様の方法にて表 3 で示される化合物10.1mgを得た。

10

【0633】

実施例 141

実施例 126 (2) で得られた化合物20mg、参考例 58 で得られた化合物9.6mgを原料として実施例 126 (3)、実施例 7 (4)と同様の方法にて表 3 で示される化合物13.9mgを得た。

【0634】

実施例 142

実施例 126 (1) で得られた化合物100mg、参考例 59 で得られた化合物84mgを原料として実施例 135と同様の方法にて表 3 で示される化合物2.6mgを得た。

20

【0635】

実施例 143

(1) 実施例 126 (2) で得られた化合物500mgをテトラヒドロフラン2mlに溶解し、エチレンジアミン64μlを加えて室温にて2日間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=10:1:0.1）にて精製してアミン体350mgを得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物50mgをクロロホルム1mlに溶解し、トリエチルアミン24mg、2-メトキシベンゾイルクロリド12mgを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液をカラムクロマトグラフィー（NH型）にて精製してカップリング体56.4mgを得た。得られたカップリング体56.4mgを原料として実施例 7 (4)と同様の方法にて表 3 で示される化合物32.9mgを得た。

30

【0636】

実施例 144

実施例 143 (1) で得られた化合物50mg、2-メトキシベンゼンスルホニルクロリド15mgを原料として実施例 143 (2)と同様の方法にて表 3 で示される化合物40.2mgを得た。

【0637】

実施例 145

実施例 143 (1) で得られた化合物50mg、2-メトキシフェニルイソシアネート11mgを原料として実施例 143 (2)と同様の方法にて表 3 で示される化合物36.0mgを得た。

【0638】

実施例 146

実施例 126 (2) で得られた化合物50mg、参考例 60 で得られた化合物17.3mgを原料として実施例 126 (3)、実施例 7 (4)と同様の方法にて表 3 で示される化合物21.1mgを得た。

40

【0639】

実施例 147

実施例 126 (2) で得られた化合物667mg、参考例 61 で得られた化合物173mgを原料として実施例 126 (3)、実施例 7 (4)と同様の方法にて表 3 で示される化合物463mgを得た。

【0640】

50

実施例 1 4 8

(1) 実施例 1 4 7 で得られた化合物 450mg をメタノール 10ml に溶解し、20% 水酸化パラジウム-炭素 300mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 2 日間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して脱ベンジル体 429mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 30mg をクロロホルムに溶解し、2-ピリジンカルボキシアルデヒド 19mg、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム 30mg を加えて室温にて 18 時間攪拌した。反応液にクロロホルムと飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1) にて精製して表 3 で示される化合物 20.4mg を得た。

10

【0 6 4 1】

実施例 1 4 9

実施例 1 4 8 (1) で得られた化合物 30mg、3-ピリジンカルボキシアルデヒドを原料として実施例 1 4 8 (2) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 12.9mg を得た。

【0 6 4 2】

実施例 1 5 0

実施例 1 4 8 (1) で得られた化合物 30mg、4-ピリジンカルボキシアルデヒドを原料として実施例 1 4 8 (2) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 19.8mg を得た。

【0 6 4 3】

実施例 1 5 1

実施例 1 4 8 (1) で得られた化合物 30mg、2-ナフトアルデヒドを原料として実施例 1 4 8 (2) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 4.5mg を得た。

20

【0 6 4 4】

実施例 1 5 2

実施例 1 4 8 (1) で得られた化合物 30mg、1-ナフトアルデヒドを原料として実施例 1 4 8 (2) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 4.0mg を得た。

【0 6 4 5】

実施例 1 5 3

実施例 1 4 8 (1) で得られた化合物 30mg、3-キノリンカルボキシアルデヒドを原料として実施例 1 4 8 (2) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 10.7mg を得た。

30

【0 6 4 6】

実施例 1 5 4

実施例 1 4 8 (1) で得られた化合物 30mg、4-キノリンカルボキシアルデヒドを原料として実施例 1 4 8 (2) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 22.5mg を得た。

【0 6 4 7】

実施例 1 5 5

実施例 1 4 8 (1) で得られた化合物 30mg、2-チオフェンカルボキシアルデヒドを原料として実施例 1 4 8 (2) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 2.8mg を得た。

【0 6 4 8】

実施例 1 5 6

実施例 1 4 8 (1) で得られた化合物 30mg、フルフラールを原料として実施例 1 4 8 (2) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 10.1mg を得た。

40

【0 6 4 9】

実施例 1 5 7

(1) 実施例 8 (1) で得られた化合物 1.39g を原料として実施例 7 (2)、(3) と同様の方法にて環化体 708mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 700mg を原料として実施例 1 2 6 (1)、(2) と同様の方法にて 4'-O-イミダゾリルカルボニル体 329mg を得た。

(3) 上記 (2) で得られた化合物 50mg、参考例 5 4 で得られた化合物を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 21.0mg を得た。

50

【0650】

実施例158

実施例157(2)で得られた化合物50mg、参考例62で得られた化合物を原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表3で示される化合物24.0mgを得た。

【0651】

実施例159

実施例126(2)で得られた化合物50mg、参考例62で得られた化合物15mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表3で示される化合物39.2mgを得た。

10

【0652】

実施例160

(1) 実施例1で得られた化合物1.14g、(R)-(+)-プロピレンオキシド0.2gを原料として実施例7(1)、(2)、(3)と同様の方法にて環化体189mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物60mgを原料として実施例126(1)(2)と同様の方法にて4'-0-イミダゾリルカルボニル体40.5mgを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物20mg、参考例62で得られた化合物6.1mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表3で示される化合物11.1mgを得た。

20

【0653】

実施例161

実施例160(2)で得られた化合物20mg、参考例54で得られた化合物6.5mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表3で示される化合物10.5mgを得た。

【0654】

実施例162

実施例126(2)で得られた化合物40mg、参考例63で得られた化合物19.1mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表3で示される化合物29mgを得た。

【0655】

実施例163

実施例126(2)で得られた化合物90.6mg、参考例64で得られた化合物50mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表3で示される化合物21mgを得た。

30

【0656】

実施例164

実施例126(2)で得られた化合物90.6mg、参考例64で得られた化合物50mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表3で示される化合物35mgを得た。

【0657】

実施例165

実施例126(2)で得られた化合物100mg、参考例65で得られた化合物37mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表3で示される化合物32.1mgをジアステレオマーの混合物として得た。

40

【0658】

実施例166

実施例126(2)で得られた化合物100mg、参考例66で得られた化合物43mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表3で示される化合物46.8mgをジアステレオマーの混合物として得た。

【0659】

50

実施例 1 6 7

(1) 実施例 1 2 6 (1) で得られた化合物 1.79g をクロロホルム (純度 99.5% 以上) 19ml に溶解し、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 1.09g、ジメチルスルホキシド 1.34ml、ピリジニウムトリフルオロアセテート 1.09g を順次加えて室温にて 2 時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=50:1:0.1 から 30:1:0.1) にて精製して 4'-ケトン体 1.52g を得た。

【0 6 6 0】

(2) 上記 (1) で得られた化合物 15mg をジクロロメタン 3ml に溶解し、ドライアイス-アセトン浴下にて 0.84M ヨウ化メチルマグネシウムエーテル溶液 140 μ l を加えてそのまま 2 時間攪拌した。 -20℃ にてさらに 20 分間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液とクロロホルムを加えて分液した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1) にて精製して 4'-メチル付加体 7mg を得た。

【0 6 6 1】

(3) 上記 (2) で得られた化合物 7mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 5mg を得た。

【0 6 6 2】

実施例 1 6 8

(1) トリメチルスルホソニウムアイオダイド 304mg をテトラヒドロフラン 16ml に溶解し、氷浴下、水素化ナトリウム 33mg を加えてそのまま 2 時間攪拌した。その後、実施例 1 6 7 (1) で得られた化合物 0.87g のジメチルスルホキシド溶液 16ml を加えて室温にて 2 時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液とジエチルエーテルを加えて抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=50:1:0.1) にて精製してエポキシ体 0.76g を得た。

【0 6 6 3】

(2) 上記 (1) で得られた化合物 21mg をエタノール 1ml に溶解し、参考例 5 7 で得られた化合物 52mg、ヨウ化カリウム 37mg を加えて 90℃ にて 20 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に飽和食塩水とクロロホルムを加えて分液した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=50:1:0.1 から 30:1:0.1) にて精製してアミン体 35mg を得た。

【0 6 6 4】

(3) 上記 (2) で得られた化合物 35mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 20mg を得た。

【0 6 6 5】

実施例 1 6 9

(1) 実施例 1 6 8 (1) で得られた化合物 73mg、参考例 5 4 で得られた化合物を原料として実施例 1 6 8 (2) と同様の方法にてアミン体 40mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 40mg、塩化アンモニウム 29mg をメタノール-蒸留水 (2:1) の混合溶媒 3ml に溶解し、90℃ にて 60 時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1) にて精製して表 3 で示される化合物 10mg を得た。

【0 6 6 6】

実施例 1 7 0

実施例 1 6 8 (1) で得られた化合物 55mg、参考例 5 8 で得られた化合物を原料として実施例 1 6 8 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 3 で示される化合物 24mg を得た。

【 0 6 6 7 】

实施例 171

(1) 実施例 168 (1) で得られた化合物 0.43g をメタノール-蒸留水 (2:1) の混合溶媒 4.5ml に溶解し、アジ化ナトリウム 0.29g、塩化アンモニウム 0.19g を加えて 90℃ にて 64 時間攪拌した。反応液に蒸留水とクロロホルムを加えて分液した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=50:1:0.1 から 20:1:0.1) にて精製してアジド体 0.27g を得た。

【 0 6 6 8 】

(2) 上記(1)で得られた化合物127mgをテトラヒドロフラン5mlに溶解し、1Mトリメチルホスフィン-テトラヒドロフラン溶液1mlを加えて室温にて5時間攪拌した。その後、蒸留水10mlを加えてさらに室温にて60時間攪拌し、反応液をクロロホルムにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)にて精製してアミン体83mgを得た。

【 0 6 6 9 】

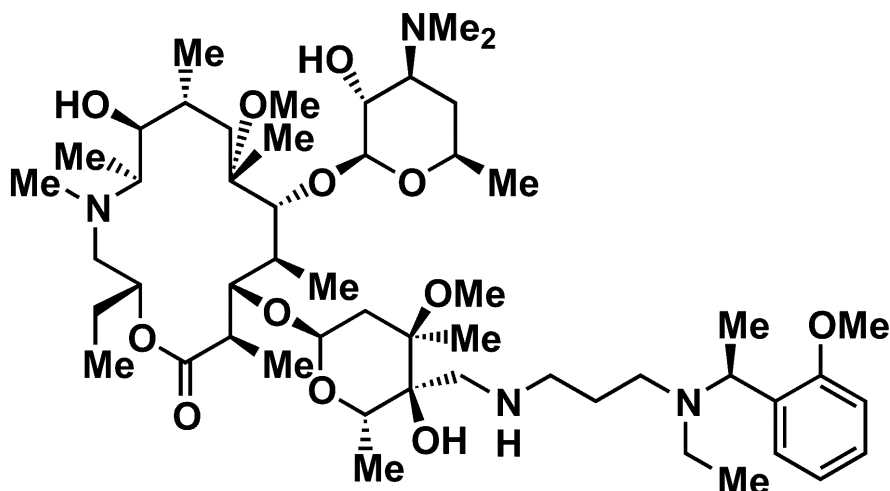
(3) 上記(2)で得られた化合物24mgをトルエン5mlに溶解し、参考例59で得られた化合物26mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩19mg、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物5mgを加えて室温にて16時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、得られた残渣に蒸留水とクロロホルムを加えて分液した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をメタノール100mlに溶解し、室温にて16時間、さらに80℃にて2時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1から10:1:0.1)にて精製して表3で示される化合物15mgを得た。

【 0 6 7 0 】

実施例 172 式 (F) で示される化合物の合成

【 0 6 7 1 】

【化 2 1】



式(F)

【 0 6 7 2 】

(1) トリメチルスルホニウムテトラフルオロボレート73mgをテトラヒドロフラン4mlに溶解し、窒素雰囲気下、食塩-氷浴下にて0.5Mピストリメチルシリルアミドカリウム-トルエン溶液0.8mlをゆっくり加えてそのまま氷浴下にて2時間攪拌した。その後、ドライアイス-アセトン浴下にて実施例167(1)で得られた化合物100mgのエチレングリコールジメチルエーテル溶液1mlを加えてそのまま2時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液とクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト

グラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン=50:5:0.1）にて精製してエポキシ体95mgを得た。

【0673】

（2）上記（1）で得られた化合物40mgを原料として実施例168（2）、実施例7（4）と同様の方法にて標記化合物9mgを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (600MHz, CDCl_3) δ (ppm): 0.77-0.83(m, 6H) 0.89(t, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 0.98(t, $J=6.65\text{Hz}$, 3H) 1.04-1.38(m, 11H) 1.09(d, $J=10.09\text{Hz}$, 3H) 1.15(d, $J=7.34\text{Hz}$, 3H) 1.27(d, $J=6.88\text{Hz}$, 4H) 1.32(s, 3H) 1.40-1.66(m, 5H) 1.68-1.88(m, 2H) 2.01(dd, $J=15.36, 5.27\text{Hz}$, 1H) 2.11-2.32(m, 3H) 2.19(d, $J=15.13\text{Hz}$, 1H) 2.26(s, 6H) 2.36(s, 3H) 2.40-2.66(m, 5H) 2.75(d, $J=12.84\text{Hz}$, 1H) 2.81(m, 1H) 2.91(d, $J=12.84\text{Hz}$, 1H) 3.16-3.20(m, 1H) 3.21(s, 3H) 3.34(s, 3H) 3.38-3.46(m, 1H) 3.49-3.56(m, 1H) 3.67(d, $J=7.79\text{Hz}$, 1H) 3.77-3.86(m, 2H) 3.80(s, 3H) 4.26-4.33(m, 1H) 4.39-4.49(m, 3H) 4.60-4.67(m, 1H) 4.85(d, $J=5.04\text{Hz}$, 1H) 6.84(d, $J=7.79\text{Hz}$, 1H) 6.92(m, 1H) 7.17(t, $J=7.57\text{Hz}$, 1H) 7.38(d, $J=5.50\text{Hz}$, 1H)

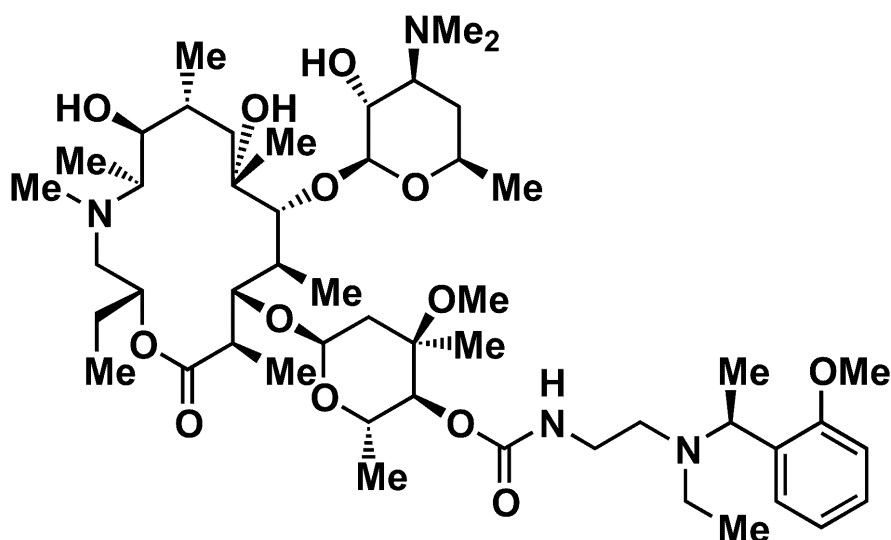
10

【0674】

実施例173 式（G）で示される化合物の合成

【0675】

【化22】



式(G)

20

30

【0676】

（1）実施例2で得られた化合物5.0gを原料として実施例7（1）、（2）、（3）と同様の方法にて環化体400mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物150mgを原料として実施例126（1）、（2）、（3）、実施例7（4）と同様の方法にて標記化合物36.7mgを得た。

MS(ESI) $m/z=953.7$ [$M+H$] $^+$

$^1\text{H-NMR}$ (600MHz, CDCl_3) δ (ppm): 0.79:1:0.1(m, 12H) 1.16(d, 20H) 1.28(d, $J=6.88\text{Hz}$, 3H) 1.48-1.65(m, 6H) 2.00-2.10(m, 1H) 2.14-2.65(m, 9H) 2.23-2.29(m, 9H) 2.69-2.80(m, 1H) 3.15-3.34(m, 4H) 3.27-3.31(m, 3H) 3.58-3.73(m, 2H) 3.83(s, 3H) 3.84-3.90(m, 1H) 4.28-4.44(m, 3H) 4.48-4.56(m, 2H) 4.80-4.85(m, 1H) 5.52(s, 1H) 6.86(d, $J=8.25\text{Hz}$, 1H) 6.91(t, $J=7.57\text{Hz}$, 1H) 7.17-7.23(m, 1H) 7.24-7.30(m, 1H)

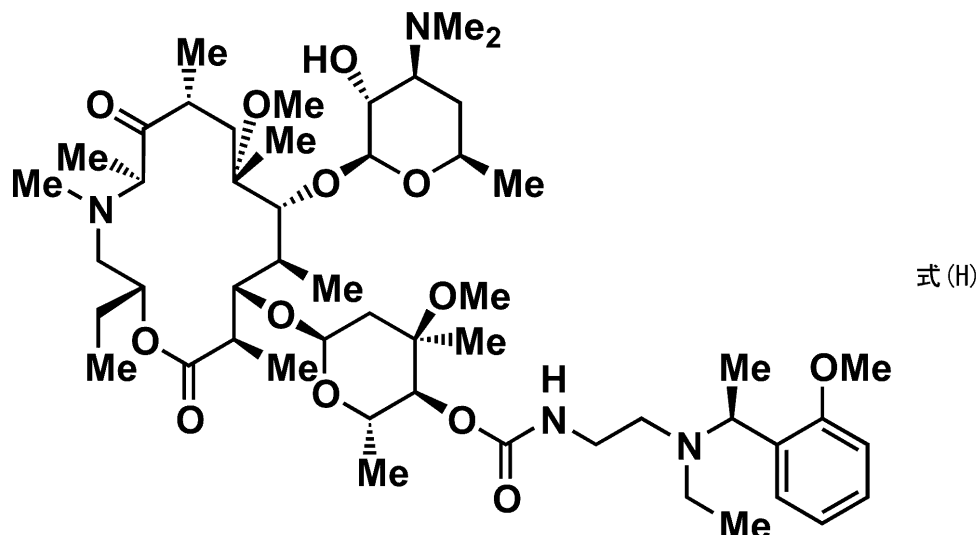
40

【0677】

実施例174 式（H）で示される化合物の合成

【0678】

【化 2 3】



10

【0 6 7 9】

実施例 1 2 6 で得られた化合物をアセトンに溶解し、無水酢酸13.7mgを加えて室温にて48時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に飽和重曹水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を原料として実施例 1 1 3 (2) と同様の方法にて得られた化合物をメタノールに溶解し、加熱還流下3時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1) にて精製して標記化合物36.4mgを得た。

20

MS(ESI) $m/z=965.5[M+H]^+$

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ (ppm): 0.90(t, $J=7.38\text{Hz}$, 3H) 0.93(t, $J=6.99\text{Hz}$, 3H) 1.04(d, $J=6.68\text{Hz}$, 3H) 1.07(d, $J=6.84\text{Hz}$, 3H) 1.08-1.32(m, 22H) 1.34-1.68(m, 5H) 2.02-2.18(m, 2H) 2.12(s, 3H) 2.25(s, 6H) 2.35-2.83(m, 9H) 3.16-3.35(m, 4H) 3.25(s, 3H) 3.31(s, 3H) 3.57-3.66(m, 2H) 3.69(d, $J=6.68\text{Hz}$, 1H) 3.85(s, 3H) 3.94-3.99(m, 1H) 4.33-4.42(m, 2H) 4.46(d, $J=7.15\text{Hz}$, 1H) 4.53(d, $J=9.79\text{Hz}$, 1H) 4.93(d, $J=4.35\text{Hz}$, 1H) 4.94-5.03(m, 1H) 5.55(s, 1H) 6.85-6.90(m, 1H) 6.91-6.95(m, 1H) 7.18-7.25(m, 1H) 7.27-7.31(m, 1H)

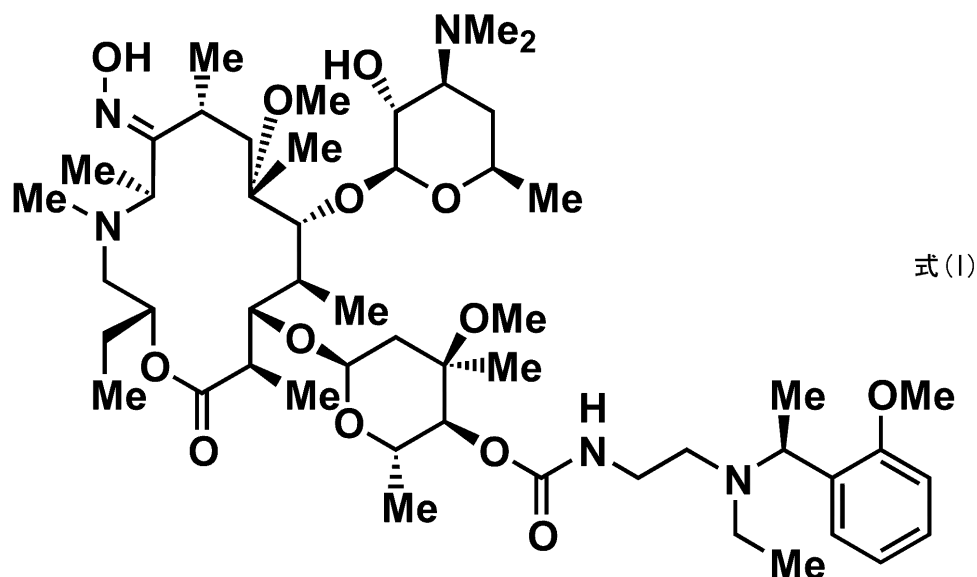
30

【0 6 8 0】

実施例 1 7 5 式 (I) で示される化合物の合成

【0 6 8 1】

【化 2 4】



10

【0682】

実施例 174 で得られた化合物28mgをメタノール1mlに溶解し、ヒドロキシルアミン塩酸塩10mg、イミダゾール11.8mgを加えて加熱還流下5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に飽和塩化アンモニウム水溶液とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール=10:1からクロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=20:1:0.1）にて精製して標記化合物24.6mgを得た。

20

MS(ESI)m/z=980.7[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.85-0.96(m, 6H) 1.02-1.29(m, 22H) 1.26-1.33(m, 6H) 1.46-1.77(m, 5H) 1.91-2.09(m, 2H) 2.07(s, 3H) 2.23(s, 6H) 2.33-2.75(m, 9H) 3.19-3.35(m, J=5.13Hz, 3H) 3.29(s, 3H) 3.30(s, 3H) 3.45-3.88(m, 4H) 3.82(s, 3H) 3.93(d, J=3.57Hz, 1H) 4.29-4.42(m, 2H) 4.52(d, J=9.95Hz, 1H) 4.57(d, J=6.99Hz, 1H) 4.83-4.88(m, 1H) 4.90(d, J=4.20Hz, 1H) 5.44(t, J=4.82Hz, 1H) 6.86(d, J=8.39Hz, 1H) 6.91(t, J=7.46Hz, 1H) 7.18-7.31(m, 2H)

30

【0683】

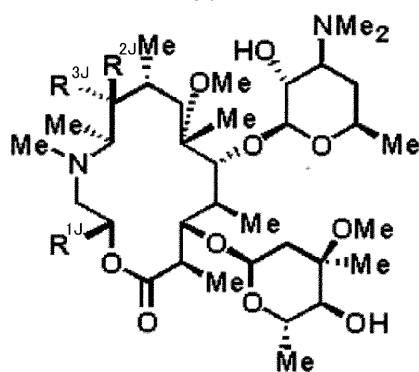
実施例 176 ~ 205 の合成

表 4 で規定した R^{1J}、R^{2J}、及び R^{3J}をもつ、式 (J) で示される化合物の製造法を以下に示す。

【0684】

【表 4 - 1】

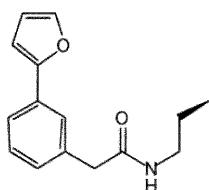
表 4



式 (J)

実施例 177 及び実施例 180 を除く、式 (J) で示される化合物の R^{1J} はエチル基である。

実施例 177 の R^{1J} は水素原子及び実施例 180 の R^{1J} は式

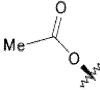


で示される基である。

実施例	R^{2J}	R^{3J}	ESI MS (M+H)	$^1\text{H-NMR}$, CDCl_3 , δ (ppm)
176			717.4	(300 MHz) : 0.89 (t, $J=7.46$ Hz, 3 H) 0.99 – 1.40 (m, 5 H) 1.04 (d, $J=6.68$ Hz, 3 H) 1.08 (d, $J=6.68$ Hz, 3 H) 1.12 (d, $J=7.46$ Hz, 3 H) 1.23 (d, $J=6.22$ Hz, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.29 (d, $J=6.22$ Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.47 – 1.62 (m, 3 H) 1.62 – 1.70 (m, 1 H) 2.02 – 2.20 (m, 2 H) 2.12 (s, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (d, $J=14.61$ Hz, 1 H) 2.42 – 2.57 (m, 2 H) 2.68 – 2.76 (m, 2 H) 2.76 – 2.87 (m, 1 H) 3.01 (d, $J=9.33$ Hz, 1 H) 3.18 – 3.35 (m, 3 H) 3.25 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.42 – 3.57 (m, 1 H) 3.62 (q, $J=6.68$ Hz, 1 H) 3.68 (d, $J=7.15$ Hz, 1 H) 3.93 (dd, $J=8.24, 2.02$ Hz, 1 H) 3.98 – 4.10 (m, 1 H) 4.40 (d, $J=7.15$ Hz, 1 H) 4.91 (d, $J=4.51$ Hz, 1 H) 4.93 – 5.02 (m, 1 H)

【0685】

【表 4 - 2】

177			689.5	(300 MHz) : 1.06 (d, J=6.68 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.14 (d, J=6.99 Hz, 3 H) 1.18 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.19 - 1.30 (m, 1 H) 1.22 - 1.24 (m, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.27 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.43 - 1.70 (m, 3 H) 2.02 - 2.25 (m, 3 H) 2.20 (s, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (d, J=15.23 Hz, 1 H) 2.42 - 2.51 (m, 1 H) 2.64 - 2.88 (m, 3 H) 2.97 - 3.12 (m, 2 H) 3.22 (s, 3 H) 3.24 - 3.30 (m, 1 H) 3.32 (s, 3 H) 3.44 - 3.56 (m, 1 H) 3.69 (d, J=6.84 Hz, 1 H) 3.82 (q, J=6.74 Hz, 1 H) 3.92 (dd, J=6.45, 2.10 Hz, 1 H) 3.97 - 4.09 (m, 2 H) 4.30 - 4.38 (m, 1 H) 4.41 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.80 (d, J=4.66 Hz, 1 H)
178		H	761.6	(300 MHz) : 0.84 - 0.91 (m, 6 H) 1.02 (d, J=6.53 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.09 - 1.28 (m, 7 H) 1.17 (d, J=6.99 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.37 - 1.88 (m, 6 H) 2.00 - 2.28 (m, 3 H) 2.05 (s, 3 H) 2.17 (s, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 - 2.74 (m, 4 H) 2.90 - 2.98 (m, 1 H) 3.03 (t, J=9.71 Hz, 1 H) 3.26 (s, 3 H) 3.31 - 3.39 (m, 1 H) 3.35 (s, 3 H) 3.50 - 3.59 (m, 1 H) 3.72 (d, J=6.99 Hz, 1 H) 3.98 - 4.12 (m, 2 H) 4.50 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.73 - 4.79 (m, 1 H) 4.84 - 4.95 (m, 2 H)
179		H	762.6	(300 MHz) : 0.88 (t, J=7.54 Hz, 3 H) 0.95 (d, J=6.84 Hz, 3 H) 1.03 (d, J=6.68 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.10 - 1.28 (m, 7 H) 1.17 (d, J=6.99 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.35 - 1.73 (m, 5 H) 1.99 - 2.27 (m, 4 H) 2.16 (s, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 - 2.74 (m, 5 H) 2.91 - 3.07 (m, 2 H) 3.26 (s, 3 H) 3.32 - 3.58 (m, 2 H) 3.34 (s, 3 H) 3.72 (d, J=6.99 Hz, 1 H) 4.06 (d, 2 H) 4.49 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.56 (s, 2 H) 4.58 - 4.65 (m, 1 H) 4.87 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 4.88 - 4.96 (m, 1 H)
180			916.5	(300 MHz) : 1.02 (d, J=6.68 Hz, 3 H) 1.04 - 1.12 (m, 6 H) 1.14 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.16 - 1.21 (m, 1 H) 1.22 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.30 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.35 - 1.42 (m, 1 H) 1.47 - 1.73 (m, 4 H) 1.97 - 2.13 (m, 2 H) 2.06 (s, 3 H) 2.20 (d, J=10.57 Hz, 1 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (d, J=15.54 Hz, 1 H) 2.39 - 2.58 (m, 2 H) 2.60 - 2.93 (m, 3 H) 3.01 (t, 1 H) 3.06 - 3.26 (m, 2 H) 3.20 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.40 - 3.72 (m, 4 H) 3.58 (s, 2 H) 3.86 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.02 (dd, J=9.25, 5.98 Hz, 1 H) 4.39 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.86 (d, J=4.35 Hz, 1 H) 4.90 (s, 1 H) 5.93 - 6.04 (m, 1 H) 6.47 (dd, J=3.26, 1.87 Hz, 1 H) 6.68 (d, J=3.42 Hz, 1 H) 7.15 - 7.22 (m, 1 H) 7.35 (t, J=7.69 Hz, 1 H) 7.46 (d, J=1.09 Hz, 1 H) 7.53 - 7.63 (m, 2 H)

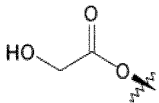
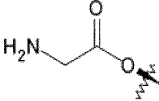
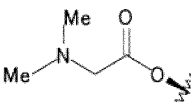
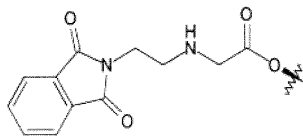
10

20

30

【 0 6 8 6 】

【表 4 - 3】

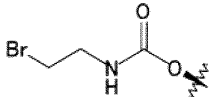
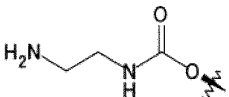
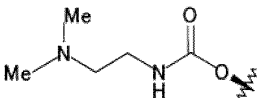
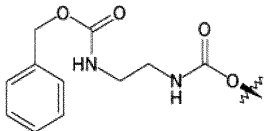
181		H	777.7	(600 MHz) : 0.86 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 0.90 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 0.99 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.17 - 1.30 (m, 2 H) 1.21 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.23 - 1.24 (m, 6 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.48 - 1.67 (m, 4 H) 1.94 - 2.05 (m, 2 H) 2.09 - 2.17 (m, 4 H) 2.17 - 2.25 (m, 1 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.42 - 2.60 (m, 3 H) 2.68 (s, 1 H) 2.93 - 3.05 (m, 2 H) 3.25 (s, 3 H) 3.26 - 3.31 (m, 1 H) 3.32 (s, 3 H) 3.47 - 3.55 (m, 1 H) 3.64 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 3.95 - 4.05 (m, 2 H) 4.09 - 4.17 (m, 2 H) 4.48 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.79 - 4.89 (m, 3 H)	10
182		H	776.7	(600 MHz) : 0.81 - 0.92 (m, 6 H) 0.99 (s, 3 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.17 - 1.30 (m, 2 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 - 1.25 (m, 6 H) 1.27 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.48 - 1.72 (m, 4 H) 1.94 - 2.06 (m, 2 H) 2.08 - 2.24 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.39 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 2.43 - 2.61 (m, 2 H) 2.68 (s, 1 H) 2.93 - 2.98 (m, 1 H) 2.98 - 3.05 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.28 - 3.36 (m, 1 H) 3.32 - 3.33 (m, 3 H) 3.41 (s, 2 H) 3.48 - 3.56 (m, 1 H) 3.67 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 3.94 - 4.07 (m, 2 H) 4.48 (d, J=5.50 Hz, 1 H) 4.81 (s, 1 H) 4.83 - 4.91 (m, 2 H)	20
183		H	804.7	(600 MHz) : 0.82 - 0.90 (m, 6 H) 0.98 (s, 3 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.17 - 1.27 (m, 2 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 - 1.26 (m, 6 H) 1.29 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.48 - 1.59 (m, 3 H) 1.59 - 1.65 (m, 1 H) 1.95 - 2.06 (m, 2 H) 2.07 - 2.23 (m, 5 H) 2.27 (s, 6 H) 2.32 (s, 6 H) 2.39 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.42 - 2.50 (m, 1 H) 2.52 - 2.61 (m, 2 H) 2.68 (s, 1 H) 2.90 - 2.97 (m, 1 H) 3.02 (t, J=9.63 Hz, 1 H) 3.14 (s, 2 H) 3.24 (s, 3 H) 3.28 - 3.38 (m, 1 H) 3.32 - 3.33 (m, 3 H) 3.52 (s, 1 H) 3.68 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 3.98 (s, 1 H) 4.01 - 4.08 (m, 1 H) 4.47 (s, 1 H) 4.80 (s, 1 H) 4.83 - 4.93 (m, 2 H)	30
184		H	949.9	(600 MHz) : 0.82 - 0.89 (m, 6 H) 0.97 (s, 3 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.18 - 1.32 (m, 2 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 - 1.26 (m, 3 H) 1.24 - 1.25 (m, 3 H) 1.28 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.47 - 1.67 (m, 4 H) 1.90 - 2.07 (m, 2 H) 2.09 - 2.22 (m, 4 H) 2.25 - 2.36 (m, 6 H) 2.38 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 2.40 - 2.64 (m, 3 H) 2.65 - 2.74 (m, 1 H) 2.91 (t, J=6.19 Hz, 2 H) 2.92 - 2.98 (m, 1 H) 3.01 (t, J=9.17 Hz, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.29 - 3.32 (m, 1 H) 3.32 - 3.34 (m, 3 H) 3.40 (d, J=4.13 Hz, 2 H) 3.48 - 3.57 (m, 1 H) 3.67 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 3.79 (t, J=6.19 Hz, 2 H) 3.95 - 4.07 (m, 2 H) 4.46 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 4.81 (s, 1 H) 4.85 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 4.88 (s, 1 H) 7.70 (dd, J=5.50, 3.21 Hz, 2 H) 7.83 (dd, J=5.50, 3.21 Hz, 2 H)	40

【表 4 - 4】

185		H	910.8	(600 MHz) : 0.82 – 0.91 (m, 6 H) 0.97 (s, 3 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.19 – 1.31 (m, 2 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 – 1.27 (m, 6 H) 1.29 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.45 – 1.69 (m, 4 H) 1.93 – 2.09 (m, 2 H) 2.14 – 2.16 (m, 3 H) 2.17 – 2.28 (m, 1 H) 2.29 – 2.31 (m, 6 H) 2.38 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.41 – 2.61 (m, 3 H) 2.66 – 2.74 (m, 1 H) 2.92 – 3.04 (m, 2 H) 3.21 – 3.34 (m, 1 H) 3.23 – 3.24 (m, 3 H) 3.31 – 3.33 (m, 3 H) 3.46 – 3.55 (m, 1 H) 3.66 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 3.87 – 4.07 (m, 4 H) 4.45 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 4.81 (s, 1 H) 4.84 – 4.91 (m, 2 H) 5.11 (s, 2 H) 5.27 (s, 1 H) 7.27 – 7.38 (m, 5 H)	10
186		H	866.8	(600 MHz) : 0.81 – 0.91 (m, 6 H) 1.00 (s, 3 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 – 1.32 (m, 11 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.46 – 1.59 (m, 3 H) 1.60 – 1.67 (m, 1 H) 1.94 – 2.05 (m, 2 H) 2.11 – 2.14 (m, 3 H) 2.15 – 2.24 (m, 1 H) 2.27 – 2.30 (m, 6 H) 2.39 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.41 – 2.63 (m, 3 H) 2.68 (s, 1 H) 2.92 – 3.04 (m, 2 H) 3.18 (s, 2 H) 3.27 – 3.35 (m, 1 H) 3.32 – 3.33 (m, 3 H) 3.37 (s, 3 H) 3.47 – 3.57 (m, 1 H) 3.67 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 3.79 (d, J=1.83 Hz, 2 H) 3.94 – 4.06 (m, 2 H) 4.46 (d, J=5.50 Hz, 1 H) 4.80 – 4.91 (m, 3 H) 7.20 – 7.25 (m, 1 H) 7.27 – 7.33 (m, 4 H)	20
187		H	880.8	(600 MHz) : 0.80 – 0.90 (m, 6 H) 1.00 (s, 3 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 – 1.32 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 – 1.31 (m, 9 H) 1.46 – 1.71 (m, 4 H) 1.92 – 2.04 (m, 2 H) 2.06 – 2.24 (m, 4 H) 2.29 – 2.34 (m, 6 H) 2.37 – 2.38 (m, 3 H) 2.38 – 2.42 (m, 1 H) 2.42 – 2.61 (m, 3 H) 2.68 (s, 1 H) 2.92 – 2.98 (m, 1 H) 3.01 (t, J=9.63 Hz, 1 H) 3.16 (s, 3 H) 3.23 (d, J=4.13 Hz, 2 H) 3.30 – 3.36 (m, 1 H) 3.32 – 3.33 (m, 3 H) 3.49 – 3.56 (m, 1 H) 3.66 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 3.68 (s, 2 H) 3.94 – 4.06 (m, 2 H) 4.46 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 4.79 – 4.91 (m, 3 H) 7.20 – 7.24 (m, 1 H) 7.26 – 7.34	30
188		H	790.7	(600 MHz) : 0.86 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 0.91 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.01 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.07 – 1.11 (m, 6 H) 1.11 – 1.29 (m, 2 H) 1.15 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 – 1.30 (m, 9 H) 1.48 – 1.59 (m, 3 H) 1.60 – 1.66 (m, 1 H) 1.97 – 2.09 (m, 2 H) 2.12 – 2.14 (m, 3 H) 2.15 – 2.23 (m, 1 H) 2.28 – 2.29 (m, 6 H) 2.40 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.45 – 2.58 (m, 3 H) 2.64 – 2.71 (m, 1 H) 2.92 (s, 1 H) 3.01 (t, J=8.94 Hz, 1 H) 3.12 – 3.26 (m, 2 H) 3.22 – 3.22 (m, 3 H) 3.29 – 3.38 (m, 1 H) 3.33 – 3.34 (m, 3 H) 3.49 – 3.56 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 3.98 – 4.10 (m, 2 H) 4.41 – 4.50 (m, 2 H) 4.61 (s, 1 H) 4.81 – 4.96 (m, 2 H)	40

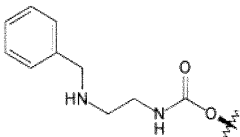
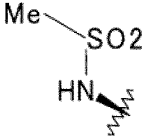
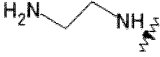
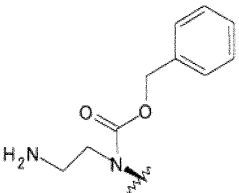
【 0 6 8 8 】

【表 4 - 5】

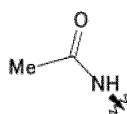
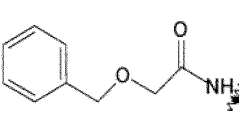
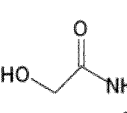
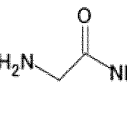
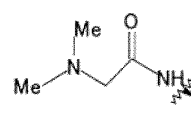
189		H	868.6	(600 MHz) : 0.87 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 0.91 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.03 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.04 - 1.32 (m, J=45.85 Hz, 2 H) 1.08 (s, 3 H) 1.16 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.19 - 1.34 (m, 12 H) 1.46 - 1.62 (m, 4 H) 1.93 - 2.08 (m, 2 H) 2.08 - 2.44 (m, 5 H) 2.13 - 2.17 (m, 9 H) 2.63 - 2.76 (m, 1 H) 2.93 - 3.08 (m, 2 H) 3.14 - 3.26 (m, 5 H) 3.27 - 3.37 (m, 1 H) 3.31 - 3.32 (m, 3 H) 3.38 - 3.49 (m, 2 H) 3.49 - 3.74 (m, 2 H) 3.91 - 4.13 (m, 2 H) 4.47 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 4.85 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 4.87 - 5.03 (m, 2 H)
190		H	805.7	(600 MHz) : 0.86 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 0.91 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.01 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.05 - 1.31 (m, 2 H) 1.10 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 - 1.31 (m, 9 H) 1.46 - 1.72 (m, 4 H) 1.96 - 2.10 (m, 2 H) 2.13 - 2.16 (m, 3 H) 2.15 - 2.25 (m, 1 H) 2.28 - 2.31 (m, 6 H) 2.39 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.44 - 2.59 (m, 3 H) 2.65 - 2.72 (m, 1 H) 2.72 - 2.84 (m, 2 H) 2.93 (s, 1 H) 3.01 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 3.12 - 3.28 (m, 2 H) 3.22 - 3.23 (m, 3 H) 3.28 - 3.40 (m, 1 H) 3.32 - 3.34 (m, 3 H) 3.48 - 3.57 (m, 1 H) 3.69 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 3.94 - 4.10 (m, 2 H) 4.47 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 4.62 (s, 1 H) 4.79 - 5.01 (m, 3 H)
191		H	833.8	(600 MHz) : 0.84 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.90 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.00 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.06 - 1.30 (m, 2 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.18 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.20 - 1.23 (m, 6 H) 1.27 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.46 - 1.58 (m, 3 H) 1.59 - 1.65 (m, 1 H) 1.90 - 2.04 (m, 2 H) 2.04 - 2.20 (m, 12 H) 2.27 - 2.28 (m, 6 H) 2.38 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 2.44 - 2.56 (m, 3 H) 2.64 (s, 1 H) 2.90 (s, 1 H) 2.99 (s, 1 H) 3.11 - 3.27 (m, 2 H) 3.20 - 3.21 (m, 3 H) 3.28 - 3.33 (m, 1 H) 3.31 - 3.32 (m, 3 H) 3.48 - 3.56 (m, 1 H) 3.68 - 3.72 (m, 1 H) 3.94 - 4.09 (m, 2 H) 4.43 - 4.50 (m, 1 H) 4.59 - 4.67 (m, 1 H) 4.79 - 4.92 (m, 2 H) 5.03 - 5.09 (m, 1 H)
192		H	939.9	(600 MHz) : 0.86 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 0.89 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 0.98 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.06 - 1.33 (m, 2 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.26 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.46 - 1.69 (m, 4 H) 2.01 - 2.10 (m, 2 H) 2.14 - 2.23 (m, 1 H) 2.15 - 2.16 (m, 3 H) 2.29 - 2.31 (m, 6 H) 2.38 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 2.42 - 2.60 (m, 3 H) 2.66 - 2.75 (m, 1 H) 2.93 (s, 1 H) 3.00 (t, J=9.86 Hz, 1 H) 3.21 - 3.22 (m, 3 H) 3.25 - 3.37 (m, 5 H) 3.31 - 3.32 (m, 3 H) 3.51 (s, 1 H) 3.67 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 3.96 - 4.10 (m, 2 H) 4.44 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.59 (s, 1 H) 4.85 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 4.89 - 4.94 (m, 1 H) 4.97 (s, 1 H) 5.08 (s, 2 H) 5.18 (s, 1 H) 7.27 - 7.39 (m, 5 H)

【 0 6 8 9 】

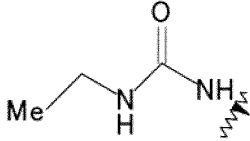
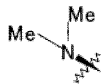
【表 4 - 6】

193		H	895.9	(600 MHz) : 0.86 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.90 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.00 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.05 - 1.33 (m, 2 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.22 - 1.32 (m, 9 H) 1.46 - 1.74 (m, 4 H) 1.96 - 2.11 (m, 2 H) 2.12 - 2.24 (m, 1 H) 2.14 - 2.17 (m, 3 H) 2.28 - 2.31 (m, 6 H) 2.39 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.43 - 2.61 (m, 3 H) 2.65 - 2.76 (m, 3 H) 2.93 (s, 1 H) 3.01 (t, J=9.17 Hz, 1 H) 3.18 - 3.38 (m, 3 H) 3.21 - 3.24 (m, 3 H) 3.32 - 3.34 (m, 3 H) 3.47 - 3.58 (m, 1 H) 3.65 - 3.84 (m, 3 H) 3.95 - 4.09 (m, 2 H) 4.46 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.80 - 4.94 (m, 2 H) 5.00 (s, 1 H) 7.18 - 7.37 (m, 5 H)	10
194			731.4	(300 MHz) : 0.88 (t, J=7.54 Hz, 3 H) 0.98 (d, J=6.37 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.08 - 1.84 (m, 8 H) 1.11 - 1.29 (m, 18 H) 1.89 (s, 3 H) 1.99 - 2.12 (m, 1 H) 2.30 (s, 6 H) 2.31 - 2.54 (m, 2 H) 2.55 - 2.78 (m, 3 H) 2.94 - 3.08 (m, 1 H) 3.16 - 3.26 (m, 1 H) 3.33 (s, 3 H) 3.44 (s, 3 H) 3.47 - 3.71 (m, 4 H) 3.86 - 4.12 (m, 2 H) 4.48 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.82 (d, J=4.35 Hz, 1 H) 4.85 - 4.96 (m, 1 H) 5.36 - 5.80 (m, 2 H)	20
195		H	718.5	(300 MHz) : 0.80 - 1.00 (m, 9 H) 1.10 - 1.19 (m, 6 H) 1.14 - 1.31 (m, 2 H) 1.21 - 1.25 (m, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.31 (d, J=6.37 Hz, 3 H) 1.35 (s, 3 H) 1.46 - 1.82 (m, 5 H) 1.89 - 2.57 (m, 5 H) 2.26 - 2.31 (m, 9 H) 2.37 (d, J=14.92 Hz, 1 H) 2.65 - 2.86 (m, 2 H) 3.02 (t, J=9.56 Hz, 1 H) 3.12 - 3.53 (m, 3 H) 3.30 - 3.34 (m, 6 H) 3.74 (d, J=8.39 Hz, 1 H) 3.96 - 4.11 (m, 2 H) 4.38 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.62 - 4.78 (m, 1 H) 4.81 - 4.94 (m, 1 H)	30
196		H	796.4	(300 MHz) : 0.84 - 0.91 (m, 3 H) 0.99 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.04 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.10 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.08 - 1.28 (m, 2 H) 1.19 (d, J=6.99 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.28 - 1.33 (m, 6 H) 1.42 - 1.71 (m, 4 H) 1.89 - 2.01 (m, 1 H) 2.03 - 2.52 (m, 14 H) 2.59 - 2.72 (m, 1 H) 2.76 - 2.93 (m, 2 H) 2.95 (s, 3 H) 3.03 (t, J=9.64 Hz, 1 H) 3.14 - 3.32 (m, 2 H) 3.32 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.43 - 3.57 (m, 1 H) 3.76 (d, J=8.08 Hz, 1 H) 3.97 - 4.10 (m, 2 H) 4.45 (d, J=6.99 Hz, 1 H) 4.87 - 4.93 (m, 1 H) 5.08 - 5.26 (m, 1 H) 6.04 - 6.21 (m, 1 H)	40
197		H	761.7		
198		H	895.7		

【表 4 - 7】

199		H	759.5	(600 MHz) : 0.84 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 0.93 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.00 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=3.67 Hz, 3 H) 1.14 - 1.28 (m, 2 H) 1.16 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.21 - 1.22 (m, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.40 - 1.48 (m, 2 H) 1.54 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.62 - 1.69 (m, 1 H) 2.01 (s, 3 H) 2.11 - 2.32 (m, 15 H) 2.35 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.44 - 2.54 (m, 1 H) 2.58 - 2.67 (m, 1 H) 2.76 - 2.88 (m, 1 H) 2.99 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 3.14 - 3.23 (m, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.41 - 3.49 (m, 2 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.97 - 4.06 (m, 1 H) 4.07 - 4.16 (m, 1 H) 4.39 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.78 - 4.95 (m, 2 H) 7.01 (br. s., 1 H)	10
200		H	866.9	(600 MHz) : 0.83 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 0.94 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.02 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.17 - 1.21 (m, 1 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.24 - 1.30 (m, 7 H) 1.42 - 1.51 (m, 2 H) 1.54 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.94 - 2.06 (m, 1 H) 2.07 - 2.50 (m, 16 H) 2.54 - 2.68 (m, 1 H) 2.75 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 - 2.96 (m, 1 H) 2.99 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 3.17 - 3.35 (m, 2 H) 3.21 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.43 - 3.50 (m, 1 H) 3.67 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.94 (s, 2 H) 3.96 - 4.18 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.61 (s, 2 H) 4.83 - 4.91 (m, 2 H) 7.11 (br. s., 1 H) 7.27 - 7.38 (m, 5 H)	20
201		H	766.8	(600 MHz) : 0.81 - 0.93 (m, 3 H) 0.97 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.02 - 1.19 (m, 7 H) 1.19 - 1.27 (m, 4 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.26 (s, 3 H) 1.29 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.41 - 1.50 (m, 2 H) 1.55 (dd, J=15.13, 4.59 Hz, 1 H) 1.64 (d, J=11.46 Hz, 1 H) 2.08 - 2.40 (m, 4 H) 2.26 - 2.28 (m, 9 H) 2.37 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.40 - 2.52 (m, 2 H) 2.63 - 2.70 (m, 1 H) 2.80 - 2.88 (m, 1 H) 3.00 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 3.19 (dd, J=10.32, 7.11 Hz, 1 H) 3.26 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.42 - 3.51 (m, 2 H) 3.72 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.99 - 4.14 (m, 4 H) 4.40 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.76 - 4.82 (m, 1 H) 4.83 - 4.91 (m, 1 H)	30
202		H	774.5	(600 MHz) : 0.86 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 0.96 - 1.01 (m, 6 H) 1.04 - 1.17 (m, 7 H) 1.17 - 1.26 (m, 4 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.42 - 1.52 (m, 2 H) 1.54 (dd, J=15.13, 4.59 Hz, 1 H) 1.67 (d, J=13.30 Hz, 1 H) 1.79 - 1.93 (m, 1 H) 1.93 - 2.25 (m, 2 H) 2.14 - 2.16 (m, 3 H) 2.28 - 2.34 (m, 6 H) 2.37 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.48 - 2.63 (m, 1 H) 2.72 - 2.85 (m, 2 H) 2.99 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 3.15 - 3.26 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.33 - 3.40 (m, 2 H) 3.43 - 3.50 (m, 1 H) 3.69 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 3.94 - 4.05 (m, 1 H) 4.09 - 4.18 (m, 1 H) 4.41 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.77 - 4.92 (m, 2 H) 7.53 (br. s., 1 H)	40
203		H	803.7		

【表 4 - 8】

204		H	789.9	(600 MHz) : 0.83 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.93 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.00 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.04 - 1.14 (m, 7 H) 1.19 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.22 - 1.28 (m, 7 H) 1.30 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.36 - 1.47 (m, 2 H) 1.56 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.62 - 1.69 (m, 1 H) 1.74 - 1.88 (m, 1 H) 2.12 - 2.20 (m, 1 H) 2.20 - 2.33 (m, 12 H) 2.37 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.41 - 2.49 (m, 1 H) 2.58 - 2.66 (m, 1 H) 2.80 - 2.91 (m, 2 H) 2.98 - 3.04 (m, 1 H) 3.13 - 3.33 (m, 4 H) 3.26 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.41 - 3.49 (m, 1 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.99 - 4.11 (m, 2 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.90 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 4.93 - 5.12 (m, 2 H) 5.46 (br. s., 1 H)
205		H	746.8	(600 MHz) : 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.07 - 1.20 (m, 2 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 - 1.25 (m, 7 H) 1.27 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.50 - 1.75 (m, J=15.13, 5.04 Hz, 3 H) 1.55 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.93 - 2.10 (m, 2 H) 2.15 - 2.41 (m, 17 H) 2.38 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.44 - 2.60 (m, 3 H) 2.62 - 2.69 (m, 1 H) 3.01 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 3.19 - 3.30 (m, 1 H) 3.27 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.46 - 3.55 (m, 1 H) 3.72 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 3.98 - 4.09 (m, 2 H) 4.41 - 4.49 (m, 1 H) 4.86 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 4.95 - 5.04 (m, 1 H)

【 0 6 9 2 】

実施例 1 7 6

(1) 実施例 1 2 6 (1) で得られた化合物 1.34g をクロロホルム 25ml に溶解し、氷冷下、ピリジン 2.28ml、トリホスゲン 1.30g を加えて 30 分間攪拌した。さらにベンジルアルコール 3.05g を加えて 1 時間攪拌後、蒸留水を加えて分液した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン=650:50:0.1）にて精製して 4'-0-ベン

【 0 6 9 3 】

(2) 上記 (1) で得られた化合物 1.59g を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて脱シリル体 1.08g を得た。

【 0 6 9 4 】

(3) 上記 (2) で得られた化合物 1.08g をアセトン 10ml に溶解し、無水酢酸 155mg を加えて 18 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に酢酸エチルと飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して 2'-0-アセチル体 1.00g を得た。

【 0 6 9 5 】

(4) N-クロロコハク酸イミド 746mg をトルエン 30ml に懸濁し、-25℃にてジメチルスルフィド 1.35ml を滴下して、そのまま 15 分間攪拌した。そこに、上記 (3) で得られた化合物 500mg のトルエン 5ml 溶液を滴下して、そのまま 15 分間攪拌した。さらにトリエチルアミン 1.56ml を加えて 10 分後に室温まで昇温してから酢酸エチルと飽和重曹水を加えて分液した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン=10:10:0.1）にて精製して 9-ケトン体 465mg を得た。

【 0 6 9 6 】

(5) 上記 (4) で得られた化合物 460mg をメタノールに溶解し、室温にて 40 時間攪拌した。反応液に 5% パラジウム-炭素 450mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 1.5 時間

攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=20:1:0.1から10:1:0.1）にて精製して表4で示される化合物308mgを得た。

【0697】

実施例177

実施例157（1）で得られた化合物240mgを原料として実施例126（1）、実施例176と同様の方法にて表4で示される化合物31.0mgを得た。

【0698】

実施例178

実施例176（3）で得られた化合物50mgをクロロホルム0.5ml、ピリジン0.5mlに溶解し、無水酢酸29mg、4-ジメチルアミノピリジン14mgを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=20:1:0.1）にて精製して得られた9-0-アセチル体51.6mgを原料として実施例176（5）と同様の方法にて表4で示される化合物31.8mgを得た。

【0699】

実施例179

実施例176（3）で得られた化合物50mgをクロロホルム1mlに溶解し、トリクロロアセチルイソシアネート8 μ lを加えて10分間攪拌した。反応液にメタノール6 μ l、炭酸カリウム9.3mgを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=20:1:0.1）にて精製して得られた9-0-カルバモイル体38.6mgを原料として実施例176（5）と同様の方法にて表4で示される化合物14.5mgを得た。

【0700】

実施例180

実施例23（2）で得られた化合物0.98gを原料として実施例176と同様の方法にて表4で示される化合物207mgを得た。

【0701】

実施例181

（1）実施例176（3）で得られた化合物50mgをクロロホルム2mlに溶解し、ピリジン1ml、ベンジルクロロアセテート26.4 μ l、4-ジメチルアミノピリジン13.6mgを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液とクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン=30:10:0.2）にて精製して9-0-アシル体52.9mgを得た。

【0702】

（2）上記（1）で得られた化合物35mgをメタノール1mlに溶解し、室温にて18時間、さらに45℃にて8時間、室温にて18時間攪拌した。5%パラジウム-炭素20mgを加えて水素雰囲気下、室温にて4日間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=30:1:0.1から10:1:0.1）にて精製して表4で示される化合物13.0mgを得た。

【0703】

実施例182

（1）実施例176（3）で得られた化合物250mgをクロロホルム2mlに溶解し、ピリジン5ml、無水クロロ酢酸478mg、4-ジメチルアミノピリジン160mgを加えて室温にて3時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液とクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルムのみからクロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=20:1:0.1）にて精製して9-0-アシル体217mgを得た。

【0704】

（2）上記（1）で得られた化合物215mgをジメチルホルムアミド5mlに溶解し、アジ化ナ

10

20

30

40

50

トリウム21.6mgを加えて80℃にて3.5時間攪拌した。反応液に蒸留水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を蒸留水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルムのみからクロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1）にて精製してアジド体158mgを得た。

【0705】

（3）上記（2）により得られた化合物155mgを酢酸エチル5mlに溶解し、5%パラジウム-炭素30mgを加えて水素雰囲気下、室温にて18時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣を酢酸エチル5mlに溶解し、5%パラジウム-炭素100mgを加えて水素雰囲気下、室温にて4時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮してアミン体を得た。

10

【0706】

（4）上記（3）により得られた化合物をメタノール5mlに溶解し、50℃にて3時間、室温にて18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=30:1:0.1）にて精製して表4で示される化合物78mgを得た。

【0707】

実施例183

実施例182で得られた化合物20mgを原料として実施例7（2）と同様の方法にて表4で示される化合物10.9mgを得た。

20

【0708】

実施例184

実施例182で得られた化合物10mgをクロロホルム0.5mlに溶解し、フタルイミドアセトアルデヒド2.9mg、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム4.1mgを加えて室温にて1時間攪拌した。さらにフタルイミドアセトアルデヒド12mg、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム16mgを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（NH型、クロロホルムのみ）と分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して表4で示される化合物2.1mgを得た。

30

【0709】

実施例185

（1）実施例182（3）で得られた化合物10mgをクロロホルム0.5mlに溶解し、トリエチルアミン2μlとベンジルオキシクロロホルレート2μlを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液に蒸留水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してN-ベンジルオキシカルボニル体12.5mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物12mgを原料として実施例182（4）と同様の方法にて表4で示される化合物4.3mgを得た。

【0710】

実施例186

実施例182で得られた化合物20mg、ベンズアルデヒド3.0mgを原料として実施例7（2）と同様の方法にて表4で示される化合物9.3mgを得た。

40

【0711】

実施例187

実施例186で得られた化合物5.8mgを原料として実施例7（2）と同様の方法にて表4で示される化合物2.7mgを得た。

【0712】

実施例188

（1）実施例176（3）で得られた化合物10mgをトルエン0.1mlに溶解し、エチルイソシアネート44μl、4-ジメチルアミノピリジン21.3mgを加えて120℃にて6時間攪拌した。

50

さらにエチルイソシアネート88 μ lを加えて120℃にて3時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=10:10:0.2）にて精製してカーバメート体10.6mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物15mgを原料として実施例181（2）と同様の方法にて表4で示される化合物3.5mgを得た。

【0713】

実施例189

（1）実施例176（3）で得られた化合物100mgをトルエン0.5mlに溶解し、2-ブロモエチルイソシアネート101 μ lを加えて120℃にて1.5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン:アセトン=20:1からヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=10:10:0.2）により精製してカーバメート体100mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物100mgを原料として実施例181（2）と同様の方法にて表4で示される化合物55mgを得た。

【0714】

実施例190

（1）実施例189で得られた化合物20mgをジメチルホルムアミド0.5mlに溶解し、アジ化ナトリウム2.2mgを加えて120℃にて3時間攪拌した。反応液に蒸留水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してアジド体18mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物18mgをメタノール-酢酸エチル(1:1)の混合溶媒0.3mlに溶解し、5%パラジウム-炭素9mgを加えて水素雰囲気下、室温にて2.5時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して表4で示される化合物7.9mgを得た。

【0715】

実施例191

実施例190で得られた化合物15mgを原料として実施例7（2）と同様の方法にて表4で示される化合物3.8mgを得た。

【0716】

実施例192

実施例190で得られた化合物15mgを原料として実施例185（1）、実施例182（4）と同様の方法にて表4で示される化合物1.3mgを得た。

【0717】

実施例193

実施例190で得られた化合物30mg、ベンズアルデヒド4.35mgを原料として実施例7（2）と同様の方法にて表4で示される化合物4.4mgを得た。

【0718】

実施例194

実施例176で得られた化合物0.22gをエタノール7mlに溶解し、ヒドラジーン一水和物0.15mlを加えて加熱還流下7時間攪拌した。反応液に蒸留水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をエタノール7mlに溶解し、ヒドラジーン一水和物0.15mlを加えて加熱還流下7時間攪拌した。反応液に蒸留水とクロロホルムを加えて分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して表4で示される化合物0.19gを得た。

【0719】

実施例195

実施例194で得られた化合物190mgをメタノール-蒸留水(2:1)の混合溶媒4.5mlに溶解し、食塩-氷浴下にて3規定塩酸150 μ lを加えた。そこに亜硝酸ナトリウム90mgの水溶液0.6m

10

20

30

40

50

lをゆっくりと加えた。さらに3規定塩酸360 μ lを加えてpH4に調整しそのまま15分間攪拌した。炭酸カリウム201mg、メタノール1ml、水素化ホウ素ナトリウム10mgを順次加えてさらにそのまま30分間攪拌した。反応液を3規定塩酸でpH2に調整しさらに30分間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=30:1:0.1から10:1:0.1）にて精製して表4で示される化合物110mgを得た。

【0720】

実施例196

実施例195で得られた化合物25mgをジエチルエーテル3mlに溶解し、メタンスルホニルクロリド50 μ l、重曹15mgの水溶液1mlを加えて室温にて50分間攪拌した。反応液にジエチルエーテルと蒸留水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=9:1:0.1）にて精製して表4で示される化合物15mgを得た。

10

【0721】

実施例197

(1) 実施例195で得られた化合物58mg、フタルイミドアセトアルデヒドを原料として実施例7(2)と同様の方法にてフタルイミド体38mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物38mgをエタノール1mlに溶解し、ヒドラジーン水和物1 μ lを加えて室温にて16時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1から5:1:0.1）にて精製して表4で示される化合物5mgを得た。

20

【0722】

実施例198

(1) 実施例197(1)で得られた化合物16mgをジエチルエーテル3mlに溶解し、重曹10mgの水溶液1ml、ベンジルクロロホルメート6 μ lを加えて2時間激しく攪拌した。反応液に飽和重曹水とジエチルエーテルを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をメタノール10mlに溶解し、室温にて14時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1から10:1:0.1）にて精製して9-N-ベンジルオキシカルボニル体10mgを得た。

30

(2) 上記(1)で得られた化合物38mgを原料として実施例197(2)と同様の方法にて表4で示される化合物7mgを得た。

【0723】

実施例199

実施例195で得られた化合物20mg、アセチルクロリド3 μ lを原料として実施例198(1)と同様の方法にて表4で示される化合物11mgを得た。

40

【0724】

実施例200

実施例195で得られた化合物30mg、ベンジルクロロアセテート13 μ lを原料として実施例198(1)と同様の方法にて表4で示される化合物12mgを得た。

【0725】

実施例201

実施例200で得られた化合物15mgを原料として実施例81と同様の方法にて表4で示される化合物10mgを得た。

【0726】

実施例202

50

(1) 実施例 195 で得られた化合物 58mg、クロロアセチルクロリド 13 μ l を原料として実施例 198 (1) と同様の方法にてクロロメチル体 38mg を得た。

【0727】

(2) 上記 (1) で得られた化合物 38mg をジメチルホルムアミド 1ml に溶解し、アジ化ナトリウム 9mg を加えて 120℃ の油浴下にて 4 時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液とクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1) にて精製してアジド体 21mg を得た。

【0728】

(3) 上記 (2) で得られた化合物 21mg をメタノール-酢酸エチル (1:1) の混合溶媒 1ml に溶解し、5%パラジウム-炭素 21mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 5 時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮し、得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1) にて精製して表 4 で示される化合物 14mg を得た。

【0729】

実施例 203

実施例 202 で得られた化合物 8mg を原料として実施例 7 (2) と同様の方法にて表 4 で示される化合物 6mg を得た。

【0730】

実施例 204

実施例 195 で得られた化合物 16mg をジクロロメタン 1ml に溶解し、エチルイソシアネート 4 μ l を加えて室温にて 3 時間攪拌した。反応液に蒸留水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1) にて精製して表 4 で示される化合物 9mg を得た。

【0731】

実施例 205

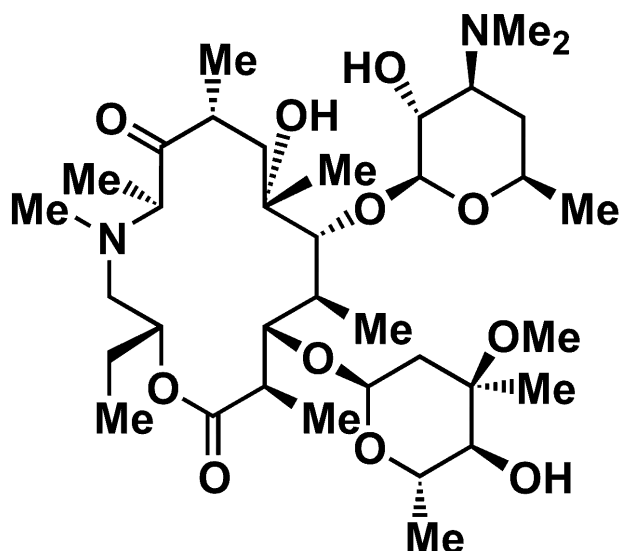
実施例 195 で得られた化合物 10mg を原料として実施例 7 (2) と同様の方法にて表 4 で示される化合物 7mg を得た。

【0732】

実施例 206 式 (K) で示される化合物の合成

【0733】

【化 25】



式 (K)

【0734】

(1) 実施例3で得られた化合物を原料として実施例7(1)、(2)、(3)と同様の方法にて環化体995mgを得た。

【0735】

(2) 上記(1)で得られた化合物500mgをメタノール5mlに溶解し、20%水酸化パラジウム-炭素100mgを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて24時間攪拌した。セライト濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=100:1:0.1)にて精製して脱ベンジル体500mgを得た。

【0736】

(3) 上記(2)で得られた化合物400mgを原料として実施例113(2)と同様の方法にて9-ケトン体421mgを得た。

10

【0737】

(4) 上記(3)で得られた化合物10mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて標記化合物5mgを得た。

MS(ESI) m/z =703.5[M+H]⁺

¹H-NMR(600MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.90(t, J=7.57Hz, 3H) 0.93(d, J=6.42Hz, 3H) 1.01(d, J=6.88Hz, 3H) 1.07(d, J=7.34Hz, 3H) 1.11(d, J=7.34Hz, 3H) 1.21(d, J=5.96Hz, 3H) 1.22(s, 3H) 1.23-1.25(m, 1H) 1.26(d, J=5.96Hz, 3H) 1.30(s, 3H) 1.52(dd, J=15.36, 4.81Hz, 1H) 1.55-1.88(m, 5H) 1.95-2.05(m, 1H) 2.15(d, J=11.00Hz, 1H) 2.21(d, J=14.67Hz, 1H) 2.29(s, 6H) 2.37(d, J=15.13Hz, 1H) 2.43(s, 3H) 2.44-2.50(m, 1H) 2.57(q, J=6.72Hz, 1H) 2.66-2.77(m, 2H) 2.98(t, J=9.63Hz, 1H) 3.05(d, J=13.76Hz, 1H) 3.18-3.25(m, 1H) 3.34(s, 3H) 3.41-3.51(m, 1H) 3.62(d, J=7.79Hz, 1H) 3.97-4.04(m, 2H) 4.39(d, J=7.34Hz, 1H) 4.61-4.65(m, 1H) 4.80(d, J=4.59Hz, 1H) 6.04(br. s., 1H)

20

【0738】

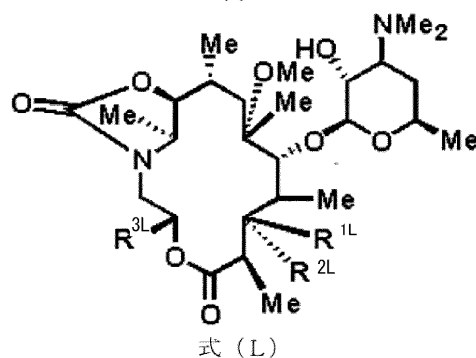
実施例207～213の合成

表5で規定したR^{1L}、R^{2L}、及びR^{3L}をもつ、式(L)で示される化合物の製造法を以下に示す。

【0739】

【表 5 - 1】

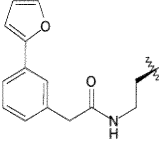
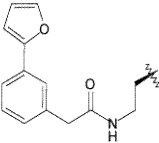
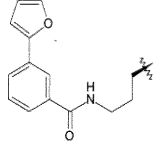
表 5



実施例	R ^{1L}	R ^{2L}	R ^{3L}	ESI MS (M+H)	¹ H-NMR, CDCl ₃ , δ (ppm)
207		H	Et	692.5	(600 MHz) : 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.97 (d, J=6.88 Hz, 2 H) 1.05 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.20 (m, 2 H) 1.16 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.28 (s, 3 H) 1.39 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 1.48 - 1.81 (m, 4 H) 1.96 - 2.03 (m, 1 H) 2.05 - 2.11 (m, 1 H) 2.26 (s, 6 H) 2.31 - 2.38 (m, 1 H) 2.72 - 2.80 (m, 1 H) 3.02 (dd, J=15.13, 9.63 Hz, 1 H) 3.11 (dd, J=10.09, 7.34 Hz, 1 H) 3.13 - 3.19 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.54 (dd, J=10.09, 2.75 Hz, 1 H) 3.62 - 3.73 (m, J=2.75 Hz, 2 H) 3.69 (d, J=2.75 Hz, 2 H) 3.79 (d, J=4.59 Hz, 2 H) 3.95 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.96 - 5.02 (m, 1 H) 5.20 (d, J=10.55 Hz, 1 H) 7.28 (dd, J=7.79, 4.13 Hz, 1 H) 7.71 (dt, J=8.14, 1.95, 1.83 Hz, 1 H) 8.53 (dd, J=5.04, 1.38 Hz, 1 H) 8.54 (d, J=1.83 Hz, 1 H)
208		H	Et	692.5	(600 MHz) : 0.90 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 1.05 (t, 9 H) 1.08 - 1.25 (m, 2 H) 1.17 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 1.41 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 1.49 - 1.66 (m, 3 H) 1.96 - 2.03 (m, 1 H) 2.05 - 2.12 (m, 1 H) 2.29 (s, 6 H) 2.49 - 2.57 (m, 1 H) 2.73 - 2.79 (m, 1 H) 3.01 (dd, J=15.13, 9.63 Hz, 1 H) 3.15 (dd, J=10.32, 7.11 Hz, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 - 3.40 (m, 1 H) 3.53 (dd, J=10.32, 2.52 Hz, 1 H) 3.67 - 3.73 (m, 2 H) 3.84 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 3.90 (d, J=3.21 Hz, 2 H) 4.11 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.96 - 5.02 (m, 1 H) 5.20 (d, J=10.55 Hz, 1 H) 7.18 - 7.21 (m, 1 H) 7.34 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.66 (dt, J=7.57, 1.83 Hz, 1 H) 8.51 - 8.53 (m, 1 H)

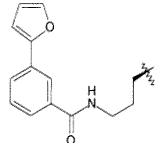
【 0 7 4 0 】

【表 5 - 2】

209	クラジノシル	H	Et	731.5	(500 MHz) : 0.92 (t, J=7.62 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=7.62 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=6.70 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.17 - 1.30 (m, 2 H) 1.22 (d, J=6.10 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.25 (d, J=6.40 Hz, 3 H) 1.29 (d, J=6.40 Hz, 3 H) 1.37 (s, 3 H) 1.44 - 1.68 (m, 5 H) 1.75 - 1.82 (m, 1 H) 2.05 - 2.12 (m, 1 H) 2.27 (s, 3 H) 2.27 (s, 6 H) 2.66 - 2.73 (m, 1 H) 2.98 - 3.10 (m, 2 H) 3.16 (dd, J=10.21, 7.16 Hz, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.42 - 3.48 (m, 1 H) 3.58 (dd, J=10.21, 3.50 Hz, 1 H) 3.66 (d, J=7.92 Hz, 1 H) 3.74 - 3.79 (m, 1 H) 3.89 - 3.92 (m, 1 H) 3.95 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 3.97 - 4.04 (m, 1 H) 4.35 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.81 - 4.86 (m, 1 H) 4.89 (d, J=4.57 Hz, 1 H)
210	クラジノシル	H		930.6	(300 MHz) : 0.81 - 1.40 (m, 17 H) 1.13 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.32 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.36 (s, 3 H) 1.41 - 1.81 (m, 5 H) 1.97 - 2.12 (m, 2 H) 2.21 - 2.51 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.61 - 2.73 (m, 1 H) 2.78 - 2.92 (m, 1 H) 2.99 - 3.72 (m, 8 H) 3.12 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.60 (s, 2 H) 3.79 - 3.86 (m, 1 H) 3.89 (d, J=7.62 Hz, 1 H) 4.00 (d, 1 H) 4.34 (d, J=6.99 Hz, 1 H) 4.81 (d, J=4.35 Hz, 1 H) 4.82 - 4.91 (m, 1 H) 6.15 - 6.23 (m, 1 H) 6.47 (dd, J=3.34, 1.79 Hz, 1 H) 6.67 (d, J=2.49 Hz, 1 H) 7.19 (d, J=7.46 Hz, 1 H) 7.35 (t, J=7.93 Hz, 1 H) 7.46 (d, J=1.55 Hz, 1 H) 7.55 - 7.61 (m, 2 H)
211				770.5	(300 MHz) : 1.05 (d, J=6.84 Hz, 3 H) 1.12 - 1.91 (m, 15 H) 1.29 (s, 3 H) 1.39 (d, J=6.99 Hz, 3 H) 2.02 - 2.16 (m, 1 H) 2.27 (s, 6 H) 2.40 - 2.52 (m, 1 H) 2.69 - 3.08 (m, 4 H) 3.14 - 3.23 (m, 1 H) 3.46 - 3.68 (m, 3 H) 3.59 (s, 3 H) 3.65 (s, 2 H) 3.72 - 3.81 (m, 1 H) 3.97 - 4.06 (m, 2 H) 4.32 (d, J=7.77 Hz, 1 H) 4.87 - 4.98 (m, 1 H) 6.17 - 6.23 (m, 1 H) 6.47 (dd, J=3.11, 2.02 Hz, 1 H) 6.68 (d, J=2.80 Hz, 1 H) 7.17 - 7.22 (m, 1 H) 7.36 (t, J=7.77 Hz, 1 H) 7.46 - 7.48 (m, 1 H) 7.55 - 7.61 (m, 2 H)
212	クラジノシル	H		930.5	(600 MHz) : 1.03 - 1.07 (m, 6 H) 1.14 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 - 1.27 (m, 2 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.28 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.36 (s, 3 H) 1.47 (d, J=16.51 Hz, 1 H) 1.51 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.54 - 1.84 (m, 6 H) 2.02 - 2.12 (m, 1 H) 2.20 - 2.37 (m, 8 H) 2.66 - 2.75 (m, 1 H) 3.01 (t, J=9.86 Hz, 1 H) 3.08 (dd, J=15.13, 9.63 Hz, 1 H) 3.13 - 3.22 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.35 - 3.51 (m, 3 H) 3.59 (dd, J=10.09, 3.67 Hz, 1 H) 3.66 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.74 - 3.79 (m, 1 H) 3.85 - 3.91 (m, 1 H) 3.93 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.95 - 4.03 (m, 1 H) 4.35 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.85 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.89 (s, 1 H) 6.48 (dd, J=3.67, 1.83 Hz, 1 H) 6.49 - 6.53 (m, 1 H) 6.73 - 6.76 (m, 1 H) 7.42 (t, J=7.79 Hz, 1 H) 7.47 (d, J=1.83 Hz, 1 H) 7.62 - 7.66 (m, 1 H) 7.75 - 7.79 (m, 1 H) 8.03 - 8.07 (m, 1 H)

【 0 7 4 1 】

【表 5 - 3】

213				770.5	(600 MHz) : 1.04 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.21 - 1.29 (m, 11 H) 1.35 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.45 - 1.79 (m, 6 H) 2.08 - 2.20 (m, 1 H) 2.27 (s, 6 H) 2.38 - 2.53 (m, 1 H) 2.76 (s, 3 H) 2.86 - 2.95 (m, 1 H) 3.04 (dd, J=15.13, 10.55 Hz, 1 H) 3.13 - 3.23 (m, 1 H) 3.35 - 3.53 (m, 2 H) 3.53 - 3.81 (m, 4 H) 4.00 - 4.11 (m, 2 H) 4.29 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.83 - 4.90 (m, 1 H) 6.47 (dd, J=3.67, 1.83 Hz, 1 H) 6.48 - 6.55 (m, 1 H) 6.77 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 7.41 (t, J=7.79 Hz, 1 H) 7.45 - 7.49 (m, 1 H) 7.61 - 7.65 (m, 1 H) 7.74 - 7.78 (m, 1 H) 8.04 - 8.07 (m, 1 H)

【 0 7 4 2 】

実施例 207

(1) 実施例 125 (2) で得られた化合物74mg、ピリジン83 μ lをクロロホルムに溶解し、トリホスゲン91mgを加えて室温にて9時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃

10

20

30

40

50

縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して9,10a-サイクリックカーバメート体52mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物52mgを原料として実施例125（3）と同様の方法にて表5で示される化合物40mgを得た。

【0743】

実施例208

実施例112で得られた化合物97mgを原料として、実施例176（3）、実施例207（1）、実施例125（3）と同様の方法にて表5で示される化合物19mgを得た。

【0744】

実施例209

（1）実施例176（3）で得られた化合物50mgを原料として実施例207（1）と同様の方法にて9,10a-サイクリックカーバメート体14.4mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物を原料として実施例176（5）と同様の方法にて表5で示される化合物5.0mgを得た。

【0745】

実施例210

（1）実施例23で得られた化合物32mgを原料として実施例176（3）、実施例207（1）と同様の方法にて9,10a-サイクリックカーバメート体10.5mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物10.5mgを原料として実施例125（3）と同様の方法にて表5で示される化合物4.4mgを得た。

【0746】

実施例211

（1）実施例210（1）で得られた化合物32mgを1規定塩酸1ml、エタノール1mlに溶解し、室温にて18時間攪拌した。反応液を1規定水酸化ナトリウム水溶液中で中和後、クロロホルムにて抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=20:1:0.1）にて精製して得られた化合物7.5mgを原料として実施例113（2）と同様の方法にて2'-0-アセチル体を7.4mg得られた。

（2）上記（1）で得られた化合物7.4mgを原料として実施例125（3）と同様の方法にて表5で示される化合物5.0mgを得た。

【0747】

実施例212

（1）実施例38で得られた化合物82mgを原料として実施例176（3）、実施例207（1）と同様の方法にて9,10a-サイクリックカーバメート体23.0mgを得た。

（3）上記（2）で得られた化合物5.0mgを原料として実施例125（3）と同様の方法にて表5で示される化合物2.8mgを得た。

【0748】

実施例213

実施例212（1）で得られた化合物17mgを原料として実施例211（1）、実施例125（3）と同様の方法にて表5で示される化合物2.5mgを得た。

【0749】

実施例214～235の合成

表6で規定した R^{1M} 、 R^{2M} 、及び R^{3M} をもつ、式（M）で示される化合物の製造法を以下に示す。

【0750】

10

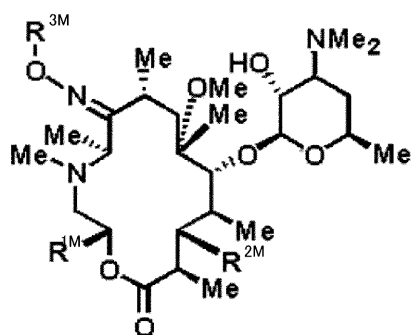
20

30

40

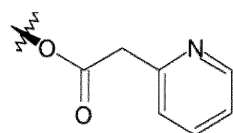
【表 6 - 1】

表 6



式 (M)

実施例 218 を除く、式 (M) で示される化合物の R^{2M} はクラジノシル基である。実施例 218 の R^{2M} は式

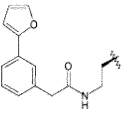
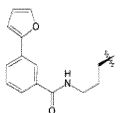
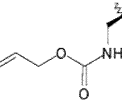


で示される基である。

実施例	R^{1M}	R^{3M}	ESI MS (M+H)	$^1\text{H-NMR}$, CDCl_3 , δ (ppm)
214	Et	H	732.5	(300 MHz) : 0.89 (t, $J=7.54$ Hz, 3 H) 1.06 (d, $J=6.84$ Hz, 3 H) 1.10 (d, $J=7.46$ Hz, 3 H) 1.20 (t, 16 H) 1.30 (s, 3 H) 1.46 – 1.72 (m, 5 H) 1.89 – 2.77 (m, 8 H) 2.11 (s, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.96 – 3.06 (m, 1 H) 3.25 – 3.30 (m, 1 H) 3.27 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.44 – 3.62 (m, 3 H) 3.68 (d, $J=6.99$ Hz, 1 H) 3.92 (dd, $J=5.28, 1.55$ Hz, 1 H) 3.96 – 4.08 (m, 1 H) 4.48 (d, $J=7.46$ Hz, 1 H) 4.80 – 4.92 (m, 1 H) 4.89 (d, $J=4.97$ Hz, 1 H)
215	H	H	704.4	(300 MHz) : 1.03 – 1.40 (m, 16 H) 1.05 (d, $J=6.99$ Hz, 3 H) 1.11 (d, $J=7.77$ Hz, 3 H) 1.28 (s, 3 H) 1.48 – 1.70 (m, 5 H) 1.97 – 2.54 (m, 5 H) 2.19 (s, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.63 – 2.91 (m, 3 H) 3.01 (t, $J=9.64$ Hz, 1 H) 3.23 – 3.37 (m, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.47 – 3.59 (m, 1 H) 3.63 – 3.74 (m, 2 H) 3.94 – 4.06 (m, 2 H) 4.20 – 4.31 (m, 1 H) 4.50 (d, $J=7.31$ Hz, 1 H) 4.66 (d, $J=4.35$ Hz, 1 H)

【 0 7 5 1】

【表 6 - 2】

216		H	931.7	(300 MHz) : 1.00 - 1.17 (m, 12 H) 1.23 (d, J=6.37 Hz, 3 H) 1.24 - 1.29 (m, 1 H) 1.26 (s, 3 H) 1.26 - 1.29 (m, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.38 - 1.74 (m, 5 H) 2.04 - 2.24 (m, 3 H) 2.17 (s, 3 H) 2.30 (s, 6 H) 2.32 - 2.57 (m, 3 H) 2.64 - 2.95 (m, 3 H) 3.02 (t, J=9.79 Hz, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.30 - 3.33 (m, 1 H) 3.33 (s, 3 H) 3.39 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 3.43 - 3.62 (m, 3 H) 3.58 (s, 2 H) 3.66 (d, J=6.22 Hz, 1 H) 3.80 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 3.95 - 4.08 (m, 1 H) 4.45 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.60 (s, 1 H) 4.86 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 6.23 (s, 1 H) 6.46 (dd, J=3.42, 1.87 Hz, 1 H) 6.68 (dd, J=3.26, 0.78 Hz, 1 H) 7.15 - 7.22 (m, 1 H) 7.35 (t, J=7.69 Hz, 1 H) 7.44 - 7.48 (m, 1 H) 7.54 - 7.62 (m, 2 H)
217		H	931.4	(600 MHz) : 1.07 - 1.15 (m, 6 H) 1.16 - 1.21 (m, 6 H) 1.25 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.26 - 1.32 (m, 7 H) 1.35 - 1.36 (m, 3 H) 1.46 - 1.88 (m, 7 H) 2.01 - 2.06 (m, 1 H) 2.15 - 2.35 (m, 1 H) 2.26 - 2.30 (m, 3 H) 2.31 - 2.32 (m, 6 H) 2.36 - 2.52 (m, 2 H) 2.68 - 2.82 (m, 3 H) 3.04 (t, J=9.63 Hz, 1 H) 3.24 - 3.42 (m, 1 H) 3.26 - 3.28 (m, 3 H) 3.35 - 3.36 (m, 3 H) 3.42 - 3.49 (m, 1 H) 3.49 - 3.58 (m, 1 H) 3.59 - 3.81 (m, 3 H) 3.68 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 3.85 - 3.89 (m, 1 H) 4.02 - 4.09 (m, 1 H) 4.48 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.71 (s, 1 H) 4.89 - 4.93 (m, 1 H) 6.50 - 6.54 (m, 1 H) 6.78 (d, J=2.75 Hz, 1 H) 7.13 - 7.18 (m, 1 H) 7.39 - 7.43 (m, 1 H) 7.44 - 7.53 (m, 3 H)
218	Et	H	693.6	(600 MHz) : 0.86 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 0.97 - 1.25 (m, 8 H) 0.99 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.27 (s, 3 H) 1.42 - 1.66 (m, 3 H) 1.97 - 2.05 (m, 1 H) 2.25 (s, 3 H) 2.30 (s, 6 H) 2.44 - 2.64 (m, 3 H) 2.68 - 2.73 (m, 1 H) 2.75 - 2.81 (m, 1 H) 3.12 (s, 3 H) 3.21 (dd, J=10.09, 7.34 Hz, 1 H) 3.24 - 3.28 (m, 1 H) 3.33 - 3.39 (m, 1 H) 3.40 - 3.47 (m, 1 H) 3.72 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 3.87 - 3.96 (m, 2 H) 4.11 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.86 - 4.93 (m, 1 H) 5.11 (d, J=11.00 Hz, 1 H) 7.18 (dd, J=7.79, 4.13 Hz, 1 H) 7.36 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.66 (td, J=7.57, 1.83 Hz, 1 H) 8.52 (d, J=4.58 Hz, 1 H)
219		H	817.7	(500 MHz) : 1.04 - 1.09 (m, 6 H) 1.11 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.19 - 1.33 (m, 7 H) 1.21 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.45 - 1.74 (m, 3 H) 1.94 - 2.10 (m, 2 H) 2.13 - 2.23 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 (d, J=15.08 Hz, 1 H) 2.42 - 2.52 (m, 1 H) 2.57 - 2.67 (m, 1 H) 2.68 - 2.75 (m, 1 H) 2.78 - 2.85 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.87 Hz, 1 H) 3.14 - 3.36 (m, 2 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.39 - 3.60 (m, 4 H) 3.65 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 3.86 (d, J=6.03 Hz, 1 H) 3.95 - 4.05 (m, 1 H) 4.45 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.50 - 4.62 (m, 2 H) 4.73 - 4.86 (m, 2 H) 5.12 - 5.23 (m, 2 H) 5.29 (d, J=16.45 Hz, 1 H) 5.82 - 5.99 (m, 1 H)

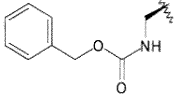
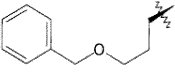
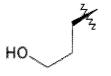
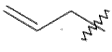
10

20

30

【 0 7 5 2 】

【表 6 - 3】

220		H	867.8	(600 MHz) : 1.01 - 1.08 (m, 6 H) 1.08 - 1.16 (m, 6 H) 1.18 - 1.56 (m, 4 H) 1.20 - 1.26 (m, 9 H) 1.29 (s, 3 H) 1.96 - 2.07 (m, 2 H) 2.13 - 2.17 (m, 6 H) 2.21 - 2.48 (m, 6 H) 2.58 - 2.84 (m, 2 H) 2.96 - 3.05 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.24 - 3.33 (m, 1 H) 3.31 - 3.32 (m, 3 H) 3.36 - 3.59 (m, 5 H) 3.65 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 3.82 - 3.87 (m, 1 H) 3.95 - 4.02 (m, 1 H) 4.46 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.77 - 4.87 (m, 2 H) 5.09 (d, J=4.58 Hz, 2 H) 5.16 (s, 1 H) 7.29 - 7.38 (m, 5 H)
221		H	852.7	(600 MHz) : 1.04 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.14 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 - 1.28 (m, 4 H) 1.23 (s, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 1.51 - 1.69 (m, 7 H) 1.90 - 1.96 (m, 1 H) 1.99 - 2.05 (m, 1 H) 2.10 (s, 3 H) 2.15 (d, J=10.55 Hz, 1 H) 2.29 (s, 6 H) 2.30 - 2.35 (m, 1 H) 2.37 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.43 - 2.52 (m, 1 H) 2.56 - 2.62 (m, 1 H) 2.65 - 2.74 (m, 2 H) 3.00 (t, J=9.86 Hz, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.26 - 3.33 (m, 2 H) 3.32 (s, 3 H) 3.42 - 3.49 (m, 2 H) 3.49 - 3.54 (m, 1 H) 3.54 - 3.60 (m, 1 H) 3.67 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 3.88 - 3.91 (m, 1 H) 3.99 - 4.02 (m, 1 H) 4.47 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.48 (s, 2 H) 4.88 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.88 - 4.94 (m, 1 H) 7.26 - 7.36 (m, 5 H)
222		H	762.7	(600 MHz) : 1.05 - 1.09 (m, 6 H) 1.12 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.17 - 1.29 (m, 7 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.50 - 1.74 (m, 7 H) 1.99 - 2.10 (m, 2 H) 2.16 (s, 3 H) 2.21 - 2.25 (m, 1 H) 2.30 (s, 6 H) 2.37 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.45 - 2.60 (m, 2 H) 2.68 - 2.74 (m, 1 H) 2.76 - 2.83 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.63 Hz, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.29 - 3.31 (m, 1 H) 3.32 (s, 3 H) 3.43 - 3.48 (m, 1 H) 3.49 - 3.54 (m, 1 H) 3.54 - 3.60 (m, 1 H) 3.61 - 3.70 (m, 3 H) 3.87 (d, J=5.50 Hz, 1 H) 3.97 - 4.04 (m, 1 H) 4.46 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.80 - 4.85 (m, 1 H) 4.87 (d, J=4.58 Hz, 1 H)
223	Et		772.8	(500 MHz) : 0.87 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.04 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.10 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.24 (d, 13 H) 1.58 (d, 5 H) 1.90 (d, J=14.53 Hz, 1 H) 2.00 - 2.05 (m, 1 H) 2.10 (s, 3 H) 2.27 (s, 6 H) 2.37 (d, J=15.29 Hz, 1 H) 2.42 - 2.49 (m, 1 H) 2.52 - 2.60 (m, 1 H) 2.65 - 2.74 (m, 2 H) 2.99 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.26 - 3.34 (m, 1 H) 3.32 (s, 3 H) 3.40 - 3.47 (m, 1 H) 3.47 - 3.60 (m, 2 H) 3.66 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 3.88 (d, J=3.06 Hz, 1 H) 3.96 - 4.05 (m, 1 H) 4.46 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.49 (d, J=4.59 Hz, 2 H) 4.74 - 4.86 (m, 1 H) 4.88 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.12 (d, J=9.94 Hz, 1 H) 5.25 (d, J=16.05 Hz, 1 H) 5.87 - 6.02 (m, 1 H)

【 0 7 5 3 】

10

20

30

【表 6 - 4】

224	Et			(600 MHz) : 0.87 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 1.06 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.12 (m, 1 H) 1.16 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.27 (s, 3 H) 1.54 - 1.67 (m, 5 H) 1.90 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 1.99 - 2.04 (m, 1 H) 2.10 (s, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.45 - 2.51 (m, 1 H) 2.55 - 2.61 (m, 1 H) 2.72 (s, 2 H) 2.95 - 3.02 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.30 - 3.31 (m, 1 H) 3.32 (s, 3 H) 3.41 - 3.45 (m, 1 H) 3.47 - 3.57 (m, 2 H) 3.67 - 3.68 (m, 1 H) 3.86 - 3.90 (m, 1 H) 3.98 - 4.02 (m, 1 H) 4.03 - 4.10 (m, 2 H) 4.47 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.81 - 4.84 (m, 1 H) 4.89 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
225	Et		866.8	(500 MHz) : 0.87 (t, J=7.54 Hz, 3 H) 1.04 (d, J=6.58 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.21 - 1.31 (m, 1 H) 1.21 - 1.24 (m, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (s, 3 H) 1.52 - 1.66 (m, 5 H) 1.92 (d, J=14.54 Hz, 1 H) 2.01 - 2.07 (m, 1 H) 2.11 (s, 3 H) 2.13 - 2.22 (m, 1 H) 2.27 (s, 6 H) 2.38 (d, J=15.08 Hz, 1 H) 2.42 - 2.51 (m, 1 H) 2.52 - 2.61 (m, 1 H) 2.65 - 2.75 (m, 2 H) 2.95 - 3.03 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.25 - 3.36 (m, 1 H) 3.32 (s, 3 H) 3.38 - 3.47 (m, 1 H) 3.47 - 3.58 (m, 2 H) 3.62 - 3.75 (m, 3 H) 3.89 (d, J=5.48 Hz, 1 H) 3.96 - 4.05 (m, 1 H) 4.12 - 4.22 (m, 2 H) 4.46 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.50 - 4.58 (m, 2 H) 4.78 - 4.86 (m, 1 H) 4.89 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 7.21 - 7.35 (m, 5 H)
226	Et		776.8	(500 MHz) : 0.88 (t, J=7.54 Hz, 3 H) 1.05 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.18 - 1.36 (m, 13 H) 1.46 - 1.74 (m, 5 H) 1.80 - 1.87 (m, 1 H) 1.96 - 2.03 (m, 1 H) 2.08 (s, 3 H) 2.14 (d, J=10.97 Hz, 1 H) 2.31 (s, 6 H) 2.37 (d, J=15.36 Hz, 1 H) 2.42 - 2.56 (m, 1 H) 2.58 - 2.65 (m, 1 H) 2.65 - 2.74 (m, 2 H) 3.01 (t, J=9.19 Hz, 1 H) 3.26 (s, 3 H) 3.28 - 3.34 (m, 1 H) 3.32 (s, 3 H) 3.42 - 3.59 (m, 3 H) 3.62 - 3.66 (m, 1 H) 3.73 - 3.85 (m, 2 H) 3.87 - 3.92 (m, 1 H) 3.95 - 4.03 (m, 1 H) 4.13 (t, J=4.25 Hz, 2 H) 4.47 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.79 - 4.86 (m, 1 H) 4.88 (d, J=4.39 Hz, 1 H)
227	Et		803.8	(500 MHz) : 0.87 (t, J=7.54 Hz, 3 H) 1.05 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.06 - 1.10 (m, 6 H) 1.15 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.18 - 1.30 (m, 13 H) 1.51 - 1.81 (m, 5 H) 1.84 - 1.95 (m, 1 H) 1.97 - 2.08 (m, 1 H) 2.11 (s, 3 H) 2.15 (d, J=9.87 Hz, 1 H) 2.23 - 2.34 (m, 12 H) 2.38 (d, J=15.63 Hz, 1 H) 2.42 - 2.51 (m, 1 H) 2.52 - 2.76 (m, 5 H) 3.00 (t, J=10.56 Hz, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.27 - 3.35 (m, 1 H) 3.33 (s, 3 H) 3.40 - 3.47 (m, 1 H) 3.47 - 3.57 (m, 2 H) 3.67 (d, J=6.86 Hz, 1 H) 3.88 (d, J=6.58 Hz, 1 H) 3.94 - 4.05 (m, 1 H) 4.07 - 4.19 (m, 2 H) 4.47 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.77 - 4.86 (m, 1 H) 4.89 (d, J=4.66 Hz, 1 H)

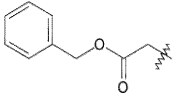
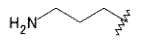
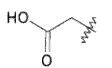
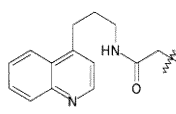
10

20

30

【 0 7 5 4】

【表 6 - 5】

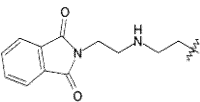
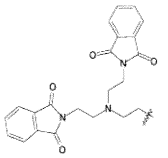
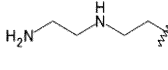
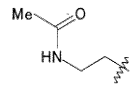
228	Et		880.8	(500 MHz) : 0.87 (t, J=7.54 Hz, 3 H) 1.01 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.20 - 1.30 (m, 1 H) 1.23 (s, 3 H) 1.25 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.28 (s, 3 H) 1.49 - 1.72 (m, 5 H) 1.93 - 2.08 (m, 2 H) 2.10 (s, 3 H) 2.16 (d, J=10.42 Hz, 1 H) 2.30 (br. s., 6 H) 2.37 (d, J=14.81 Hz, 1 H) 2.43 - 2.59 (m, 2 H) 2.64 - 2.75 (m, 2 H) 3.00 (t, J=9.87 Hz, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.27 - 3.35 (m, 1 H) 3.32 (s, 3 H) 3.37 - 3.45 (m, 1 H) 3.46 - 3.57 (m, 2 H) 3.66 (d, J=6.86 Hz, 1 H) 3.89 (d, J=5.48 Hz, 1 H) 3.96 - 4.05 (m, 1 H) 4.46 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.59 (d, J=3.29 Hz, 2 H) 4.76 - 4.86 (m, 1 H) 4.89 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 5.12 - 5.21 (m, 2 H) 7.27 - 7.37 (m, 5 H)
229	Et		789.8	(500 MHz) : 0.88 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.04 - 1.10 (m, 6 H) 1.11 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.19 - 1.38 (m, 13 H) 1.51 - 1.61 (m, 3 H) 1.61 - 1.72 (m, 2 H) 1.74 - 1.82 (m, 2 H) 1.86 - 1.93 (m, 1 H) 2.01 - 2.07 (m, 1 H) 2.14 (s, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (d, J=15.29 Hz, 1 H) 2.44 - 2.52 (m, 1 H) 2.53 - 2.60 (m, 1 H) 2.66 - 2.75 (m, 2 H) 2.77 - 2.84 (m, 2 H) 3.00 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.26 - 3.34 (m, 1 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.40 (m, 1 H) 3.40 - 3.47 (m, 1 H) 3.47 - 3.57 (m, 1 H) 3.67 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 3.89 (d, J=6.12 Hz, 1 H) 3.97 - 4.04 (m, 1 H) 4.04 - 4.11 (m, 2 H) 4.45 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.77 - 4.86 (m, 1 H) 4.90 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
230	Et		790.7	(600 MHz) : 0.86 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 1.05 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.13 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.19 - 1.36 (m, 13 H) 1.48 - 1.59 (m, 3 H) 1.72 - 1.87 (m, 2 H) 1.89 - 1.97 (m, 1 H) 1.99 - 2.06 (m, 1 H) 2.16 (s, 6 H) 2.35 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.49 - 2.59 (m, 1 H) 2.54 (s, 3 H) 2.67 - 2.77 (m, 2 H) 2.83 - 2.92 (m, 1 H) 2.99 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.26 - 3.43 (m, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.49 - 3.58 (m, 1 H) 3.61 - 3.64 (m, 1 H) 3.86 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 3.93 - 4.02 (m, 1 H) 4.40 - 4.52 (m, 3 H) 4.80 - 4.86 (m, 1 H) 4.87 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
231	Et		958.6	(500 MHz) : 0.84 (t, J=7.54 Hz, 3 H) 1.04 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.21 - 1.30 (m, 7 H) 1.31 (s, 3 H) 1.45 - 1.71 (m, 5 H) 1.94 - 2.20 (m, 8 H) 2.20 - 2.34 (m, 7 H) 2.37 (d, J=20.02 Hz, 1 H) 2.41 - 2.51 (m, 1 H) 2.72 - 2.77 (m, 2 H) 2.98 - 3.03 (m, 1 H) 3.09 - 3.13 (m, 2 H) 3.16 - 3.27 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.34 - 3.60 (m, 5 H) 3.68 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 3.83 (d, J=5.76 Hz, 1 H) 3.96 - 4.04 (m, 1 H) 4.45 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.51 (d, J=2.47 Hz, 2 H) 4.66 - 4.77 (m, 1 H) 4.90 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 6.52 - 6.60 (m, 1 H) 7.27 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 7.51 - 7.58 (m, 1 H) 7.69 (t, J=7.68 Hz, 1 H) 8.02 (d, J=9.87 Hz, 1 H) 8.09 (d, J=9.05 Hz, 1 H) 8.80 (d, J=4.39 Hz, 1 H)

10

20

30

【表 6 - 6】

232	Et		948.9	(500 MHz) : 0.88 (t, J=7.65 Hz, 3 H) 1.04 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.06 - 1.10 (m, 6 H) 1.16 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.20 - 1.31 (m, 13 H) 1.49 - 1.72 (m, 5 H) 1.86 - 1.95 (m, 1 H) 1.99 - 2.07 (m, 1 H) 2.10 (s, 3 H) 2.15 (d, J=10.70 Hz, 1 H) 2.29 (br. s., 6 H) 2.38 (d, J=15.29 Hz, 1 H) 2.41 - 2.52 (m, 1 H) 2.53 - 2.61 (m, 1 H) 2.66 - 2.75 (m, 2 H) 2.88 - 2.96 (m, 4 H) 3.00 (t, J=9.94 Hz, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.28 - 3.36 (m, 1 H) 3.33 (s, 3 H) 3.38 - 3.44 (m, 1 H) 3.44 - 3.58 (m, 2 H) 3.66 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 3.79 (t, J=6.50 Hz, 2 H) 3.89 (d, J=3.82 Hz, 1 H) 3.97 - 4.04 (m, 1 H) 4.04 - 4.12 (m, 2 H) 4.46 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.75 - 4.86 (m, 1 H) 4.89 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 7.69 (dd, J=5.35, 3.06 Hz, 2 H) 7.83 (dd, J=5.35, 3.06 Hz, 2 H)
233	Et		1122.0	(600 MHz) : 0.84 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 1.13 (m, 22 H) 1.13 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.46 - 1.61 (m, 5 H) 1.75 - 2.38 (m, 13 H) 2.39 - 2.62 (m, 2 H) 2.62 - 2.71 (m, 2 H) 2.79 - 2.94 (m, 6 H) 2.98 (t, J=9.40 Hz, 1 H) 3.15 (s, 3 H) 3.23 - 3.56 (m, 4 H) 3.29 (s, 3 H) 3.61 - 3.63 (m, 1 H) 3.69 (t, J=6.88 Hz, 4 H) 3.81 - 3.87 (m, 1 H) 3.91 - 4.03 (m, 3 H) 4.40 - 4.48 (m, 1 H) 4.73 - 4.82 (m, 1 H) 4.86 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 7.59 - 7.66 (m, 4 H) 7.66 - 7.72 (m, 4 H)
234	Et		818.8	(500 MHz) : 0.88 (t, J=7.45 Hz, 3 H) 1.03 - 1.10 (m, 6 H) 1.11 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.20 - 1.33 (m, 7 H) 1.22 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 1.50 - 1.60 (m, 3 H) 1.61 - 1.69 (m, 2 H) 1.73 - 2.08 (m, 2 H) 2.13 (s, 3 H) 2.30 (s, 6 H) 2.38 (d, J=14.91 Hz, 1 H) 2.44 - 2.51 (m, 1 H) 2.52 - 2.60 (m, 1 H) 2.67 - 2.79 (m, 4 H) 2.79 - 2.85 (m, 2 H) 2.85 - 2.97 (m, 2 H) 3.00 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.26 - 3.34 (m, 1 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.60 (m, 3 H) 3.67 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 3.89 (d, J=5.73 Hz, 1 H) 3.97 - 4.05 (m, 1 H) 4.11 - 4.17 (m, 2 H) 4.45 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.77 - 4.87 (m, 1 H) 4.90 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
235	Et		817.9	(500 MHz) : 0.88 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.04 - 1.10 (m, 6 H) 1.11 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.19 - 1.38 (m, 13 H) 1.51 - 1.61 (m, 3 H) 1.61 - 1.72 (m, 2 H) 1.74 - 1.82 (m, 2 H) 1.86 - 1.93 (m, 1 H) 2.01 - 2.07 (m, 1 H) 2.14 (s, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (d, J=15.29 Hz, 1 H) 2.44 - 2.52 (m, 1 H) 2.53 - 2.60 (m, 1 H) 2.66 - 2.75 (m, 2 H) 2.77 - 2.84 (m, 2 H) 3.00 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.26 - 3.34 (m, 1 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.40 (m, 1 H) 3.40 - 3.47 (m, 1 H) 3.47 - 3.57 (m, 1 H) 3.67 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 3.89 (d, J=6.12 Hz, 1 H) 3.97 - 4.04 (m, 1 H) 4.04 - 4.11 (m, 2 H) 4.45 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.77 - 4.86 (m, 1 H) 4.90 (d, J=4.59 Hz, 1 H)

【 0 7 5 6 】

実施例 2 1 4

実施例 1 7 6 で得られた化合物285mgをメタノール10mlに溶解し、イミダゾール163mg、ヒドロキシルアミン塩酸塩138mgを加えて加熱還流下4時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に酢酸エチルと飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液し、有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=20:1:0.1から10:1:0.1）にて精製して表 6 で示される化合物160mgを得た。

【 0 7 5 7 】

実施例 2 1 5

実施例 1 7 7 で得られた化合物25mgを原料として実施例 2 1 4 と同様の方法にて表 6 で示される化合物5.0mgを得た。

【 0 7 5 8 】

実施例 2 1 6

実施例 1 8 0 で得られた化合物50mgを原料として実施例 2 1 4 と同様の方法にて表 6 で示される化合物35.6mgを得た。

【 0 7 5 9 】

10

20

30

40

50

実施例 2 1 7

(1) 実施例 1 で得られた化合物 1.58g、参考例 1 5 で得られた化合物 1.36g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3)、実施例 2 3 (2) と同様の方法にてビアリール体 0.81 g を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 0.8g を原料として実施例 1 2 6 (1)、実施例 1 7 6、実施例 2 1 4 と同様の方法にて表 6 で示される化合物 154mg を得た。

【0 7 6 0】

実施例 2 1 8

実施例 1 7 6 (4) で得られた化合物 100mg を 1 規定塩酸 2ml、エタノール 1ml に溶解し、50℃にて 5 時間攪拌した。反応液を 1 規定水酸化ナトリウム水溶液で中和後、クロロホルムにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過し、減圧濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1) にて精製して得られた化合物 50mg を原料として実施例 1 1 2 (2)、実施例 2 1 4 と同様の方法にて表 6 で示される化合物 12.4mg を得た。

【0 7 6 1】

実施例 2 1 9

(1) 実施例 7 0 (1) で得られた化合物 606mg を原料として実施例 1 2 6 (1) と同様の方法にて 4''-ヒドロキシ体 401mg を得た。

【0 7 6 2】

(2) 上記 (1) で得られた化合物 394mg をクロロホルム 5ml に溶解し、氷冷下、ピリジン 5ml、4-ジメチルアミノピリジン 93.2mg、無水酢酸 108 μ l を加えて室温にて 18 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:アセトン=8:1) にて精製した。再度、精製した化合物 372mg をピリジン 7ml に溶解し、氷冷下、4-ジメチルアミノピリジン 93.2mg、無水酢酸 0.32ml を加えて室温にて 18 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:アセトン=8:1) にて精製して 4''-O-アセチル体 336mg を得た。

【0 7 6 3】

(3) 上記 (2) で得られた化合物 323mg を原料として実施例 7 (4)、実施例 1 7 6 (3)、(4)、実施例 1 2 5 (3)、実施例 2 1 4 と同様の方法にて 9-オキシム体を得た。

【0 7 6 4】

(4) 上記 (3) で得られた化合物 22.0mg をメタノール 1.5ml、テトラヒドロフラン 0.5ml に溶解し、氷冷下、ナトリウムメトキシド 6.92mg を加えて 50℃にて 6 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に飽和塩化アンモニウム水溶液、酢酸エチルを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1) にて精製して表 6 で示される化合物 14.0mg を得た。

【0 7 6 5】

実施例 2 2 0

実施例 1 7 (2) で得られた化合物 70mg を原料として実施例 2 1 9 (実施例 1 2 6 (1)、2 1 9 (2)、実施例 7 (4)、実施例 1 7 6 (3)、(4)、実施例 1 2 5 (3)、実施例 2 1 4、実施例 2 1 9 (4)) と同様の方法にて表 6 で示される化合物 0.84mg を得た。

【0 7 6 6】

実施例 2 2 1

(1) 実施例 1 で得られた化合物 3.0g、文献 (European Journal of Organic Chemistry, 2000 年, 1219 ページ) に記載の方法にて得られた 2-[3-(ベンジルオキシ)プロピル]オキシラン 3.48g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 401mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 114mg を原料として実施例 2 1 9 (実施例 1 2 6 (1

10

20

30

40

50

)、219(2)、実施例7(4)、実施例176(3)、(4)、実施例125(3)、実施例214、実施例219(4))と同様の方法にて表6で示される化合物14.6mgを得た。

【0767】

実施例222

実施例221で得られた化合物14.6mgを原料として実施例73と同様の方法にて表6で示される化合物3.7mgを得た。

【0768】

実施例223

(1) 実施例176(4)で得られた化合物381mgを原料として実施例214と同様の方法にて9-オキシム体299mg得られた。

10

(2) 上記(1)で得られた化合物217mgをテトラヒドロフラン5mlに溶解し、アシルブロミド33 μ l、水酸化カリウム70.1mgを加えて室温にて18時間攪拌した。さらにアシルブロミド7 μ l、水酸化カリウム14.1mgを加えて室温にて18時間攪拌した。さらにアシルブロミド7 μ l、水酸化カリウム14.1mgを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン=8:1)にて精製して表6で示される化合物80mgを得た。

【0769】

実施例224

実施例214で得られた化合物48.4mgをテトラヒドロフラン3mlに溶解し、2-ブロモエチルアミン臭化水素酸塩40.6mg、水酸化カリウム37.1mg、18-クラウン-6-エーテル175mgを加えて室温にて1時間攪拌した。反応液に飽和食塩水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=9:1:0から10:1:0.1)にて精製して表6で示される化合物34.1mgを得た。

20

【0770】

実施例225

実施例214で得られた化合物50.8mg、ベンジル2-ブロモエチルエーテル44.8mgを原料として実施例224と同様の方法にて表6で示される化合物22.7mgを得た。

30

【0771】

実施例226

実施例225で得られた化合物5.6mgを原料として実施例43と同様の方法にて表6で示される化合物4.7mgを得た。

【0772】

実施例227

実施例224で得られた化合物8.4mgを原料として実施例7(2)と同様の方法にて表6で示される化合物5.9mgを得た。

【0773】

実施例228

実施例214で得られた化合物78.7mg、ベンジルブロモアセテート74.0mgを原料として実施例224と同様の方法にて表6で示される化合物5.8mgを得た。

40

【0774】

実施例229

実施例214で得られた化合物18.6mg、3-ブロモピロピルアミン臭化水素酸塩16.7mgを原料として実施例224と同様の方法にて表6で示される化合物10.2mgを得た。

【0775】

実施例230

実施例214で得られた化合物78.7mg、ベンジルブロモアセテート74.0mgを原料として実施例224と同様の方法にて表6で示される化合物25.4mgを得た。

50

【0776】

実施例231

実施例230で得られた化合物12.1mgをクロロホルムに溶解し、氷冷下、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩14.7mg、特許文献（特開2005-200318号公報）に記載の方法にて得られた4-(3-アミノプロピル)-キノリン14.3mgを加えて室温にて4時間攪拌した。反応液にクロロホルムと飽和食塩水を加えて分液して、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10：1：0から10：1：0.1）と分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10：1：0.1）にて精製して表6で示される化合物1.7mgを得た。

10

【0777】

実施例232

実施例224で得られた化合物16.8mg、フタルイミドアセトアルデヒド4.5mgを原料として実施例7（2）と同様の方法にて表6で示される化合物12.0mgを得た。

【0778】

実施例233

実施例224で得られた化合物16.8mg、フタルイミドアセトアルデヒド4.5mgを原料として実施例7（2）と同様の方法にて表6で示される化合物1.7mgを得た。

【0779】

実施例234

実施例232で得られた化合物12.0mgをエタノール1mlに溶解し、氷冷下、ヒドラジン－水和物0.64mgを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10：1：0.1）にて精製して表6で示される化合物5.4mgを得た。

20

【0780】

実施例235

（1）実施例224で得られた化合物8.4mgを原料として実施例176（3）と同様の方法にてジアセチル体7.7mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物6.9mgをメタノール1mlに溶解し、室温にて24時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10：1：0.1）にて精製して表6で示される化合物3.2mgを得た。

30

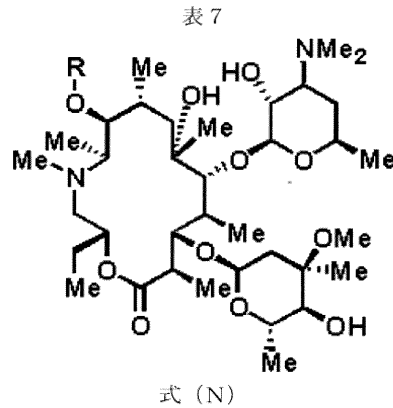
【0781】

実施例236～239の合成

表7で規定したRをもつ、式（N）で示される化合物の製造法を以下に示す。

【0782】

【表 7】



実施例	R	ESI MS (M+H)	¹ H-NMR, CDCl ₃ , δ (ppm)
236		882.8	(500 MHz) : 0.85 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 0.88 – 1.31 (m, 25 H) 1.45 – 1.65 (m, 5 H) 1.87 – 1.97 (m, 1 H) 1.97 – 2.15 (m, 1 H) 2.08 (s, 3 H) 2.20 – 2.45 (m, 2 H) 2.24 (s, 6 H) 2.46 – 2.63 (m, 3 H) 2.68 – 2.79 (m, 1 H) 2.89 – 2.96 (m, 1 H) 2.97 – 3.05 (m, 1 H) 3.32 (s, 11 H) 3.91 – 4.04 (m, 1 H) 4.09 – 4.20 (m, 2 H) 4.49 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.72 – 4.85 (m, 2 H) 5.02 (d, J=13.00 Hz, 1 H) 5.16 (d, J=13.00 Hz, 1 H) 6.76 (br. s., 1 H) 7.20 – 7.44 (m, 5 H)
237		839.7	(600 MHz) : 0.86 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.97 – 1.29 (m, 25 H) 1.47 – 1.69 (m, 5 H) 1.87 – 1.99 (m, 1 H) 2.07 – 2.20 (m, 1 H) 2.12 (s, 3 H) 2.22 – 2.62 (m, 6 H) 2.29 (s, 6 H) 2.71 – 2.82 (m, 1 H) 2.94 – 3.05 (m, 2 H) 3.26 – 3.68 (m, 6 H) 3.33 (s, 3 H) 3.94 – 4.18 (m, 3 H) 4.48 – 4.58 (m, 3 H) 4.75 – 4.87 (m, 2 H) 7.21 – 7.36 (m, 5 H)
238		748.7	(600 MHz) : 0.80 – 1.34 (m, 28 H) 1.50 – 1.70 (m, 5 H) 1.84 – 2.21 (m, 2 H) 2.16 (s, 3 H) 2.24 – 2.64 (m, 7 H) 2.29 (s, 6 H) 2.72 – 3.08 (m, 4 H) 3.18 – 3.60 (m, 4 H) 3.34 (s, 3 H) 3.78 – 4.16 (m, 4 H) 4.50 – 4.59 (m, 1 H) 4.74 – 4.86 (m, 2 H)
239		749.7	(600 MHz) : 0.86 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 0.94 – 1.36 (m, 25 H) 1.47 – 1.67 (m, 5 H) 1.87 – 1.96 (m, 1 H) 2.04 – 2.17 (m, 1 H) 2.09 (s, 3 H) 2.23 – 2.41 (m, 8 H) 2.47 – 2.63 (m, 3 H) 2.69 – 2.78 (m, 1 H) 2.91 – 2.97 (m, 1 H) 3.00 – 3.07 (m, 1 H) 3.24 – 3.39 (m, 1 H) 3.34 (s, 3 H) 3.43 – 3.67 (m, 5 H) 3.79 – 3.86 (m, 1 H) 3.95 – 4.04 (m, 1 H) 4.10 – 4.41 (m, 3 H) 4.56 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.74 – 4.85 (m, 2 H)

【 0 7 8 3 】

実施例 2 3 6

実施例 4 で得られた化合物 225mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 7 で示される化合物 16mg を得た。

【 0 7 8 4 】

実施例 2 3 7

実施例 5 で得られた化合物 180mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 7 で示される化合物 16mg を得た。

【 0 7 8 5 】

実施例 2 3 8

実施例 2 3 6 で得られた化合物 24mg をメタノール 0.3ml に溶解し、5% パラジウム-炭素 4mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて攪拌した。反応液をセライト濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (NH 型、アセトン:ヘキサン:トリエチルアミン=10:40:0.2) にて精製して表 7 で示される化合物 8.7mg を得た。

【 0 7 8 6 】

実施例 2 3 9

10

20

30

40

50

実施例 2 3 7 で得られた化合物 11mg をメタノール 0.1ml に溶解し、20%水酸化パラジウム-炭素 2mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 6 時間攪拌した。反応液をセライト濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をメタノール 0.1ml に溶解し、20%水酸化パラジウム-炭素 2mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 17 時間攪拌した。反応液をセライト濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をメタノール 0.1ml に溶解し、20%水酸化パラジウム-炭素 2mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 6 時間攪拌した。反応液をセライト濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)にて精製して表 7 で示される化合物 1.7mg を得た。

【0 7 8 7】

10

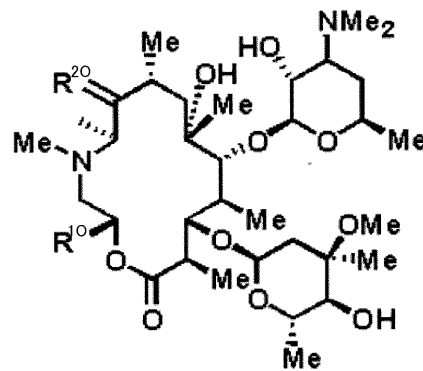
実施例 2 4 0 ~ 2 4 3 の合成

表 8 で規定した R^{10} 、及び R^{20} をもつ、式 (O) で示される化合物の製造法を以下に示す。

【0 7 8 8】

【表 8】

表 8



式 (O)

実施例	R ¹⁰	R ²⁰	ESI MS (M+H)	¹ H-NMR, CDCl ₃ , δ (ppm)
240	H		675.3	(500 MHz) : 0.93 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.01 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.21 - 1.31 (m, 1 H) 1.23 (s, 3 H) 1.27 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.29, 4.59 Hz, 1 H) 1.61 - 1.73 (m, 2 H) 1.80 (t, J=12.61 Hz, 1 H) 1.98 - 2.08 (m, 1 H) 2.10 - 2.16 (m, 2 H) 2.30 (s, 6 H) 2.34 - 2.40 (m, 1 H) 2.37 (s, 3 H) 2.42 - 2.53 (m, 1 H) 2.60 (q, J=6.88 Hz, 1 H) 2.67 - 2.76 (m, 1 H) 2.77 - 2.86 (m, 1 H) 2.99 (t, J=9.94 Hz, 1 H) 3.06 - 3.15 (m, 1 H) 3.19 - 3.26 (m, 1 H) 3.34 (s, 3 H) 3.44 - 3.52 (m, 1 H) 3.63 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 3.76 (t, J=11.09 Hz, 1 H) 3.96 - 4.04 (m, 1 H) 4.05 - 4.08 (m, 1 H) 4.41 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.47 (d, J=11.47 Hz, 1 H) 4.72 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
241	H		690.3	(300 MHz) : 0.98 - 1.12 (m, 9 H) 1.20 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.21 - 1.32 (m, 1 H) 1.22 - 1.25 (m, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.30 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.37 (s, 3 H) 1.48 - 2.06 (m, 5 H) 2.26 (s, 3 H) 2.30 (s, 6 H) 2.31 - 2.53 (m, 2 H) 2.64 - 2.83 (m, 2 H) 2.84 - 2.95 (m, 1 H) 2.96 - 3.06 (m, 1 H) 3.27 (dd, J=10.26, 7.31 Hz, 1 H) 3.31 (s, 3 H) 3.42 - 3.58 (m, 3 H) 3.74 - 3.89 (m, 1 H) 3.95 - 4.13 (m, 2 H) 4.27 - 4.39 (m, 2 H) 4.43 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.77 (d, J=4.51 Hz, 1 H)
242	Et		718.6	(500 MHz) : 0.88 (t, J=7.55 Hz, 3 H) 0.99 - 1.37 (m, 25 H) 1.48 - 1.68 (m, 5 H) 1.90 - 1.96 (m, 1 H) 2.08 - 2.37 (m, 3 H) 2.18 (s, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.40 - 2.49 (m, 1 H) 2.53 - 2.77 (m, 3 H) 2.95 - 3.03 (m, 1 H) 3.21 - 3.69 (m, 5 H) 3.30 (s, 3 H) 3.73 - 3.84 (m, 1 H) 3.94 - 4.03 (m, 1 H) 4.05 - 4.13 (m, 1 H) 4.42 (d, J=7.20 Hz, 1 H) 4.76 - 4.81 (m, 1 H) 5.00 - 5.08 (m, 1 H) 5.15 (br. s., 1 H)
243	Et		761.6	(600 MHz) : 0.88 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 0.91 - 1.40 (m, 25 H) 1.47 - 1.58 (m, 3 H) 1.60 - 1.68 (m, 1 H) 1.89 - 1.98 (m, 2 H) 2.08 - 2.37 (m, 3 H) 2.21 (s, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.41 - 2.48 (m, 1 H) 2.52 - 2.58 (m, 1 H) 2.66 - 2.82 (m, 4 H) 2.85 - 3.03 (m, 3 H) 3.20 - 3.52 (m, 4 H) 3.30 (s, 3 H) 3.63 (s, 1 H) 3.77 - 3.86 (m, 1 H) 3.95 - 4.11 (m, 3 H) 4.42 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.76 - 4.82 (m, 1 H) 5.01 - 5.10 (m, 1 H)

【 0 7 8 9 】

実施例 2 4 0

(1) 実施例 2 で得られた化合物 30g をトルエン 700ml に溶解し、トリエチルアミン 51ml、2-ブロモエチルアルコール 22ml を加えて 80℃ にて 4 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=9:1:0.1) にて精製して 10a-N-(2-ヒドロキシエチル) 体 19.4g を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 19.4g を原料として実施例 7 (2)、(3) と同様の方法にて環化体 3.0g を得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物0.67gを原料として実施例126(1)と同様の方法にて4''-ヒドロキシ体0.52gを得た。

【0790】

(4) 上記(3)で得られた化合物0.5gをテトラヒドロフラン5mlに溶解し、炭酸カリウム0.3g、N,N'-カルボニルジイミダゾール0.27gを加えて室温にて80分間攪拌後、さらに炭酸カリウム0.3g、N,N'-カルボニルジイミダゾール0.27gを加えて室温にて30分間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣を酢酸エチルにて希釈して飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水にて順次洗浄後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をテトラヒドロフラン5mlに溶解し、水素化ナトリウム29mg、ベンジルアルコール0.11mlのテトラヒドロフラン溶液5mlを加えて室温にて30分間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2)にて精製して4''-O-ベンジルオキシカルボニル体0.35gを得た。

10

【0791】

(5) 上記(4)で得られた化合物0.35gを原料として実施例7(4)、実施例176(3)と同様の方法にて2'-アセチル体105mgを得た。

(6) 上記(5)で得られた化合物50mgを原料として実施例176(4)、(5)と同様の方法にて表8で示される化合物17mgを得た。

20

【0792】

実施例241

実施例240で得られた化合物23mgをメタノール1mlに溶解し、50%ヒドロキシアミン水溶液30 μ l、酢酸15 μ lを加えて50℃にて40時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと0.5規定水酸化ナトリウム水溶液を加えて分液し、有機層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=9:1:0.1)にて精製して表8で示される化合物6.5mgを得た。

【0793】

実施例242

30

(1) 実施例206(3)で得られた化合物100mgを原料として実施例214と同様の方法にて9-オキシム体56mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物20mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表8で示される化合物7mgを得た。

【0794】

実施例243

(1) 実施例242(1)で得られた化合物29mgを原料として実施例224と同様の方法にてアミノエチル体14mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物14mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表8で示される化合物8mgを得た。

40

【0795】

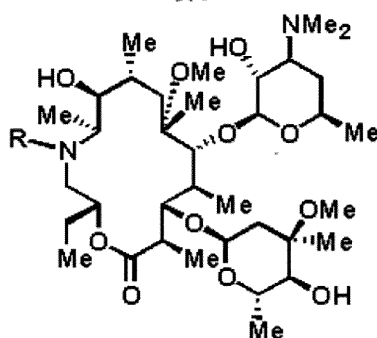
実施例244～247の合成

表9で規定したRをもつ、式(P)で示される化合物の製造法を以下に示す

【0796】

【表 9】

表 9



式 (P)

実施例	R	ESI MS (M+H)	¹ H-NMR, CDCl ₃ , δ (ppm)
244	H	705.4	
245	Et	733.4	(600 MHz) : 0.76 – 0.83 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.97 (t, J=7.79 Hz, 2 H) 0.99 – 1.36 (m, 4 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.29 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 2 H) 1.69 – 1.77 (m, 1 H) 1.77 – 1.87 (m, 1 H) 2.21 – 2.40 (m, 12 H) 2.46 – 2.58 (m, 1 H) 2.59 – 2.70 (m, 1 H) 2.77 – 2.86 (m, 1 H) 2.91 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.86 Hz, 1 H) 3.14 – 3.25 (m, 1 H) 3.15 – 3.25 (m, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.38 – 3.50 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.02 – 4.09 (m, 1 H) 4.15 – 4.22 (m, 1 H) 4.37 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.50 – 4.62 (m, 1 H) 4.95 (d, J=4.13 Hz, 1 H)
246		745.4	(600 MHz) : 0.66 (t, J=8.02 Hz, 3 H) 0.75 – 0.82 (m, 6 H) 0.89 – 0.96 (m, 5 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.14 – 1.17 (m, 3 H) 1.17 – 1.24 (m, 5 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=14.90, 4.81 Hz, 1 H) 1.60 – 1.87 (m, 2 H) 2.19 – 2.40 (m, 10 H) 2.45 – 2.66 (m, 2 H) 2.78 – 2.85 (m, 1 H) 2.93 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.17 Hz, 1 H) 3.21(s, 3 H) 3.13 – 3.26 (m, 1 H) 3.32(s, 3 H) 3.29 – 3.33 (m, 2 H) 3.40 – 3.51 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.01 – 4.08 (m, 1 H) 4.15 – 4.21 (m, 1 H) 4.37 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.55 – 4.66 (m, 1 H) 4.95 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.10 (m, 2 H) 5.78 – 5.88 (m, 1 H)
247		795.4	(600 MHz) : 0.53 – 0.69 (m, 3 H) 0.78 – 0.83 (m, 3 H) 0.84 – 0.90 (m, 3 H) 0.91 – 0.99 (m, 2 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.18 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.19 – 1.25 (m, 8 H) 1.29 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.64 (d, J=11.46 Hz, 1 H) 1.75 – 1.92 (m, 1 H) 2.16 – 2.32 (m, 9 H) 2.36 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.42 – 2.51 (m, 2 H) 2.81 – 2.88 (m, 1 H) 2.98 – 3.04 (m, 2 H) 3.16 – 3.21 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.41 – 3.49 (m, 1 H) 3.51 – 3.59 (m, 1 H) 3.65 (d, J=13.76 Hz, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.76 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 4.01 – 4.09 (m, 1 H) 4.17 – 4.22 (m, 1 H) 4.36 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.61 – 4.70 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 7.22 (t, J=7.34 Hz, 1 H) 7.30 (t, J=7.57 Hz, 2 H) 7.35 (d, 2 H)

【0797】

実施例 244

(1) 実施例 1 で得られた化合物 1.0g をクロロホルム 5ml に溶解し、ベンズアルデヒド 107 mg、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム 322mg を加えて室温にて 18 時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール : 28% アンモニア水 = 30 : 1 : 0.1) にて精製して 10a-N-ベンジル体 717mg を得た。

【0798】

(2) 上記 (1) で得られた化合物 710mg を原料として実施例 7 (1)、(3) と同様の方法にて環化体 35mg を得た。

【0799】

(3) 上記 (2) で得られた化合物 30mg を原料として実施例 7 (4)、実施例 73 と同様の方法にて表 9 で示される化合物 1.7mg を得た。

【0800】

実施例245

(1) 実施例1で得られた化合物5.03g、(S)-1,2-エポキシブタンを原料として実施例7(1)と同様の方法にて付加体2.39gを得た。

【0801】

(2) 上記(1)で得られた化合物2.39g、トリフェニルホスフィン2.36gをテトラヒドロフラン36mlに溶解し、40%ジイソプロピルアゾジカルボキシラートトルエン溶液4.7mlを加えて室温にて5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣に蒸留水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=90:5:0.1から45:5:0.1)にて精製して環化体0.63gを得た。

10

【0802】

(3) 上記(2)で得られた化合物50mg、アセトアルデヒドを原料として実施例7(2)と同様の方法にてエチル体24mgを得た。

【0803】

(4) 上記(3)で得られた化合物24mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表9で示される化合物10mgを得た。

【0804】

実施例246

(1) 実施例245(2)で得られた化合物70mgをジメチルホルムアミド1mlに溶解し、アリルブロミド116mg、炭酸カリウム186mgを加えて室温にて21時間攪拌した。反応液に蒸留水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=50:1:0.1)にて精製してアリル体21mgを得た。

20

(2) 上記(1)で得られた化合物21mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表9で示される化合物5mgを得た。

【0805】

実施例247

実施例245(2)で得られた化合物48mg、ベンジルブロミドを原料として実施例246(1)、実施例7(4)と同様の方法にて表9で示される化合物5mgを得た。

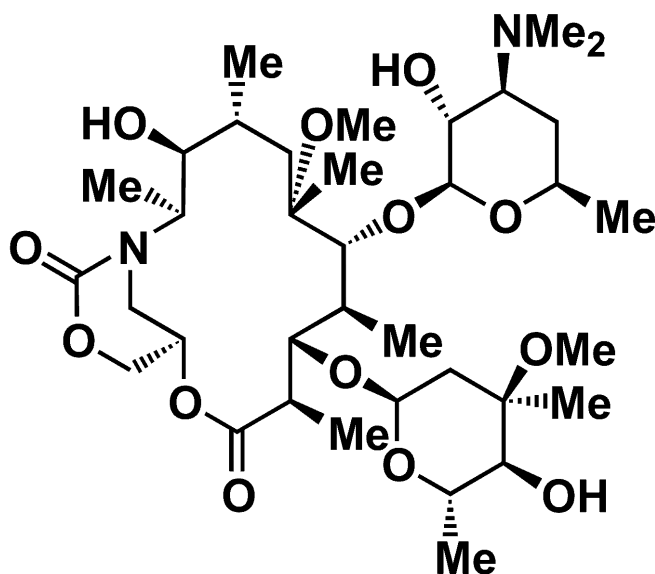
30

【0806】

実施例248 式(Q)で示される化合物の合成

【0807】

【化26】



式(Q)

40

50

【0808】

(1) 実施例1で得られた化合物4.5gとベンジル(S)-(+)-グリシジルエーテル3.0gを原料として実施例7(1)と同様の方法により付加体2.74gを得た。

【0809】

(2) 上記(1)で得られた化合物2.0gをテトラヒドロフラン300mlに溶解し、2.2Mジエチルアゾジカルボキシラートトルエン溶液1.57ml、トリフェニルホスフィン0.91gを加えて室温にて6時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2)にて精製して環化体0.3gを得た。

【0810】

(3) 上記(2)で得られた化合物0.14gをテトラヒドロフラン10mlに溶解し、20%水酸化パラジウム-炭素0.5gを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて8時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮した。得られた残渣65mgをクロロホルム3ml、ピリジン0.05mlに溶解し、トリホスゲン18mgのクロロホルム溶液1mlを少しずつ滴下した後、室温にて5時間攪拌した。反応液にクロロホルムと飽和重曹水を加えて分液し、有機層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2)にて精製してカーバメート体18mgを得た。

【0811】

(4) 上記(3)で得られた化合物18mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて標記化合物11.6mgを得た。

MS(ESI) m/z =733.3[M+H]⁺

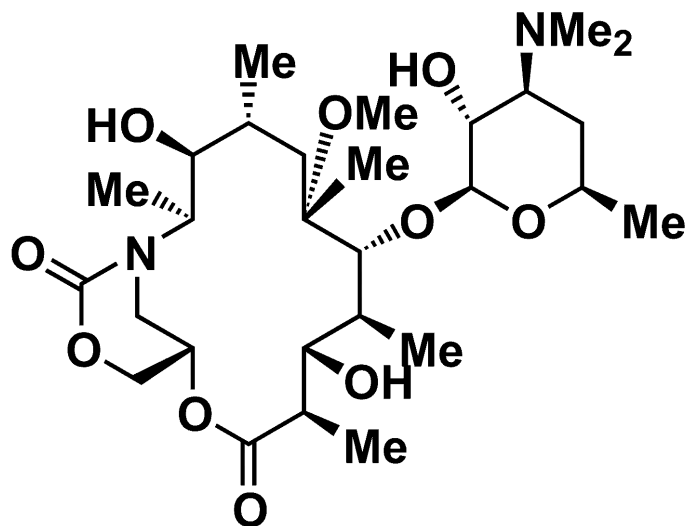
¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ(ppm): 1.06(d, J=7.34Hz, 3H) 1.12(d, J=7.34Hz, 3H) 1.13-1.32(m, 2H) 1.19(d, J=6.88Hz, 3H) 1.22(d, J=5.96Hz, 3H) 1.24-1.25(m, 6H) 1.36(d, J=6.42Hz, 3H) 1.44(d, J=6.88Hz, 3H) 1.58(dd, J=15.36, 4.81Hz, 1H) 1.60-1.65(m, 1H) 1.88-2.05(m, 2H) 2.07-2.13(m, 1H) 2.28(s, 1H) 2.28(s, 6H) 2.36(d, J=15.13Hz, 1H) 2.43-2.52(m, 1H) 2.68-2.77(m, 1H) 3.09(t, J=9.17Hz, 1H) 3.20-3.27(m, 1H) 3.32-3.40(m, 2H) 3.34(s, 3H) 3.36(s, 3H) 3.41-3.48(m, 1H) 3.50-3.59(m, 1H) 3.72(d, J=3.67Hz, 1H) 3.74(d, J=5.50Hz, 1H) 3.98-4.05(m, 1H) 4.13-4.20(m, 1H) 4.23(d, J=11.92Hz, 1H) 4.40-4.49(m, 1H) 4.51-4.59(m, 2H) 4.97-5.04(m, 1H)

【0812】

実施例249 式(R)で示される化合物の合成

【0813】

【化27】



式(R)

【0814】

(1) 実施例1で得られた化合物3.0g、(R)-1,2-エポキシプロパンベンジルエーテル2.0g

を原料として実施例 7 (1) と同様の方法にて付加体1.13gを得た。

【0815】

(2) 上記(1) で得られた化合物0.6gをテトラヒドロフラン90mlに溶解し、1.9Mジイソプロピルアゾジカルボキシラートトルエン溶液0.55ml、トリフェニルホスフィン0.27gを加えて室温にて6時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2) にて精製して環化体0.42gを得た。

【0816】

(3) 上記(2) で得られた化合物59mgを原料として実施例 248 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて標記化合物5.7mgを得た。

10

MS(ESI)m/z=575.2[M+H]⁺

¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm) : 1.10(d, J=6.88Hz, 3H) 1.15-1.19(m, 3H) 1.21-1.30(m, 13H) 1.32(s, 3H) 1.40(dd, J=15.36, 6.19Hz, 1H) 1.61-1.67(m, 1H) 1.72-1.80(m, 1H) 1.84-1.92(m, 1H) 2.00-2.07(m, 1H) 2.24(s, 6H) 2.44-2.50(m, 1H) 2.70-2.77(m, 1H) 3.15(s, 3H) 3.23(dd, J=10.32, 7.57Hz, 1H) 3.26-3.29(m, 1H) 3.48-3.54(m, 1H) 3.57-3.64(m, 1H) 3.82-3.85(m, 1H) 3.89-4.02(m, 1H) 4.03-4.14(m, 1H) 4.18-4.23(m, 1H) 4.28-4.34(m, 1H) 4.47(d, J=7.34Hz, 1H) 4.63-4.70(m, 1H) 5.00-5.04(m, 1H)

【0817】

実施例 250 ~ 258 の合成

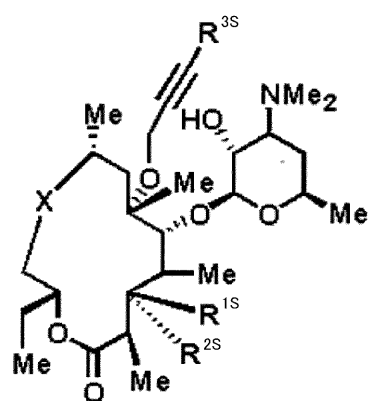
表 10 で規定した R^{1S}、R^{2S}、及び R^{3S}をもつ、式 (S) で示される化合物の製造法を以下に示す。

20

【0818】

【表 10 - 1】

表 10



式 (S)

実施例	X	R ^{1S}	R ^{2S}	R ^{3S}	ESI MS (M+H)	¹ H-NMR, CDCl ₃ , δ (ppm)
250		クラジノシル	H	H	743.7	(300 MHz) : 0.83 - 0.93 (m, 9 H) 1.04 - 1.32 (m, 2 H) 1.13 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.38 (s, 3 H) 1.49 - 1.79 (m, 4 H) 1.91 - 2.53 (m, 9 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.70 - 3.08 (m, 3 H) 3.17 - 3.27 (m, 1 H) 3.34 (s, 3 H) 3.44 - 3.59 (m, 2 H) 3.66 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 3.99 - 4.10 (m, 1 H) 4.14 - 4.24 (m, 2 H) 4.30 - 4.33 (m, 1 H) 4.41 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.64 - 4.74 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.97 Hz, 1 H)
251		クラジノシル	H		871.7	(300 MHz) : 0.83 (t, J=7.38 Hz, 3 H) 0.88 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 0.91 (d, J=6.84 Hz, 3 H) 1.10 - 1.37 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.27 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.34 (d, J=6.37 Hz, 3 H) 1.44 - 2.10 (m, 5 H) 1.47 (s, 3 H) 2.23 - 2.55 (m, 7 H) 2.30 (s, 6 H) 2.31 (s, 3 H) 2.74 - 2.96 (m, 2 H) 3.05 (t, J=9.25 Hz, 1 H) 3.20 - 3.28 (m, 1 H) 3.35 (s, 3 H) 3.46 - 3.60 (m, 2 H) 3.75 (d, J=8.08 Hz, 1 H) 4.03 - 4.15 (m, 1 H) 4.30 (d, J=2.64 Hz, 1 H) 4.41 - 4.71 (m, 4 H) 5.07 (d, J=4.35 Hz, 1 H) 7.63 (dd, J=8.55, 4.20 Hz, 1 H) 8.36 - 8.41 (m, 1 H) 8.45 - 8.48 (m, 1 H) 8.98 - 9.01 (m, 2 H)
252		クラジノシル	H		888.7	(300 MHz) : 0.84 - 0.94 (m, 9 H) 1.09 - 1.35 (m, 8 H) 1.15 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.32 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.44 (s, 3 H) 1.49 - 1.88 (m, 4 H) 1.95 - 2.54 (m, 8 H) 2.29 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.73 - 2.98 (m, 2 H) 3.04 (t, J=9.17 Hz, 1 H) 3.23 (dd, J=10.65, 7.38 Hz, 1 H) 3.34 (s, 3 H) 3.45 - 3.56 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.39 Hz, 1 H) 4.01 - 4.11 (m, 1 H) 4.21 - 4.24 (m, 1 H) 4.43 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.46 - 4.74 (m, 3 H) 5.00 (d, J=3.89 Hz, 1 H) 7.30 (s, 1 H) 7.61 (dd, J=8.55, 4.97 Hz, 1 H) 8.26 (dd, J=8.55, 1.71 Hz, 1 H) 9.25 (dd, J=4.97, 1.71 Hz, 1 H)

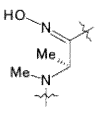
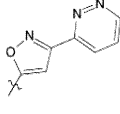
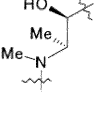
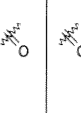
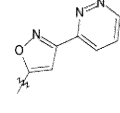
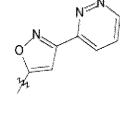
【0819】

【表 10-2】

253		クラジ ノシル	H	H	755.6	(300 MHz) : 0.93 (t, J=7.54 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.07 - 1.33 (m, 14 H) 1.13 (d, J=6.53 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.30 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.45 - 1.83 (m, 6 H) 2.07 - 2.51 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.67 - 2.79 (m, 1 H) 2.98 - 3.10 (m, 2 H) 3.17 (dd, J=10.26, 7.31 Hz, 1 H) 3.31 (s, 3 H) 3.45 (dd, 1 H) 3.58 (dd, J=10.57, 3.11 Hz, 1 H) 3.64 (d, J=7.62 Hz, 1 H) 3.74 - 3.80 (m, 1 H) 3.81 - 3.90 (m, 1 H) 3.93 - 4.05 (m, 2 H) 4.21 (ddd, J=21.18, 16.44, 2.49 Hz, 2 H) 4.37 (d, J=7.30 Hz, 1 H) 4.85 - 4.98 (m, 2 H)
254		クラジ ノシル	H		883.7	(300 MHz) : 0.91 (t, J=7.62 Hz, 3 H) 1.09 - 1.32 (m, 11 H) 1.13 (d, J=7.62 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=6.53 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.30 (d, J=6.53 Hz, 3 H) 1.51 - 1.88 (m, 7 H) 2.20 - 2.48 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.72 - 2.81 (m, 1 H) 2.98 - 3.11 (m, 2 H) 3.19 (dd, J=10.26, 7.31 Hz, 1 H) 3.32 (s, 3 H) 3.41 - 3.56 (m, 1 H) 3.60 - 3.90 (m, 4 H) 3.97 - 4.05 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.46 - 4.61 (m, 2 H) 4.91 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 4.94 - 5.03 (m, 1 H) 7.61 (dd, J=8.55, 4.20 Hz, 1 H) 8.35 - 8.40 (m, 1 H) 8.45 - 8.47 (m, 1 H) 8.97 - 9.01 (m, 2 H)
255		クラジ ノシル	H		900.7	(300 MHz) : 0.93 (t, J=7.54 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=7.46 Hz, 3 H) 1.10 - 1.34 (m, 14 H) 1.15 (d, J=6.37 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.31 (d, J=6.22 Hz, 3 H) 1.54 - 1.85 (m, 6 H) 2.19 - 2.30 (m, 3 H) 2.32 (s, 6 H) 2.43 - 2.55 (m, 1 H) 2.70 - 2.80 (m, 1 H) 2.98 - 3.25 (m, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.45 - 3.56 (m, 1 H) 3.62 (dd, J=10.10, 2.80 Hz, 1 H) 3.71 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 3.74 - 3.83 (m, 2 H) 3.96 (d, J=8.55 Hz, 1 H) 3.96 - 4.06 (m, 2 H) 4.41 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.47 - 4.61 (m, 2 H) 4.90 (d, J=4.35 Hz, 1 H) 4.93 - 5.05 (m, 1 H) 7.31 (s, 1 H) 7.61 (dd, J=8.55, 4.97 Hz, 1 H) 8.25 (dd, J=8.55, 1.71 Hz, 1 H) 9.24 (dd, J=4.97, 1.71 Hz, 1 H)
256					740.4	(300 MHz) : 0.95 (t, J=7.46 Hz, 3 H) 1.12 - 1.77 (m, 12 H) 1.19 (d, J=6.53 Hz, 3 H) 1.26 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.41 (d, J=6.84 Hz, 3 H) 1.59 (s, 3 H) 2.08 - 2.19 (m, 1 H) 2.28 (s, 6 H) 2.41 - 2.53 (m, 1 H) 2.86 - 2.99 (m, 1 H) 3.10 (dd, J=15.08, 10.41 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.26, 7.31 Hz, 1 H) 3.46 - 3.75 (m, 4 H) 3.82 (d, J=13.37 Hz, 1 H) 3.96 - 4.16 (m, 2 H) 4.13 (d, J=11.04 Hz, 1 H) 4.22 (d, J=9.48 Hz, 1 H) 4.33 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.81 - 4.93 (m, 1 H) 7.30 (s, 1 H) 7.60 (dd, J=8.63, 5.05 Hz, 1 H) 8.25 (dd, J=8.55, 1.71 Hz, 1 H) 9.24 (dd, J=5.13, 1.71 Hz, 1 H)

【0820】

【表 10-3】

257		クラジ ノシル	H		901.5	(300 MHz) : 0.89 (t, J=7.46 Hz, 3 H) 1.05 (d, J=6.68 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=7.62 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=6.84 Hz, 3 H) 1.29 (s, 7 H) 1.30 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.40 (s, 3 H) 1.53 - 1.70 (m, 4 H) 1.80 - 1.85 (m, 2 H) 1.94 - 1.99 (m, 1 H) 2.01 (s, 3 H) 2.13 (d, J=10.41 Hz, 1 H) 2.30 (s, 6 H) 2.37 - 2.43 (m, 1 H) 2.43 - 2.55 (m, 1 H) 2.61 - 2.72 (m, 3 H) 3.03 (t, J=10.10 Hz, 1 H) 3.35 (s, 3 H) 3.39 (dd, J=10.49, 7.07 Hz, 1 H) 3.53 - 3.63 (m, 2 H) 3.68 (d, J=6.06 Hz, 1 H) 3.76 - 3.84 (m, 1 H) 3.91 - 3.94 (m, 1 H) 3.96 - 4.06 (m, 1 H) 4.55 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 4.61 (d, J=14.30 Hz, 1 H) 4.78 (d, J=14.45 Hz, 1 H) 4.85 (d, J=4.04 Hz, 1 H) 4.85 - 4.95 (m, 1 H) 7.25 (s, 1 H) 7.60 (dd, J=8.55, 4.97 Hz, 1 H) 8.25 (dd, J=8.55, 1.71 Hz, 1 H) 9.24 (dd, J=5.05, 1.79 Hz, 1 H)
258					728.4	(300 MHz) : 0.85 (d, J=6.53 Hz, 3 H) 0.86 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 0.92 (t, J=7.38 Hz, 3 H) 1.16 - 1.98 (m, 6 H) 1.26 (d, J=6.06 Hz, 3 H) 1.34 (d, J=6.84 Hz, 3 H) 1.43 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.51 (s, 3 H) 2.08 (dd, J=15.93, 1.32 Hz, 1 H) 2.23 - 2.57 (m, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.42 (s, 3 H) 3.00 (dd, J=15.47, 2.56 Hz, 1 H) 3.21 (dd, J=10.34, 7.23 Hz, 1 H) 3.33 - 3.57 (m, 3 H) 3.67 (s, 1 H) 3.89 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 3.94 - 4.07 (m, 2 H) 4.13 - 4.24 (m, 1 H) 4.41 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.64 - 4.72 (m, 1 H) 7.22 (s, 1 H) 7.61 (dd, J=8.55, 4.97 Hz, 1 H) 8.25 (dd, J=8.55, 1.71 Hz, 1 H) 9.25 (dd, J=5.05, 1.79 Hz, 1 H)

【0821】

実施例 250

(1) 実施例 6 で得られた化合物 650mg を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 312mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 300mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 10 で示される化合物 166mg を得た。

【0822】

実施例 251

実施例 250 で得られた化合物 50mg をアセトニトリル 1.5ml に溶解し、文献 (Journal of Organic Chemistry, 1968 年, 33 巻, 1384 ページ) に記載の方法にて得られた 3-ブロモ-1,5-ナフチリジン 21.1mg、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム 3.9mg、トリエチルアミン 0.3ml を加えて 80℃ にて 4 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=10:10:0.2) にて精製して表 10 で示される化合物 26.8mg を得た。

【0823】

実施例 252

実施例 250 で得られた化合物 6.0mg、特許文献 (W005/087787) に記載の方法にて得られた 5-ヨード-3-(ピリダジン-3-イル) イソキサゾール 3.3mg を原料として実施例 251 と同様の方法にて表 10 で示される化合物 4.24mg を得た。

【0824】

実施例 253

実施例 250 で得られた化合物 92mg を原料として実施例 176 (3)、実施例 207 (1)、実施例 125 (3) と同様の方法にて表 10 で示される化合物 48.3mg を得た。

【0825】

実施例 254

実施例 253 で得られた化合物 22mg を原料として実施例 251 と同様の方法にて表 10 で示される化合物 10.1mg を得た。

【0826】

実施例 255

実施例 253 で得られた化合物 22mg を原料として実施例 252 と同様の方法にて表 10 で

10

20

30

40

50

示される化合物21.4mgを得た。

【0827】

実施例256

(1) 実施例255で得られた化合物15mgを原料として実施例125(2)、実施例176(3)と同様の方法にて3-ヒドロキシ体11.2mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物11.2mgを原料として実施例176(4)、実施例125(3)と同様の方法にて表10で示される化合物6.71mgを得た。

【0828】

実施例257

(1) 実施例250(1)で得られた化合物1.0gを原料として実施例126(1)、実施例219(2)、実施例7(4)と同様の方法にて9-ヒドロキシ体592mgを得た。 10

(2) 上記(1)で得られた化合物590mgを原料として実施例176(3)、(4)と同様の方法にてケトン体594mgを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物280mgを原料として実施例125(3)と同様の方法にて脱アセチル体229.5mgを得た。

(4) 上記(3)で得られた化合物150mgを原料として実施例252と同様の方法にてカップリング体188mgを得た。

(5) 上記(4)で得られた化合物180mgを原料として実施例214と同様の方法にてオキシム体81mgを得た。

(6) 上記(5)で得られた化合物49.7mgを原料として実施例219(4)と同様の方法にて表10で示される化合物40.0mgを得た。 20

【0829】

実施例258

(1) 実施例250(1)で得られた化合物1.0gを原料として実施例125(2)、実施例112(1)と同様の方法にて3-ヒドロキシ体135mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物135mgを原料として実施例176(4)、実施例114(4)と同様の方法にて3-ケトン体72.3mgを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物71mgを原料として実施例252と同様の方法にてカップリング体70.6mgを得た。

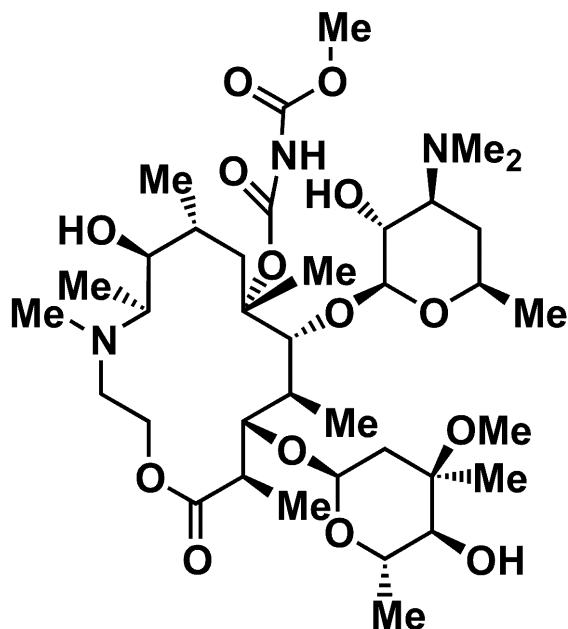
(4) 上記(3)で得られた化合物70.6mgを原料として実施例125(2)と同様の方法にて表10で示される化合物38.4mgを得た。 30

【0830】

実施例259 式(T)で示される化合物の合成

【0831】

【化 2 8】



式(T)

10

【0832】

(1) 実施例240(2)で得られた化合物0.2gをクロロホルム3mlに溶解し、氷冷下、トリクロロアセチルイソシアネート26 μ lを加えて室温にて3時間攪拌した。反応液にメタノール40 μ l、炭酸カリウム40mgを加えて室温にて2.5日間攪拌した。反応液にクロロホルムと飽和重曹水を加えて分液して、有機層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=50:10:0.2)にて精製して6-O-カーバメート体0.16gを得た。

20

【0833】

(2) 上記(1)で得られた化合物80mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて標記化合物4.7mgを得た。

MS(ESI) m/z =778.5[M+H]⁺

30

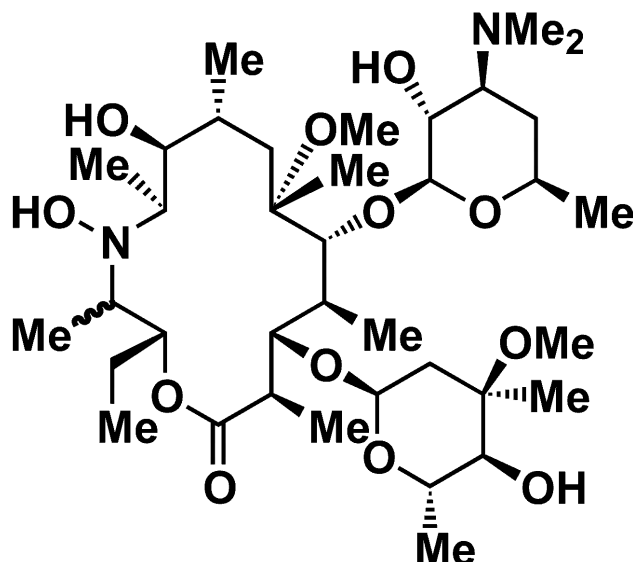
¹H-NMR(300MHz, CDCl₃) δ (ppm): 0.85(d, J=6.22Hz, 3H) 0.90(d, J=6.68Hz, 3H) 1.13(d, J=7.15Hz, 3H) 1.15-1.32(m, 14H) 1.27(d, J=6.37Hz, 3H) 1.44-1.80(m, 3H) 2.10-2.61(m, 6H) 2.29(s, 6H) 2.32(s, 3H) 2.76-2.96(m, 2H) 2.98-3.07(m, 1H) 3.20-3.33(m, 2H) 3.33(s, 3H) 3.42-3.55(m, 1H) 3.76(s, 3H) 3.80-4.09(m, 3H) 4.24-4.49(m, 3H) 4.73-4.81(m, 1H)

【0834】

実施例260 式(U)で示される化合物の合成

【0835】

【化 2 9】



式 (U)

10

【0836】

(1) 実施例 245 (2) で得られた化合物 119mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて脱保護体 70mg を得た。

【0837】

20

(2) 上記 (1) で得られた化合物 30mg をジクロロメタン 860 μ l に溶解し、氷浴下、*m*-クロロ過安息香酸 30mg を加えてそのまま 1 時間攪拌した。反応液に蒸留水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1) にて精製した。得られた化合物 27mg をテトラヒドロフラン 4ml に溶解し、トリフェニルホスフィン 45mg を加えて 70°C にて 60 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1) にて精製してニトロン体 24mg を得た。

【0838】

30

(3) 上記 (2) で得られた化合物 8mg をジエチルエーテル-ジクロロメタン-テトラヒドロフラン (1:1:1) 3ml に溶解し、氷浴下、0.84M ヨウ化メチルマグネシウムエーテル溶液 660 μ l を加えて室温にて 2 時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1) にて精製して標記化合物 5mg を得た。

MS (ESI) m/z = 735.5 $[M+H]^+$

^1H -NMR (300MHz, CDCl_3) δ (ppm) : 0.87 (t, J =7.57Hz, 3H) 0.97 (d, J =6.88Hz, 3H) 1.09-1.13 (m, 6H) 1.18 (d, J =6.88Hz, 3H) 1.19-1.29 (m, 11H) 1.30 (d, J =5.96Hz, 3H) 1.34 (s, 3H) 1.44-1.77 (m, 4H) 1.98-2.05 (m, 1H) 2.06-2.13 (m, 1H) 2.14-2.22 (m, 2H) 2.28 (s, 6H) 2.36 (d, J =15.13Hz, 1H) 2.42-2.52 (m, 1H) 2.73-2.81 (m, 1H) 2.92-3.08 (m, 3H) 3.16-3.25 (m, 2H) 3.30 (s, 3H) 3.30 (s, 3H) 3.42-3.54 (m, 1H) 3.73 (d, J =8.71Hz, 1H) 3.97-4.08 (m, 2H) 4.38 (d, J =7.34Hz, 1H) 4.86 (d, J =4.58Hz, 1H) 4.96 (td, J =7.91, 3.44Hz, 1H) 5.83 (br. s., 1H)

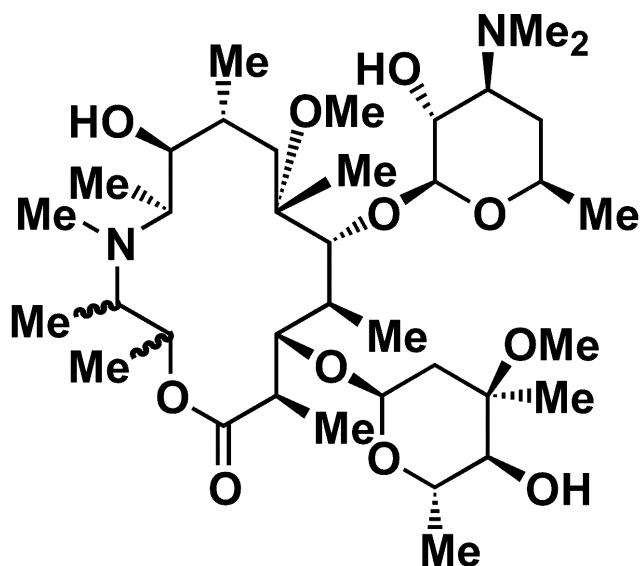
40

【0839】

実施例 261 式 (V) で示される化合物の合成

【0840】

【化 3 0】



式 (V)

10

【 0 8 4 1 】

実施例 1 で得られた化合物 700mg と cis-2,3-エポキシブタン 254mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて標記化合物 4.0mg を得た。

MS (ESI) $m/z = 719.2 [M+H]^+$

20

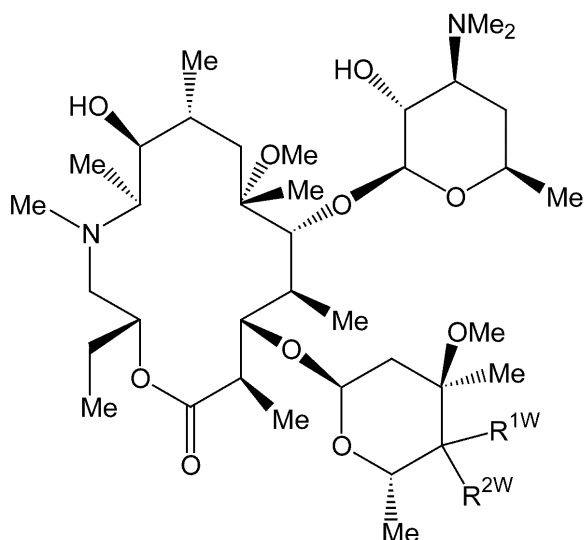
【 0 8 4 2 】

実施例 2 6 2 ~ 5 5 1 の合成

表 1 1 で規定した R^{1W}、及び R^{2W}をもつ、式 (W) で示される化合物の製造法を以下に示す。

【 0 8 4 3 】

【 0 8 4 4 】



式(W)

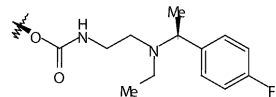
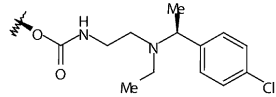
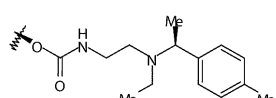
10

実施例	R ^{1W}	R ^{2W}	ESI MS (M+H)	¹ H-NMR, CDCl ₃ , δ (ppm)
262			718	(300 MHz) : 0.81 – 0.84 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.2 Hz, 3 H) 1.10 (d, J=7.2 Hz, 3 H) 1.15 – 1.23 (m, 10 H) 1.27 – 1.32 (m, 6 H) 1.48 – 1.85 (m, 6 H) 2.15 – 2.54 (m, 16 H) 2.76 – 2.91 (m, 2 H) 3.18 – 3.24 (m, 4 H) 3.29 (s, 3 H) 3.41 – 3.54 (m, 2 H) 3.72 (d, J=7.8 Hz, 1 H) 4.04 (dq, J=9.6 Hz, J=6.3 Hz, 1 H) 4.14 (d, J=4.5 Hz, 1 H) 4.42 (d, J=7.2 Hz, 1 H) 4.65 (m, 1 H) 4.95 (d, J=4.8 Hz, 1 H)
263			719	(300 MHz) : 0.81 – 0.92 (m, 9 H) 1.11 (d, J=7.2 Hz, 3 H) 1.16 – 1.25 (m, 13 H) 1.32 (s, 3 H) 1.42 – 1.85 (m, 7 H) 2.07 (d, J=15.3 Hz, 1 H) 2.15 – 2.55 (m, 14 H) 2.77 – 2.91 (m, 2 H) 3.04 (brs, 1 H) 3.17 – 3.24 (m, 4 H) 3.32 (s, 3 H) 3.40 – 3.49 (m, 2 H) 3.67 (d, J=7.5 Hz, 1 H) 4.18 (d, J=3.9 Hz, 1 H) 4.43 (d, J=7.2 Hz, 1 H) 4.58 – 4.64 (m, 2 H) 4.99 (d, J=4.8 Hz, 1 H)
264			967.6	(600 MHz): 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.00 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.07 – 1.26 (m, 2 H) 1.10 – 1.20 (m, 15 H) 1.31 (s, 3 H) 1.32 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.50 – 1.65 (m, 3 H) 1.69 – 1.79 (m, 1 H) 1.80 – 1.88 (m, 1 H) 2.11 – 2.21 (m, 1 H) 2.23 – 2.51 (m, 6 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.54 – 2.64 (m, 3 H) 2.77 – 2.84 (m, 1 H) 2.85 – 2.93 (m, 1 H) 3.16 – 3.22 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.35 – 3.45 (m, 1 H) 3.54 – 3.64 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.79 (s, 3 H) 3.81 – 3.85 (m, 1 H) 4.18 – 4.25 (m, 1 H) 4.35 – 4.42 (m, 1 H) 4.43 – 4.48 (m, 1 H) 4.53 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.97 (d, J=3.21 Hz, 1 H) 5.19 (s, 1 H) 6.76 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 6.84 (s, 1 H) 6.88 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 7.21 (t, J=7.79 Hz, 1 H)
265			967.6	(600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.99 (t, J=6.88 Hz, 3 H) 1.07 – 1.23 (m, 2 H) 1.12 (s, 3 H) 1.12 – 1.18 (m, 9 H) 1.19 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.28 – 1.32 (m, 6 H) 1.50 – 1.66 (m, 3 H) 1.69 – 1.79 (m, 1 H) 1.80 – 1.88 (m, 1 H) 2.11 – 2.21 (m, 1 H) 2.22 – 2.46 (m, 6 H) 2.28 (s, 6 H) 2.26 (s, 3 H) 2.51 – 2.61 (m, 3 H) 2.78 – 2.84 (m, 1 H) 2.85 – 2.91 (m, 1 H) 3.15 – 3.22 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.35 – 3.45 (m, 1 H) 3.56 – 3.65 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.78 (s, 3 H) 3.80 – 3.87 (m, 1 H) 4.21 (s, 1 H) 4.36 – 4.42 (m, 1 H) 4.46 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.53 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.60 – 4.69 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.17 – 5.23 (m, 1 H) 6.83 (d, J=8.71 Hz, 2 H) 7.19 (d, J=8.25 Hz, 2 H)

20

30

【表 1 1 - 2】

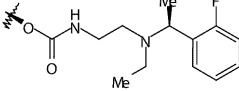
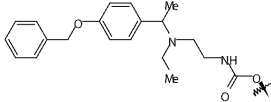
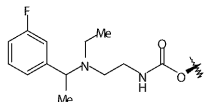
266		$\frac{1}{2}$ -H	955.6	(600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.00 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.07 - 1.25 (m, 2 H) 1.10 (s, 3 H) 1.11 - 1.14 (m, 3 H) 1.14 - 1.20 (m, 9 H) 1.27 - 1.35 (m, 6 H) 1.51 - 1.65 (m, 3 H) 1.69 - 1.79 (m, 1 H) 1.81 - 1.88 (m, 1 H) 2.10 - 2.21 (m, 1 H) 2.23 - 2.33 (m, 2 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.47 (m, 4 H) 2.49 - 2.62 (m, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 - 2.92 (m, 1 H) 3.15 - 3.26 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.36 - 3.45 (m, 1 H) 3.56 - 3.65 (m, 1 H) 3.72 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.83 - 3.89 (m, 1 H) 4.22 (s, 1 H) 4.35 - 4.43 (m, 1 H) 4.44 - 4.49 (m, 1 H) 4.52 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 5.15 (s, 1 H) 6.98 (t, J=8.71 Hz, 2 H) 7.23 - 7.29 (m, 2 H)
267		$\frac{1}{2}$ -H	971.6	(600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.00 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.07 - 1.25 (m, 2 H) 1.10 - 1.14 (m, 3 H) 1.11 (s, 3 H) 1.14 - 1.20 (m, 9 H) 1.28 - 1.33 (m, 6 H) 1.50 - 1.66 (m, 3 H) 1.69 - 1.80 (m, 1 H) 1.80 - 1.89 (m, 1 H) 2.10 - 2.21 (m, 1 H) 2.22 - 2.34 (m, 2 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.37 - 2.48 (m, 4 H) 2.50 - 2.62 (m, 3 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.85 - 2.93 (m, 1 H) 3.15 - 3.26 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 - 3.45 (m, 1 H) 3.36 (s, 3 H) 3.55 - 3.65 (m, 1 H) 3.72 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.82 - 3.89 (m, 1 H) 4.18 - 4.26 (m, 1 H) 4.35 - 4.43 (m, 1 H) 4.44 - 4.49 (m, 1 H) 4.53 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.15 (s, 1 H) 7.21 - 7.29 (m, 4 H)
268		$\frac{1}{2}$ -H	951.6	(600 MHz): 0.82 (d, J=5.96 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.96 - 1.03 (m, 3 H) 1.07 - 1.25 (m, 17 H) 1.28 - 1.34 (m, 6 H) 1.48 - 1.66 (m, 3 H) 1.69 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.89 (m, 1 H) 2.12 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.30 (m, 2 H) 2.27 (s, 6 H) 2.31 (s, 3 H) 2.33 - 2.48 (m, 4 H) 2.36 (s, 3 H) 2.52 - 2.63 (m, 3 H) 2.78 - 2.85 (m, 1 H) 2.85 - 2.94 (m, 1 H) 3.15 - 3.23 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.36 - 3.44 (m, 1 H) 3.56 - 3.66 (m, 1 H) 3.72 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.80 - 3.89 (m, 1 H) 4.16 - 4.25 (m, 1 H) 4.35 - 4.43 (m, 1 H) 4.45 - 4.49 (m, 1 H) 4.53 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.60 - 4.69 (m, 1 H) 4.93 - 5.00 (m, 1 H) 5.22 (s, 1 H) 7.10 (d, J=7.79 Hz, 2 H) 7.17 (d, J=8.25 Hz, 2 H)

【 0 8 4 5】

10

20

【表 1 1 - 3】

269		$\frac{1}{2}\text{H}$	955.6	(600 MHz): 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=8.02 Hz, 3 H) 1.00 (t, J=6.88 Hz, 3 H) 1.07 - 1.27 (m, 2 H) 1.10 (s, 3 H) 1.12 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.14 - 1.18 (m, 6 H) 1.19 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.33 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.49 - 1.68 (m, 3 H) 1.74 (s, 1 H) 1.85 (s, 1 H) 2.10 - 2.20 (m, 1 H) 2.21 - 2.50 (m, 6 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.53 - 2.65 (m, 3 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.89 (d, J=16.05 Hz, 1 H) 3.15 - 3.28 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.45 (m, 1 H) 3.58 - 3.67 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.17 (s, 1 H) 4.26 - 4.33 (m, 1 H) 4.34 - 4.42 (m, 1 H) 4.49 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 4.48 - 4.56 (m, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.25 - 5.33 (m, 1 H) 6.98 - 7.03 (m, 1 H) 7.08 (t, J=7.11 Hz, 1 H) 7.17 - 7.24 (m, 1 H) 7.30 (t, J=7.11 Hz, 1 H)
270		$\frac{1}{2}\text{H}$	1043.6	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.78 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.86 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.90 - 1.00 (m, 3 H) 1.04 - 1.22 (m, 2 H) 1.07 - 1.17 (m, 15 H) 1.24 - 1.31 (m, 6 H) 1.46 - 1.63 (m, 3 H) 1.71 (s, 1 H) 1.81 (s, 1 H) 2.07 - 2.17 (m, 1 H) 2.18 - 2.47 (m, 6 H) 2.23 (s, 6 H) 2.32 (s, 3 H) 2.48 - 2.61 (m, 3 H) 2.74 - 2.81 (m, 1 H) 2.85 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 3.11 - 3.23 (m, 3 H) 3.20 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.33 - 3.43 (m, 1 H) 3.52 - 3.62 (m, 1 H) 3.68 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.72 - 3.84 (m, 1 H) 4.14 - 4.22 (m, 1 H) 4.32 - 4.40 (m, 1 H) 4.43 (d, J=5.96 Hz, 1 H) 4.47 - 4.54 (m, 1 H) 4.60 (s, 1 H) 4.91 - 4.96 (m, 1 H) 5.00 (s, 2 H) 5.15 - 5.25 (m, 1 H) 6.87 (d, J=8.71 Hz, 2 H) 7.17 (d, J=7.79 Hz, 2 H) 7.26 - 7.31 (m, 1 H) 7.32 - 7.37 (m, 2 H) 7.37 - 7.41 (m, 2 H)
271		$\frac{1}{2}\text{H}$	955.6	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.79 Hz, 3 H) 1.00 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.07 - 1.27 (m, 17 H) 1.28 - 1.33 (m, 6 H) 1.48 - 1.67 (m, 3 H) 1.69 - 1.89 (m, 2 H) 2.11 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.63 (m, 9 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.88 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 3.16 - 3.46 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.55 - 3.63 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.78 - 3.88 (m, 1 H) 4.18 - 4.25 (m, 1 H) 4.34 - 4.43 (m, 1 H) 4.43 - 4.48 (m, 1 H) 4.53 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.97 (d, J=3.21 Hz, 1 H) 5.14 - 5.21 (m, 1 H) 6.90 (t, J=8.25 Hz, 1 H) 7.01 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 7.06 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.22 - 7.28 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.79 Hz, 3 H) 0.97 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.07 - 1.27 (m, 17 H) 1.28 - 1.33 (m, 6 H) 1.48 - 1.67 (m, 3 H) 1.69 - 1.89 (m, 2 H) 2.11 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.63 (m, 9 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.88 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 3.16 - 3.46 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.55 - 3.63 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.78 - 3.88 (m, 1 H) 4.18 - 4.25 (m, 1 H) 4.34 - 4.43 (m, 1 H) 4.43 - 4.48 (m, 1 H) 4.54 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.97 (d, J=3.21 Hz, 1 H) 5.14 - 5.21 (m, 1 H) 6.90 (t, J=8.25 Hz, 1 H) 7.01 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 7.06 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.22 - 7.28 (m, 1 H)

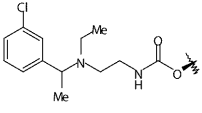
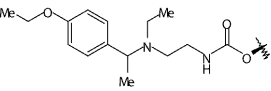
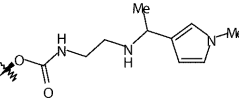
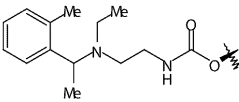
10

20

30

【 0 8 4 6 】

【表 1 1 - 4】

272		--H	971.6	ジーステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.87 - 0.93 (m, 3 H) 0.94 - 1.03 (m, 3 H) 1.07 - 1.25 (m, 2 H) 1.11 - 1.21 (m, 15 H) 1.30 (s, 3 H) 1.32 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.48 - 1.65 (m, 3 H) 1.75 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.10 - 2.21 (m, 1 H) 2.21 - 2.53 (m, 6 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.53 - 2.64 (m, 3 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.84 - 2.96 (m, 1 H) 3.16 - 3.26 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.46 (m, 1 H) 3.55 - 3.66 (m, 1 H) 3.69 - 3.74 (m, 1 H) 3.76 - 3.88 (m, 1 H) 4.18 - 4.26 (m, 1 H) 4.34 - 4.42 (m, 1 H) 4.43 - 4.51 (m, 1 H) 4.52 - 4.56 (m, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.93 - 5.00 (m, 1 H) 5.12 - 5.23 (m, 1 H) 7.15 - 7.31 (m, 4 H)
273		--H	981.6	ジーステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.79 Hz, 3 H) 0.93 - 1.04 (m, 3 H) 1.06 - 1.27 (m, 2 H) 1.10 - 1.21 (m, 15 H) 1.27 - 1.33 (m, 6 H) 1.39 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.49 - 1.67 (m, 3 H) 1.75 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.16 (s, 1 H) 2.21 - 2.33 (m, 2 H) 2.28 (s, 6 H) 2.33 - 2.49 (m, 4 H) 2.35 (s, 3 H) 2.50 - 2.64 (m, 3 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.84 - 2.92 (m, 1 H) 3.14 - 3.22 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.45 (m, 1 H) 3.56 - 3.66 (m, 1 H) 3.69 - 3.74 (m, 1 H) 3.74 - 3.87 (m, 1 H) 3.97 - 4.02 (m, 2 H) 4.18 - 4.24 (m, 1 H) 4.35 - 4.43 (m, 1 H) 4.47 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.51 - 4.55 (m, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.95 - 4.99 (m, 1 H) 5.18 - 5.28 (m, 1 H) 6.81 (d, J=8.25 Hz, 2 H) 7.18 (d, J=8.25 Hz, 2 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.79 Hz, 3 H) 0.93 - 1.04 (m, 3 H) 1.06 - 1.27 (m, 2 H) 1.10 - 1.21 (m, 15 H) 1.27 - 1.33 (m, 6 H) 1.39 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.49 - 1.67 (m, 3 H) 1.75 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.16 (s, 1 H) 2.21 - 2.33 (m, 2 H) 2.28 (s, 6 H) 2.33 - 2.49 (m, 4 H) 2.35 (s, 3 H) 2.50 - 2.64 (m, 3 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.84 - 2.92 (m, 1 H) 3.14 - 3.22 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.36 - 3.45 (m, 1 H) 3.56 - 3.66 (m, 1 H) 3.69 - 3.74 (m, 1 H) 3.74 - 3.87 (m, 1 H) 3.97 - 4.02 (m, 2 H) 4.18 - 4.24 (m, 1 H) 4.35 - 4.43 (m, 1 H) 4.47 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.51 - 4.55 (m, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.95 - 4.99 (m, 1 H) 5.18 - 5.28 (m, 1 H) 6.81 (d, J=8.25 Hz, 2 H) 7.18 (d, J=8.25 Hz, 2 H)
274		--H	912.5	ジーステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.78 - 0.84 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 - 1.24 (m, 17 H) 1.29 - 1.34 (m, 6 H) 1.49 - 1.87 (m, 5 H) 2.10 - 2.45 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.54 - 2.60 (m, 1 H) 2.63 - 2.74 (m, 2 H) 2.77 - 2.83 (m, 1 H) 2.86 - 2.91 (m, 1 H) 3.17 - 3.44 (m, 10 H) 3.55 - 3.62 (m, 4 H) 3.65 - 3.72 (m, 2 H) 4.16 - 4.22 (m, 1 H) 4.34 - 4.40 (m, 1 H) 4.42 - 4.46 (m, 1 H) 4.51 - 4.55 (m, 1 H) 4.60 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.28 - 5.33 (m, 1 H) 6.01 (br. s., 1 H) 6.46 (br. s., 1 H) 6.51 (br. s., 1 H)
275		--H	951.6	ジーステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=5.96 Hz, 6 H) 0.86 - 0.93 (m, 3 H) 0.93 - 1.03 (m, 3 H) 1.04 - 1.25 (m, 2 H) 1.09 - 1.20 (m, 15 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.49 - 1.64 (m, 3 H) 1.74 (s, 1 H) 1.85 (s, 1 H) 2.10 - 2.21 (m, 1 H) 2.23 - 2.46 (m, 4 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.36 (s, 3 H) 2.47 - 2.54 (m, 1 H) 2.54 - 2.69 (m, 4 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 - 2.94 (m, 1 H) 3.05 - 3.16 (m, 2 H) 3.17 - 3.22 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.44 (m, 1 H) 3.55 - 3.66 (m, 1 H) 3.69 - 3.74 (m, 1 H) 3.97 - 4.03 (m, 1 H) 4.16 - 4.25 (m, 1 H) 4.33 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.54 (m, 2 H) 4.64 (s, 1 H) 4.92 - 4.99 (m, 1 H) 5.02 - 5.11 (m, 1 H) 7.07 - 7.19 (m, 3 H) 7.30 - 7.39 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=5.96 Hz, 6 H) 0.86 - 0.93 (m, 3 H) 0.93 - 1.03 (m, 3 H) 1.04 - 1.25 (m, 2 H) 1.09 - 1.20 (m, 15 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.49 - 1.64 (m, 3 H) 1.74 (s, 1 H) 1.85 (s, 1 H) 2.10 - 2.21 (m, 1 H) 2.23 - 2.46 (m, 4 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.37 (s, 3 H) 2.47 - 2.54 (m, 1 H) 2.54 - 2.69 (m, 4 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 - 2.94 (m, 1 H) 3.05 - 3.16 (m, 2 H) 3.17 - 3.22 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.44 (m, 1 H) 3.55 - 3.66 (m, 1 H) 3.69 - 3.74 (m, 1 H) 4.02 - 4.09 (m, 1 H) 4.16 - 4.25 (m, 1 H) 4.33 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.54 (m, 2 H) 4.64 (s, 1 H) 4.92 - 4.99 (m, 1 H) 5.00 - 5.06 (m, 1 H) 7.07 - 7.19 (m, 3 H) 7.30 - 7.39 (m, 1 H)

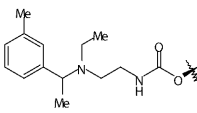
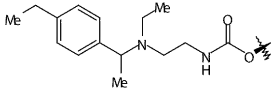
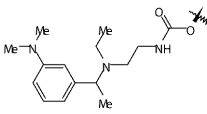
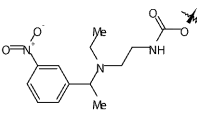
10

20

30

40

【表 1 1 - 5】

276		$-\frac{2}{3}H$	951.6	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.77 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.84 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 0.89 - 0.99 (m, 3 H) 1.01 - 1.22 (m, 2 H) 1.05 - 1.16 (m, 15 H) 1.26 (s, 3 H) 1.27 (d, J=3.67 Hz, 3 H) 1.45 - 1.61 (m, 3 H) 1.70 (s, 1 H) 1.79 (s, 1 H) 2.05 - 2.17 (m, 1 H) 2.16 - 2.47 (m, 6 H) 2.23 (s, 6 H) 2.29 (s, 3 H) 2.31 (s, 3 H) 2.48 - 2.62 (m, 3 H) 2.72 - 2.79 (m, 1 H) 2.84 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.10 - 3.20 (m, 3 H) 3.18 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.31 - 3.41 (m, 1 H) 3.50 - 3.61 (m, 1 H) 3.64 - 3.69 (m, 1 H) 3.69 - 3.82 (m, 1 H) 4.13 - 4.20 (m, 1 H) 4.30 - 4.38 (m, 1 H) 4.38 - 4.45 (m, 1 H) 4.45 - 4.51 (m, 1 H) 4.59 (s, 1 H) 4.92 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.11 - 5.24 (m, 1 H) 6.98 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 7.01 - 7.07 (m, 2 H) 7.13 (t, J=7.57 Hz, 1 H)
277		$-\frac{2}{3}H$	965.6	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 0.94 - 1.04 (m, 3 H) 1.06 - 1.28 (m, 2 H) 1.11 - 1.24 (m, 18 H) 1.31 (s, 3 H) 1.31 - 1.35 (m, 3 H) 1.49 - 1.66 (m, 3 H) 1.75 (s, 1 H) 1.85 (s, 1 H) 2.11 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.34 (m, 2 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.50 (m, 4 H) 2.53 - 2.63 (m, 3 H) 2.62 (q, J=7.34 Hz, 2 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.85 - 2.93 (m, 1 H) 3.16 - 3.23 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.36 - 3.44 (m, 1 H) 3.56 - 3.66 (m, 1 H) 3.72 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.76 - 3.90 (m, 1 H) 4.17 - 4.24 (m, 1 H) 4.35 - 4.43 (m, 1 H) 4.44 - 4.50 (m, 1 H) 4.53 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.94 - 5.00 (m, 1 H) 5.25 (s, 1 H) 7.12 (d, J=7.79 Hz, 2 H) 7.19 (d, J=7.79 Hz, 2 H)
278		$-\frac{2}{3}H$		ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.94 - 1.06 (m, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 2 H) 1.10 - 1.22 (m, 15 H) 1.30 (s, 3 H) 1.31 - 1.37 (m, 3 H) 1.49 - 1.66 (m, 3 H) 1.70 - 1.80 (m, 1 H) 1.80 - 1.88 (m, 1 H) 2.12 - 2.22 (m, 1 H) 2.22 - 2.34 (m, 2 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 - 2.54 (m, 4 H) 2.36 (s, 3 H) 2.53 - 2.69 (m, 3 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.85 - 2.92 (m, 1 H) 2.93 (s, 6 H) 3.15 - 3.22 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.35 - 3.44 (m, 1 H) 3.56 - 3.66 (m, 1 H) 3.69 - 3.73 (m, 1 H) 3.73 - 3.84 (m, 1 H) 4.17 - 4.26 (m, 1 H) 4.35 - 4.42 (m, 1 H) 4.43 - 4.49 (m, 1 H) 4.53 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.59 - 4.69 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 5.20 - 5.29 (m, 1 H) 6.57 - 6.70 (m, 3 H) 7.16 (t, J=7.79 Hz, 1 H)
279		$-\frac{2}{3}H$	982.6	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.87 - 0.92 (m, 3 H) 0.96 - 1.04 (m, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 2 H) 1.10 - 1.20 (m, 15 H) 1.30 (s, 3 H) 1.38 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.49 - 1.65 (m, 3 H) 1.71 - 1.80 (m, 1 H) 1.79 - 1.88 (m, 1 H) 2.10 - 2.19 (m, 1 H) 2.21 - 2.67 (m, 9 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.84 - 2.94 (m, 1 H) 3.19 - 3.40 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.55 - 3.61 (m, 1 H) 3.69 - 3.73 (m, 1 H) 3.91 - 4.01 (m, 1 H) 4.18 - 4.25 (m, 1 H) 4.34 - 4.41 (m, 1 H) 4.41 - 4.49 (m, 1 H) 4.51 - 4.56 (m, 1 H) 4.62 (s, 1 H) 4.94 - 4.98 (m, 1 H) 5.08 - 5.16 (m, 1 H) 7.47 (t, J=8.02 Hz, 1 H) 7.68 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.09 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 8.17 (s, 1 H)

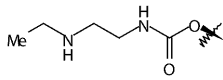
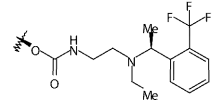
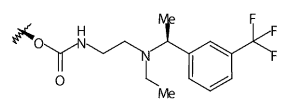
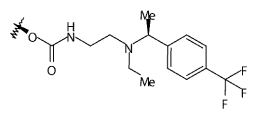
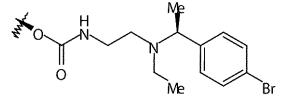
10

20

30

【 0 8 4 8 】

【表 1 1 - 6】

280		$\frac{1}{2}H$	833.5	(600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 - 1.15 (m, 1 H) 1.15 - 1.18 (m, 9 H) 1.19 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=11.92 Hz, 1 H) 1.30 (s, 3 H) 1.50 - 1.58 (m, 1 H) 1.60 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.65 (d, J=13.30 Hz, 1 H) 1.74 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.11 - 2.21 (m, 1 H) 2.22 - 2.29 (m, 1 H) 2.30 (s, 6 H) 2.30 - 2.34 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.36 - 2.47 (m, 1 H) 2.40 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.55 - 2.67 (m, 3 H) 2.70 - 2.78 (m, 2 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.89 (d, J=13.30 Hz, 1 H) 3.18 - 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.26 - 3.31 (m, 2 H) 3.33 (s, 3 H) 3.40 (s, 1 H) 3.55 - 3.62 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.20 (s, 1 H) 4.33 - 4.41 (m, 1 H) 4.44 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.53 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.28 - 5.36 (m, 1 H)
281		$\frac{1}{2}H$	1005.6	(600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.94 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 17 H) 1.29 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.50 - 1.65 (m, 3 H) 1.71 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.88 (m, 1 H) 2.10 - 2.19 (m, 1 H) 2.21 - 2.45 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.46 - 2.75 (m, 5 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.85 - 2.93 (m, 1 H) 3.15 - 3.26 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.35 - 3.40 (m, 1 H) 3.52 - 3.62 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.07 - 4.15 (m, 1 H) 4.21 - 4.29 (m, 1 H) 4.35 - 4.47 (m, 2 H) 4.54 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.93 - 5.00 (m, 1 H) 5.02 - 5.10 (m, 1 H) 7.30 (t, J=7.57 Hz, 1 H) 7.48 (t, J=7.79 Hz, 1 H) 7.58 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 7.77 (d, J=7.79 Hz, 1 H)
282		$\frac{1}{2}H$	1005.6	(600 MHz): 0.79 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.87 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.97 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.04 - 1.23 (m, 17 H) 1.28 (s, 3 H) 1.33 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.47 - 1.64 (m, 3 H) 1.68 - 1.77 (m, 1 H) 1.78 - 1.86 (m, 1 H) 2.08 - 2.17 (m, 1 H) 2.20 - 2.50 (m, 6 H) 2.25 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.50 - 2.61 (m, 3 H) 2.75 - 2.82 (m, 1 H) 2.82 - 2.91 (m, 1 H) 3.13 - 3.24 (m, 3 H) 3.20 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.33 - 3.38 (m, 1 H) 3.50 - 3.59 (m, 1 H) 3.69 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 3.85 - 3.92 (m, 1 H) 4.15 - 4.26 (m, 1 H) 4.33 - 4.45 (m, 2 H) 4.52 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.55 - 4.66 (m, 1 H) 4.92 - 4.97 (m, 1 H) 5.08 - 5.15 (m, 1 H) 7.36 - 7.42 (m, 1 H) 7.44 - 7.54 (m, 3 H)
283		$\frac{1}{2}H$	1005.6	(600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.00 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.07 - 1.27 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.34 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.50 - 1.64 (m, 3 H) 1.70 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.89 (m, 1 H) 2.11 - 2.19 (m, 1 H) 2.21 - 2.50 (m, 6 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.52 - 2.63 (m, 3 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 - 2.93 (m, 1 H) 3.16 - 3.30 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.46 (m, 1 H) 3.54 - 3.63 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.88 - 3.94 (m, 1 H) 4.23 (s, 1 H) 4.35 - 4.43 (m, 1 H) 4.42 - 4.48 (m, 1 H) 4.54 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.97 (d, J=3.67 Hz, 1 H) 5.12 - 5.20 (m, 1 H) 7.43 (d, J=7.79 Hz, 2 H) 7.55 (d, J=8.25 Hz, 2 H)
284		$\frac{1}{2}H$	1015.5	(600 MHz): 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.00 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.07 - 1.27 (m, 17 H) 1.27 - 1.33 (m, 6 H) 1.48 - 1.67 (m, 3 H) 1.69 - 1.80 (m, 1 H) 1.80 - 1.88 (m, 1 H) 2.11 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.49 (m, 6 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.49 - 2.62 (m, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 - 2.93 (m, 1 H) 3.16 - 3.27 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.36 (s, 3 H) 3.38 - 3.47 (m, 1 H) 3.55 - 3.64 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.80 - 3.87 (m, 1 H) 4.22 (s, 1 H) 4.35 - 4.42 (m, 1 H) 4.43 - 4.50 (m, 1 H) 4.53 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.93 - 5.00 (m, 1 H) 5.13 - 5.20 (m, 1 H) 7.18 (d, J=8.25 Hz, 2 H) 7.41 (d, J=8.25 Hz, 2 H)

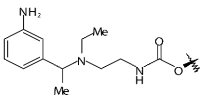
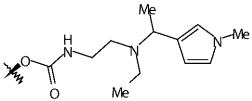
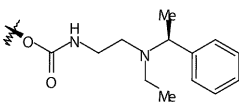
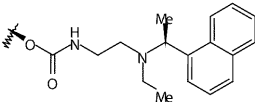
【 0 8 4 9 】

10

20

30

【表 1 1 - 7】

285		$\frac{1}{2}$ H	952.6	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=5.96 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.95 - 1.05 (m, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 17 H) 1.27 - 1.30 (m, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 - 1.68 (m, 3 H) 1.72 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.87 (m, 1 H) 2.12 - 2.18 (m, 1 H) 2.18 - 2.69 (m, 9 H) 2.26 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.75 - 2.85 (m, 1 H) 2.86 - 2.94 (m, 1 H) 3.08 - 3.46 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.53 - 3.65 (m, 1 H) 3.66 - 3.80 (m, 2 H) 4.15 - 4.28 (m, 1 H) 4.35 - 4.43 (m, 1 H) 4.42 - 4.51 (m, 1 H) 4.54 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.57 - 4.69 (m, 1 H) 4.92 - 5.00 (m, 1 H) 5.05 - 5.20 (m, 1 H) 6.51 - 6.56 (m, 1 H) 6.60 - 6.67 (m, 1 H) 6.68 - 6.75 (m, 1 H) 7.06 (t, J=7.57 Hz, 1 H)
286		$\frac{1}{2}$ H	940.6	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.78 - 0.84 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.96 - 1.04 (m, 3 H) 1.08 - 1.33 (m, 23 H) 1.49 - 1.78 (m, 4 H) 1.81 - 1.88 (m, 1 H) 2.11 - 2.64 (m, 10 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 3.15 - 3.45 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.57 - 3.65 (m, 4 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.81 - 3.89 (m, 1 H) 4.17 - 4.23 (m, 1 H) 4.36 - 4.42 (m, 1 H) 4.44 - 4.49 (m, 1 H) 4.54 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.60 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.36 (br. s., 1 H) 5.99 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 6.42 (br. s., 1 H) 6.50 (br. s., 1 H)、及び (600 MHz): 0.78 - 0.84 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.96 - 1.04 (m, 3 H) 1.08 - 1.33 (m, 23 H) 1.49 - 1.78 (m, 4 H) 1.81 - 1.88 (m, 1 H) 2.11 - 2.64 (m, 10 H) 2.27 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 3.15 - 3.45 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.57 - 3.65 (m, 4 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.81 - 3.89 (m, 1 H) 4.17 - 4.23 (m, 1 H) 4.36 - 4.42 (m, 1 H) 4.44 - 4.49 (m, 1 H) 4.54 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.60 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.36 (br. s., 1 H) 5.99 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 6.42 (br. s., 1 H) 6.50 (br. s., 1 H)
287		$\frac{1}{2}$ H	937.6	(600 MHz): 0.79 - 0.83 (m, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.00 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.07 - 1.17 (m, 13 H) 1.18 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.20 - 1.26 (m, 1 H) 1.30 (s, 3 H) 1.32 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.49 - 1.56 (m, 1 H) 1.59 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.62 - 1.88 (m, 3 H) 2.11 - 2.19 (m, 1 H) 2.22 - 2.27 (m, 2 H) 2.29 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.39 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 2.41 - 2.47 (m, 3 H) 2.52 - 2.65 (m, 3 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 - 2.91 (m, 1 H) 3.16 - 3.22 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.37 - 3.42 (m, 1 H) 3.57 - 3.64 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.87 (q, J=6.88 Hz, 1 H) 4.17 - 4.24 (m, 1 H) 4.34 - 4.42 (m, 1 H) 4.46 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.52 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.60 - 4.66 (m, 1 H) 4.96 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.18 - 5.24 (m, 1 H) 7.18 - 7.23 (m, 1 H) 7.27 - 7.30 (m, 4 H)
288		$\frac{1}{2}$ H	987.7	(600 MHz): 0.79 - 0.83 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.00 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.06 (s, 3 H) 1.08 - 1.18 (m, 13 H) 1.18 - 1.25 (m, 1 H) 1.29 (s, 3 H) 1.45 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.49 - 1.62 (m, 3 H) 1.69 - 1.88 (m, 2 H) 2.11 - 2.19 (m, 1 H) 2.20 - 2.32 (m, 2 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.38 - 2.48 (m, 2 H) 2.50 - 2.62 (m, 2 H) 2.64 - 2.73 (m, 3 H) 2.78 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 3.00 - 3.12 (m, 1 H) 3.17 - 3.22 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 - 3.41 (m, 1 H) 3.48 - 3.55 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.16 - 4.26 (m, 1 H) 4.32 - 4.39 (m, 1 H) 4.42 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.48 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.59 - 4.67 (m, 2 H) 4.95 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 4.98 - 5.04 (m, 1 H) 7.38 - 7.43 (m, 2 H) 7.43 - 7.47 (m, 1 H) 7.48 - 7.54 (m, 2 H) 7.73 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.83 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 8.34 (d, J=8.71 Hz, 1 H)

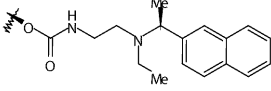
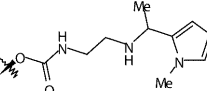
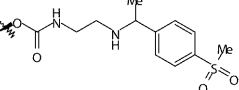
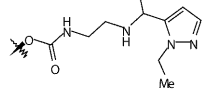
10

20

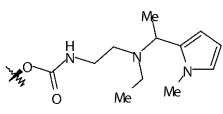
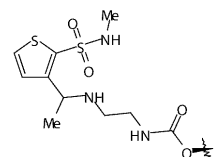
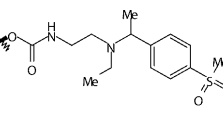
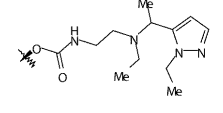
30

【 0 8 5 0 】

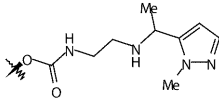
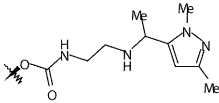
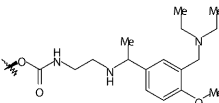
【表 1 1 - 8】

289		- S-H	987.7	(600 MHz): 0.79 - 0.84 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.02 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.06 (s, 3 H) 1.13 (d, J=7.34 Hz, 8 H) 1.13 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.19 - 1.27 (m, 1 H) 1.30 (s, 3 H) 1.42 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.49 - 1.64 (m, 2 H) 1.58 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.68 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.88 (m, 1 H) 2.12 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.25 (m, 1 H) 2.26 (s, 6 H) 2.28 - 2.32 (m, 1 H) 2.35 (s, 3 H) 2.39 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.46 - 2.55 (m, 3 H) 2.56 - 2.67 (m, 3 H) 2.78 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 3.17 - 3.23 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.36 (s, 3 H) 3.37 - 3.42 (m, 1 H) 3.57 - 3.64 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.03 (q, J=6.42 Hz, 1 H) 4.17 - 4.24 (m, 1 H) 4.35 - 4.43 (m, 1 H) 4.47 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.51 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.60 - 4.67 (m, 1 H) 4.96 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.19 - 5.23 (m, 1 H) 7.40 - 7.51 (m, 3 H) 7.67 (s, 1 H) 7.74 - 7.83 (m, 3 H)
290		- S-H	912.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 - 1.25 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.36 - 1.39 (m, 3 H) 1.50 - 1.87 (m, 5 H) 2.12 - 2.46 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.53 - 2.61 (m, 1 H) 2.66 - 2.73 (m, 2 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.86 - 2.92 (m, 1 H) 3.17 - 3.44 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.53 - 3.59 (m, 1 H) 3.61 (s, 3 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.82 - 3.87 (m, 1 H) 4.19 - 4.24 (m, 1 H) 4.35 - 4.40 (m, 1 H) 4.41 - 4.45 (m, 1 H) 4.52 - 4.55 (m, 1 H) 4.61 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.17 - 5.20 (m, 1 H) 5.96 - 5.98 (m, 1 H) 6.03 - 6.04 (m, 1 H) 6.51 - 6.53 (m, 1 H)
291		- S-H	987.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 - 1.27 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.32 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.50 - 1.87 (m, 5 H) 2.11 - 2.46 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.50 - 2.66 (m, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 - 2.91 (m, 1 H) 3.04 (s, 3 H) 3.17 - 3.44 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.53 - 3.60 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.82 - 3.88 (m, 1 H) 4.20 - 4.26 (m, 1 H) 4.35 - 4.45 (m, 2 H) 4.52 - 4.56 (m, 1 H) 4.60 - 4.66 (m, 1 H) 4.95 - 4.99 (m, 1 H) 5.15 - 5.20 (m, 1 H) 7.47 - 7.51 (m, 2 H) 7.85 - 7.89 (m, 2 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 - 1.27 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.32 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.50 - 1.87 (m, 5 H) 2.11 - 2.46 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.50 - 2.66 (m, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 - 2.91 (m, 1 H) 3.04 (s, 3 H) 3.17 - 3.44 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.53 - 3.60 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.82 - 3.88 (m, 1 H) 4.20 - 4.26 (m, 1 H) 4.35 - 4.45 (m, 2 H) 4.52 - 4.56 (m, 1 H) 4.60 - 4.66 (m, 1 H) 4.95 - 4.99 (m, 1 H) 5.15 - 5.20 (m, 1 H) 7.47 - 7.51 (m, 2 H) 7.85 - 7.89 (m, 2 H)
292		- S-H	927.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 - 1.25 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.37 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.42 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.49 - 1.87 (m, 5 H) 2.11 - 2.45 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.53 - 2.60 (m, 1 H) 2.63 - 2.70 (m, 2 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.86 - 2.91 (m, 1 H) 3.16 - 3.45 (m, 10 H) 3.52 - 3.59 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.90 - 3.95 (m, 1 H) 4.16 (q, J=7.18 Hz, 2 H) 4.20 - 4.25 (m, 1 H) 4.34 - 4.45 (m, 2 H) 4.52 - 4.55 (m, 1 H) 4.61 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.15 - 5.18 (m, 1 H) 6.07 - 6.08 (m, 1 H) 7.40 - 7.42 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 - 1.25 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.38 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.42 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.49 - 1.87 (m, 5 H) 2.11 - 2.45 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.53 - 2.60 (m, 1 H) 2.63 - 2.70 (m, 2 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.86 - 2.91 (m, 1 H) 3.16 - 3.45 (m, 10 H) 3.52 - 3.59 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.90 - 3.95 (m, 1 H) 4.16 (q, J=7.18 Hz, 2 H) 4.20 - 4.25 (m, 1 H) 4.34 - 4.45 (m, 2 H) 4.52 - 4.55 (m, 1 H) 4.61 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.15 - 5.18 (m, 1 H) 6.07 - 6.08 (m, 1 H) 7.40 - 7.42 (m, 1 H)

【表 1 1 - 9】

293		$\frac{1}{2}$ -H	940.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.03 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.06 - 1.23 (m, 17 H) 1.26 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.50 - 1.87 (m, 5 H) 2.10 - 2.63 (m, 10 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 3.11 (m, 4 H) 3.18 - 3.23 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.36 - 3.46 (m, 1 H) 3.51 - 3.57 (m, 1 H) 3.66 (s, 3 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.96 - 4.04 (m, 1 H) 4.18 - 4.24 (m, 1 H) 4.33 - 4.39 (m, 1 H) 4.41 - 4.45 (m, 1 H) 4.47 - 4.51 (m, 1 H) 4.60 - 4.71 (m, 2 H) 4.94 - 4.98 (m, 1 H) 5.98 - 6.02 (m, 2 H) 6.52 - 6.56 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.99 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.06 - 1.24 (m, 17 H) 1.26 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.49 - 1.88 (m, 5 H) 2.10 - 2.64 (m, 10 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.77 - 3.11 (m, 4 H) 3.17 - 3.21 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.36 - 3.46 (m, 1 H) 3.51 - 3.58 (m, 1 H) 3.65 (s, 3 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.96 - 4.04 (m, 1 H) 4.17 - 4.25 (m, 1 H) 4.32 - 4.39 (m, 1 H) 4.41 - 4.45 (m, 1 H) 4.47 - 4.51 (m, 1 H) 4.60 - 4.66 (m, 1 H) 4.85 - 4.89 (m, 1 H) 4.94 - 4.97 (m, 1 H) 5.99 - 6.02 (m, 2 H) 6.52 - 6.56 (m, 1 H)
294		$\frac{1}{2}$ -H	1008.6	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 - 1.25 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.37 - 1.41 (m, 3 H) 1.48 - 1.86 (m, 5 H) 2.10 - 2.47 (m, 5 H) 2.31 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.55 - 2.73 (m, 3 H) 2.70 (s, 3 H) 2.78 - 2.83 (m, 1 H) 2.86 - 2.92 (m, 1 H) 3.13 - 3.31 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.36 - 3.45 (m, 1 H) 3.52 - 3.61 (m, 1 H) 3.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.17 - 4.24 (m, 1 H) 4.34 - 4.53 (m, 4 H) 4.60 - 4.65 (m, 1 H) 4.95 - 4.98 (m, 1 H) 5.23 - 5.29 (m, 1 H) 7.12 - 7.15 (m, 1 H) 7.44 - 7.46 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 - 1.25 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.37 - 1.41 (m, 3 H) 1.48 - 1.86 (m, 5 H) 2.10 - 2.47 (m, 5 H) 2.31 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.55 - 2.73 (m, 3 H) 2.70 (s, 3 H) 2.78 - 2.83 (m, 1 H) 2.86 - 2.92 (m, 1 H) 3.13 - 3.31 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.36 - 3.45 (m, 1 H) 3.52 - 3.61 (m, 1 H) 3.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.17 - 4.24 (m, 1 H) 4.34 - 4.53 (m, 4 H) 4.60 - 4.65 (m, 1 H) 4.95 - 4.98 (m, 1 H) 5.23 - 5.29 (m, 1 H) 7.12 - 7.15 (m, 1 H) 7.44 - 7.46 (m, 1 H)
295		$\frac{1}{2}$ -H	1015.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.95 - 1.01 (m, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.35 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.49 - 1.87 (m, 5 H) 2.10 - 2.64 (m, 10 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 3.04 (s, 3 H) 3.17 - 3.26 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.41 - 3.46 (m, 1 H) 3.54 - 3.60 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.88 - 3.95 (m, 1 H) 4.22 - 4.27 (m, 1 H) 4.36 - 4.46 (m, 2 H) 4.54 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.60 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 5.12 - 5.15 (m, 1 H) 7.52 (d, J=8.71 Hz, 2 H) 7.86 (d, J=8.25 Hz, 2 H)
296		$\frac{1}{2}$ -H	955.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.80 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.03 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.05 - 1.25 (m, 17 H) 1.27 - 1.32 (m, 6 H) 1.40 - 1.45 (m, 3 H) 1.49 - 1.86 (m, 5 H) 2.10 - 2.59 (m, 10 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.76 - 3.21 (m, 5 H) 3.21 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 - 3.44 (m, 1 H) 3.49 - 3.58 (m, 1 H) 3.69 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.00 - 4.06 (m, 1 H) 4.13 - 4.45 (m, 5 H) 4.49 - 4.53 (m, 1 H) 4.59 - 4.66 (m, 1 H) 4.88 - 4.92 (m, 1 H) 4.96 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 6.09 (s, 1 H) 7.39 (s, 1 H)、及び (600 MHz): 0.80 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.99 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.15 (d, 17 H) 1.27 - 1.32 (m, 6 H) 1.40 - 1.45 (m, 3 H) 1.49 - 1.86 (m, 5 H) 2.10 - 2.59 (m, 10 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.76 - 3.21 (m, 5 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 - 3.44 (m, 1 H) 3.49 - 3.58 (m, 1 H) 3.69 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.00 - 4.06 (m, 1 H) 4.13 - 4.45 (m, 5 H) 4.49 - 4.53 (m, 1 H) 4.59 - 4.66 (m, 1 H) 4.84 - 4.88 (m, 1 H) 4.96 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 6.09 (s, 1 H) 7.39 (s, 1 H)

【表 1 1 - 1 0】

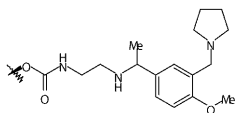
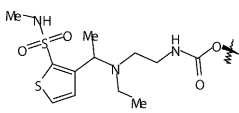
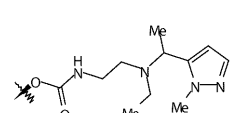
297		$-\frac{2}{3}H$	913.7	ジーステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08-1.27 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.37 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.47 - 1.87 (m, 5 H) 2.10 - 2.46 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.52 - 2.70 (m, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.86 - 2.92 (m, 1 H) 3.17 - 3.46 (m, 3 H) 3.22 (s, 4 H) 3.33 (s, 3 H) 3.53 - 3.60 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.86 (s, 3 H) 3.90 - 3.96 (m, 1 H) 4.19 - 4.26 (m, 1 H) 4.35 - 4.46 (m, 2 H) 4.51 - 4.56 (m, 1 H) 4.60 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.15 - 5.19 (m, 1 H) 6.08 - 6.10 (m, 1 H) 7.36 - 7.38 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08-1.27 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.37 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.47 - 1.87 (m, 5 H) 2.10 - 2.46 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.52 - 2.70 (m, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.86 - 2.92 (m, 1 H) 3.17 - 3.46 (m, 3 H) 3.22 (s, 4 H) 3.33 (s, 3 H) 3.53 - 3.60 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.86 (s, 3 H) 3.90 - 3.96 (m, 1 H) 4.19 - 4.26 (m, 1 H) 4.35 - 4.46 (m, 2 H) 4.51 - 4.56 (m, 1 H) 4.60 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.15 - 5.19 (m, 1 H) 6.08 - 6.10 (m, 1 H) 7.36 - 7.38 (m, 1 H)
298		$-\frac{2}{3}H$	927.7	ジーステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.76 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.84 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.01-1.20 (m, 17 H) 1.25 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.44 - 1.81 (m, 5 H) 2.03 - 2.41 (m, 5 H) 2.15 (s, 3 H) 2.24 (s, 6 H) 2.31 (s, 3 H) 2.48 - 2.55 (m, 1 H) 2.59 - 2.63 (m, 2 H) 2.73 - 2.78 (m, 1 H) 2.80 - 2.86 (m, 1 H) 3.12 - 3.39 (m, 4 H) 3.17 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.47 - 3.54 (m, 1 H) 3.65 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.72 (s, 3 H) 3.78 - 3.84 (m, 1 H) 4.14 - 4.20 (m, 1 H) 4.29 - 4.41 (m, 2 H) 4.47 - 4.50 (m, 1 H) 4.55 - 4.62 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.09 - 5.14 (m, 1 H) 5.81 (s, 1 H)、及び (600 MHz): 0.76 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.84 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.01-1.20 (m, 17 H) 1.25 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.44 - 1.81 (m, 5 H) 2.03 - 2.41 (m, 5 H) 2.15 (s, 3 H) 2.24 (s, 6 H) 2.31 (s, 3 H) 2.48 - 2.55 (m, 1 H) 2.59 - 2.63 (m, 2 H) 2.73 - 2.78 (m, 1 H) 2.80 - 2.86 (m, 1 H) 3.12 - 3.39 (m, 4 H) 3.17 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.47 - 3.54 (m, 1 H) 3.65 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.72 (s, 3 H) 3.78 - 3.84 (m, 1 H) 4.14 - 4.20 (m, 1 H) 4.29 - 4.41 (m, 2 H) 4.47 - 4.50 (m, 1 H) 4.55 - 4.62 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.09 - 5.14 (m, 1 H) 5.81 (s, 1 H)
299		$-\frac{2}{3}H$	1024.8	ジーステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.02 - 1.07 (m, 6 H) 1.07-1.25 (m, 17 H) 1.28 - 1.33 (m, 6 H) 1.49 - 1.88 (m, 5 H) 2.09 - 2.61 (m, 12 H) 2.26 - 2.31 (m, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 (d, J=13.76 Hz, 1 H) 3.12 - 3.44 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.53 - 3.62 (m, 3 H) 3.66 - 3.72 (m, 2 H) 3.79 (s, 3 H) 4.17 - 4.24 (m, 1 H) 4.35 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.46 (m, 1 H) 4.51 - 4.55 (m, 1 H) 4.61 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.25 - 5.33 (m, 1 H) 6.79 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.09 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 7.28 (s, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.02 - 1.07 (m, 6 H) 1.07-1.25 (m, 17 H) 1.28 - 1.33 (m, 6 H) 1.49 - 1.88 (m, 5 H) 2.09 - 2.61 (m, 12 H) 2.26 - 2.31 (m, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 (d, J=13.76 Hz, 1 H) 3.12 - 3.44 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.53 - 3.62 (m, 3 H) 3.66 - 3.72 (m, 2 H) 3.79 (s, 3 H) 4.17 - 4.24 (m, 1 H) 4.35 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.46 (m, 1 H) 4.51 - 4.55 (m, 1 H) 4.61 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.25 - 5.33 (m, 1 H) 6.79 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.09 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 7.28 (s, 1 H)

10

20

30

【表 1 1 - 1 1】

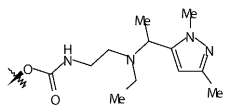
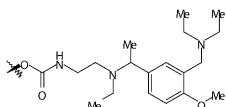
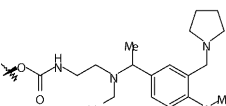
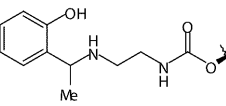
300		$\frac{1}{2}H$	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07-1.25 (m, 17 H) 1.28 - 1.33 (m, 6 H) 1.48 - 1.87 (m, 9 H) 2.11 - 2.61 (m, 12 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.83 (m, 1 H) 2.86 - 2.92 (m, 1 H) 3.13 - 3.45 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.54 - 3.73 (m, 5 H) 3.80 (s, 3 H) 4.18 - 4.24 (m, 1 H) 4.35 - 4.40 (m, 1 H) 4.41 - 4.46 (m, 1 H) 4.50 - 4.56 (m, 1 H) 4.60 - 4.68 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.25 - 5.32 (m, 1 H) 6.80 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.11 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 7.22 (s, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07-1.25 (m, 17 H) 1.28 - 1.33 (m, 6 H) 1.48 - 1.87 (m, 9 H) 2.11 - 2.61 (m, 12 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.83 (m, 1 H) 2.86 - 2.92 (m, 1 H) 3.13 - 3.45 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.54 - 3.73 (m, 5 H) 3.80 (s, 3 H) 4.18 - 4.24 (m, 1 H) 4.35 - 4.40 (m, 1 H) 4.41 - 4.46 (m, 1 H) 4.50 - 4.56 (m, 1 H) 4.60 - 4.68 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.25 - 5.32 (m, 1 H) 6.80 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.11 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 7.22 (s, 1 H)
301		$\frac{1}{2}H$	1036.7 ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.78 - 0.86 (m, 6 H) 0.86 - 0.95 (m, 6 H) 1.07 - 1.25 (m, 17 H) 1.28 - 1.31 (m, 3 H) 1.33 - 1.37 (m, 3 H) 1.49 - 1.89 (m, 5 H) 2.12 - 2.59 (m, 18 H) 2.61 (s, 3 H) 2.74 - 2.91 (m, 3 H) 3.17 - 3.46 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.54 - 3.73 (m, 2 H) 4.10 - 4.21 (m, 1 H) 4.37 - 4.55 (m, 3 H) 4.61 - 4.78 (m, 2 H) 4.95 - 4.98 (m, 1 H) 5.39 - 5.44 (m, 1 H) 7.14 - 7.18 (m, 1 H) 7.44 - 7.47 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.78 - 0.86 (m, 6 H) 0.86 - 0.95 (m, 6 H) 1.07 - 1.25 (m, 17 H) 1.28 - 1.31 (m, 3 H) 1.33 - 1.37 (m, 3 H) 1.49 - 1.89 (m, 5 H) 2.12 - 2.59 (m, 18 H) 2.60 (s, 3 H) 2.74 - 2.91 (m, 3 H) 3.17 - 3.46 (m, 4 H) 3.24 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.54 - 3.73 (m, 2 H) 4.10 - 4.21 (m, 1 H) 4.37 - 4.55 (m, 3 H) 4.61 - 4.78 (m, 2 H) 4.95 - 4.98 (m, 1 H) 5.73 - 5.80 (m, 1 H) 7.14 - 7.18 (m, 1 H) 7.44 - 7.47 (m, 1 H)
302		$\frac{1}{2}H$	941.8 ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.76 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.84 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.98 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.01 - 1.21 (m, 17 H) 1.23 - 1.27 (m, 6 H) 1.44 - 1.81 (m, 5 H) 2.05 - 2.56 (m, 10 H) 2.24 (s, 6 H) 2.30 (s, 3 H) 2.71 - 2.79 (m, 1 H) 2.79 - 2.86 (m, 1 H) 2.88 - 3.16 (m, 3 H) 3.16 (s, 3 H) 3.27 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 3.31 - 3.39 (m, 1 H) 3.46 - 3.52 (m, 1 H) 3.64 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 3.84 (s, 3 H) 3.95 - 4.02 (m, 1 H) 4.13 - 4.19 (m, 1 H) 4.28 - 4.34 (m, 1 H) 4.35 - 4.40 (m, 1 H) 4.43 - 4.50 (m, 1 H) 4.53 - 4.60 (m, 1 H) 4.80 - 4.88 (m, 1 H) 4.91 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 6.05 (s, 1 H) 7.30 (s, 1 H)、及び (600 MHz): 0.76 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.84 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.94 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.01 - 1.21 (m, 17 H) 1.23 - 1.27 (m, 6 H) 1.44 - 1.81 (m, 5 H) 2.05 - 2.56 (m, 10 H) 2.24 (s, 6 H) 2.30 (s, 3 H) 2.71 - 2.79 (m, 1 H) 2.79 - 2.86 (m, 1 H) 2.88 - 3.16 (m, 3 H) 3.16 (s, 3 H) 3.26 (s, 3 H) 3.31 - 3.39 (m, 1 H) 3.46 - 3.52 (m, 1 H) 3.64 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 3.84 (s, 3 H) 3.95 - 4.02 (m, 1 H) 4.13 - 4.19 (m, 1 H) 4.28 - 4.34 (m, 1 H) 4.35 - 4.40 (m, 1 H) 4.43 - 4.50 (m, 1 H) 4.53 - 4.60 (m, 1 H) 4.80 - 4.88 (m, 1 H) 4.91 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 6.05 (s, 1 H) 7.30 (s, 1 H)

10

20

30

【表 1 1 - 1 2】

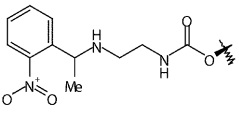
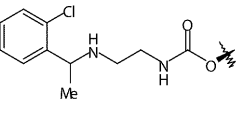
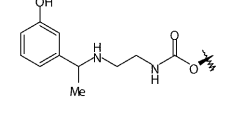
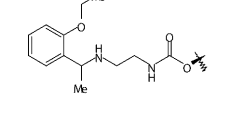
303		$-\frac{2}{3}H$	955.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.02 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.06 - 1.23 (m, 17 H) 1.25 - 1.28 (m, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.49 - 1.86 (m, 5 H) 2.10 - 2.59 (m, 10 H) 2.20 (s, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.77 - 2.83 (m, 1 H) 2.85 - 2.91 (m, 1 H) 2.96 - 3.21 (m, 3 H) 3.21 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.44 (m, 1 H) 3.51 - 3.57 (m, 1 H) 3.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.81 (s, 3 H) 3.93 - 3.99 (m, 1 H) 4.19 - 4.25 (m, 1 H) 4.33 - 4.39 (m, 1 H) 4.40 - 4.45 (m, 1 H) 4.49 - 4.53 (m, 1 H) 4.59 - 4.66 (m, 1 H) 4.88 - 4.94 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.87 (s, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.99 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.06 - 1.23 (m, 17 H) 1.25 - 1.28 (m, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.49 - 1.86 (m, 5 H) 2.10 - 2.59 (m, 10 H) 2.20 (s, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.77 - 2.83 (m, 1 H) 2.85 - 2.91 (m, 1 H) 2.96 - 3.21 (m, 3 H) 3.21 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 - 3.44 (m, 1 H) 3.51 - 3.57 (m, 1 H) 3.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.80 (s, 3 H) 3.93 - 3.99 (m, 1 H) 4.19 - 4.25 (m, 1 H) 4.33 - 4.39 (m, 1 H) 4.40 - 4.45 (m, 1 H) 4.49 - 4.53 (m, 1 H) 4.59 - 4.66 (m, 1 H) 4.88 - 4.94 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.87 (s, 1 H)
304		$-\frac{2}{3}H$	1052.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.96 - 1.00 (m, 3 H) 1.04 (t, J=7.11 Hz, 6 H) 1.07-1.25 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.31 - 1.34 (m, 3 H) 1.49 - 1.86 (m, 5 H) 2.11 - 2.66 (m, 14 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.91 (m, 2 H) 3.16 - 3.21 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.44 (m, 1 H) 3.54 - 3.58 (m, 3 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.79 (s, 3 H) 3.80 - 3.84 (m, 1 H) 4.19 - 4.25 (m, 1 H) 4.36 - 4.47 (m, 2 H) 4.53 - 4.56 (m, 1 H) 4.61 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.27 - 5.30 (m, 1 H) 6.77 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 7.10 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.29 (s, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.94 - 0.99 (m, 3 H) 1.04 (t, J=7.11 Hz, 6 H) 1.07-1.25 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.31 - 1.34 (m, 3 H) 1.49 - 1.86 (m, 5 H) 2.11 - 2.66 (m, 14 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.91 (m, 2 H) 3.16 - 3.21 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.44 (m, 1 H) 3.54 - 3.58 (m, 3 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.79 (s, 3 H) 3.80 - 3.84 (m, 1 H) 4.19 - 4.25 (m, 1 H) 4.36 - 4.47 (m, 2 H) 4.53 - 4.56 (m, 1 H) 4.61 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.27 - 5.30 (m, 1 H) 6.77 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 7.10 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.29 (s, 1 H)
305		$-\frac{2}{3}H$	1050.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.95 - 1.02 (m, 3 H) 1.04 - 1.35 (m, 23 H) 1.49 - 1.91 (m, 9 H) 2.11 - 2.73 (m, 14 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.92 (m, 2 H) 3.16 - 3.42 (m, 6 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.55 - 3.63 (m, 1 H) 3.69 - 3.73 (m, 1 H) 3.79 - 3.83 (m, 4 H) 4.20 - 4.26 (m, 1 H) 4.36 - 4.49 (m, 2 H) 4.52 - 4.56 (m, 1 H) 4.60-4.68 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.33 - 5.41 (m, 1 H) 6.78 - 6.84 (m, 1 H) 7.14 - 7.22 (m, 1 H) 7.30 - 7.36 (m, 1 H)
306		$-\frac{2}{3}H$	925.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 - 1.27 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.39 - 1.44 (m, 3 H) 1.49 - 1.88 (m, 5 H) 2.11 - 2.18 (m, 1 H) 2.22 - 2.46 (m, 4 H) 2.31 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.54 - 2.64 (m, 1 H) 2.65 - 2.74 (m, 1 H) 2.75 - 2.85 (m, 2 H) 2.86 - 2.93 (m, 1 H) 3.15 - 3.48 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.50 - 3.61 (m, 1 H) 3.67 - 3.72 (m, 1 H) 3.90 - 3.97 (m, 1 H) 4.18 - 4.27 (m, 1 H) 4.34 - 4.46 (m, 2 H) 4.54 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.59 - 4.67 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.01 - 5.07 (m, 1 H) 6.72 - 6.79 (m, 2 H) 6.90 - 6.96 (m, 1 H) 7.09 - 7.15 (m, 1 H)

10

20

30

【表 1 1 - 1 3】

307		$\frac{1}{2}H$	954.6	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 2 H) 1.10 - 1.20 (m, 15 H) 1.31 (s, 3 H) 1.40 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.47 - 1.67 (m, 3 H) 1.75 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.10 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.45 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.47 - 2.54 (m, 1 H) 2.55 - 2.65 (m, 2 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.15 - 3.31 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.35 - 3.46 (m, 1 H) 3.57 (s, 1 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.21 - 4.23 (m, 1 H) 4.23 - 4.29 (m, 1 H) 4.34 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.47 (m, 1 H) 4.50 - 4.56 (m, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.12 - 5.21 (m, 1 H) 7.34 - 7.39 (m, 1 H) 7.53 - 7.60 (m, 1 H) 7.68 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 7.74 (d, J=7.79 Hz, 1 H)
308		$\frac{1}{2}H$	943.6	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 2 H) 1.10 - 1.20 (m, 15 H) 1.29 - 1.34 (m, 6 H) 1.48 - 1.66 (m, 3 H) 1.75 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.10 - 2.20 (m, 1 H) 2.20 - 2.47 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.54 - 2.65 (m, 3 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.89 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.16 - 3.33 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.46 (m, 1 H) 3.58 (s, 1 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.21 (s, 1 H) 4.22 - 4.27 (m, 1 H) 4.35 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.47 (m, 1 H) 4.51 - 4.56 (m, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.21 - 5.30 (m, 1 H) 7.13 - 7.18 (m, 1 H) 7.21 - 7.25 (m, 1 H) 7.29 - 7.34 (m, 1 H) 7.38 - 7.42 (m, 1 H)
309		$\frac{1}{2}H$	925.6	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.77 - 0.85 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.03 - 1.37 (m, 23 H) 1.49 - 1.90 (m, 5 H) 2.09 - 2.53 (m, 5 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.45 (m, 6 H) 2.55 - 2.62 (m, 1 H) 2.70 - 2.96 (m, 3 H) 3.00 - 3.10 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.29 - 3.48 (m, 4 H) 3.36 (s, 3 H) 3.58 - 3.74 (m, 3 H) 4.08 - 4.17 (m, 1 H) 4.29 - 4.38 (m, 1 H) 4.46 - 4.55 (m, 2 H) 4.57 - 4.66 (m, 1 H) 4.93 - 4.98 (m, 1 H) 5.28 - 5.35 (m, 1 H) 6.67 - 6.76 (m, 2 H) 6.86 - 6.93 (m, 1 H) 7.09 - 7.17 (m, 1 H). 及び (600 MHz): 0.77 - 0.85 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.03 - 1.37 (m, 23 H) 1.49 - 1.90 (m, 5 H) 2.09 - 2.53 (m, 5 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.45 (m, 6 H) 2.55 - 2.62 (m, 1 H) 2.70 - 2.96 (m, 3 H) 3.00 - 3.10 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.29 - 3.48 (m, 4 H) 3.34 (s, 3 H) 3.58 - 3.74 (m, 3 H) 4.08 - 4.17 (m, 1 H) 4.29 - 4.38 (m, 1 H) 4.46 - 4.55 (m, 2 H) 4.57 - 4.66 (m, 1 H) 4.93 - 4.98 (m, 1 H) 5.01 - 5.07 (m, 1 H) 6.67 - 6.76 (m, 2 H) 6.86 - 6.93 (m, 1 H) 7.09 - 7.17 (m, 1 H)
310		$\frac{1}{2}H$	953.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.05 - 1.27 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.34 (d, J=5.50 Hz, 3 H) 1.41 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.47 - 1.71 (m, 3 H) 1.71 - 1.88 (m, 2 H) 2.09 - 2.47 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.51 - 2.64 (m, 3 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.86 - 2.92 (m, 1 H) 3.14 - 3.36 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.37 - 3.44 (m, 1 H) 3.53 - 3.64 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.99 - 4.08 (m, 3 H) 4.14 - 4.22 (m, 1 H) 4.32 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.48 (m, 1 H) 4.51 - 4.55 (m, 1 H) 4.60 - 4.68 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 5.33 - 5.41 (m, 1 H) 6.83 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 6.87 - 6.92 (m, 1 H) 7.14 - 7.22 (m, 2 H)

【 0 8 5 6 】

10

20

30

【表 1 1 - 1 4】

311		$\frac{1}{2}H$	982.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.77 - 0.85 (m, 6 H) 0.86 - 0.92 (m, 6 H) 1.05 - 1.24 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.34 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.48 - 1.89 (m, 5 H) 2.08 - 2.66 (m, 10 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.84 - 2.92 (m, 1 H) 2.97 - 3.48 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.59 - 3.75 (m, 2 H) 4.08 - 4.13 (m, 1 H) 4.32 - 4.57 (m, 4 H) 4.58 - 4.69 (m, 1 H) 4.92 - 4.99 (m, 1 H) 5.22 - 5.27 (m, 1 H) 7.32 - 7.38 (m, 1 H) 7.45 - 7.60 (m, 3 H)、及び (600 MHz): 0.77 - 0.85 (m, 6 H) 0.86 - 0.92 (m, 6 H) 1.05 - 1.24 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.36 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.48 - 1.89 (m, 5 H) 2.08 - 2.66 (m, 10 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.84 - 2.92 (m, 1 H) 2.97 - 3.48 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.59 - 3.75 (m, 2 H) 4.13 - 4.19 (m, 1 H) 4.32 - 4.57 (m, 4 H) 4.58 - 4.69 (m, 1 H) 4.92 - 4.99 (m, 1 H) 5.14 - 5.20 (m, 1 H) 7.32 - 7.38 (m, 1 H) 7.45 - 7.60 (m, 3 H)
312		$\frac{1}{2}H$	954.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.79 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.87 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 - 1.23 (m, 17 H) 1.28 (s, 3 H) 1.29 - 1.32 (m, 3 H) 1.44 - 1.67 (m, 3 H) 1.67 - 1.85 (m, 2 H) 2.06 - 2.45 (m, 6 H) 2.26 (s, 6 H) 2.33 (s, 3 H) 2.46 - 2.54 (m, 1 H) 2.57 - 2.66 (m, 1 H) 2.74 - 2.91 (m, 2 H) 3.13 - 3.42 (m, 4 H) 3.20 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.49 - 3.58 (m, 1 H) 3.67 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.82 - 3.88 (m, 1 H) 4.15 - 4.25 (m, 1 H) 4.30 - 4.45 (m, 2 H) 4.48 - 4.53 (m, 1 H) 4.56 - 4.64 (m, 1 H) 4.95 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.12 - 5.19 (m, 1 H) 7.44 (d, J=8.71 Hz, 2 H) 8.14 (d, J=8.25 Hz, 2 H)、及び (600 MHz): 0.79 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.87 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 - 1.23 (m, 17 H) 1.28 (s, 3 H) 1.29 - 1.32 (m, 3 H) 1.44 - 1.67 (m, 3 H) 1.67 - 1.85 (m, 2 H) 2.06 - 2.45 (m, 6 H) 2.26 (s, 6 H) 2.33 (s, 3 H) 2.46 - 2.54 (m, 1 H) 2.57 - 2.66 (m, 1 H) 2.74 - 2.91 (m, 2 H) 3.13 - 3.42 (m, 4 H) 3.20 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.49 - 3.58 (m, 1 H) 3.67 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.82 - 3.88 (m, 1 H) 4.15 - 4.25 (m, 1 H) 4.30 - 4.45 (m, 2 H) 4.48 - 4.53 (m, 1 H) 4.56 - 4.64 (m, 1 H) 4.95 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.12 - 5.19 (m, 1 H) 7.44 (d, J=8.71 Hz, 2 H) 8.14 (d, J=8.25 Hz, 2 H)
313		$\frac{1}{2}H$	939.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.25 (m, 17 H) 1.27 - 1.34 (m, 6 H) 1.47 - 1.69 (m, 3 H) 1.70 - 1.89 (m, 2 H) 2.11 - 2.46 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.53 - 2.66 (m, 3 H) 2.76 - 2.85 (m, 1 H) 2.85 - 2.94 (m, 1 H) 3.14 - 3.48 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.53 - 3.63 (m, 1 H) 3.66 - 3.74 (m, 2 H) 3.80 (s, 3 H) 4.21 (s, 1 H) 4.33 - 4.41 (m, 1 H) 4.41 - 4.48 (m, 1 H) 4.50 - 4.56 (m, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.19 - 5.30 (m, 1 H) 6.74 - 6.79 (m, 1 H) 6.81 (s, 1 H) 6.85 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 7.19 - 7.24 (m, 1 H)
314		$\frac{1}{2}H$	953.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.04 - 1.27 (m, 2 H) 1.05 - 1.20 (m, 18 H) 1.30 (s, 3 H) 1.37 - 1.41 (m, 3 H) 1.49 - 1.64 (m, 3 H) 1.74 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.10 - 2.21 (m, 1 H) 2.20 - 2.46 (m, 4 H) 2.30 (s, 7 H) 2.36 (s, 3 H) 2.53 - 2.95 (m, 6 H) 3.14 - 3.48 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.55 - 3.66 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.10 - 4.22 (m, 2 H) 4.37 (s, 1 H) 4.42 - 4.55 (m, 2 H) 4.64 (s, 1 H) 4.96 (s, 1 H) 5.07 - 5.17 (m, 1 H) 6.72 - 6.82 (m, 2 H) 7.02 (t, J=6.19 Hz, 1 H) 7.15 (t, J=7.79 Hz, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.04 - 1.27 (m, 2 H) 1.05 - 1.20 (m, 18 H) 1.30 (s, 3 H) 1.37 - 1.41 (m, 3 H) 1.49 - 1.64 (m, 3 H) 1.74 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.10 - 2.21 (m, 1 H) 2.20 - 2.46 (m, 4 H) 2.30 (s, 7 H) 2.36 (s, 3 H) 2.53 - 2.95 (m, 6 H) 3.14 - 3.48 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.55 - 3.66 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.04 - 4.09 (m, 1 H) 4.14 - 4.21 (m, 1 H) 4.37 (s, 1 H) 4.42 - 4.55 (m, 2 H) 4.64 (s, 1 H) 4.96 (s, 1 H) 5.07 - 5.17 (m, 1 H) 6.72 - 6.82 (m, 2 H) 7.02 (t, J=6.19 Hz, 1 H) 7.15 (t, J=7.79 Hz, 1 H)

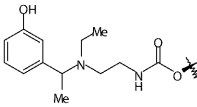
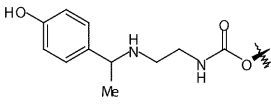
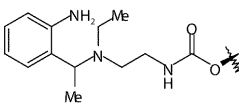
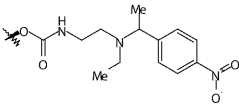
10

20

30

40

【表 1 1 - 1 5】

315		$\frac{1}{2}H$	953.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.31 (m, 2 H) 1.08 - 1.31 (m, 18 H) 1.31 - 1.34 (m, 3 H) 1.48 - 1.88 (m, 5 H) 2.08 - 2.18 (m, 1 H) 2.21 - 2.51 (m, 7 H) 2.31 - 2.39 (m, 9 H) 2.55 - 2.76 (m, 2 H) 2.77 - 2.99 (m, 2 H) 3.19 - 3.24 (m, 3 H) 3.23 - 3.54 (m, 4 H) 3.39 - 3.42 (m, 3 H) 3.59 - 3.75 (m, 2 H) 3.92 (q, J=6.42 Hz, 1 H) 4.20 (s, 1 H) 4.32 - 4.42 (m, 1 H) 4.45 - 4.52 (m, 1 H) 4.58 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.66 (s, 1 H) 4.96 - 5.02 (m, 1 H) 6.68 - 6.79 (m, 2 H) 6.98 (s, 1 H) 7.12 (t, J=7.79 Hz, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.01 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.06 - 1.31 (m, 2 H) 1.08 - 1.31 (m, 18 H) 1.31 - 1.34 (m, 3 H) 1.48 - 1.88 (m, 5 H) 2.08 - 2.18 (m, 1 H) 2.21 - 2.51 (m, 7 H) 2.31 - 2.39 (m, 9 H) 2.55 - 2.76 (m, 2 H) 2.77 - 2.99 (m, 2 H) 3.19 - 3.24 (m, 3 H) 3.23 - 3.54 (m, 4 H) 3.39 - 3.42 (m, 3 H) 3.59 - 3.75 (m, 2 H) 3.92 (q, J=6.42 Hz, 1 H) 4.17 (s, 1 H) 4.32 - 4.42 (m, 1 H) 4.45 - 4.52 (m, 1 H) 4.54 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.59 - 4.64 (m, 1 H) 4.96 - 5.02 (m, 1 H) 6.68 - 6.79 (m, 2 H) 7.07 (s, 1 H) 7.15 (t, J=7.79 Hz, 1 H)
316		$\frac{1}{2}H$	925.6	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.75 - 0.82 (m, 6 H) 0.86 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.00 - 1.17 (m, 14 H) 1.18 - 1.30 (m, 9 H) 1.43 - 1.66 (m, 3 H) 1.67 - 1.76 (m, 1 H) 1.77 - 1.86 (m, 1 H) 2.10 - 2.65 (m, 11 H) 2.30 (s, 6 H) 2.72 - 2.90 (m, 2 H) 3.12 - 3.46 (m, 4 H) 3.20 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.50 - 3.69 (m, 3 H) 4.08 - 4.14 (m, 1 H) 4.23 - 4.31 (m, 1 H) 4.41 - 4.64 (m, 3 H) 4.91 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.63 - 6.71 (m, 1 H) 6.71 - 6.79 (m, 1 H) 7.09 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 7.13 (d, J=8.25 Hz, 1 H)、及び (600 MHz): 0.75 - 0.82 (m, 6 H) 0.86 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.00 - 1.17 (m, 14 H) 1.18 - 1.30 (m, 9 H) 1.43 - 1.66 (m, 3 H) 1.67 - 1.76 (m, 1 H) 1.77 - 1.86 (m, 1 H) 2.10 - 2.65 (m, 11 H) 2.31 (s, 6 H) 2.72 - 2.90 (m, 2 H) 3.12 - 3.46 (m, 4 H) 3.19 (s, 3 H) 3.37 (s, 3 H) 3.50 - 3.69 (m, 3 H) 4.02 - 4.08 (m, 1 H) 4.23 - 4.31 (m, 1 H) 4.41 - 4.64 (m, 3 H) 4.91 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.63 - 6.71 (m, 1 H) 6.71 - 6.79 (m, 1 H) 7.09 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 7.13 (d, J=8.25 Hz, 1 H)
317		$\frac{1}{2}H$	952.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.05 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 - 1.27 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.35 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.48 - 1.90 (m, 5 H) 2.10 - 2.20 (m, 1 H) 2.21 - 2.53 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.54 - 2.70 (m, 4 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.89 (d, J=13.76 Hz, 1 H) 3.02 - 3.30 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.37 - 3.49 (m, 1 H) 3.49 - 3.59 (m, 1 H) 3.67 - 3.72 (m, 1 H) 3.93 - 4.02 (m, 1 H) 4.17 - 4.28 (m, 1 H) 4.32 - 4.39 (m, 1 H) 4.40 - 4.46 (m, 1 H) 4.49 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.58 - 4.68 (m, 1 H) 4.74 - 4.83 (m, 1 H) 4.94 - 4.98 (m, 1 H) 6.60 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 6.65 - 6.71 (m, 1 H) 7.02 - 7.08 (m, 2 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.05 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 - 1.27 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.35 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.48 - 1.90 (m, 5 H) 2.10 - 2.20 (m, 1 H) 2.21 - 2.53 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.54 - 2.70 (m, 4 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.89 (d, J=13.76 Hz, 1 H) 3.02 - 3.30 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.37 - 3.49 (m, 1 H) 3.49 - 3.59 (m, 1 H) 3.67 - 3.72 (m, 1 H) 3.93 - 4.02 (m, 1 H) 4.17 - 4.28 (m, 1 H) 4.32 - 4.39 (m, 1 H) 4.40 - 4.46 (m, 1 H) 4.49 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.58 - 4.68 (m, 1 H) 4.93 - 5.02 (m, 2 H) 6.60 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 6.65 - 6.71 (m, 1 H) 7.02 - 7.08 (m, 2 H)
318		$\frac{1}{2}H$	982.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=7.34 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.96 - 1.03 (m, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.36 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.49 - 1.66 (m, 3 H) 1.70 - 1.90 (m, 2 H) 2.10 - 2.64 (m, 10 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.76 - 2.94 (m, 2 H) 3.16 - 3.48 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.52 - 3.62 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.88 - 4.00 (m, 1 H) 4.19 - 4.29 (m, 1 H) 4.34 - 4.49 (m, 2 H) 4.51 - 4.57 (m, 1 H) 4.59 - 4.67 (m, 1 H) 4.94 - 5.00 (m, 1 H) 5.07 - 5.15 (m, 1 H) 7.50 (d, J=8.71 Hz, 2 H) 8.16 (d, J=7.34 Hz, 2 H)

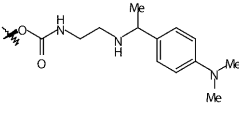
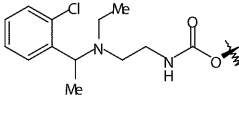
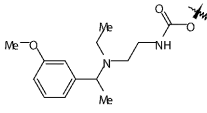
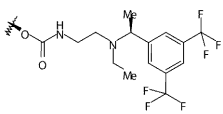
10

20

30

40

【表 1 1 - 1 6】

319		- $\frac{2}{3}$ H	952.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.25 (m, 17 H) 1.28 - 1.33 (m, 6 H) 1.49 - 1.68 (m, 3 H) 1.70 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.87 (m, 1 H) 2.11 - 2.19 (m, 1 H) 2.21 - 2.46 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.54 - 2.64 (m, 3 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 - 2.93 (m, 1 H) 2.92 (s, 6 H) 3.13 - 3.31 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.44 (m, 1 H) 3.55 - 3.62 (m, 1 H) 3.62 - 3.68 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.20 (s, 1 H) 4.34 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.47 (m, 1 H) 4.51 - 4.55 (m, 1 H) 4.59 - 4.68 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.23 - 5.31 (m, 1 H) 6.68 (d, J=8.71 Hz, 2 H) 7.12 (d, J=8.71 Hz, 2 H)
320		- $\frac{2}{3}$ H	971.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 0.94 (t, J=6.88 Hz, 3 H) 1.05 - 1.26 (m, 2 H) 1.09 - 1.20 (m, 15 H) 1.27 - 1.34 (m, 6 H) 1.48 - 1.68 (m, 3 H) 1.74 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.12 - 2.49 (m, 5 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.49 - 2.69 (m, 5 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (s, 1 H) 3.13 - 3.45 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.61 (s, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.20 (s, 1 H) 4.28 - 4.36 (m, 1 H) 4.38 (s, 1 H) 4.47 (s, 1 H) 4.49 - 4.55 (m, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.96 (s, 1 H) 5.19 - 5.30 (m, 1 H) 7.12 - 7.18 (m, 1 H) 7.19 - 7.24 (m, 1 H) 7.32 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.39 - 7.45 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 0.98 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.05 - 1.26 (m, 2 H) 1.09 - 1.20 (m, 15 H) 1.27 - 1.34 (m, 6 H) 1.48 - 1.68 (m, 3 H) 1.74 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.12 - 2.49 (m, 5 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.49 - 2.69 (m, 5 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (s, 1 H) 3.13 - 3.45 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.61 (s, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.20 (s, 1 H) 4.28 - 4.36 (m, 1 H) 4.38 (s, 1 H) 4.47 (s, 1 H) 4.49 - 4.55 (m, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.96 (s, 1 H) 5.19 - 5.30 (m, 1 H) 7.12 - 7.18 (m, 1 H) 7.19 - 7.24 (m, 1 H) 7.32 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.39 - 7.45 (m, 1 H)
321		- $\frac{2}{3}$ H	967.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.95 - 1.04 (m, 3 H) 1.07 - 1.27 (m, 2 H) 1.10 - 1.21 (m, 15 H) 1.31 (s, 3 H) 1.32 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.49 - 1.65 (m, 3 H) 1.70 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.88 (m, 1 H) 2.11 - 2.21 (m, 1 H) 2.21 - 2.53 (m, 6 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.53 - 2.65 (m, 3 H) 2.81 (dd, J=7.34, 5.50 Hz, 1 H) 2.85 - 2.93 (m, 1 H) 3.16 - 3.23 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.45 (m, 1 H) 3.55 - 3.63 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.80 (s, 3 H) 3.80 - 3.86 (m, 1 H) 4.21 (s, 1 H) 4.35 - 4.42 (m, 1 H) 4.46 (s, 1 H) 4.51 - 4.56 (m, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.94 - 4.99 (m, 1 H) 5.20 (s, 1 H) 6.76 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 6.83 (s, 1 H) 6.88 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.21 (t, J=7.57 Hz, 1 H)
322		- $\frac{2}{3}$ H	1073.7	(600 MHz): 0.79 - 0.84 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.00 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.07 - 1.18 (m, 16 H) 1.19 - 1.27 (m, 1 H) 1.30 (s, 3 H) 1.38 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.49 - 1.63 (m, J=15.13, 5.04 Hz, 2 H) 1.60 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 1.70 - 1.88 (m, 2 H) 2.11 - 2.19 (m, 1 H) 2.29 (s, 6 H) 2.30 - 2.33 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.46 (m, 3 H) 2.49 - 2.64 (m, 6 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=11.92 Hz, 1 H) 3.16 - 3.30 (m, 2 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.39 (m, 1 H) 3.52 - 3.57 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 3.96 (q, J=6.72 Hz, 1 H) 4.21 - 4.30 (m, 1 H) 4.36 - 4.44 (m, 2 H) 4.55 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.59 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.06 - 5.11 (m, 1 H) 7.75 (s, 1 H) 7.78 (s, 2 H)

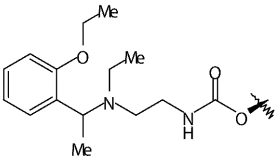
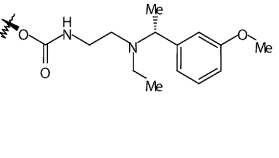
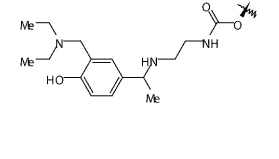
【 0 8 5 9 】

10

20

30

【表 1 1 - 1 7】

323		--H	981.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.92 - 1.00 (m, 3 H) 1.05 - 1.24 (m, 2 H) 1.10 - 1.19 (m, 15 H) 1.25 - 1.33 (m, 6 H) 1.38 - 1.43 (m, 3 H) 1.49 - 1.65 (m, 3 H) 1.74 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.12 - 2.20 (m, 1 H) 2.21 - 2.32 (m, 2 H) 2.26 (s, 6 H) 2.33 - 2.65 (m, 7 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=16.05 Hz, 1 H) 3.15 - 3.27 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 - 3.46 (m, 1 H) 3.53 - 3.63 (m, 1 H) 3.69 - 3.74 (m, 1 H) 3.96 - 4.05 (m, 2 H) 4.22 (s, 1 H) 4.33 - 4.49 (m, 3 H) 4.50 - 4.56 (m, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.39 - 5.50 (m, 1 H) 6.84 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.86 - 6.93 (m, 1 H) 7.17 (t, J=7.11 Hz, 1 H) 7.27 (s, 1 H)、及び (600 MHz): 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.92 - 1.00 (m, 3 H) 1.05 - 1.24 (m, 2 H) 1.10 - 1.19 (m, 15 H) 1.25 - 1.33 (m, 6 H) 1.38 - 1.43 (m, 3 H) 1.49 - 1.65 (m, 3 H) 1.74 (s, 1 H) 1.84 (s, 1 H) 2.12 - 2.20 (m, 1 H) 2.21 - 2.32 (m, 2 H) 2.27 (s, 6 H) 2.33 - 2.65 (m, 7 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=16.05 Hz, 1 H) 3.15 - 3.27 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.46 (m, 1 H) 3.53 - 3.63 (m, 1 H) 3.69 - 3.74 (m, 1 H) 4.04 - 4.13 (m, 2 H) 4.22 (s, 1 H) 4.33 - 4.49 (m, 3 H) 4.50 - 4.56 (m, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.39 - 5.50 (m, 1 H) 6.84 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.86 - 6.93 (m, 1 H) 7.17 (t, J=7.11 Hz, 1 H) 7.27 (s, 1 H)
324		--H	967.8	(600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.98 (t, J=6.88 Hz, 3 H) 1.06 - 1.25 (m, 2 H) 1.13 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.14 (s, 3 H) 1.15 - 1.18 (m, 6 H) 1.19 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.33 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.50 - 1.68 (m, 3 H) 1.70 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.88 (m, 1 H) 2.10 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.34 (m, 2 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.52 (m, 4 H) 2.55 - 2.65 (m, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 - 2.92 (m, 1 H) 3.16 - 3.25 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.35 - 3.42 (m, 1 H) 3.56 - 3.65 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.76 - 3.84 (m, 1 H) 3.79 (s, 3 H) 4.21 (s, 1 H) 4.35 - 4.42 (m, 1 H) 4.47 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.53 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.22 (s, 1 H) 6.76 (dd, J=7.79, 2.29 Hz, 1 H) 6.84 (s, 1 H) 6.88 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 7.21 (t, J=8.02 Hz, 1 H)
325		--H	1010.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 - 1.24 (m, 23 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 - 1.86 (m, 5 H) 2.10 - 2.45 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.54 - 2.62 (m, 7 H) 2.78 - 2.91 (m, 2 H) 3.15 - 3.46 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.54 - 3.65 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.73 (s, 2 H) 4.18 - 4.23 (m, 1 H) 4.34 - 4.40 (m, 1 H) 4.42 - 4.46 (m, 1 H) 4.52 - 4.55 (m, 1 H) 4.62 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.23 - 5.28 (m, 1 H) 6.71 - 6.73 (m, 1 H) 6.82 - 6.84 (m, 1 H) 7.01 - 7.03 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 - 1.24 (m, 23 H) 1.28 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 - 1.86 (m, 5 H) 2.10 - 2.45 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.54 - 2.62 (m, 7 H) 2.78 - 2.91 (m, 2 H) 3.15 - 3.46 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.54 - 3.65 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.73 (s, 2 H) 4.18 - 4.23 (m, 1 H) 4.34 - 4.40 (m, 1 H) 4.42 - 4.46 (m, 1 H) 4.52 - 4.55 (m, 1 H) 4.62 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.23 - 5.28 (m, 1 H) 6.71 - 6.73 (m, 1 H) 6.82 - 6.84 (m, 1 H) 7.01 - 7.03 (m, 1 H)

10

20

30

【表 1 1 - 1 8】

326		$-\frac{2}{3}H$	1022.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08-1.25 (m, 17 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 - 1.88 (m, 11 H) 2.11 - 2.63 (m, 12 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.86 - 2.91 (m, 1 H) 3.14 - 3.45 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.55 - 3.62 (m, 2 H) 3.63 (s, 2 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.19 - 4.23 (m, 1 H) 4.35 - 4.40 (m, 1 H) 4.42 - 4.46 (m, 1 H) 4.52 - 4.55 (m, 1 H) 4.61 - 4.66 (m, 1 H) 4.96 - 4.99 (m, 1 H) 5.23 - 5.26 (m, 1 H) 6.72 - 6.74 (m, 1 H) 6.82 - 6.83 (m, 1 H) 7.01 - 7.04 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08-1.25 (m, 17 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 - 1.88 (m, 11 H) 2.11 - 2.63 (m, 12 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.86 - 2.91 (m, 1 H) 3.14 - 3.45 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.55 - 3.62 (m, 2 H) 3.63 (s, 2 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.19 - 4.23 (m, 1 H) 4.35 - 4.40 (m, 1 H) 4.42 - 4.46 (m, 1 H) 4.52 - 4.55 (m, 1 H) 4.61 - 4.66 (m, 1 H) 4.96 - 4.99 (m, 1 H) 5.23 - 5.26 (m, 1 H) 6.72 - 6.74 (m, 1 H) 6.82 - 6.83 (m, 1 H) 7.01 - 7.04 (m, 1 H)
327			1036.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06-1.26 (m, 17 H) 1.28 - 1.32 (m, 6 H) 1.37 - 1.86 (m, 11 H) 2.10 - 2.46 (m, 9 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.53 - 2.61 (m, 3 H) 2.77 - 2.92 (m, 2 H) 3.12 - 3.61 (m, 7 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.65 - 3.72 (m, 2 H) 3.78 (s, 3 H) 4.19 - 4.23 (m, 1 H) 4.35 - 4.41 (m, 1 H) 4.41 - 4.45 (m, 1 H) 4.51 - 4.55 (m, 1 H) 4.60 - 4.67 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.25 - 5.32 (m, 1 H) 6.77 - 6.81 (m, 1 H) 7.07 - 7.13 (m, 1 H) 7.21 - 7.24 (m, 1 H)
328		$-\frac{2}{3}H$	1038.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07-1.25 (m, 17 H) 1.28 - 1.32 (m, 6 H) 1.50 - 1.86 (m, 5 H) 2.10 - 2.62 (m, 12 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.79 - 2.84 (m, 1 H) 2.86 - 2.92 (m, 1 H) 3.13 - 3.45 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.53 (s, 3 H) 3.54 - 3.60 (m, 1 H) 3.66 - 3.73 (m, 6 H) 3.80 (s, 2 H) 4.20 - 4.24 (m, 1 H) 4.35 - 4.40 (m, 1 H) 4.42 - 4.46 (m, 1 H) 4.54 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.60 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.23 - 5.29 (m, 1 H) 6.79 - 6.83 (m, 1 H) 7.11 - 7.14 (m, 1 H) 7.20 - 7.22 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07-1.25 (m, 17 H) 1.28 - 1.32 (m, 6 H) 1.50 - 1.86 (m, 5 H) 2.10 - 2.62 (m, 12 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.79 - 2.84 (m, 1 H) 2.86 - 2.92 (m, 1 H) 3.13 - 3.45 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.53 (s, 3 H) 3.54 - 3.60 (m, 1 H) 3.66 - 3.73 (m, 6 H) 3.80 (s, 2 H) 4.20 - 4.24 (m, 1 H) 4.35 - 4.40 (m, 1 H) 4.42 - 4.46 (m, 1 H) 4.54 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.60 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.23 - 5.29 (m, 1 H) 6.79 - 6.83 (m, 1 H) 7.11 - 7.14 (m, 1 H) 7.20 - 7.22 (m, 1 H)

【 0 8 6 1 】

10

20

30

【表 1 1 - 1 9】

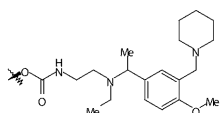
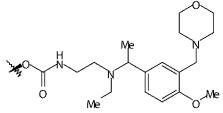
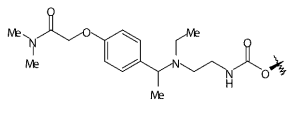
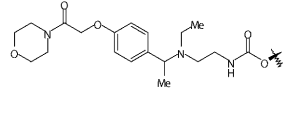
329		$\frac{1}{2}$ H	1010.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.84 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.92 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.27 (m, 17 H) 1.31 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.53 - 1.90 (m, 5 H) 2.13 - 2.48 (m, 5 H) 2.32 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.55 - 2.66 (m, 3 H) 2.80 - 2.86 (m, 1 H) 2.88 - 2.93 (m, 1 H) 3.00 (s, 3 H) 3.10 (s, 3 H) 3.17 - 3.49 (m, 4 H) 3.26 (s, 3 H) 3.36 (s, 3 H) 3.57 - 3.64 (m, 1 H) 3.68 - 3.74 (m, 2 H) 4.22 - 4.25 (m, 1 H) 4.37 - 4.42 (m, 1 H) 4.45 - 4.49 (m, 1 H) 4.54 - 4.58 (m, 1 H) 4.64 - 4.69 (m, 3 H) 4.99 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.23 - 5.28 (m, 1 H) 6.88 - 6.92 (m, 2 H) 7.17 - 7.22 (m, 2 H)、及び (600 MHz): 0.84 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.92 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.27 (m, 17 H) 1.31 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.53 - 1.90 (m, 5 H) 2.13 - 2.48 (m, 5 H) 2.32 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.55 - 2.66 (m, 3 H) 2.80 - 2.86 (m, 1 H) 2.88 - 2.93 (m, 1 H) 3.00 (s, 3 H) 3.10 (s, 3 H) 3.17 - 3.49 (m, 4 H) 3.26 (s, 3 H) 3.36 (s, 3 H) 3.57 - 3.64 (m, 1 H) 3.68 - 3.74 (m, 2 H) 4.22 - 4.25 (m, 1 H) 4.37 - 4.42 (m, 1 H) 4.45 - 4.49 (m, 1 H) 4.54 - 4.58 (m, 1 H) 4.64 - 4.69 (m, 3 H) 4.99 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.23 - 5.28 (m, 1 H) 6.88 - 6.92 (m, 2 H) 7.17 - 7.22 (m, 2 H)
330		$\frac{1}{2}$ H	1052.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07-1.25 (m, 17 H) 1.30 (s, 6 H) 1.49 - 1.88 (m, 5 H) 2.10 - 2.46 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.51 - 2.62 (m, 3 H) 2.78 - 2.83 (m, 1 H) 2.86 - 2.91 (m, 1 H) 3.15 - 3.46 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.55 - 3.72 (m, 11 H) 4.18 - 4.23 (m, 1 H) 4.34 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.47 (m, 1 H) 4.51 - 4.55 (m, 1 H) 4.61 - 4.67 (m, 3 H) 4.97 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 5.20 - 5.25 (m, 1 H) 6.85 - 6.90 (m, 2 H) 7.17 - 7.20 (m, 2 H)
331		$\frac{1}{2}$ H	1007.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=5.96 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07-1.25 (m, 17 H) 1.28 - 1.31 (m, 6 H) 1.50 - 1.88 (m, 5 H) 2.12 - 2.47 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.35 (s, 3 H) 2.53 - 2.63 (m, 7 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.86 - 2.91 (m, 1 H) 3.14 - 3.52 (m, 14 H) 3.56 - 3.62 (m, 1 H) 3.63 - 3.69 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.18 - 4.22 (m, 1 H) 4.34 - 4.40 (m, 1 H) 4.43 - 4.48 (m, 1 H) 4.53 (d, J=10.55 Hz, 1 H) 4.62 - 4.67 (m, 1 H) 4.95 - 4.98 (m, 1 H) 5.21 - 5.26 (m, 1 H) 6.87 (d, J=8.71 Hz, 2 H) 7.14 (d, J=8.25 Hz, 2 H)
332		$\frac{1}{2}$ H	1038.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.93 - 1.01 (m, 3 H) 1.05 - 1.25 (m, 23 H) 1.27 - 1.33 (m, 6 H) 1.50 - 1.88 (m, 5 H) 2.11 - 2.66 (m, 14 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.79 - 2.83 (m, 1 H) 2.85 - 2.92 (m, 1 H) 3.15 - 3.79 (m, 9 H) 3.23 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 4.20 - 4.25 (m, 1 H) 4.36 - 4.42 (m, 1 H) 4.44 - 4.48 (m, 1 H) 4.52 - 4.56 (m, 1 H) 4.61 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.22 - 5.25 (m, 1 H) 6.72 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.84 (br. s., 1 H) 7.05 (d, J=8.25 Hz, 1 H)
333		$\frac{1}{2}$ H	1050.9	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.84 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.92 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.95 - 1.05 (m, 3 H) 1.10-1.28 (m, 17 H) 1.29 - 1.35 (m, 6 H) 1.49 - 1.91 (m, 11 H) 2.14 - 2.65 (m, 14 H) 2.31 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.81 - 2.87 (m, 1 H) 2.88 - 2.95 (m, 1 H) 3.17 - 3.50 (m, 4 H) 3.25 (s, 3 H) 3.37 (s, 3 H) 3.59 - 3.82 (m, 5 H) 4.23 - 4.27 (m, 1 H) 4.40 - 4.45 (m, 1 H) 4.47 - 4.51 (m, 1 H) 4.54 - 4.60 (m, 1 H) 4.64 - 4.69 (m, 1 H) 5.00 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.24 - 5.27 (m, 1 H) 6.74 - 6.76 (m, 1 H) 6.84 - 6.87 (m, 1 H) 7.06 - 7.10 (m, 1 H)

10

20

30

【表 1 1 - 2 0】

334		$-\frac{5}{2}H$	1064.9	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.95 - 1.01 (m, 3 H) 1.07 - 1.25 (m, 17 H) 1.28 - 1.34 (m, 6 H) 1.37 - 1.87 (m, 11 H) 2.10 - 2.64 (m, 14 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.78 - 2.83 (m, 1 H) 2.86 - 2.92 (m, 1 H) 3.15 - 3.24 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.36 - 3.61 (m, 4 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.77 - 3.86 (m, 4 H) 4.21 - 4.26 (m, 1 H) 4.37 - 4.47 (m, 2 H) 4.53 - 4.57 (m, 1 H) 4.61 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.31 - 5.38 (m, 1 H) 6.78 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.08 - 7.13 (m, 1 H) 7.26 - 7.29 (m, 1 H)
335		$-\frac{5}{2}H$	1066.9	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.95 - 1.01 (m, 3 H) 1.07 - 1.25 (m, 17 H) 1.28 - 1.35 (m, 6 H) 1.50 - 1.87 (m, 5 H) 2.10 - 2.51 (m, 11 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.53 - 2.64 (m, 3 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.86 - 2.91 (m, 1 H) 3.16 - 3.24 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.45 (m, 1 H) 3.52 - 3.60 (m, 1 H) 3.54 (s, 2 H) 3.67 - 3.73 (m, 5 H) 3.77 - 3.85 (m, 4 H) 4.21 - 4.27 (m, 1 H) 4.36 - 4.47 (m, 2 H) 4.53 - 4.56 (m, 1 H) 4.61 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.27 - 5.33 (m, 1 H) 6.80 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.11 - 7.16 (m, 1 H) 7.23 - 7.26 (m, 1 H)
336		$-\frac{5}{2}H$	1038.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.94 - 1.01 (m, 3 H) 1.07 - 1.26 (m, 17 H) 1.28 - 1.33 (m, 6 H) 1.50 - 1.88 (m, 5 H) 2.12 - 2.47 (m, 7 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.51 - 2.62 (m, 3 H) 2.77 - 2.92 (m, 2 H) 2.98 (s, 3 H) 3.08 (s, 3 H) 3.16 - 3.23 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.37 - 3.45 (m, 1 H) 3.56 - 3.64 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.76 - 3.84 (m, 1 H) 4.19 - 4.24 (m, 1 H) 4.36 - 4.42 (m, 1 H) 4.44 - 4.48 (m, 1 H) 4.52 - 4.55 (m, 1 H) 4.62 - 4.65 (m, 1 H) 4.65 (s, 2 H) 4.95 - 4.99 (m, 1 H) 5.19 - 5.24 (m, 1 H) 6.87 (d, J=8.25 Hz, 2 H) 7.19 (d, J=8.25 Hz, 2 H)
337		$-\frac{5}{2}H$	1080.9	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.77 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.85 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.89 - 0.96 (m, 3 H) 1.03 - 1.21 (m, 17 H) 1.24 - 1.28 (m, 6 H) 1.45 - 1.83 (m, 5 H) 2.09 - 2.43 (m, 7 H) 2.24 (s, 6 H) 2.31 (s, 3 H) 2.47 - 2.57 (m, 3 H) 2.74 - 2.79 (m, 1 H) 2.82 - 2.86 (m, 1 H) 3.13 - 3.18 (m, 3 H) 3.19 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.33 - 3.40 (m, 1 H) 3.53 - 3.63 (m, 9 H) 3.67 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.72 - 3.80 (m, 1 H) 4.16 - 4.20 (m, 1 H) 4.32 - 4.37 (m, 1 H) 4.40 - 4.43 (m, 1 H) 4.48 - 4.51 (m, 1 H) 4.57 - 4.63 (m, 3 H) 4.92 - 4.94 (m, 1 H) 5.15 - 5.19 (m, 1 H) 6.82 (d, J=8.25 Hz, 2 H) 7.16 (d, J=8.25 Hz, 2 H)

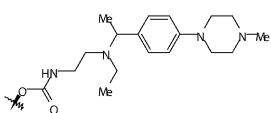
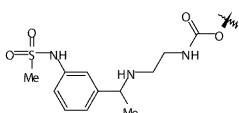
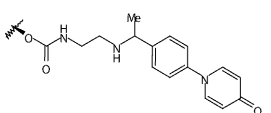
10

20

【 0 8 6 3 】

30

【表 1 1 - 2 1】

338		- $\frac{5}{2}$ H	1035.9	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.77 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.85 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.89 - 0.96 (m, 3 H) 1.03 - 1.21 (m, 17 H) 1.24 - 1.28 (m, 6 H) 1.45 - 1.83 (m, 5 H) 2.09 - 2.43 (m, 7 H) 2.24 (s, 6 H) 2.31 (s, 3 H) 2.47 - 2.57 (m, 3 H) 2.74 - 2.79 (m, 1 H) 2.82 - 2.86 (m, 1 H) 3.13 - 3.18 (m, 3 H) 3.19 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.33 - 3.40 (m, 1 H) 3.53 - 3.63 (m, 9 H) 3.67 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.72 - 3.80 (m, 1 H) 4.16 - 4.20 (m, 1 H) 4.32 - 4.37 (m, 1 H) 4.40 - 4.43 (m, 1 H) 4.48 - 4.51 (m, 1 H) 4.57 - 4.63 (m, 3 H) 4.92 - 4.94 (m, 1 H) 5.15 - 5.19 (m, 1 H) 6.82 (d, J=8.25 Hz, 2 H) 7.16 (d, J=8.25 Hz, 2 H)
339		- $\frac{5}{2}$ H	1002.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 2 H) 1.09 - 1.19 (m, 15 H) 1.28 - 1.35 (m, 6 H) 1.50 - 1.58 (m, 1 H) 1.57 - 1.63 (m, 1 H) 1.68 - 1.80 (m, 2 H) 1.83 (s, 1 H) 2.09 - 2.19 (m, 1 H) 2.21 - 2.45 (m, 4 H) 2.32 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.49 - 2.59 (m, 1 H) 2.59 - 2.72 (m, 2 H) 2.76 - 2.84 (m, 1 H) 2.89 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 3.00 (s, 3 H) 3.15 - 3.28 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.47 (m, 1 H) 3.57 (s, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.74 (q, J=6.72 Hz, 1 H) 4.17 - 4.26 (m, 1 H) 4.34 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.47 (m, 1 H) 4.50 - 4.55 (m, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.94 - 4.99 (m, 1 H) 5.19 - 5.26 (m, 1 H) 7.06 - 7.14 (m, 2 H) 7.18 (s, 1 H) 7.26 - 7.31 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 2 H) 1.09 - 1.19 (m, 15 H) 1.28 - 1.35 (m, 6 H) 1.50 - 1.58 (m, 1 H) 1.57 - 1.63 (m, 1 H) 1.68 - 1.80 (m, 2 H) 1.83 (s, 1 H) 2.09 - 2.19 (m, 1 H) 2.21 - 2.45 (m, 4 H) 2.32 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.49 - 2.59 (m, 1 H) 2.59 - 2.72 (m, 2 H) 2.76 - 2.84 (m, 1 H) 2.89 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 3.01 (s, 3 H) 3.15 - 3.28 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.47 (m, 1 H) 3.57 (s, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.74 (q, J=6.72 Hz, 1 H) 4.17 - 4.26 (m, 1 H) 4.34 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.47 (m, 1 H) 4.50 - 4.55 (m, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.94 - 4.99 (m, 1 H) 5.25 - 5.31 (m, 1 H) 7.06 - 7.14 (m, 2 H) 7.18 (s, 1 H) 7.26 - 7.31 (m, 1 H)
340		- $\frac{5}{2}$ H	1002.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.79 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.87 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 - 1.24 (m, 2 H) 1.07 - 1.19 (m, 15 H) 1.28 (s, 3 H) 1.29 - 1.34 (m, 3 H) 1.48 - 1.56 (m, 1 H) 1.56 - 1.61 (m, 1 H) 1.60 - 1.87 (m, 3 H) 2.07 - 2.18 (m, 1 H) 2.19 - 2.45 (m, 4 H) 2.30 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.49 - 2.67 (m, 3 H) 2.75 - 2.82 (m, 1 H) 2.83 - 2.90 (m, 1 H) 3.13 - 3.45 (m, 4 H) 3.20 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.50 - 3.59 (m, 1 H) 3.68 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.77 - 3.85 (m, 1 H) 4.20 (s, 1 H) 4.32 - 4.39 (m, 1 H) 4.39 - 4.44 (m, 1 H) 4.50 - 4.54 (m, 1 H) 4.60 (s, 1 H) 4.95 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.16 - 5.23 (m, 1 H) 6.47 (d, J=7.79 Hz, 2 H) 7.24 - 7.28 (m, 2 H) 7.39 - 7.45 (m, 2 H) 7.54 (d, J=7.79 Hz, 2 H)、及び (600 MHz): 0.79 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.87 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 - 1.24 (m, 2 H) 1.07 - 1.19 (m, 15 H) 1.28 (s, 3 H) 1.29 - 1.34 (m, 3 H) 1.48 - 1.56 (m, 1 H) 1.56 - 1.61 (m, 1 H) 1.60 - 1.87 (m, 3 H) 2.07 - 2.18 (m, 1 H) 2.19 - 2.45 (m, 4 H) 2.30 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.49 - 2.67 (m, 3 H) 2.75 - 2.82 (m, 1 H) 2.83 - 2.90 (m, 1 H) 3.13 - 3.45 (m, 4 H) 3.20 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.50 - 3.59 (m, 1 H) 3.68 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.77 - 3.85 (m, 1 H) 4.20 (s, 1 H) 4.32 - 4.39 (m, 1 H) 4.39 - 4.44 (m, 1 H) 4.50 - 4.54 (m, 1 H) 4.60 (s, 1 H) 4.95 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.16 - 5.23 (m, 1 H) 6.47 (d, J=7.79 Hz, 2 H) 7.24 - 7.28 (m, 2 H) 7.39 - 7.45 (m, 2 H) 7.54 (d, J=7.79 Hz, 2 H)

【 0 8 6 4 】

10

20

30

【表 1 1 - 2 2】

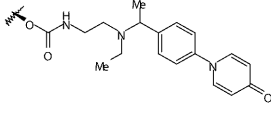
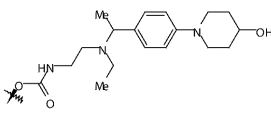
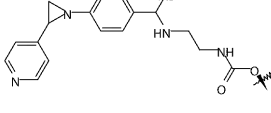
341		$\frac{1}{2}H$	1008.8	ジアステレオマーの混合物 (500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.45 Hz, 3 H) 1.04 - 1.26 (m, 2 H) 1.07 - 1.21 (m, 15 H) 1.27 - 1.34 (m, 6 H) 1.47 - 1.79 (m, 6 H) 1.79 - 1.89 (m, 1 H) 1.92 - 2.03 (m, 2 H) 2.08 - 2.47 (m, 5 H) 2.31 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.52 - 2.68 (m, 3 H) 2.75 - 2.83 (m, 1 H) 2.83 - 2.92 (m, 3 H) 3.12 - 3.45 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.47 - 3.55 (m, 2 H) 3.54 - 3.62 (m, 1 H) 3.63 - 3.72 (m, 2 H) 3.76 - 3.85 (m, 1 H) 4.17 (s, 1 H) 4.31 - 4.40 (m, 1 H) 4.41 - 4.47 (m, 1 H) 4.48 - 4.53 (m, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.95 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.36 - 5.45 (m, 1 H) 6.86 (d, J=8.79 Hz, 2 H) 7.13 (d, J=8.79 Hz, 2 H)
342		$\frac{1}{2}H$	1031.7	ジアステレオマーの混合物 (500 MHz): 0.82 (d, J=7.20 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.20 Hz, 3 H) 1.06 - 1.23 (m, 17 H) 1.28 - 1.33 (m, 6 H) 1.48 - 1.66 (m, 3 H) 1.69 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.89 (m, 1 H) 2.10 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.46 (m, 4 H) 2.31 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.48 - 2.70 (m, 3 H) 2.77 - 2.94 (m, 2 H) 2.83 (s, 6 H) 3.12 - 3.48 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.52 - 3.63 (m, 1 H) 3.67 - 3.76 (m, 2 H) 4.13 - 4.28 (m, 1 H) 4.33 - 4.49 (m, 2 H) 4.50 - 4.56 (m, 1 H) 4.59 - 4.68 (m, 1 H) 4.94 - 4.99 (m, 1 H) 5.22 - 5.31 (m, 1 H) 6.98 - 7.27 (m, 4 H)、及び (500 MHz): 0.82 (d, J=7.20 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.20 Hz, 3 H) 1.06 - 1.23 (m, 17 H) 1.28 - 1.33 (m, 6 H) 1.48 - 1.66 (m, 3 H) 1.69 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.89 (m, 1 H) 2.10 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.46 (m, 4 H) 2.31 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.48 - 2.70 (m, 3 H) 2.77 - 2.94 (m, 2 H) 2.84 (s, 6 H) 3.12 - 3.48 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.52 - 3.63 (m, 1 H) 3.67 - 3.76 (m, 2 H) 4.13 - 4.28 (m, 1 H) 4.33 - 4.49 (m, 2 H) 4.50 - 4.56 (m, 1 H) 4.59 - 4.68 (m, 1 H) 4.94 - 4.99 (m, 1 H) 5.22 - 5.31 (m, 1 H) 6.98 - 7.27 (m, 4 H)
343		$\frac{1}{2}H$	1030.7	ジアステレオマーの混合物 (500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 0.95 - 1.03 (m, 3 H) 1.05 - 1.27 (m, 2 H) 1.10 - 1.19 (m, 15 H) 1.29 - 1.34 (m, 6 H) 1.50 - 1.58 (m, 1 H) 1.57 - 1.64 (m, 1 H) 1.64 - 1.90 (m, 3 H) 2.10 - 2.20 (m, 1 H) 2.21 - 2.45 (m, 4 H) 2.33 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.44 - 2.65 (m, 4 H) 2.66 - 2.76 (m, 1 H) 2.76 - 2.85 (m, 1 H) 2.90 (d, J=14.91 Hz, 1 H) 3.00 (s, 3 H) 3.05 - 3.44 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.53 - 3.62 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.84 (q, J=6.75 Hz, 1 H) 4.24 (s, 1 H) 4.36 - 4.45 (m, 1 H) 4.47 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.50 - 4.56 (m, 1 H) 4.62 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.20 - 5.26 (m, 1 H) 7.09 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 7.15 (t, J=7.26 Hz, 1 H) 7.26 (t, J=7.45 Hz, 1 H) 7.32 (d, J=13.00 Hz, 1 H)、及び (500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 0.95 - 1.03 (m, 3 H) 1.05 - 1.27 (m, 2 H) 1.10 - 1.19 (m, 15 H) 1.29 - 1.34 (m, 6 H) 1.50 - 1.58 (m, 1 H) 1.57 - 1.64 (m, 1 H) 1.64 - 1.90 (m, 3 H) 2.10 - 2.20 (m, 1 H) 2.21 - 2.45 (m, 4 H) 2.33 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.44 - 2.65 (m, 4 H) 2.66 - 2.76 (m, 1 H) 2.76 - 2.85 (m, 1 H) 2.90 (d, J=14.91 Hz, 1 H) 3.00 (s, 3 H) 3.13 - 3.42 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.53 - 3.62 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.84 (q, J=6.75 Hz, 1 H) 4.24 (s, 1 H) 4.36 - 4.45 (m, 1 H) 4.47 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.50 - 4.56 (m, 1 H) 4.62 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.25 - 5.31 (m, 1 H) 7.09 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 7.15 (t, J=7.26 Hz, 1 H) 7.26 (t, J=7.45 Hz, 1 H) 7.32 (d, J=13.00 Hz, 1 H)

10

20

30

【表 1 1 - 2 3】

344		$-\frac{2}{3}H$	1030.8	ジアステレオマーの混合物 (500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.45 Hz, 3 H) 0.95 - 1.05 (m, 3 H) 1.06 - 1.27 (m, 2 H) 1.10 (s, 3 H) 1.12 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 1.14 - 1.21 (m, 9 H) 1.29 (s, 3 H) 1.36 (d, J=4.97 Hz, 3 H) 1.49 - 1.63 (m, 2 H) 1.63 - 1.70 (m, 1 H) 1.70 - 1.79 (m, 1 H) 1.79 - 1.89 (m, 1 H) 2.11 - 2.20 (m, 1 H) 2.20 - 2.68 (m, 9 H) 2.31 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.76 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=15.29 Hz, 1 H) 3.19 - 3.27 (m, 3 H) 3.21 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.33 - 3.40 (m, 1 H) 3.53 - 3.61 (m, 1 H) 3.69 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.90 - 3.96 (m, 1 H) 4.21 (s, 1 H) 4.33 - 4.42 (m, 1 H) 4.44 (d, J=6.50 Hz, 1 H) 4.52 (d, J=9.94 Hz, 1 H) 4.62 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 5.17 - 5.28 (m, 1 H) 6.49 (d, J=7.64 Hz, 2 H) 7.23 - 7.30 (m, 2 H) 7.47 (d, J=8.79 Hz, 2 H) 7.58 (d, J=7.65 Hz, 2 H)、及び (500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.45 Hz, 3 H) 0.95 - 1.05 (m, 3 H) 1.06 - 1.27 (m, 2 H) 1.10 (s, 3 H) 1.12 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 1.14 - 1.21 (m, 9 H) 1.29 (s, 3 H) 1.36 (d, J=4.97 Hz, 3 H) 1.49 - 1.63 (m, 2 H) 1.63 - 1.70 (m, 1 H) 1.70 - 1.79 (m, 1 H) 1.79 - 1.89 (m, 1 H) 2.11 - 2.20 (m, 1 H) 2.20 - 2.68 (m, 9 H) 2.31 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.76 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=15.29 Hz, 1 H) 3.19 - 3.27 (m, 3 H) 3.21 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.33 - 3.40 (m, 1 H) 3.53 - 3.61 (m, 1 H) 3.69 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.86 - 3.91 (m, 1 H) 4.21 (s, 1 H) 4.33 - 4.42 (m, 1 H) 4.44 (d, J=6.50 Hz, 1 H) 4.53 (d, J=9.56 Hz, 1 H) 4.62 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 5.17 - 5.28 (m, 1 H) 6.49 (d, J=7.64 Hz, 2 H) 7.23 - 7.30 (m, 2 H) 7.46 (d, J=8.41 Hz, 2 H) 7.58 (d, J=7.65 Hz, 2 H)
345		$-\frac{2}{3}H$	1036.8	ジアステレオマーの混合物 (500 MHz): 0.81 (d, J=6.50 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 0.94 - 1.02 (m, 3 H) 1.07 - 1.26 (m, 2 H) 1.10 - 1.21 (m, 15 H) 1.26 - 1.35 (m, 6 H) 1.46 - 1.79 (m, 6 H) 1.79 - 1.90 (m, 1 H) 1.93 - 2.02 (m, 2 H) 2.11 - 2.20 (m, 1 H) 2.21 - 2.49 (m, 6 H) 2.28 - 2.31 (m, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.51 - 2.66 (m, 3 H) 2.76 - 2.84 (m, 1 H) 2.84 - 2.92 (m, 3 H) 3.14 - 3.26 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.34 - 3.42 (m, 1 H) 3.48 - 3.56 (m, 2 H) 3.55 - 3.64 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.64 Hz, 1 H) 3.74 - 3.86 (m, 2 H) 4.19 (s, 1 H) 4.33 - 4.41 (m, 1 H) 4.43 - 4.49 (m, 1 H) 4.52 (d, J=9.56 Hz, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.33 (s, 1 H) 6.86 (d, J=8.41 Hz, 2 H) 7.14 (d, J=8.41 Hz, 2 H)
346		$-\frac{2}{3}H$	1027.8	ジアステレオマーの混合物 (500 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.45 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 17 H) 1.27 - 1.32 (m, 6 H) 1.48 - 1.90 (m, 5 H) 2.11 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.47 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.49 - 2.65 (m, 4 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.89 (d, J=14.91 Hz, 1 H) 3.02 - 3.06 (m, 1 H) 3.14 - 3.45 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.53 - 3.63 (m, 1 H) 3.66 - 3.73 (m, 2 H) 4.21 (s, 1 H) 4.34 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.47 (m, 1 H) 4.50 - 4.57 (m, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.21 - 5.28 (m, 1 H) 6.95 (d, J=8.41 Hz, 2 H) 7.16 (d, J=8.41 Hz, 2 H) 7.29 (d, J=6.12 Hz, 2 H) 8.56 (d, J=5.73 Hz, 2 H)

10

20

30

【 0 8 6 6 】

【表 1 1 - 2 4】

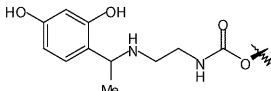
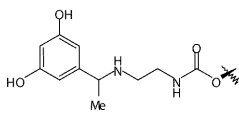
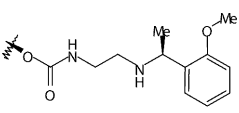
347		--H	1059.8	ジアステレオマーの混合物 (500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.45 Hz, 3 H) 0.94 - 1.03 (m, 3 H) 1.04 - 1.26 (m, 2 H) 1.11 - 1.19 (m, 15 H) 1.26 - 1.34 (m, 6 H) 1.48 - 1.69 (m, 3 H) 1.69 - 1.79 (m, 1 H) 1.78 - 1.87 (m, 1 H) 2.09 - 2.19 (m, 1 H) 2.21 - 2.71 (m, 9 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.82 (s, 6 H) 2.88 (d, J=15.29 Hz, 1 H) 3.04 - 3.40 (m, 4 H) 3.21 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.54 - 3.61 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 3.77 - 3.87 (m, 1 H) 4.26 (s, 1 H) 4.38 - 4.50 (m, 2 H) 4.50 - 4.56 (m, 1 H) 4.62 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 5.28 - 5.35 (m, 1 H) 6.98 - 7.11 (m, 2 H) 7.18 - 7.25 (m, 1 H) 7.29 (d, J=14.14 Hz, 1 H)、及び (500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.45 Hz, 3 H) 0.94 - 1.03 (m, 3 H) 1.04 - 1.26 (m, 2 H) 1.11 - 1.19 (m, 15 H) 1.26 - 1.34 (m, 6 H) 1.48 - 1.69 (m, 3 H) 1.69 - 1.79 (m, 1 H) 1.78 - 1.87 (m, 1 H) 2.09 - 2.19 (m, 1 H) 2.21 - 2.71 (m, 9 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.82 (s, 6 H) 2.88 (d, J=15.29 Hz, 1 H) 3.10 - 3.42 (m, 4 H) 3.21 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.54 - 3.61 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 3.77 - 3.87 (m, 1 H) 4.26 (s, 1 H) 4.38 - 4.50 (m, 2 H) 4.50 - 4.56 (m, 1 H) 4.62 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 5.22 - 5.28 (m, 1 H) 6.98 - 7.11 (m, 2 H) 7.18 - 7.25 (m, 1 H) 7.29 (d, J=14.14 Hz, 1 H)
348		--H	913.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 - 1.26 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.34 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.51 - 1.88 (m, 5 H) 2.13 - 2.46 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.55 - 2.61 (m, 1 H) 2.66 - 2.70 (m, 2 H) 2.79 - 2.84 (m, 1 H) 2.87 - 2.92 (m, 1 H) 3.18 - 3.36 (m, 6 H) 3.23 (s, 3 H) 3.37 - 3.42 (m, 1 H) 3.54 - 3.62 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.74 - 3.79 (m, 1 H) 3.86 (s, 3 H) 4.19 - 4.24 (m, 1 H) 4.35 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.46 (m, 1 H) 4.54 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.62 - 4.67 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.26 - 5.30 (m, 1 H) 7.24 (s, 1 H) 7.37 (s, 1 H)、及び (600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 - 1.26 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.33 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.51 - 1.88 (m, 5 H) 2.13 - 2.46 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.55 - 2.61 (m, 1 H) 2.66 - 2.70 (m, 2 H) 2.79 - 2.84 (m, 1 H) 2.87 - 2.92 (m, 1 H) 3.18 - 3.36 (m, 6 H) 3.23 (s, 3 H) 3.37 - 3.42 (m, 1 H) 3.54 - 3.62 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.74 - 3.79 (m, 1 H) 3.86 (s, 3 H) 4.19 - 4.24 (m, 1 H) 4.35 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.46 (m, 1 H) 4.54 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.62 - 4.67 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.26 - 5.30 (m, 1 H) 7.24 (s, 1 H) 7.37 (s, 1 H)
349		--H	988.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.07 - 1.26 (m, 14 H) 1.30 - 1.34 (m, 6 H) 1.51 - 1.88 (m, 5 H) 2.10 - 2.84 (m, 18 H) 2.87 - 2.93 (m, 1 H) 3.18 - 3.34 (m, 9 H) 3.37 - 3.44 (m, 1 H) 3.53 - 3.61 (m, 1 H) 3.68 - 3.72 (m, 1 H) 3.81 - 3.86 (m, 1 H) 4.19 - 4.22 (m, 1 H) 4.34 - 4.46 (m, 2 H) 4.52 - 4.56 (m, 1 H) 4.61 - 4.67 (m, 1 H) 4.94 - 4.99 (m, 1 H) 5.32 - 5.41 (m, 1 H) 7.44 (d, J=8.25 Hz, 2 H) 7.83 - 7.87 (m, 2 H)、及び (600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.03 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.07 - 1.26 (m, 14 H) 1.30 - 1.34 (m, 6 H) 1.51 - 1.88 (m, 5 H) 2.10 - 2.84 (m, 18 H) 2.87 - 2.93 (m, 1 H) 3.18 - 3.34 (m, 9 H) 3.37 - 3.44 (m, 1 H) 3.53 - 3.61 (m, 1 H) 3.68 - 3.72 (m, 1 H) 3.81 - 3.86 (m, 1 H) 4.19 - 4.22 (m, 1 H) 4.34 - 4.46 (m, 2 H) 4.52 - 4.56 (m, 1 H) 4.61 - 4.67 (m, 1 H) 4.94 - 4.99 (m, 1 H) 5.32 - 5.41 (m, 1 H) 7.44 (d, J=8.25 Hz, 2 H) 7.83 - 7.87 (m, 2 H)

10

20

30

【表 1 1 - 2 5】

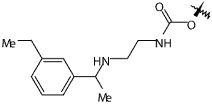
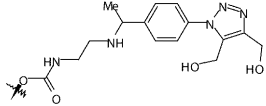
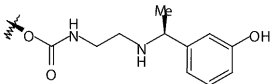
350		$\frac{1}{2}H$	941.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.83 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.04 - 1.37 (m, 20 H) 1.44 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.52 - 1.90 (m, 5 H) 2.13 - 2.45 (m, 5 H) 2.43 (s, 6 H) 2.53 (s, 3 H) 2.55 - 2.98 (m, 5 H) 3.08 - 3.51 (m, 10 H) 3.60 - 3.72 (m, 2 H) 3.78 - 3.99 (m, 1 H) 4.04 - 4.18 (m, 1 H) 4.30 - 4.39 (m, 1 H) 4.46 - 4.55 (m, 2 H) 4.60 - 4.67 (m, 1 H) 4.88 - 4.92 (m, 1 H) 4.97 - 5.00 (m, 1 H) 6.11 - 6.32 (m, 2 H) 6.79 (d, J=8.25 Hz, 1 H), 及び (600 MHz): 0.83 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.04 - 1.37 (m, 20 H) 1.42 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.52 - 1.90 (m, 5 H) 2.13 - 2.45 (m, 5 H) 2.43 (s, 6 H) 2.53 (s, 3 H) 2.55 - 2.98 (m, 5 H) 3.08 - 3.51 (m, 10 H) 3.60 - 3.72 (m, 2 H) 3.78 - 3.99 (m, 1 H) 4.04 - 4.18 (m, 1 H) 4.30 - 4.39 (m, 1 H) 4.46 - 4.55 (m, 2 H) 4.60 - 4.67 (m, 1 H) 4.88 - 4.92 (m, 1 H) 4.97 - 5.00 (m, 1 H) 6.11 - 6.32 (m, 2 H) 6.79 (d, J=8.25 Hz, 1 H)
351		$\frac{1}{2}H$	941.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=5.96 Hz, 6 H) 0.89 - 0.93 (m, 3 H) 1.05 - 1.22 (m, 16 H) 1.23 - 1.34 (m, 7 H) 1.50 - 1.89 (m, 5 H) 2.11 - 3.03 (m, 10 H) 2.38 (s, 6 H) 2.45 (s, 3 H) 3.15 - 3.55 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.38 (s, 3 H) 3.57 - 3.66 (m, 2 H) 3.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.11 - 4.18 (m, 1 H) 4.32 - 4.39 (m, 1 H) 4.47 - 4.56 (m, 2 H) 4.59 - 4.66 (m, 1 H) 4.95 - 4.99 (m, 1 H) 5.04 - 5.08 (m, 1 H) 6.24 - 6.28 (m, 1 H) 6.33 - 6.37 (m, 2 H), 及び (600 MHz): 0.82 (d, J=5.96 Hz, 6 H) 0.89 - 0.93 (m, 3 H) 1.05 - 1.22 (m, 16 H) 1.23 - 1.34 (m, 7 H) 1.50 - 1.89 (m, 5 H) 2.11 - 3.03 (m, 10 H) 2.38 (s, 6 H) 2.45 (s, 3 H) 3.15 - 3.55 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.36 (s, 3 H) 3.57 - 3.66 (m, 2 H) 3.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.11 - 4.18 (m, 1 H) 4.32 - 4.39 (m, 1 H) 4.47 - 4.56 (m, 2 H) 4.59 - 4.66 (m, 1 H) 4.95 - 4.99 (m, 1 H) 5.44 - 5.49 (m, 1 H) 6.24 - 6.28 (m, 1 H) 6.33 - 6.37 (m, 2 H)
352		$\frac{1}{2}H$	939.7	(600 MHz): 0.91 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.99 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 - 1.32 (m, 2 H) 1.22 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.24 - 1.29 (m, 12 H) 1.40 (s, 3 H) 1.42 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.58 - 1.74 (m, 3 H) 1.79 - 1.88 (m, 1 H) 1.90 - 1.97 (m, 1 H) 2.21 - 2.30 (m, 1 H) 2.30 - 2.56 (m, 4 H) 2.38 (s, 6 H) 2.45 (s, 3 H) 2.61 - 2.71 (m, 3 H) 2.87 - 2.94 (m, 1 H) 2.98 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.25 - 3.40 (m, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.43 (s, 3 H) 3.50 (s, 1 H) 3.63 - 3.71 (m, 1 H) 3.80 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.91 (s, 3 H) 4.15 (q, J=6.72 Hz, 1 H) 4.30 (s, 1 H) 4.43 - 4.51 (m, 1 H) 4.54 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.63 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.74 (s, 1 H) 5.07 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.41 - 5.47 (m, 1 H) 6.95 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.01 (t, J=7.57 Hz, 1 H) 7.27 - 7.34 (m, 2 H)

10

20

【 0 8 6 8 】

【表 1 1 - 2 6】

353		δ -H	937.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 - 1.26 (m, 2 H) 1.12 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 - 1.21 (m, 12 H) 1.21 - 1.24 (m, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.31 - 1.34 (m, 3 H) 1.50 - 1.68 (m, 3 H) 1.70 - 1.80 (m, 1 H) 1.80 - 1.89 (m, 1 H) 2.12 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.47 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.53 - 2.64 (m, 3 H) 2.63 (q, J=7.79 Hz, 2 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=17.42 Hz, 1 H) 3.15 - 3.45 (m, 4 H) 3.22 - 3.24 (m, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.53 - 3.63 (m, 1 H) 3.66 - 3.74 (m, 2 H) 4.17 - 4.26 (m, 1 H) 4.34 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.47 (m, 1 H) 4.54 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.60 - 4.69 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.23 - 5.30 (m, 1 H) 7.05 - 7.10 (m, 3 H) 7.19 - 7.24 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 - 1.26 (m, 2 H) 1.12 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 - 1.21 (m, 12 H) 1.21 - 1.24 (m, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.31 - 1.34 (m, 3 H) 1.50 - 1.68 (m, 3 H) 1.70 - 1.80 (m, 1 H) 1.80 - 1.89 (m, 1 H) 2.12 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.47 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.53 - 2.64 (m, 3 H) 2.63 (q, J=7.79 Hz, 2 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.88 (d, J=17.42 Hz, 1 H) 3.15 - 3.45 (m, 4 H) 3.22 - 3.24 (m, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.53 - 3.63 (m, 1 H) 3.66 - 3.74 (m, 2 H) 4.17 - 4.26 (m, 1 H) 4.34 - 4.41 (m, 1 H) 4.42 - 4.47 (m, 1 H) 4.53 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.60 - 4.69 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.23 - 5.30 (m, 1 H) 7.05 - 7.10 (m, 3 H) 7.19 - 7.24 (m, 1 H)
354		δ -H	1036.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.78 - 0.86 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 2 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 - 1.20 (m, 12 H) 1.28 (s, 3 H) 1.36 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.50 - 1.68 (m, 3 H) 1.69 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.90 (m, 1 H) 2.12 - 2.47 (m, 5 H) 2.27 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.48 - 2.66 (m, 2 H) 2.69 - 2.93 (m, 3 H) 3.20 - 3.36 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.37 - 3.43 (m, 1 H) 3.56 (s, 1 H) 3.70 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 3.81 - 3.88 (m, 1 H) 4.19 (s, 1 H) 4.33 - 4.40 (m, 1 H) 4.43 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 4.54 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.72 (s, 2 H) 4.93 - 4.98 (m, 1 H) 4.94 (s, 2 H) 5.24 - 5.27 (m, 1 H) 7.44 - 7.51 (m, 2 H) 7.54 - 7.60 (m, 2 H)、及び (600 MHz): 0.78 - 0.86 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 2 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 - 1.20 (m, 12 H) 1.29 (s, 3 H) 1.36 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.50 - 1.68 (m, 3 H) 1.69 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.90 (m, 1 H) 2.12 - 2.47 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.48 - 2.66 (m, 2 H) 2.69 - 2.93 (m, 3 H) 3.20 - 3.36 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.37 - 3.43 (m, 1 H) 3.56 (s, 1 H) 3.70 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 3.81 - 3.88 (m, 1 H) 4.19 (s, 1 H) 4.33 - 4.40 (m, 1 H) 4.43 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 4.53 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.63 (s, 1 H) 4.72 (s, 2 H) 4.92 (s, 2 H) 4.93 - 4.98 (m, 1 H) 5.27 - 5.31 (m, 1 H) 7.44 - 7.51 (m, 2 H) 7.57 (m, 2 H)
355		δ -H	925.8	(600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 - 1.23 (m, 2 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.15 - 1.19 (m, 9 H) 1.29 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.50 - 1.58 (m, 1 H) 1.63 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.68 (d, J=12.38 Hz, 1 H) 1.72 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.87 (m, 1 H) 2.11 - 2.19 (m, 1 H) 2.19 - 2.26 (m, 1 H) 2.29 - 2.52 (m, 4 H) 2.37 (s, 3 H) 2.40 (s, 6 H) 2.74 - 2.85 (m, 2 H) 2.85 - 3.00 (m, 2 H) 3.00 - 3.08 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.30 - 3.35 (m, 1 H) 3.35 - 3.47 (m, 2 H) 3.36 (s, 3 H) 3.58 - 3.65 (m, 1 H) 3.66 - 3.73 (m, 2 H) 4.14 (s, 1 H) 4.32 - 4.39 (m, 1 H) 4.49 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.53 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.62 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.07 (s, 1 H) 6.67 - 6.74 (m, 2 H) 6.90 (s, 1 H) 7.13 (t, J=7.79 Hz, 1 H)

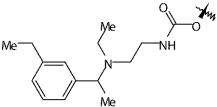
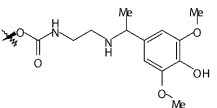
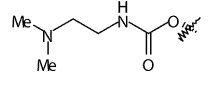
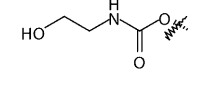
10

20

30

【 0 8 6 9】

【表 1 1 - 2 7】

356		$-\frac{2}{3}H$	965.9	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.00 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.06 - 1.27 (m, 2 H) 1.11 - 1.15 (m, 6 H) 1.15 - 1.21 (m, 9 H) 1.21 - 1.24 (m, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.33 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.50 - 1.67 (m, 3 H) 1.69 - 1.79 (m, 1 H) 1.81 - 1.89 (m, 1 H) 2.11 - 2.21 (m, 1 H) 2.23 - 2.51 (m, 6 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.55 - 2.65 (m, 3 H) 2.63 (q, J=7.79 Hz, 2 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 - 2.93 (m, 1 H) 3.17 - 3.25 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.46 (m, 1 H) 3.59 (s, 1 H) 3.72 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.82 - 3.87 (m, 1 H) 4.22 (s, 1 H) 4.36 - 4.43 (m, 1 H) 4.43 - 4.49 (m, 1 H) 4.53 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.19 - 5.28 (m, 1 H) 7.04 - 7.12 (m, 3 H) 7.21 (t, J=7.57 Hz, 1 H)、及び (600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.97 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 1.06 - 1.27 (m, 2 H) 1.11 - 1.15 (m, 6 H) 1.15 - 1.21 (m, 9 H) 1.21 - 1.24 (m, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.34 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.50 - 1.67 (m, 3 H) 1.69 - 1.79 (m, 1 H) 1.81 - 1.89 (m, 1 H) 2.11 - 2.21 (m, 1 H) 2.23 - 2.51 (m, 6 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.55 - 2.65 (m, 3 H) 2.63 (q, J=7.79 Hz, 2 H) 2.78 - 2.84 (m, 1 H) 2.85 - 2.93 (m, 1 H) 3.17 - 3.25 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.46 (m, 1 H) 3.59 (s, 1 H) 3.72 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.76 - 3.82 (m, 1 H) 4.22 (s, 1 H) 4.36 - 4.43 (m, 1 H) 4.43 - 4.49 (m, 1 H) 4.54 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.19 - 5.28 (m, 1 H) 7.04 - 7.12 (m, 3 H) 7.21 (t, J=7.57 Hz, 1 H)
357		$-\frac{2}{3}H$	985.9	ジアステレオマーの混合物 (500 MHz): 0.81 (d, J=6.58 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.05 - 1.34 (m, 23 H) 1.50 - 1.89 (m, 4 H) 2.11 - 2.45 (m, 15 H) 2.48 - 2.73 (m, 3 H) 2.76 - 2.93 (m, 2 H) 3.13 - 3.43 (m, 10 H) 3.50 - 3.61 (m, 1 H) 3.62 - 3.72 (m, 2 H) 3.88 (s, 6 H) 4.16 - 4.24 (m, 1 H) 4.30 - 4.69 (m, 4 H) 4.94 - 4.99 (m, 1 H) 5.10 - 5.32 (m, 1 H) 6.50 - 6.54 (m, 2 H)
358		$-\frac{2}{3}H$	833.9	(500 MHz): 0.78 - 0.86 (m, 6 H) 0.86 - 0.93 (m, 3 H) 1.04 - 1.28 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.47 - 1.90 (m, 6 H) 2.05 - 2.12 (m, 1 H) 2.13 - 2.58 (m, 8 H) 2.21 (s, 6 H) 2.30 (s, 7 H) 2.77 - 2.96 (m, 2 H) 3.16 - 3.34 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 - 3.52 (m, 2 H) 3.64 - 3.68 (m, 1 H) 4.09 - 4.16 (m, 1 H) 4.40 - 4.47 (m, 1 H) 4.51 (s, 1 H) 4.53 - 4.69 (m, 2 H) 5.03 - 5.07 (m, 1 H) 5.37 - 5.43 (m, 1 H)
359		$-\frac{2}{3}H$	806.8	(500 MHz): 0.79 - 0.86 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.05 - 1.27 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.47 - 1.89 (m, 5 H) 2.08 - 2.13 (m, 1 H) 2.20 - 2.34 (m, 8 H) 2.36 (s, 3 H) 2.40 - 2.56 (m, 2 H) 2.78 - 2.94 (m, 2 H) 3.22 - 3.25 (m, 4 H) 3.32 (s, 3 H) 3.34 - 3.51 (m, 5 H) 3.65 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 3.73 (t, J=5.16 Hz, 2 H) 4.10 - 4.16 (m, 1 H) 4.41 - 4.47 (m, 1 H) 4.52 (s, 1 H) 4.54 - 4.68 (m, 2 H) 5.05 (d, J=4.97 Hz, 1 H) 5.24 - 5.32 (m, 1 H)

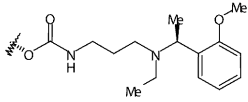
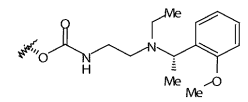
【 0 8 7 0 】

10

20

30

【表 1 1 - 2 8】

360		$\frac{1}{2}\text{H}$	982.0	(500 MHz): 0.77 - 0.86 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.06 (s, 3 H) 1.07 - 1.12 (m, 1 H) 1.07 - 1.11 (m, 3 H) 1.13 (d, J=6.58 Hz, 3 H) 1.15 - 1.19 (m, 1 H) 1.18 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.19 (s, 3 H) 1.22 - 1.28 (m, 6 H) 1.31 (s, 3 H) 1.45 - 1.69 (m, 5 H) 1.70 - 1.79 (m, 1 H) 1.81 - 1.90 (m, 1 H) 2.08 (d, J=15.36 Hz, 1 H) 2.14 - 2.30 (m, 3 H) 2.27 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.39 - 2.55 (m, 5 H) 2.57 - 2.64 (m, 1 H) 2.71 - 2.78 (m, 1 H) 2.79 - 2.84 (m, 1 H) 2.89 (d, J=15.36 Hz, 1 H) 3.19 (dd, J=10.28, 7.27 Hz, 1 H) 3.22 - 3.28 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.36 - 3.43 (m, 1 H) 3.44 - 3.51 (m, 1 H) 3.67 (d, J=7.68 Hz, 1 H) 3.81 (s, 3 H) 4.09 - 4.17 (m, 1 H) 4.37 - 4.43 (m, 1 H) 4.45 (d, J=6.86 Hz, 1 H) 4.48 (s, 1 H) 4.50 - 4.56 (m, 1 H) 4.61 - 4.70 (m, 1 H) 5.02 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 6.11 - 6.18 (m, 1 H) 6.85 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 6.93 (t, J=7.27 Hz, 1 H) 7.18 - 7.23 (m, 1 H) 7.30 (d, J=7.68 Hz, 1 H)
361		$\frac{1}{2}\text{H}$	968.0	(500 MHz): 0.77 - 0.86 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.27 Hz, 3 H) 0.94 (t, J=7.13 Hz, 3 H) 1.08 (s, 3 H) 1.08 - 1.18 (m, 2 H) 1.10 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=6.58 Hz, 3 H) 1.18 (d, J=6.31 Hz, 6 H) 1.28 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.52 - 1.68 (m, 3 H) 1.69 - 1.78 (m, 1 H) 1.80 - 1.90 (m, 1 H) 2.09 (d, J=14.81 Hz, 1 H) 2.14 - 2.21 (m, 1 H) 2.22 - 2.32 (m, 2 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.40 - 2.61 (m, 6 H) 2.78 - 2.86 (m, 1 H) 2.90 (d, J=12.34 Hz, 1 H) 3.16 - 3.25 (m, 3 H) 3.25 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.36 - 3.50 (m, 2 H) 3.66 (d, J=7.68 Hz, 1 H) 3.84 (s, 3 H) 4.09 - 4.15 (m, 1 H) 4.35 (q, J=6.86 Hz, 1 H) 4.44 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.50 (s, 1 H) 4.51 - 4.57 (m, 1 H) 4.60 - 4.70 (m, 1 H) 5.04 (d, J=4.94 Hz, 1 H) 5.65 - 5.69 (m, 1 H) 6.87 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 6.91 (t, J=7.54 Hz, 1 H) 7.17 - 7.22 (m, 1 H) 7.26 - 7.30 (m, 1 H)
362		$\text{HO}^{\frac{1}{2}}\text{H}$	748.4	(600 MHz): 0.78 - 0.83 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.14 (m, 1 H) 1.13 - 1.18 (m, 6 H) 1.18 (s, 3 H) 1.23 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.24 - 1.29 (m, 2 H) 1.31 (s, 3 H) 1.47 - 1.58 (m, 1 H) 1.68 - 1.82 (m, 2 H) 1.85 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 2.05 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.10 - 2.19 (m, 1 H) 2.20 - 2.47 (m, 13 H) 2.53 - 2.63 (m, 1 H) 2.75 - 2.81 (m, 1 H) 2.87 - 2.96 (m, 2 H) 3.19 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.23 - 3.26 (m, 1 H) 3.27 (s, 3 H) 3.36 (s, 3 H) 3.37 - 3.41 (m, 1 H) 3.42 - 3.48 (m, 1 H) 3.59 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.15 - 4.21 (m, 1 H) 4.35 - 4.40 (m, 2 H) 4.56 - 4.65 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H)
363		$\text{HO}^{\frac{1}{2}}\text{H}$	748.4	(600 MHz): 0.73 - 0.79 (m, 6 H) 0.84 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.05 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.08 (m, 1 H) 1.09 (s, 3 H) 1.09 - 1.12 (m, 6 H) 1.16 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.17 - 1.23 (m, 1 H) 1.27 (s, 3 H) 1.44 - 1.53 (m, 1 H) 1.58 - 1.78 (m, 3 H) 1.81 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 2.00 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.07 - 2.15 (m, 1 H) 2.18 - 2.26 (m, 2 H) 2.27 (s, 6 H) 2.31 (s, 3 H) 2.34 - 2.42 (m, 1 H) 2.45 - 2.54 (m, 1 H) 2.58 (d, J=13.76 Hz, 1 H) 2.71 - 2.77 (m, 1 H) 2.81 - 2.87 (m, 1 H) 2.89 (d, J=13.76 Hz, 1 H) 3.12 - 3.19 (m, 1 H) 3.18 (s, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.30 - 3.38 (m, 1 H) 3.41 - 3.49 (m, 1 H) 3.65 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.11 - 4.19 (m, 1 H) 4.33 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.35 - 4.42 (m, 1 H) 4.52 - 4.62 (m, 1 H) 4.93 (d, J=5.04 Hz, 1 H)

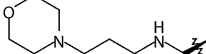
【 0 8 7 1 】

10

20

30

【表 1 1 - 2 9】

364		HO ⁺ 	762.5	(600 MHz): 0.79 - 0.83 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.10 - 1.12 (m, 1 H) 1.14 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.18 (s, 3 H) 1.21 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.26 - 1.30 (m, 1 H) 1.33 (s, 3 H) 1.49 - 1.58 (m, 1 H) 1.66 - 1.81 (m, 2 H) 1.83 (dd, J=14.90, 4.81 Hz, 1 H) 2.03 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.11 - 2.31 (m, 3 H) 2.33 - 2.56 (m, 16 H) 2.63 - 2.83 (m, 3 H) 2.91 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.23 - 3.28 (m, 1 H) 3.30 (s, 3 H) 3.36 - 3.42 (m, 1 H) 3.62 - 3.70 (m, 2 H) 4.14 - 4.22 (m, 1 H) 4.36 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.48 - 4.65 (m, 2 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
365		HO ⁺ 	776.1	(600 MHz): 0.77 - 0.83 (m, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.09 (s, 3 H) 1.09 - 1.11 (m, 1 H) 1.11 - 1.17 (m, 6 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 - 1.27 (m, 1 H) 1.30 (s, 3 H) 1.48 - 1.56 (m, 1 H) 1.61 - 1.84 (m, 3 H) 1.88 (dd, J=14.67, 5.04 Hz, 1 H) 1.97 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.05 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.10 - 2.20 (m, 1 H) 2.20 - 2.29 (m, 2 H) 2.31 (s, 6 H) 2.34 (s, 9 H) 2.38 - 2.56 (m, 2 H) 2.73 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.75 - 2.79 (m, 1 H) 2.89 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 3.19 - 3.24 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.34 - 3.46 (m, 2 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.12 - 4.20 (m, 2 H) 4.36 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.61 (br. s., 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H)
366			790.4	(600 MHz): 0.78 - 0.83 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.12 - 1.17 (m, 7 H) 1.18 - 1.25 (m, 7 H) 1.30 (s, 3 H) 1.50 - 1.59 (m, 1 H) 1.63 - 1.84 (m, 3 H) 1.88 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 2.09 - 2.16 (m, 1 H) 2.20 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.22 - 2.27 (m, 1 H) 2.27 - 2.33 (m, 7 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.53 (m, 2 H) 2.76 - 2.83 (m, 1 H) 2.85 - 2.92 (m, 1 H) 3.17 - 3.23 (m, 2 H) 3.20 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.31 - 3.37 (m, 2 H) 3.63 (d, J=4.13 Hz, 1 H) 3.88 (d, J=10.55 Hz, 1 H) 4.25 - 4.29 (m, 1 H) 4.30 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.38 (q, J=6.72 Hz, 1 H) 4.56 - 4.66 (m, 1 H) 5.00 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
367		HO ⁺ 	779.5	(600 MHz): 0.77 - 0.83 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 - 1.09 (m, 1 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.11 - 1.17 (m, 10 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 - 1.26 (m, 1 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 - 1.57 (m, 1 H) 1.59 - 1.83 (m, 3 H) 1.84 (dd, J=15.13, 5.50 Hz, 1 H) 2.04 - 2.08 (m, 1 H) 2.09 (s, 3 H) 2.11 - 2.19 (m, 1 H) 2.23 - 2.32 (m, 8 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.46 (m, 1 H) 2.47 - 2.55 (m, 1 H) 2.62 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 2.75 - 2.81 (m, 1 H) 2.83 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.90 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 3.09 (s, 1 H) 3.17 - 3.21 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.36 - 3.44 (m, 1 H) 3.46 - 3.55 (m, 1 H) 3.66 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.13 - 4.24 (m, 1 H) 4.37 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.44 (q, J=6.42 Hz, 1 H) 4.54 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H)
368		HO ⁺ 		(600 MHz): 0.79 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.87 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.03 - 1.26 (m, 2 H) 1.07 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 (s, 3 H) 1.11 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.13 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.18 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 1.46 - 1.56 (m, 1 H) 1.56 - 1.88 (m, 6 H) 2.02 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.07 - 2.18 (m, 1 H) 2.20 - 2.50 (m, 11 H) 2.26 (s, 6 H) 2.33 (s, 3 H) 2.59 - 2.67 (m, 2 H) 2.71 - 2.80 (m, 2 H) 2.83 - 2.91 (m, 1 H) 3.14 - 3.22 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.25 (s, 3 H) 3.33 - 3.43 (m, 1 H) 3.46 - 3.54 (m, 1 H) 3.62 - 3.71 (m, 5 H) 4.17 (s, 1 H) 4.30 - 4.38 (m, 2 H) 4.59 (s, 1 H) 4.94 (d, J=4.59 Hz, 1 H)

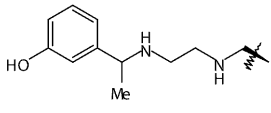
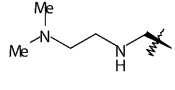
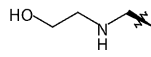
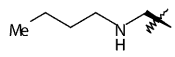
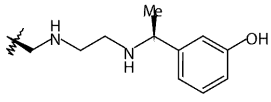
【 0 8 7 2 】

10

20

30

【表 1 1 - 3 0】

369		HO ⁺ 	911.9	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 - 1.40 (m, 17 H) 1.12 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.52 - 1.58 (m, 1 H) 1.59 - 1.67 (m, 1 H) 1.72 - 1.88 (m, 3 H) 2.01 - 2.08 (m, 1 H) 2.10 - 2.33 (m, 3 H) 2.34 - 2.70 (m, 16 H) 2.72 - 2.83 (m, 2 H) 2.90 - 2.96 (m, 1 H) 3.18 - 3.32 (m, 6 H) 3.32 - 3.39 (m, 1 H) 3.39 - 3.60 (m, 2 H) 3.62 - 3.77 (m, 3 H) 4.12 - 4.20 (m, 1 H) 4.36 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.40 - 4.48 (m, 1 H) 4.57 - 4.65 (m, 1 H) 4.95 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 6.64 - 6.82 (m, 3 H) 7.13 - 7.21 (m, 1 H)
370		HO ⁺ 	819.8	(500 MHz): 0.81 (d, J=7.13 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.27 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.11 - 1.17 (m, 1 H) 1.12 (s, 3 H) 1.13 - 1.17 (m, 6 H) 1.20 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.21 - 1.26 (m, 1 H) 1.31 (s, 3 H) 1.48 - 1.57 (m, 1 H) 1.60 - 1.66 (m, 1 H) 1.68 - 1.79 (m, 1 H) 1.79 - 1.90 (m, 2 H) 2.01 - 2.06 (m, 1 H) 2.11 - 2.18 (m, 1 H) 2.18 - 2.53 (m, 7 H) 2.21 (s, 6 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.64 - 2.94 (m, 5 H) 3.16 - 3.25 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.35 - 3.56 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 4.14 - 4.23 (m, 1 H) 4.29 - 4.41 (m, 2 H) 4.53 - 4.67 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.39 Hz, 1 H)
371		HO ⁺ 	792.8	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.86 - 0.92 (m, 3 H) 1.04 - 1.36 (m, 20 H) 1.38 - 1.47 (m, 2 H) 1.48 - 1.89 (m, 5 H) 2.04 (d, J=14.81 Hz, 1 H) 2.10 - 2.53 (m, 6 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.54 - 2.60 (m, 2 H) 2.73 - 2.94 (m, 3 H) 3.17 - 3.24 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.35 - 3.45 (m, 1 H) 3.51 - 3.60 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 4.14 - 4.22 (m, 1 H) 4.34 - 4.42 (m, 2 H) 4.56 - 4.67 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.66 Hz, 1 H)
372		HO ⁺ 	804.8	(500 MHz): 0.76 - 0.84 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.27 Hz, 3 H) 1.05 - 1.30 (m, 20 H) 1.34 (s, 3 H) 1.48 - 1.87 (m, 5 H) 2.03 - 2.18 (m, 2 H) 2.20 - 2.45 (m, 4 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.51 - 2.59 (m, 1 H) 2.62 - 2.69 (m, 2 H) 2.75 - 2.82 (m, 3 H) 2.87 - 2.94 (m, 1 H) 3.19 - 3.30 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.35 - 3.41 (m, 1 H) 3.51 - 3.71 (m, 5 H) 4.18 - 4.25 (m, 1 H) 4.38 (d, J=6.58 Hz, 1 H) 4.51 - 4.65 (m, 2 H) 4.96 (d, J=4.66 Hz, 1 H)
373		 OH	911.9	(600 MHz): 0.86 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.95 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.33 (m, 17 H) 1.35 (s, 3 H) 1.36 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.55 - 1.63 (m, 1 H) 1.65 - 1.70 (m, 1 H) 1.75 - 1.93 (m, 3 H) 2.09 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.15 - 2.38 (m, 3 H) 2.39 - 2.75 (m, 8 H) 2.41 (s, 3 H) 2.45 (s, 6 H) 2.79 - 2.87 (m, 1 H) 2.93 - 3.03 (m, 1 H) 3.26 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.37 - 3.52 (m, 2 H) 3.59 - 3.66 (m, 1 H) 3.72 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.77 (q, J=6.57 Hz, 1 H) 4.15 - 4.21 (m, 1 H) 4.40 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.46 - 4.53 (m, 1 H) 4.62 - 4.69 (m, 1 H) 4.99 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 6.72 - 6.77 (m, 1 H) 6.80 - 6.87 (m, 2 H) 7.20 (t, J=7.79 Hz, 1 H)

【 0 8 7 3 】

10

20

30

【表 1 1 - 3 1】

374		$\frac{1}{2}\text{OH}$	943.9	(600 MHz): 0.79 – 0.83 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 (s, 3 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 – 1.31 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.36 (s, 3 H) 1.50 – 1.85 (m, 5 H) 2.05 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.10 – 2.17 (m, 1 H) 2.23 – 2.44 (m, 2 H) 2.27 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.57 – 2.63 (m, 3 H) 2.75 – 2.93 (m, 4 H) 3.20 (s, 3 H) 3.21 (s, 3 H) 3.30 (dd, J=9.86, 6.65 Hz, 1 H) 3.35 – 3.39 (m, 1 H) 3.45 (dd, J=11.23, 2.98 Hz, 1 H) 3.47 – 3.51 (m, 1 H) 3.52 – 3.58 (m, 1 H) 3.66 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.69 (dd, J=11.46, 4.13 Hz, 1 H) 4.23 – 4.26 (m, 1 H) 4.37 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 4.57 – 4.62 (m, 1 H) 4.64 – 4.69 (m, 1 H) 4.86 (d, J=5.96 Hz, 1 H) 4.95 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 7.57 (d, J=8.25 Hz, 2 H) 8.20 (d, J=8.71 Hz, 2 H)
375		$\text{HO}^{\oplus}\text{NH}_2$		(600 MHz): 0.78 – 0.83 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.17 – 1.27 (m, 2 H) 1.20 (s, 3 H) 1.21 – 1.23 (m, 6 H) 1.35 (s, 3 H) 1.49 – 1.58 (m, 1 H) 1.63 – 1.69 (m, 1 H) 1.71 – 1.88 (m, 3 H) 2.08 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.09 – 2.17 (m, 1 H) 2.22 – 2.45 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.49 – 2.55 (m, 1 H) 2.59 – 2.64 (m, 1 H) 2.72 – 2.84 (m, 3 H) 2.91 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.27 (dd, J=9.86, 6.65 Hz, 1 H) 3.29 (s, 3 H) 3.36 – 3.42 (m, 1 H) 3.52 – 3.77 (m, 6 H) 4.22 (s, 1 H) 4.38 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 4.56 – 4.66 (m, 2 H) 4.97 (d, J=4.58 Hz, 1 H)
376		$\text{HO}^{\oplus}\text{NH}_2$	897.9	(600 MHz): 0.83 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 – 1.29 (m, 2 H) 1.11 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.12 (s, 3 H) 1.15 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.51 – 1.59 (m, 1 H) 1.62 – 1.68 (m, 1 H) 1.71 – 1.88 (m, 3 H) 2.04 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.10 – 2.21 (m, 1 H) 2.23 – 2.47 (m, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.47 – 2.54 (m, 1 H) 2.61 (d, J=13.30 Hz, 1 H) 2.77 – 2.84 (m, 2 H) 2.84 – 2.96 (m, 5 H) 3.20 – 3.26 (m, 7 H) 3.35 – 3.43 (m, 1 H) 3.52 – 3.60 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.23 (s, 1 H) 4.38 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.47 (q, J=6.42 Hz, 1 H) 4.62 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 7.36 (d, J=8.71 Hz, 2 H) 8.17 (d, J=8.71 Hz, 2 H)
377		$\text{HO}^{\oplus}\text{NH}_2$	817.6	(500 MHz): 0.81 (d, J=7.13 Hz, 6 H) 0.85 – 0.91 (m, 9 H) 1.05 – 1.36 (m, 22 H) 1.48 – 1.88 (m, 5 H) 2.00 – 2.07 (m, 1 H) 2.09 – 2.19 (m, 1 H) 2.20 – 2.31 (m, 8 H) 2.35 (s, 3 H) 2.37 – 2.62 (m, 5 H) 2.73 – 2.81 (m, 2 H) 2.86 – 2.94 (m, 1 H) 3.18 – 3.24 (m, 4 H) 3.27 (s, 3 H) 3.34 – 3.45 (m, 2 H) 3.51 – 3.60 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 4.15 – 4.21 (m, 1 H) 4.33 – 4.43 (m, 2 H) 4.57 – 4.66 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.39 Hz, 1 H)
378		$\text{HO}^{\oplus}\text{NH}_2$	859.8	(500 MHz): 0.81 (d, J=7.13 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.27 Hz, 3 H) 1.06 – 1.26 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.37 – 1.45 (m, 2 H) 1.49 – 1.58 (m, 4 H) 1.60 – 1.91 (m, 4 H) 2.04 (d, J=14.81 Hz, 1 H) 2.09 – 2.20 (m, 1 H) 2.21 – 2.52 (m, 21 H) 2.65 – 2.82 (m, 4 H) 2.85 – 2.93 (m, 1 H) 3.17 – 3.25 (m, 4 H) 3.27 (s, 3 H) 3.34 – 3.56 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 4.13 – 4.22 (m, 1 H) 4.33 – 4.39 (m, 2 H) 4.58 – 4.66 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.66 Hz, 1 H)

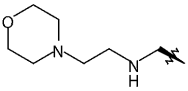
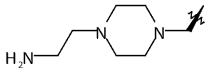
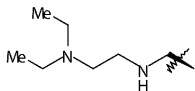
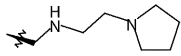
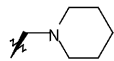
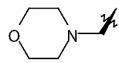
【 0 8 7 4 】

10

20

30

【表 1 1 - 3 2】

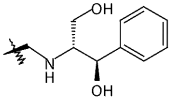
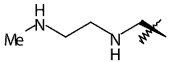
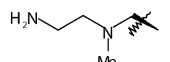
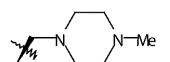
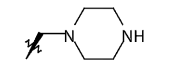
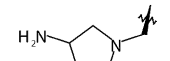
379		HO ⁺ 	861.8	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.45 Hz, 3 H) 1.06 – 1.33 (m, 20 H) 1.48 – 1.89 (m, 5 H) 2.04 (d, J=14.53 Hz, 1 H) 2.09 – 2.52 (m, 20 H) 2.64 – 2.93 (m, 5 H) 3.18 – 3.24 (m, 4 H) 3.28 (s, 3 H) 3.35 – 3.45 (m, 2 H) 3.48 – 3.56 (m, 1 H) 3.65 – 3.72 (m, 5 H) 4.16 – 4.23 (m, 1 H) 4.34 – 4.41 (m, 2 H) 4.58 – 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
380		HO ⁺ 	860.8	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.85 – 0.92 (m, 3 H) 1.05 – 1.33 (m, 20 H) 1.47 – 1.91 (m, 5 H) 1.98 – 2.20 (m, 3 H) 2.20 – 2.53 (m, 17 H) 2.58 – 2.73 (m, 2 H) 2.73 – 2.92 (m, 7 H) 3.18 – 3.24 (m, 4 H) 3.28 (s, 3 H) 3.33 – 3.46 (m, 2 H) 3.47 – 3.56 (m, 1 H) 3.66 – 3.72 (m, 1 H) 4.13 – 4.22 (m, 2 H) 4.33 – 4.39 (m, 2 H) 4.57 – 4.67 (m, 1 H) 4.94 – 4.98 (m, 1 H)
381		HO ⁺ 	847.9	(600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.99 (t, J=7.11 Hz, 6 H) 1.06 – 1.28 (m, 2 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 (s, 3 H) 1.14 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 – 1.57 (m, 1 H) 1.57 – 1.91 (m, 4 H) 2.04 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.11 – 2.19 (m, 1 H) 2.22 – 2.32 (m, 2 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.39 – 2.68 (m, 11 H) 2.74 – 2.84 (m, 2 H) 2.86 – 2.93 (m, 1 H) 3.19 – 3.22 (m, 1 H) 3.22 – 3.23 (m, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.35 – 3.44 (m, 1 H) 3.46 – 3.55 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.18 (s, 1 H) 4.30 – 4.42 (m, 2 H) 4.62 (s, 1 H) 4.97 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
382		HO ⁺ 	845.8	(600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 – 1.26 (m, 2 H) 1.12 (s, 3 H) 1.14 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 – 1.66 (m, 2 H) 1.71 – 1.90 (m, 7 H) 2.04 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.09 – 2.32 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.37 – 2.45 (m, 1 H) 2.45 – 2.59 (m, 9 H) 2.71 (t, J=6.42 Hz, 1 H) 2.74 – 2.94 (m, 3 H) 3.17 – 3.22 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.36 – 3.44 (m, 1 H) 3.48 – 3.57 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.17 (s, 1 H) 4.33 – 4.39 (m, 2 H) 4.61 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
383		HO ⁺ 	816.8	(600 MHz): 0.82 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.03 – 1.28 (m, 4 H) 1.07 – 1.11 (m, 6 H) 1.13 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.70 (d, 9 H) 1.97 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.06 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.11 – 2.21 (m, 1 H) 2.22 – 2.33 (m, 4 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.39 – 2.46 (m, 1 H) 2.46 – 2.53 (m, 1 H) 2.53 – 2.63 (m, 2 H) 2.72 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.75 – 2.82 (m, 1 H) 2.86 – 2.93 (m, 1 H) 3.22 (dd, J=10.32, 7.11 Hz, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.37 – 3.47 (m, 2 H) 3.71 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.13 – 4.22 (m, 2 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.59 – 4.68 (m, 1 H) 4.98 (d, J=5.04 Hz, 1 H)
384		HO ⁺ 	818.8	(600 MHz): 0.83 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 – 1.29 (m, 2 H) 1.08 – 1.12 (m, 6 H) 1.15 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.51 – 1.59 (m, 1 H) 1.62 – 1.93 (m, 4 H) 2.05 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.08 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.12 – 2.22 (m, 1 H) 2.23 – 2.34 (m, 2 H) 2.31 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.40 – 2.46 (m, 1 H) 2.46 – 2.53 (m, 1 H) 2.55 – 2.71 (m, 4 H) 2.76 – 2.84 (m, 2 H) 2.86 – 2.95 (m, 1 H) 3.23 (dd, J=10.55, 7.34 Hz, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.37 – 3.47 (m, 2 H) 3.66 – 3.77 (m, 5 H) 4.16 – 4.26 (m, 2 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.64 (s, 1 H) 4.99 (d, J=4.58 Hz, 1 H)

10

20

30

【表 1 1 - 3 3】

385		OH	898.9	(500 MHz): 0.78 – 0.83 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.06 – 1.36 (m, 20 H) 1.48 – 1.86 (m, 4 H) 2.01 – 2.44 (m, J=15.29 Hz, 14 H) 2.55 – 2.94 (m, 6 H) 3.17 – 3.28 (m, 7 H) 3.33 – 3.69 (m, 6 H) 4.19 – 4.25 (m, 1 H) 4.36 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.56 – 4.65 (m, 2 H) 4.72 (d, J=6.12 Hz, 1 H) 4.95 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 7.24 – 7.37 (m, 5 H)
386		HO^*	805.8	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.06 – 1.34 (m, 20 H) 1.48 – 1.89 (m, 5 H) 2.04 (d, J=13.99 Hz, 1 H) 2.11 – 2.53 (m, 18 H) 2.62 – 2.93 (m, 6 H) 3.17 – 3.25 (m, 4 H) 3.27 (s, 3 H) 3.33 – 3.55 (m, 3 H) 3.70 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 4.16 – 4.23 (m, 1 H) 4.33 – 4.40 (m, 2 H) 4.57 – 4.68 (m, 1 H) 4.94 – 4.98 (m, 1 H)
387		HO^*	805.8	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.05 – 1.28 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.48 – 1.92 (m, 5 H) 2.01 – 2.19 (m, 3 H) 2.22 – 2.38 (m, 15 H) 2.38 – 2.54 (m, 3 H) 2.59 – 2.67 (m, 1 H) 2.74 – 2.92 (m, 4 H) 3.18 – 3.30 (m, 7 H) 3.36 – 3.47 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 4.14 – 4.25 (m, 2 H) 4.37 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.58 – 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.66 Hz, 1 H)
388		HO^*	831.8	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.45 Hz, 3 H) 1.03 – 1.34 (m, 20 H) 1.48 – 1.92 (m, 6 H) 1.99 – 2.19 (m, 4 H) 2.19 – 2.32 (m, 4 H) 2.27 (s, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.38 – 2.53 (m, 2 H) 2.56 – 2.71 (m, 1 H) 2.74 – 2.83 (m, 2 H) 2.84 – 2.94 (m, 1 H) 3.15 – 3.25 (m, 4 H) 3.28 (s, 3 H) 3.34 – 3.46 (m, 4 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 4.18 (d, 2 H) 4.36 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.43 – 4.57 (m, 1 H) 4.58 – 4.68 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
389		HO^*	817.8	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.05 – 1.33 (m, 20 H) 1.48 – 1.92 (m, 6 H) 1.98 – 2.20 (m, 3 H) 2.21 – 2.33 (m, 9 H) 2.35 (s, 3 H) 2.38 – 2.67 (m, 3 H) 2.73 – 2.92 (m, 7 H) 3.18 – 3.26 (m, 4 H) 3.28 (s, 3 H) 3.35 – 3.47 (m, 3 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 4.14 – 4.23 (m, 2 H) 4.37 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.58 – 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.97 Hz, 1 H)
390		HO^*	817.7	ジアステレオマーの混合物 (500 MHz): 0.80 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.03 – 1.26 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.46 – 1.91 (m, 7 H) 2.06 (d, J=14.91 Hz, 1 H) 2.10 – 2.31 (m, 11 H) 2.34 (s, 3 H) 2.37 – 2.53 (m, 3 H) 2.61 – 2.81 (m, 2 H) 2.82 – 3.00 (m, 3 H) 3.16 – 3.25 (m, 4 H) 3.27 (s, 3 H) 3.34 – 3.56 (m, 3 H) 3.69 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 4.11 – 4.22 (m, 2 H) 4.36 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.57 – 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.97 Hz, 1 H)

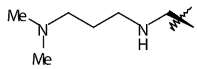
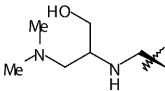
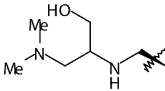
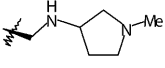
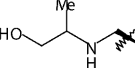
【 0 8 7 6 】

10

20

30

【表 1 1 - 3 4】

391		HO ⁺ 	833.8	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.06 - 1.32 (m, 20 H) 1.47 - 1.90 (m, 7 H) 2.03 (d, J=15.08 Hz, 1 H) 2.10 - 2.53 (m, 22 H) 2.60 - 2.66 (m, 2 H) 2.74 - 2.93 (m, 3 H) 3.17 - 3.24 (m, 4 H) 3.27 (s, 3 H) 3.33 - 3.56 (m, 3 H) 3.70 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 4.14 - 4.21 (m, 1 H) 4.32 - 4.39 (m, 2 H) 4.57 - 4.67 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.66 Hz, 1 H)
392		HO ⁺ 	849.9	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.06 - 1.30 (m, 17 H) 1.32 (s, 3 H) 1.47 - 1.86 (m, 5 H) 2.05 (d, J=15.29 Hz, 1 H) 2.10 - 2.56 (m, 23 H) 3.16 - 3.57 (m, 15 H) 3.69 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 4.20 - 4.26 (m, 1 H) 4.35 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.48 - 4.65 (m, 2 H) 4.97 (d, J=4.97 Hz, 1 H)
393		HO ⁺ 	849.8	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.06 - 1.28 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 - 1.89 (m, 5 H) 2.00 - 2.55 (m, 19 H) 2.57 - 2.94 (m, 5 H) 3.17 - 3.29 (m, 7 H) 3.35 - 3.72 (m, 9 H) 4.17 - 4.24 (m, 1 H) 4.32 - 4.43 (m, 2 H) 4.58 - 4.66 (m, 1 H) 4.95 (d, J=5.49 Hz, 1 H)
394		HO ⁺ 	831.8	ジアステレオマーの混合物 (500 MHz): 0.81 (d, J=6.58 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.27 Hz, 3 H) 1.04 - 1.33 (m, 20 H) 1.47 - 1.92 (m, 7 H) 2.00 - 3.00 (m, 25 H) 3.17 - 3.30 (m, 7 H) 3.35 - 3.46 (m, 2 H) 3.65 - 3.72 (m, 3 H) 4.11 - 4.23 (m, 2 H) 4.33 - 4.42 (m, 1 H) 4.57 - 4.67 (m, 1 H) 4.93 - 4.99 (m, 1 H)
395		HO ⁺ 	806.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.76 - 0.83 (m, 6 H) 0.86 - 0.92 (m, 3 H) 0.97 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.05 - 1.28 (m, 14 H) 1.07 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.36 (s, 3 H) 1.49 - 1.58 (m, 1 H) 1.61 - 1.69 (m, 1 H) 1.70 - 1.85 (m, 3 H) 2.03 - 2.09 (m, 1 H) 2.09 - 2.17 (m, 1 H) 2.24 - 2.44 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 - 2.37 (m, 3 H) 2.48 - 2.57 (m, 1 H) 2.67 - 2.95 (m, 5 H) 3.21 (s, 3 H) 3.23 - 3.27 (m, 1 H) 3.29 (s, 3 H) 3.34 - 3.43 (m, 2 H) 3.49 - 3.58 (m, 2 H) 3.64 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.16 (s, 1 H) 4.34 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.50 - 4.55 (m, 1 H) 4.56 - 4.65 (m, 1 H) 4.94 (d, J=4.58 Hz, 1 H)、及び (600 MHz): 0.76 - 0.83 (m, 6 H) 0.86 - 0.92 (m, 3 H) 1.05 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.05 - 1.28 (m, 14 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.49 - 1.58 (m, 1 H) 1.61 - 1.69 (m, 1 H) 1.70 - 1.85 (m, 3 H) 2.03 - 2.09 (m, 1 H) 2.09 - 2.17 (m, 1 H) 2.24 - 2.44 (m, 3 H) 2.27 (s, 6 H) 2.35 - 2.37 (m, 3 H) 2.48 - 2.57 (m, 2 H) 2.61 - 2.66 (m, 1 H) 2.67 - 2.95 (m, 3 H) 3.21 (s, 3 H) 3.27 - 3.42 (m, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.49 - 3.58 (m, 1 H) 3.60 - 3.65 (m, 1 H) 3.68 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 4.24 (s, 1 H) 4.43 (d, J=5.50 Hz, 1 H) 4.56 - 4.65 (m, 2 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H)

10

20

30

【 0 8 7 7 】

【表 1 1 - 3 5】

396		HO ⁺	818.8	(600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.84 - 0.91 (m, 9 H) 1.06 - 1.28 (m, 2 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 (s, 3 H) 1.14 (d, J=4.13 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=5.04 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.29 - 1.48 (m, 4 H) 1.31 (s, 3 H) 1.48 - 1.57 (m, 1 H) 1.59 - 1.65 (m, 1 H) 1.68 - 1.79 (m, 1 H) 1.79 - 1.89 (m, 2 H) 2.04 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.10 - 2.19 (m, 1 H) 2.21 - 2.31 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.37 - 2.54 (m, 3 H) 2.74 - 2.81 (m, 2 H) 2.90 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.18 - 3.22 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.36 - 3.43 (m, 1 H) 3.53 - 3.59 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.17 (s, 1 H) 4.35 - 4.42 (m, 2 H) 4.61 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.58 Hz, 1 H)
397		HO ⁺	833.8	(600 MHz): 0.77 - 0.83 (m, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.02 - 1.06 (m, 6 H) 1.06 - 1.27 (m, 2 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 (s, 3 H) 1.13 - 1.16 (m, 6 H) 1.20 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.49 - 1.57 (m, 1 H) 1.59 - 1.66 (m, 1 H) 1.68 - 1.89 (m, 3 H) 2.04 (d, J=16.05 Hz, 1 H) 2.09 - 2.19 (m, 1 H) 2.21 - 2.32 (m, 2 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.37 - 2.52 (m, 3 H) 2.64 - 2.80 (m, 6 H) 2.82 (d, J=13.30 Hz, 1 H) 2.85 - 2.93 (m, 1 H) 3.17 - 3.24 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.33 - 3.54 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.20 (s, 1 H) 4.33 - 4.40 (m, 2 H) 4.61 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
398		HO ⁺	832.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.80 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.42 (m, 4 H) 1.13 - 1.17 (m, 9 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 - 1.57 (m, 1 H) 1.59 - 1.87 (m, 6 H) 2.05 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.09 - 2.19 (m, 1 H) 2.20 - 2.32 (m, 2 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.37 - 2.60 (m, 4 H) 2.73 - 2.84 (m, 2 H) 2.86 - 2.93 (m, 1 H) 3.18 - 3.22 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.31 - 3.43 (m, 3 H) 3.55 - 3.62 (m, 1 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.90 - 3.98 (m, 2 H) 4.19 (s, 1 H) 4.35 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.45 (q, J=6.27 Hz, 1 H) 4.61 (s, 1 H) 4.96 (d, J=4.58 Hz, 1 H)
399		 OH		(600 MHz): 0.89 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.97 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.12 - 1.35 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.17 (s, 3 H) 1.20 - 1.25 (m, 6 H) 1.30 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.39 (s, 3 H) 1.55 - 1.87 (m, 5 H) 1.91 (s, 1 H) 1.96 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 2.15 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.20 - 2.60 (m, 9 H) 2.37 (s, 6 H) 2.43 (s, 3 H) 2.71 - 3.10 (m, 6 H) 3.29 (dd, J=10.55, 7.34 Hz, 1 H) 3.32 (s, 3 H) 3.36 (s, 3 H) 3.44 - 3.53 (m, 2 H) 3.57 - 3.63 (m, 1 H) 3.78 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.23 (s, 1 H) 4.28 (q, J=6.42 Hz, 1 H) 4.45 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.70 (s, 1 H) 5.06 (d, J=5.04 Hz, 1 H)
400		HO ⁺	907.7	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.80 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 - 1.32 (m, 22 H) 1.46 - 1.87 (m, 5 H) 1.98 - 2.93 (m, 23 H) 3.15 - 3.29 (m, 7 H) 3.32 - 3.60 (m, 4 H) 3.65 - 3.74 (m, 2 H) 4.14 - 4.21 (m, 1 H) 4.31 - 4.40 (m, 2 H) 4.55 - 4.66 (m, 1 H) 4.95 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 7.20 - 7.32 (m, 5 H)
401		HO ⁺	874.7	(600 MHz): 0.77 - 0.91 (m, 9 H) 1.06 - 1.34 (m, 20 H) 1.48 - 1.90 (m, 5 H) 2.00 - 2.59 (m, 28 H) 2.66 - 2.93 (m, 5 H) 3.16 - 3.26 (m, 5 H) 3.28 (s, 3 H) 3.34 - 3.56 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.15 - 4.23 (m, 1 H) 4.34 - 4.39 (m, 2 H) 4.58 - 4.66 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H)

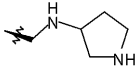
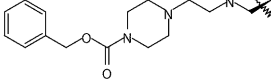
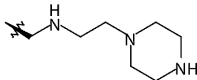
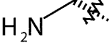
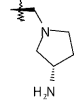
【 0 8 7 8 】

10

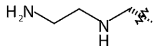
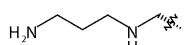
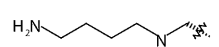
20

30

【表 1 1 - 3 6】

402		HO ⁺ 	817.6	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.76 - 0.84 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.05 - 1.27 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.40 - 2.07 (m, 7 H) 2.09 - 2.58 (m, 14 H) 2.62 - 3.04 (m, 8 H) 3.14 - 3.24 (m, 5 H) 3.27 (s, 3 H) 3.34 - 3.58 (m, 3 H) 3.67 - 3.72 (m, 1 H) 4.16 - 4.24 (m, 1 H) 4.33 - 4.47 (m, 2 H) 4.56 - 4.65 (m, 1 H) 4.94 - 4.98 (m, 1 H)
403		HO ⁺ 	994.7	(600 MHz): 0.77 - 0.84 (m, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.47 - 1.89 (m, 5 H) 2.03 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.10 - 2.51 (m, 20 H) 2.63 - 2.93 (m, 5 H) 3.17 - 3.29 (m, 8 H) 3.35 - 3.55 (m, 6 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.14 - 4.23 (m, 1 H) 4.33 - 4.40 (m, 2 H) 4.56 - 4.65 (m, 1 H) 4.96 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 5.11 (s, 2 H) 7.27 - 7.37 (m, 5 H)
404		HO ⁺ 	860.6	(600 MHz): 0.76 - 0.84 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.33 (m, 20 H) 1.48 - 1.90 (m, 5 H) 2.04 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.11 - 2.53 (m, 22 H) 2.66 - 2.93 (m, 8 H) 3.18 - 3.25 (m, 4 H) 3.28 (s, 3 H) 3.35 - 3.56 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.15 - 4.22 (m, 1 H) 4.34 - 4.40 (m, 2 H) 4.58 - 4.66 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
405		HO ⁺ 	748.4	(600 MHz): 0.78 - 0.82 (m, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.14 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 (s, 3 H) 1.16 - 1.17 (m, 1 H) 1.17 - 1.19 (m, 1 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.24 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 - 1.57 (m, 1 H) 1.62 - 1.85 (m, 3 H) 1.88 (dd, J=15.36, 5.27 Hz, 1 H) 2.10 - 2.27 (m, 2 H) 2.24 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.29 (s, 6 H) 2.30 - 2.32 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.44 (m, 1 H) 2.49 - 2.55 (m, 1 H) 2.77 - 2.99 (m, 4 H) 3.17 - 3.20 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.37 - 3.44 (m, 1 H) 3.48 - 3.57 (m, 1 H) 3.67 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.06 - 4.14 (m, 1 H) 4.40 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.48 (q, J=6.88 Hz, 1 H) 4.58 - 4.68 (m, 1 H) 4.88 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
406		H ₂ O ⁺ 		(600 MHz): 0.79 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.87 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 - 1.25 (m, 2 H) 1.07 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 (s, 3 H) 1.12 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.14 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 1.44 - 1.91 (m, 7 H) 2.05 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.10 - 2.53 (m, 9 H) 2.27 (s, 6 H) 2.33 (s, 3 H) 2.63 - 2.98 (m, 6 H) 3.16 - 3.21 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.35 - 3.43 (m, 2 H) 3.47 - 3.53 (m, 1 H) 3.68 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.14 (s, 1 H) 4.18 (q, J=6.11 Hz, 1 H) 4.35 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.61 (s, 1 H) 4.96 (d, J=5.04 Hz, 1 H)
407		HO ⁺ 	763.2	(600 MHz): 0.77 - 0.83 (m, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.14 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 - 1.17 (m, 1 H) 1.17 (s, 3 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.21 - 1.25 (m, 1 H) 1.26 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.48 - 1.57 (m, 1 H) 1.62 - 1.83 (m, 3 H) 1.83 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 2.05 - 2.24 (m, 2 H) 2.22 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.27 - 2.30 (m, 1 H) 2.32 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.39 - 2.46 (m, 1 H) 2.50 - 2.58 (m, 1 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.89 - 2.96 (m, 1 H) 3.07 (s, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.20 - 3.24 (m, 1 H) 3.34 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.37 - 3.43 (m, 1 H) 3.46 - 3.55 (m, 2 H) 3.52 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 3.66 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.05 - 4.11 (m, 1 H) 4.37 - 4.46 (m, 2 H) 4.56 - 4.66 (m, 1 H) 4.90 (d, J=5.04 Hz, 1 H)
408		HO ⁺ 	779.4	(600 MHz): 0.72 - 0.78 (m, 6 H) 0.84 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.02 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.04 - 1.08 (m, 1 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.14 - 1.18 (m, 6 H) 1.17 - 1.20 (m, 1 H) 1.22 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.26 (s, 3 H) 1.45 - 1.54 (m, 1 H) 1.56 - 1.77 (m, 3 H) 1.80 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 2.06 - 2.10 (m, 6 H) 2.13 - 2.43 (m, 7 H) 2.67 (d, J=13.76 Hz, 1 H) 2.71 - 2.81 (m, 2 H) 2.83 - 2.90 (m, 1 H) 3.13 - 3.16 (m, 9 H) 3.17 - 3.23 (m, 1 H) 3.29 (s, 3 H) 3.30 - 3.35 (m, 1 H) 3.44 - 3.52 (m, 1 H) 3.62 - 3.67 (m, 1 H) 4.01 - 4.09 (m, 1 H) 4.36 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.39 (q, J=6.57 Hz, 1 H) 4.53 - 4.61 (m, 1 H) 4.83 (d, J=4.13 Hz, 1 H)

【表 1 1 - 3 7】

409		HO- 	762.5	(600 MHz): 0.78 - 0.82 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.11 (m, 1 H) 1.14 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.17 (s, 3 H) 1.17 - 1.19 (m, 1 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.50 - 1.57 (m, 1 H) 1.61 - 1.87 (m, 3 H) 2.13 (m, 1 H) 2.20 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.23 - 2.26 (m, 2 H) 2.26 - 2.32 (m, 7 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 (s, 3 H) 2.39 - 2.45 (m, 1 H) 2.45 - 2.54 (m, 1 H) 2.69 - 2.73 (m, 2 H) 2.77 - 2.83 (m, 1 H) 2.87 - 2.94 (m, 1 H) 3.17 - 3.20 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.38 - 3.45 (m, 1 H) 3.46 - 3.53 (m, 1 H) 3.66 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.05 - 4.12 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.43 (q, J=6.42 Hz, 1 H) 4.58 - 4.66 (m, 1 H) 4.87 (d, J=4.58 Hz, 1 H)
410		HO- 	776.5	(600 MHz): 0.77 - 0.83 (m, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.12 - 1.17 (m, 8 H) 1.16 (s, 3 H) 1.19 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.46 (dd, J=15.36, 5.27 Hz, 1 H) 1.49 - 1.57 (m, 1 H) 1.63 - 1.87 (m, 3 H) 2.15 - 2.24 (m, 4 H) 2.25 - 2.33 (m, 7 H) 2.34 - 2.37 (m, 9 H) 2.39 - 2.45 (m, 1 H) 2.55 - 2.64 (m, 1 H) 2.74 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.77 - 2.83 (m, 1 H) 2.87 - 2.92 (m, 1 H) 3.16 - 3.21 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.37 - 3.43 (m, 1 H) 3.59 - 3.66 (m, 1 H) 3.68 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.04 - 4.09 (m, 1 H) 4.45 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.59 (q, J=6.72 Hz, 1 H) 4.61 - 4.66 (m, 1 H) 4.82 (d, J=5.04 Hz, 1 H)
411			790.4	(600 MHz): 0.77 - 0.93 (m, 9 H) 1.08 - 1.16 (m, 6 H) 1.15 - 1.18 (m, 1 H) 1.19 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.21 - 1.25 (m, 7 H) 1.31 (s, 3 H) 1.33 - 1.43 (m, 1 H) 1.51 - 1.58 (m, 1 H) 1.69 - 1.88 (m, 3 H) 2.13 - 2.49 (m, 14 H) 2.54 - 2.63 (m, 1 H) 2.80 - 2.92 (m, 2 H) 3.15 - 3.21 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.37 (s, 3 H) 3.39 - 3.48 (m, 2 H) 3.60 - 3.66 (m, 2 H) 3.83 (d, J=10.55 Hz, 1 H) 4.13 - 4.19 (m, 1 H) 4.45 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.63 - 4.71 (m, 1 H) 4.90 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 4.91 - 4.95 (m, 1 H)
412		HO- 	791.7	(500 MHz): 0.80 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.06 - 1.26 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.47 - 1.88 (m, 4 H) 2.26 (s, 6 H) 2.26 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.37 - 2.57 (m, 3 H) 2.65 - 2.84 (m, 5 H) 2.86 - 2.93 (m, 1 H) 3.14 - 3.23 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.37 - 3.54 (m, 2 H) 3.66 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 4.05 - 4.14 (m, 1 H) 4.33 - 4.48 (m, 2 H) 4.58 - 4.67 (m, 1 H) 4.85 - 4.89 (m, 1 H)
413		HO- 	805.7	(500 MHz): 0.80 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.05 - 1.24 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.47 - 1.88 (m, 6 H) 2.08 - 2.33 (m, 5 H) 2.26 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.37 - 2.59 (m, 3 H) 2.63 - 2.84 (m, 6 H) 2.85 - 2.94 (m, 1 H) 3.09 - 3.24 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.55 (m, 2 H) 3.66 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 4.04-4.13 (m, 1 H) 4.34 - 4.47 (m, 2 H) 4.54 - 4.68 (m, 1 H) 4.86 (d, J=4.66 Hz, 1 H)
414		HO- 	819.7	(500 MHz): 0.80 (d, J=6.58 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.27 Hz, 3 H) 1.04 - 1.25 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.39 - 1.88 (m, 8 H) 2.08 - 2.33 (m, 6 H) 2.26 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.37 - 2.64 (m, 4 H) 2.65 - 2.94 (m, 5 H) 3.15 - 3.23 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.37 - 3.68 (m, 3 H) 3.99 - 4.14 (m, 1 H) 4.33 - 4.50 (m, 2 H) 4.58 - 4.68 (m, 1 H) 4.83 - 4.89 (m, 1 H)

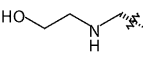
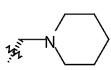
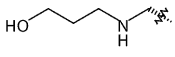
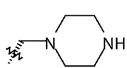
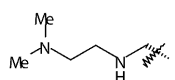
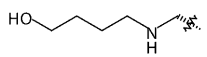
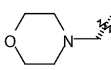
【 0 8 8 0 】

10

20

30

【表 1 1 - 3 8】

415			792.7	(500 MHz): 0.80 (d, J=6.86 Hz, 9 H) 0.89 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.05 - 1.12 (m, 4 H) 1.12 - 1.22 (m, 10 H) 1.23 - 1.28 (m, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.48 - 1.66 (m, 2 H) 1.68 - 1.88 (m, 2 H) 2.26 (s, 5 H) 2.26 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.50 (m, 2 H) 2.59 - 2.67 (m, 1 H) 2.74 - 2.93 (m, 5 H) 3.14 - 3.26 (m, 2 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.68 (m, 4 H) 4.06 - 4.16 (m, 1 H) 4.37 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.44 (d, 1 H) 4.58-4.67 (m, 1 H) 4.89 (d, J=4.66 Hz, 1 H)
416			816.7	(500 MHz): 0.81 (d, J=7.13 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.27 Hz, 3 H) 1.07 - 1.16 (m, 13 H) 1.16 - 1.22 (m, 4 H) 1.32 (s, 3 H) 1.36 - 1.89 (m, 12 H) 2.10 - 2.33 (m, 6 H) 2.26 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.39 - 2.48 (m, 1 H) 2.50 - 2.66 (m, 2 H) 2.70 (d, J=14.54 Hz, 1 H) 2.85 (d, 2 H) 3.14 - 3.30 (m, 2 H) 3.22 (s, 3 H) 3.36 (s, 3 H) 3.38 - 3.47 (m, 1 H) 3.60 - 3.72 (m, 2 H) 4.02 - 4.10 (m, 1 H) 4.47 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.59-4.67 (m, 2 H) 4.82 (d, J=5.21 Hz, 1 H)
417			806.7	(500 MHz): 0.80 (d, J=6.87 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.44 Hz, 3 H) 1.04 - 1.26 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.48 - 1.85 (m, 6 H) 1.90 - 1.97 (m, 1 H) 2.18 - 2.34 (m, 4 H) 2.26 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.37 - 2.49 (m, 2 H) 2.64 - 2.96 (m, 6 H) 3.12 - 3.26 (m, 2 H) 3.19 (s, 2 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.51 (m, 2 H) 3.65 (d, J=8.01 Hz, 1 H) 3.75 - 3.79 (m, 2 H) 4.07 - 4.16 (m, 1 H) 4.33 - 4.47 (m, 2 H) 4.57-4.66 (m, 1 H) 4.88 (d, J=4.58 Hz, 1 H)
418			817.8	(500 MHz): 0.80 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.03-1.22 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.46 - 1.88 (m, 6 H) 2.25 (s, 4 H) 2.25 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.37 - 2.46 (m, 1 H) 2.48 - 2.74 (m, 5 H) 2.76 - 2.93 (m, 6 H) 3.12 - 3.24 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.37 - 3.45 (m, 1 H) 3.56 - 3.65 (m, 1 H) 3.68 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.01 - 4.11 (m, 1 H) 4.28 - 4.37 (m, 1 H) 4.45 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.54 - 4.68 (m, 2 H) 4.83 (d, J=5.35 Hz, 1 H)
419			819.7	(500 MHz): 0.80 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.27 Hz, 3 H) 1.03 - 1.27 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.47 - 1.94 (m, 5 H) 1.97 - 2.07 (m, 1 H) 2.09 - 2.45 (m, 6 H) 2.20 (s, 6 H) 2.26 (s, 7 H) 2.35 (s, 3 H) 2.45 - 2.53 (m, 1 H) 2.58 - 2.74 (m, 3 H) 2.75 - 2.84 (m, 2 H) 2.85 - 2.94 (m, 1 H) 3.13 - 3.29 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.37 - 3.56 (m, 2 H) 3.67 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 4.04 - 4.14 (m, 1 H) 4.36 - 4.51 (m, 2 H) 4.57 - 4.69 (m, 1 H) 4.86 (d, J=4.94 Hz, 1 H)
420			820.7	(500 MHz): 0.80 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.04 - 1.28 (m, 17 H) 1.32 (s, 3 H) 1.47 - 1.88 (m, 8 H) 1.98 - 2.19 (m, 2 H) 2.17 - 2.55 (m, 6 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.67 - 2.96 (m, 5 H) 3.14 - 3.26 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.32 - 3.53 (m, 2 H) 3.53 - 3.69 (m, 3 H) 4.04 - 4.16 (m, 1 H) 4.32 - 4.48 (m, 2 H) 4.56-4.68 (m, 1 H) 4.89 (d, J=5.35 Hz, 1 H)
421			818.7	(500 MHz): 0.80 (d, J=7.13 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.06 - 1.22 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.47 - 1.90 (m, 5 H) 2.10 - 2.37 (m, 5 H) 2.26 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.37 - 2.46 (m, 1 H) 2.47 - 2.61 (m, 3 H) 2.62 - 2.93 (m, 5 H) 3.15 - 3.25 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.37 - 3.44 (m, 1 H) 3.54 - 3.63 (m, 1 H) 3.64 - 3.70 (m, 5 H) 4.02-4.13 (m, 1 H) 4.43 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.53 - 4.67 (m, 2 H) 4.84 (d, J=4.94 Hz, 1 H)

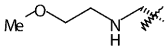
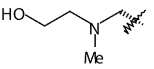
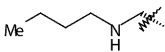
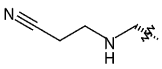
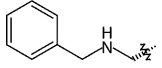
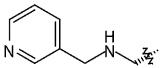
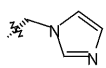
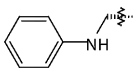
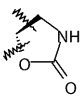
10

20

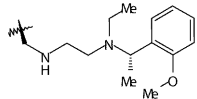
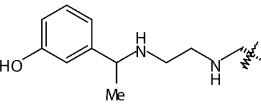
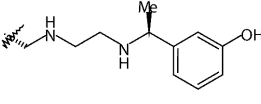
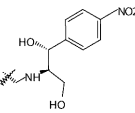
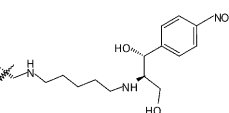
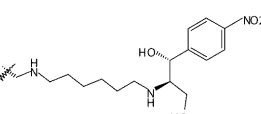
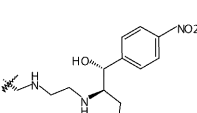
30

【 0 8 8 1】

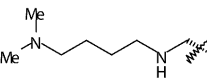
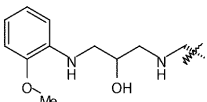
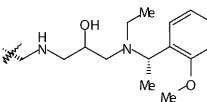
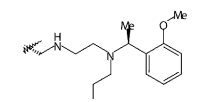
【表 1 1 - 3 9】

422		HO $\rightarrow$	806.7	(500 MHz): 0.80 (d, J=7.13 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.05 - 1.24 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.47 - 1.87 (m, 4 H) 1.99 - 2.54 (m, 7 H) 2.25 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.67 - 2.94 (m, 5 H) 3.13 - 3.24 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.37 - 3.55 (m, 5 H) 3.67 (d, J=7.68 Hz, 1 H) 4.05-4.13 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.46 (q, J=6.58 Hz, 1 H) 4.56-4.69 (m, 1 H) 4.85 (d, J=4.66 Hz, 1 H)
423		HO $\rightarrow$	806.7	(500 MHz): 0.80 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.06 - 1.28 (m, 17 H) 1.32 (s, 3 H) 1.49 - 1.87 (m, 5 H) 2.10 - 2.52 (m, 7 H) 2.26 (s, 6 H) 2.34 - 2.36 (m, 3 H) 2.36 (s, 3 H) 2.58 - 2.66 (m, 1 H) 2.69 - 2.93 (m, 4 H) 3.15 - 3.29 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.37 - 3.70 (m, 5 H) 4.06-4.11 (m, 1 H) 4.40 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.50 (q, J=6.88 Hz, 1 H) 4.59-4.67 (m, 1 H) 4.86 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
424		HO $\rightarrow$	804.7	(500 MHz): 0.80 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.85 - 0.92 (m, 6 H) 1.05 - 1.25 (m, 17 H) 1.27 - 1.36 (m, 5 H) 1.38 - 1.47 (m, 2 H) 1.48 - 1.88 (m, 4 H) 2.06 - 2.61 (m, 9 H) 2.26 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.66 - 2.84 (m, 3 H) 2.86 - 2.94 (m, 1 H) 3.15 - 3.25 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.32 - 3.55 (m, 2 H) 3.34 (s, 3 H) 3.66 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 4.04 - 4.14 (m, 1 H) 4.37 - 4.49 (m, 2 H) 4.58 - 4.69 (m, 1 H) 4.86 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
425		HO $\rightarrow$	801.6	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.07 - 1.29 (m, 17 H) 1.32 (s, 3 H) 1.49 - 1.88 (m, 5 H) 2.10 - 2.55 (m, 8 H) 2.31 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.66 - 3.02 (m, 6 H) 3.15 - 3.51 (m, 3 H) 3.21 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.66 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.08 - 4.16 (m, 1 H) 4.36 - 4.45 (m, 2 H) 4.58 - 4.68 (m, 1 H) 4.89 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
426		HO $\rightarrow$	838.6	(500 MHz): 0.80 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.06 - 1.23 (m, 17 H) 1.32 (s, 3 H) 1.49 - 1.86 (m, 4 H) 2.26 (s, 5 H) 2.26 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.51 (m, 2 H) 2.67 - 2.84 (m, 3 H) 2.86 - 2.94 (m, 1 H) 3.15 - 3.22 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.38 - 3.52 (m, 2 H) 3.63 - 3.80 (m, 3 H) 4.06 - 4.13 (m, 1 H) 4.34 - 4.45 (m, 2 H) 4.58 - 4.68 (m, 1 H) 4.88 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 7.20 - 7.35 (m, 5 H)
427		HO $\rightarrow$	839.6	(500 MHz): 0.80 (d, J=7.13 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.04 - 1.35 (m, 20 H) 1.46 - 1.95 (m, 4 H) 2.07 - 2.48 (m, 7 H) 2.26 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.66 (d, J=12.07 Hz, 1 H) 2.76 - 2.84 (m, 2 H) 2.85 - 2.93 (m, 1 H) 3.14 - 3.49 (m, 4 H) 3.19 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.61 - 3.69 (m, 2 H) 3.80 (d, J=13.44 Hz, 1 H) 4.06 - 4.15 (m, 1 H) 4.33 - 4.44 (m, 2 H) 4.58 - 4.67 (m, 1 H) 4.88 (d, J=4.94 Hz, 1 H) 7.21 - 7.25 (m, 1 H) 7.59 - 7.64 (m, 1 H) 8.45 - 8.58 (m, 2 H)
428		HO $\rightarrow$	799.6	(500 MHz): 0.76 - 0.84 (m, 6 H) 0.86 - 0.92 (m, 6 H) 1.04 - 1.27 (m, 14 H) 1.30 (s, 3 H) 1.50 - 1.87 (m, 5 H) 2.09 - 2.56 (m, 6 H) 2.32 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.79 - 2.95 (m, 2 H) 3.16 - 3.25 (m, 1 H) 3.19 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.34 - 3.46 (m, 2 H) 3.63 (d, J=7.64 Hz, 1 H) 4.11 - 4.29 (m, 3 H) 4.35 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.48 - 4.68 (m, 2 H) 4.98 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 7.00 (s, 1 H) 7.07 - 7.10 (m, 1 H) 7.60 (s, 1 H)
429		HO $\rightarrow$	824.7	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.06 - 1.36 (m, 20 H) 1.51 - 1.89 (m, 4 H) 2.01 - 2.55 (m, 7 H) 2.31 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.79 - 2.88 (m, 1 H) 2.89 - 2.97 (m, 1 H) 3.14 - 3.52 (m, 5 H) 3.23 (s, 3 H) 3.37 (s, 3 H) 3.68 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 4.17 - 4.25 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.50 (q, J=6.75 Hz, 1 H) 4.60 - 4.69 (m, 1 H) 5.01 (d, J=4.97 Hz, 1 H) 6.62 (d, J=8.03 Hz, 2 H) 6.69 (t, J=7.26 Hz, 1 H) 7.18 (t, J=7.84 Hz, 2 H)
430			774.6	(500 MHz): 0.77 - 0.93 (m, 9 H) 1.07 - 1.28 (m, 17 H) 1.32 (s, 3 H) 1.40 - 1.89 (m, 4 H) 2.10 - 2.61 (m, 7 H) 2.29 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.75 - 2.92 (m, 2 H) 3.14 - 3.45 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.38 (s, 3 H) 3.57 - 3.71 (m, 3 H) 4.10 - 4.19 (m, 1 H) 4.43 - 4.49 (m, 1 H) 4.57 - 4.69 (m, 1 H) 4.86 - 4.93 (m, 2 H) 5.00 - 5.04 (m, 1 H)

【表 1 1 - 4 0】

431			954.0	(600 MHz): 0.82 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.94 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.11 - 1.29 (m, 17 H) 1.27 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.48 - 1.75 (m, 3 H) 1.80 - 1.85 (m, 1 H) 1.88 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 2.04 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 2.11 - 2.19 (m, 1 H) 2.25 - 2.30 (m, 2 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.36 - 2.66 (m, 9 H) 2.74 - 2.81 (m, 2 H) 2.86 - 2.94 (m, 1 H) 3.18 - 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.35 - 3.42 (m, 1 H) 3.43 - 3.48 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.80 (s, 3 H) 4.15 - 4.22 (m, 1 H) 4.26 - 4.32 (m, 1 H) 4.33 - 4.39 (m, 2 H) 4.59 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 6.84 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.89 - 6.94 (m, 1 H) 7.17 - 7.22 (m, 1 H) 7.29 - 7.33 (m, 1 H)
432			911.9	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.80 - 0.88 (m, 6 H) 0.89 - 0.95 (m, 3 H) 1.08 - 1.39 (m, 23 H) 1.49 - 1.91 (m, 4 H) 2.09 - 2.73 (m, 12 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.75 - 2.96 (m, 3 H) 3.15 - 3.56 (m, 9 H) 3.63 - 3.77 (m, 2 H) 4.13 - 4.21 (m, 1 H) 4.36 - 4.48 (m, 2 H) 4.66 - 4.75 (m, 1 H) 4.89 - 4.95 (m, 1 H) 6.70 - 6.90 (m, 3 H) 7.15 (t, J=7.79 Hz, 1 H)
433			911.9	(600 MHz): 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.03 - 1.28 (m, 2 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 (s, 3 H) 1.17 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.26 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.29 - 1.34 (m, 6 H) 1.50 - 1.60 (m, 1 H) 1.60 - 1.68 (m, 1 H) 1.70 - 1.90 (m, 2 H) 2.07 - 2.46 (m, 6 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.46 - 2.73 (m, 7 H) 2.79 - 2.86 (m, 1 H) 2.86 - 2.93 (m, 1 H) 3.19 - 3.23 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.37 - 3.44 (m, 1 H) 3.46 - 3.55 (m, 1 H) 3.65 - 3.77 (m, 2 H) 4.16 (s, 1 H) 4.40 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.44 (q, J=6.88 Hz, 1 H) 4.67 (s, 1 H) 4.89 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 6.71 (dd, J=8.02, 2.52 Hz, 1 H) 6.75 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 6.84 - 6.88 (m, 1 H) 7.13 (t, J=7.79 Hz, 1 H)
434			944.0	(500 MHz): 0.77 - 0.85 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.04 - 1.26 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.50 - 1.87 (m, 4 H) 1.97 - 2.03 (m, 1 H) 2.10 - 2.52 (m, 6 H) 2.25 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.61 - 2.69 (m, 2 H) 2.77 - 2.96 (m, 3 H) 3.14 - 3.23 (m, 1 H) 3.15 (s, 3 H) 3.29 - 3.46 (m, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.60 - 3.67 (m, 2 H) 4.09 - 4.17 (m, 1 H) 4.33 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.41 (q, J=6.40 Hz, 1 H) 4.59 - 4.68 (m, 1 H) 4.81 (d, J=6.31 Hz, 1 H) 4.89 (d, J=4.94 Hz, 1 H) 7.57 (d, J=8.78 Hz, 2 H) 8.19 (d, J=8.78 Hz, 2 H)
435				(500 MHz): 0.80 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.05 - 1.37 (m, 22 H) 1.39 - 1.88 (m, 8 H) 2.07 - 2.32 (m, 11 H) 2.32 - 2.92 (m, 13 H) 3.15 - 3.23 (m, 4 H) 3.31 - 3.43 (m, 5 H) 3.46 - 3.74 (m, 4 H) 4.05 - 4.13 (m, 1 H) 4.37 - 4.48 (m, 2 H) 4.58 - 4.71 (m, 2 H) 4.86 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 7.58 (d, J=8.50 Hz, 2 H) 8.17 - 8.21 (m, 2 H)
436			1042.8	(500 MHz): 0.73 - 0.83 (m, 6 H) 0.84 - 0.90 (m, 3 H) 1.03 - 1.87 (m, 32 H) 1.91 - 1.96 (m, 4 H) 2.04 - 2.91 (m, 20 H) 3.11 - 3.30 (m, 4 H) 3.30 - 3.42 (m, 5 H) 3.45 - 3.55 (m, 1 H) 3.63 - 3.72 (m, 2 H) 4.04 - 4.10 (m, 1 H) 4.35 - 4.47 (m, 2 H) 4.55 - 4.71 (m, 2 H) 4.83 - 4.86 (m, 1 H) 5.68 - 5.76 (m, 1 H) 7.56 - 7.60 (m, 2 H) 8.17 (d, J=8.78 Hz, 2 H)
437			987.0	(600 MHz): 0.82 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.22 (m, 2 H) 1.17 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.18 (s, 3 H) 1.22 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.28 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.34 (s, 3 H) 1.51 - 1.87 (m, 5 H) 2.11 - 2.26 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.30 - 2.35 (m, 1 H) 2.37 (s, 3 H) 2.41 - 2.46 (m, 1 H) 2.46 - 2.51 (m, 1 H) 2.56 - 2.91 (m, 10 H) 3.20 - 3.24 (m, 4 H) 3.36 (s, 3 H) 3.38 - 3.43 (m, 2 H) 3.45 - 3.50 (m, 1 H) 3.64 - 3.68 (m, 2 H) 4.11 - 4.17 (m, 1 H) 4.38 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.43 - 4.48 (m, 1 H) 4.59 - 4.64 (m, 1 H) 4.69 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 4.94 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 7.60 (d, J=8.71 Hz, 2 H) 8.20 (d, J=8.71 Hz, 2 H)

【表 1 1 - 4 2】

445		HO ~~CH~~	847.9	(500 MHz): 0.80 (d, J=7.13 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.05 - 1.25 (m, 17 H) 1.32 (s, 3 H) 1.42 - 1.87 (m, 8 H) 2.08 - 2.33 (m, 18 H) 2.36 (s, 3 H) 2.37 - 2.65 (m, 4 H) 2.68 - 2.94 (m, 4 H) 3.15 - 3.27 (m, 5 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.55 (m, 2 H) 3.66 (d, J=7.68 Hz, 1 H) 4.05 - 4.12 (m, 1 H) 4.36 - 4.48 (m, 2 H) 4.58 - 4.69 (m, 1 H) 4.86 (d, J=4.66 Hz, 1 H)
446		HO ~~CH~~	928.0	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.14 - 1.26 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=4.13 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.26 - 1.29 (m, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.46 - 1.88 (m, 4 H) 2.03 - 2.18 (m, 2 H) 2.21 - 2.51 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.54 (dd, J=11.92, 8.71 Hz, 1 H) 2.74 - 2.94 (m, 5 H) 3.07 - 3.29 (m, 3 H) 3.20 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.37 - 3.51 (m, 2 H) 3.67 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.84 (s, 3 H) 3.87 - 3.96 (m, 1 H) 4.08 - 4.17 (m, 1 H) 4.38 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.41 - 4.47 (m, 1 H) 4.59 - 4.67 (m, 1 H) 4.86 - 4.92 (m, 1 H) 6.59 - 6.64 (m, 1 H) 6.65 - 6.70 (m, 1 H) 6.74 - 6.79 (m, 1 H) 6.82 - 6.88 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.14 - 1.26 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=4.13 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.26 - 1.29 (m, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.46 - 1.88 (m, 4 H) 2.03 - 2.18 (m, 2 H) 2.21 - 2.51 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.63 (dd, J=12.38, 3.67 Hz, 1 H) 2.74 - 2.94 (m, 5 H) 3.07 - 3.29 (m, 3 H) 3.20 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.37 - 3.51 (m, 2 H) 3.67 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.84 (s, 3 H) 3.87 - 3.96 (m, 1 H) 4.08 - 4.17 (m, 1 H) 4.38 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.41 - 4.47 (m, 1 H) 4.59 - 4.67 (m, 1 H) 4.86 - 4.92 (m, 1 H) 6.59 - 6.64 (m, 1 H) 6.65 - 6.70 (m, 1 H) 6.74 - 6.79 (m, 1 H) 6.82 - 6.88 (m, 1 H)
447		~~CH~~ OH	984.0	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.86 - 0.91 (m, 3 H) 0.91 - 0.99 (m, 3 H) 1.05 - 1.36 (m, 23 H) 1.47 - 1.88 (m, 4 H) 1.95 - 2.03 (m, 1 H) 2.10 - 2.33 (m, 4 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.85 (m, 11 H) 2.88 - 2.95 (m, 1 H) 3.16 - 3.21 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.37 - 3.46 (m, 1 H) 3.49 - 3.58 (m, 1 H) 3.64 - 3.78 (m, 2 H) 3.82 (s, 3 H) 4.05 - 4.15 (m, 1 H) 4.36 - 4.45 (m, 2 H) 4.45 - 4.52 (m, 1 H) 4.57 - 4.67 (m, 1 H) 4.82 - 4.89 (m, 1 H) 6.83 - 6.96 (m, 2 H) 7.18 - 7.29 (m, 2 H)、及び (600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.86 - 0.91 (m, 3 H) 0.91 - 0.99 (m, 3 H) 1.05 - 1.36 (m, 23 H) 1.47 - 1.88 (m, 4 H) 1.95 - 2.03 (m, 1 H) 2.10 - 2.33 (m, 4 H) 2.27 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.85 (m, 11 H) 2.88 - 2.95 (m, 1 H) 3.16 - 3.21 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.37 - 3.46 (m, 1 H) 3.49 - 3.58 (m, 1 H) 3.64 - 3.78 (m, 2 H) 3.83 (s, 3 H) 4.05 - 4.15 (m, 1 H) 4.36 - 4.45 (m, 2 H) 4.45 - 4.52 (m, 1 H) 4.57 - 4.67 (m, 1 H) 4.82 - 4.89 (m, 1 H) 6.83 - 6.96 (m, 2 H) 7.18 - 7.29 (m, 2 H)
448		~~CH~~ OH	970.0	(600 MHz): 0.78 - 0.84 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.05 - 1.22 (m, 2 H) 1.07 (s, 3 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.29 - 1.34 (m, 6 H) 1.50 - 1.58 (m, 1 H) 1.60 - 1.66 (m, 1 H) 1.70 - 1.88 (m, 3 H) 2.12 - 2.20 (m, 1 H) 2.21 - 2.39 (m, 4 H) 2.26 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.42 (d, J=12.84 Hz, 1 H) 2.46 - 2.64 (m, 6 H) 2.67 (d, J=12.84 Hz, 1 H) 2.70 - 2.76 (m, 1 H) 2.77 - 2.84 (m, 1 H) 2.91 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 3.18 (dd, J=10.09, 7.34 Hz, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.37 - 3.57 (m, 3 H) 3.60 - 3.68 (m, 2 H) 3.83 (s, 3 H) 4.07 (s, 1 H) 4.36 - 4.48 (m, 3 H) 4.63 (s, 1 H) 4.83 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 6.87 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 6.94 (t, J=7.11 Hz, 1 H) 7.20 - 7.29 (m, 2 H)

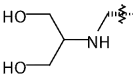
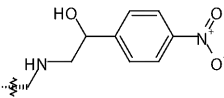
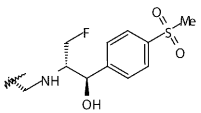
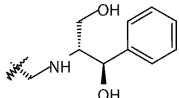
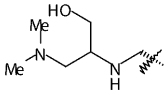
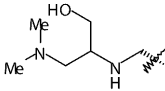
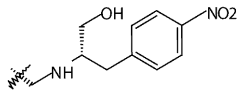
10

20

30

【 0 8 8 5 】

【表 1 1 - 4 3】

449		HO ~~+~~	822.7	(600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.26 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.19 (s, 3 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.29 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.48 - 1.87 (m, 4 H) 2.05 (dd, J=15.13, 5.04 Hz, 1 H) 2.08 - 2.19 (m, 1 H) 2.19 - 2.52 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.64 - 2.70 (m, 1 H) 2.78 - 2.94 (m, 4 H) 3.17 - 3.23 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.29 - 3.41 (m, 1 H) 3.35 (s, 3 H) 3.43 - 3.51 (m, 1 H) 3.53 (dd, J=11.00, 5.04 Hz, 1 H) 3.61 (dd, J=11.00, 5.50 Hz, 1 H) 3.65 - 3.69 (m, 2 H) 3.72 (dd, J=11.00, 4.59 Hz, 1 H) 4.14 (s, 1 H) 4.38 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.42 - 4.48 (m, 1 H) 4.62 (s, 1 H) 4.90 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
450		HO ~~+~~	913.8	ジアステレオマーの混合物 (600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.87 - 0.93 (m, 3 H) 1.07 - 1.36 (m, 17 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.48 - 1.88 (m, 4 H) 2.00 - 2.19 (m, 2 H) 2.20 - 2.48 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 - 2.38 (m, 3 H) 2.48 - 3.02 (m, 6 H) 3.18 - 3.24 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.34 - 3.48 (m, 2 H) 3.36 (s, 3 H) 3.61 - 3.68 (m, 1 H) 4.15 (s, 1 H) 4.34 - 4.39 (m, 1 H) 4.41 - 4.47 (m, 1 H) 4.60 - 4.69 (m, 1 H) 4.75 - 4.82 (m, 1 H) 4.93 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 7.50 - 7.57 (m, 2 H) 8.18 - 8.23 (m, 2 H)
451		~~+~~ OH	978.8	(600 MHz): 0.76 - 0.83 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.05 - 1.34 (m, 20 H) 1.42 - 1.86 (m, 4 H) 1.88 - 2.54 (m, 15 H) 2.60 - 3.00 (m, 4 H) 3.01 - 3.07 (m, 4 H) 3.13 - 3.68 (m, 13 H) 4.10 - 4.28 (m, 1 H) 4.32 - 4.47 (m, 2 H) 4.67 (d, J=7.79 Hz, 2 H) 4.87 - 4.92 (m, 1 H) 7.59 (d, J=8.25 Hz, 2 H) 7.92 (d, J=8.25 Hz, 2 H)
452		~~+~~ OH	898.9	(500 MHz): 0.76 - 0.85 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.05 - 1.26 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.48 - 1.66 (m, 2 H) 1.69 - 1.87 (m, 2 H) 2.04 (dd, J=15.08, 5.21 Hz, 1 H) 2.10 - 2.33 (m, 5 H) 2.25 (s, 6 H) 2.34 - 2.50 (m, 2 H) 2.36 (s, 3 H) 2.63 - 2.74 (m, 2 H) 2.77 - 2.95 (m, 3 H) 3.16 - 3.22 (m, 1 H) 3.19 (s, 3 H) 3.30 - 3.39 (m, 1 H) 3.33 (s, 3 H) 3.40 - 3.49 (m, 1 H) 3.53 - 3.67 (m, 2 H) 4.09 - 4.16 (m, 1 H) 4.32 - 4.44 (m, 2 H) 4.58 - 4.70 (m, 2 H) 4.88 (d, J=4.94 Hz, 1 H) 7.22 - 7.38 (m, 5 H)
453		HO ~~+~~	849.8	(500 MHz): 0.81 (d, J=7.13 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.27 Hz, 3 H) 1.06 - 1.35 (m, 20 H) 1.49 - 1.93 (m, 5 H) 2.09 - 2.53 (m, 24 H) 2.63 - 2.71 (m, 1 H) 2.74 - 2.94 (m, 3 H) 3.16 - 3.24 (m, 4 H) 3.30 - 3.70 (m, 8 H) 4.08 - 4.17 (m, 1 H) 4.35 - 4.45 (m, 2 H) 4.59 - 4.68 (m, 1 H) 4.86 (d, J=4.11 Hz, 1 H)
454		HO ~~+~~	849.8	(500 MHz): 0.80 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.06 - 1.27 (m, 17 H) 1.32 (s, 3 H) 1.48 - 1.87 (m, 5 H) 1.99 - 2.07 (m, 1 H) 2.10 - 2.53 (m, 23 H) 2.69 - 2.94 (m, 4 H) 3.16 - 3.24 (m, 4 H) 3.31 - 3.70 (m, 8 H) 4.07 - 4.15 (m, 1 H) 4.36 - 4.48 (m, 2 H) 4.58 - 4.69 (m, 1 H) 4.86 (d, J=4.94 Hz, 1 H)
455		~~+~~ OH	927.9	(500 MHz): 0.78 - 0.85 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.06 - 1.27 (m, 17 H) 1.32 (s, 3 H) 1.50 - 1.87 (m, 4 H) 1.98 - 2.05 (m, 1 H) 2.10 - 2.53 (m, 14 H) 2.60 - 2.66 (m, 1 H) 2.70 - 2.75 (m, 1 H) 2.79 - 2.96 (m, 3 H) 3.02 - 3.06 (m, 3 H) 3.16 - 3.24 (m, 4 H) 3.31 - 3.38 (m, 4 H) 3.41 - 3.67 (m, 3 H) 4.13 - 4.19 (m, 1 H) 4.36 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.45 (q, 1 H) 4.58 - 4.67 (m, 1 H) 4.74 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.91 (d, J=4.97 Hz, 1 H) 7.61 (d, J=8.41 Hz, 2 H) 7.92 (d, J=8.41 Hz, 2 H)

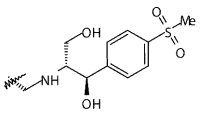
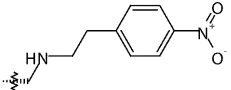
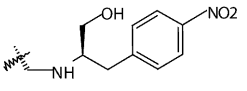
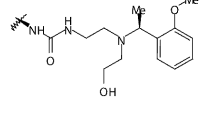
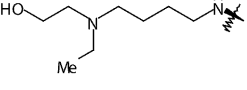
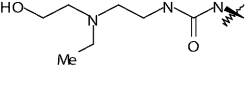
10

20

30

【 0 8 8 6 】

【表 1 1 - 4 4】

456			976.8	(500 MHz): 0.78 – 0.85 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.27 Hz, 3 H) 1.06 – 1.27 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.50 – 1.88 (m, 4 H) 1.96 – 2.04 (m, 1 H) 2.10 – 2.53 (m, 16 H) 2.60 – 2.95 (m, 5 H) 3.04 (s, 3 H) 3.16 – 3.24 (m, 4 H) 3.32 – 3.38 (m, 5 H) 3.41 – 3.50 (m, 1 H) 3.58 – 3.67 (m, 2 H) 4.12 – 4.19 (m, 1 H) 4.36 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.44 (q, J=6.76 Hz, 1 H) 4.59 – 4.67 (m, 1 H) 4.74 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.91 (d, J=4.94 Hz, 1 H) 7.59 – 7.63 (m, 1 H) 7.91 (d, J=8.50 Hz, 2 H)
457			897.9	(600 MHz): 0.77 – 0.84 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.05 – 1.22 (m, 2 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 (s, 3 H) 1.13 – 1.17 (m, 6 H) 1.18 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 – 1.65 (m, 2 H) 1.71 – 1.87 (m, 2 H) 2.11 – 2.20 (m, 3 H) 2.21 – 2.49 (m, 4 H) 2.26 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.70 – 2.74 (m, 1 H) 2.76 – 2.94 (m, 7 H) 3.17 (s, 3 H) 3.17 – 3.20 (m, 1 H) 3.33 (s, 3 H) 3.40 – 3.48 (m, 2 H) 3.62 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.06 – 4.12 (m, 1 H) 4.33 – 4.41 (m, 2 H) 4.62 – 4.71 (m, 1 H) 4.84 – 4.88 (m, 1 H) 7.34 (d, J=8.71 Hz, 2 H) 8.15 (d, J=8.71 Hz, 2 H)
458			927.6	(600 MHz): 0.77 – 0.84 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.57 Hz, 3 H) 1.04 – 1.35 (m, 20 H) 1.49 – 1.94 (m, 5 H) 2.10 – 2.52 (m, 14 H) 2.67 – 2.94 (m, 6 H) 3.16 – 3.25 (m, 5 H) 3.29 – 3.47 (m, 5 H) 3.59 – 3.66 (m, 3 H) 3.76 – 3.78 (m, 1 H) 4.08 – 4.15 (m, 1 H) 4.33 – 4.43 (m, 2 H) 4.58 – 4.68 (m, 1 H) 4.84 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 7.36 (d, J=8.71 Hz, 2 H) 8.14 – 8.16 (m, 2 H)
459				(600 MHz): 0.81 (d, J=7.34 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.05 (s, 3 H) 1.06 – 1.26 (m, 2 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 – 1.20 (m, 9 H) 1.30 – 1.35 (m, 6 H) 1.50 – 1.70 (m, 3 H) 1.71 – 1.79 (m, 1 H) 1.79 – 1.86 (m, 1 H) 2.09 – 2.18 (m, 1 H) 2.21 – 2.45 (m, 4 H) 2.27 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.46 – 2.61 (m, 3 H) 2.63 – 2.76 (m, 2 H) 2.76 – 2.84 (m, 1 H) 2.88 – 2.93 (m, 1 H) 2.99 – 3.08 (m, 1 H) 3.17 – 3.32 (m, 2 H) 3.22 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.33 – 3.50 (m, 3 H) 3.60 – 3.67 (m, 1 H) 3.69 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 3.90 (s, 3 H) 4.03 – 4.09 (m, 1 H) 4.21 – 4.27 (m, 1 H) 4.33 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.39 – 4.45 (m, 1 H) 4.58 – 4.67 (m, 2 H) 4.81 (s, 1 H) 4.95 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.93 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 6.94 – 6.98 (m, 1 H) 7.22 – 7.30 (m, 2 H)
460				(600 MHz): 0.83 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.02 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.07 – 1.24 (m, 8 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.26 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.44 – 1.78 (m, 6 H) 1.83 – 1.90 (m, 1 H) 1.93 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 2.15 – 2.35 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.41 – 2.63 (m, 7 H) 2.78 – 2.91 (m, 3 H) 3.21 (dd, J=10.09, 7.34 Hz, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.37 – 3.45 (m, 5 H) 3.53 (t, J=5.50 Hz, 2 H) 3.66 – 3.70 (m, 1 H) 3.72 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.98 – 4.04 (m, 1 H) 4.08 – 4.11 (m, 1 H) 4.45 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.63 – 4.70 (m, 1 H) 4.93 (d, J=5.04 Hz, 1 H)
461			876.9	(500 MHz): 0.81 (d, J=7.13 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.27 Hz, 3 H) 1.01 (t, J=7.13 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.07 – 1.12 (m, 1 H) 1.12 (s, 3 H) 1.15 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.21 – 1.28 (m, 1 H) 1.34 (s, 3 H) 1.49 – 1.58 (m, 2 H) 1.63 – 1.70 (m, 1 H) 1.71 – 1.79 (m, 1 H) 1.78 – 1.86 (m, 1 H) 2.10 – 2.18 (m, 1 H) 2.18 – 2.25 (m, 1 H) 2.26 – 2.33 (m, 2 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 – 2.44 (m, 1 H) 2.52 – 2.65 (m, 7 H) 2.74 – 2.82 (m, 1 H) 2.92 (d, J=13.99 Hz, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.21 – 3.33 (m, 3 H) 3.26 (s, 3 H) 3.36 – 3.42 (m, 1 H) 3.42 – 3.49 (m, 2 H) 3.54 – 3.58 (m, 2 H) 3.66 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 4.07 – 4.13 (m, 1 H) 4.13 – 4.19 (m, 1 H) 4.31 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.56 – 4.64 (m, 1 H) 4.94 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 5.08 – 5.12 (m, 1 H) 5.12 – 5.17 (m, 1 H)

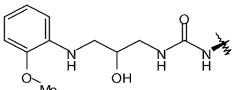
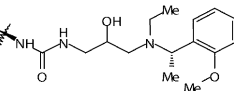
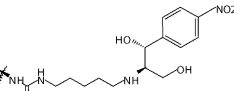
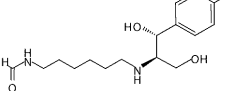
【0 8 8 7】

10

20

30

【表 1 1 - 4 5】

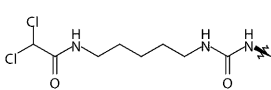
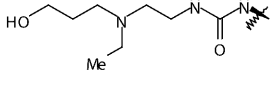
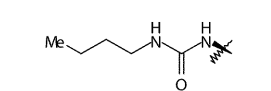
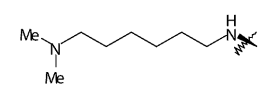
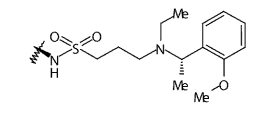
462		$\frac{1}{2}$ H	940.9	ジアステレオマーの混合物 (500 MHz): 0.77 - 0.85 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=2.19 Hz, 3 H) 1.12 - 1.16 (m, 1 H) 1.15 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.18 - 1.23 (m, 6 H) 1.20 - 1.27 (m, 1 H) 1.35 (s, 3 H) 1.49 - 1.58 (m, 2 H) 1.59 - 1.68 (m, 1 H) 1.70 - 1.79 (m, 1 H) 1.79 - 1.85 (m, 1 H) 2.16 - 2.30 (m, 3 H) 2.26 (s, 6 H) 2.33 (d, J=15.08 Hz, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.45 (m, 1 H) 2.48 - 2.57 (m, 1 H) 2.76 - 2.80 (m, 1 H) 2.92 (d, J=14.26 Hz, 1 H) 3.10 - 3.16 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.24 (d, J=2.47 Hz, 3 H) 3.24 - 3.36 (m, 3 H) 3.37 - 3.52 (m, 4 H) 3.66 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 3.82 (s, 3 H) 3.91 - 3.98 (m, 1 H) 4.07 - 4.19 (m, 2 H) 4.28 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.48 - 4.56 (m, 1 H) 4.56 - 4.64 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.11 Hz, 1 H) 5.24 - 5.31 (m, 1 H) 5.31 - 5.38 (m, 1 H) 6.59 - 6.63 (m, 1 H) 6.64 - 6.69 (m, 1 H) 6.73 - 6.77 (m, 1 H) 6.80 - 6.86 (m, 1 H)
463		$\frac{1}{2}$ H	997.0	ジアステレオマーの混合物 (500 MHz): 0.74 - 0.85 (m, 6 H) 0.86 - 0.91 (m, 3 H) 0.90 - 1.01 (m, 3 H) 1.06 - 1.12 (m, 6 H) 1.14 - 1.23 (m, 9 H) 1.15 - 1.19 (m, 1 H) 1.21 - 1.26 (m, 1 H) 1.26 - 1.35 (m, 6 H) 1.51 - 1.59 (m, 2 H) 1.61 - 1.70 (m, 1 H) 1.71 - 1.79 (m, 1 H) 1.80 - 1.86 (m, 1 H) 2.10 - 2.17 (m, 1 H) 2.26 - 2.35 (m, 2 H) 2.28 - 2.31 (m, 6 H) 2.35 - 2.37 (m, 3 H) 2.38 - 2.59 (m, 5 H) 2.76 - 2.83 (m, 1 H) 2.89 (d, J=15.08 Hz, 1 H) 2.93 - 3.06 (m, 1 H) 3.19 - 3.23 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.27 - 3.28 (m, 3 H) 3.33 - 3.50 (m, 6 H) 3.58 - 3.70 (m, 1 H) 3.69 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 3.83 (s, 3 H) 4.03 - 4.12 (m, 1 H) 4.17 - 4.24 (m, 1 H) 4.32 - 4.41 (m, 2 H) 4.60 - 4.65 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 6.86 - 6.89 (m, 1 H) 6.94 (t, J=7.40 Hz, 1 H) 7.20 - 7.26 (m, 2 H)
464		$\frac{1}{2}$ H	1042.0	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.45 Hz, 3 H) 1.03 - 1.59 (m, 26 H) 1.63 - 1.87 (m, 3 H) 2.10 - 2.47 (m, 8 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.51 - 2.69 (m, 3 H) 2.74 - 2.81 (m, 1 H) 2.89 - 2.97 (m, 1 H) 3.07 - 3.54 (m, 7 H) 3.20 (s, 3 H) 3.24 (s, 3 H) 3.61 - 3.72 (m, 2 H) 4.05 - 4.14 (m, 2 H) 4.28 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.56 - 4.69 (m, 2 H) 4.93 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 4.98 - 5.13 (m, 2 H) 7.60 (d, J=8.79 Hz, 2 H) 8.18 (d, J=8.79 Hz, 2 H)
465		$\frac{1}{2}$ H	1054.7	(500 MHz): 0.55 - 0.64 (m, 1 H) 0.76 - 1.00 (m, 11 H) 0.99 - 1.89 (m, 30 H) 1.98 - 2.48 (m, 6 H) 2.30 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.50 - 2.68 (m, 3 H) 2.74 - 2.84 (m, 1 H) 2.87 - 2.97 (m, 1 H) 3.06 - 3.54 (m, 6 H) 3.21 (s, 3 H) 3.25 (s, 3 H) 3.61 - 3.75 (m, 2 H) 4.06 - 4.19 (m, 2 H) 4.30 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.57 - 4.73 (m, 2 H) 4.83 - 5.10 (m, 3 H) 7.08 (s, 1 H) 7.60 (d, J=8.41 Hz, 2 H) 8.19 (d, J=8.79 Hz, 2 H)

【 0 8 8 8 】

10

20

【表 1 1 - 4 6】

466		$\frac{2}{3}\text{H}$	956.9	(500 MHz): 0.80 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.88 (t, J=7.26 Hz, 3 H) 1.04 - 1.41 (m, 22 H) 1.47 - 1.87 (m, 8 H) 2.09 - 2.45 (m, 7 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.46 - 2.56 (m, 1 H) 2.73 - 2.94 (m, 2 H) 3.08 - 3.50 (m, 7 H) 3.20 (s, 3 H) 3.25 (s, 3 H) 3.65 - 3.69 (m, 1 H) 4.05 - 4.14 (m, 1 H) 4.15 - 4.21 (m, 1 H) 4.30 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.57 - 4.65 (m, 1 H) 4.75 - 4.83 (m, 1 H) 4.92 - 5.02 (m, 2 H) 6.00 (s, 1 H) 6.99 - 7.06 (m, 1 H)
467		$\frac{2}{3}\text{H}$	890.8	(600 MHz): 0.77 - 0.83 (m, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.03 (t, J=7.11 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.10 - 1.21 (m, 2 H) 1.11 (s, 3 H) 1.15 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 - 1.58 (m, 2 H) 1.61 - 1.71 (m, 3 H) 1.71 - 1.78 (m, 1 H) 1.79 - 1.87 (m, 1 H) 2.11 - 2.18 (m, 1 H) 2.20 - 2.28 (m, 2 H) 2.29 (s, 6 H) 2.32 - 2.35 (m, 1 H) 2.35 (s, 3 H) 2.37 - 2.45 (m, 1 H) 2.48 - 2.59 (m, 5 H) 2.61 - 2.70 (m, 2 H) 2.76 - 2.82 (m, 1 H) 2.90 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.21 - 3.25 (m, 2 H) 3.26 (s, 3 H) 3.32 - 3.48 (m, 4 H) 3.67 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.79 (t, J=5.27 Hz, 2 H) 4.05 - 4.12 (m, 1 H) 4.13 - 4.18 (m, 1 H) 4.34 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.58 - 4.65 (m, 1 H) 4.95 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.96 - 4.99 (m, 1 H) 5.10 - 5.20 (m, 1 H)
468		$\frac{2}{3}\text{H}$	817.9	(600 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.87 - 0.93 (m, 6 H) 1.06 - 1.29 (m, 2 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.12 (s, 3 H) 1.16 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.20 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.30 - 1.39 (m, 2 H) 1.32 (s, 3 H) 1.44 - 1.50 (m, 2 H) 1.50 - 1.59 (m, 2 H) 1.60 - 1.69 (m, 1 H) 1.71 - 1.79 (m, 1 H) 1.79 - 1.86 (m, 1 H) 2.08 - 2.18 (m, 1 H) 2.20 - 2.44 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.45 - 2.53 (m, 1 H) 2.76 - 2.83 (m, 1 H) 2.90 (d, J=14.67 Hz, 1 H) 3.13 - 3.19 (m, 2 H) 3.20 - 3.25 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.37 - 3.53 (m, 3 H) 3.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 4.05 - 4.13 (m, 1 H) 4.16 - 4.24 (m, 1 H) 4.25 - 4.31 (m, 1 H) 4.34 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.56 - 4.66 (m, 1 H) 4.79 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
469		$\frac{2}{3}\text{H}$	845.9	(600 MHz): 0.78 - 0.85 (m, 6 H) 0.88 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.09 - 1.23 (m, 4 H) 1.15 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.18 (s, 3 H) 1.19 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.25 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.26 - 1.35 (m, 7 H) 1.36 - 1.66 (m, 7 H) 1.68 - 1.80 (m, 1 H) 1.80 - 1.90 (m, 1 H) 1.92 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 2.19 - 2.26 (m, 3 H) 2.20 (s, 6 H) 2.28 (s, 6 H) 2.32 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.35 (s, 3 H) 2.40 - 2.46 (m, 1 H) 2.47 - 2.52 (m, 1 H) 2.54 - 2.60 (m, 1 H) 2.76 - 2.83 (m, 2 H) 2.84 - 2.92 (m, 1 H) 3.17 - 3.22 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.36 - 3.46 (m, 1 H) 3.64 - 3.70 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 3.96 - 4.03 (m, 1 H) 4.08 (s, 1 H) 4.44 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.65 (s, 1 H) 4.92 (d, J=5.04 Hz, 1 H)
470		$\frac{2}{3}\text{H}$	1002.1	(600 MHz): 0.81 (d, J=6.42 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.34 Hz, 3 H) 0.96 (t, J=6.88 Hz, 3 H) 1.06 - 1.28 (m, 2 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.25 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.27 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.49 - 2.02 (m, 7 H) 2.06 - 2.70 (m, 10 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.73 - 3.34 (m, 6 H) 3.23 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.37 - 3.46 (m, 2 H) 3.62 - 3.68 (m, 1 H) 3.80 (s, 3 H) 4.09 - 4.23 (m, 2 H) 4.29 - 4.36 (m, 2 H) 4.58 - 4.70 (m, 2 H) 4.96 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.83 - 6.98 (m, 2 H) 7.17 - 7.34 (m, 2 H)

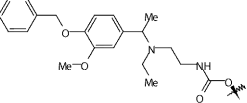
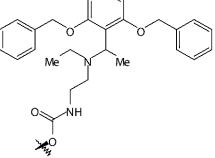
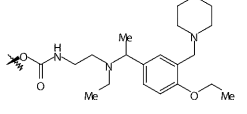
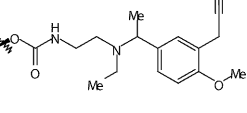
10

20

30

【 0 8 8 9 】

【表 1 1 - 4 7】

471		δ -H	718.5	(300 MHz) : 0.81 - 0.84 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.2 Hz, 3 H) 1.10 (d, J=7.2 Hz, 3 H) 1.16 - 1.26 (m, 13 H) 1.32 (s, 3 H) 1.51 - 1.85 (m, 6 H) 2.03 (d, J=15.6 Hz, 1H) 2.14 - 2.57 (m, 15 H) 2.77 - 2.93 (m, 2 H) 3.18 - 3.25 (m, 4 H) 3.33 (s, 3 H) 3.41 - 3.50 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.8 Hz, 1 H) 4.14 (d, J=5.1 Hz, 1 H) 4.46 (d, J=7.2 Hz, 1 H) 4.62 - 4.68 (m, 2 H) 4.96 (d, J=4.8 Hz, 1 H)
472		δ -H	1073.3	ジアステレオマーの混合物 (300 MHz) : 0.82 (d, J=6.87 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.14 Hz, 3 H) 0.94 - 1.04 (m, 3 H) 1.07 - 1.35 (m, 23 H) 1.49 - 1.90 (m, 5 H) 2.12 - 2.66 (m, 8 H) 2.28 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.76 - 2.95 (m, 2 H) 3.16 - 3.50 (m, 9 H) 3.24 (s, 3 H) 3.51 - 3.64 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 3.74 - 3.83 (m, 1 H) 3.89 (s, 3 H) 4.19 - 4.27 (m, 1 H) 4.34 - 4.49 (m, 2 H) 4.55 (d, J=9.61 Hz, 1 H) 4.59 - 4.70 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.60 Hz, 1 H) 5.13 (s, 2 H) 5.18 - 5.29 (m, 1 H) 6.74 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 6.82 (d, J=8.51 Hz, 1 H) 6.86 (s, 1 H) 7.27 - 7.46 (m, 5 H)
473		δ -H	1149.4	ジアステレオマーの混合物 (300 MHz) : 0.82 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.84 - 0.94 (m, 3 H) 1.05 - 1.32 (m, 23 H) 1.41 - 1.91 (m, 8 H) 2.11 - 2.76 (m, 8 H) 2.21 (s, 3 H) 2.23 (s, 3 H) 2.37 (s, 3 H) 2.76 - 2.86 (m, 1 H) 2.89 (d, J=15.38 Hz, 1 H) 2.99 - 3.58 (m, 10 H) 3.23 (s, 3 H) 3.67 - 3.77 (m, 1 H) 4.21 - 4.54 (m, 4 H) 4.58 - 4.73 (m, 2 H) 4.93 - 4.99 (m, 1 H) 5.05 - 5.13 (m, 4 H) 5.43 - 5.69 (m, 1 H) 6.59 (d, J=8.24 Hz, 2 H) 7.05 - 7.13 (m, 1 H) 7.27 - 7.44 (m, 10 H)
474		δ -H	1078.4	ジアステレオマーの混合物 (300 MHz) : 0.83 (d, J=6.87 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.41 Hz, 3 H) 0.94 - 1.04 (m, 3 H) 1.08 - 1.47 (m, 26 H) 1.56 - 1.91 (m, 11 H) 2.12 - 2.68 (m, 12 H) 2.28 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.77 - 2.95 (m, 2 H) 3.15 - 3.65 (m, 7 H) 3.24 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.53 (s, 2 H) 3.72 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 3.76 - 3.88 (m, 1 H) 4.00 (q, J=6.87 Hz, 2 H) 4.19 - 4.28 (m, 1 H) 4.34 - 4.49 (m, 2 H) 4.56 (d, J=9.62 Hz, 1 H) 4.60 - 4.69 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.67 Hz, 1 H) 5.37 - 5.45 (m, 1 H) 6.77 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 7.09 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 7.27 - 7.29 (m, 1 H)
475		δ -H	1006.3	ジアステレオマーの混合物 (300 MHz) : 0.82 (d, J=6.87 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.42 Hz, 3 H) 0.95 - 1.35 (m, 26 H) 1.47 - 1.93 (m, 5 H) 2.11 - 2.64 (m, 8 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.76 - 2.95 (m, 2 H) 3.17 - 3.64 (m, 7 H) 3.24 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.69 (s, 2 H) 3.72 (d, J=8.51 Hz, 1 H) 3.76 - 3.85 (m, 1 H) 3.86 (s, 3 H) 4.21 - 4.29 (m, 1 H) 4.34 - 4.49 (m, 2 H) 4.55 (d, J=9.89 Hz, 1 H) 4.60 - 4.69 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 5.17 - 5.25 (m, 1 H) 6.83 (d, J=8.52 Hz, 1 H) 7.21 - 7.28 (m, 2 H)

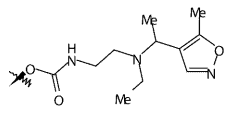
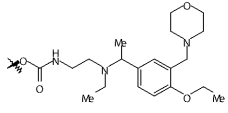
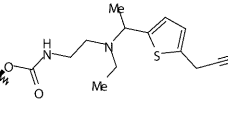
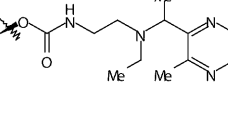
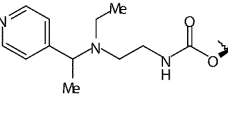
10

20

【 0 8 9 0 】

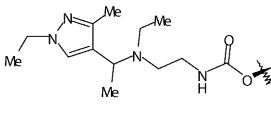
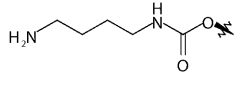
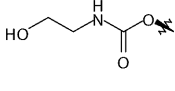
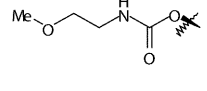
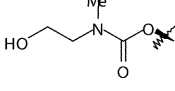
30

【表 1 1 - 4 8】

476		$\frac{2}{3}\text{H}$	942.3	ジアステレオマーの混合物 (300 MHz) : 0.83 (d, J=6.87 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.14 Hz, 3 H) 0.98 - 1.35 (m, 26 H) 1.47 - 1.94 (m, 5 H) 2.12 - 2.48 (m, 8 H) 2.30 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.51 - 2.67 (m, 3 H) 2.76 - 2.95 (m, 2 H) 3.14 - 3.48 (m, 15 H) 3.24 (s, 3 H) 3.51 - 3.63 (m, 1 H) 3.72 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 3.71 - 3.89 (m, 1 H) 4.20 - 4.28 (m, 1 H) 4.34 - 4.48 (m, 2 H) 4.55 (d, J=9.89 Hz, 1 H) 4.60 - 4.69 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.67 Hz, 1 H) 5.13 - 5.27 (m, 1 H) 8.10 (s, 1 H)
477		$\frac{2}{3}\text{H}$	1080.4	ジアステレオマーの混合物 (300 MHz) : 0.82 (d, J=6.87 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.41 Hz, 3 H) 0.94 - 1.03 (m, 3 H) 1.07 - 1.36 (m, 23 H) 1.40 (t, J=6.87 Hz, 3 H) 1.47 - 1.90 (m, 5 H) 2.12 - 2.67 (m, 12 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.76 - 2.87 (m, 1 H) 2.89 (d, J=15.66 Hz, 1 H) 3.14 - 3.43 (m, 6 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.53 - 3.64 (m, 1 H) 3.56 (s, 2 H) 3.67 - 3.88 (m, 5 H) 4.01 (q, J=6.86 Hz, 2 H) 4.20 - 4.29 (m, 1 H) 4.34 - 4.49 (m, 2 H) 4.56 (d, J=9.89 Hz, 1 H) 4.60 - 4.69 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 5.31 - 5.43 (m, 1 H) 6.78 (d, J=8.51 Hz, 1 H) 7.11 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 7.23 - 7.27 (m, 1 H)
478		$\frac{2}{3}\text{H}$	982	ジアステレオマーの混合物 (300 MHz) : 0.83 (d, J=6.87 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.41 Hz, 3 H) 0.99 - 1.39 (m, 26 H) 1.54 - 1.89 (m, 5 H) 2.11 - 2.69 (m, 8 H) 2.30 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.76 - 2.95 (m, 2 H) 3.17 - 3.43 (m, 9 H) 3.24 (s, 3 H) 3.54 - 3.67 (m, 1 H) 3.72 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 3.85 (s, 2 H) 4.04 - 4.12 (m, 1 H) 4.19 - 4.27 (m, 1 H) 4.35 - 4.48 (m, 2 H) 4.56 (d, J=9.88 Hz, 1 H) 4.60 - 4.69 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.67 Hz, 1 H) 5.18 - 5.28 (m, 1 H) 6.71 (d, J=3.30 Hz, 1 H) 6.87 - 6.90 (m, 1 H)
479		$\frac{2}{3}\text{H}$	953	ジアステレオマーの混合物 (300 MHz) : 0.83 (d, J=6.60 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.15 Hz, 3 H) 0.97 - 1.05 (m, 3 H) 1.07 - 1.29 (m, 17 H) 1.31 (s, 3 H) 1.37 (d, J=6.59 Hz, 3 H) 1.55 - 1.93 (m, 5 H) 2.10 - 2.75 (m, 14 H) 2.21 (s, 3 H) 2.29 (s, 3 H) 2.36 (s, 3 H) 2.77 - 2.95 (m, 2 H) 2.98 - 3.75 (m, 15 H) 4.14 - 4.54 (m, 4 H) 4.59 - 4.70 (m, 1 H) 4.95 - 5.00 (m, 1 H) 5.08 - 5.68 (m, 1 H) 8.30 - 8.48 (m, 2 H)
480		$\frac{2}{3}\text{H}$	938	ジアステレオマーの混合物 (300 MHz) : 0.83 (d, J=7.15 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=6.59 Hz, 3 H) 0.96 - 1.05 (m, 3 H) 1.07 - 1.37 (m, 24 H) 1.49 - 1.91 (m, 5 H) 2.08 - 2.66 (m, 8 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.76 - 2.95 (m, 2 H) 3.18 - 3.43 (m, 9 H) 3.24 (s, 3 H) 3.53 - 3.65 (m, 1 H) 3.72 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 3.79 - 3.91 (m, 1 H) 4.19 - 4.27 (m, 1 H) 4.36 - 4.48 (m, 2 H) 4.52 - 4.59 (m, 1 H) 4.59 - 4.69 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.67 Hz, 1 H) 5.14 - 5.23 (m, 1 H) 7.25 - 7.27 (m, 2 H) 8.53 (d, J=6.04 Hz, 2 H)

【 0 8 9 1 】

【表 1 1 - 4 9】

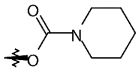
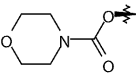
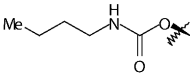
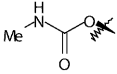
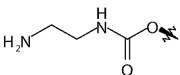
481		$-\frac{2}{3}H$	969.4	ジアステレオマーの混合物 (300 MHz) : 0.83 (d, J=6.87 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.42 Hz, 3 H) 0.96 - 1.07 (m, 3 H) 1.08 - 1.35 (m, 20 H) 1.31 (s, 3 H) 1.41 - 1.48 (m, 3 H) 1.50 - 1.95 (m, 5 H) 2.11 - 2.64 (m, 11 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.75 - 2.88 (m, 1 H) 2.89 (d, J=14.56 Hz, 1 H) 3.14 - 3.48 (m, 9 H) 3.24 (s, 3 H) 3.52 - 3.67 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 3.81 - 3.93 (m, 1 H) 4.01 - 4.10 (m, 2 H) 4.17 - 4.25 (m, 1 H) 4.34 - 4.45 (m, 1 H) 4.46 (d, J=7.42 Hz, 1 H) 4.51 - 4.58 (m, 1 H) 4.59 - 4.71 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.40 Hz, 1 H) 5.18 - 5.28 (m, 1 H) 7.15 - 7.18 (m, 1 H)
482		$-\frac{2}{3}H$	833	(400 MHz) : 0.81 - 0.89 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.11 - 1.28 (m, 18 H) 1.32 (s, 3 H) 1.49 - 1.67 (m, 8 H) 2.17 - 2.43 (m, 15 H) 2.64 - 2.66 (m, 1 H) 2.73 (t, J=6.7 Hz, 1 H) 2.80 - 2.83 (m, 1 H) 2.90 (d, J=15.1 Hz, 1H) 3.20 - 3.23 (m, 6 H) 3.34 (s, 3 H) 3.39 (m, 1 H) 3.56 (m, 1 H) 3.70 - 3.75 (m, 3 H) 4.22 (m, 1 H) 4.35 - 4.45 (m, 2 H) 4.54 (d, J=10.0 Hz, 1 H) 4.64 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.6 Hz, 1 H) 5.07 (m, 1 H)
483		$-\frac{2}{3}H$	806 FAB MASS	(400 MHz) : 0.82 - 0.89 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.01 - 1.24 (m, 16 H) 1.32 (s, 3 H) 1.53 - 2.09 (m, 6 H) 2.18 - 2.45 (m, 14 H) 2.58 - 2.62 (m, 1 H) 2.78 - 2.92 (m, 2 H) 3.20 - 3.23 (m, 4 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.39 (m, 3 H) 3.56 - 3.59 (m, 1 H) 3.65 - 3.75 (m, 3 H) 4.21 (m, 1 H) 4.36 - 4.45 (m, 2 H) 4.54 (d, J=9.8 Hz, 1 H) 4.64 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.6 Hz, 1 H) 5.39 (m, 1 H)
484		$-\frac{2}{3}H$	820.3	(400 MHz) : 0.82 - 0.83 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.12 - 1.27 (m, 16 H) 1.32 (s, 3 H) 1.52 - 1.76 (m, 6 H) 2.19 - 2.44 (m, 14 H) 2.60 (m, 1 H) 2.80 - 2.92 (m, 2 H) 3.17 - 3.24 (m, 4 H) 3.34 - 3.35 (m, 7 H) 3.37 - 3.47 (m, 4 H) 3.56 - 3.59 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.1 Hz, 1 H) 4.21 (m, 1 H) 4.34 - 4.46 (m, 2 H) 4.54 (d, J=9.8 Hz, 1 H) 4.65 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.6 Hz, 1 H) 5.23 (m, 1 H)
485		$-\frac{2}{3}H$	820.3	(400 MHz) : 0.82 - 0.83 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.09 - 1.26 (m, 16 H) 1.33 (s, 3 H) 1.52 - 1.85 (m, 6 H) 2.15 - 2.67 (m, 15 H) 2.82 - 2.99 (m, 5 H) 3.10 (d, J=7.6 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.42 - 3.78 (m, 7 H) 4.10 (m, 1 H) 4.41 - 4.47 (m, 2 H) 4.58 - 4.64 (m, 2 H) 4.97 (d, J=4.6 Hz, 1 H)

10

20

【 0 8 9 2 】

【表 1 1 - 5 0】

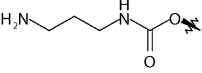
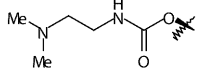
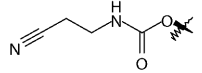
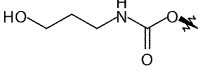
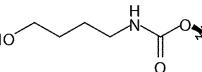
486		$\frac{1}{2}H$	830.3	(400 MHz) : 0.82 - 0.84 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.10 - 1.28 (m, 16 H) 1.31 (s, 3 H) 1.50 - 1.64 (m, 10 H) 1.74 (m, 1 H) 1.88 (m, 1 H) 2.14 - 2.47 (m, 14 H) 2.56 (m, 1 H) 2.80 - 2.93 (m, 2 H) 3.22 - 3.27 (m, 4 H) 3.33 (s, 3 H) 3.44 (m, 5 H) 3.63 (m, 1 H) 3.70 (d, J=6.8 Hz, 1 H) 4.07 (d, J=4.6 Hz, 1 H) 4.39 (m, 1 H) 4.55 - 4.59 (m, 2 H) 4.67 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.6 Hz, 1 H)
487		$\frac{1}{2}H$	832.3	(400 MHz) : 0.82 - 0.84 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.10 - 1.31 (m, 19 H) 1.50 - 1.64 (m, 4 H) 1.75 (m, 1 H) 1.87 (m, 1 H) 2.23 - 2.37 (m, 4 H) 2.42 (s, 3 H) 3.41 - 3.71 (m, 8 H) 4.10 (d, J=4.4 Hz, 1 H) 4.40 (m, 1 H) 4.53 - 4.59 (m, 2 H) 4.64 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.9 Hz, 1 H)
488		$\frac{1}{2}H$	818.3	(400 MHz) : 0.82 - 0.83 (m, 6 H) 0.86 - 0.92 (m, 6 H) 1.09 - 1.37 (m, 23 H) 1.45 - 1.93 (m, 6 H) 2.14 - 2.44 (m, 14 H) 2.60 (m, 1 H), 2.80 (m, 1 H) 2.90 (d, J=15.4 Hz, 1 H) 3.19 - 3.24 (m, 6 H) 3.34 (s, 3 H) 3.40 (d, J=8.3 Hz, 1 H) 3.55 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.3 Hz, 1 H) 4.22 (m, 1 H) 4.34 - 4.44 (m, 2 H) 4.55 (d, J=9.8 Hz, 1 H) 4.64 (m, 1 H) 4.86 (t, J=5.5 Hz, 1 H) 4.98 (d, J=4.6 Hz, 1 H)
489		$\frac{1}{2}H$	776	(400 MHz) : 0.82 - 0.83 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.12 - 1.27 (m, 16 H) 1.32 (s, 3 H) 1.50 - 1.88 (m, 6 H) 2.14 - 2.43 (m, 14 H) 2.59 (m, 1 H) 2.80 - 2.84 (m, 4 H) 2.90 (d, J=14.2 Hz, 1 H) 3.19 - 3.23 (m, 4 H) 3.34 (s, 3 H) 3.39 (d, J=8.6 Hz, 1 H) 3.55 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.3 Hz, 1 H), 4.22 (m, 1 H), 4.34 - 4.44 (m, 2 H) 4.56 (d, J=9.8 Hz, 1 H) 4.64 (m, 1 H) 4.80 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.6 Hz, 1 H)
490		$\frac{1}{2}H$	805	(400 MHz) : 0.83 (d, J=6.82 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.31 Hz, 3 H) 1.08 - 1.28 (m, 2 H) 1.13 (d, J=7.31 Hz, 3H) 1.17 (s, 3 H) 1.18 (d, J=8.04 Hz, 6 H) 1.20 (d, J=6.09 Hz, 3 H) 1.32(s, 3 H) 1.50 - 1.90 (m, 8 H) 2.10 - 2.46 (m, 6 H) 2.32 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.58 - 2.67 (m, 1 H) 2.75 -2.95 (m, 4 H) 3.15 - 3.31 (m, 3 H) 3.24 (s , 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.40 (d, J=6.33 Hz, 1 H) 3.54 - 3.63 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.04 Hz, 1 H) 4.16 - 4.25 (m, 1 H) 4.34 - 4.44 (m, 1 H) 4.45 (d, J=7.06 Hz, 1 H) 4.54 (d, J=9.74 Hz, 1 H) 4.60 - 4.70 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.78 Hz, 1 H) 5.31 (t, J=5.60 Hz, 1 H)

10

20

【 0 8 9 3】

【表 1 1 - 5 1】

491		$\frac{1}{2}H$	819	(400 MHz) : 0.82 (d, J=6.82 Hz, 6 H) 0.95 (t, J=7.31 Hz, 3 H) 1.08 - 1.26 (m, 2 H) 1.12 (d, J=7.31 Hz, 3H) 1.16 (s, 3 H) 1.17 (d, J=9.01 Hz, 6 H) 1.21 (d, J=6.33 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.49 - 1.92 (m, 10 H) 2.10 - 2.48 (m, 6 H) 2.31 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.55 - 2.64 (m, 1 H) 2.78 (t, J=6.58 Hz, 2 H) 2.82 (dd, J=5.36, 7.31 Hz, 1 H) 2.90 (d, J=15.10 Hz, 1 H) 3.18 - 3.26 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.28 - 3.36 (m, 2 H) 3.34 (s, 3 H) 3.40 (d, J=6.57 Hz, 1 H) 3.52 - 3.62 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.29 Hz, 1 H) 4.16 - 4.27 (m, 1 H) 4.32 - 4.43 (m, 1 H) 4.44 (d, J=7.06 Hz, 1 H) 4.55 (d, J=9.74 Hz, 1 H) 4.59 - 4.69 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.63 Hz, 1 H) 5.28 (t, J=5.60 Hz, 1 H)
492		$\frac{1}{2}H$	833	(400 MHz) : 0.82 (d, J=6.82 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.31 Hz, 3 H) 1.08 - 1.24 (m, 2 H) 1.12 (d, J=7.31 Hz, 3H) 1.17 (s, 3 H) 1.18 (d, J=6.09 Hz, 6 H) 1.19 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.45 - 1.95 (m, 6 H) 2.12 - 2.35 (m, 4 H) 2.21 (s, 6 H) 2.31 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.37 - 2.48 (m, 4 H) 2.55 - 2.65 (m, 1 H) 2.76 - 2.86 (m, 1 H) 2.90 (d, J=14.8 Hz, 1 H) 3.17 - 3.22 (m, 3 H) 3.24 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.50 (m, 1 H) 3.55 - 3.65 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.04 Hz, 1 H) 4.14 - 4.23 (m, 1 H) 4.33 - 4.43 (m, 1 H) 4.46 (d, J=7.06 Hz, 1 H) 4.54 (d, J=9.75 Hz, 1 H) 4.60 - 4.70 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.63 Hz, 1 H) 5.39 (t, J=4.87 Hz, 1 H)
493		$\frac{1}{2}H$	815	(400 MHz) : 0.82 (d, J=6.82 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.31 Hz, 3 H) 1.08 - 1.24 (m, 2 H) 1.13 (d, J=7.31 Hz, 3H) 1.16 (s, 3 H) 1.18 (d, J=5.11 Hz, 6 H) 1.21 (d, J=6.09 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.49 - 1.95 (m, 6 H) 2.11 - 2.48 (m, 5 H) 2.31 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.54 - 2.62 (m, 1 H) 2.64 (t, J=6.33 Hz, 2 H) 2.78 - 2.86 (m, 1 H) 2.90 (d, J=14.61 Hz, 1 H) 3.16 - 3.24 (m, 2 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.61 (m, 4 H) 3.70 (d, J=8.04 Hz, 1 H) 4.18 - 4.27 (m, 1 H) 4.35 - 4.45 (m, 2 H) 4.55 (d, J=9.74 Hz, 1 H) 4.58 - 4.70 (m, 1 H) 4.99 (d, J=4.63 Hz, 1 H) 5.38 (t, J=6.33 Hz, 1 H)
494		$\frac{1}{2}H$	820	(400 MHz) : 0.82 (d, J=6.82 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.31 Hz, 3 H) 1.07 - 1.29 (m, 2 H) 1.12 (d, J=7.06 Hz, 3H) 1.17 (s, 3 H) 1.18 (d, J=7.80 Hz, 6 H) 1.20 (d, J=6.82 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.48 - 1.91 (m, 8 H) 2.10 - 2.48 (m, 4 H) 2.31 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.54 - 2.67 (m, 1 H) 2.75 - 2.87 (m, 1 H) 2.90 (d, J=14.61 Hz, 1 H) 3.12 - 3.27 (m, 2 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 - 3.48 (m, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.52 - 3.75 (m, 4 H) 4.16 - 4.26 (m, 1 H) 4.33 - 4.42 (m, 1 H) 4.44 (d, J=7.07 Hz, 1 H) 4.55 (d, J=9.74 Hz, 1 H) 4.58 - 4.69 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.63 Hz, 1 H) 5.19 (t, J=4.87 Hz, 1 H)
495		$\frac{1}{2}H$	834	(400 MHz) : 0.82 (d, J=6.81 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.31 Hz, 3 H) 1.08 - 1.28 (m, 2 H) 1.12 (d, J=7.31 Hz, 3H) 1.16 (s, 3 H) 1.17 (d, J=6.33 Hz, 6 H) 1.19 (d, J=7.06 Hz, 3 H) 1.39 (s, 3 H) 1.50 - 1.72 (m, 10 H) 2.10 - 2.21 (m, 1 H) 2.22 - 2.47 (m, 3 H) 2.32 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.54 - 2.66 (m, 1 H) 2.77 - 2.87 (m, 1 H) 2.91 (d, J=14.61 Hz, 1 H) 3.18 - 3.29 (m, 4 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 - 3.50 (m, 2 H) 3.51 - 3.61 (m, 1 H) 3.65 - 3.73 (m, 3 H) 4.18 - 4.26 (m, 1 H) 4.33 - 4.43 (m, 3 H) 4.43 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.55 (d, J=9.74 Hz, 1 H) 4.59 - 4.61 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.63 Hz, 1 H) 5.04 (t, J=4.87 Hz, 1 H)

【 0 8 9 4 】

10

20

30

【表 1 1 - 5 3】

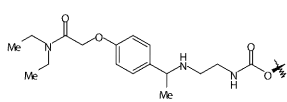
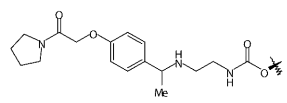
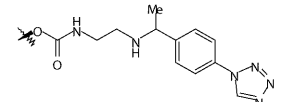
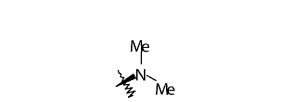
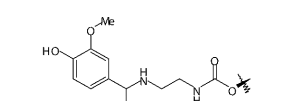
501		$-\frac{5}{2}H$	969.6	ジアステレオマー混合物、(400 MHz) : 0.82 – 0.83 (m, 6 H) 0.89 – 0.97 (m, 6 H) 1.12 – 1.33 (m, 22 H) 1.52 – 1.64 (m, 6 H) 2.19 – 2.71 (m, 25 H) 2.80 – 2.91 (m, 2 H) 3.19 – 3.24 (m, 6 H) 3.34 – 3.40 (m, 4 H) 3.51 – 3.72 (m, 6 H) 4.22 (m, 1 H) 4.39 – 4.55 (m, 2 H) 4.65 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.6 Hz, 1 H) 5.11 – 5.13 (m, 1 H)
502		$-\frac{5}{2}H$	1022.7	ジアステレオマー混合物、(400 MHz) : 0.82 – 0.84 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 0.95 – 1.01 (m, 3 H) 1.11 – 1.33 (m, 22 H) 1.47 – 1.64 (m, 6 H) 2.25 – 2.62 (m, 19 H) 2.79 – 2.91 (m, 2 H) 3.13 – 3.16 (m, 4 H) 3.20 – 3.24 (m, 6 H) 3.31 – 3.39 (m, 4 H) 3.61 (m, 1 H) 3.72 (d, J= 8.1 Hz, 1 H) 3.76 – 3.87 (m, 5 H) 4.22 (m, 1 H) 4.37 – 4.48 (m, 2 H) 4.55 (d, J=9.8 Hz, 1 H) 4.65 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.6 Hz, 1 H) 5.27 – 5.30 (m, 1 H) 6.85 (d, J=8.6 Hz, 2 H) 7.19 (d, J=8.6 Hz, 2 H)
503		$-\frac{5}{2}H$	1086.7	ジアステレオマー混合物、(400 MHz) : 0.82 – 0.84 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 0.98 – 1.02 (m, 3 H) 1.10 – 1.32 (m, 19 H) 1.37 (d, J=6.8 Hz, 3 H) 1.50 – 1.65 (m, 6 H) 2.25 – 2.66 (m, 19 H) 2.81 – 2.91 (m, 2 H) 3.01 (m, 4 H) 3.20 – 3.40 (m, 10 H) 3.58 (m, 1 H) 3.71 – 3.77 (m, 5 H) 3.93 (d, J=6.8 Hz, 1 H) 4.25 (m, 1 H) 4.37 – 4.45 (m, 2 H) 4.56 (d, J=9.8 Hz, 1 H) 4.65 (m, 1 H) 4.99 (d, J=4.4 Hz, 1 H) 5.19 (m, 1 H) 7.51 (d, J=8.3 Hz, 2 H) 7.69 (d, J=8.3 Hz, 2 H)
504		$-\frac{5}{2}H$	969.6	ジアステレオマー混合物、(400 MHz) : 0.82 – 0.84 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 0.99 – 1.42 (m, 22 H) 1.52 – 1.64 (m, 6 H) 2.09 – 2.60 (m, 22 H) 2.81 – 2.92 (m, 2 H) 3.19 – 3.24 (m, 6 H) 3.34 – 3.39 (m, 4 H) 3.58 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.8 Hz, 1 H) 3.82 (q, J=7.1 Hz, 1 H) 4.05 – 4.11 (m, 2 H) 4.22 (m, 1 H) 4.36 – 4.46 (m, 2 H) 4.54 (dd, J=9.8 Hz, J=2.0 Hz, 1 H) 4.65 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.4 Hz, 1 H) 5.16 – 5.25 (m, 1 H)
505		$-\frac{5}{2}H$	1095.6	ジアステレオマー混合物、(400 MHz) : 0.82 – 0.84 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 0.95 – 0.99 (m, 3 H) 1.10 – 1.32 (m, 22 H) 1.52 – 1.64 (m, 6 H) 2.15 – 2.62 (m, 19 H) 2.81 – 2.92 (m, 2 H) 3.19 – 3.24 (m, 6 H) 3.31 – 3.39 (m, 4 H) 3.60 (m, 1 H) 3.71 – 3.78 (m, 5 H) 3.85 (s, 3 H) 4.23 (m, 1 H) 4.37 – 4.57 (m, 5 H) 4.65 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.4 Hz, 1 H) 5.30 – 5.35 (m, 1 H) 6.62 (d, J=8.5 Hz, 1 H) 7.20 (d, J=8.5 Hz, 1 H), 7.27 (brs, 1 H)

10

20

【 0 8 9 6 】

【表 1 1 - 5 4】

506		$\frac{1}{2}H$	1038.6	ジアステレオマー混合物、(400 MHz) : 0.82 - 0.84 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.12 - 1.32 (m, 28 H) 1.52 - 1.67 (m, 6 H) 2.15 - 2.43 (m, 14 H) 2.56 - 2.62 (m, 3 H) 2.80 - 2.91 (m, 2 H) 3.16 - 3.27 (m, 6 H) 3.30 - 3.44 (m, 8 H) 3.59 (m, 1 H) 3.69 - 3.73 (m, 2 H) 4.22 (m, 1 H) 4.35 - 4.47 (m, 2 H) 4.53 - 4.56 (dd, J=9.8 Hz, J=1.7 Hz, 1 H) 4.65 (m, 3 H) 4.98 (d, J=4.6 Hz, 1 H) 5.27 - 5.31 (m, 1 H) 6.89 (dd, J=8.6 Hz, J=2.0 Hz, 2 H) 7.18 (d, J=8.6 Hz, 1 H)
507		$\frac{1}{2}H$	1036.6	ジアステレオマー混合物、(400 MHz) : 0.82 - 0.84 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.12 - 1.32 (m, 25 H) 1.52 - 2.01 (m, 10 H) 2.25 - 2.44 (m, 16 H) 2.59 (m, 3 H) 2.81 - 2.91 (m, 2 H) 3.20 - 3.73 (m, 17 H) 4.22 (m, 1 H) 4.37 - 4.46 (m, 2 H) 4.53 - 4.64 (m, 4 H) 4.98 (d, J=4.6 Hz, 1 H) 5.29 - 5.31 (m, 1 H) 6.89 (dd, J=8.6 Hz, J=1.9 Hz, 2 H) 7.18 (d, J=8.6 Hz, 1 H)
508		$\frac{1}{2}H$	977.5	ジアステレオマー混合物、(400 MHz) : 0.82 - 0.84 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.12 - 1.32 (m, 19 H) 1.37 (d, J=6.6 Hz, 3 H) 1.52 - 1.73 (m, 6 H) 2.28 - 2.44 (m, 14 H) 2.55 - 2.69 (m, 3 H) 2.81 - 2.92 (m, 2 H) 3.22 - 3.39 (m, 10 H) 3.58 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.1 Hz, 1 H) 3.87 (q, J=6.4 Hz, 1 H) 4.23 (m, 1 H) 4.37 - 4.45 (m, 2 H) 4.55 (dd, J=9.8 Hz, J=2.7 Hz, 1 H) 4.64 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.4 Hz, 1 H) 5.27 - 5.28 (m, 1 H) 7.53 (d, J=8.3 Hz, 2 H) 7.65 (d, J=8.3 Hz, 2 H) 8.99 (d, J=2.9 Hz, 1 H)
509		$\frac{1}{2}H$	746 FAB MASS	(300 MHz) : 0.80 - 0.83 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.5 Hz, 3 H) 1.07 - 1.30 (m, 16 H) 1.34 (s, 3 H) 1.41 - 1.82 (m, 6 H) 2.02 - 2.54 (m, 22 H) 2.74 - 2.81 (m, 1 H) 2.93 (d, J=14.7 Hz, 1 H) 3.15 - 3.25 (m, 7 H) 3.37 (d, J=8.4 Hz, 1 H) 3.46 - 3.53 (m, 1 H) 3.73 (d, J=8.4 Hz, 1 H) 4.20 (d, J=4.8, 1 H) 4.36 (d, J=7.2 Hz, 1 H) 4.46 (dq, J=9.9 Hz, J=6.0 Hz, 1 H) 4.62 (m, 1 H) 4.90 (d, J=4.2 Hz, 1 H)
510		$\frac{1}{2}H$	955	ジアステレオマーの混合物 (400 MHz) : 0.83 (d, J=6.84 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.32 Hz, 3 H) 1.08 - 1.34 (m, 22 H) 1.49 - 1.91 (m, 5 H) 2.13 - 2.76 (m, 6 H) 2.30 (s, 3 H) 2.37 (s, 6 H) 2.77 - 2.87 (m, 1 H) 2.90 (d, J=14.65 Hz, 1 H) 3.11 - 3.49 (m, 12 H) 3.52 - 3.74 (m, 3 H) 3.84 - 3.91 (m, 3 H) 4.15 - 4.25 (m, 1 H) 4.32 - 4.49 (m, 2 H) 4.54 (d, J=9.76 Hz, 1 H) 4.59 - 4.69 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.64 Hz, 1 H) 5.02 - 5.29 (m, 1 H) 6.73 - 6.85 (m, 3 H)

【 0 8 9 7 】

【表 1 1 - 5 5】

511		$\frac{1}{2}$ H	955	ジアステレオマーの混合物 (400 MHz) : 0.83 (d, J=6.84 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.33 Hz, 3 H) 1.09 - 1.41 (m, 17 H) 1.12 (d, J=7.73 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.48 - 1.91 (m, 5 H) 2.08 - 2.48 (m, 6 H) 2.30 (s, 3 H) 2.33 (s, 3 H) 2.37 (s, 3 H) 2.57 - 2.93 (m, 5 H) 3.20 - 3.49 (m, 6 H) 3.23 (s, 3 H) 3.37 (s, 3 H) 3.50 - 3.64 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.06 Hz, 1 H) 3.79 - 3.88 (m, 1 H) 4.15 - 4.27 (m, 1 H) 4.33 - 4.48 (m, 2 H) 4.51 - 4.57 (m, 1 H) 4.59 - 4.70 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.64 Hz, 1 H) 5.08 - 5.25 (m, 1 H) 6.22 - 6.29 (m, 1 H) 6.56 - 6.64 (m, 1 H)
512		$\frac{1}{2}$ H	985	ジアステレオマーの混合物 (400 MHz) : 0.82 (d, J=6.84 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.33 Hz, 3 H) 1.08 - 1.32 (m, 17 H) 1.32 (s, 3 H) 1.42 (d, J=6.83 Hz, 3 H) 1.50 - 1.89 (m, 5 H) 2.13 - 2.45 (m, 3 H) 2.30 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.54 - 2.64 (m, 1 H) 2.65 - 2.87 (m, 3 H) 2.90 (d, J=14.9 Hz, 1 H) 3.17 - 3.59 (m, 10 H) 3.23 (s, 3 H) 3.70 (d, J=6.83 Hz, 1 H) 3.83 (s, 3 H) 3.89 - 3.95 (m, 4 H) 4.18 - 4.27 (m, 1 H) 4.35 - 4.46 (m, 2 H) 4.52 - 4.57 (m, 1 H) 4.60 - 4.68 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.64 Hz, 1 H) 5.09 - 5.17 (m, 1 H) 6.36 (d, J=8.30 Hz, 1 H) 6.65 (d, J=8.55 Hz, 1 H)
513		$\frac{1}{2}$ H	969	ジアステレオマーの混合物 (400 MHz) : 0.83 (d, J=6.83 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.56 Hz, 3 H) 1.08 - 1.34 (m, 23 H) 1.49 - 1.92 (m, 5 H) 2.12 - 2.69 (m, 6 H) 2.30 (s, 3 H) 2.34 (s, 3 H) 2.37 (s, 3 H) 2.77 - 2.87 (m, 1 H) 2.90 (d, J=14.9 Hz, 1 H) 3.12 - 3.52 (m, 9 H) 3.24 (s, 3 H) 3.46 (s, 3 H) 3.54 - 3.62 (m, 1 H) 3.66 (q, J=6.59 Hz, 1 H) 3.71 (d, J=8.06 Hz, 1 H) 4.15 - 4.25 (m, 1 H) 4.33 - 4.49 (m, 2 H) 4.54 (d, J=9.76 Hz, 1 H) 4.61 - 4.67 (m, 3 H) 4.98 (d, J=4.64 Hz, 1 H) 5.12 - 5.31 (m, 1 H) 6.77 - 6.84 (m, 1 H) 6.93 - 6.97 (m, 1 H) 7.08 - 7.16 (m, 1 H)
514		$\frac{1}{2}$ H	955	ジアステレオマーの混合物 (400 MHz) : 0.82 (d, J=7.08 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.32 Hz, 3 H) 1.08 - 1.34 (m, 17 H) 1.32 (s, 3 H) 1.40 - 1.45 (m, 3 H) 1.49 - 1.91 (m, 5 H) 2.12 - 2.46 (m, 3 H) 2.30 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.53 - 2.74 (m, 2 H) 2.75 - 2.87 (m, 2 H) 2.90 (d, J=14.64 Hz, 1 H) 3.18 - 3.64 (m, 10 H) 3.23 (s, 3 H) 3.69 - 3.73 (m, 1 H) 3.74 (s, 3 H) 3.85 - 3.92 (m, 1 H) 4.16 - 4.27 (m, 1 H) 4.35 - 4.47 (m, 2 H) 4.54 (d, J=9.77 Hz, 1 H) 4.60 - 4.70 (m, 1 H) 4.99 (d, J=4.64 Hz, 1 H) 5.17 (t, J=5.86 Hz, 1 H) 6.51 - 6.54 (m, 1 H) 6.68 - 6.71 (m, 2 H)
515		$\frac{1}{2}$ H	941.5	ジアステレオマーの混合物 (400 MHz) : 0.83 (d, J=7.08 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.32 Hz, 3 H) 1.08 - 1.30 (m, 17 H) 1.32 (s, 3 H) 1.39 (d, J=6.59 Hz, 3 H) 1.50 - 1.91 (m, 5 H) 2.12 - 2.49 (m, 4 H) 2.31 (s, 3 H) 2.32 (s, 3 H) 2.38 (s, 3 H) 2.58 - 2.67 (m, 1 H) 2.69 - 2.87 (m, 3 H) 2.91 (d, J=15.14 Hz, 1 H) 3.19 - 3.61 (m, 8 H) 3.23 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.67 - 3.74 (m, 1 H) 4.16 - 4.29 (m, 1 H) 4.32 - 4.51 (m, 1 H) 4.54 (d, J=9.77 Hz, 1 H) 4.59 - 4.69 (m, 1 H) 4.95 - 5.20 (m, 1 H) 6.26 - 6.32 (m, 2 H) 6.90 - 6.96 (m, 1 H)

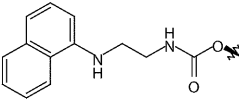
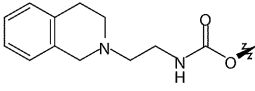
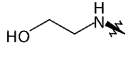
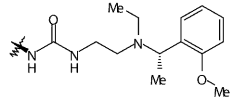
【 0 8 9 8 】

10

20

30

【表 1 1 - 5 6】

516		$\frac{2}{3}\text{H}$	931.6	(400 MHz) : 0.81 (d, J=7.08 Hz, 6 H) 0.90 (t, J=7.32 Hz, 3 H) 1.05 - 1.33 (m, 14 H) 1.13 (s, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 1.48 - 1.89 (m, 5 H) 2.08 - 2.55 (m, 6 H) 2.24 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.76 - 2.94 (m, 2 H) 3.14 - 3.51 (m, 6 H) 3.22 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.60 - 3.71 (m, 3 H) 4.14 - 4.25 (m, 1 H) 4.34 - 4.42 (m, 2 H) 4.61 - 4.70 (m, 1 H) 4.62 (d, J=9.76 Hz, 1 H) 4.91 - 4.97 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.64 Hz, 1 H) 5.36 (t, J=6.35 Hz, 1 H) 6.55 (d, J=7.32 Hz, 1 H) 7.23 (d, J=8.30 Hz, 1 H) 7.33 (t, J=7.81 Hz, 1 H) 7.39 - 7.47 (m, 2 H) 7.75 - 7.82 (m, 2 H)
517		$\frac{2}{3}\text{H}$	921.5	(400 MHz) : 0.79 - 0.86 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.30 Hz, 3 H) 0.96 - 1.38 (m, 8 H) 1.05 (d, J=6.08 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.16 (s, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 1.48 - 1.89 (m, 5 H) 2.12 - 2.51 (m, 4 H) 2.20 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.60 - 2.95 (m, 8 H) 3.13 (dd, J=2.68, 9.89 Hz, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 - 3.53 (m, 4 H) 3.61 (s, 2 H) 3.67 (d, J=8.04 Hz, 1 H) 4.13 - 4.20 (m, 1 H) 4.28 - 4.37 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.07 Hz, 1 H) 4.52 (d, J=9.74 Hz, 1 H) 4.59 - 4.71 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.63 Hz, 1 H) 5.47 (t, J=4.88 Hz, 1 H) 6.98 - 7.02 (m, 1 H) 7.07 - 7.16 (m, 3 H)
518		$\frac{2}{3}\text{H}$	760 FAB MASS	(400 MHz) : 0.82 - 0.83 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.10 - 1.12 (m, 6 H) 1.17 - 1.32 (m, 13 H) 1.48 - 1.97 (m, 6 H) 2.03 (s, 3 H) 2.14 - 2.54 (m, 15 H) 2.81 (dq, J=7.3 Hz, J=5.1 Hz, 1 H) 2.90 (d, J=14.7 Hz, 1 H) 3.23 - 3.30 (m, 7 H) 3.40 - 3.49 (m, 2 H) 3.64 - 3.74 (m, 2 H) 4.12 (dq, J=10.0 Hz, J=6.3 Hz, 1 H) 4.24 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.4 Hz, 1 H) 5.90 (d, J=9.5 Hz, 1 H)
519		$\frac{2}{3}\text{H}$	762.4	(400 MHz) : 0.82 - 0.84 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.3 Hz, 3 H) 1.16 - 1.32 (m, 16 H) 1.51 - 1.86 (m, 6 H) 2.01 (d, J=9.8 Hz, 1 H) 2.20 - 2.55 (m, 15 H) 2.75 - 2.84 (m, 2 H) 2.89 (d, J=14.4 Hz, 1 H) 3.04 - 3.13 (m, 1 H) 3.20 - 3.25 (m, 4 H) 3.30 (s, 3 H) 3.42 (m, 1 H) 3.52 - 3.59 (m, 2 H) 3.73 (d, J=5.1 Hz, 1 H) 4.06 (dq, J=9.6 Hz, J=6.2 Hz, 1 H) 4.14 (d, J=3.9 Hz, 1 H) 4.42 (d, J=7.1 Hz, 1 H) 4.66 (m, 1 H) 4.95 (d, J=4.6 Hz, 1 H)
520		$\frac{2}{3}\text{H}$	796.3	(400 MHz) : 0.82 - 0.84 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.10 (d, J=7.3 Hz, 3 H) 1.14 - 1.33 (m, 16 H) 1.52 - 1.80 (m, 6 H) 2.19 - 2.53 (m, 15 H) 2.81 (dq, J=7.3 Hz, J=5.1 Hz, 1 H) 2.89 (d, J=14.4 Hz, 1 H) 3.02 (s, 3 H) 3.14 (dd, J=9.5 Hz, J=9.3 Hz, 1 H) 3.20 - 3.24 (m, 4 H) 3.30 (s, 3 H) 3.41 - 3.49 (m, 2 H) 3.66 (d, J=8.1 Hz, 1 H) 4.14 - 4.20 (m, 2 H) 4.35 (d, J=7.3 Hz, 1 H) 4.65 (m, 1 H) 4.90 (d, J=9.0 Hz, 1 H) 4.98 (d, J=4.6 Hz, 1 H)
521		$\frac{2}{3}\text{H}$	966.5	(400 MHz) : 0.81 - 0.83 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 0.97 (m, 3 H) 0.99 - 1.27 (m, 19 H) 1.33 (s, 3 H) 1.52 - 1.92 (m, 6 H) 2.13 - 2.58 (m, 19 H) 2.81 (dq, J=7.2 Hz, J=5.2 Hz, 1 H) 2.89 (d, J=15.4 Hz, 1 H) 3.20 - 3.24 (m, 7 H) 3.30 (s, 3 H) 3.41 - 3.49 (m, 2 H) 3.71 (d, J=8.3 Hz, 1 H) 3.85 (s, 3 H) 4.03 - 4.13 (m, 1 H) 4.23 (m, 1 H) 4.35 - 4.40 (m, 2 H) 4.63 (m, 1 H) 4.71 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.4 Hz, 1 H) 6.88 - 7.00 (m, 2 H) 7.21 - 7.33 (m, 2 H)

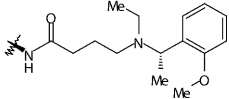
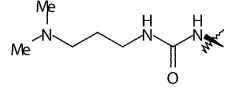
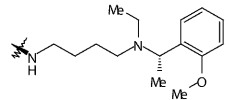
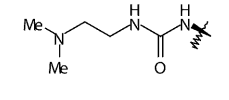
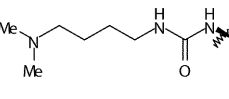
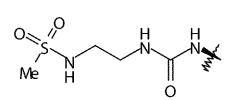
【 0 8 9 9 】

10

20

30

【表 1 1 - 5 7】

522		$\frac{1}{2}$ H	965.6	(300 MHz) : 0.82 (d, J=6.87 Hz, 6 H) 0.91 (t, J=7.14 Hz, 3 H) 1.13 (t, J=7.14 Hz, 3 H) 1.06 - 1.35 (m, 17 H) 1.09 (s, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.48 - 1.94 (m, 4 H) 1.56 (dd, J=4.94, 15.11 Hz, 1 H) 2.10 - 2.74 (m, 12 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.76 - 2.94 (m, 2 H) 3.16 - 3.26 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.34 - 3.47 (m, 2 H) 3.64 - 3.76 (m, 2 H) 3.81 (s, 3 H) 4.02 - 4.17 (m, 1 H) 4.20 - 4.28 (m, 1 H) 4.33 - 4.39 (m, 2 H) 4.56 - 4.70 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.40 Hz, 1 H) 5.85 (d, J=9.61 Hz, 1 H) 6.86 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 6.94 (t, J=7.15 Hz, 1 H) 7.20 (t, J=7.42 Hz, 1 H) 7.36 - 7.52 (m, 1 H)
523		$\frac{1}{2}$ H	846.5	(400 MHz) : 0.82 (d, J=6.82 Hz, 6 H) 0.84 - 0.94 (m, 6 H) 1.08 - 1.35 (m, 5 H) 1.10 (d, J=7.07 Hz, 3H) 1.13 (s, 3 H) 1.17 (d, J=7.31 Hz, 3 H) 1.33(s, 3 H) 1.52 - 1.90 (m, 7 H) 1.91 - 2.50 (m, 6 H) 2.26 (s, 6 H) 2.33 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.53 - 2.63 (m, 1 H) 2.75 - 2.86 (m, 1 H) 2.92 (d, J=15.35 Hz, 1 H) 3.21 - 3.33 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.36 - 3.53 (m, 3 H) 3.69 (d, J=8.08 Hz, 1 H) 4.08 - 4.24 (m, 2 H) 4.36 (d, J=7.31 Hz, 1 H) 4.57 - 4.70 (m, 1 H) 4.92 - 5.02 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.38 Hz, 1 H)
524		$\frac{1}{2}$ H	951.5	(300 MHz) : 0.81 - 0.92 (m, 9 H) 0.99 - 1.37 (m, 25 H) 1.46 - 2.01 (m, 11 H) 2.20 - 2.57 (m, 19 H) 2.77 - 2.91 (m, 4 H) 3.16 - 3.32 (m, 7 H) 3.40 (m, 1 H) 3.65 - 3.75 (m, 2 H) 3.81 (s, 3 H) 3.97 - 4.11 (m, 2 H) 4.33 - 4.38 (m, 1 H) 4.43 (d, J=7.2 Hz, 1 H) 4.66 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.5 Hz, 1 H) 6.85 (d, J=8.1 Hz, 1 H) 6.94 (m, 1 H) 7.21 (m, 1 H) 7.46 (m, 1 H)
525		$\frac{1}{2}$ H	832.4	(300 MHz) : 0.77 - 0.87 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.14 Hz, 3 H) 1.10 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.13 (s, 3 H) 1.17 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.20 - 1.32(m, 8 H) 1.33 (s, 3 H) 1.49 - 1.63 (m, 2 H) 1.63 - 1.89 (m, 3 H) 1.92 - 2.11 (m, 2 H) 2.11 - 2.47 (m, 21 H) 2.48 - 2.59 (m, 1 H) 2.75 - 2.86 (m, 1 H) 2.87 - 2.96 (m, 1 H) 3.18 - 3.34 (m, 8 H) 3.37 - 3.56 (m, 3 H) 3.70 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 4.04 - 4.24 (m, 2 H) 4.35 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.58 - 4.68 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.40 Hz, 1 H) 4.99 - 5.08 (m, 2 H)
526		$\frac{1}{2}$ H	860.3	(300 MHz) : 0.78 - 0.87 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.14 Hz, 3 H) 1.10 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.13 (s, 3 H) 1.17 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.19 - 1.30 (m, 8 H) 1.35 (s, 3 H) 1.46 - 1.90 (m, 8 H) 2.02 - 2.46 (m, 21 H) 2.47 - 2.58 (m, 1 H) 2.71 - 2.86 (m, 1 H) 2.88 - 2.98 (m, 1 H) 3.12 - 3.31 (m, 8 H) 3.36 - 3.58 (m, 3 H) 3.69 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 4.04 - 4.24 (m, 2 H) 4.33 (d, J=7.42 Hz, 1 H) 4.56 - 4.68 (m, 1 H) 4.88 (d, J=9.62 Hz, 1 H) 4.96 (d, J=4.12 Hz, 1 H) 5.00 - 5.11 (m, 1 H)
527		$\frac{1}{2}$ H	882.2	(300 MHz) : 0.77 - 0.87 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.42 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.13 (s, 3 H) 1.17 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.19 - 1.30(m, 8 H) 1.37 (s, 3 H) 1.49 - 1.63 (m, 2 H) 1.68 - 1.90 (m, 3 H) 2.10 - 2.50 (m, 14 H) 2.54 - 2.66 (m, 1 H) 2.73 - 2.85 (m, 1 H) 2.89 - 3.00 (m, 4 H) 3.18 - 3.59 (m, 13 H) 3.66 (d, J=7.42 Hz, 1 H) 4.07 - 4.20 (m, 2 H) 4.29 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.57 - 4.68 (m, 1 H) 4.95 (d, J=4.12 Hz, 1 H) 5.27 - 5.40 (m, 1 H) 5.51 - 5.62 (m, 1 H)

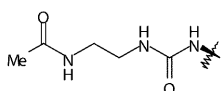
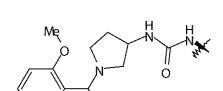
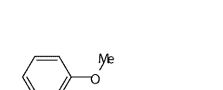
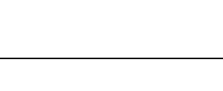
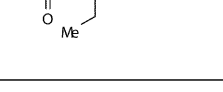
10

20

30

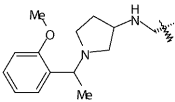
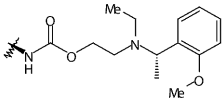
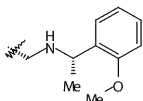
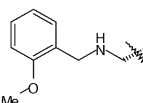
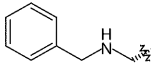
【0 9 0 0】

【表 1 1 - 5 8】

528		$\text{-}\overset{\text{H}}{\text{N}}$	846.3	(300 MHz) : 0.77 - 0.87 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.42 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.12 (s, 3 H) 1.14 - 1.30 (m, 11 H) 1.36 (s, 3 H) 1.48 - 1.63 (m, 2 H) 1.67 - 1.89 (m, 3 H) 1.95 (s, 3 H) 2.02 - 2.49 (m, 14 H) 2.49 - 2.62 (m, 1 H) 2.74 - 2.85 (m, 1 H) 2.88 - 2.99 (m, 1 H) 3.16 - 3.57 (m, 13 H) 3.66 (d, J=7.42 Hz, 1 H) 4.07 - 4.21 (m, 2 H) 4.29 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.57 - 4.68 (m, 1 H) 4.95 (d, J=4.12 Hz, 1 H) 5.19 - 5.32 (m, 1 H) 5.49 - 5.59 (m, 1 H) 6.85 (br s, 1 H)
529		$\text{-}\overset{\text{H}}{\text{N}}$	964 FAB MASS	ジアステレオマーの混合物 (300 MHz) : 0.77 - 0.87 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.14 Hz, 3 H) 1.04 - 1.40 (m, 20 H) 1.47 - 2.05 (m, 6 H) 2.10 - 2.64 (m, 17 H) 2.66 - 3.08 (m, 4 H) 3.12 - 3.32 (m, 8 H) 3.36 - 3.54 (m, 4 H) 3.64 - 3.75 (m, 1 H) 3.77 - 3.89 (m, 4 H) 4.02 - 4.31 (m, 3 H) 4.31 - 4.38 (m, 1 H) 4.57 - 4.69 (m, 1 H) 4.78 - 5.04 (m, 3 H) 6.82 - 6.92 (m, 2 H) 7.15 - 7.24 (m, 1 H) 7.39 - 7.49 (m, 1 H)
530		$\text{-}\overset{\text{H}}{\text{N}}$	964.4	ジアステレオマーの混合物 (400 MHz) : 0.78 - 0.88 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.31 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.05 - 1.14 (m, 6 H) 1.14 - 1.29 (m, 11 H) 1.29 - 1.40 (m, 6 H) 1.50 - 1.65 (m, 2 H) 1.70 - 1.93 (m, 3 H) 2.11 - 2.30 (m, 1 H) 2.20 - 2.56 (m, 18 H) 2.77 - 2.87 (m, 1 H) 2.90 - 2.98 (m, 1 H) 3.10 - 3.38 (m, 14 H) 3.48 - 3.55 (m, 1 H) 3.68 - 3.73 (m, 1 H) 3.83 (s, 3 H) 3.92 - 4.01 (m, 1 H) 4.04 - 4.13 (m, 1 H) 4.17 - 4.26 (m, 1 H) 4.36 - 4.43 (m, 1 H) 4.58 - 4.68 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.62 Hz, 1 H) 5.00 - 5.07 (m, 1 H) 6.88 (d, J=8.04 Hz, 1 H) 6.92 - 6.98 (m, 1 H) 7.19 - 7.26 (m, 1 H) 7.38 - 7.44 (m, 1 H)
531		$\text{-}\overset{\text{H}}{\text{N}}$	916.4	ジアステレオマーの混合物 (300 MHz) : 0.79 - 0.86 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.42 Hz, 3 H) 1.12 (t, J=7.14 Hz, 3 H) 1.06 - 1.96 (m, 26 H) 1.20 (s, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.93 (d, J=9.61 Hz, 1 H) 2.13 - 2.67 (m, 12 H) 2.30 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.70 - 2.88 (m, 3 H) 2.93 (s, 3 H) 3.15 (s, 3 H) 3.17 - 3.25 (m, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.36 - 3.47 (m, 1 H) 3.60 - 3.78 (m, 3 H) 3.94 - 4.15 (m, 2 H) 4.44 (d, J=7.42 Hz, 1 H) 4.60 - 4.72 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.67 Hz, 1 H)
532		$\text{HO}\text{---}$	951.5	(300 MHz) : 0.76 - 0.86 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.14 Hz, 3 H) 1.04 - 1.24 (m, 17 H) 1.24 - 1.38 (m, 6 H) 1.46 - 1.90 (m, 5 H) 2.10 - 2.50 (m, 21 H) 2.50 - 2.83 (m, 5 H) 2.85 - 2.96 (m, 1 H) 3.14 - 3.26 (m, 4 H) 3.32 - 3.48 (m, 4 H) 3.56 - 3.72 (m, 2 H) 3.81 (s, 3 H) 3.86 - 3.95 (m, 1 H) 4.02 - 4.10 (m, 1 H) 4.46 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.55 - 4.70 (m, 2 H) 4.83 (d, J=5.22 Hz, 1 H) 6.86 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 6.91 - 7.00 (m, 1 H) 7.20 (t, J=7.69 Hz, 1 H) 7.41 (m, J=6.59 Hz, 1 H)

【 0 9 0 1 】

【表 1 1 - 5 9】

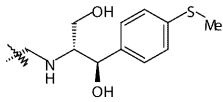
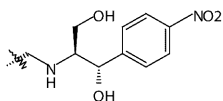
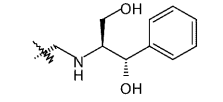
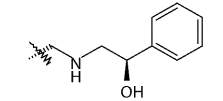
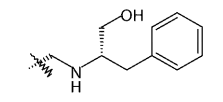
533		HO $\rightarrow$	951 FAB MASS	ジアステレオマーの混合物 (300 MHz) : 0.77 - 0.87 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.14 Hz, 3 H) 1.03 - 1.28 (m, 14 H) 1.28 - 1.39 (m, 6 H) 1.46 - 1.92 (m, 5 H) 2.00 - 2.56 (m, 9 H) 2.28 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.62 - 2.87 (m, 6 H) 2.87 - 2.97 (m, 1 H) 3.10 - 3.28 (m, 4 H) 2.35 (s, 3 H) 3.39 - 3.60 (m, 2 H) 3.62 - 3.71 (m, 1 H) 3.76 - 3.88 (m, 1 H) 3.82 (s, 3 H) 4.06 - 4.14 (m, 1 H) 4.37 - 4.51 (m, 2 H) 4.59 - 4.70 (m, 1 H) 4.83 - 4.91 (m, 1 H) 6.86 (d, J=8.52 Hz, 1 H) 6.92 - 7.00 (m, 1 H) 7.14 - 7.23 (m, 1 H) 7.44 - 7.52 (m, 1 H)
534		$\rightarrow$ H	967.6	(400 MHz) : 0.81 - 0.83 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 0.94 - 1.03 (m, 3 H) 1.08 - 1.31 (m, 22 H) 1.43 - 1.84 (m, 6 H) 2.13 - 2.91 (m, 21 H) 3.18 - 3.40 (m, 10 H) 3.68 (d, J=8.1 Hz, 1 H) 3.80 (s, 3 H) 4.02 - 4.18 (m, 4 H) 4.33 - 4.40 (m, 2 H) 4.63 (m, 1 H) 4.98 (d, J=4.5 Hz, 1 H) 5.10 (d, J=9.9 Hz, 1 H) 6.84 - 6.94 (m, 2 H) 7.19 (ddd, J=8.4 Hz, J=6.9 Hz, J=1.5 Hz, 1 H) 7.37 (dd, J=7.8 Hz, J=1.5 Hz, 1 H)
535		$\downarrow$ OH	882.4	(400 MHz) : 0.82 (d, J=7.1 Hz, 3 H) 0.82 (d, J=7.1 Hz, 3 H) 0.90 (t, J=7.4 Hz, 3 H) 1.07 - 1.26 (m, 21 H) 1.31 - 1.35 (m, 7 H) 1.70 - 1.90 (m, 4 H) 2.04 - 2.55 (m, 19 H) 2.82 (t, J=6.8 Hz, 1 H) 2.92 (d, J=15.3 Hz, 1 H) 3.19 (dd, J=10.2, 7.4 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.41 (m, 1 H) 3.55 (m, 1 H) 3.67 (d, J=7.8 Hz, 1 H) 4.04 (q, J=6.7 Hz, 1 H), 4.09 (m, 1 H) 4.42 (d, J=7.3 Hz, 1 H) 4.46 (q, J=6.8 Hz, 1 H) 4.65 (m, 1 H) 4.86 (d, J=4.9 Hz, 1 H) 6.86 (m, 1 H) 6.94 (m, 1 H) 7.21 (m, 1 H) 7.31 (m, 1 H)
536		HO $\rightarrow$	868.3	(400 MHz) : 0.82 (d, J=7.0 Hz, 3 H) 0.82 (d, J=7.0 Hz, 3 H) 0.90 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.08 - 1.38 (m, 28 H) 1.85 - 2.00 (m, 2 H) 2.09 - 2.55 (m, 18 H) 2.63 - 2.89 (m, 4 H) 3.19 (dd, J=10.2, 8.2 Hz, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.41 (m, 1 H) 3.51 (m, 1 H) 3.67 (d, J=8.0 Hz, 1 H) 3.69 (d, J=14.4 Hz, 1 H) 3.79 (d, J=14.4 Hz, 1 H) 3.81 (s, 3 H) 4.09 (m, 1 H) 4.40 (d, J=7.1 Hz, 1 H) 4.45 (q, J=6.6 Hz, 1 H) 4.63 (m, 1 H) 4.87 (m, 1 H) 6.86 (m, 1 H) 6.91 (m, 1 H) 7.20 - 7.25 (m, 2 H)
537		HO $\rightarrow$	838.3	(400 MHz) : 0.81 (d, J=7.0 Hz, 3 H) 0.81 (d, J=7.0 Hz, 3 H) 0.90 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.08 - 1.34 (m, 24 H) 1.60 - 1.80 (m, 3 H) 2.14 - 2.54 (m, 17 H) 2.69 - 2.85 (m, 3 H) 2.91 (m, 1 H) 3.20 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.36 - 3.52 (m, 3 H) 3.66 (d, J=7.8 Hz, 1 H) 3.70 (d, J=13.3 Hz, 1 H) 3.79 (d, J=13.2 Hz, 1 H) 4.10 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.3 Hz, 1 H) 4.43 (q, J=6.6 Hz, 1 H) 4.64 (m, 1 H) 4.89 (m, 1 H) 7.24 - 7.32 (m, 4 H)

10

20

【 0 9 0 2 】

【表 1 1 - 6 0】

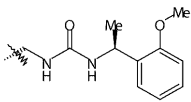
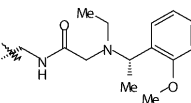
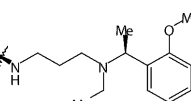
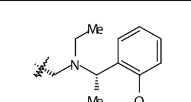
538			944.3	(300 MHz) : 0.77 - 0.87 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.14 Hz, 3 H) 1.10 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.13 (s, 3 H) 1.13 - 1.27 (m, 14 H) 1.29 (d, J=6.59 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.47 - 1.69 (m, 2 H) 1.71 - 1.91 (m, 2 H) 1.98 (dd, J=5.23 Hz, J=15.4 Hz, 1 H) 2.10 - 2.35 (m, 10 H) 2.38 (s, 3 H) 2.41 - 2.54 (m, 5 H) 2.56 - 2.64 (m, 1 H) 2.69 (d, J=12.4 Hz, 3 H) 2.77 - 2.98 (m, 3 H) 3.16 - 3.25 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.31 - 3.54 (m, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.64 - 3.73 (m, 2 H) 4.10 - 4.19 (m, 1 H) 4.34 - 4.49 (m, 2 H) 4.56 (d, J=6.87 Hz, 1 H) 4.59 - 4.69 (m, 1 H) 4.91 (d, J=4.34 Hz, 1 H) 7.20 - 7.34 (m, 5 H)
539			943.5	(300 MHz) : 0.78 - 0.88 (m, 6 H) 0.92 (t, J=7.14 Hz, 3 H) 1.04 - 1.14 (m, 7 H) 1.13 (s, 3 H) 1.14 - 1.24 (m, 7 H) 1.27 (d, J=6.87 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.48 - 1.69 (m, 2 H) 1.71 - 1.89 (m, 2 H) 1.95 (dd, J=4.67 Hz, J=15.1 Hz, 1 H) 2.11 - 2.35 (m, 10 H) 2.38 (s, 3 H) 2.42 - 2.64 (m, 4 H) 2.77 - 2.98 (m, 3 H) 3.16 - 3.26 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.28 - 3.38 (m, 1 H) 3.33 (s, 3 H) 3.39 - 3.56 (m, 2 H) 3.67 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 3.80 (dd, J=3.85 Hz, J=11.0 Hz, 1 H) 4.11 - 4.19 (m, 1 H) 4.34 - 4.48 (m, 2 H) 4.60 - 4.70 (m, 1 H) 4.76 (d, J=5.77 Hz, 1 H) 4.90 (d, J=4.67 Hz, 1 H) 7.59 (d, J=8.79 Hz, 2 H) 8.21 (d, J=8.79 Hz, 2 H)
540			898.7	(300 MHz) : 0.76 - 0.88 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.14 Hz, 3 H) 1.05 - 1.26 (m, 14 H) 1.28 (d, J=6.87 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.47 - 1.69 (m, 2 H) 1.69 - 1.91 (m, 2 H) 1.96 (dd, J=5.22 Hz, J=15.4 Hz, 1 H) 2.10 - 2.36 (m, 10 H) 2.36 - 2.55 (m, 5 H) 2.61 - 2.72 (m, 2 H) 2.77 - 2.98 (m, 3 H) 3.16 - 3.26 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.30 - 3.42 (m, 1 H) 3.34 (s, 3 H) 3.42 - 3.54 (m, 2 H) 3.64 - 3.74 (m, 2 H) 4.10 - 4.18 (m, 1 H) 4.34 - 4.48 (m, 2 H) 4.58 - 4.70 (m, 2 H) 4.90 (d, J=4.40 Hz, 1 H) 7.23 - 7.42 (m, 5 H)
541			968.5	(300 MHz) : 0.76 - 0.87 (m, 6 H) 0.92 (t, J=7.42 Hz, 3 H) 1.05 - 1.15 (m, 1 H) 1.11 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.15 - 1.30 (m, 13 H) 1.33 (s, 3 H) 1.48 - 1.69 (m, 2 H) 1.71 - 1.90 (m, 2 H) 2.10 - 2.34 (m, 11 H) 2.34 - 2.54 (m, 5 H) 2.70 - 2.87 (m, 4 H) 2.87 - 2.98 (m, 2 H) 3.16 - 3.25 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.33 - 3.55 (m, 2 H) 3.37 (s, 3 H) 3.67 (d, J=7.97 Hz, 3 H) 4.09 - 4.18 (m, 1 H) 4.35 - 4.49 (m, 2 H) 4.59 - 4.70 (m, 1 H) 4.72 (dd, J=3.85 Hz, J=8.24 Hz, 1 H) 4.91 (d, J=4.12 Hz, 1 H) 7.23 - 7.40 (m, 5 H)
542			882.5	(300 MHz) : 0.75 - 0.87 (m, 6 H) 0.92 (t, J=7.42 Hz, 3 H) 0.99 (d, J=6.59 Hz, 3 H) 1.04 - 1.29 (m, 14 H) 1.32 (s, 3 H) 1.48 - 1.67 (m, 2 H) 1.70 - 1.90 (m, 2 H) 2.11 - 2.36 (m, 11 H) 2.36 - 2.51 (m, 5 H) 2.66 - 2.89 (m, 4 H) 2.90 - 3.00 (m, 1 H) 3.14 - 3.24 (m, 2 H) 3.20 (s, 3 H) 3.29 - 3.48 (m, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.56 - 3.69 (m, 2 H) 4.04 - 4.13 (m, 1 H) 4.26 - 4.38 (m, 2 H) 4.60 - 4.72 (m, 1 H) 4.86 (d, J=3.85 Hz, 1 H) 7.12 - 7.21 (m, 2 H) 7.22 - 7.36 (m, 3 H)

10

20

30

【表 1 1 - 6 1】

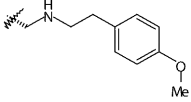
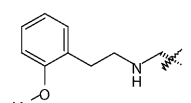
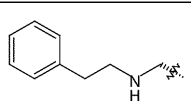
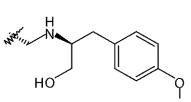
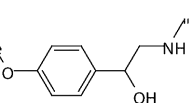
543			925.3	(300 MHz) : 0.75 – 0.86 (m, 6 H) 0.91 (t, J=7.42 Hz, 3 H) 1.00 – 1.29 (m, 17 H) 1.33 (s, 3 H) 1.42 (d, J=6.59 Hz, 3 H) 1.47 – 1.69 (m, 2 H) 1.69 – 2.00 (m, 3 H) 2.08 – 2.52 (m, 15 H) 2.76 – 2.99 (m, 2 H) 3.04 – 3.26 (m, 2 H) 3.21 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 – 3.51 (m, 2 H) 3.58 – 3.63 (m, 2 H) 3.87 (s, 3 H) 4.05 – 4.18 (m, 1 H) 4.30 – 4.47 (m, 2 H) 4.55 – 4.60 (m, 1 H) 4.84 – 5.01 (m, 3 H) 5.01 – 5.10 (m, 1 H) 6.83 – 6.96 (m, 2 H) 7.16 – 7.31 (m, 3 H)
544			967.4	(300 MHz) : 0.81 – 0.83 (m, 6 H) 0.90 (t, J=7.1Hz, 3 H) 1.02 – 1.34 (m, 25 H) 1.50 – 1.76 (m, 9 H) 2.12 – 2.63 (m, 17 H) 2.80 – 2.94 (m, 2 H) 2.99 – 3.51 (m, 12 H) 3.65 – 3.73 (m, 3 H) 3.82 (s, 3 H) 4.18 (m, 1 H) 4.37 – 4.50 (m, 3 H) 4.62 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.8 Hz, 1 H) 6.84 – 6.94 (m, 2 H) 7.21 (ddd, J=7.8 Hz, J=7.8 Hz, J=1.5 Hz, 1 H) 7.31 (dd, J=7.2 Hz, J=1.5Hz, 1 H) 7.98 (m, 1 H)
545			937.4	(300 MHz) : 0.81 – 0.92 (m, 9 H) 0.98 (t, J=6.9 Hz, 3 H) 1.07 – 1.31 (m, 22 H) 1.46 – 1.92 (m, 9 H) 2.16 – 2.68 (m, 21 H) 2.75 – 2.91 (m, 2 H) 3.14 – 3.32 (m, 7 H) 3.41 (m, 1 H) 3.65 – 3.73 (m, 2 H) 3.80 (s, 3 H) 3.95 – 4.10 (m, 2 H) 4.31 (q, J=6.9 Hz, 1 H) 4.43 (d, J=7.2 Hz, 1 H) 4.65 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.8 Hz, 1 H) 6.84 (d, J=8.0 Hz, 1 H) 6.93 (dd, J=7.8 Hz, J=7.5 Hz, 1 H) 7.19 (ddd, J=8.0Hz, J=7.5 Hz, J=1.5 Hz, 1 H) 7.39 (m, 1 H)
546			910.4	(400 MHz) : 0.80 – 0.85 (m, 6 H) 0.91 (m, 3 H) 1.02 – 1.42 (m, 40 H) 1.70 – 1.90 (m, 4 H) 1.95 – 2.65 (m, 18 H) 2.76 – 2.98 (m, 4 H) 3.20 (dd, J=10.2, 7.8 Hz, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.42 (m, 1 H) 3.64 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.8Hz, 1 H) 3.81 (s, 3 H) 4.04 (m, 1 H) 4.42 – 4.49 (m, 1 H) 4.61 – 4.76 (m, 2 H) 6.84 (m, 1 H) 6.94 (m, 1 H) 7.24 (m, 1 H) 7.32 (m, 1 H)

10

20

【 0 9 0 4】

【表 1 1 - 6 2】

547			882.3	(400 MHz) : 0.82 (d, J=6.9 Hz, 3 H) 0.82 (d, J=6.9 Hz, 3 H) 0.89 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.07 – 1.39 (m, 26 H) 1.69 – 1.89 (m, 3 H) 2.06 – 2.60 (m, 15 H) 2.65 – 2.87 (m, 8 H) 3.17 – 3.20 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.38 – 3.56 (m, 2 H) 3.66 (d, J=7.8Hz, 1 H) 3.78 (s, 3 H) 4.09 (m, 1 H) 4.40 (d, J=7.1 Hz, 1 H) 4.43 (q, J=6.5 Hz, 1 H) 4.86 (m, 1 H) 6.82 – 6.90 (m, 2 H) 7.11 – 7.20 (m, 2 H)
548			882.3	(400 MHz) : 0.82 (d, J=6.9 Hz, 3 H) 0.82 (d, J=6.9 Hz, 3 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.08 – 1.38 (m, 32 H) 1.70 – 1.90 (m, 3 H) 2.05 (dd, J=15.1, 6.1Hz, 1 H) 2.12 – 2.95 (m, 16 H) 3.16 – 3.25 (m, 4 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 – 3.56 (m, 2 H) 3.82 (s, 3 H) 3.66 (d, J=7.8 Hz, 1 H) 4.08 (m, 1 H) 4.41 (d, J=7.1 Hz, 1 H) 4.45 (q, J=6.9 Hz, 1 H) 4.64 (m, 1 H) 4.86 (m, 1 H) 6.83 (m, 2 H) 7.11 (m, 2 H)
549			852.3	(400 MHz) : 0.79 – 0.85 (m, 6 H) 0.91 (t, J=8.3 Hz, 3 H) 1.07 – 1.36 (m, 26 H) 1.70 – 1.88 (m, 2 H) 2.06 – 2.54 (m, 17 H) 2.85 – 2.95 (m, 7 H) 3.16 – 3.26 (m, 4 H) 3.34 (s, 3 H) 3.36 – 3.58 (m, 2 H) 3.66 (d, J=7.5Hz, 1 H) 4.08 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.1 Hz, 1 H) 4.43 (q, J=6.6 Hz, 1 H) 4.85 (m, 1 H) 7.17 – 7.31 (m, 5 H)
550			912	(400 MHz) : 0.79 – 0.84 (m, 6 H) 0.92 (t, J=7.4 Hz, 3 H) 1.02 – 1.25 (m, 17 H) 1.32 (s, 3 H) 1.72 – 1.88 (m, 4 H) 2.10 – 2.50 (m, 16 H) 2.62 – 2.77 (m, 5 H) 2.83 (m, 1 H) 2.94 (m, 1 H) 3.16 – 3.47 (m, 13 H) 3.60 – 3.65 (m, 2 H) 3.78 (s, 3 H) 4.11 (m, 1 H) 4.31 – 4.37 (m, 2 H) 4.66 (m, 1 H) 4.89 (m, 1 H) 6.83 (m, 2 H) 7.09 (m, 2 H)
551			898	ジアステレオマーの混合物 (400 MHz) : 0.82 (m, 3 H) 0.82 (m, 3 H) 0.91 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.08 – 1.35 (m, 20 H) 1.60 – 1.90 (m, 8 H) 2.00 – 2.95 (m, 20 H) 3.18 – 3.60 (m, 12 H) 3.67 (m, 1 H) 3.81 (s, 3 H) 4.14 (m, 1 H) 4.32 – 4.48 (m, 2 H) 4.61 – 4.69 (m, 2 H) 4.87 – 4.97 (m, 1 H) 6.89 (m, 2 H) 7.28 (m, 2 H)

30

40

【 0 9 0 5】

実施例 2 6 2

(1) 実施例 1 2 6 (1) で得られた化合物 1.00g を原料として、実施例 1 1 3 (2) と同様の方法にて 4" 位ケトン体 0.99g を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 305mg をメタノール 9ml に溶解し、酢酸アンモニウム 24

50

9mg、シアノ水素化ホウ素ナトリウム30.4mgを加え、室温にて終夜攪拌した。反応液に飽和重曹水、クロロホルムを加え分液後、有機層を飽和食塩水にて洗浄した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール=30:1）、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（NH型、トルエン：酢酸エチル=50:1）にて精製して4”位の立体配置がSのアミン体43.3mg及びエピマー混合物35.3mgを得た。

（3）上記（2）で得られた4”位の立体配置がSのアミン体25.1mgを原料として、実施例7（4）と同様の方法にて、表11で示される化合物16.1mgを得た。

【0906】

実施例263

10

（1）実施例262（1）で得られた化合物109mgをエタノール7.3mlに溶解し、ラネーニッケルスラリー液2mlを加えて3.5kgt/cm²の水素雰囲気下、室温にて7時間攪拌した。反応液をセライト濾過後、濾液に蒸留水、酢酸エチルを加え分液し、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン=60:10:0.2）にて精製して4”位の立体配置がRのヒドロキシル体40.1mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物20.3mgを原料として、実施例7（4）と同様の方法にて、表11で示される化合物14.2mgを得た。

【0907】

実施例264

20

実施例126（2）で得られた化合物100mg、参考例72で得られた化合物54.7mgを原料として実施例126（3）、実施例7（4）と同様の方法にて表11で示される化合物72mgを得た。

【0908】

実施例265

実施例126（2）で得られた化合物100mg、参考例73で得られた化合物54.7mgを原料として実施例126（3）、実施例7（4）と同様の方法にて表11で示される化合物64mgを得た。

【0909】

実施例266

30

実施例126（2）で得られた化合物100mg、参考例74で得られた化合物51.7mgを原料として実施例126（3）、実施例7（4）と同様の方法にて表11で示される化合物50mgを得た。

【0910】

実施例267

実施例126（2）で得られた化合物100mg、参考例75で得られた化合物55.8mgを原料として実施例126（3）、実施例7（4）と同様の方法にて表11で示される化合物43mgを得た。

【0911】

実施例268

40

実施例126（2）で得られた化合物100mg、参考例76で得られた化合物50.8mgを原料として実施例126（3）、実施例7（4）と同様の方法にて表11で示される化合物43mgを得た。

【0912】

実施例269

実施例126（2）で得られた化合物150mg、参考例77で得られた化合物60.6mgを原料として実施例126（3）、実施例7（4）と同様の方法にて表11で示される化合物82mgを得た。

【0913】

実施例270

50

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 250mg、参考例 7 8 で得られた化合物 143.3mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 235mg を得た。

【0 9 1 4】

実施例 2 7 1

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 7 9 で得られた化合物 60.6mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 97mg を得た。

【0 9 1 5】

実施例 2 7 2

10

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 8 0 で得られた化合物 65.3mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 99mg を得た。

【0 9 1 6】

実施例 2 7 3

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 8 1 で得られた化合物 68.1mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 126mg を得た。

【0 9 1 7】

実施例 2 7 4

20

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 8 2 で得られた化合物 48mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 95mg を得た。

【0 9 1 8】

実施例 2 7 5

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 8 3 で得られた化合物 59.4mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 113mg を得た。

【0 9 1 9】

実施例 2 7 6

30

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 8 4 で得られた化合物 59.4mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 119mg を得た。

【0 9 2 0】

実施例 2 7 7

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 8 5 で得られた化合物 63.5mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 125mg を得た。

【0 9 2 1】

実施例 2 7 8

40

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 8 6 で得られた化合物 67.8mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 130mg を得た。

【0 9 2 2】

実施例 2 7 9

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 8 7 で得られた化合物 68.4mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 83mg を得た。

【0 9 2 3】

実施例 2 8 0

50

実施例 270 で得られた化合物 100mg をメタノール 5ml に溶解し、5% パラジウム-炭素 20mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 3 時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1 から 5:1:0.1）にて精製して表 11 で示される化合物 54mg を得た。

【0924】

実施例 281

実施例 126 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 88 で得られた化合物 75.0mg を原料として実施例 126 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 126mg を得た。

10

【0925】

実施例 282

実施例 126 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 89 で得られた化合物 75.0mg を原料として実施例 126 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 102mg を得た。

【0926】

実施例 283

実施例 126 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 90 で得られた化合物 75.0mg を原料として実施例 126 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 104mg を得た。

20

【0927】

実施例 284

実施例 126 (2) で得られた化合物 110mg、参考例 91 で得られた化合物 57.3mg を原料として実施例 126 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 77mg を得た。

【0928】

実施例 285

実施例 279 で得られた化合物 50mg をイソプロパノール 4ml と蒸留水 2ml の混合溶媒に溶解し、鉄 5.4mg を加えて 90℃ にて 1 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して表 11 で示される化合物 32mg を得た。

30

【0929】

実施例 286

実施例 274 で得られた化合物 53mg をクロロホルム 1ml に溶解し、アセトアルデヒド 13mg、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム 18mg を加えて室温にて 1 時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1）により精製して表 11 で示される化合物 44.8mg を得た。

【0930】

40

実施例 287

(1) 実施例 126 (2) で得られた化合物 150mg をテトラヒドロフラン 0.2ml に溶解し、参考例 92 で得られた化合物 55mg を加えて室温にて 3 日間攪拌した。反応液にクロロホルム、蒸留水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=15:10:0.2）にて精製してカーバメート体 169mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 169mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 100mg を得た。

【0931】

実施例 288

50

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 9 3 で得られた化合物 70mg を原料として実施例 2 8 7 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 111mg を得た。

【0 9 3 2】

実施例 2 8 9

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 9 4 で得られた化合物 70mg を原料として実施例 2 8 7 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 110mg を得た。

【0 9 3 3】

実施例 2 9 0

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 9 5 で得られた化合物 48mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 106mg を得た。

【0 9 3 4】

実施例 2 9 1

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 9 6 で得られた化合物 70mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 103mg を得た。

【0 9 3 5】

実施例 2 9 2

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 9 7 で得られた化合物 52mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 107mg を得た。

【0 9 3 6】

実施例 2 9 3

実施例 2 9 0 で得られた化合物 80mg を原料として実施例 2 8 6 と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 65mg を得た。

【0 9 3 7】

実施例 2 9 4

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 9 8 で得られた化合物 76mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 50mg を得た。

【0 9 3 8】

実施例 2 9 5

実施例 2 9 1 で得られた化合物 70mg を原料として実施例 2 8 6 と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 70mg を得た。

【0 9 3 9】

実施例 2 9 6

実施例 2 9 2 で得られた化合物 70mg を原料として実施例 2 8 6 と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 61mg を得た。

【0 9 4 0】

実施例 2 9 7

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 9 9 で得られた化合物 48mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 26mg を得た。

【0 9 4 1】

実施例 2 9 8

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 1 0 0 で得られた化合物 52mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 117mg を得た。

10

20

30

40

50

【0942】

実施例299

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例101で得られた化合物80mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物64mgを得た。

【0943】

実施例300

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例102で得られた化合物80mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物65mgを得た。

10

【0944】

実施例301

実施例294で得られた化合物35mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物26mgを得た。

【0945】

実施例302

実施例297で得られた化合物17mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物14mgを得た。

【0946】

実施例303

実施例298で得られた化合物70mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物67mgを得た。

20

【0947】

実施例304

実施例299で得られた化合物43mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物40mgを得た。

【0948】

実施例305

実施例300で得られた化合物65mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物24mgを得た。

30

【0949】

実施例306

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例103で得られた化合物51.9mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物127mgを得た。

【0950】

実施例307

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例104で得られた化合物60.3mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物118mgを得た。

40

【0951】

実施例308

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例105で得られた化合物57.2mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物120mgを得た。

【0952】

実施例309

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例106で得られた化合物51.9mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物105mgを得た。

50

【0953】

実施例310

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例107で得られた化合物60.0mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物128mgを得た。

【0954】

実施例311

実施例307で得られた化合物65mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物53mgを得た。

【0955】

実施例312

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例108で得られた化合物60.3mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物120mgを得た。

【0956】

実施例313

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例109で得られた化合物56.0mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物123mgを得た。

【0957】

実施例314

実施例306で得られた化合物65mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物46mgを得た。

【0958】

実施例315

実施例309で得られた化合物60mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物63mgを得た。

【0959】

実施例316

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例110で得られた化合物51.9mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物86mgを得た。

【0960】

実施例317

実施例311で得られた化合物35mgを原料として実施例285と同様の方法にて表11で示される化合物20mgを得た。

【0961】

実施例318

実施例312で得られた化合物65mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物73mgを得た。

【0962】

実施例319

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例111で得られた化合物59.7mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物125mgを得た。

【0963】

実施例320

実施例308で得られた化合物60mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物67mgを得た。

【0964】

10

20

30

40

50

実施例 3 2 1

実施例 3 1 3 で得られた化合物 70mg を原料として実施例 2 8 6 と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 72mg を得た。

【0 9 6 5】

実施例 3 2 2

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 164mg、参考例 1 1 2 で得られた化合物 103mg を原料として実施例 2 8 7 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 110mg を得た。

【0 9 6 6】

実施例 3 2 3

実施例 3 1 0 で得られた化合物 70mg を原料として実施例 2 8 6 と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 66mg を得た。

【0 9 6 7】

実施例 3 2 4

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 1 1 3 で得られた化合物 64.0mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 130mg を得た。

【0 9 6 8】

実施例 3 2 5

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 1 1 4 で得られた化合物 76mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 100mg を得た。

【0 9 6 9】

実施例 3 2 6

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 1 1 5 で得られた化合物 80mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 106mg を得た。

【0 9 7 0】

実施例 3 2 7

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 1 1 6 で得られた化合物 69mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 96mg を得た。

【0 9 7 1】

実施例 3 2 8

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 1 1 7 で得られた化合物 85mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 80mg を得た。

【0 9 7 2】

実施例 3 2 9

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 1 1 8 で得られた化合物 76mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 101mg を得た。

【0 9 7 3】

実施例 3 3 0

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 1 1 9 で得られた化合物 89mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 123mg を得た。

【0 9 7 4】

実施例 3 3 1

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 1 2 0 で得られた化合物 62mg を原料

10

20

30

40

50

として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 12 5mg を得た。

【0 9 7 5】

実施例 3 3 2

実施例 3 2 5 で得られた化合物 58mg を原料として実施例 2 8 6 と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 34mg を得た。

【0 9 7 6】

実施例 3 3 3

実施例 3 2 6 で得られた化合物 73mg を原料として実施例 2 8 6 と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 48mg を得た。

10

【0 9 7 7】

実施例 3 3 4

実施例 3 2 7 で得られた化合物 68mg を原料として実施例 2 8 6 と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 62mg を得た。

【0 9 7 8】

実施例 3 3 5

実施例 3 2 8 で得られた化合物 48mg を原料として実施例 2 8 6 と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 47mg を得た。

【0 9 7 9】

実施例 3 3 6

20

実施例 3 2 9 で得られた化合物 60mg を原料として実施例 2 8 6 と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 58mg を得た。

【0 9 8 0】

実施例 3 3 7

実施例 3 3 0 で得られた化合物 74mg を原料として実施例 2 8 6 と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 67mg を得た。

【0 9 8 1】

実施例 3 3 8

実施例 3 3 1 で得られた化合物 81mg を原料として実施例 2 8 6 と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 53mg を得た。

30

【0 9 8 2】

実施例 3 3 9

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 1 2 1 で得られた化合物 74.1mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 75mg を得た。

【0 9 8 3】

実施例 3 4 0

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 1 2 2 で得られた化合物 74.1mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 108mg を得た。

40

【0 9 8 4】

実施例 3 4 1

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 1 2 3 で得られた化合物 75.9mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 132mg を得た。

【0 9 8 5】

実施例 3 4 2

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 150mg、参考例 1 2 4 で得られた化合物 82.5mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 125mg を得た。

50

【0986】

実施例343

実施例339で得られた化合物40mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物41mgを得た。

【0987】

実施例344

実施例340で得られた化合物50mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物51mgを得た。

【0988】

実施例345

実施例341で得られた化合物75mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物57mgを得た。

【0989】

実施例346

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例125で得られた化合物81.3mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物10mgを得た。

【0990】

実施例347

実施例342で得られた化合物75mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物58mgを得た。

【0991】

実施例348

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例126で得られた化合物40mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物17mgを得た。

【0992】

実施例349

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例127で得られた化合物64mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物15mgを得た。

【0993】

実施例350

2',4'-ジヒドロキシアセトフェノン500mgをジメチルホルムアミド10mlに溶解してイミダゾール1.34g、t-ブチルジメチルクロロシラン1.09gを加えて室温にて48時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液後、有機層を蒸留水で3回洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して粗生成物1.34gを得た。これをメタノール10mlに溶解し、エチレンジアミン634mgを加えて室温にて16時間攪拌した。反応液を水素化ホウ素ナトリウム200mgのテトラヒドロフラン懸濁液50mlに加えた後にメタノール6mlを加えて、室温にて1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、クロロホルムと飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)にて精製して得たアミン体62mgと実施例126(2)で得られた化合物100mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物5mgを得た。

【0994】

実施例351

3',5'-ジヒドロキシアセトフェノン500mgをジメチルホルムアミド10mlに溶解してイミダゾール1.34g、t-ブチルジメチルクロロシラン1.09gを加えて室温にて48時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液後、有機層を蒸留水で3回

10

20

30

40

50

洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して粗生成物1.49gを得た。このうち250mgをメタノール2mlに溶解し、エチレンジアミン118mgを加えて室温にて16時間攪拌した。これを水素化ホウ素ナトリウム37mgのテトラヒドロフラン懸濁液10mlに加えた後にメタノール2mlを加えて、室温にて1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、クロロホルムと飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して得たアミン体58mgと実施例126(2)で得られた化合物100mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物5mgを得た。

【0995】

10

実施例352

実施例126(2)で得られた化合物70mg、参考例128で得られた化合物15.7mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物54mgを得た。

【0996】

実施例353

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例129で得られた化合物41.5mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物142mgを得た。

【0997】

20

実施例354

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例130で得られた化合物112.3mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物131mgを得た。

【0998】

実施例355

実施例126(2)で得られた化合物150mg、参考例131で得られた化合物38.9mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物113mgを得た。

【0999】

30

実施例356

実施例353で得られた化合物35mgを原料として実施例286と同様の方法にて表11で示される化合物32mgを得た。

【1000】

実施例357

実施例126(2)で得られた化合物100mg、参考例132で得られた化合物68mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物87mgを得た。

【1001】

実施例358

40

(1) 実施例263(1)で得られた化合物100mgを原料として実施例126(2)と同様の方法にて4"-0-イミダゾリルカルボニル体110mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物20mg、N,N-ジメチルエチレンジアミン16.9mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物5mgを得た。

【1002】

実施例359

実施例358(1)で得られた化合物20mg、アミノエタノール11.5mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物6mgを得た。

【1003】

50

実施例 3 6 0

実施例 3 5 8 (1) で得られた化合物 23mg、参考例 5 7 で得られた化合物 10.4mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 7.4mg を得た。

【1 0 0 4】

実施例 3 6 1

実施例 3 5 8 (1) で得られた化合物 27.2mg、参考例 5 4 で得られた化合物 9.8mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 5.7mg を得た。

【1 0 0 5】

10

実施例 3 6 2

(1) 実施例 1 6 8 (1) で得られた化合物 80mg をメタノール 8ml に溶解し、ナトリウムメトキシド 0.16g を加えて加熱還流下 3 日間攪拌した。さらにナトリウムメトキシド 0.16g を加えて加熱還流下 7 日間攪拌した。さらにナトリウムメトキシド 0.16g を加えて加熱還流下 2 日間攪拌した。反応液にクロロホルム、飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン=30:10:0.2）にて精製してヒドロキシ体 14mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 14mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 8mg を得た。

20

【1 0 0 6】

実施例 3 6 3

(1) 実施例 1 6 8 (1) で得られた化合物 60mg をエタノール 3ml に溶解し、24%アンモニア水 3ml、ピリジン塩酸塩 6mg を加えて封管中 70℃にて 15 時間攪拌した。反応液にクロロホルム、食塩水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=30:1:0.1 から 10:1:0.1）にて精製してアミン体 38mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 38mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 4mg を得た。

【1 0 0 7】

30

実施例 3 6 4

実施例 1 6 8 (1) で得られた化合物 60mg、40%メチルアミン水溶液 3ml を原料として実施例 3 6 3 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 15mg を得た。

【1 0 0 8】

実施例 3 6 5

実施例 1 6 8 (1) で得られた化合物 60mg、50%ジメチルアミン水溶液 3ml を原料として実施例 3 6 3 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 34mg を得た。

【1 0 0 9】

実施例 3 6 6

40

(1) 実施例 3 6 3 (1) で得られた化合物 64mg をジクロロメタン 6.6ml に溶解し、1,1'-チオカルボニルジイミダゾール 14mg を加えて室温にて 13 時間攪拌した。さらに 1,1'-チオカルボニルジイミダゾール 7mg を加えて室温にて 4 時間攪拌した。さらに 1,1'-チオカルボニルジイミダゾール 7mg を加えて室温にて 4 時間攪拌した。反応液にクロロホルム、飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=22:1:0.1）にて精製して環化体 47mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 47mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 34mg を得た。

【1 0 1 0】

50

実施例 367

(1) 実施例 168 (1) で得られた化合物 350mg をジメチルスルホキシド 54ml に溶解し、ナトリウムメタランチオラート 250mg を加えて 70℃ にて 4 時間攪拌した。反応液にクロロホルム、飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2）にて精製してヒドロキシ体 31mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 31mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 17mg を得た。

【1011】

実施例 368

10

(1) 実施例 168 (1) で得られた化合物 275mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて脱保護体 210mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 30mg をエタノール 0.5ml に溶解し、N-(3-アミノプロピル)モルホリン 29.6mg、ピリジン塩酸塩 0.95mg を加えて 90℃ にて 36 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=30:1:0.1）にて精製して表 11 で示される化合物 24mg を得た。

【1012】

実施例 369

実施例 368 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 106 で得られた化合物 62mg を原料として実施例 168 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 13mg を得た。

20

【1013】

実施例 370

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、N,N-ジメチルエチレンジアミン 45 μ l を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 23mg を得た。

【1014】

実施例 371

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、アミノエタノール 24.8 μ l を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 28mg を得た。

【1015】

実施例 372

30

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、n-ブチルアミン 40.6 μ l を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 22mg を得た。

【1016】

実施例 373

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、参考例 131 で得られた化合物 37.0mg を原料として実施例 168 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 38mg を得た。

【1017】

実施例 374

実施例 368 (1) で得られた化合物 50mg をエタノールに溶解し、(1S,2S)-(+)-2-アミノ-1-(4-ニトロフェニル)-1,3-プロパンジオール 73mg、ピリジン塩酸塩 1.6mg を加えて封管中 90℃ にて 48 時間加熱した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:1:0.1）により精製して表 11 で示される化合物 23mg を得た。

40

【1018】

実施例 375

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、2-アミノ-1,3-プロパンジオール 18.7mg を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 24mg を得た。

【1019】

実施例 376

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、4-ニトロフェネチルアミン 34.1mg を原料とし

50

て実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 9mg を得た。

【1020】

実施例 377

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、イソamilアミン 24 μ l を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 29mg を得た。

【1021】

実施例 378

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、1-(2-アミノエチル)ピペリジン 29.2 μ l を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 24mg を得た。

【1022】

実施例 379

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、4-(2-アミノエチル)モルホリン 26.9 μ l を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 24mg を得た。

【1023】

実施例 380

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、1-(2-アミノエチル)ピペラジン 26.9 μ l を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 15mg を得た。

【1024】

実施例 381

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、N,N-ジエチルエチレンジアミン 23.8mg を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 28mg を得た。

【1025】

実施例 382

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、N-(2-アミノエチル)ピロリジン 23.4mg を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 21mg を得た。

【1026】

実施例 383

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、ピペリジン 17.5mg を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 36mg を得た。

【1027】

実施例 384

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、モルホリン 17.9mg を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 28mg を得た。

【1028】

実施例 385

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、(1R,2R)-(-)-2-アミノ-1-フェニル-1,3-プロパンジオール 34.2mg を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 36mg を得た。

【1029】

実施例 386

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、N-メチルエチレンジアミン 18 μ l を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 9mg を得た。

【1030】

実施例 387

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、N-メチルエチレンジアミン 18 μ l を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 9mg を得た。

【1031】

実施例 388

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、1-メチルピペラジン 23 μ l を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 18mg を得た。

10

20

30

40

50

【1032】

実施例389

実施例368(1)で得られた化合物30mg、ピペラジン17.7mgを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物22mgを得た。

【1033】

実施例390

実施例368(1)で得られた化合物60mg、3-アミノピロリジン36.4 μ lを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物39mgを得た。

【1034】

実施例391

実施例368(1)で得られた化合物30mg、N,N-ジメチル-1,3-プロパンジアミン25.8 μ lを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物23mgを得た。

【1035】

実施例392

実施例368(1)で得られた化合物30mg、参考例133で得られた化合物24.2mgを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物11mgを得た。

【1036】

実施例393

実施例368(1)で得られた化合物30mg、参考例133で得られた化合物24.2mgを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される実施例392のジアステレオマー5mgを得た。

【1037】

実施例394

実施例368(1)で得られた化合物30mg、参考例134で得られた化合物20.5mgを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物16mgを得た。

【1038】

実施例395

実施例368(1)で得られた化合物10mg、2-アミノ-1-プロパノール5.1mgを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物10.7mgを得た。

【1039】

実施例396

実施例368(1)で得られた化合物10mg、3-アミノペンタン6.0mgを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物10.7mgを得た。

【1040】

実施例397

実施例368(1)で得られた化合物10mg、N-イソプロピルエチレンジアミン7.0mgを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物9.4mgを得た。

【1041】

実施例398

実施例368(1)で得られた化合物10mg、4-アミノテトラヒドロピラン6.9mgを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物10.5mgを得た。

【1042】

実施例399

実施例368(1)で得られた化合物30mg、(3R)-(+)-3-アミノピロリジン17.7mgを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物26.1mgを得た。

【1043】

実施例400

実施例368(1)で得られた化合物50mg、1-ベンジル-3-アミノピロリジン60.3mgを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物30.7mgを得た。

【1044】

10

20

30

40

50

実施例 401

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、参考例 135 で得られた化合物 11mg を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 3.2mg を得た。

【1045】

実施例 402

実施例 400 で得られた化合物 15mg をメタノール 300 μ l に溶解し、20% 水酸化パラジウム-炭素 7.5mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 3 時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1) にて精製して表 11 で示される化合物 8.4mg を得た。

10

【1046】

実施例 403

実施例 368 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 136 で得られた化合物 90.1mg を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 33.4mg を得た。

【1047】

実施例 404

実施例 403 で得られた化合物 15mg を原料として実施例 402 と同様の方法にて表 11 で示される化合物 3.0mg を得た。

【1048】

実施例 405

(1) 実施例 172 (1) で得られた化合物 60mg、24%アンモニア水 3ml を原料として実施例 363 (1) と同様の方法にてアミン体 52mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 52mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 25mg を得た。

【1049】

実施例 406

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、(3S)-(-)-3-アミノピロリジン 17.7mg を原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 30.7mg を得た。

【1050】

実施例 407

(1) 実施例 172 (1) で得られた化合物 80mg を原料として実施例 362 (1) と同様の方法にてヒドロキシ体 27mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 32mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 22mg を得た。

【1051】

実施例 408

実施例 172 (1) で得られた化合物 70mg を原料として実施例 367 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 8mg を得た。

【1052】

実施例 409

実施例 172 (1) で得られた化合物 60mg、40%メチルアミン水溶液 3ml を原料として実施例 363 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 20mg を得た。

【1053】

実施例 410

実施例 172 (1) で得られた化合物 60mg、50%ジメチルアミン水溶液 3ml を原料として実施例 363 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 29mg を得た。

【1054】

実施例 411

実施例 405 (1) で得られた化合物 43mg を原料として実施例 366 (1) と同様の方法

50

にて環化体26mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物32mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物30mgを得た。

【1055】

実施例412

(1) 実施例172(1)で得られた化合物2.0gを原料として実施例7(4)と同様の方法にて脱保護体1.4gを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物115mg、エチレンジアミン52.6 μ lを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物124mgを得た。

【1056】

10

実施例413

実施例412(1)で得られた化合物100mg、1,3-ジアミノプロパン57.1 μ lを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物51mgを得た。

【1057】

実施例414

実施例412(1)で得られた化合物100mg、1,4-ジアミノブタン27.5 μ lを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物51mgを得た。

【1058】

実施例415

実施例412(1)で得られた化合物100mg、アミノエタノール16.5 μ lを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物82mgを得た。

20

【1059】

実施例416

実施例412(1)で得られた化合物100mg、ピペリジン27.1 μ lを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物43mgを得た。

【1060】

実施例417

実施例412(1)で得られた化合物100mg、3-アミノ-1-プロパノール52.3 μ lを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物41mgを得た。

【1061】

30

実施例418

実施例412(1)で得られた化合物100mg、ピペラジン58.9mgを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物96mgを得た。

【1062】

実施例419

実施例412(1)で得られた化合物100mg、N,N-ジメチルエチレンジアミン75 μ lを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物100mgを得た。

【1063】

実施例420

実施例412(1)で得られた化合物100mg、4-アミノ-1-ブタノール63 μ lを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物86mgを得た。

40

【1064】

実施例421

実施例412(1)で得られた化合物100mg、モルホリン60 μ lを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物47mgを得た。

【1065】

実施例422

実施例412(1)で得られた化合物100mg、2-メトキシエチルアミン60 μ lを原料として実施例368(2)と同様の方法にて表11で示される化合物71mgを得た。

【1066】

50

実施例 4 2 3

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 100mg、2-(メチルアミノ)エタノール 55 μ l を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 64mg を得た。

【1067】

実施例 4 2 4

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 100mg、n-ブチルアミン 68 μ l を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 66mg を得た。

【1068】

実施例 4 2 5

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 100mg、3-アミノプロピオニトリル 102 μ l を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 14mg を得た。

【1069】

実施例 4 2 6

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 60mg、ベンジルアミン 45 μ l を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 61mg を得た。

【1070】

実施例 4 2 7

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 60mg、3-(アミノメチル)ピリジン 42 μ l を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 52mg を得た。

【1071】

実施例 4 2 8

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 60mg、イミダゾール 28.2mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 57mg を得た。

【1072】

実施例 4 2 9

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 60mg、アニリン 37 μ l を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 58mg を得た。

【1073】

実施例 4 3 0

(1) 実施例 1 7 2 (1) で得られた化合物 100mg、ベンジルアミン 75 μ l を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にてアミン体 84mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 84mg をメタノール 200 μ l に溶解し、20%水酸化パラジウム-炭素 42mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 14 時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣 72mg をクロロホルム 200 μ l に溶解し、ピリジン 162 μ l、トリホスゲン 59.4mg を加えて氷冷下 1 時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して環化体 12mg を得た。

(3) 上記 (2) で得られた化合物 12mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 10mg を得た。

【1074】

実施例 4 3 1

実施例 1 7 2 (1) で得られた化合物 40mg、参考例 5 4 で得られた化合物 15.3mg を原料として実施例 1 6 8 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 2.4mg を得た。

【1075】

実施例 4 3 2

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 1 0 6 で得られた化合物 62mg を原料として実施例 1 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 18mg を得た。

【1076】

実施例 4 3 3

10

20

30

40

50

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 30mg、参考例 1 3 1 で得られた化合物 37.0mg を原料として実施例 1 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 17mg を得た。

【1 0 7 7】

実施例 4 3 4

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、D-(-)-トレオ-2-アミノ-1-(4-ニトロフェニル)-1,3-プロパンジオール 72.6mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 37mg を得た。

【1 0 7 8】

実施例 4 3 5

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 1 3 7 で得られた化合物 102mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 23mg を得た。

10

【1 0 7 9】

実施例 4 3 6

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 1 3 8 で得られた化合物 107mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 39mg を得た。

【1 0 8 0】

実施例 4 3 7

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 1 3 9 で得られた化合物 87mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 36mg を得た。

【1 0 8 1】

20

実施例 4 3 8

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 1 4 0 で得られた化合物 92mg を原料として 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 52mg を得た。

【1 0 8 2】

実施例 4 3 9

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 1 4 1 で得られた化合物 97mg を原料として 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 51mg を得た。

【1 0 8 3】

実施例 4 4 0

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 1 4 2 で得られた化合物 84mg を原料として 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 15mg を得た。

30

【1 0 8 4】

実施例 4 4 1

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 1 5 0 で得られた化合物 89mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 21mg を得た。

【1 0 8 5】

実施例 4 4 2

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 6 9 で得られた化合物 36.0mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 37mg を得た。

【1 0 8 6】

40

実施例 4 4 3

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 6 8 で得られた化合物 47.3mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 37mg を得た。

【1 0 8 7】

実施例 4 4 4

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、N,N-ジメチルプロパン-1,4-ジアミン 34.9mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 37mg を得た。

【1 0 8 8】

実施例 4 4 5

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 6 7 で得られた化合物 39.7mg を原料と

50

して実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 12.5mg を得た。

【1 0 8 9】

実施例 4 4 6

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 1 4 7 で得られた化合物 67.1mg を原料として実施例 1 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 31mg を得た。

【1 0 9 0】

実施例 4 4 7

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 1 4 8 で得られた化合物 76.7mg を原料として実施例 1 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 32mg を得た。

【1 0 9 1】

実施例 4 4 8

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 1 4 5 で得られた化合物 121mg を原料として実施例 1 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 32mg を得た。

【1 0 9 2】

実施例 4 4 9

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 30mg、2-アミノ-1,3-プロパンジオール 18.7mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 36mg を得た。

【1 0 9 3】

実施例 4 5 0

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 30mg、参考例 1 4 3 で得られた化合物 37.4mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 34mg を得た。

【1 0 9 4】

実施例 4 5 1

(1) フロルフェニコールアミン塩酸塩 20mg に 1 規定水酸化ナトリウム水溶液とクロロホルムを加えて分液し、水層に炭酸カリウムを加えてクロロホルムにて抽出した。有機層を減圧濃縮してアミン体 17mg を得た。

(2) 実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 12.6mg、上記 (1) で得られた化合物 17mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 1.0mg を得た。

【1 0 9 5】

実施例 4 5 2

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 30mg、(1R,2R)-(-)-2-アミノ-1-フェニル-1,3-プロパンジオール 34.3mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 30mg を得た。

【1 0 9 6】

実施例 4 5 3

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 30mg、参考例 1 3 3 で得られた化合物 24.2mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 8mg を得た。

【1 0 9 7】

実施例 4 5 4

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 30mg、参考例 1 3 3 で得られた化合物 24.2mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される実施例 4 5 3 のジアステレオマー 10mg を得た。

【1 0 9 8】

実施例 4 5 5

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、参考例 1 4 4 で得られた化合物 39.7mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 12.5mg を得た。

【1 0 9 9】

実施例 4 5 6

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 30mg、D-(+)-トレオ-[1-(p-メタンスルホニル)フェニル]-2-アミノ-1,3-プロパンジオール 13mg を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方

10

20

30

40

50

法にて表 1 1 で示される化合物12.5mgを得た。

【1 1 0 0】

実施例 4 5 7

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物30mg、4-ニトロフェネチルアミン塩酸塩41.6mgを原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物13mgを得た。

【1 1 0 1】

実施例 4 5 8

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物30mg、参考例 1 4 4 で得られた化合物40.2mgを原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物4.0mgを得た。

【1 1 0 2】

実施例 4 5 9

(1) 実施例 2 6 2 (2) で得られた4”位の立体配置がSのアミン体50mgをジメチルホルムアミド2mlに溶解し、N,N'-カルボニルジイミダゾール25.7mgを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液に酢酸エチル、飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をテトラヒドロフラン2mlに溶解し、参考例 1 4 5 で得られた化合物55.9mgを加えて加熱還流下1時間攪拌した。反応液に飽和重曹水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2）にて精製してウレア体71mgを得た。

(2) 上記(1) で得られた化合物65mgを原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物48mgを得た。

【1 1 0 3】

実施例 4 6 0

(1) 参考例 1 4 6 で得られた化合物20mgをクロロホルムに溶解し、デスマーチン試薬40mgを加えて室温にて20分間攪拌した。反応液に飽和重曹水とジエチルエーテルを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られたアルデヒドと実施例 2 6 2 (2) で得られた4”位の立体配置がSのアミン体50mgをクロロホルムに溶解し、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム1.38gを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=50:10:0.2）にて精製して付加体30mgを得た。

(2) 上記(1) で得られた化合物30mgを原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物9.5mgを得た。

【1 1 0 4】

実施例 4 6 1

(1) 実施例 2 6 2 (2) で得られた4”位の立体配置がSのアミン体420mgをジメチルホルムアミド8mlに溶解し、N,N'-カルボニルジイミダゾール180mgを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液に酢酸エチル、飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して4”-N-イミダゾリルカルボニル体462mgを得た。

(2) 上記(1) で得られた化合物66mgをテトラヒドロフラン2mlに溶解し、参考例 1 4 2 で得られた化合物47mgを加えて加熱還流下1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=50:10:0.2）にて精製してウレア体72.2mgを得た。

(3) 上記(2) で得られた化合物71.2mgを原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物16.6mgを得た。

【1 1 0 5】

実施例 4 6 2

実施例 4 6 1 (1) で得られた化合物66mg、参考例 1 4 7 で得られた化合物38mgを原料として実施例 4 6 1 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物30.4

10

20

30

40

50

mgを得た。

【1106】

実施例463

実施例461(1)で得られた化合物66mg、参考例148で得られた化合物48mgを原料として実施例461(2)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物41.3mgを得た。

【1107】

実施例464

(1) 実施例461(1)で得られた化合物130mg、参考例137で得られた化合物44.6mgを原料として実施例126(3)と同様の方法にてウレア体111mgを得た。

10

(2) 上記(1)で得られた化合物50mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物42mgを得た。

【1108】

実施例465

(1) 実施例461(1)で得られた化合物60mg、参考例138で得られた化合物15mgを原料として実施例126(3)と同様の方法にてウレア体23mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物20mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物14mgを得た。

【1109】

実施例466

20

(1) 実施例461(1)で得られた化合物70mg、参考例149で得られた化合物17.2mgを原料として実施例126(3)と同様の方法にてウレア体54mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物50mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物33mgを得た。

【1110】

実施例467

(1) 実施例262(2)で得られた4"位の立体配置がSのアミン体70mgをジメチルホルムアミド1.5mlに溶解し、N,N'-カルボニルジイミダゾール30.0mgを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液に酢酸エチル、飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をテトラヒドロフラン2mlに溶解し、参考例150で得られた化合物38.5mgを加えて加熱還流下1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=50:10:0.2)にて精製してウレア体66.9mgを得た。

30

(2) 上記(1)で得られた化合物64.3mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物32.7mgを得た。

【1111】

実施例468

実施例262(2)で得られた4"位の立体配置がSのアミン体50mg、n-ブチルアミン11.6mgを原料として実施例459(1)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物40mgを得た。

40

【1112】

実施例469

(1) 実施例262(2)で得られた4"位の立体配置がSのアミン体50mgをクロロホルム2mlに溶解し、参考例151で得られた化合物37.8mg、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム16.8mgを加えて、室温にて2時間攪拌した。反応液に飽和重曹水とクロロホルムを加えて分液後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=50:10:0.2)により精製してアミン体37mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物35mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物23mgを得た。

50

【1113】

実施例470

(1) 実施例262(2)で得られた4”位の立体配置がSのアミン体60mgをクロロホルムに溶解し、トリエチルアミン64mg、3-クロロプロパンスルホニルクロリドを32mg加えて室温にて1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=10:10:0.2)にて精製してクロロ体60mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物46mgと特許文献(特開昭54-154724号公報)に記載の方法にて得られた(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エタンアミン19mgをジメチルホルムアミド0.5mlに溶解し、110℃にて5時間加熱した。反応液に酢酸エチルおよび飽和重曹水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2)にて精製して付加体26mgを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物26mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物9mgを得た。

【1114】

実施例471

(1) 実施例262(2)で得られたエピマー混合物48mgをジクロロメタン0.5mlに溶解し、9-フルオレニルメチルスクシンイミジルカルボナート25mg、トリエチルアミン33μlを加え、室温にて2日間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル:メタノール:28%アンモニア水=50:10:1:1)にて精製して、4”位の立体配置がRのアミン保護体8.0mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物12.2mgをピペリジン0.3mlに溶解し、室温にて20分間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール=10:1)にて精製して、4”位の立体配置がRのアミン体9.2mgを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物9.2mgを原料として、実施例7(4)と同様の方法にて、表11で示される化合物4.9mgを得た。

【1115】

実施例472

実施例126(2)で得られた化合物79mg、参考例163で得られた化合物47.2mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物25.5mgを得た。

【1116】

実施例473

実施例126(2)で得られた化合物80.5mg、参考例164で得られた化合物53.2mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物23.1mgを得た。

【1117】

実施例474

実施例126(2)で得られた化合物79.3mg、参考例165で得られた化合物41.2mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物21.3mgを得た。

【1118】

実施例475

実施例126(2)で得られた化合物80.5mg、参考例166で得られた化合物37.2mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物22.3mgを得た。

【1119】

実施例476

実施例126(2)で得られた化合物78.3mg、参考例167で得られた化合物28.7mgを原

10

20

30

40

50

料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 24.3mg を得た。

【1 1 2 0】

実施例 4 7 7

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 81.1mg、参考例 1 6 8 で得られた化合物 42.3mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 15.3mg を得た。

【1 1 2 1】

実施例 4 7 8

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 81.3mg、参考例 1 6 9 で得られた化合物 33.5mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 16.3mg を得た。

10

【1 1 2 2】

実施例 4 7 9

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 86.7mg、参考例 1 7 0 で得られた化合物 28.4mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 12.4mg を得た。

【1 1 2 3】

実施例 4 8 0

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 79.6mg、参考例 1 7 1 で得られた化合物 30.3mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 17.0mg を得た。

20

【1 1 2 4】

実施例 4 8 1

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 79.9mg、参考例 1 7 2 で得られた化合物 27.5mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 20.0mg を得た。

【1 1 2 5】

実施例 4 8 2

(1) 実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 80mg をテトラヒドロフラン 0.2ml に溶解し、1,4-ブタンジアミン 77 μ l を加え、室温にて終夜攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液、酢酸エチルを加え分液後、フェーズセパレーターにて濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=5:1:0.1) にて精製してカーバメート体 52.1mg を得た。

30

(2) 上記 (1) で得られた化合物 52.1mg を原料として、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 1 1 で示される化合物 2.6mg を得た。

【1 1 2 6】

実施例 4 8 3

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 80mg、2-アミノエタノール 9 μ l を原料として、実施例 4 8 2 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 1 1 で示される化合物 10.9mg を得た。

40

【1 1 2 7】

実施例 4 8 4

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 80mg、2-メトキシエチルアミン 13 μ l を原料として、実施例 4 8 2 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 1 1 で示される化合物 20.0mg を得た。

【1 1 2 8】

実施例 4 8 5

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 80mg、2-(N-メチルアミノ)エタノール 12 μ l を原料として、実施例 4 8 2 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 1 1 で示される化合

50

物21.9mgを得た。

【1129】

実施例486

実施例126(2)で得られた化合物80mg、ピペリジン15 μ lを原料として、実施例482(1)、実施例7(4)と同様の方法にて、表11で示される化合物36.2mgを得た。

【1130】

実施例487

実施例126(2)で得られた化合物80mg、モルホリン13 μ lを原料として、実施例482(1)、実施例7(4)と同様の方法にて、表11で示される化合物13.3mgを得た。

【1131】

実施例488

実施例126(2)で得られた化合物80mg、n-ブチルアミン15 μ lを原料として、実施例482(1)、実施例7(4)と同様の方法にて、表11で示される化合物33.5mgを得た。

【1132】

実施例489

実施例126(2)で得られた化合物80mg、メチルアミン塩酸塩52mg、トリエチルアミン107 μ lを原料として、実施例482(1)、実施例7(4)と同様の方法にて、表11で示される化合物17.0mgを得た。

【1133】

実施例490

実施例126(2)で得られた化合物80mg、エチレンジアミン51.3 μ lを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物22.5mgを得た。

【1134】

実施例491

実施例126(2)で得られた化合物80mg、1,3-プロパンジアミン64 μ lを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物26.6mgを得た。

【1135】

実施例492

実施例126(2)で得られた化合物80mg、N,N-ジメチルエチレンジアミン15.4 μ lを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物28.9mgを得た。

【1136】

実施例493

実施例126(2)で得られた化合物80mg、3-アミノプロパンニトリル11.3 μ lを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物33.5mgを得た。

【1137】

実施例494

実施例126(2)で得られた化合物80mg、3-アミノ-1-プロパノール11.7 μ lを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物26.7mgを得た。

【1138】

実施例495

実施例126(2)で得られた化合物80mg、4-アミノ-1-ブタノール14.3 μ lを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物21.7mgを得た。

【1139】

10

20

30

40

50

実施例 496

実施例 126 (2) で得られた化合物 80mg、28%アンモニア水 46.7 μ l を原料として実施例 126 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 22.3mg を得た。

【1140】

実施例 497

実施例 126 (2) で得られた化合物 80mg、50%ジメチルアミン水溶液 69 μ l を原料として実施例 126 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 31.0mg を得た。

【1141】

実施例 498

実施例 126 (2) で得られた化合物 80mg、ピペラジン 132mg を原料として実施例 126 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 35.1mg を得た。

【1142】

実施例 499

(1) 実施例 126 (2) で得られた化合物 80mg をテトラヒドロフラン 0.2ml に溶解し、参考例 173 で得られた化合物 48mg を加え、室温にて 2 日間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=15:1:0.1) にて精製してカーバメート体 58.2mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 58.2mg を原料として、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 11 で示される化合物 39.0mg を得た。

【1143】

実施例 500

実施例 126 (2) で得られた化合物 80mg、参考例 174 で得られた化合物 40mg を原料として、実施例 499 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 11 で示される化合物 44.0mg を得た。

【1144】

実施例 501

実施例 126 (2) で得られた化合物 80mg、参考例 175 で得られた化合物 51mg を原料として、実施例 499 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 11 で示される化合物 39.0mg を得た。

【1145】

実施例 502

実施例 126 (2) で得られた化合物 80mg、参考例 176 で得られた化合物 42mg を原料として、実施例 499 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 11 で示される化合物 43.5mg を得た。

【1146】

実施例 503

実施例 126 (2) で得られた化合物 80mg、参考例 177 で得られた化合物 52mg を原料として、実施例 499 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 11 で示される化合物 50.8mg を得た。

【1147】

実施例 504

実施例 126 (2) で得られた化合物 80mg、参考例 178 で得られた化合物 51mg を原料として、実施例 499 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 11 で示される化合物 42.2mg を得た。

【1148】

実施例 505

実施例 126 (2) で得られた化合物 80mg、参考例 179 で得られた化合物 54mg を原料として、実施例 499 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 11 で示される化合物 50.8mg を得た。

【1149】

実施例506

実施例126(2)で得られた化合物80mg、参考例180で得られた化合物45mgを原料として、実施例499(1)、実施例7(4)と同様の方法にて、表11で示される化合物38.8mgを得た。

【1150】

実施例507

実施例126(2)で得られた化合物80mg、参考例181で得られた化合物45mgを原料として、実施例499(1)、実施例7(4)と同様の方法にて、表11で示される化合物40.8mgを得た。

10

【1151】

実施例508

実施例126(2)で得られた化合物80mg、参考例182で得られた化合物36mgを原料として、テトラヒドロフランの代わりにジメチルホルムアミドを用いて実施例499(1)、実施例7(4)と同様の方法にて、表11で示される化合物10.0mgを得た。

【1152】

実施例509

実施例262で得られた化合物11.0mgをクロロホルムに溶解し、36%ホルムアルデヒド水溶液12.7 μ l、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム4.9mgを加え、室温にて4時間攪拌した。反応液に飽和重曹水、炭酸カリウム、ジクロロメタンを加え分液後、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=5:1:0.1)にて精製して表11で示される化合物6.2mgを得た。

20

【1153】

実施例510

実施例126(2)で得られた化合物80.0mg、参考例183で得られた化合物77.0mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物44.6mgを得た。

【1154】

実施例511

実施例126(2)で得られた化合物80.0mg、参考例184で得られた化合物100mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物44.3mgを得た。

30

【1155】

実施例512

実施例126(2)で得られた化合物80.0mg、参考例185で得られた化合物23.5mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物19.0mgを得た。

【1156】

実施例513

実施例126(2)で得られた化合物80.0mg、参考例186で得られた化合物60.0mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物47.2mgを得た。

40

【1157】

実施例514

実施例126(2)で得られた化合物80.0mg、参考例187で得られた化合物35.0mgを原料として実施例126(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物55.9mgを得た。

【1158】

実施例515

50

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 80.0mg、参考例 1 8 8 で得られた化合物 87.7mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 14.8mg を得た。

【1 1 5 9】

実施例 5 1 6

(1) N-(ナフタレン-1-イル)エタン-1,2-ジアミン塩酸塩 100mg を蒸留水 5ml に溶解し、炭酸カリウムを加え塩基性とした後、クロロホルムで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した後、濾液を減圧濃縮して脱塩体 40mg を得た。

(2) 実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 80.0mg、上記 (1) で得られた脱塩体 40mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 47.8mg を得た。

10

【1 1 6 0】

実施例 5 1 7

実施例 1 2 6 (2) で得られた化合物 80.0mg、参考例 1 8 9 で得られた化合物 50.0mg を原料として実施例 1 2 6 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 1 で示される化合物 41.2mg を得た。

【1 1 6 1】

実施例 5 1 8

(1) 実施例 2 6 2 (2) で得られた 4" 位の立体配置が S のアミン体 50mg をジクロロメタン 1ml に溶解し、氷冷下、無水酢酸 6.0 μ l、ピリジン 6.4 μ l を加え、氷冷にて 1.5 時間攪拌した。反応液に飽和食塩水、酢酸エチルを加え分液後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2）にて精製してアセチル体 40.6mg を得た。

20

(2) 上記 (1) で得られた化合物 40.6mg を原料として、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 1 1 で示される化合物 27.3mg を得た。

【1 1 6 2】

実施例 5 1 9

(1) 実施例 2 6 2 (2) で得られた 4" 位の立体配置が S のアミン体 30mg をクロロホルム 0.6ml に溶解し、2-(t-ブチルジメチルシリルオキシ)アセトアルデヒド 7.4 μ ml、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム 10.1mg、酢酸 1.8 μ l を加え、室温にて 3 時間攪拌した。反応液に飽和重曹水、酢酸エチルを加え分液後、有機層を飽和食塩水にて洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=40:10:0.2）にて精製してアルキルアミン体 23.1mg を得た。

30

(2) 上記 (1) で得られた化合物 23.1mg を原料として、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 1 1 で示される化合物 11.9mg を得た。

【1 1 6 3】

実施例 5 2 0

(1) 実施例 2 6 2 (2) で得られた 4" 位の立体配置が S のアミン体 50mg をジクロロメタン 1ml に溶解し、氷冷下、メタンスルホンクロライド 6.1 μ l、トリエチルアミン 14.7 μ l を加え、氷冷にて 3 時間、さらに室温にて 4 時間攪拌した。反応液に飽和食塩水、酢酸エチルを加え分液後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2）にて精製してスルホンアミド体 31.5mg を得た。

40

(2) 上記 (1) で得られた化合物 31.5mg を原料として、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 1 1 で示される化合物 17.0mg を得た。

【1 1 6 4】

実施例 5 2 1

(1) 実施例 2 6 2 (2) で得られた 4" 位の立体配置が S のアミン体 40mg をテトラヒドロフラン 0.4ml に溶解し、N,N'-カルボニルジイミダゾール 41.2mg を加え室温にて終夜攪拌

50

した後、さらに40℃にて3時間攪拌した。反応液に蒸留水、酢酸エチルを加え分液後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン=30:10:0.2）にて精製してイミダゾラミド体17.3mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物17.3mgをテトラヒドロフラン0.1mlに溶解し、特許文献（特開昭54-154724号公報）に記載の方法で得られた(1S)-1-(2-メトキシフェニル)エタンアミン7.4mgを加え、室温にて終夜攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン=30:10:0.2）にて精製してウレア体8.7mgを得た。

（3）上記（2）で得られた化合物11.0mgを原料として、実施例7（4）と同様の方法にて、表11で示される化合物7.5mgを得た。

【1165】

実施例522

（1）実施例262（2）で得られた4”位の立体配置がSのアミン体38mgと参考例191で得られた化合物33.9mgをジクロロメタン760μlに溶解し、4-ジメチルアミノピリジン16.6mg、ジシクロヘキシルカルボジイミド16.6mgを順次加え、室温にて12時間攪拌した。反応液に飽和重曹水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（NH型、クロロホルム）にて精製してアミド体44.7mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物44.7mgをジメチルホルムアミド894μlに溶解し、ベンゼンチオール16.9μl、炭酸カリウム22.9mgを順次加え、60℃にて30分間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え分液し、有機層を減圧濃縮して得られた残渣を分取薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール=10:1）にて精製して脱ニトロベンゼンスルホニル体20.1mgを得た。

（3）上記（2）で得られた化合物20.1mgとアセトアルデヒド4.87μlを原料として実施例7（2）、実施例7（4）と同様の方法にて表11で示される化合物9.8mgを得た。

【1166】

実施例523

実施例262（2）で得られた4”位の立体配置がSのアミン体15.5mgをジメチルホルムアミド100μlに溶解し、カルボニルジイミダゾール3.02mgを加え、室温にて1時間攪拌した後、N,N-ジメチルプロパン-1,3-ジアミン6μlを加え、室温にて1時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと蒸留水を加え分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して表11で示される化合物13.2mgを得た。

【1167】

実施例524

（1）実施例262（2）で得られた4”位の立体配置がSのアミン体60mgをクロロホルム1.2mlに溶解し、参考例190で得られた化合物30.9mg、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム20.2mg、酢酸3.6μlを加え、室温にて2時間攪拌した。反応液に飽和重曹水、クロロホルムを加え分液後、有機層を飽和食塩水にて洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=50:1:0.1）にて精製してアルキルアミン体68.4mgを得た。

（2）上記（1）で得られた化合物40mgを原料として、実施例522（2）と同様の方法にて、脱ニトロベンゼンスルホニル体20.0mgを得た。

（3）上記（2）で得られた化合物20.0mgをクロロホルム0.6mlに溶解し、氷冷下、アセトアルデヒド1.18μl、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム5.5mgを加えて氷冷にて2時間攪拌した後、室温にて1.5時間攪拌した。反応液に飽和重曹水、クロロホルムを加え分液後、有機層を飽和食塩水にて洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過

10

20

30

40

50

した後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：アセトン：トリエチルアミン=60:10:0.2）にて精製してモノ-N-エチル体14.0mgを得た。

（４）上記（３）で得られた化合物14.0mgを原料として、実施例７（４）と同様の方法にて、表１１で示される化合物7.0mgを得た。

【１１６８】

実施例５２５

実施例４６１（１）で得られた化合物20mgとN,N-ジメチルエチレンジアミン7.7μlを原料として実施例１２６（３）、実施例７（４）と同様の方法にて表１１で示される化合物10mgを得た。

10

【１１６９】

実施例５２６

実施例４６１（１）で得られた化合物20mgと参考例６７で得られた化合物12mgを原料として実施例１２６（３）、実施例７（４）と同様の方法にて表１１で示される化合物11mgを得た。

【１１７０】

実施例５２７

実施例４６１（１）で得られた化合物20mgと参考例６８で得られた化合物20mgを原料として実施例１２６（３）、実施例７（４）と同様の方法にて表１１で示される化合物15mgを得た。

20

【１１７１】

実施例５２８

実施例４６１（１）で得られた化合物20mgと参考例６９で得られた化合物15mgを原料として実施例１２６（３）、実施例７（４）と同様の方法にて表１１で示される化合物13mgを得た。

【１１７２】

実施例５２９

実施例４６１（１）で得られた化合物17mgと参考例７０で得られた化合物17mgを原料として実施例１２６（３）、実施例７（４）と同様の方法にて表１１で示される化合物13.5mgを得た。

30

【１１７３】

実施例５３０

実施例４６１（１）で得られた化合物20mgと参考例７１で得られた化合物11mgを原料として実施例１２６（３）、実施例７（４）と同様の方法にて表１１で示される化合物14mgを得た。

【１１７４】

実施例５３１

参考例１９２で得られた化合物31.1mgをジクロロメタン622μlに溶解し、デスマーチン試薬79.2mgを加え、室温にて1.5時間攪拌した。反応液に飽和重曹水：飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液（１：１）を加えて分液し、有機層を減圧濃縮してアルデヒド体を得た。得られたアルデヒド体と実施例２６２（２）で得られた4”位の立体配置がSのアミン体30mgを原料として実施例７（２）、実施例７（４）と同様の方法にて表１１で示される化合物2.3mgを得た。

40

【１１７５】

実施例５３２

実施例３６８（１）で得られた化合物30mgと参考例７１で得られた化合物45mgを原料として実施例１６８（２）と同様の方法にて表１１で示される化合物33mgを得た。

【１１７６】

実施例５３３

実施例３６８（１）で得られた化合物20mgと参考例７０で得られた化合物30mgを原料とし

50

て実施例 168 (2) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 20mg を得た。

【1177】

実施例 534

(1) 実施例 461 (1) で得られた化合物 60mg をジメチルホルムアミド 1.5ml に溶解し、参考例 193 で得られた化合物 20.1mg、*t*-ブトキシナトリウム 1.7mg を加え、室温にて 30 分間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水、酢酸エチルを加え分液後、有機層を蒸留水にて洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=30:10:0.2) にて精製してカーバメート体 51.1mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 51.1mg を原料として、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 11 で示される化合物 17.1mg を得た。

10

【1178】

実施例 535

実施例 412 (1) で得られた化合物 23mg と特許文献 (特開昭 54-154724 号公報) に記載の方法にて得られた (1*S*)-(2-メトキシフェニル)エタンアミン 24mg をエタノール 0.3ml に溶解し、ヨウ化カリウム 26mg を加え、マイクロ波照射下 120℃ で 30 分間攪拌した。反応液に酢酸エチルを加えて濾過した後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン:アセトン:28%アンモニア水=5:5:0.1) にて精製して表 11 で示される化合物 19mg を得た。

【1179】

20

実施例 536

実施例 412 (1) で得られた化合物 23mg と 2-メトキシベンジルアミン 18 μ l を原料として実施例 535 と同様の方法にて表 11 で示される化合物 10mg を得た。

【1180】

実施例 537

実施例 412 (1) で得られた化合物 21mg とベンジルアミン 16 μ l を原料として実施例 535 と同様の方法にて表 11 で示される化合物 17mg を得た。

【1181】

実施例 538

30

実施例 412 (1) で得られた化合物 25mg と (1*S*,2*S*)-チオミカミン 36mg を原料として実施例 535 と同様の方法にて表 11 で示される化合物 25mg を得た。

【1182】

実施例 539

実施例 412 (1) で得られた化合物 25mg と (1*S*,2*S*)-2-アミノ-1-(4-ニトロフェニル)プロパン-1,3-ジオール 36mg を原料として実施例 535 と同様の方法にて表 11 で示される化合物 23mg を得た。

【1183】

実施例 540

実施例 412 (1) で得られた化合物 25mg と (1*S*,2*S*)-2-アミノ-1-フェニル-1,3-プロパンジオール 29mg を原料として実施例 535 と同様の方法にて表 11 で示される化合物 26mg を得た。

40

【1184】

実施例 541

実施例 412 (1) で得られた化合物 25mg と (R)-2-アミノ-1-フェニルエタノール 23mg を原料として実施例 535 と同様の方法にて表 11 で示される化合物 25mg を得た。

【1185】

実施例 542

実施例 412 (1) で得られた化合物 25mg と L-フェニルアラニノール 26mg を原料として実施例 535 と同様の方法にて表 11 で示される化合物 23mg を得た。

50

【1186】

実施例543

(1) 実施例405(1)で得られた化合物20mgと参考例194で得られた化合物15mgをジメチルホルムアミド0.1mlに溶解し、90℃で4時間攪拌した。反応液に蒸留水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を蒸留水、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール=15:1)にて精製してウレア体22mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物22mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表11で示される化合物15mgを得た。

【1187】

実施例544

(1) 実施例405(1)で得られた化合物28.2mg、参考例195で得られた化合物12.7mgを原料として、実施例112(2)、実施例7(4)と同様の方法にて、表11で示される化合物3.6mgを得た。

【1188】

実施例545

実施例262(2)で得られた4”位の立体配置がSのアミン体60mg、参考例196で得られた化合物29.9mgを原料として、実施例524(1)、実施例522(2)、実施例524(3)、実施例7(4)と同様の方法にて、表11で示される化合物7.5mgを得た。

【1189】

実施例546

実施例412(1)で得られた化合物20mgと参考例54(2)で得られた化合物20mgを原料として、実施例535と同様の方法にて表11で示される化合物8mgを得た。

【1190】

実施例547

実施例412(1)で得られた化合物23mgと4-メトキシフェネチルアミン21μlを原料として実施例535と同様の方法にて表11で示される化合物20mgを得た。

【1191】

実施例548

実施例412(1)で得られた化合物22mgと2-メトキシフェネチルアミン21μlを原料として実施例535と同様の方法にて表11で示される化合物17mgを得た。

【1192】

実施例549

実施例412(1)で得られた化合物23mgとフェネチルアミン20μlを原料として実施例535と同様の方法にて表11で示される化合物19mgを得た。

【1193】

実施例550

実施例412(1)で得られた化合物29mgと参考例197で得られた化合物36mgを原料として実施例535と同様の方法にて表11で示される化合物30mgを得た。

【1194】

実施例551

実施例412(1)で得られた化合物28mgと参考例198で得られた化合物24mgを原料として実施例535と同様の方法にて表11で示される化合物31mgを得た。

【1195】

実施例552～558の合成

表12で規定したRをもつ、式(X)で示される化合物の製造法を以下に示す。

【1196】

10

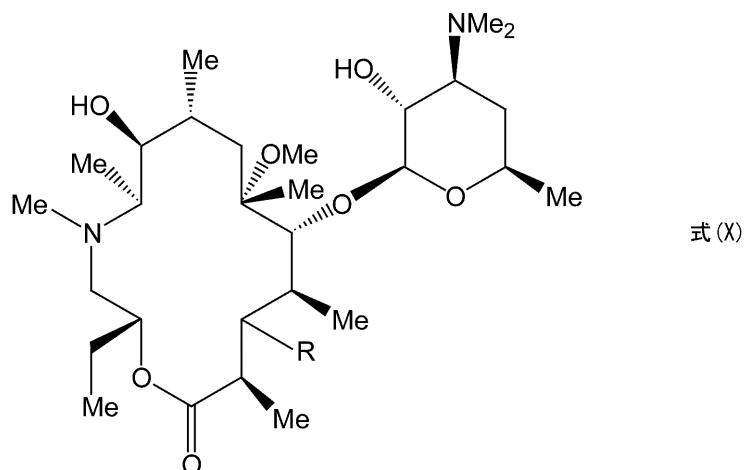
20

30

40

【表 1 2 - 1】

表12



実施例	R	ESI MS (M+H)	¹ H-NMR, CDCl ₃ , δ (ppm)
552		769	(300 MHz) : 0.84 – 0.91 (m, 9 H) 1.00 (d, J=6.9 Hz, 3 H) 1.09 – 1.15 (m, 4 H) 1.19 (d, J=6.0 Hz, 1 H) 1.26 (s, 3 H) 1.51 – 1.60 (m, 4 H) 1.92 (m, 1 H) 2.22 – 2.30 (m, 8 H) 2.38 (s, 3 H) 2.47 – 2.52 (m, 3 H) 2.83 (m, 1 H) 3.02 (d, J=14.1 Hz, 1 H) 3.18 – 3.23 (m, 5 H) 3.35 (m, 1 H) 3.61 (d, J=16.4 Hz, 1 H) 3.71 (d, J=16.4 Hz, 1 H) 3.82 – 3.93 (m, 10 H) 4.09 (m, 1 H) 4.72 (m, 1 H) 5.26 (m, 1 H) 6.62 (d, J=8.7 Hz, 1 H) 6.92 (d, J=8.7 Hz, 1 H)
553		704	(300 MHz) : 0.83 – 0.94 (m, 12 H) 1.08 (d, J=7.2 Hz, 3 H) 1.18 (d, J=6.0 Hz, 3 H) 1.22 – 1.30 (m, 4 H) 1.50 – 1.60 (m, 4 H) 1.91 (m, 1 H) 2.17 – 2.28 (m, 8 H) 2.38 (s, 3 H) 2.44 – 2.52 (m, 3 H) 2.83 (q, J=7.2 Hz, 1 H) 3.02 (d, J=14.4 Hz, 1 H) 3.15 – 3.27 (m, 6 H) 3.70 – 3.76 (m, 3 H) 3.81 (d, J=3.9 Hz, 1 H) 4.02 (m, 1 H) 4.69 (m, 1 H) 7.46 (d, J=8.1 Hz, 2 H), 7.62 (d, J=8.1 Hz, 2 H)
554		704 FAB MASS	(400 MHz) : 0.84 – 0.91 (m, 9 H) 0.96 (d, J=6.8 Hz, 3 H) 1.09 (d, J=7.3 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=6.1 Hz, 3 H) 1.23 – 1.27 (m, 4 H) 1.53 – 1.67 (m, 4 H) 1.91 (m, 1 H) 2.15 – 2.25 (m, 2 H) 2.32 (s, 6 H) 2.39 (s, 3 H) 2.42 – 2.50 (m, 3 H) 2.85 (t, J=7.8 Hz, 1 H) 3.04 (d, J=14.6 Hz, 1 H) 3.17 – 3.28 (m, 6 H) 3.70 – 3.78 (m, 3 H) 3.83 (d, J=4.1 Hz, 1 H) 4.07 (m, 1 H) 4.69 (m, 1 H) 5.36 (m, 1 H) 7.45 (dd, J=7.8 Hz, J=7.8 Hz, 1 H) 7.57 – 7.60 (m, 2 H) 7.64 (s, 1 H)

【 1 1 9 7】

【表 1 2 - 2】

555		757 FAB MASS	(400 MHz) : 0.84 - 0.90 (m, 9 H) 0.96 (d, J=6.8 Hz, 3 H) 1.06 (d, J=6.8 Hz, 3 H) 1.19 (d, J=6.1 Hz, 3 H) 1.23 - 1.27 (m, 4 H) 1.51 - 1.68 (m, 4 H) 1.89 - 1.92 (m, 1 H) 2.19 - 2.25 (m, 2 H) 2.30 (s, 6 H) 2.38 - 2.51 (m, 6 H) 2.81 - 2.87 (m, 1 H) 3.03 - 3.07 (m, 4 H) 3.17 - 3.23 (m, 5 H) 3.28 - 3.29 (m, 1 H) 3.81 - 3.84 (m, 4 H) 4.05 - 4.07 (m, 1 H) 4.70 (m, 1 H) 5.35 (m, 1 H) 7.55 (dd, J=7.7 Hz, J=7.7 Hz, 1 H) 7.62 (d, J=7.7 Hz, 1 H), 7.87 (d, J=7.7 Hz, 1 H) 7.93 (s, 1 H)
556		694	(300 MHz) : 0.82 - 0.95 (m, 12 H) 1.07 - 1.27 (m, 2 H) 1.11 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.14 (d, J=5.76 Hz, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.45 - 1.95 (m, 4 H) 2.10 - 2.39 (m, 3 H) 2.27 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.43 - 2.59 (m, 2 H) 2.76 - 2.89 (m, 1 H) 2.93 - 3.08 (m, 2 H) 3.14 (dd, J=2.75, 9.89 Hz, 2 H) 3.20 (s, 3 H) 3.60 (d, J=14.01 Hz, 1 H) 3.68 (d, J=14.01 Hz, 1 H) 4.64 - 4.79 (m, 1 H) 5.15 - 5.33 (m, 1 H) 6.69 - 6.75 (m, 2 H) 7.04 - 7.13 (m, 2 H)
557		694	(300 MHz) : 0.82 - 1.02 (m, 12 H) 1.05 - 1.27 (m, 2 H) 1.09 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.40 - 2.58 (m, 9 H) 2.33 (s, 6 H) 2.39 (s, 3 H) 2.72 - 2.86 (m, 1 H) 2.96 - 3.23 (m, 4 H) 3.20 (s, 3 H) 3.59 (s, 2 H) 3.87 (d, J=4.12 Hz, 1 H) 3.94 - 4.06 (m, 1 H) 4.63 - 4.78 (m, 1 H) 5.23 - 5.31 (m, 1 H) 6.55 - 6.61 (m, 1 H) 6.69 (d, J=7.42 Hz, 1 H) 6.71 (s, 1 H) 7.09 (t, J=7.69 Hz, 1 H)
558		694	(300 MHz) : 0.82 - 0.97 (m, 12 H) 1.16 - 1.27 (m, 2 H) 1.09 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.45 - 1.98 (m, 4 H) 2.11 - 2.58 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.75 - 2.87 (m, 1 H) 2.96 - 3.22 (m, 4 H) 3.21 (s, 3 H) 3.54 (d, J=15.39 Hz, 1 H) 3.59 (d, J=15.11 Hz, 1 H) 3.85 (d, J=4.12 Hz, 1 H) 3.96 (d, J=6.60 Hz, 1 H) 4.66 - 4.79 (m, 1 H) 5.12 - 5.31 (m, 1 H) 6.62 - 6.66 (m, 2 H) 7.12 (d, J=8.52 Hz, 2 H)

【 1 1 9 8 】

実施例 5 5 2

実施例 1 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、2,3,4-トリメトキシフェニル酢酸 47mg を原料として、実施例 1 1 2 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 1 2 で示される化合物 2.5mg を得た。

【 1 1 9 9 】

実施例 5 5 3

実施例 1 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、4-シアノフェニル酢酸 34mg を原料として、実施例 1 1 2 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 1 2 で示される化合物 2.6mg を得た。

【 1 2 0 0 】

実施例 5 5 4

(1) 実施例 1 1 2 (1) で得られた化合物 50mg をジクロロメタン 0.5ml に溶解し、3-シアノフェニル酢酸 68mg、ジシクロヘキシルカルボジイミド 86mg、4-ジメチルアミノピリジン 17.0mg を加え、室温にて 3 日間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液、クロロホルムを加え分液後、フェーズセパレーターにて濾過した。濾液を飽和重曹水で洗浄し、フェーズセパレーターにて濾過した後、濾液を減圧濃縮してメタノールを加え、室温にて 1 日間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=15:1:0.1) にて精製してアシル体 18.5mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 18.5mg を原料として、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 1 2 で示される化合物 8.0mg を得た。

【 1 2 0 1 】

実施例 5 5 5

実施例 1 1 2 (1) で得られた化合物 50mg、3-メタンсульфоニルフェニル酢酸 90mg を原

料として、実施例 5 5 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて、表 1 2 で示される化合物 15.4mg を得た。

【 1 2 0 2 】

实施例 556

(1) 実施例 112 (1) で得られた化合物 50mg をジメチルホルムアミド 1.0ml に溶解し、ジシクロヘキシルカルボジイミド 120mg、4-ジメチルアミノピリジン 26.1mg、2-(2-ニトロフェニル)酢酸 114mg を加え室温にて 3 日間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣にメタノール 5ml を加え、室温で 24 時間攪拌した後、反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28% アンモニア水 = 10:1:0.1）にて精製して縮合体 41mg を得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物41mgを原料として、実施例7(4)と同様の方法にて脱トリエチルシリル体15.4mgを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物15.4mgをメタノール-酢酸エチル(1:1) 2.0mlに溶解し、10%パラジウム-炭素3mgを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて4時間攪拌した。反応液をセライト濾過した後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1)にて精製して表12で示される化合物7.3mgを得た。

【 1 2 0 3 】

实施例 557

実施例 1 1 2 (1) で得られた化合物 50mg と 2-(3-ニトロフェニル)酢酸 114mg を原料として実施例 5 5 6 (1)、実施例 7 (4)、実施例 5 5 6 (3) と同様の方法にて表 1 2 で示される化合物 1.5mg を得た。

【 1 2 0 4 】

实施例 558

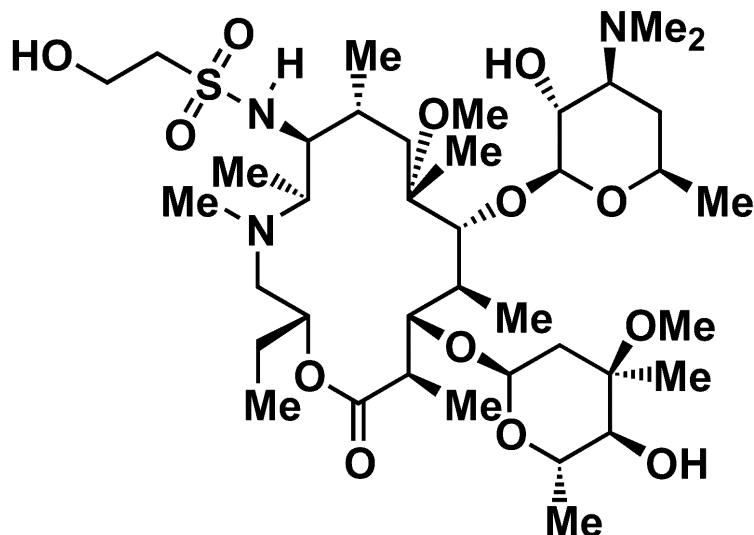
実施例 1 1 2 (1) で得られた化合物 50mg と 2-(4-ニトロフェニル)酢酸 114mg を原料として実施例 5 5 6 (1)、実施例 7 (4)、実施例 5 5 6 (3) と同様の方法にて表 1 2 で示される化合物 4.8mg を得た。

【 1 2 0 5 】

実施例 559 式 (Y) で示される化合物の合成

【 1 2 0 6 】

【化 3 1】



式 (Y)

【 1 2 0 7 】

実施例 195 で得られた化合物 8mg、塩化 2-クロロエタンスルホン 2 μ l を原料として実施例 196 と同様の方法にて標記化合物 8mg を得た。

【1208】

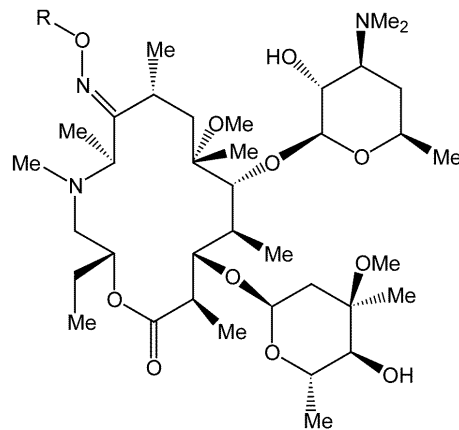
実施例560～562の合成

表13で規定したRをもつ、式(Z)で示される化合物の製造法を以下に示す。

【1209】

【表13】

表13



式(Z)

実施例	R	ESI MS (M+H)	¹ H-NMR, CDCl ₃ , δ (ppm)
560		786.5	(500 MHz): 0.87 (t, J=7.54 Hz, 3 H) 1.06 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.68 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.23 - 1.25 (m, 4 H) 1.28 (s, 3 H) 1.50 - 1.67 (m, 5 H) 1.73 (s, 3 H) 1.92 - 2.00 (m, 1 H) 2.01 - 2.08 (m, 1 H) 2.13 (s, 3 H) 2.15 (d, J=10.42 Hz, 1 H) 2.28 (s, 6 H) 2.38 (d, J=15.08 Hz, 1 H) 2.42 - 2.50 (m, 1 H) 2.51 - 2.59 (m, 1 H) 2.68 - 2.75 (m, 2 H) 3.00 (t, J=9.87 Hz, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.25 - 3.32 (m, 1 H) 3.32 (s, 3 H) 3.38 - 3.45 (m, 1 H) 3.47 - 3.57 (m, 2 H) 3.67 (d, J=6.86 Hz, 1 H) 3.88 (d, J=4.11 Hz, 1 H) 3.97 - 4.04 (m, 1 H) 4.41 (s, 2 H) 4.47 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.80 (br. s., 1 H) 4.84 (s, 1 H) 4.89 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 4.94 (s, 1 H)
561		746.4	(500 MHz): 0.88 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 1.06 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.07 - 1.09 (m, 3 H) 1.08 - 1.11 (m, 3 H) 1.16 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.19 - 1.30 (m, 10 H) 1.27 (s, 3 H) 1.48 - 1.68 (m, 5 H) 1.89 (d, J=14.81 Hz, 1 H) 1.99 - 2.06 (m, 1 H) 2.11 (s, 3 H) 2.14 (d, J=10.42 Hz, 1 H) 2.28 (s, 6 H) 2.38 (d, J=15.36 Hz, 1 H) 2.43 - 2.51 (m, 1 H) 2.54 - 2.61 (m, 1 H) 2.67 - 2.75 (m, 2 H) 2.97 - 3.03 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.28 - 3.32 (m, 1 H) 3.33 (s, 3 H) 3.38 - 3.45 (m, 1 H) 3.47 - 3.56 (m, 2 H) 3.67 (d, J=6.86 Hz, 1 H) 3.78 (s, 3 H) 3.86 - 3.91 (m, 1 H) 4.01 (d, 1 H) 4.47 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.79 - 4.86 (m, 1 H) 4.89 (d, J=4.66 Hz, 1 H)
562		776.4	(500 MHz): 0.87 (t, J=7.54 Hz, 3 H) 1.08 (dd, J=6.99, 3.70 Hz, 6 H) 1.12 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.18 - 1.27 (m, 1 H) 1.21 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.24 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.47 - 1.67 (m, 5 H) 1.99 - 2.06 (m, 1 H) 2.06 - 2.12 (m, 1 H) 2.14 - 2.17 (m, 1 H) 2.17 (s, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 - 2.40 (m, 1 H) 2.41 - 2.49 (m, 1 H) 2.49 - 2.56 (m, 1 H) 2.65 - 2.80 (m, 2 H) 3.00 (t, J=9.87 Hz, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.25 - 3.31 (m, 1 H) 3.32 (s, 3 H) 3.41 (s, 3 H) 3.41 - 3.46 (m, 1 H) 3.47 - 3.56 (m, 2 H) 3.67 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 3.85 - 3.90 (m, 1 H) 3.97 - 4.05 (m, 1 H) 4.46 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.78 (br. s., 1 H) 4.89 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 5.03 - 5.10 (m, 2 H)

【1210】

実施例560

実施例214で得られた化合物101mgをテトラヒドロフラン6mlに溶解し、3-クロロ-2-メチル-1-プロペン41μl、水酸化カリウム77.4mg、18-クラウン-6-エーテル365mgを加えて室温にて15分間攪拌した。反応液に飽和食塩水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール=9:1からクロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）、分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して表13で示される化合物33.8mgを得た。

【1211】

実施例561

実施例 2 1 4 で得られた化合物104mgをテトラヒドロフラン6mlに溶解し、ヨウ化メチル9 μ l、水酸化カリウム23.9mgを加えて室温にて40分間攪拌した。反応液に飽和食塩水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して表 1 3 で示される化合物62.8mgを得た。

【 1 2 1 2 】

実施例 5 6 2

実施例 2 1 4 で得られた化合物104mg、クロロメチルメチルエーテル32.4 μ lを原料として実施例 5 6 0 と同様の方法にて表 1 3 で示される化合物44.0mgを得た。

【 1 2 1 3 】

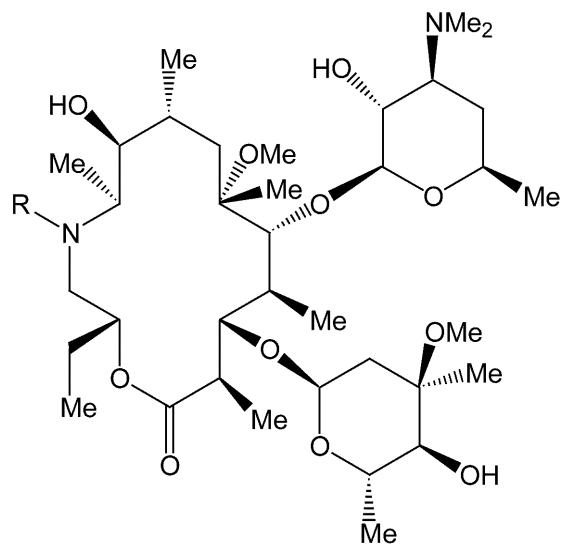
実施例 5 6 3 ～ 5 6 6 の合成

表 1 4 で規定した R をもつ、式 (AA) で示される化合物の製造法を以下に示す。

【 1 2 1 4 】

【表 1 4 - 1 】

表14

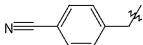
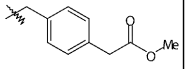
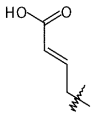


式 (AA)

実施例	R	ESI MS (M+H)	$^1\text{H-NMR}$, CDCl_3 , δ (ppm)
563		803.5	(600 MHz): 0.73 – 0.84 (m, 6 H) 0.88 (t, $J=7.34$ Hz, 3 H) 1.08 (d, $J=7.34$ Hz, 3 H) 1.10 – 1.14 (m, 1 H) 1.16 (d, $J=7.79$ Hz, 3 H) 1.19 – 1.23 (m, 6 H) 1.23 – 1.26 (m, 1 H) 1.28 (d, $J=5.96$ Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.44 – 1.50 (m, 1 H) 1.53 (dd, $J=15.13, 5.04$ Hz, 1 H) 1.63 – 1.86 (m, 3 H) 2.20 – 2.33 (m, 9 H) 2.35 (d, $J=15.13$ Hz, 1 H) 2.46 – 2.56 (m, 2 H) 2.76 – 2.85 (m, 1 H) 2.94 – 3.02 (m, 2 H) 3.17 – 3.25 (m, 2 H) 3.21 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.37 – 3.58 (m, 3 H) 3.69 (d, $J=7.79$ Hz, 1 H) 3.72 (s, 3 H) 4.01 – 4.08 (m, 1 H) 4.09 – 4.20 (m, 1 H) 4.36 (d, $J=6.88$ Hz, 1 H) 4.56 – 4.68 (m, 1 H) 4.93 (d, $J=4.58$ Hz, 1 H) 5.98 (d, $J=16.05$ Hz, 1 H) 6.87 – 6.95 (m, 1 H)

【 1 2 1 5 】

【表 1 4 - 2】

564		820.5	(600 MHz): 0.51 - 0.65 (m, 3 H) 0.74 - 0.84 (m, 6 H) 0.99 - 1.03 (m, 1 H) 1.04 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.17 (s, 3 H) 1.17 - 1.19 (m, 1 H) 1.23 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.26 (s, 3 H) 1.34 - 1.44 (m, 2 H) 1.48 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.56 - 1.66 (m, 2 H) 1.68 - 1.81 (m, 1 H) 2.07 - 2.18 (m, 1 H) 2.23 (s, 6 H) 2.25 - 2.27 (m, 1 H) 2.30 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.33 - 2.46 (m, 3 H) 2.73 - 2.80 (m, 1 H) 2.91 - 2.99 (m, 2 H) 3.09 - 3.15 (m, 1 H) 3.17 (s, 3 H) 3.26 (s, 3 H) 3.36 - 3.43 (m, 1 H) 3.49 - 3.55 (m, 1 H) 3.65 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.70 (s, 2 H) 3.96 - 4.02 (m, 1 H) 4.08 - 4.13 (m, 1 H) 4.30 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.58 - 4.67 (m, 1 H) 4.89 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 7.44 (d, J=8.25 Hz, 2 H) 7.53 (d, J=8.25 Hz, 2 H)
565		867.5	(600 MHz): 0.50 - 0.59 (m, 3 H) 0.71 - 0.77 (m, 3 H) 0.78 - 0.85 (m, 3 H) 0.94 - 1.00 (m, 1 H) 1.03 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=7.79 Hz, 3 H) 1.13 - 1.19 (m, 9 H) 1.20 - 1.31 (m, 2 H) 1.23 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.25 (s, 2 H) 1.41 - 1.82 (m, 3 H) 1.99 - 2.59 (m, 7 H) 2.23 (s, 6 H) 2.30 (d, J=15.13 Hz, 1 H) 2.74 - 2.83 (m, 1 H) 2.93 - 2.98 (m, 2 H) 3.09 - 3.15 (m, 1 H) 3.16 (s, 3 H) 3.26 (s, 3 H) 3.36 - 3.44 (m, 1 H) 3.45 - 3.52 (m, 1 H) 3.53 (s, 2 H) 3.61 (s, 3 H) 3.62 - 3.71 (m, 3 H) 3.95 - 4.03 (m, 1 H) 4.11 - 4.16 (m, 1 H) 4.30 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.56 - 4.62 (m, 1 H) 4.90 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 7.15 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 7.25 (d, J=7.79 Hz, 2 H)
566		789.5	(600 MHz): 0.75 - 0.83 (m, 6 H) 0.84 - 0.91 (m, 3 H) 1.03 - 1.13 (m, 6 H) 1.16 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.20 - 1.36 (m, 9 H) 1.45 - 2.17 (m, 5 H) 1.53 (dd, J=14.90, 4.81 Hz, 1 H) 2.23 - 2.43 (m, 4 H) 2.45 - 2.72 (m, 8 H) 2.77 - 2.91 (m, 2 H) 2.95 - 2.99 (m, 1 H) 3.00 (d, J=9.63 Hz, 1 H) 3.16 - 3.19 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.34 - 3.48 (m, 3 H) 3.45 - 3.55 (m, 1 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.99 - 4.07 (m, 1 H) 4.08 - 4.17 (m, 1 H) 4.41 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.56 - 4.69 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.93 - 6.04 (m, 1 H) 6.79 - 6.91 (m, 1 H)

10

20

【1 2 1 6】

実施例 5 6 3

(1) 実施例 2 4 5 (2) で得られた化合物 200mg をジメチルホルムアミド 3.8ml に溶解し、4-ブロモクロトン酸メチル 265 μ l、炭酸カリウム 260mg を加えて室温にて 16 時間攪拌した。反応液に蒸留水とジエチルエーテルを加えて分液した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルムからヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=10:10:0.2) にて精製して N-アルキル体 70mg を得た。

30

(2) 上記 (1) で得られた化合物 70mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 4 で示される化合物 49mg を得た。

【1 2 1 7】

実施例 5 6 4

実施例 2 4 5 (2) で得られた化合物 200mg、4-シアノベンジルプロミド 370mg を原料として実施例 5 6 3 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 4 で示される化合物 53mg を得た。

【1 2 1 8】

実施例 5 6 5

実施例 2 4 5 (2) で得られた化合物 200mg、4-(プロモメチル)フェニル酢酸メチルエステル 460mg を原料として実施例 5 6 3 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 4 で示される化合物 14mg を得た。

40

【1 2 1 9】

実施例 5 6 6

実施例 5 6 3 (2) で得られた化合物 27mg をテトラヒドロフラン-メタノール-蒸留水 (3:1:1) の混合溶媒 1ml に溶解し、水酸化リチウム一水和物 7mg を加えて室温にて 4 時間攪拌した。さらに水酸化リチウム一水和物 7mg を加えて室温にて 14 時間攪拌した。反応液にクロロホルム、飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=3:1:0.1) にて精製して表 1 4 で示される化

50

合物3mgを得た。

【1220】

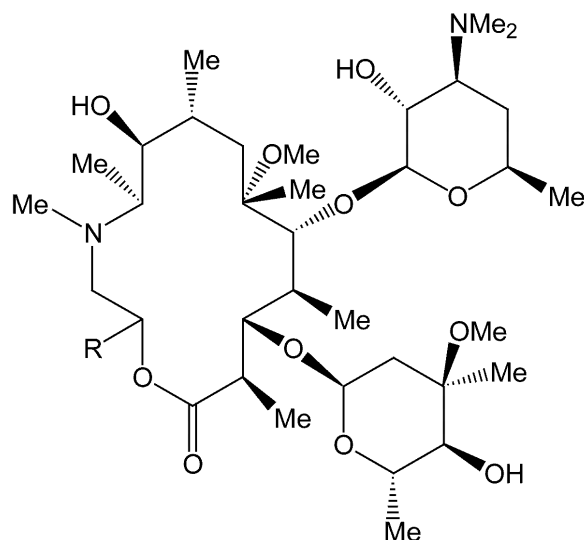
実施例567～663の合成

表15で規定したRをもつ、式(AB)で示される化合物の製造法を以下に示す。

【1221】

【表15-1】

表15



式(AB)

実施例	R	ESI MS (M+H)	¹ H-NMR, CDCl ₃ , δ (ppm)
567		852.6	(500 MHz): 0.78 – 0.86 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.11 – 1.25 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.27 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.22, 4.80 Hz, 1 H) 1.55 – 1.68 (m, 4 H) 1.79 – 1.89 (m, 2 H) 2.22 – 2.31 (m, 4 H) 2.27 (s, 6 H) 2.32 – 2.37 (m, 1 H) 2.35 (s, 3 H) 2.41 – 2.50 (m, 2 H) 2.74 – 2.83 (m, 1 H) 2.88 – 2.94 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.32 Hz, 1 H) 3.16 – 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.36 – 3.56 (m, 4 H) 3.69 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.98 – 4.08 (m, 1 H) 4.07 – 4.16 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.69 – 4.82 (m, 1 H) 4.91 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 6.36 (br. s., 1 H) 7.39 – 7.44 (m, 2 H) 7.45 – 7.50 (m, 1 H) 7.71 – 7.78 (m, 2 H)
568		853.6	(500 MHz): 0.79 – 0.87 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.11 – 1.26 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.27 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.50 – 1.57 (m, 1 H) 1.56 – 1.71 (m, 4 H) 1.76 – 1.93 (m, 2 H) 2.15 – 2.29 (m, 4 H) 2.27 (s, 6 H) 2.32 – 2.38 (m, 1 H) 2.35 (s, 3 H) 2.41 – 2.52 (m, 2 H) 2.76 – 2.83 (m, 1 H) 2.88 – 2.95 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.74 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.28, 7.27 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.26 – 3.29 (m, 1 H) 3.31 (s, 3 H) 3.34 – 3.51 (m, 2 H) 3.51 – 3.60 (m, 1 H) 3.69 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 4.00 – 4.07 (m, 1 H) 4.07 – 4.14 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.75 – 4.85 (m, 1 H) 4.90 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 6.58 (br. s., 1 H) 7.34 – 7.40 (m, 1 H) 8.07 – 8.15 (m, 1 H) 8.70 (dd, J=4.94, 1.65 Hz, 1 H) 8.97 (d, J=1.65 Hz, 1 H)
569		903.7	(500 MHz): 0.75 – 0.90 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.14 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.16 – 1.28 (m, 2 H) 1.20 – 1.23 (m, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.29, 4.59 Hz, 1 H) 1.58 – 1.91 (m, 6 H) 2.13 – 2.30 (m, 4 H) 2.28 (s, 6 H) 2.33 (d, J=15.29 Hz, 1 H) 2.38 (s, 3 H) 2.41 – 2.51 (m, 2 H) 2.73 – 2.85 (m, 1 H) 2.91 – 2.97 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.56 Hz, 1 H) 3.16 – 3.21 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.34 – 3.43 (m, 1 H) 3.43 – 3.49 (m, 1 H) 3.49 – 3.64 (m, 2 H) 3.69 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 4.01 – 4.08 (m, 1 H) 4.08 – 4.15 (m, 1 H) 4.39 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.74 – 4.85 (m, 1 H) 4.90 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.28 (br. s., 1 H) 7.46 (dd, J=8.79, 4.20 Hz, 1 H) 7.62 – 7.71 (m, 2 H) 8.13 – 8.19 (m, 1 H) 8.74 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 8.92 – 8.96 (m, 1 H)

【1222】

【表 1 5 - 2】

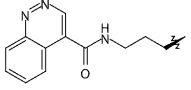
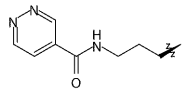
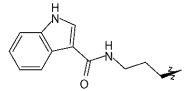
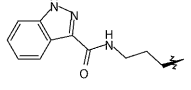
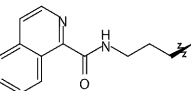
570		903.7 (500 MHz): 0.75 – 0.86 (m, 6 H) 1.07 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.10 – 1.26 (m, 2 H) 1.14 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.17 – 1.24 (m, 6 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.29, 4.59 Hz, 1 H) 1.60 – 1.74 (m, 4 H) 1.78 – 1.90 (m, 2 H) 2.16 – 2.30 (m, 4 H) 2.28 (s, 6 H) 2.33 (d, J=14.53 Hz, 1 H) 2.38 (s, 3 H) 2.42 – 2.52 (m, 2 H) 2.75 – 2.84 (m, 1 H) 2.91 – 3.03 (m, 2 H) 3.14 – 3.21 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.33 – 3.41 (m, 1 H) 3.43 – 3.49 (m, 1 H) 3.49 – 3.64 (m, 2 H) 3.69 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 3.98 – 4.08 (m, 1 H) 4.08 – 4.16 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.76 – 4.85 (m, 1 H) 4.89 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.22 – 6.37 (m, 1 H) 7.56 – 7.62 (m, 1 H) 7.83 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 8.04 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 8.15 (d, J=6.12 Hz, 1 H) 8.57 (d, J=6.12 Hz, 1 H) 9.26 (s, 1 H)
571		842.6 (500 MHz): 0.78 – 0.88 (m, 6 H) 1.09 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.15 – 1.26 (m, 2 H) 1.21 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.47 – 1.67 (m, 5 H) 1.72 – 1.83 (m, 1 H) 1.83 – 1.90 (m, 1 H) 2.13 – 2.31 (m, 4 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.35 – 2.39 (m, 1 H) 2.41 – 2.51 (m, 2 H) 2.75 – 2.83 (m, 1 H) 2.88 – 2.95 (m, 1 H) 2.97 – 3.03 (m, 1 H) 3.16 – 3.23 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.33 – 3.40 (m, 2 H) 3.43 – 3.52 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.00 – 4.08 (m, 1 H) 4.08 – 4.17 (m, 1 H) 4.40 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.73 – 4.84 (m, 1 H) 4.91 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.12 (br. s., 1 H) 6.64 (s, 1 H) 7.39 – 7.44 (m, 1 H) 7.94 (s, 1 H)
572		858.6 (500 MHz): 0.73 – 0.84 (m, 6 H) 1.11 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.19 – 1.31 (m, 2 H) 1.19 – 1.22 (m, 3 H) 1.22 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.53 – 1.57 (m, 1 H) 1.63 – 1.71 (m, 1 H) 1.79 – 1.87 (m, 1 H) 1.87 – 1.96 (m, 1 H) 2.04 – 2.12 (m, 1 H) 2.22 – 2.38 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.38 – 2.45 (m, 1 H) 2.46 – 2.54 (m, 1 H) 2.82 – 2.89 (m, 1 H) 2.94 – 3.05 (m, 2 H) 3.17 – 3.24 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.38 – 3.44 (m, 1 H) 3.44 – 3.51 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.78 – 3.87 (m, 1 H) 3.93 – 4.01 (m, 1 H) 4.02 – 4.10 (m, 1 H) 4.14 – 4.21 (m, 1 H) 4.39 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.67 – 4.75 (m, 1 H) 4.94 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 6.10 – 6.16 (m, 2 H) 6.58 – 6.63 (m, 2 H)
573		854.7 (500 MHz): 0.77 – 0.85 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.10 – 1.24 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.19 – 1.24 (m, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.29, 4.59 Hz, 1 H) 1.56 – 1.74 (m, 4 H) 1.79 – 1.89 (m, 2 H) 2.11 – 2.20 (m, 1 H) 2.22 – 2.37 (m, 4 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.39 – 2.51 (m, 2 H) 2.75 – 2.83 (m, 1 H) 2.90 – 2.96 (m, 1 H) 2.97 – 3.03 (m, 1 H) 3.17 – 3.21 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 – 3.54 (m, 4 H) 3.69 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 3.96 – 4.09 (m, 1 H) 4.11 – 4.17 (m, 1 H) 4.38 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.68 – 4.82 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 7.81 – 7.89 (m, 1 H) 8.51 – 8.55 (m, 1 H) 8.74 (d, J=3.06 Hz, 1 H) 9.37 – 9.41 (m, 1 H)

10

20

30

【表 1 5 - 3】

574		904.7	(500 MHz): 0.74 - 0.90 (m, 6 H) 1.07 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.09 - 1.26 (m, 2 H) 1.13 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.19 - 1.23 (m, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.27 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=14.91, 4.97 Hz, 1 H) 1.64 (d, J=13.00 Hz, 1 H) 1.66 - 1.95 (m, 5 H) 2.17 - 2.36 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.41 - 2.51 (m, 2 H) 2.74 - 2.84 (m, 1 H) 2.91 - 3.04 (m, 2 H) 3.16 - 3.20 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.31 - 3.40 (m, 1 H) 3.40 - 3.51 (m, 1 H) 3.54 - 3.66 (m, 2 H) 3.68 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 3.94 - 4.13 (m, 2 H) 4.38 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.76 - 4.85 (m, 1 H) 4.87 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.76 - 7.03 (m, 1 H) 7.82 (t, J=8.41 Hz, 1 H) 7.85 - 7.89 (m, 1 H) 8.32 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 8.52 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 9.27 (s, 1 H)
575		854.7	(500 MHz): 0.76 - 0.91 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.11 - 1.24 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.27 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.51 - 1.71 (m, 5 H) 1.74 - 1.83 (m, 1 H) 1.84 - 1.92 (m, 1 H) 2.17 - 2.29 (m, 4 H) 2.26 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.34 - 2.38 (m, 1 H) 2.39 - 2.47 (m, 1 H) 2.48 - 2.56 (m, 1 H) 2.75 - 2.82 (m, 1 H) 2.87 - 2.94 (m, 1 H) 3.00 (t, J=7.82 Hz, 1 H) 3.19 (dd, J=10.15, 7.40 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.26 - 3.38 (m, 1 H) 3.31 (s, 3 H) 3.40 - 3.52 (m, 2 H) 3.58 - 3.67 (m, 1 H) 3.69 (d, J=7.68 Hz, 1 H) 3.97 - 4.11 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.78 - 4.86 (m, 1 H) 4.89 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 7.41 (br. s., 1 H) 7.88 (dd, J=5.21, 2.19 Hz, 1 H) 9.29 - 9.35 (m, 1 H) 9.55 (s, 1 H)
576		891.7	(500 MHz): 0.72 - 0.85 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.11 - 1.26 (m, 2 H) 1.14 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.20 - 1.24 (m, 6 H) 1.29 - 1.34 (m, 6 H) 1.52 (dd, J=15.22, 4.80 Hz, 1 H) 1.58 - 1.72 (m, 4 H) 1.78 - 1.93 (m, 2 H) 2.15 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.35 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.40 - 2.51 (m, 2 H) 2.79 - 2.85 (m, 1 H) 2.95 (d, J=14.81 Hz, 1 H) 2.98 - 3.04 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.21 - 3.26 (m, 1 H) 3.30 (s, 3 H) 3.41 - 3.54 (m, 4 H) 3.69 (d, J=7.68 Hz, 1 H) 4.01 - 4.10 (m, 1 H) 4.11 - 4.21 (m, 1 H) 4.40 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.67 - 4.81 (m, 1 H) 4.91 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 6.46 - 6.57 (m, 1 H) 7.16 - 7.23 (m, 2 H) 7.36 - 7.41 (m, 1 H) 7.81 - 7.87 (m, 1 H) 8.00 - 8.11 (m, 1 H) 9.72 (br. s., 1 H)
577		892.7	(500 MHz): 0.75 - 0.85 (m, 6 H) 1.06 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.08 - 1.14 (m, 1 H) 1.13 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.15 - 1.26 (m, 1 H) 1.19 - 1.24 (m, 6 H) 1.29 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.51 (dd, J=15.08, 4.66 Hz, 1 H) 1.57 - 1.71 (m, 4 H) 1.78 - 1.94 (m, 2 H) 2.07 - 2.18 (m, 1 H) 2.23 - 2.37 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.32 (s, 3 H) 2.38 - 2.44 (m, 1 H) 2.44 - 2.53 (m, 1 H) 2.77 - 2.85 (m, 1 H) 2.87 - 2.95 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.19 Hz, 1 H) 3.16 - 3.26 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.39 - 3.57 (m, 4 H) 3.71 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.98 - 4.10 (m, 1 H) 4.12 - 4.21 (m, 1 H) 4.40 (d, J=6.86 Hz, 1 H) 4.72 - 4.82 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 7.20 - 7.28 (m, 1 H) 7.32 - 7.40 (m, 2 H) 7.46 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 8.37 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 11.30 (br. s., 1 H)
578		903.7	(500 MHz): 0.77 - 0.84 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.09 - 1.14 (m, 1 H) 1.16 (d, J=7.68 Hz, 3 H) 1.19 - 1.25 (m, 1 H) 1.19 - 1.23 (m, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.22, 4.80 Hz, 1 H) 1.60 - 1.77 (m, 4 H) 1.80 - 1.95 (m, 2 H) 2.13 - 2.21 (m, 1 H) 2.22 - 2.31 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.32 - 2.36 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.39 - 2.51 (m, 2 H) 2.74 - 2.84 (m, 1 H) 2.94 (d, J=14.54 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.46 Hz, 1 H) 3.16 - 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 - 3.43 (m, 1 H) 3.43 - 3.59 (m, 3 H) 3.69 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 3.99 - 4.09 (m, 1 H) 4.11 - 4.19 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.72 - 4.83 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 7.62 - 7.74 (m, 2 H) 7.79 (d, J=5.49 Hz, 1 H) 7.84 (d, J=7.68 Hz, 1 H) 8.22 - 8.29 (m, 1 H) 8.46 (d, J=5.48 Hz, 1 H) 9.58 (d, J=8.78 Hz, 1 H)

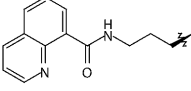
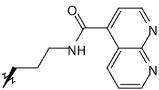
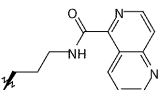
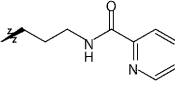
10

20

30

40

【表 1 5 - 4】

579		903.7	(500 MHz): 0.78 – 0.86 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.10 – 1.24 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.20 – 1.22 (m, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.36, 4.94 Hz, 1 H) 1.60 – 1.66 (m, 1 H) 1.67 – 1.87 (m, 4 H) 1.90 – 1.98 (m, 1 H) 2.13 – 2.20 (m, 1 H) 2.20 – 2.38 (m, 4 H) 2.28 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.39 – 2.52 (m, 2 H) 2.77 – 2.85 (m, 1 H) 2.90 – 2.97 (m, 1 H) 2.97 – 3.03 (m, 1 H) 3.20 (dd, J=10.15, 7.40 Hz, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.36 – 3.43 (m, 1 H) 3.43 – 3.51 (m, 1 H) 3.56 – 3.65 (m, 2 H) 3.69 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 3.96 – 4.09 (m, 1 H) 4.11 – 4.19 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.71 – 4.84 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 7.49 (dd, J=8.23, 4.39 Hz, 1 H) 7.63 – 7.70 (m, 1 H) 7.95 (dd, J=8.09, 1.51 Hz, 1 H) 8.27 (dd, J=8.36, 1.78 Hz, 1 H) 8.85 (dd, J=7.27, 1.51 Hz, 1 H) 8.92 (dd, J=4.11, 1.92 Hz, 1 H) 11.26 – 11.34 (m, 1 H)
580		904.7	(500 MHz): 0.77 – 0.87 (m, 6 H) 1.07 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.12 – 1.16 (m, 1 H) 1.18 – 1.24 (m, 1 H) 1.19 – 1.22 (m, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.27 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.22, 4.80 Hz, 1 H) 1.60 – 1.77 (m, 4 H) 1.80 – 1.95 (m, 2 H) 2.15 – 2.29 (m, 4 H) 2.27 (s, 6 H) 2.30 – 2.35 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.39 – 2.52 (m, 2 H) 2.71 – 2.80 (m, 1 H) 2.90 – 2.97 (m, 1 H) 2.97 – 3.03 (m, 1 H) 3.15 – 3.20 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.32 – 3.40 (m, 1 H) 3.41 – 3.50 (m, 1 H) 3.53 – 3.65 (m, 2 H) 3.68 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.98 – 4.07 (m, 1 H) 4.06 – 4.13 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.75 – 4.85 (m, 1 H) 4.88 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 6.85 – 7.03 (m, 1 H) 7.49 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 7.52 (dd, J=8.50, 4.11 Hz, 1 H) 8.68 (dd, J=8.50, 1.92 Hz, 1 H) 9.01 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 9.09 (dd, J=4.11, 1.92 Hz, 1 H)
581		904.6	(500 MHz): 0.78 – 0.86 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.12 – 1.23 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.20 – 1.23 (m, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.22, 5.07 Hz, 1 H) 1.59 – 1.77 (m, 4 H) 1.80 – 1.93 (m, 2 H) 2.16 – 2.21 (m, 1 H) 2.21 – 2.31 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.32 – 2.37 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.39 – 2.50 (m, 2 H) 2.76 – 2.84 (m, 1 H) 2.91 – 2.96 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.32 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.42, 7.40 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 – 3.42 (m, 1 H) 3.42 – 3.59 (m, 3 H) 3.69 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.99 – 4.09 (m, 1 H) 4.10 – 4.20 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.74 – 4.84 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 7.58 (dd, J=8.78, 4.11 Hz, 1 H) 8.06 (dd, J=5.62, 0.69 Hz, 1 H) 8.29 – 8.36 (m, 1 H) 8.68 (d, J=5.76 Hz, 1 H) 9.09 (dd, J=4.11, 1.65 Hz, 1 H) 9.94 – 10.03 (m, 1 H)
582		853.6	(500 MHz): 0.79 – 0.86 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.11 – 1.26 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.20 – 1.23 (m, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.29, 4.59 Hz, 1 H) 1.57 – 1.73 (m, 4 H) 1.78 – 1.92 (m, 2 H) 2.13 – 2.19 (m, 1 H) 2.22 – 2.32 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.33 – 2.38 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.40 – 2.51 (m, 2 H) 2.77 – 2.84 (m, 1 H) 2.90 – 2.96 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.56 Hz, 1 H) 3.16 – 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 – 3.42 (m, 1 H) 3.42 – 3.52 (m, 3 H) 3.70 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.00 – 4.09 (m, 1 H) 4.12 – 4.19 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.70 – 4.82 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 7.39 – 7.44 (m, 1 H) 7.81 – 7.86 (m, 1 H) 8.03 – 8.10 (m, 1 H) 8.18 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 8.55 (d, J=4.59 Hz, 1 H)

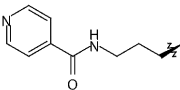
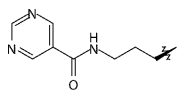
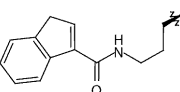
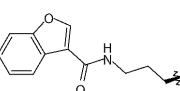
【 1 2 2 5 】

10

20

30

【表 1 5 - 5】

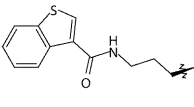
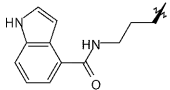
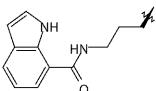
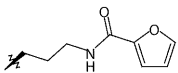
583		853.7	(500 MHz): 0.79 - 0.88 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.11 - 1.26 (m, 2 H) 1.15 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.22, 4.80 Hz, 1 H) 1.57 - 1.91 (m, 6 H) 2.16 - 2.31 (m, 4 H) 2.27 (s, 6 H) 2.33 - 2.40 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.40 - 2.54 (m, 2 H) 2.75 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 - 2.95 (m, 1 H) 3.01 (t, J=9.60 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.15, 7.13 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.33 - 3.40 (m, 1 H) 3.40 - 3.52 (m, 2 H) 3.53 - 3.63 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.99 - 4.07 (m, 1 H) 4.07 - 4.14 (m, 1 H) 4.40 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.75 - 4.87 (m, 1 H) 4.91 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 6.66 (br. s., 1 H) 7.63 (d, J=5.76 Hz, 2 H) 8.69 - 8.75 (m, 2 H)
584		854.6	(500 MHz): 0.79 - 0.90 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.12 - 1.26 (m, 2 H) 1.16 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.27 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.55 (dd, J=15.29, 4.97 Hz, 2 H) 1.59 - 1.72 (m, 4 H) 1.73 - 1.83 (m, 1 H) 1.84 - 1.96 (m, 1 H) 2.18 - 2.31 (m, 4 H) 2.27 (s, 6 H) 2.33 - 2.38 (m, 1 H) 2.35 (s, 3 H) 2.41 - 2.53 (m, 2 H) 2.76 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 - 2.95 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.37 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.32, 7.26 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.28 - 3.39 (m, 1 H) 3.31 (s, 3 H) 3.41 - 3.51 (m, 2 H) 3.54 - 3.64 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.64 Hz, 1 H) 3.98 - 4.09 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.79 - 4.87 (m, 1 H) 4.89 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 9.13 (s, 2 H) 9.29 (s, 1 H)
585		890.6	(500 MHz): 0.77 - 0.88 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.64 Hz, 3 H) 1.11 - 1.18 (m, 1 H) 1.16 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.19 - 1.26 (m, 1 H) 1.20 - 1.23 (m, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.29, 4.59 Hz, 1 H) 1.56 - 1.69 (m, 4 H) 1.72 - 1.90 (m, 2 H) 2.13 - 2.22 (m, 1 H) 2.22 - 2.32 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.32 - 2.38 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.41 - 2.52 (m, 2 H) 2.75 - 2.83 (m, 1 H) 2.89 - 2.96 (m, 1 H) 3.00 (t, J=8.60 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.32, 7.26 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 - 3.54 (m, 6 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 4.00 - 4.08 (m, 1 H) 4.10 - 4.17 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.72 - 4.83 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 6.16 (br. s., 1 H) 6.91 - 6.96 (m, 1 H) 7.22 - 7.27 (m, 1 H) 7.33 (t, J=7.64 Hz, 1 H) 7.47 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 7.88 (d, J=7.65 Hz, 1 H)
586		892.7	(500 MHz): 0.76 - 0.87 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.10 - 1.26 (m, 2 H) 1.17 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.20 - 1.23 (m, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.29, 4.97 Hz, 1 H) 1.56 - 1.75 (m, 4 H) 1.78 - 1.90 (m, 2 H) 2.13 - 2.21 (m, 1 H) 2.21 - 2.31 (m, 3 H) 2.27 (s, 6 H) 2.31 - 2.38 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.40 - 2.51 (m, 2 H) 2.75 - 2.84 (m, 1 H) 2.89 - 2.95 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.37 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.32, 7.26 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.34 - 3.42 (m, 1 H) 3.42 - 3.57 (m, 3 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 4.01 - 4.09 (m, 1 H) 4.09 - 4.19 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.73 - 4.83 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.65 - 6.78 (m, 1 H) 7.28 (t, J=7.45 Hz, 1 H) 7.37 - 7.42 (m, 1 H) 7.45 (s, 1 H) 7.50 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 7.66 (d, J=7.64 Hz, 1 H)

10

20

30

【表 1 5 - 6】

587		908.6	(500 MHz): 0.79 – 0.91 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.13 – 1.19 (m, 1 H) 1.15 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.19 – 1.27 (m, 1 H) 1.21 – 1.23 (m, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.29, 5.35 Hz, 1 H) 1.59 – 1.76 (m, 4 H) 1.80 – 1.94 (m, 2 H) 2.16 – 2.32 (m, 4 H) 2.28 (s, 6 H) 2.32 – 2.39 (m, 1 H) 2.37 (s, 3 H) 2.41 – 2.51 (m, 2 H) 2.70 – 2.84 (m, 1 H) 2.90 – 2.97 (m, 1 H) 3.01 (t, J=9.56 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=9.94, 7.65 Hz, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 – 3.41 (m, 1 H) 3.43 – 3.51 (m, 2 H) 3.51 – 3.61 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 3.99 – 4.09 (m, 1 H) 4.09 – 4.18 (m, 1 H) 4.40 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.72 – 4.86 (m, 1 H) 4.91 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.30 (br. s., 1 H) 7.34 – 7.42 (m, 1 H) 7.41 – 7.47 (m, 1 H) 7.85 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 7.87 (s, 1 H) 8.38 (d, J=7.65 Hz, 1 H)
588		891.7	(500 MHz): 0.76 – 0.88 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.10 – 1.18 (m, 1 H) 1.15 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.19 – 1.26 (m, 1 H) 1.20 – 1.23 (m, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.29, 4.97 Hz, 1 H) 1.60 – 1.78 (m, 4 H) 1.80 – 1.97 (m, 2 H) 2.12 – 2.21 (m, 1 H) 2.21 – 2.32 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.31 – 2.38 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.40 – 2.54 (m, 2 H) 2.77 – 2.83 (m, 1 H) 2.90 – 2.97 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.75 Hz, 1 H) 3.16 – 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.36 – 3.42 (m, 1 H) 3.43 – 3.49 (m, 1 H) 3.50 – 3.60 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 4.00 – 4.11 (m, 1 H) 4.11 – 4.20 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.72 – 4.83 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 6.25 – 6.37 (m, 1 H) 6.89 – 6.93 (m, 1 H) 7.21 (t, J=7.84 Hz, 1 H) 7.28 – 7.35 (m, 1 H) 7.49 (dd, J=11.85, 7.64 Hz, 2 H) 8.63 – 8.74 (m, 1 H)
589		891.7	(500 MHz): 0.79 – 0.88 (m, 6 H) 1.10 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.13 – 1.19 (m, 1 H) 1.16 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.20 – 1.27 (m, 1 H) 1.21 – 1.23 (m, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.29, 4.59 Hz, 1 H) 1.58 – 1.74 (m, 4 H) 1.78 – 1.91 (m, 2 H) 2.14 – 2.22 (m, 1 H) 2.22 – 2.32 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.32 – 2.39 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.42 – 2.53 (m, 2 H) 2.74 – 2.85 (m, 1 H) 2.87 – 2.96 (m, 1 H) 3.01 (t, J=9.94 Hz, 1 H) 3.21 (dd, J=10.32, 7.26 Hz, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 – 3.42 (m, 1 H) 3.43 – 3.52 (m, 2 H) 3.54 – 3.63 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 3.98 – 4.08 (m, 1 H) 4.09 – 4.18 (m, 1 H) 4.40 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.74 – 4.87 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.48 – 6.65 (m, 2 H) 7.10 (t, J=7.65 Hz, 1 H) 7.29 – 7.34 (m, 1 H) 7.38 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 7.79 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 10.28 – 10.38 (m, 1 H)
590		842.6	(500 MHz): 0.75 – 0.85 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.11 – 1.18 (m, 1 H) 1.16 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.19 – 1.25 (m, 1 H) 1.21 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.50 – 1.67 (m, 5 H) 1.71 – 1.78 (m, 1 H) 1.79 – 1.89 (m, 1 H) 2.11 – 2.21 (m, 1 H) 2.22 – 2.32 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.32 – 2.37 (m, 1 H) 2.35 (s, 3 H) 2.40 – 2.50 (m, 2 H) 2.76 – 2.83 (m, 1 H) 2.89 – 2.95 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.75 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.32, 7.26 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.36 – 3.50 (m, 4 H) 3.69 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 4.00 – 4.09 (m, 1 H) 4.10 – 4.17 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.64 – 4.81 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.38 – 6.45 (m, 1 H) 6.48 (dd, J=3.44, 1.53 Hz, 1 H) 7.07 – 7.11 (m, 1 H) 7.39 – 7.44 (m, 1 H)

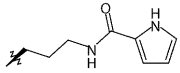
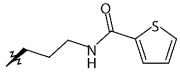
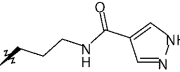
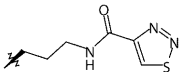
【 1 2 2 7 】

10

20

30

【表 1 5 - 7】

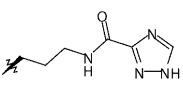
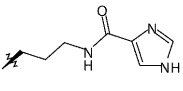
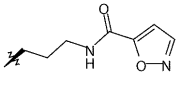
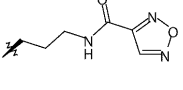
591		841.6	(500 MHz): 0.80 – 0.87 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.13 – 1.18 (m, 1 H) 1.16 (d, J=7.64 Hz, 3 H) 1.20 – 1.26 (m, 1 H) 1.22 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.51 – 1.73 (m, 5 H) 1.75 – 1.83 (m, 1 H) 1.83 – 1.91 (m, 1 H) 2.13 – 2.21 (m, 1 H) 2.23 – 2.31 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.35 – 2.40 (m, 1 H) 2.41 – 2.52 (m, 2 H) 2.76 – 2.84 (m, 1 H) 2.88 – 2.95 (m, 1 H) 3.01 (t, J=9.75 Hz, 1 H) 3.17 – 3.22 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.34 – 3.43 (m, 2 H) 3.43 – 3.52 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 4.00 – 4.09 (m, 1 H) 4.10 – 4.17 (m, 1 H) 4.40 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.72 – 4.85 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.01 – 6.16 (m, 1 H) 6.19 – 6.24 (m, 1 H) 6.54 – 6.60 (m, 1 H) 6.87 – 6.94 (m, 1 H) 9.38 (br. s., 1 H)
592		858.6	(500 MHz): 0.79–0.88 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.09 – 1.18 (m, 1 H) 1.16 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.18 – 1.25 (m, 1 H) 1.21 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.22, 4.80 Hz, 1 H) 1.57 – 1.66 (m, 4 H) 1.73 – 1.81 (m, 1 H) 1.82 – 1.92 (m, 1 H) 2.12 – 2.22 (m, 1 H) 2.22 – 2.31 (m, 3 H) 2.27 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.35 – 2.39 (m, 1 H) 2.40 – 2.50 (m, 2 H) 2.73 – 2.83 (m, 1 H) 2.91 (d, J=14.26 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.46 Hz, 1 H) 3.20 (dd, J=10.28, 7.27 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.34 – 3.43 (m, 2 H) 3.43 – 3.54 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.98 – 4.08 (m, 1 H) 4.09 – 4.17 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.72 – 4.85 (m, 1 H) 4.91 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 6.24 (br. s., 1 H) 7.05 (dd, J=4.94, 3.84 Hz, 1 H) 7.44 (dd, J=4.94, 1.10 Hz, 1 H) 7.50 (dd, J=3.70, 0.96 Hz, 1 H)
593		842.6	(500 MHz): 0.75 – 0.86 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.12 – 1.17 (m, 1 H) 1.14 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.20 – 1.23 (m, 3 H) 1.20 – 1.26 (m, 1 H) 1.22 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.22, 5.07 Hz, 1 H) 1.57 – 1.69 (m, 4 H) 1.73 – 1.90 (m, 2 H) 2.13 – 2.28 (m, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.31 – 2.35 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.41 – 2.46 (m, 1 H) 2.47 – 2.53 (m, 1 H) 2.79 – 2.84 (m, 1 H) 2.95 (d, J=13.71 Hz, 1 H) 3.01 (d, J=9.05 Hz, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.24 (dd, J=10.15, 7.40 Hz, 1 H) 3.30 (s, 3 H) 3.35 – 3.51 (m, 4 H) 3.68 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.01 – 4.09 (m, 1 H) 4.11 – 4.19 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.67 – 4.83 (m, 1 H) 4.90 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 6.71 – 6.77 (m, 1 H) 8.02 (s, 2 H)
594		860.6	(500 MHz): 0.78 – 0.84 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.10 – 1.14 (m, 1 H) 1.16 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.19 – 1.22 (m, 1 H) 1.21 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.27 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.22, 4.80 Hz, 1 H) 1.56 – 1.66 (m, 3 H) 1.67 – 1.80 (m, 2 H) 1.81 – 1.93 (m, 1 H) 2.11 – 2.20 (m, 1 H) 2.22 – 2.34 (m, 3 H) 2.27 (s, 6 H) 2.34 – 2.38 (m, 1 H) 2.35 (s, 3 H) 2.40 – 2.49 (m, 2 H) 2.75 – 2.83 (m, 1 H) 2.93 (d, J=15.63 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.46 Hz, 1 H) 3.13 – 3.20 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 – 3.41 (m, 1 H) 3.42 – 3.49 (m, 1 H) 3.50 – 3.59 (m, 2 H) 3.69 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 4.00 – 4.08 (m, 1 H) 4.10 – 4.17 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.70 – 4.84 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 7.58 – 7.64 (m, 1 H) 9.21 (s, 1 H)

10

20

30

【表 1 5 - 8】

595		843.7	(500 MHz): 0.77 – 0.85 (m, 6 H) 1.07 – 1.10 (m, 3 H) 1.10 – 1.17 (m, 1 H) 1.13 – 1.17 (m, 3 H) 1.18 – 1.25 (m, 1 H) 1.19 – 1.23 (m, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.47 – 1.71 (m, 5 H) 1.73 – 1.89 (m, 2 H) 2.09 – 2.20 (m, 1 H) 2.20 – 2.32 (m, 2 H) 2.28 (s, 6 H) 2.31 – 2.40 (m, 4 H) 2.41 – 2.52 (m, 2 H) 2.63 – 2.84 (m, 3 H) 2.87 – 2.95 (m, 1 H) 3.00 (d, J=9.32 Hz, 1 H) 3.17 – 3.22 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 – 3.50 (m, 2 H) 3.69 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 4.01 – 4.09 (m, 1 H) 4.10 – 4.18 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.66 – 4.79 (m, 1 H) 4.89 – 4.95 (m, 1 H)
596		842.6	(500 MHz): 0.73 – 0.89 (m, 6 H) 1.07 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.10 – 1.18 (m, 1 H) 1.15 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.18 – 1.25 (m, 1 H) 1.20 – 1.23 (m, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.22, 4.80 Hz, 1 H) 1.56 – 1.68 (m, 4 H) 1.74 – 1.90 (m, 2 H) 2.10 – 2.18 (m, 1 H) 2.19 – 2.29 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.34 – 2.37 (m, 1 H) 2.38 – 2.44 (m, 1 H) 2.44 – 2.52 (m, 1 H) 2.74 – 2.84 (m, 1 H) 2.91 (d, J=13.44 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.19 Hz, 1 H) 3.14 – 3.24 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 – 3.52 (m, 4 H) 3.69 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 4.00 – 4.08 (m, 1 H) 4.10 – 4.18 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.70 – 4.79 (m, 1 H) 4.91 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 7.19 (br. s., 1 H) 7.57 (s, 1 H) 7.60 (s, 1 H) 10.92 (br. s., 1 H)
597		843.6	(500 MHz): 0.77 – 0.86 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.12 – 1.17 (m, 1 H) 1.17 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.19 – 1.26 (m, 1 H) 1.22 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.50 – 1.75 (m, 5 H) 1.77 – 1.91 (m, 2 H) 2.14 – 2.23 (m, 1 H) 2.22 – 2.33 (m, 3 H) 2.29 (s, 6 H) 2.33 – 2.39 (m, 1 H) 2.36 (s, 3 H) 2.41 – 2.55 (m, 2 H) 2.77 – 2.85 (m, 1 H) 2.94 (d, J=15.67 Hz, 1 H) 3.01 (t, J=8.98 Hz, 1 H) 3.16 – 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.36 – 3.42 (m, 1 H) 3.42 – 3.54 (m, 3 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 4.00 – 4.09 (m, 1 H) 4.10 – 4.18 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.73 – 4.83 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.63 – 6.77 (m, 1 H) 6.90 (d, J=1.15 Hz, 1 H) 8.27 – 8.37 (m, 1 H)
598		844.5	(500 MHz): 0.80 – 0.92 (m, 6 H) 1.11 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.18 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.17 – 1.29 (m, 2 H) 1.21 – 1.24 (m, 3 H) 1.25 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 1.34 (s, 3 H) 1.51 – 1.81 (m, 6 H) 1.93 – 2.16 (m, 2 H) 2.30 – 2.42 (m, 12 H) 2.51 – 2.61 (m, 2 H) 2.79 – 2.88 (m, 2 H) 3.01 (d, J=9.56 Hz, 1 H) 3.21 – 3.27 (m, 1 H) 3.27 – 3.33 (m, 6 H) 3.33 – 3.43 (m, 2 H) 3.44 – 3.55 (m, 2 H) 3.72 – 3.75 (m, 1 H) 3.98 – 4.11 (m, 2 H) 4.36 – 4.41 (m, 1 H) 4.80 – 5.00 (m, 2 H)

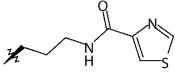
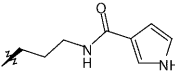
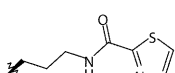
【 1 2 2 9】

10

20

30

【表 1 5 - 9】

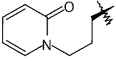
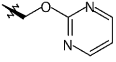
599		859.6	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 1.09 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.11 - 1.16 (m, 1 H) 1.16 (d, J=7.64 Hz, 3 H) 1.19 - 1.26 (m, 1 H) 1.20 - 1.24 (m, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.10, 4.78 Hz, 1 H) 1.56 - 1.75 (m, 4 H) 1.77 - 1.88 (m, 2 H) 2.10 - 2.20 (m, 1 H) 2.21 - 2.32 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.34 - 2.37 (m, 1 H) 2.35 (s, 3 H) 2.40 - 2.51 (m, 2 H) 2.75 - 2.85 (m, 1 H) 2.93 (d, J=13.38 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.75 Hz, 1 H) 3.17 - 3.23 (m, 1 H) 3.22 - 3.23 (m, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.34 - 3.52 (m, 4 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 4.01 - 4.09 (m, 1 H) 4.10 - 4.18 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.67 - 4.80 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 7.38 - 7.46 (m, 1 H) 8.15 (d, J=1.91 Hz, 1 H) 8.74 (d, J=2.29 Hz, 1 H)
600		841.6	(500 MHz): 0.73 - 0.91 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.12 - 1.19 (m, 1 H) 1.15 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.17 - 1.26 (m, 1 H) 1.19 - 1.25 (m, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.29, 4.59 Hz, 1 H) 1.56 - 1.68 (m, 4 H) 1.76 - 1.89 (m, 2 H) 2.11 - 2.21 (m, 1 H) 2.22 - 2.30 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.33 - 2.38 (m, 1 H) 2.39 - 2.51 (m, 2 H) 2.76 - 2.83 (m, 1 H) 2.91 (d, J=13.76 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.36 Hz, 1 H) 3.18 - 3.22 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.34 - 3.52 (m, 4 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 4.00 - 4.09 (m, 1 H) 4.11 - 4.19 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.70 - 4.81 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.09 (br. s., 1 H) 6.41 - 6.46 (m, 1 H) 6.70 - 6.76 (m, 1 H) 7.33 - 7.39 (m, 1 H) 9.12 (br. s., 1 H)
601		859.6	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 1.09 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.10 - 1.17 (m, 1 H) 1.16 (d, J=7.64 Hz, 3 H) 1.18 - 1.26 (m, 1 H) 1.21 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.10, 4.78 Hz, 1 H) 1.56 - 1.78 (m, 4 H) 1.79 - 1.89 (m, 2 H) 2.12 - 2.20 (m, 1 H) 2.22 - 2.32 (m, 3 H) 2.28 (s, 6 H) 2.33 - 2.38 (m, 1 H) 2.35 (s, 3 H) 2.40 - 2.50 (m, 2 H) 2.75 - 2.84 (m, 1 H) 2.93 (d, J=14.53 Hz, 1 H) 3.00 (t, J=9.56 Hz, 1 H) 3.16 - 3.22 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 - 3.42 (m, 1 H) 3.42 - 3.50 (m, 3 H) 3.69 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.99 - 4.09 (m, 1 H) 4.10 - 4.17 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.70 - 4.79 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 7.29 - 7.36 (m, 1 H) 7.55 (d, J=3.06 Hz, 1 H) 7.84 (d, J=3.06 Hz, 1 H)
602		812.4	(600 MHz): 0.75 - 0.84 (m, 6 H) 1.06 - 1.26 (m, 11 H) 1.10 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.61 - 1.67 (m, 1 H) 1.77 - 1.86 (m, 1 H) 2.02 - 2.49 (m, 9 H) 2.27 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.81 - 2.89 (m, 1 H) 2.94 - 3.03 (m, 2 H) 3.19 (dd, J=10.09, 7.34 Hz, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.34 - 3.41 (m, 1 H) 3.42 - 3.48 (m, 1 H) 3.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.86 - 3.96 (m, 2 H) 4.02 - 4.08 (m, 1 H) 4.14 - 4.20 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.75 - 4.78 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.14 (dd, J=13.30, 1.38 Hz, 1 H) 6.54 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 7.20 (d, J=6.42 Hz, 1 H) 7.29 - 7.32 (m, 1 H)

10

20

30

【表 1 5 - 1 0】

603		826.4	(600 MHz): 0.77 - 0.85 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.07 - 1.25 (m, 8 H) 1.14 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.27 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.50 - 1.86 (m, 7 H) 2.08 - 2.49 (m, 7 H) 2.28 (s, 6 H) 2.33 (s, 3 H) 2.75 - 2.81 (m, 1 H) 2.87 - 2.94 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.86 Hz, 1 H) 3.16 - 3.49 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.69 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 3.86 - 3.97 (m, 2 H) 4.01 - 4.07 (m, 1 H) 4.09 - 4.15 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.71 - 4.78 (m, 1 H) 4.91 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 6.10 - 6.16 (m, 1 H) 6.54 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 7.21 - 7.23 (m, 1 H) 7.27 - 7.31 (m, 1 H)
604		804.5	(500 MHz): 0.87 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 0.93 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.64 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.16 - 1.29 (m, 2 H) 1.21 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.26 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 1.48 - 1.56 (m, 1 H) 1.57 - 1.64 (m, 1 H) 1.87 - 1.96 (m, 1 H) 2.18 - 2.22 (m, 1 H) 2.21 - 2.41 (m, 13 H) 2.42 - 2.52 (m, 1 H) 2.54 - 2.62 (m, 1 H) 2.72 - 2.80 (m, 1 H) 2.91 - 3.03 (m, 2 H) 3.18 - 3.29 (m, 2 H) 3.24 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.43 - 3.52 (m, 1 H) 3.59 - 3.66 (m, 1 H) 3.70 (d, J=7.64 Hz, 1 H) 3.80 - 3.92 (m, 1 H) 3.95 - 4.07 (m, 2 H) 4.42 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.63 (q, J=15.80 Hz, 2 H) 4.79 - 4.86 (m, 1 H) 5.12 - 5.21 (m, 1 H)
605		799.5	(500 MHz): 0.79 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 0.82 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 0.90 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=7.64 Hz, 3 H) 1.08 - 1.30 (m, 8 H) 1.26 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.48 (dd, J=15.10, 4.78 Hz, 1 H) 1.64 (d, J=12.23 Hz, 1 H) 1.75 - 1.89 (m, 1 H) 2.19 - 2.50 (m, 7 H) 2.27 (s, 6 H) 2.39 (s, 3 H) 2.69 (m, 1 H) 2.97 (t, J=9.56 Hz, 1 H) 3.09 - 3.18 (m, 2 H) 3.18 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.27 - 3.34 (m, 1 H) 3.37 - 3.49 (m, 1 H) 3.66 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.70 - 3.81 (m, 1 H) 3.93 - 4.05 (m, 1 H) 4.06 - 4.14 (m, 1 H) 4.34 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.45 - 4.71 (m, 1 H) 4.81 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.95 - 5.16 (m, 1 H) 6.22 - 6.32 (m, 1 H) 7.65 - 7.75 (m, 1 H) 8.49 - 8.66 (m, 1 H)
606		799.5	(500 MHz): 0.79 - 0.89 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.64 Hz, 3 H) 1.10 - 1.15 (m, 1 H) 1.14 (d, J=7.64 Hz, 3 H) 1.19 - 1.26 (m, 7 H) 1.28 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.49 - 1.56 (m, 1 H) 1.59 - 1.76 (m, 1 H) 1.79 - 1.90 (m, 1 H) 2.17 - 2.37 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.40 (s, 3 H) 2.44 - 2.55 (m, 2 H) 2.75 - 2.83 (m, 1 H) 2.95 - 3.07 (m, 2 H) 3.16 - 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 - 3.52 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.99 - 4.08 (m, 1 H) 4.10 - 4.18 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.44 - 4.60 (m, 2 H) 4.91 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.07 - 5.19 (m, 1 H) 6.94 (t, J=4.78 Hz, 1 H) 8.50 (d, J=4.59 Hz, 2 H)

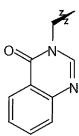
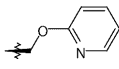
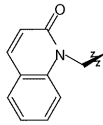
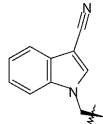
10

20

30

【 1 2 3 1】

【表 1 5 - 1 1】

607		849.5	(500 MHz): 0.78 – 0.88 (m, 9 H) 1.07 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.10 – 1.23 (m, 2 H) 1.16 (s, 3 H) 1.19 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.24 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.40 (dd, J=15.10, 4.78 Hz, 1 H) 1.60 – 1.65 (m, 1 H) 1.78 – 1.87 (m, 1 H) 2.15 – 2.34 (m, 4 H) 2.27 (s, 6 H) 2.35 – 2.52 (m, 3 H) 2.44 (s, 3 H) 2.71 – 2.79 (m, 1 H) 2.94 (t, J=9.56 Hz, 1 H) 3.08 – 3.17 (m, 2 H) 3.18 (s, 3 H) 3.24 (s, 3 H) 3.30 – 3.37 (m, 1 H) 3.39 – 3.47 (m, 1 H) 3.65 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.84 – 3.93 (m, 1 H) 3.95 – 4.02 (m, 1 H) 4.03 – 4.08 (m, 1 H) 4.34 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.50 – 4.66 (m, 1 H) 4.75 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.05 (br. s., 1 H) 7.45 – 7.52 (m, 1 H) 7.65 – 7.70 (m, 1 H) 7.71 – 7.76 (m, 1 H) 8.03 (s, 1 H) 8.27 (dd, J=8.03, 1.53 Hz, 1 H)
608		798.5	(500 MHz): 0.79 – 0.87 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.13 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.15 – 1.25 (m, 2 H) 1.20 – 1.22 (m, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.27 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.08, 4.94 Hz, 1 H) 1.59 – 1.68 (m, 1 H) 1.81 – 1.89 (m, 1 H) 2.22 – 2.37 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.42 – 2.51 (m, 2 H) 2.72 – 2.83 (m, 1 H) 2.93 – 3.04 (m, 2 H) 3.14 – 3.23 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 – 3.43 (m, 1 H) 3.42 – 3.52 (m, 1 H) 3.69 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.99 – 4.08 (m, 1 H) 4.11 – 4.17 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.39 – 4.51 (m, 2 H) 4.91 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 5.11 (br. s., 1 H) 6.65 – 6.71 (m, 1 H) 6.82 – 6.89 (m, 1 H) 7.49 – 7.58 (m, 1 H) 8.08 – 8.15 (m, 1 H)
609		848.6	(500 MHz): 0.22 – 0.49 (m, 3 H) 0.86 (t, J=6.58 Hz, 6 H) 0.99 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.11 – 1.25 (m, 2 H) 1.16 (s, 3 H) 1.19 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.40 (dd, J=15.22, 3.98 Hz, 1 H) 1.60 – 1.67 (m, 1 H) 1.82 – 1.91 (m, 1 H) 2.14 – 2.30 (m, 4 H) 2.27 (s, 6 H) 2.33 – 2.61 (m, 4 H) 2.48 (s, 3 H) 2.93 (t, J=9.60 Hz, 1 H) 3.01 (d, J=14.54 Hz, 1 H) 3.17 (s, 3 H) 3.18 – 3.25 (m, 2 H) 3.22 (s, 3 H) 3.40 – 3.47 (m, 1 H) 3.63 (d, J=7.68 Hz, 1 H) 3.91 – 4.01 (m, 2 H) 4.34 (d, J=6.86 Hz, 1 H) 4.45 – 4.58 (m, 1 H) 4.59 – 4.67 (m, 1 H) 4.69 – 4.73 (m, 1 H) 5.17 – 5.28 (m, 1 H) 6.65 (d, J=9.60 Hz, 1 H) 7.20 (t, J=7.40 Hz, 1 H) 7.47 – 7.52 (m, 1 H) 7.54 – 7.59 (m, 1 H) 7.64 (d, J=9.32 Hz, 2 H)
610		845.6	(500 MHz): 0.49 – 0.58 (m, 3 H) 0.84 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 0.87 (d, J=6.58 Hz, 3 H) 1.03 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.07 – 1.27 (m, 2 H) 1.18 (s, 3 H) 1.20 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.24 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.43 (dd, J=15.22, 4.80 Hz, 1 H) 1.60 – 1.67 (m, 1 H) 1.81 – 1.88 (m, 1 H) 2.17 – 2.31 (m, 4 H) 2.27 (s, 6 H) 2.31 – 2.39 (m, 1 H) 2.39 – 2.59 (m, 3 H) 2.45 (s, 3 H) 2.95 (t, J=9.74 Hz, 1 H) 3.09 – 3.14 (m, 1 H) 3.15 – 3.21 (m, 1 H) 3.17 (s, 3 H) 3.21 – 3.32 (m, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.37 – 3.50 (m, 1 H) 3.64 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.89 – 3.95 (m, 1 H) 3.95 – 4.02 (m, 1 H) 4.27 (dd, J=14.54, 3.02 Hz, 1 H) 4.34 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.43 – 4.53 (m, 1 H) 4.71 (d, J=4.11 Hz, 1 H) 4.97 – 5.12 (m, 1 H) 7.26 – 7.29 (m, 1 H) 7.31 – 7.36 (m, 1 H) 7.43 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 7.60 (s, 1 H) 7.72 (d, J=7.68 Hz, 1 H)

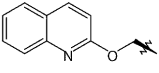
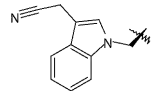
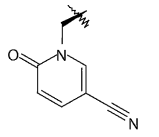
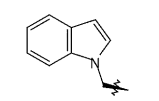
10

20

30

【 1 2 3 2】

【表 1 5 - 1 2】

611		848.6	(500 MHz): 0.84 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 0.87 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.10 - 1.25 (m, 2 H) 1.15 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.21 - 1.24 (m, 6 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=14.91, 4.97 Hz, 1 H) 1.62 - 1.69 (m, 1 H) 1.82 - 1.92 (m, 1 H) 2.22 - 2.40 (m, 5 H) 2.29 (s, 6 H) 2.42 (s, 3 H) 2.45 - 2.52 (m, 2 H) 2.76 - 2.87 (m, 1 H) 2.94 - 3.06 (m, 2 H) 3.16 - 3.24 (m, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.37 - 3.44 (m, 1 H) 3.45 - 3.52 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 3.99 - 4.09 (m, 1 H) 4.11 - 4.17 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.53 - 4.62 (m, 1 H) 4.70 (dd, J=11.09, 4.97 Hz, 1 H) 4.92 (d, J=5.35 Hz, 1 H) 5.12 - 5.25 (m, 1 H) 6.86 (d, J=9.17 Hz, 1 H) 7.37 (t, J=7.65 Hz, 1 H) 7.57 - 7.64 (m, 1 H) 7.70 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 7.82 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 7.97 (d, J=9.17 Hz, 1 H)
612		859.7	(500 MHz): 0.47 - 0.61 (m, 3 H) 0.84 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 0.86 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.03 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.12 (d, J=13.71 Hz, 1 H) 1.18 (s, 3 H) 1.18 - 1.23 (m, 1 H) 1.20 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.24 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.42 (dd, J=15.08, 4.39 Hz, 1 H) 1.56 - 1.73 (m, 1 H) 1.80 - 1.90 (m, 1 H) 2.14 - 2.39 (m, 6 H) 2.31 (s, 6 H) 2.45 (s, 3 H) 2.47 - 2.59 (m, 2 H) 2.90 - 2.99 (m, 1 H) 3.07 (d, J=13.71 Hz, 1 H) 3.18 (s, 3 H) 3.19 - 3.23 (m, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.40 - 3.48 (m, 2 H) 3.64 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.80 (s, 2 H) 3.91 - 4.01 (m, 2 H) 4.16 - 4.24 (m, 1 H) 4.35 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.39 - 4.50 (m, 1 H) 4.73 (d, J=4.94 Hz, 1 H) 5.01 - 5.11 (m, 1 H) 7.11 (s, 1 H) 7.13 - 7.18 (m, 1 H) 7.23 - 7.29 (m, 1 H) 7.37 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 7.54 (d, J=7.95 Hz, 1 H)
613		823.7	(500 MHz): 0.81 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 0.83 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 0.96 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.10 - 1.23 (m, 2 H) 1.18 - 1.22 (m, 6 H) 1.25 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.47 (dd, J=15.08, 4.94 Hz, 1 H) 1.58 - 1.67 (m, 1 H) 1.76 - 1.89 (m, 1 H) 2.19 - 2.32 (m, 4 H) 2.26 (s, 6 H) 2.31 - 2.38 (m, 1 H) 2.37 - 2.52 (m, 2 H) 2.40 (s, 3 H) 2.70 - 2.80 (m, 1 H) 2.91 - 3.01 (m, 1 H) 3.06 - 3.13 (m, 1 H) 3.14 - 3.19 (m, 1 H) 3.18 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.29 - 3.34 (m, 1 H) 3.39 - 3.50 (m, 1 H) 3.66 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 3.70 - 3.79 (m, 1 H) 3.96 - 4.04 (m, 1 H) 4.05 - 4.10 (m, 1 H) 4.35 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.51 - 4.72 (m, 1 H) 4.80 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 4.94 - 5.06 (m, 1 H) 6.54 (d, J=9.60 Hz, 1 H) 7.36 (dd, J=9.60, 2.47 Hz, 1 H) 7.83 - 7.90 (m, 1 H)
614		820.6	(500 MHz): 0.44 - 0.56 (m, 3 H) 0.84 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 0.86 (d, J=6.86 Hz, 3 H) 1.03 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.08 - 1.15 (m, 1 H) 1.17 (s, 3 H) 1.17 - 1.24 (m, 1 H) 1.20 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.24 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.41 (dd, J=15.36, 4.66 Hz, 1 H) 1.59 - 1.72 (m, 1 H) 1.79 - 1.89 (m, 1 H) 2.17 - 2.28 (m, 4 H) 2.28 (s, 6 H) 2.33 - 2.39 (m, 1 H) 2.39 - 2.46 (m, 1 H) 2.45 (s, 3 H) 2.48 - 2.57 (m, 2 H) 2.94 (t, J=9.60 Hz, 1 H) 3.06 (d, J=14.81 Hz, 1 H) 3.18 (s, 3 H) 3.18 (s, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.38 - 3.52 (m, 2 H) 3.64 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.92 - 3.96 (m, 1 H) 3.96 - 4.02 (m, 1 H) 4.21 (dd, J=14.54, 3.29 Hz, 1 H) 4.35 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.42 - 4.51 (m, 1 H) 4.73 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 5.06 - 5.13 (m, 1 H) 6.44 - 6.48 (m, 1 H) 7.04 - 7.10 (m, 2 H) 7.16 - 7.22 (m, 1 H) 7.32 - 7.38 (m, 1 H) 7.54 - 7.61 (m, 1 H)

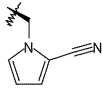
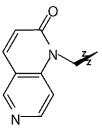
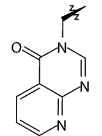
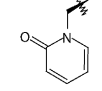
10

20

30

【 1 2 3 3 】

【表 1 5 - 1 3】

615		795.6	(500 MHz): 0.83 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 0.86 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 0.89 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.09 - 1.14 (m, 1 H) 1.19 - 1.25 (m, 1 H) 1.19 - 1.22 (m, 3 H) 1.21 (s, 3 H) 1.26 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.48 (dd, J=15.29, 4.97 Hz, 1 H) 1.61 - 1.67 (m, 1 H) 1.81 - 1.90 (m, 1 H) 2.22 - 2.35 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.41 (s, 3 H) 2.42 - 2.48 (m, 1 H) 2.48 - 2.55 (m, 1 H) 2.69 - 2.77 (m, 1 H) 2.98 (t, J=9.56 Hz, 1 H) 3.06 (d, J=13.76 Hz, 1 H) 3.16 - 3.20 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.40 - 3.50 (m, 2 H) 3.67 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.97 - 4.05 (m, 2 H) 4.17 - 4.23 (m, 1 H) 4.25 - 4.33 (m, 1 H) 4.37 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.82 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.97 - 5.08 (m, 1 H) 6.14 (dd, J=3.82, 2.68 Hz, 1 H) 6.76 (dd, J=3.82, 1.53 Hz, 1 H) 6.85 (dd, J=2.68, 1.53 Hz, 1 H)
616		849.6	(500 MHz): 0.85 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 0.87 (d, J=6.58 Hz, 3 H) 1.00 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.16 (s, 3 H) 1.17 - 1.20 (m, 1 H) 1.19 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.21 - 1.24 (m, 1 H) 1.22 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.41 (dd, J=15.50, 4.53 Hz, 1 H) 1.58 - 1.66 (m, 1 H) 1.82 - 1.95 (m, 1 H) 2.14 - 2.25 (m, 4 H) 2.26 (s, 6 H) 2.36 - 2.59 (m, 4 H) 2.47 (s, 3 H) 2.93 (t, J=8.91 Hz, 1 H) 3.04 (d, J=14.54 Hz, 1 H) 3.14 - 3.20 (m, 1 H) 3.17 (s, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.36 - 3.52 (m, 2 H) 3.63 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.87 - 4.06 (m, 2 H) 4.34 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.36 - 4.46 (m, 1 H) 4.51 - 4.60 (m, 1 H) 4.68 - 4.76 (m, 1 H) 5.13 - 5.24 (m, 1 H) 6.71 (d, J=9.32 Hz, 1 H) 7.44 - 7.50 (m, 1 H) 7.71 (d, J=9.32 Hz, 1 H) 8.60 (d, J=6.31 Hz, 1 H) 8.73 (s, 1 H)
617		850.6	(500 MHz): 0.81 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 0.83 - 0.89 (m, 3 H) 1.06 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.07 - 1.13 (m, 1 H) 1.16 (s, 3 H) 1.17 - 1.24 (m, 1 H) 1.19 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.39 (dd, J=15.08, 4.39 Hz, 1 H) 1.59 - 1.66 (m, 1 H) 1.78 - 1.88 (m, 1 H) 2.18 - 2.30 (m, 4 H) 2.26 (s, 6 H) 2.34 - 2.52 (m, 3 H) 2.44 (s, 3 H) 2.72 - 2.81 (m, 1 H) 2.93 (t, J=9.46 Hz, 1 H) 3.09 - 3.20 (m, 2 H) 3.17 (s, 3 H) 3.24 (s, 3 H) 3.26 - 3.38 (m, 1 H) 3.39 - 3.49 (m, 1 H) 3.64 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 3.88 - 4.05 (m, 3 H) 4.34 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.49 - 4.62 (m, 1 H) 4.73 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 4.96 - 5.11 (m, 1 H) 7.27 (m, 3 H) 7.44 (dd, J=7.95, 4.66 Hz, 1 H) 8.26 (s, 1 H) 8.60 (dd, J=7.95, 1.92 Hz, 1 H) 8.97 (dd, J=4.39, 1.92 Hz, 1 H)
618		798.4	(600 MHz): 0.78-0.84 (m, 6 H) 0.87 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 - 1.11 (m, 1 H) 1.16 - 1.25 (m, 1 H) 1.19 (s, 3 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.26 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.43 - 1.49 (m, 1 H) 1.61 - 1.67 (m, 1 H) 1.77 - 1.84 (m, 1 H) 2.22 - 2.49 (m, 7 H) 2.27 (s, 6 H) 2.41 (s, 3 H) 2.66 - 2.72 (m, 1 H) 2.97 (t, J=9.86 Hz, 1 H) 3.06 - 3.11 (m, 1 H) 3.14 - 3.20 (m, 1 H) 3.19 (s, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.40 - 3.49 (m, 2 H) 3.63 - 3.72 (m, 2 H) 3.97 - 4.04 (m, 1 H) 4.07 - 4.11 (m, 1 H) 4.35 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.60-4.69 (m, 1 H) 4.81 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.02 - 5.08 (m, 1 H) 6.09 - 6.14 (m, 1 H) 6.51 (d, J=8.71 Hz, 1 H) 7.26 - 7.31 (m, 2 H)

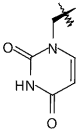
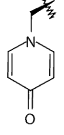
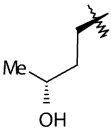
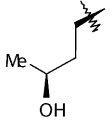
10

20

30

【 1 2 3 4 】

【表 1 5 - 1 4】

619		815.4	(600 MHz): 0.78 – 0.85 (m, 6 H) 1.03 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.06 – 1.24 (m, 8 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.27 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.50 (dd, J=15.13, 4.59 Hz, 1 H) 1.61 – 1.68 (m, 1 H) 1.79 – 1.87 (m, 1 H) 2.20 – 2.34 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.42 – 2.50 (m, 2 H) 2.70 – 2.76 (m, 1 H) 2.99 (t, J=9.86 Hz, 1 H) 3.06 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 3.15 – 3.22 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.40 – 3.48 (m, 2 H) 3.62 – 3.70 (m, 2 H) 3.99 – 4.05 (m, 1 H) 4.07 – 4.13 (m, 1 H) 4.23 – 4.30 (m, 1 H) 4.36 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.84 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.96 – 5.04 (m, 1 H) 5.66 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 7.22 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 8.64 (br. s., 1 H)
620		798.4	(600 MHz): 0.79 – 0.88 (m, 6 H) 0.94 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.08 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.08 (s, 8 H) 1.27 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.47 – 1.53 (m, 1 H) 1.58 – 1.68 (m, 1 H) 1.80 – 1.87 (m, 1 H) 2.17 – 2.53 (m, 7 H) 2.28 (s, 6 H) 2.39 (s, 3 H) 2.68 – 2.74 (m, 1 H) 2.98 (t, J=10.09 Hz, 1 H) 3.09 – 3.22 (m, 2 H) 3.20 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.31 – 3.48 (m, 2 H) 3.67 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.88 – 4.06 (m, 4 H) 4.36 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.82 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 4.91 – 5.01 (m, 1 H) 6.35 (d, J=7.79 Hz, 2 H) 7.24 – 7.27 (m, 2 H)
621		763.4	(500 MHz): 0.79 – 0.86 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.17 – 1.24 (m, 2 H) 1.19 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.35 – 1.43 (m, 1 H) 1.45 – 1.50 (m, 1 H) 1.54 (dd, J=15.29, 4.97 Hz, 1 H) 1.57 – 1.71 (m, 2 H) 1.73 – 1.81 (m, 1 H) 1.82 – 1.90 (m, 1 H) 2.11 – 2.21 (m, 1 H) 2.23 – 2.39 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.43 – 2.53 (m, 2 H) 2.76 – 2.84 (m, 1 H) 2.92 (d, J=14.91 Hz, 1 H) 3.01 (t, J=9.94 Hz, 1 H) 3.16 – 3.23 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 – 3.43 (m, 1 H) 3.44 – 3.51 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.76 – 3.84 (m, 1 H) 4.01 – 4.09 (m, 1 H) 4.14 (br. s., 1 H) 4.39 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.73 (br. s., 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
622		763.4	(500 MHz): 0.79 – 0.86 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.64 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.18 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.20 – 1.26 (m, 2 H) 1.22 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.22 – 1.24 (m, 3 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.37 – 1.45 (m, 1 H) 1.45 – 1.73 (m, 4 H) 1.78 – 1.95 (m, 2 H) 2.11 – 2.20 (m, 1 H) 2.22 – 2.36 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.41 – 2.53 (m, 2 H) 2.75 – 2.84 (m, 1 H) 2.93 (d, J=13.76 Hz, 1 H) 3.01 (t, J=9.75 Hz, 1 H) 3.16 – 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.36 – 3.43 (m, 1 H) 3.43 – 3.51 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.77 – 3.85 (m, 1 H) 4.00 – 4.09 (m, 1 H) 4.15 (br. s., 1 H) 4.39 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.75 (br. s., 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H)

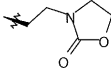
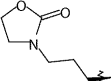
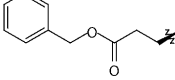
10

20

30

【 1 2 3 5】

【表 1 5 - 1 5】

623		790.4	(500 MHz): 0.84 - 0.92 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.15 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.19 - 1.29 (m, 2 H) 1.21 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.22 - 1.25 (m, 3 H) 1.28 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.08, 4.94 Hz, 1 H) 1.58 - 1.70 (m, 1 H) 1.86 - 1.97 (m, 1 H) 2.20 - 2.31 (m, 3 H) 2.28 - 2.31 (m, 6 H) 2.32 - 2.38 (m, 2 H) 2.34 - 2.35 (m, 3 H) 2.40 - 2.49 (m, 1 H) 2.50 - 2.58 (m, 1 H) 2.76 - 2.85 (m, 1 H) 2.89 (d, J=14.26 Hz, 1 H) 2.97 - 3.04 (m, 1 H) 3.20 (dd, J=10.15, 7.13 Hz, 1 H) 3.25 (s, 3 H) 3.26 - 3.30 (m, 1 H) 3.31 (s, 3 H) 3.44 - 3.50 (m, 1 H) 3.50 - 3.60 (m, 3 H) 3.68 - 3.77 (m, 2 H) 3.98 - 4.08 (m, 2 H) 4.22 - 4.29 (m, 2 H) 4.41 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.92 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 5.09 (br. s., 1 H)
624		804.4	(600 MHz): 0.77 - 0.85 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.19 - 1.26 (m, 2 H) 1.21 (d, J=5.96 Hz, 3 H) 1.22 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.52 (dd, J=15.36, 4.81 Hz, 1 H) 1.61 - 1.69 (m, 1 H) 1.72 - 1.88 (m, 2 H) 1.99 - 2.10 (m, 1 H) 2.10 - 2.21 (m, 1 H) 2.21 - 2.36 (m, 4 H) 2.28 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.41 - 2.50 (m, 2 H) 2.75 - 2.83 (m, 1 H) 2.96 - 3.04 (m, 2 H) 3.17 - 3.22 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.23 - 3.30 (m, 2 H) 3.31 (s, 3 H) 3.37 - 3.43 (m, 1 H) 3.43 - 3.49 (m, 1 H) 3.55 (t, J=8.25 Hz, 2 H) 3.69 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.00 - 4.07 (m, 1 H) 4.09 - 4.18 (m, 1 H) 4.28 - 4.35 (m, 2 H) 4.37 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.72 - 4.79 (m, 1 H) 4.90 (d, J=4.58 Hz, 1 H)
625		818.5	(500 MHz): 0.77 - 0.87 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.19 - 1.28 (m, 8 H) 1.28 (d, J=6.50 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.45 - 1.70 (m, 5 H) 1.72 - 1.81 (m, 1 H) 1.81 - 1.88 (m, 1 H) 2.09 - 2.19 (m, 1 H) 2.21 - 2.38 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.39 - 2.52 (m, 2 H) 2.75 - 2.83 (m, 1 H) 2.88 - 2.96 (m, 1 H) 2.98 - 3.04 (m, 1 H) 3.17 - 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.24 - 3.29 (m, 2 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 - 3.42 (m, 1 H) 3.43 - 3.49 (m, 1 H) 3.51 - 3.56 (m, 2 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.99 - 4.09 (m, 1 H) 4.10 - 4.18 (m, 1 H) 4.32 (t, J=8.03 Hz, 2 H) 4.39 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.74 (br. s., 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
626		853.4	(500 MHz): 0.77 - 0.84 (m, 6 H) 1.08 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=7.68 Hz, 3 H) 1.20 - 1.25 (m, 2 H) 1.22 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.53 (dd, J=15.22, 4.80 Hz, 1 H) 1.57 - 1.65 (m, 1 H) 1.77 - 1.92 (m, 2 H) 2.07 - 2.19 (m, 1 H) 2.20 - 2.53 (m, 18 H) 2.74 - 2.82 (m, 1 H) 2.93 - 3.03 (m, 2 H) 3.17 - 3.25 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.35 - 3.41 (m, 1 H) 3.42 - 3.50 (m, 1 H) 3.68 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.99 - 4.08 (m, 1 H) 4.09 - 4.17 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.66 - 4.76 (m, 1 H) 4.91 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 5.08 - 5.13 (m, 2 H) 7.28 - 7.39 (m, 5 H)

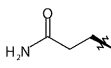
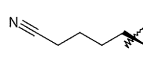
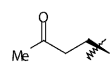
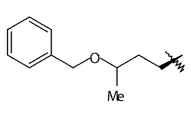
10

20

30

【 1 2 3 6】

【表 1 5 - 1 6】

627		762.5	(500 MHz): 0.79 – 0.87 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.20 – 1.25 (m, 2 H) 1.21 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.23 (s, 3 H) 1.28 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=15.08, 4.94 Hz, 1 H) 1.62 – 1.69 (m, 1 H) 1.80 – 1.96 (m, 2 H) 2.00 – 2.11 (m, 1 H) 2.12 – 2.34 (m, 7 H) 2.28 (s, 6 H) 2.38 (s, 3 H) 2.42 – 2.51 (m, 2 H) 2.74 – 2.84 (m, 1 H) 2.91 – 2.97 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.87 Hz, 1 H) 3.15 – 3.22 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.35 – 3.41 (m, 1 H) 3.42 – 3.50 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 3.99 – 4.08 (m, 1 H) 4.12 (br. s., 1 H) 4.39 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.79 (br. s., 1 H) 4.91 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 5.35 (br. s., 1 H) 5.66 (br. s., 1 H)
628		772.5	(500 MHz): 0.77–0.86 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.64 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.20 – 1.28 (m, 8 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.38 – 1.73 (m, 6 H) 1.75 – 1.91 (m, 2 H) 2.09 – 2.20 (m, 1 H) 2.22 – 2.41 (m, 16 H) 2.41 – 2.53 (m, 2 H) 2.75 – 2.85 (m, 1 H) 2.89 – 2.96 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.94 Hz, 1 H) 3.15 – 3.21 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.34 – 3.42 (m, 1 H) 3.43 – 3.50 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.99 – 4.09 (m, 1 H) 4.11 – 4.17 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.74 (br. s., 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H)
629		761.5	(500 MHz): 0.77 – 0.87 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.13 Hz, 3 H) 1.12 – 1.27 (m, 2 H) 1.17 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.20 – 1.25 (m, 6 H) 1.28 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.46 – 1.63 (m, 2 H) 1.77 – 1.91 (m, 2 H) 1.92 – 2.05 (m, 1 H) 2.13 (s, 3 H) 2.14 – 2.19 (m, 1 H) 2.20 – 2.40 (m, 13 H) 2.42 – 2.55 (m, 4 H) 2.76 – 2.83 (m, 1 H) 2.89 – 2.96 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.87 Hz, 1 H) 3.16 – 3.26 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.34 – 3.42 (m, 1 H) 3.43 – 3.51 (m, 1 H) 3.69 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.99 – 4.08 (m, 1 H) 4.10 – 4.18 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.65 – 4.76 (m, 1 H) 4.90 – 4.95 (m, 1 H)
630		853.6	(500 MHz): 0.76–0.84 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.11 – 1.25 (m, 8 H) 1.14 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.18 (dd, J=6.17, 3.43 Hz, 3 H) 1.28 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.33 – 1.45 (m, 1 H) 1.45 – 1.77 (m, 5 H) 1.79 – 1.91 (m, 1 H) 2.07 – 2.19 (m, 1 H) 2.20 – 2.38 (m, 13 H) 2.39 – 2.56 (m, 2 H) 2.75 – 2.83 (m, 1 H) 2.86 – 2.95 (m, 1 H) 2.97 – 3.03 (m, 1 H) 3.14 – 3.25 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.36 – 3.43 (m, 1 H) 3.44 – 3.55 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.95 Hz, 1 H) 3.98 – 4.09 (m, 1 H) 4.12 – 4.19 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.13 Hz, 1 H) 4.42 (d, J=11.79 Hz, 1 H) 4.56 (d, J=11.79 Hz, 1 H) 4.63 – 4.74 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.66 Hz, 1 H) 7.26 – 7.35 (m, 5 H)

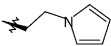
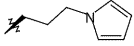
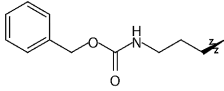
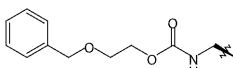
10

20

30

【 1 2 3 7】

【表 1 5 - 1 7】

631		784.6	(500 MHz): 0.73 – 0.84 (m, 6 H) 1.11 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.19 – 1.31 (m, 2 H) 1.19 – 1.22 (m, 3 H) 1.22 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.53 – 1.57 (m, 1 H) 1.63 – 1.71 (m, 1 H) 1.79 – 1.87 (m, 1 H) 1.87 – 1.96 (m, 1 H) 2.04 – 2.12 (m, 1 H) 2.22 – 2.38 (m, 5 H) 2.30 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.38 – 2.45 (m, 1 H) 2.46 – 2.54 (m, 1 H) 2.82 – 2.89 (m, 1 H) 2.94 – 3.05 (m, 2 H) 3.17 – 3.24 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.38 – 3.44 (m, 1 H) 3.44 – 3.51 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.78 – 3.87 (m, 1 H) 3.93 – 4.01 (m, 1 H) 4.02 – 4.10 (m, 1 H) 4.14 – 4.21 (m, 1 H) 4.39 (d, J=6.88 Hz, 1 H) 4.67 – 4.75 (m, 1 H) 4.94 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 6.10 – 6.16 (m, 2 H) 6.58 – 6.63 (m, 2 H)
632		798.6	(500 MHz): 0.77–0.84 (m, 6 H) 1.09 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.10 – 1.13 (m, 1 H) 1.16 (d, J=7.26 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.23 – 1.26 (m, 1 H) 1.23 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.39 – 1.48 (m, 1 H) 1.49 – 1.88 (m, 6 H) 2.04 – 2.15 (m, 1 H) 2.19 – 2.38 (m, 13 H) 2.39 – 2.44 (m, 1 H) 2.45 – 2.55 (m, 1 H) 2.75 – 2.84 (m, 1 H) 2.87 – 2.95 (m, 1 H) 2.97 – 3.04 (m, 1 H) 3.19 – 3.28 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.34 – 3.42 (m, 1 H) 3.43 – 3.52 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 3.81 – 3.95 (m, 2 H) 4.00 – 4.08 (m, 1 H) 4.11 – 4.17 (m, 1 H) 4.39 (d, J=7.26 Hz, 1 H) 4.69 – 4.78 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.20 Hz, 1 H) 6.00 – 6.21 (m, 2 H) 6.55 – 6.67 (m, 2 H)
633		882.5	(500 MHz): 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 1.09 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.12 – 1.25 (m, 2 H) 1.14 (d, J=7.65 Hz, 3 H) 1.20 – 1.23 (m, 6 H) 1.28 (d, J=6.12 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.41 – 1.59 (m, 4 H) 1.62 – 1.69 (m, 1 H) 1.71 – 1.81 (m, 1 H) 1.80 – 1.89 (m, 1 H) 2.07 – 2.18 (m, 1 H) 2.21 – 2.38 (m, 4 H) 2.29 (s, 6 H) 2.34 (s, 3 H) 2.39 – 2.52 (m, 2 H) 2.73 – 2.82 (m, 1 H) 2.86 – 2.95 (m, 1 H) 3.00 (t, J=9.94 Hz, 1 H) 3.13 – 3.26 (m, 3 H) 3.22 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.34 – 3.42 (m, 1 H) 3.43 – 3.50 (m, 1 H) 3.69 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 3.98 – 4.09 (m, 1 H) 4.09 – 4.17 (m, 1 H) 4.38 (d, J=7.65 Hz, 1 H) 4.71 (br. s., 1 H) 4.77 – 4.84 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.08 (s, 2 H) 7.27 – 7.39 (m, 5 H)
634		898 FAB MASS	(300 MHz) : 0.80 – 0.92 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.18 – 1.26 (m, 2 H) 1.23 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.54 (dd, J=5.00 Hz, 15.4Hz, 1 H) 1.53 – 1.58 (m, 1 H) 1.64 – 1.73 (m, 1 H) 1.85 – 1.94 (m, 1 H) 2.17 – 2.40 (m, 12 H) 2.41 – 2.54 (m, 2 H) 2.75 – 2.87 (m, 1 H) 2.91 – 3.06 (m, 2 H) 3.21 (dd, J=7.42 Hz, 10.2 Hz, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.26 – 3.56 (m, 4 H) 3.65 (t, J=4.40 Hz, 2 H) 3.70 (d, J=7.69 Hz, 1 H) 3.99 – 4.14 (m, 2 H) 4.20 – 4.29 (m, 1 H) 4.40 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.56 (s, 2 H) 4.76 – 4.88 (m, 1 H) 4.90 (d, J=4.40 Hz, 1 H) 7.25 – 7.39 (m, 5 H)

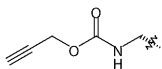
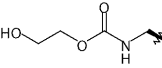
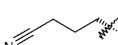
10

20

30

【 1 2 3 8 】

【表 1 5 - 1 8】

635		802.2	(300 MHz) : 0.80 – 0.92 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=6.04 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.55 (dd, J=4.95 Hz, 15.1 Hz, 1 H) 1.62 – 1.72 (m, 1 H) 1.81 – 1.94 (m, 1 H) 2.17 – 2.40 (m, 12 H) 2.41 – 2.54 (m, 3 H) 2.75 – 2.87 (m, 1 H) 2.94 – 3.07 (m, 2 H) 3.21 (dd, J=6.87 Hz, 10.2 Hz, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.26 – 3.58 (m, 7 H) 3.71 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 3.99 – 4.14 (m, 2 H) 4.41 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.56 (s, 2 H) 4.60 – 4.74 (m, 2 H) 4.77 – 4.94 (m, 2 H) 5.10 – 5.22 (m, 1 H)
636		808 FAB MASS	(300 MHz) : 0.81 – 0.94 (m, 6 H) 1.11 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.18 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=7.69 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.55 (dd, J=4.67 Hz, 15.1 Hz, 1 H) 1.62 – 1.71 (m, 1 H) 1.81 – 1.94 (m, 1 H) 2.17 – 2.58 (m, 14 H) 2.75 – 2.87 (m, 1 H) 2.94 – 3.07 (m, 2 H) 3.21 (dd, J=6.87 Hz, 10.2 Hz, 1 H) 3.24 (s, 3 H) 3.30 – 3.39 (m, 4 H) 3.40 – 3.62 (m, 2 H) 3.71 (d, J=7.69 Hz, 1 H) 3.75 – 3.85 (m, 3 H) 3.99 – 4.19 (m, 2 H) 4.21 – 4.30 (m, 2 H) 4.41 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.56 (s, 2 H) 4.80 – 4.94 (m, 2 H) 5.28 – 5.38 (m, 1 H)
637		758 FAB MASS	(300 MHz) : 0.90 – 1.05 (m, 6 H) 1.14 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.18 – 1.39 (m, 15 H) 1.55 (dd, J=4.67 Hz, 15.1 Hz, 1 H) 1.60 – 1.74 (m, 1 H) 1.75 – 1.87 (m, 1 H) 2.05 – 2.42 (m, 12 H) 2.45 – 2.56 (m, 1 H) 2.61 – 2.83 (m, 2 H) 2.98 – 3.08 (m, 1 H) 3.24 – 3.44 (m, 8 H) 3.47 – 3.60 (m, 1 H) 3.81 (d, J=6.87 Hz, 1 H) 3.97 – 4.09 (m, 1 H) 4.24 – 4.34 (m, 1 H) 4.53 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.62 (d, J=4.40 Hz, 1 H) 4.87 – 5.20 (m, 1 H)
638		791.2	(300 MHz) : 0.82 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 1.06 – 1.92 (m, 17 H) 1.10 (d, J=7.41 Hz, 3H) 1.16 (d, J=7.41 Hz, 3H) 1.23 (d, J=6.04 Hz, 3H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 2.08 – 2.52 (m, 6 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.73 – 2.87 (m, 1 H) 2.91 (d, J=14.55 Hz, 1 H) 3.01 (t, J=9.89 Hz, 1 H) 3.15 – 3.25 (m, 2 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.37 – 3.54 (m, 2 H) 3.64 (t, J=6.59 Hz, 2 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 4.00 – 4.19 (m, 2 H) 4.39 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.66 – 4.76 (m, 1 H) 4.94 (d, J=4.40 Hz, 1 H)

【 1 2 3 9】

10

20

30

【表 1 5 - 1 9】

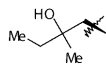
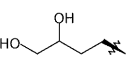
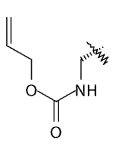
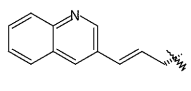
639		777.3	(300 MHz) : 0.83 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 1.08 – 1.92 (m, 15 H) 1.10 (d, J=7.41 Hz, 3H) 1.16 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=6.04 Hz, 3H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.59 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 2.07 – 2.53 (m, 6 H) 2.29 (s, 6 H) 2.37 (s, 3 H) 2.72 – 2.86 (m, 1 H) 2.91 (d, J=14.56 Hz, 1 H) 2.98 (t, J=9.88 Hz, 1 H) 3.16 – 3.27 (m, 2 H) 3.23 (s, 3 H) 3.33 (s, 3 H) 3.37 – 3.53 (m, 2 H) 3.63 (t, J=6.60 Hz, 2 H) 3.71 (d, J=8.24 Hz, 1 H) 4.00 – 4.20 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.42 Hz, 1 H) 4.65 – 4.80 (m, 1 H) 4.94 (d, J=4.40 Hz, 1 H)
640		858	(300 MHz) : 0.84 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.87 (d, J=4.67 Hz, 3 H) 1.03 – 1.36 (m, 2 H) 1.03 (d, J=7.42 Hz, 3H) 1.08 (d, J=7.14 Hz, 3H) 1.21 (s, 3 H) 1.22 (d, J=6.05 Hz, 3H) 1.28 (d, J=6.32 Hz, 3H) 1.33 (s, 3 H) 1.50 (dd, J=4.67, 14.84 Hz, 1 H) 1.59 – 1.75 (m, 1 H) 1.81 – 1.94 (m, 1 H) 2.22 – 2.36 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.43 (s, 3 H) 2.43 – 2.56 (m, 2 H) 2.65 – 2.86 (m, 2 H) 2.93 – 3.06 (m, 2 H) 3.16 – 3.24 (m, 2 H) 3.25 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.36 – 3.54 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 3.97 – 4.16 (m, 2 H) 4.38 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.90 (d, J=4.67 Hz, 1 H) 4.95 – 5.03 (m, 1 H) 6.30 – 6.43 (m, 1 H) 6.59 (d, J=15.93 Hz, 1 H), 7.49 – 7.56 (m, 1 H), 7.63 – 7.69 (m, 1 H), 7.78 (d, J=8.24 Hz, 1 H), 7.98 (d, J=1.93 Hz, 1 H), 8.06 (d, J=8.52 Hz, 1 H), 8.94 (d, J=2.20 Hz, 1 H)
641		803	ジアステレオマーの混合物、(300 MHz) : 0.85 (d, J=6.87 Hz, 6 H) 1.07 – 1.79 (m, 9 H) 1.09 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=6.04 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.29 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.80 – 2.57 (m, 6 H) 2.33 (s, 6 H) 2.42 (s, 3 H) 2.71 – 2.82 (m, 1 H) 2.96 – 3.09 (m, 2 H) 3.17 – 3.39 (m, 2 H) 3.25 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.42 – 3.54 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 3.98 – 4.19 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.92 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 5.01 – 5.11 (m, 1 H)
642		825	(300 MHz) : 0.79 – 2.70 (m, 18 H) 0.79 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 0.89 (d, J=6.87 Hz, 3 H) 1.04 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.22 (d, J=4.40 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.26 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.49 (s, 3 H) 2.35 (s, 9 H) 2.91 – 3.09 (m, 2 H) 3.20 – 3.33 (m, 2 H) 3.25 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.33 – 3.54 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.15 Hz, 1 H) 3.90 – 4.07 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.76 (d, J=3.85 Hz, 1 H) 4.95 – 5.07 (m, 1 H) 7.18 – 7.34 (m, 3 H) 7.46 (d, J=7.14 Hz, 2 H)

10

20

【 1 2 4 0】

【表 1 5 - 2 0】

643		777	ジアステレオマーの混合物、(300 MHz) : 0.80 – 0.94 (m, 9 H) 1.10 – 1.74 (m, 9 H) 1.10 (d, J=7.15 Hz, 3 H) 1.16 (s, 3 H) 1.17 (d, J=6.04 Hz, 3 H) 1.23 (d, J=5.77 Hz, 3 H) 1.24 (s, 3 H) 1.30 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.79 – 2.55 (m, 6 H) 2.31 (s, 6 H) 2.43 (s, 3 H) 2.71 – 2.84 (m, 1 H) 2.95 – 3.10 (m, 2 H) 3.18 – 3.42 (m, 2 H) 3.25 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.42 – 3.53 (m, 1 H) 3.71 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 4.00 – 4.21 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.93 (d, J=4.39 Hz, 1 H) 4.99 – 5.08 (m, 1 H)
644		749 FAB MASS	ジアステレオマーの混合物、(300 MHz) : 0.82 – 0.95 (m, 6 H) 1.07 – 1.49 (m, 22 H) 1.49 – 1.98 (m, 5 H) 2.14 – 2.62 (m, 16 H) 2.74 – 2.87 (m, 1 H) 2.87 – 3.11 (m, 3 H) 3.16 – 3.31 (m, 4 H) 3.33 and 3.34 (s, 3 H) 3.38 – 3.55 (m, 2 H) 3.59 – 3.69 and 3.81 – 3.93 (m, 1 H) 3.73 (d, J=7.69 Hz, 1 H) 3.99 – 4.17 (m, 2 H) 4.37 – 4.46 (m, 1 H)
645		779	(300 MHz) : 0.78 – 0.92 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.10 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.19 – 1.27 (m, 6 H) 1.29 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.37 – 1.98 (m, 6 H) 2.11 – 2.35 (m, 9 H) 2.38 (s, 3 H) 2.41 – 2.53 (m, 2 H) 2.74 – 2.86 (m, 1 H) 2.89 – 3.00 (m, 1 H) 3.02 (t, J= 10.2 Hz 1H) 3.17 – 3.30 (m, 5 H) 3.33 (s, 3 H) 3.36 – 3.54 (m, 2 H) 3.59 – 3.77 (m, 3 H) 4.00 – 4.18 (m, 2 H) 4.39 (d, J=7.42 Hz, 1 H) 4.70 – 4.83 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.4 Hz, 1 H)
646		804	(300 MHz) : 0.92 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.21 – 1.29 (m, 7 H) 1.32 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.55 (dd, J=4.95 Hz, 15.7 Hz 1 H) 1.59 – 1.67 (m, 1 H) 1.86 – 1.99 (m, 1 H) 2.11 – 2.20 (m, 1 H) 2.16 (s, 3 H) 2.23 – 2.41 (m, 9 H) 2.43 – 2.60 (m, 3 H) 2.91 – 3.10 (m, 3 H) 3.21 – 3.49 (m, 9 H) 3.50 – 3.66 (m, 2 H) 3.81 (d, J=6.04 Hz, 1 H) 4.03 – 4.15 (m, 1 H) 4.49 – 4.57 (m, 3 H) 4.60 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 5.15 – 5.31 (m, 2 H) 5.31 – 5.43 (m, 1 H) 5.81 – 5.96 (m, 1 H) 7.00 (br s, 1 H)
647		858.4	(400 MHz) : 0.94 – 1.04 (m, 6 H) 1.05 – 1.36 (m, 2 H) 1.13 (d, J=9.01 Hz, 3 H) 1.15 (s, 3 H) 1.19 (d, J=6.82 Hz, 3H) 1.24 (d, J=6.09 Hz, 3H) 1.28 (d, J=6.33 Hz, 3H) 1.31 (s, 3 H) 1.61 – 1.90 (m, 3 H) 2.05 – 3.04 (m, 11 H) 2.25 (s, 3 H) 2.31 (s, 6 H) 3.24 – 3.43 (m, 3 H) 3.30 (s, 3 H) 3.38 (s, 3 H) 3.47 – 3.60 (m, 2 H) 3.83 (d, J=6.82 Hz, 1 H) 3.97 – 4.08 (m, 1 H) 4.27 – 4.35 (m, 1 H) 4.47 – 4.57 (m, 1 H) 4.60 (d, J=4.62 Hz, 1 H) 5.02 – 5.29 (m, 1 H) 6.33 – 6.44 (m, 1 H) 6.62 (d, J=16.07 Hz, 1 H) 7.53(t, J=7.06 Hz, 1 H) 7.67 (dd, J=7.06, 8.52 Hz, 1 H) 7.78 (d, J=8.28 Hz, 1 H) 7.99 (s, 1 H) 8.06 (d, J=8.53 Hz, 1 H) 8.96 (d, J=1.46 Hz, 1 H)

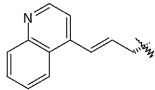
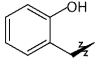
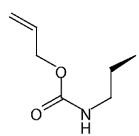
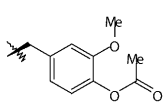
【 1 2 4 1】

10

20

30

【表 1 5 - 2 1】

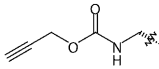
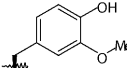
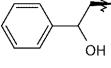
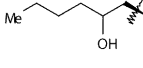
648		858.5	(300 MHz) : 0.94 – 1.06 (m, 6 H) 1.08 – 1.32 (m, 2 H) 1.10 (s, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.44 – 1.79 (m, 3 H) 2.03 – 3.04 (m, 11 H) 2.27 (s, 3 H) 2.33 (s, 6 H) 3.15 – 3.58 (m, 3 H) 3.27 (s, 3 H) 3.37 (s, 3 H) 3.82 (d, J=6.60 Hz, 1 H) 3.91 – 4.01 (m, 1 H) 4.27 – 4.35 (m, 1 H) 4.47 – 4.55 (m, 2 H) 6.37 – 6.49 (m, 1 H) 7.20 (d, J=15.38 Hz, 1 H) 7.42(d, J=4.67 Hz, 1 H) 7.53 – 7.60 (m, 1 H) 7.68 – 7.77 (m, 1 H) 8.10 (d, J=9.34 Hz, 2 H) 8.84 (d, J=4.67 Hz, 1 H)
649		797.4	(300 MHz) : 0.96 (d, J=6.87 Hz, 3 H) 1.03 (d, J=5.76 Hz, 3 H) 1.05 – 1.37 (m, 2 H) 1.13 (d, J=7.42 Hz, 6 H) 1.22 (s, 3 H) 1.23 (d, J=4.39 Hz, 3 H) 1.26 (d, J=6.31 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.50 (dd, J=4.95, 15.11 Hz, 1 H) 1.55 – 1.76 (m, 2 H) 1.95 – 2.06 (m, 1 H) 2.16 – 2.51 (m, 5 H) 2.28 (s, 6 H) 2.40 (s, 3 H) 2.75 – 2.92 (m, 3 H) 2.93 – 3.05 (m, 2 H) 3.17 – 3.38 (m, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.40 – 3.56 (m, 2 H) 3.77 (d, J=6.59 Hz, 1 H) 3.96 – 4.18 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.42 Hz, 1 H) 4.75 (d, J=4.40 Hz, 1 H) 4.84 – 4.93 (m, 1 H) 6.76 – 6.88 (m, 2 H) 7.06 – 7.16 (m, 2 H)
650		818	(300 MHz) : 0.79 – 0.90 (m, 6 H) 1.11 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.18 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.21 – 1.27 (m, 6 H) 1.29 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.55 (dd, J=4.95 Hz, 15.4 Hz, 1 H) 1.60 – 1.81 (m, 2 H) 1.81 – 1.96 (m, 1 H) 2.12 – 2.33 (m, 8 H) 2.33 – 2.41 (m, 4 H) 2.41 – 2.53 (m, 2 H) 2.75 – 2.87 (m, 1 H) 2.88 – 3.07 (m, 3 H) 3.17 – 3.29 (m, 5 H) 3.30 – 3.54 (m, 5 H) 3.71 (d, J=7.69 Hz, 1 H) 4.00 – 4.18 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.55 (d, J=5.77 Hz, 2 H) 4.79 – 4.90 (m, 1 H) 4.92 (d, J=4.40 Hz, 1 H) 5.07 (br s, 1 H) 5.18 – 5.35 (m, 2 H) 5.84 – 5.99 (m, 1 H)
651		869 FAB MASS	(300 MHz) : 0.73 – 0.89 (m, 9 H) 1.06 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.17 – 1.25 (m, 6 H) 1.27 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.47 (dd, J=4.67 Hz, 15.1 Hz, 1 H) 1.56 – 1.71 (m, 2 H) 1.77 – 1.92 (m, 1 H) 2.18 – 2.33 (m, 14 H) 2.39 – 2.54 (m, 4 H) 2.57 – 2.69 (m, 1 H) 2.77 (dd, J=3.57 Hz, 13.7 Hz, 1 H) 2.94 – 3.10 (m, 3 H) 3.15 – 3.25 (m, 5 H) 3.28 (s, 3 H) 3.39 – 3.53 (m, 2 H) 3.67 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 3.81 (s, 3 H) 3.96 – 4.09 (m, 2 H) 4.36 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.84 (d, J=4.40 Hz, 2 H) 4.90 – 5.02 (m, 1 H) 6.74 – 6.83 (m, 2 H) 6.92 (d, J=7.97 Hz, 1 H)

10

20

【 1 2 4 2 】

【表 1 5 - 2 2】

652		802.5	(300 MHz) : 0.92 (d, J=6.60 Hz, 3 H) 1.07 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.21 - 1.30 (m, 12 H) 1.33-1.41 (m, 4 H) 1.33 (s, 3 H) 1.56 - 1.75 (m, 2 H) 1.86 - 1.98 (m, 1 H) 2.11 - 2.19 (m, 3 H) 2.20 - 2.39 (m, 10 H) 2.42 (t, J=2.47 Hz, 3 H) 2.44 - 2.58 (m, 3 H) 2.94 - 3.07 (m, 2 H) 3.12 (t, J=9.89 Hz, 1 H) 3.24 - 3.48 (m, 9 H) 3.50 - 3.64 (m, 2 H) 3.81 (d, J=6.32 Hz, 1 H) 4.04 - 4.16 (m, 1 H) 4.52 (d, J=4.95 Hz, 1 H) 4.54 - 4.66 (m, 3 H) 5.30 - 5.42 (m, 1 H)
653		827 FAB MASS	(300 MHz) : 0.76 - 0.89 (m, 9 H) 1.07 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.17 - 1.25 (m, 6 H) 1.27 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.48 (dd, J=4.95 Hz, 15.4 Hz, 1 H) 1.60 - 1.92 (m, 3 H) 2.19 - 2.35 (m, 9 H) 2.38 - 2.54 (m, 5 H) 2.60 - 2.75 (m, 2 H) 2.91 - 3.04 (m, 3 H) 3.16 - 3.25 (m, 5 H) 3.29 (s, 3 H) 3.39 - 3.53 (m, 2 H) 3.68 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 3.87 (s, 3 H) 3.97 - 4.10 (m, 2 H) 4.37 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.85 (d, J=4.40 Hz, 2 H) 4.88 - 4.98 (m, 1 H) 6.65 - 6.72 (m, 2 H) 6.80 (d, J=7.97 Hz, 1 H)
654		811.4	ジアステレオマーの混合物、(400 MHz) : 0.82 - 0.91 (m, 6 H) 1.07 - 1.38 (m, 14 H) 1.25 (s, 3 H) 1.34 (s, 3 H) 1.57 (dd, J=4.88, 15.35 Hz, 1 H) 1.66 (d, J=12.66 Hz, 1 H) 1.73 - 2.02 (m, 3 H) 2.15 - 2.63 (m, 15 H) 2.29 (s, 6 H) 2.77 - 2.93 (m, 1 H) 2.94 - 3.12 (m, 2 H) 3.18 - 3.38 (m, 5 H) 3.34 (s, 3 H) 3.38 - 3.61 (m, 2 H) 3.73 (d, J=7.80 Hz, 1 H) 4.01 - 4.22 (m, 2 H) 4.37 - 4.45 (m, 1 H) 4.55 - 4.78 (m, 1 H) 4.75 - 5.22 (m, 1 H) 4.88 - 4.97 (m, 1 H) 7.24 - 7.37 (m, 5 H)
655		791.5	ジアステレオマーの混合物、(400 MHz) : 0.82 - 0.94 (m, 9 H) 1.08 - 1.98 (m, 27 H) 1.24 (s, 3 H) 1.55 (dd, J=4.87, 15.34 Hz, 1 H) 2.19 - 2.56 (m, 9 H) 2.29 (s, 6 H) 2.75 - 2.86 (m, 1 H) 2.87 - 3.08 (m, 3 H) 3.18 - 3.28 (m, 2 H) 3.26 (s, 3 H) 3.32 - 3.35 (m, 2 H) 3.37 - 3.58 (m, 2 H) 3.62 - 3.73 (m, 1 H) 3.73 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 4.00 - 4.17 (m, 2 H) 4.34 - 4.45 (m, 1 H) 4.88 - 5.11 (m, 2 H)
656		777.5	ジアステレオマーの混合物、(400 MHz) : 0.79 - 0.94 (m, 12 H) 1.09 - 1.35 (m, 14 H) 1.24 (s, 3 H) 1.32 (s, 3 H) 1.41 - 1.49 (m, 1 H) 1.55 (dd, J=4.87, 15.10 Hz, 1 H) 1.60 - 1.96 (m, 4 H) 2.19 - 2.54 (m, 9 H) 2.29 (s, 6 H) 2.74 - 2.86 (m, 1 H) 2.89 - 3.07 (m, 2 H) 3.14 - 3.27 (m, 2 H) 3.25 (s, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.38 - 3.55 (m, 2 H) 3.73 (d, J=7.80 Hz, 1 H) 4.00 - 4.19 (m, 2 H) 4.41 (d, J=7.06 Hz, 1 H) 4.87 - 5.10 (m, 2 H)

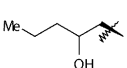
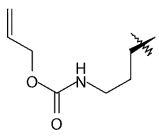
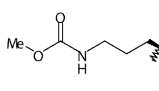
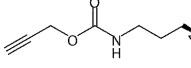
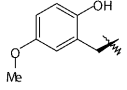
10

20

30

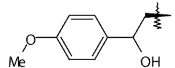
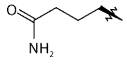
【 1 2 4 3 】

【表 1 5 - 2 3】

657		777.5	ジアステレオマーの混合物、(400 MHz) : 0.81 - 0.95 (m, 9 H) 1.08 - 1.97 (m, 25 H) 1.24 (s, 3 H) 1.55 (dd, J=4.39, 15.11 Hz, 1 H) 2.16 - 2.54 (m, 9 H) 2.29 (s, 6 H) 2.74 - 2.87 (m, 1 H) 2.89 - 3.08 (m, 2 H) 3.17 - 3.30 (m, 2 H) 3.26 (s, 3 H) 3.32 - 3.35 (m, 3 H) 3.38 - 3.56 (m, 2 H) 3.60 - 3.75 (m, 1 H) 3.72 (d, J=7.80 Hz, 1 H) 4.01 - 4.18 (m, 2 H) 4.37 - 4.46 (m, 1 H) 4.88 - 5.12. (m, 2 H)
658		832.6	(300 MHz) : 0.78 - 0.88 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.19 - 1.27 (m, 6 H) 1.29 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.43 - 1.91 (m, 4 H) 2.09 - 2.41 (m, 12 H) 2.41 - 2.53 (m, 2 H) 2.74 - 2.85 (m, 1 H) 2.87 - 2.97 (m, 1 H) 3.02 (t, J=9.34 Hz, 1 H) 3.13 - 3.26 (m, 5 H) 3.33 (s, 3 H) 3.36 - 3.53 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 4.00 - 4.18 (m, 2 H) 4.39 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.55 (d, J=5.77 Hz, 2 H) 4.68 - 4.83 (m, 2 H) 4.93 (d, J=4.40 Hz, 1 H) 5.17 - 5.35 (m, 2 H) 5.84 - 6.00 (m, 1 H)
659		806.6	(300 MHz) : 0.78 - 0.88 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.19 - 1.27 (m, 6 H) 1.29 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.42 - 1.91 (m, 4 H) 2.09 - 2.41 (m, 12 H) 2.41 - 2.54 (m, 2 H) 2.74 - 2.85 (m, 1 H) 2.87 - 2.97 (m, 1 H) 3.02 (t, J=9.34 Hz, 1 H) 3.13 - 3.27 (m, 5 H) 3.33 (s, 3 H) 3.36 - 3.53 (m, 2 H) 3.66 (s, 3 H) 3.70 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 4.00 - 4.19 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.68 - 4.79 (m, 2 H) 4.93 (d, J=4.40 Hz, 1 H)
660		830.3	(300 MHz) : 0.77 - 0.90 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.16 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.20 - 1.27 (m, 6 H) 1.29 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.43 - 1.94 (m, 4 H) 2.10 - 2.41 (m, 12 H) 2.41 - 2.56 (m, 3 H) 2.74 - 2.85 (m, 1 H) 2.89 - 3.06 (m, 2 H) 3.15 - 3.28 (m, 5 H) 3.33 (s, 3 H) 3.36 - 3.54 (m, 2 H) 3.70 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 4.00 - 4.18 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.63 - 4.78 (m, 3 H) 4.88 (br s, 1 H) 4.93 (d, J=4.12 Hz, 1 H)
661		827.4	(300 MHz) : 0.91 - 1.06 (m, 6 H) 1.06 - 1.17 (m, 6 H) 1.19 - 1.31 (m, 9 H) 1.34 (s, 3 H) 1.51 (dd, J=4.67 Hz, 15.4 Hz, 1 H) 1.64 - 1.73 (m, 1 H) 1.94 - 2.09 (m, 1 H) 2.13 - 2.35 (m, 9 H) 2.35 - 2.54 (m, 6 H) 2.75 - 2.90 (m, 2 H) 2.93 - 3.04 (m, 2 H) 3.18 - 3.36 (m, 8 H) 3.43 - 3.56 (m, 2 H) 3.67 - 3.81 (m, 4 H) 3.96 - 4.07 (m, 1 H) 4.09 - 4.18 (m, 1 H) 4.41 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.76 (d, J=4.40 Hz, 2 H) 4.87 - 4.97 (m, 1 H) 6.61 - 6.75 (m, 2 H) 6.81 (d, J=8.52 Hz, 1 H)

【 1 2 4 4 】

【表 1 5 - 2 4】

662		841.5	(300 MHz) : 0.79 - 0.92 (m, 6 H) 1.12 (d, J=7.14 Hz, 3 H) 1.15 - 1.27 (m, 11 H) 1.29 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.56 (dd, J=4.95 Hz, 15.1 Hz, 1 H) 1.62 - 1.71 (m, 1 H) 1.80 - 1.98 (m, 2 H) 2.12 - 2.38 (m, 9 H) 2.38 - 2.60 (m, 5 H) 2.77 - 2.88 (m, 1 H) 2.97 - 3.09 (m, 2 H) 3.17 - 3.27 (m, 4 H) 3.27 - 3.37 (m, 4 H) 3.39 - 3.54 (m, 2 H) 3.72 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 3.80 (s, 3 H) 4.00 - 4.18 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.66 - 4.82 (m, 2 H) 4.91 (d, J=4.67 Hz, 1 H) 6.87 (d, J=8.79 Hz, 1 H) 7.23 (d, J=8.79 Hz, 1 H)
663		776 FAB MASS	(300 MHz) : 0.77 - 0.88 (m, 6 H) 1.10 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.17 (d, J=7.42 Hz, 3 H) 1.19 - 1.27 (m, 8 H) 1.29 (d, J=6.32 Hz, 3 H) 1.33 (s, 3 H) 1.49 - 1.92 (m, 4 H) 2.11 - 2.33 (m, 10 H) 2.33 - 2.41 (m, 4 H) 2.41 - 2.54 (m, 2 H) 2.75 - 2.86 (m, 1 H) 2.87 - 2.97 (m, 1 H) 3.02 (t, J=9.07 Hz, 1 H) 3.17 - 3.26 (m, 5 H) 3.33 (s, 3 H) 3.35 - 3.54 (m, 2 H) 3.71 (d, J=7.97 Hz, 1 H) 4.00 - 4.17 (m, 2 H) 4.40 (d, J=7.14 Hz, 1 H) 4.71 - 4.84 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.40 Hz, 1 H) 5.31 (br s, 1 H) 5.55 (br s, 1 H)

【 1 2 4 5 】

実施例 5 6 7

(1) 実施例 1 で得られた化合物 9.0g、参考例 1 6 0 で得られた化合物 8.52g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 2.57g を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 2.25g をメタノール 110ml に溶解し、5%パラジウム-炭

10

20

30

40

50

素51mgを加えて1気圧の水素雰囲気下、室温にて18時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣に飽和重曹水と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮してアミン体1.92gを得た。

(3) 上記(2)で得られた化合物100mgをクロロホルム-メタノール(2:1)の混合溶媒3mlに溶解し、安息香酸34mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩53mg、4-ジメチルアミノピリジン11.2mgを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=90:10:0.2から30:10:0.2)にて精製してアミド体96.9mgを得た。

(4) 上記(3)で得られた化合物93.9mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表15で示される化合物66.4mgを得た。

10

【1246】

実施例568

実施例567(2)で得られた化合物100mg、ニコチン酸34mgを原料として実施例567(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表15で示される化合物41.5mgを得た。

【1247】

実施例569

実施例567(2)で得られた化合物100mg、キノリン-5-カルボン酸47.6mgを原料として実施例567(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表15で示される化合物25.7mgを得た。

【1248】

実施例570

実施例567(2)で得られた化合物100mg、イソキノリン-5-カルボン酸47.6mgを原料として実施例567(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表15で示される化合物31.1mgを得た。

20

【1249】

実施例571

(1) 実施例567(2)で得られた化合物100mgをクロロホルム2mlに溶解し、3-フランカルボン酸30.8mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩53mg、4-ジメチルアミノピリジン11.2mgを加えて室温にて18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=90:10:0.2から30:10:0.2)にて精製してアミド体91.2mgを得た。

30

(2) 上記(1)で得られた化合物89.5mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表15で示される化合物38.4mgを得た。

【1250】

実施例572

実施例567(2)で得られた化合物100mg、3-テノイル酸35.2mgを原料として実施例571(1)、実施例7(4)と同様の方法にて表15で示される化合物39.5mgを得た。

【1251】

実施例573

実施例567(2)で得られた化合物100mg、ピラジンカルボン酸34.1mgを原料として実施例571(1)、実施例7(4)と同様の方法にて表15で示される化合物52.4mgを得た。

40

【1252】

実施例574

実施例567(2)で得られた化合物100mg、シノリン-4-カルボン酸47.9mgを原料として実施例571(1)、実施例7(4)と同様の方法にて表15で示される化合物24.9mgを得た。

【1253】

実施例575

実施例567(2)で得られた化合物100mg、4-ピリダジンカルボン酸34.1mgを原料とし

50

て実施例 571 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 42.9mg を得た。

【1254】

実施例 576

実施例 567 (2) で得られた化合物 101mg、インドール-3-カルボン酸 44.9mg を原料として実施例 571 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 33.1mg を得た。

【1255】

実施例 577

実施例 567 (2) で得られた化合物 100mg、インダゾール-3-カルボン酸 44.6mg を原料として実施例 571 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 39.2mg を得た。

10

【1256】

実施例 578

(1) 実施例 567 (2) で得られた化合物 88mg をクロロホルム 2ml に溶解し、1-イソキノリンカルボン酸 41.9mg、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 46.2mg を加えて室温にて 18 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=100:10:0.2 から 30:10:0.2) にて精製してアミド体 55.9mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 53.9mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 35.5mg を得た。

20

【1257】

実施例 579

実施例 567 (2) で得られた化合物 88mg、キノリン-8-カルボン酸 41.9mg を原料として実施例 578 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 43.9mg を得た。

【1258】

実施例 580

実施例 567 (2) で得られた化合物 88mg、[1,8]ナフチリジン-4-カルボン酸 42.2mg を原料として実施例 578 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 29.0mg を得た。

30

【1259】

実施例 581

実施例 567 (2) で得られた化合物 88mg、[1,6]ナフチリジン-5-カルボン酸 42.2mg を原料として実施例 578 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 27.2mg を得た。

【1260】

実施例 582

実施例 567 (2) で得られた化合物 88mg、ピコリン酸 29.8mg を原料として実施例 578 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 30.1mg を得た。

40

【1261】

実施例 583

実施例 567 (2) で得られた化合物 63mg、イソニコチン酸 21.4mg を原料として実施例 578 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 19.4mg を得た。

【1262】

実施例 584

実施例 567 (2) で得られた化合物 100mg、5-ピリミジンカルボン酸 34.1mg を原料として実施例 578 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 28.2mg を得た。

【1263】

50

実施例 5 8 5

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、1H-インデン-3-カルボン酸 44.1mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 43mg を得た。

【1 2 6 4】

実施例 5 8 6

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、1-ベンゾフラン-3-カルボン酸 44.6mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 72mg を得た。

【1 2 6 5】

10

実施例 5 8 7

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、1-ベンゾチオフェン-3-カルボン酸 49mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 38mg を得た。

【1 2 6 6】

実施例 5 8 8

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、インドール-4-カルボン酸 44.3mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 57.1mg を得た。

【1 2 6 7】

20

実施例 5 8 9

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、インドール-7-カルボン酸 44.3mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 44.1mg を得た。

【1 2 6 8】

実施例 5 9 0

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、2-フランカルボン酸 30.8mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 51.1mg を得た。

【1 2 6 9】

30

実施例 5 9 1

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、ピロール-2-カルボン酸 30.6mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 52.9mg を得た。

【1 2 7 0】

実施例 5 9 2

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、2-テノイル酸 35.2mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 35.8mg を得た。

【1 2 7 1】

実施例 5 9 3

40

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、4-ピラゾールカルボン酸 30.8mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 42.6mg を得た。

【1 2 7 2】

実施例 5 9 4

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、1,2,3-チアジアゾール-4-カルボン酸 35.8mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 68.6mg を得た。

【1 2 7 3】

実施例 5 9 5

50

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、1H-[1,2,4]トリアゾール-3-カルボン酸 31.1mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 12.2mg を得た。

【1 2 7 4】

実施例 5 9 6

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、4-イミダゾールカルボン酸 30.8mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 13.6mg を得た。

【1 2 7 5】

実施例 5 9 7

10

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、イソキサゾール-5-カルボン酸 31.1mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 17.2mg を得た。

【1 2 7 6】

実施例 5 9 8

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、1,2,5-オキサジアゾール-3-カルボン酸 31.4mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 9.3mg を得た。

【1 2 7 7】

実施例 5 9 9

20

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、4-チアゾールカルボン酸 35.5mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 14.2mg を得た。

【1 2 7 8】

実施例 6 0 0

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、ピロール-3-カルボン酸 1 水和物 30.6mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 31.1mg を得た。

【1 2 7 9】

実施例 6 0 1

30

実施例 5 6 7 (2) で得られた化合物 100mg、チアゾール-2-カルボン酸 35.5mg を原料として実施例 5 7 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 51.6mg を得た。

【1 2 8 0】

実施例 6 0 2

実施例 1 で得られた化合物 480mg、参考例 1 6 1 で得られた化合物 470mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 49mg を得た。

【1 2 8 1】

実施例 6 0 3

実施例 1 で得られた化合物 1.5g、参考例 1 6 2 で得られた化合物 1.62g を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 148mg を得た。

40

【1 2 8 2】

実施例 6 0 4

(1) 実施例 5 2 (1) で得られた化合物 140mg をジメチルホルムアミド 5ml に溶解し、2,4-オキサゾリジンジオン 65.3mg、炭酸カリウム 179mg を加えて 120℃ にて 1.5 時間攪拌した。反応液に酢酸エチルと蒸留水を加えて分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=60:10:0.2) にて精製して N-アルキル体 101mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 98.0mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて

50

表 1 5 で示される化合物 45.8mg を得た。

【 1 2 8 3 】

実施例 6 0 5

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 130mg、2-ヒドロキシピリミジン 157mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 42.5mg を得た。

【 1 2 8 4 】

実施例 6 0 6

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 130mg、2-ヒドロキシピリミジン 157mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 12.3mg を得た。

10

【 1 2 8 5 】

実施例 6 0 7

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 150mg、4-ヒドロキシキナゾリン 101mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 77.3mg を得た。

【 1 2 8 6 】

実施例 6 0 8

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 750mg、2-ヒドロキシピリミジン 330mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 108mg を得た。

20

【 1 2 8 7 】

実施例 6 0 9

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 150mg、2-キノリノール 101mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 43.2mg を得た。

【 1 2 8 8 】

実施例 6 1 0

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 150mg、3-シアノインドール 98.5mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 71.0mg を得た。

30

【 1 2 8 9 】

実施例 6 1 1

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 150mg、2-キノリノール 101mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 32.6mg を得た。

【 1 2 9 0 】

実施例 6 1 2

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 150mg、3-インドールアセトニトリル 108mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 16.1mg を得た。

【 1 2 9 1 】

実施例 6 1 3

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 150mg、6-オキソ-1,6-ジヒドロ-3-ピリジンカルボニトリル 83.5mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 74.3mg を得た。

40

【 1 2 9 2 】

実施例 6 1 4

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 300mg、インドール 162mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 37.8mg を得た。

【 1 2 9 3 】

実施例 6 1 5

50

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 150mg、ピロール-2-カルボニトリル 63.8mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 55.0mg を得た。

【1 2 9 4】

実施例 6 1 6

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 150mg、1,6-ナフチリジン-2(1H)-オン 101mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 48.6 mg を得た。

【1 2 9 5】

実施例 6 1 7

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 150mg、ピリド [2,3-d] ピリミジン-4(3H)-オン 102mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 76.6mg を得た。

【1 2 9 6】

実施例 6 1 8

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 150mg、2-ヒドロキシピリジン 132mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 55mg を得た。

【1 2 9 7】

実施例 6 1 9

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 150mg、ウラシル 156mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 44mg を得た。

【1 2 9 8】

実施例 6 2 0

実施例 5 2 (1) で得られた化合物 150mg、4-ヒドロキシピリジン 132mg を原料として実施例 6 0 4 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 32mg を得た。

【1 2 9 9】

実施例 6 2 1

(1) 実施例 1 で得られた化合物 1.5g、参考例 1 5 2 で得られた化合物 1.55g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 276mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 170mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 85.6mg を得た。

【1 3 0 0】

実施例 6 2 2

(1) 実施例 1 で得られた化合物 1.5g、参考例 1 5 3 で得られた化合物 1.45g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 244mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 176mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 77.7mg を得た。

【1 3 0 1】

実施例 6 2 3

実施例 1 で得られた化合物 1.18g、参考例 1 5 4 で得られた化合物 511mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 133mg を得た。

【1 3 0 2】

実施例 6 2 4

実施例 1 で得られた化合物 811mg、参考例 1 5 5 で得られた化合物 385mg を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 16.3mg を得た。

【1 3 0 3】

実施例 6 2 5

(1) 実施例 1 で得られた化合物 1.5g、参考例 1 5 6 で得られた化合物 1.22g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 314mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 250mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて

表 15 で示される化合物 194mg を得た。

【1304】

実施例 626

(1) 実施例 1 で得られた化合物 3.0g、参考例 157 で得られた化合物 3.8g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 257mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 50.1mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 25.1mg を得た。

【1305】

実施例 627

(1) 実施例 626 (1) で得られた化合物 102mg をメタノール-酢酸エチル (2:1) の混合溶媒 3ml に溶解し、5%パラジウム-炭素 51mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 1 時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=10:1:0.1) にて精製して脱ベンジル体 93.9mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 30.6mg をクロロホルム 1ml に溶解し、氷冷下、トリエチルアミン 19.2 μ l、クロロギ酸イソブチル 18 μ l を加えてそのまま 1 時間攪拌した。0.5 規定アンモニア 1,4-ジオキサン溶液 0.83ml を加えて室温にて 40 分間攪拌した。反応液を飽和塩化アンモニウム水溶液で中和後、反応液にクロロホルムと飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=60:10:0.2) にて精製してアミド体 40.7mg を得た。

(3) 上記 (2) で得られた化合物 40.7mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 10.0mg を得た。

【1306】

実施例 628

実施例 1 で得られた化合物 1.50g、参考例 158 で得られた化合物 2.0g を原料として実施例 7 と同様の方法にて表 15 で示される化合物 93mg を得た。

【1307】

実施例 629

(1) 実施例 1 で得られた化合物 3.0g、参考例 159 で得られた化合物 3.0g を原料として実施例 7 (1)、(2)、(3) と同様の方法にて環化体 514mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 200mg をメタノール 5ml に溶解し、5%パラジウム-炭素 100mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 2 時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をメタノール 5ml に溶解し、20%水酸化パラジウム-炭素 500mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 2 時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をテトラヒドロフラン 4ml に溶解し、20%水酸化パラジウム-炭素 500mg を加えて 1 気圧の水素雰囲気下、室温にて 1.5 時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:アセトン:トリエチルアミン=60:10:0.2) にて精製して脱ベンジル体 73.9mg を得た。

(3) 上記 (2) で得られた化合物 72.2mg を原料として実施例 113 (2) と同様の方法にてケトン体 73.3mg を得た。

(4) 上記 (3) で得られた化合物 73.3mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 27.4mg を得た。

【1308】

実施例 630

実施例 629 (1) で得られた化合物 130mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 59.4mg を得た。

【1309】

実施例 631

実施例 1 で得られた化合物 719mg、文献 (Journal of Organic Chemistry, 1987 年, 52 巻,

10

20

30

40

50

5号,819ページ)に記載の方法にて得られた1-(2-オキシラン-2-イルエチル)-1H-ピロール497mgを原料として実施例7と同様の方法にて表15で示される化合物64.9mgを得た。

【1310】

実施例632

実施例1で得られた化合物604mg、文献(Journal of Organic Chemistry,1987年,52巻,5号,819ページ)に記載の方法にて得られた1-(3-オキシラン-2-イルプロピル)-1H-ピロール460mgを原料として実施例7と同様の方法にて表15で示される化合物29.3mgを得た。

【1311】

実施例633

実施例567(1)で得られた化合物100mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表15で示される化合物67.6mgを得た。

10

【1312】

実施例634

(1) 実施例1で得られた化合物800mgをテトラヒドロフラン5.4mlに溶解し、参考例199で得られた化合物3.03g、イッテルビウムトリフレート一水和物50mgを加えてマイクロ波照射下90℃にて10分間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール=30:1からクロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=30:1:0.1)にて精製して10a-N-(4-((2-(ベンジルオキシ)エトキシ)カルボニルアミノ)-2-ヒドロキシプロピル)体290mgを得た。

(2) 上記(1)で得られた化合物289mgを原料として実施例7(2)と同様の方法にて10a-N-メチル体288mgを得た。

20

(3) ジメチルアミノピリジン83mg、2-メチル-6-ニトロ安息香酸無水物117mgをジクロロメタン24mlに溶解し、上記(2)で得られた化合物281mgのジクロロメタン溶液16ml溶液を1時間20分かけて室温にて滴下した後、さらに室温にて1時間攪拌した。反応液に20%塩化アンモニウム水溶液を加えて分液し、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=5:1から2:1)にて精製して環化体148mgを得た。

(4) 上記(3)で得られた化合物146mgを原料として実施例7(4)と同様の方法にて表15で示される化合物104mgを得た。

【1313】

30

実施例635

実施例1で得られた化合物800mgと参考例200で得られた化合物1.87gを原料として実施例634(1)、実施例7(2)、実施例634(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表15で示される化合物76mgを得た。

【1314】

実施例636

実施例634で得られた化合物91mgを原料として実施例81と同様の方法にて表15で示される化合物15mgを得た。

【1315】

実施例637

実施例1で得られた化合物800mgと参考例42で得られた化合物1.34gを原料として実施例634(1)、実施例7(2)、実施例634(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表15で示される化合物12.9mgを得た。

40

【1316】

実施例638

実施例1で得られた化合物800mgと参考例201で得られた化合物3.12gを原料として実施例634(1)、実施例7(2)、実施例634(3)、実施例7(4)と同様の方法にて表15で示される化合物105mgを得た。

【1317】

実施例639

50

実施例 1 で得られた化合物 800mg と参考例 202 で得られた化合物 2.95g を原料として実施例 634 (1)、実施例 7 (2)、実施例 634 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 125mg を得た。

【1318】

実施例 640

(1) 実施例 1 で得られた化合物 800mg と文献 (Journal of American Chemical Society, 2004 年, 126 巻, 2495 ページ) 記載の方法にて得られた (R)-2-アシルオキシラン 1.02g を原料として、実施例 634 (1)、実施例 7 (2)、実施例 634 (3) と同様の方法にて環化体 442mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 160mg を 1-メチル-2-ピロリジノンの 2% ジオキサン溶液に溶解し、トリスジベンジリデンアセトンジパラジウム 13.7mg、3-ブロモキノリン 40.5mg、ジシクロヘキシルメチルアミン 63.5 μ l、0.52 規定トリ-t-ブチルホスフィンジオキサン溶液 57.5 μ l を加え、マイクロ波照射下 90°C にて 1 時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:テトラヒドロフラン=20:1) にて精製してカップリング体 95.6mg を得た。

(3) 上記 (2) で得られた化合物 95.6mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 61.4mg を得た。

【1319】

実施例 641

実施例 1 で得られた化合物 800mg と参考例 203 で得られた化合物 3.26g を原料として実施例 634 (1)、実施例 7 (2)、実施例 634 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて脱保護体混合物を得た。これをジメチルホルムアミド 150 μ l に溶解し、18-クラウン-6-エーテル 43.8mg、フッ化カリウム 9.6mg を加え 60°C で 26 時間攪拌した。反応液を濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=5:1:0.1) にて精製して表 15 で示される化合物 10mg を得た。

【1320】

実施例 642

実施例 1 で得られた化合物 800mg と参考例 204 で得られた化合物 1.63g を原料として実施例 641 と同様の方法にて表 15 で示される化合物 2.1mg を得た。

【1321】

実施例 643

実施例 1 で得られた化合物 1.5g と参考例 205 で得られた化合物 1.15g を原料として実施例 634 (1)、実施例 7 (2)、実施例 634 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 27.6mg を得た。

【1322】

実施例 644

実施例 1 で得られた化合物 1.5g と参考例 206 で得られた化合物 3.3g を原料として実施例 634 (1)、実施例 7 (2)、実施例 634 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 105mg を得た。

【1323】

実施例 645

実施例 1 で得られた化合物 1.5g と参考例 207 で得られた化合物 5.4g を原料として実施例 634 (1)、実施例 7 (2)、実施例 634 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 208mg を得た。

【1324】

実施例 646

(1) 実施例 1 で得られた化合物 800mg と参考例 208 で得られた化合物 978mg を原料として実施例 634 (1)、実施例 7 (2) と同様の方法にて 10a-N-メチル体 110mg を得た。

(2) 2-クロロ-1-メチルピリジニウムヨーダイド 37mg をアセトニトリル 23ml に溶解し、

10

20

30

40

50

加熱還流下、上記（１）で得られた化合物110mgとトリエチルアミン40 μ lのアセトニトリル10ml溶液を20分かけて滴下した後、さらに加熱還流下0.5時間攪拌した。反応液に20%塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=15:1から10:1）にて精製して環化体36mgを得た。

（３）上記（２）で得られた化合物35mgを原料として実施例７（４）と同様の方法にて表１５で示される化合物22mgを得た。

【１３２５】

実施例６４７

10

（１）実施例１で得られた化合物0.55gと参考例２０９で得られた化合物441mgを原料として実施例６３４（１）、実施例７（２）、実施例６４６（２）と同様の方法にて環化体88.1mgを得た。

（２）上記（１）で得られた化合物29.4mgと3-ブロモキノリン7.4 μ lを原料として実施例６４０（２）、実施例７（４）と同様の方法にて表１５で示される化合物9.0mgを得た。

【１３２６】

実施例６４８

実施例６４７（１）で得られた化合物29.4mgと4-ブロモキノリン28.5mgを原料として実施例６４０（２）、実施例７（４）と同様の方法にて表１５で示される化合物2.7mgを得た。

20

【１３２７】

実施例６４９

実施例１で得られた化合物1.0gと参考例２１０で得られた化合物3.99gを原料として実施例６３４（１）、実施例７（２）、実施例６３４（３）、実施例７（４）と同様の方法にて表１５で示される化合物198.9mgを得た。

【１３２８】

実施例６５０

実施例１で得られた化合物1.2gと参考例２１１で得られた化合物1.64gを原料として実施例６３４（１）、実施例７（２）、実施例６３４（３）、実施例７（４）と同様の方法にて表１５で示される化合物134mgを得た。

30

【１３２９】

実施例６５１

（１）実施例１で得られた化合物1.2gと参考例２１２で得られた化合物1.64gを原料として実施例６３４（１）、実施例７（２）、実施例６３４（３）と同様の方法にて環化体496mgを得た。

（２）上記（１）で得られた化合物250mgを原料として実施例７（４）と同様の方法にて表１５で示される化合物170mgを得た。

【１３３０】

実施例６５２

実施例１で得られた化合物2.0gと参考例２００で得られた化合物3.06gを原料として実施例６３４（１）、実施例７（２）、実施例６４６（２）、実施例７（４）と同様の方法にて表１５で示される化合物80mgを得た。

40

【１３３１】

実施例６５３

実施例６５１で得られた化合物30mgをメタノール2mlに溶解し、加熱還流下19時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：28%アンモニア水=10:1:0.1）にて精製して表１５で示される化合物26mgを得た。

【１３３２】

実施例６５４

50

実施例 1 で得られた化合物 1.0g と参考例 2 1 3 で得られた化合物 4.2g を原料として実施例 6 3 4 (1)、実施例 7 (2)、実施例 6 3 4 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 71.1mg を得た。

【1 3 3 3】

実施例 6 5 5

実施例 1 で得られた化合物 1.0g と参考例 2 1 4 で得られた化合物 3.9g を原料として実施例 6 3 4 (1)、実施例 7 (2)、実施例 6 3 4 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 76.0mg を得た。

【1 3 3 4】

実施例 6 5 6

実施例 1 で得られた化合物 1.0g と参考例 2 1 5 で得られた化合物 3.69g を原料として実施例 6 3 4 (1)、実施例 7 (2)、実施例 6 3 4 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 51.3mg を得た。

【1 3 3 5】

実施例 6 5 7

実施例 1 で得られた化合物 1.0g と参考例 2 1 6 で得られた化合物 3.69g を原料として実施例 6 3 4 (1)、実施例 7 (2)、実施例 6 3 4 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 63mg を得た。

【1 3 3 6】

実施例 6 5 8

(1) 実施例 5 4 (1) で得られた化合物 50mg をジクロロメタン 1ml に溶解し、トリエチルアミン 7.7 μ l、クロロ蟻酸アシル 5.4 μ l を加え、氷冷下 1 時間攪拌した。反応液に蒸留水とクロロホルムを加えて分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥して濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=3:1）にて精製してカーバメート体 44mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 43mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 29mg を得た。

【1 3 3 7】

実施例 6 5 9

実施例 5 4 (1) で得られた化合物 40mg とクロロ蟻酸メチル 3.1 μ l を原料として実施例 6 5 8 (1)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 24mg を得た。

【1 3 3 8】

実施例 6 6 0

実施例 5 4 (1) で得られた化合物 40mg とプロパルギルアルコール 30 μ l を原料として実施例 5 4 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 5mg を得た。

【1 3 3 9】

実施例 6 6 1

実施例 1 で得られた化合物 405mg と参考例 2 1 7 で得られた化合物 600mg を原料として実施例 6 3 4 (1)、実施例 7 (2)、実施例 6 3 4 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 23mg を得た。

【1 3 4 0】

実施例 6 6 2

(1) 実施例 1 で得られた化合物 1.0g と参考例 2 1 8 で得られた化合物 2.4g を原料として実施例 6 3 4 (1)、実施例 7 (2)、実施例 6 3 4 (3) と同様の方法にて環化体 92mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 42mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 5 で示される化合物 13mg を得た。

【1 3 4 1】

実施例 6 6 3

(1) 実施例 1 で得られた化合物 1.5g と参考例 2 1 9 で得られた化合物 3.3g を原料として

10

20

30

40

50

実施例 634 (1)、実施例 7 (2)、実施例 634 (3) と同様の方法にて環化体 349mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 150mg を原料として実施例 64 と同様の方法にてカルボン酸体 138mg を得た。

(3) 上記 (2) で得られた化合物 75mg を原料として実施例 91 (2)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 15 で示される化合物 20mg を得た。

【1342】

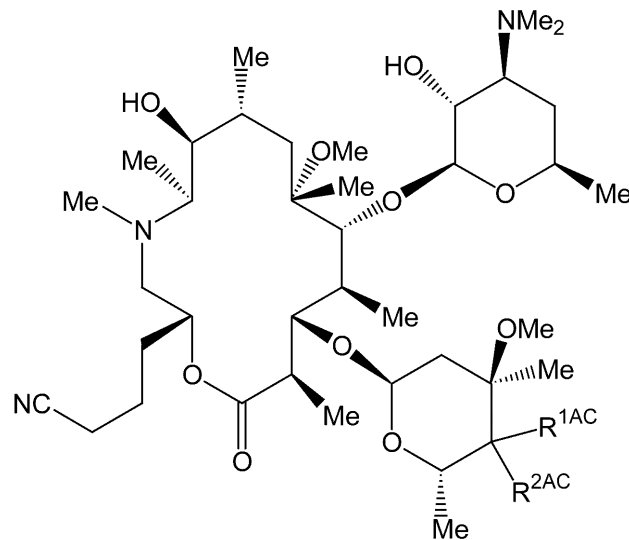
実施例 664 ~ 668 の合成

表 16 で規定した R^{1AC} 、及び R^{2AC} をもつ、式 (AC) で示される化合物の製造法を以下に示す。

【1343】

【表 16 - 1】

表 16



式 (AC)

実施例	R^{1AC}	R^{2AC}	ESI MS (M+H)	^1H -NMR, $CDCl_3$, δ (ppm)
664			965.0	ジアステレオマーの混合物(600 MHz): 0.76 - 0.88 (m, 6 H) 1.02 - 1.25 (m, 17 H) 1.26 - 1.34 (m, 8 H) 1.57 - 1.97 (m, 7 H) 2.10 - 2.32 (m, 3 H) 2.32 - 2.52 (m, 4 H) 2.35 (s, 3 H) 2.36 - 2.38 (m, 6 H) 2.53 - 2.61 (m, 1 H) 2.67 - 2.85 (m, 3 H) 2.93 - 3.01 (m, 1 H) 3.22 (s, 3 H) 3.29 - 3.45 (m, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.58 - 3.74 (m, 3 H) 4.05 - 4.17 (m, 1 H) 4.31 - 4.40 (m, 1 H) 4.43 - 4.56 (m, 2 H) 4.69 - 4.79 (m, 1 H) 4.91 - 4.97 (m, 1 H) 5.37 - 5.45 (m, 1 H) 6.67 - 6.75 (m, 2 H) 6.88 - 6.93 (m, 1 H) 7.10 - 7.17 (m, 1 H)、及び (600 MHz): 0.76 - 0.88 (m, 6 H) 1.02 - 1.25 (m, 17 H) 1.26 - 1.34 (m, 8 H) 1.57 - 1.97 (m, 7 H) 2.10 - 2.32 (m, 3 H) 2.32 - 2.52 (m, 5 H) 2.36 - 2.38 (m, 6 H) 2.39 (s, 3 H) 2.67 - 2.85 (m, 3 H) 2.93 - 3.01 (m, 1 H) 3.01 - 3.09 (m, 1 H) 3.21 (s, 3 H) 3.35 (d, J=10.09 Hz, 3 H) 3.36 (s, 3 H) 3.58 - 3.74 (m, 3 H) 4.05 - 4.17 (m, 1 H) 4.31 - 4.40 (m, 1 H) 4.43 - 4.56 (m, 2 H) 4.69 - 4.79 (m, 1 H) 4.91 - 4.97 (m, 1 H) 5.09 - 5.15 (m, 1 H) 6.67 - 6.75 (m, 2 H) 6.88 - 6.93 (m, 1 H) 7.10 - 7.17 (m, 1 H)
665			964.9	(600 MHz): 0.76 - 0.84 (m, 6 H) 1.00 - 1.26 (m, 2 H) 1.07 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.11 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.13 - 1.16 (m, 6 H) 1.21 (s, 3 H) 1.27 (d, J=6.42 Hz, 3 H) 1.29 (s, 3 H) 1.53 - 1.98 (m, 7 H) 2.09 - 2.31 (m, 3 H) 2.32 - 2.51 (m, 5 H) 2.35 (s, 3 H) 2.37 (s, 6 H) 2.71 - 2.83 (m, 3 H) 2.95 (d, J=14.21 Hz, 1 H) 3.00 - 3.07 (m, 1 H) 3.20 (s, 3 H) 3.26 - 3.41 (m, 3 H) 3.34 (s, 3 H) 3.55 - 3.62 (m, 1 H) 3.63 - 3.70 (m, 2 H) 4.06 - 4.15 (m, 1 H) 4.29 - 4.39 (m, 1 H) 4.45 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 4.51 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.67 - 4.77 (m, 1 H) 4.93 (d, J=4.59 Hz, 1 H) 5.10 - 5.14 (m, 1 H) 6.65 - 6.71 (m, 2 H) 6.88 (s, 1 H) 7.10 (t, J=7.79 Hz, 1 H)

【1344】

【表 16-2】

666		$\xrightarrow{-H}$	1007.0	(600 MHz): 0.77 – 0.85 (m, 6 H) 0.92 (t, J=6.88 Hz, 3 H) 1.06 – 1.25 (m, 2 H) 1.11 (d, J=7.34 Hz, 3 H) 1.13 (s, 3 H) 1.14 – 1.19 (m, 9 H) 1.28 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.30 (s, 3 H) 1.50 – 1.56 (m, 1 H) 1.56 – 1.97 (m, 6 H) 2.10 – 2.19 (m, 1 H) 2.20 – 2.31 (m, 2 H) 2.24 (s, 6 H) 2.31 – 2.65 (m, 9 H) 2.36 (s, 3 H) 2.76 – 2.84 (m, 1 H) 2.93 (d, J=15.59 Hz, 1 H) 3.12 – 3.42 (m, 4 H) 3.22 (s, 3 H) 3.31 (s, 3 H) 3.50 – 3.59 (m, 1 H) 3.70 (d, J=8.25 Hz, 1 H) 3.84 (s, 3 H) 4.17 (s, 1 H) 4.32 – 4.46 (m, 3 H) 4.53 (d, J=10.09 Hz, 1 H) 4.75 (s, 1 H) 4.94 (d, J=4.58 Hz, 1 H) 5.54 – 5.62 (m, 1 H) 6.86 (d, J=7.79 Hz, 1 H) 6.90 (t, J=7.57 Hz, 1 H) 7.19 (t, J=6.88 Hz, 1 H) 7.27 (d, J=7.34 Hz, 1 H)
667		$\xrightarrow{OH}$	993.0	(600 MHz): 0.78 – 0.88 (m, 6 H) 0.97 – 1.02 (m, 3 H) 1.09 – 1.13 (m, 6 H) 1.12 – 1.23 (m, 12 H) 1.28 (d, J=6.88 Hz, 3 H) 1.34 (s, 3 H) 1.56 – 1.70 (m, 3 H) 1.72 – 1.90 (m, 2 H) 1.91 – 1.97 (m, 1 H) 2.10 – 2.24 (m, 2 H) 2.23 – 2.31 (m, 2 H) 2.27 (s, 6 H) 2.35 – 2.41 (m, 2 H) 2.38 (s, 3 H) 2.41 – 2.68 (m, 9 H) 2.72 – 2.77 (m, 1 H) 2.79 – 2.83 (m, 1 H) 2.94 – 3.00 (m, 1 H) 3.16 – 3.20 (m, 1 H) 3.22 – 3.25 (m, 3 H) 3.35 (s, 3 H) 3.37 – 3.45 (m, 1 H) 3.54 – 3.60 (m, 1 H) 3.68 – 3.71 (m, 1 H) 3.79 – 3.82 (m, 3 H) 4.03 – 4.13 (m, 1 H) 4.32 – 4.39 (m, 1 H) 4.41 – 4.46 (m, 1 H) 4.47 – 4.53 (m, 1 H) 4.70 – 4.81 (m, 1 H) 4.85 (d, J=5.04 Hz, 1 H) 6.83 – 6.87 (m, 1 H) 6.93 (t, J=6.88 Hz, 1 H) 7.16 – 7.22 (m, 1 H) 7.32 – 7.36 (m, 1 H)
668		$\xrightarrow{HO}$	951.1	(600 MHz): 0.76 – 0.89 (m, 6 H) 1.06 – 1.37 (m, 24 H) 1.58 – 1.95 (m, 5 H) 2.05 – 2.27 (m, 5 H) 2.27 (s, 6 H) 2.33 – 2.40 (m, 5 H) 2.42 – 2.77 (m, 8 H) 2.78 – 2.86 (m, 1 H) 2.89 – 2.98 (m, 1 H) 3.14 – 3.25 (m, 4 H) 3.31 – 3.35 (m, 3 H) 3.35 – 3.45 (m, 1 H) 3.45 – 3.55 (m, 1 H) 3.61 – 3.76 (m, 2 H) 4.07 – 4.19 (m, 1 H) 4.34 – 4.47 (m, 2 H) 4.73 – 4.85 (m, 1 H) 4.86 – 4.91 (m, 1 H) 6.68 – 6.77 (m, 2 H) 6.83 – 6.86 (m, 1 H) 7.13 (t, J=7.79 Hz, 1 H)

【1345】

実施例 664

(1) 実施例 104 (1) で得られた化合物 740mg を原料として実施例 126 (1) と同様の方法にて 4''-ヒドロキシ体 630mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 100mg を原料として実施例 126 (2) と同様の方法にて イミダゾリルカルボニル体 109mg を得た。

(3) 上記 (2) で得られた化合物 30mg、参考例 106 で得られた化合物 10.1mg を原料として実施例 126 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 16 で示される化合物 21mg を得た。

【1346】

実施例 665

実施例 664 (2) で得られた化合物 30mg、参考例 131 で得られた化合物 10.1mg を原料として実施例 126 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 16 で示される化合物 17mg を得た。

【1347】

実施例 666

実施例 664 (2) で得られた化合物 30mg、参考例 54 で得られた化合物 12.3mg を原料として、実施例 126 (3)、実施例 7 (4) と同様の方法にて表 16 で示される化合物 21mg を得た。

【1348】

実施例 667

(1) 実施例 664 (1) で得られた化合物 500mg を原料として実施例 113 (2) と同様の方法にて ケトン体 401mg を得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物 200mg を原料として実施例 172 (1) と同様の方法にて エポキシ体 146mg を得た。

(3) 上記 (2) で得られた化合物 142mg を原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて 脱保護体 106mg を得た。

(4) 上記 (3) で得られた化合物 30mg、参考例 54 で得られた化合物 43.4mg を原料として実施例 168 (2) と同様の方法にて表 16 で示される化合物 14.2mg を得た。

【1349】

実施例 668

10

20

30

40

50

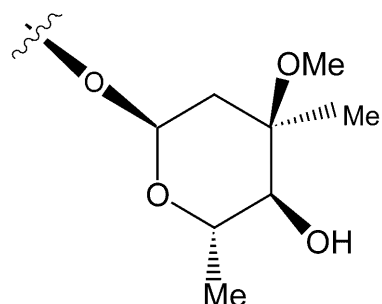
実施例 667 (2) で得られた化合物 30mg、参考例 106 で得られた化合物 35.1mg を原料として実施例 168 (2) と同様の方法にて表 16 で示される化合物 10.3mg を得た。

【1350】

なお上記、表中に記載した「クラジノシル」とは下記式で示される基である。

【1351】

【化 32】



10

【1352】

実施例 669 ~ 675 の合成

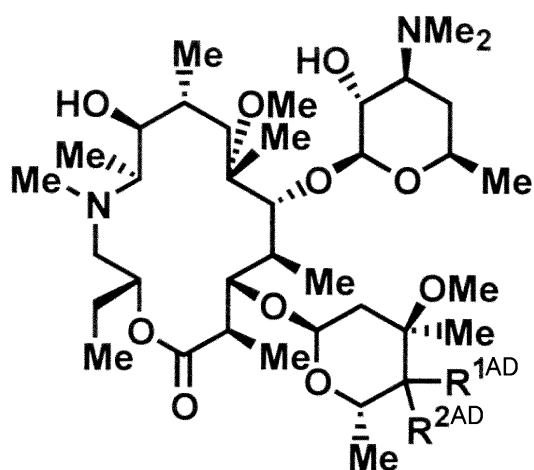
表 17 で規定した R^{1AD} 、及び R^{2AD} をもつ、式 (AD) で示される化合物の製造法を以下に示す。

【1353】

【化 33】

20

表 17



式 (AD)

【1354】

30

【表 17-1】

実施例	R ^{1AD}	R ^{2AD}	MS (M+H)	¹ H-NMR, CDCl ₃ , δ (ppm)
669		HO	833.7	(500 MHz) : 0.81 (d, J=6.86 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 0.95 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.05 - 1.28 (m, 11 H) 1.10 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.21 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.48 - 1.91 (m, 5 H) 1.98 - 2.10 (m, 2 H) 2.11 - 2.57 (m, 7 H) 2.18 (s, 6 H) 2.29 (s, 6 H) 2.35 (s, 3 H) 2.65 - 2.73 (m, 1 H) 2.74 - 2.83 (m, 2 H) 2.85 - 2.94 (m, 1 H) 3.17 - 3.23 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.29 (s, 3 H) 3.33 - 3.45 (m, 1 H) 3.47 - 3.58 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.23 Hz, 1 H) 4.13 - 4.22 (m, 1 H) 4.34 - 4.42 (m, 2 H) 4.57 - 4.66 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.66 Hz, 1 H)
670		HO	833.6	(500 MHz) : 0.81 (d, J=7.13 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.40 Hz, 3 H) 0.99 (d, J=5.48 Hz, 3 H) 1.05 - 1.28 (m, 8 H) 1.09 (d, J=7.40 Hz, 3 H) 1.12 (s, 3 H) 1.21 (d, J=6.03 Hz, 3 H) 1.31 (s, 3 H) 1.48 - 1.94 (m, 5 H) 1.97 - 2.04 (m, 1 H) 2.09 - 2.55 (m, 8 H) 2.20 (s, 6 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.64 - 2.74 (m, 1 H) 2.74 - 2.81 (m, 1 H) 2.90 (d, J=14.54 Hz, 1 H) 2.95 (d, J=13.16 Hz, 1 H) 3.16 - 3.23 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.34 - 3.45 (m, 1 H) 3.46 - 3.56 (m, 1 H) 3.72 (d, J=7.68 Hz, 1 H) 4.12 - 4.22 (m, 1 H) 4.32 (q, J=6.40 Hz, 1 H) 4.38 (d, J=7.40 Hz, 1 H) 4.57 - 4.68 (m, 1 H) 4.96 (d, J=4.94 Hz, 1 H)
671		HO	859.6	(500 MHz) : 0.81 (d, J=6.88 Hz, 6 H) 0.89 (t, J=7.45 Hz, 3 H) 1.03 - 1.28 (m, 20 H) 1.31 (s, 3 H) 1.46 - 1.94 (m, 9 H) 2.01 - 2.33 (m, 6 H) 2.29 (s, 6 H) 2.36 (s, 3 H) 2.38 - 2.69 (m, 5 H) 2.73 - 2.84 (m, 3 H) 2.90 (d, J=15.29 Hz, 1 H) 3.09 - 3.22 (m, 3 H) 3.23 (s, 3 H) 3.28 (s, 3 H) 3.36 - 3.44 (m, 1 H) 3.46 - 3.55 (m, 1 H) 3.71 (d, J=8.41 Hz, 1 H) 4.15 - 4.23 (m, 1 H) 4.32 - 4.40 (m, 2 H) 4.57 - 4.67 (m, 1 H) 4.97 (d, J=4.97 Hz, 1 H)

【1355】

【表 17-2】

672		HO	896.4	ジアステレオマーの混合物(400 MHz) : 0.80 - 0.84 (m, 6 H) 0.88 - 0.93 (m, 3 H) 1.03 - 1.37 (m, 23 H) 2.06 - 2.50 (m, 19 H) 2.61 - 2.96 (m, 6 H) 3.16 - 3.68 (m, 15 H) 3.80 - 3.83 (m, 4 H) 4.06 (m, 1 H) 4.36 - 4.42 (m, 2 H) 4.65 (m, 1 H) 4.79 (d, J=4.9 Hz, 1 H) 6.82 - 6.94 (m, 2 H) 7.18 - 7.23 (m, 2 H)
673		HO	868.3	(400 MHz) : 0.82 (d, J=6.9 Hz, 3 H) 0.82 (d, J=6.9 Hz, 3 H) 0.90 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.05 (s, 3 H) 1.08 (d, J=7.3 Hz, 3 H) 1.15 - 1.20 (m, 11 H) 1.32 (s, 3 H) 1.50 - 1.89 (m, 10 H) 2.00 - 2.46 (m, 15 H) 3.20 (dd, J=10.3, 7.1 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.26 (s, 3 H) 3.50 (m, 1 H) 3.62 (d, J=13.4 Hz, 1 H) 3.68 (d, J=8.1 Hz, 1 H) 3.84 (s, 3 H) 3.85 (d, J=13.4 Hz, 1 H) 4.14 (m, 1 H) 4.37 (d, J=7.1 Hz, 1 H) 4.39 (q, J=6.4 Hz, 1 H) 4.62 (m, 1 H) 4.96 (m, 1 H) 6.85 - 6.93 (m, 2 H) 7.15 - 7.26 (m, 2 H)
674		HO	882.3	(400 MHz) : 0.81 (d, J=7.0 Hz, 3 H) 0.81 (d, J=7.0 Hz, 3 H) 0.84 (t, J=7.3 Hz, 3 H) 1.08 - 1.17 (m, 17 H) 1.30 (s, 3 H) 1.35 (d, J=6.9 Hz, 3 H) 1.43 - 2.05 (m, 10 H) 2.13 - 2.46 (m, 15 H) 2.73 - 2.94 (m, 3 H) 3.18 (dd, J=10.0, 7.3 Hz, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.26 (s, 3 H) 3.34 - 3.45 (m, 2 H) 3.67 (d, J=7.8 Hz, 1 H) 3.83 (s, 3 H) 4.02 (m, 1 H) 4.08 - 4.14 (m, 1 H) 4.30 (q, J=6.4 Hz, 1 H) 4.35 (d, J=7.4 Hz, 1 H) 4.62 (m, 1 H) 4.96 (m, 1 H) 6.84 - 6.94 (m, 2 H) 7.18 - 7.24 (m, 2 H)
675		HO	910.4	(400 MHz) : 0.82 (d, J=7.1 Hz, 3 H) 0.82 (d, J=7.1 Hz, 3 H) 0.90 (t, J=7.4 Hz, 3 H) 1.08 - 1.44 (m, 24 H) 1.50 - 1.80 (m, 10 H) 1.95 - 2.60 (m, 18 H) 2.72 - 2.93 (m, 3 H) 3.20 (m, 1 H) 3.23 (s, 3 H) 3.32 (s, 3 H) 3.39 (m, 2 H) 3.72 (d, J=8.1 Hz, 1 H) 3.85 (s, 3 H) 4.15 - 4.25 (m, 2 H) 4.35 - 4.40 (m, 2 H) 4.63 (m, 1 H) 4.99 (m, 1 H) 6.84 - 6.95 (m, 2 H) 7.24 - 7.34 (m, 2 H)

【1356】

実施例 669

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、1-ジメチルアミノ-2-プロピルアミン 21.0mgを原料として実施例 368 (2) と同様の方法にて表 17 で示される化合物 8.1mgを得た。

【1357】

実施例 670

実施例 368 (1) で得られた化合物 30mg、1-ジメチルアミノ-2-プロピルアミン

10

20

30

40

50

21.0mgを原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表17で示される実施例 6 6 9 のジアステレオマー11.0mgを得た。

【1 3 5 8】

実施例 6 7 1

実施例 3 6 8 (1) で得られた化合物 30mg、(S)-(-)-2-アミノメチル-1-エチルピロリジン 26.3mgを原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 7 で示される化合物 21.7mgを得た。

【1 3 5 9】

実施例 6 7 2

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物 30 mg、参考例 2 2 0 で得られた化合物 32 mgを原料として実施例 5 3 5 と同様の方法にて表 1 7 で示される化合物 25 mgを得た。 10

【1 3 6 0】

実施例 6 7 3

(1) 実施例 1 6 8 (1) で得られた化合物 25 mg、2-メトキシベンジルアミン 23 μ l を原料として実施例 5 3 5 と同様の方法にてアミン体 29 mgを得た。

(2) 上記 (1) で得られた化合物19 mgを原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 7 で示される化合物 13 mgを得た。

【1 3 6 1】

実施例 6 7 4

(1) 実施例 1 6 8 (1) で得られた化合物 26 mg、特許(特開昭54154724)に記載の方法にて得られた(1S)-(2-メトキシフェニル)エタンアミン 26 mgを原料として実施例 5 3 5 と同様の方法にてアミン体 30 mgを得た。 20

(2) 上記 (1) で得られた化合物19 mgを原料として実施例 7 (4) と同様の方法にて表 1 7 で示される化合物 13 mgを得た。

【1 3 6 2】

実施例 6 7 5

実施例 3 6 8 (1) で得られた化合物 33 mg、参考例 5 4 (2) で得られた化合物 40 mg を原料として実施例 5 3 5 と同様の方法にて表 1 7 で示される化合物 21 mgを得た。

【1 3 6 3】

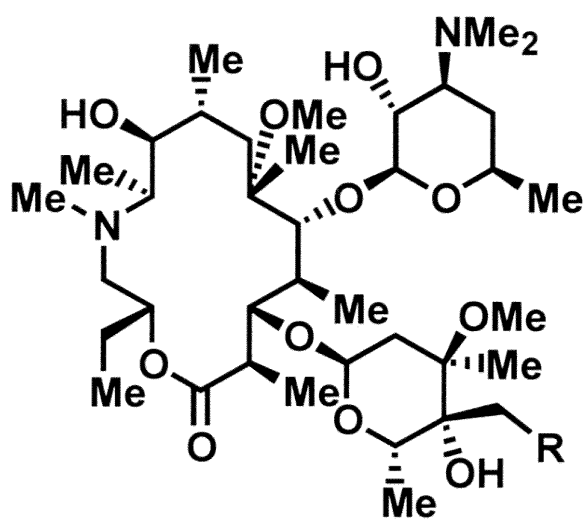
実施例 6 7 6 から実施例 7 7 8 の合成 30

実施例 3 6 8 (1) で得られた化合物とアミン試薬を原料として、実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 8 で規定した R をもつ、式 (AE) で示される化合物を得た。

【1 3 6 4】

【化 3 4】

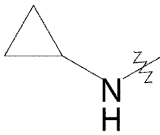
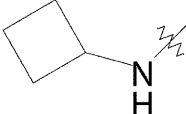
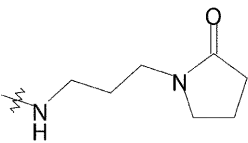
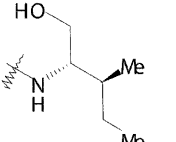
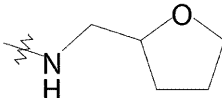
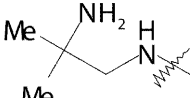
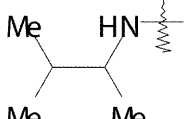
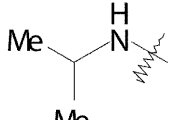
表 1 8



式 (AE)

【 1 3 6 5】

【表 1 8 - 1】

実施例	R	ESI MS (M+H)
676		788.93
677		802.97
678		873.99
679		849.00
680		832.97
681		820.00
682		819.00
683		790.97

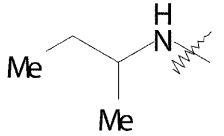
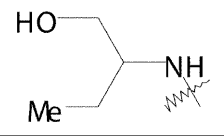
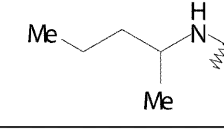
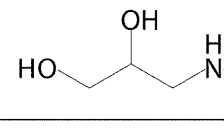
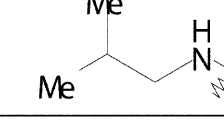
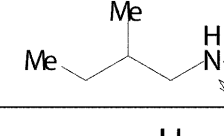
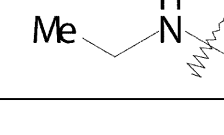
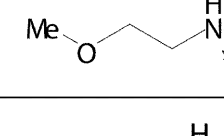
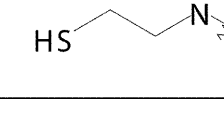
【 1 3 6 6 】

10

20

30

【表 1 8 - 2】

684		804.99
685		820.99
686		819.01
687		822.97
688		805.01
689		819.01
690		776.95
691		806.98
692		808.02

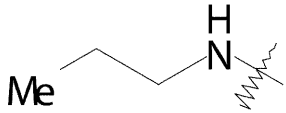
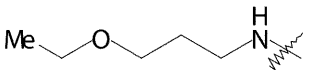
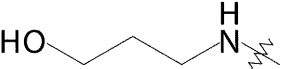
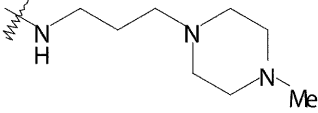
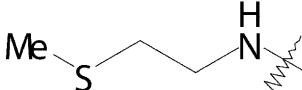
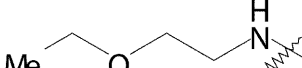
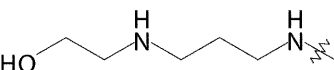
【 1 3 6 7 】

10

20

30

【表 1 8 - 3】

693		790.98
694		835.01
695		806.98
696		889.04
697		822.96
698		820.99
699		850.01

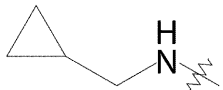
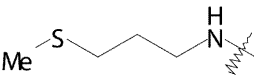
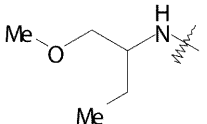
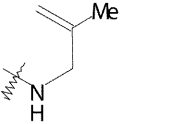
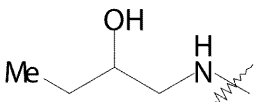
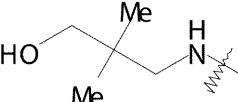
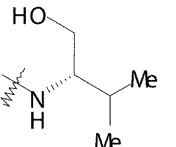
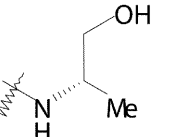
【 1 3 6 8】

10

20

30

【表 18-4】

700		802.99
701		836.97
702		835.01
703		802.98
704		820.99
705		835.00
706		835.02
707		806.98

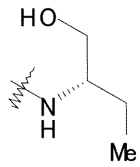
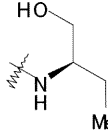
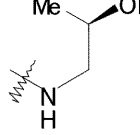
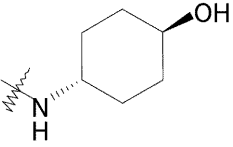
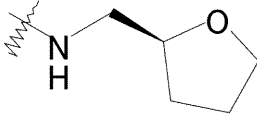
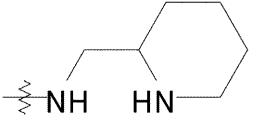
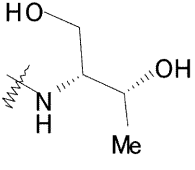
【1369】

10

20

30

【表 1 8 - 5】

708		820.99
709		821.00
710		806.99
711		847.00
712		832.99
713		846.02
714		836.98

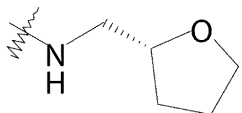
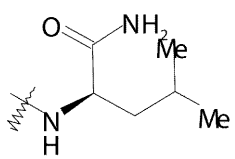
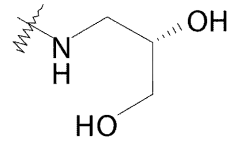
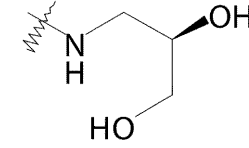
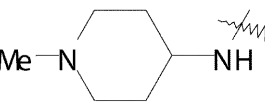
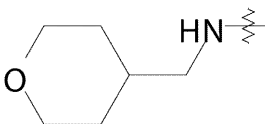
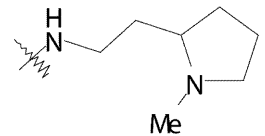
【 1 3 7 0 】

10

20

30

【表 18-6】

715		832.99
716		862.01
717		822.97
718		822.97
719		846.01
720		846.99
721		860.04

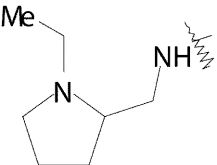
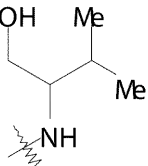
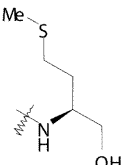
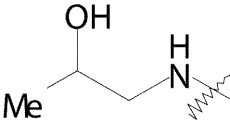
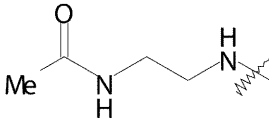
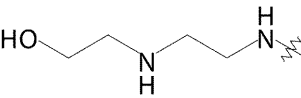
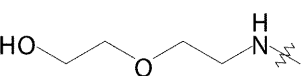
【1371】

10

20

30

【表 18-7】

722		860.05
723		835.01
724		866.97
725		806.98
726		833.99
727		836.01
728		836.99

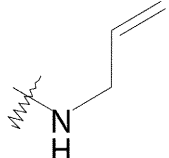
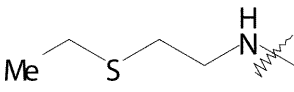
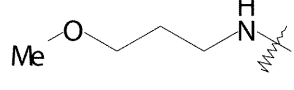
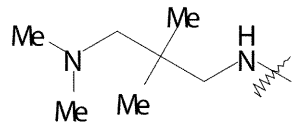
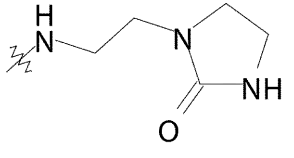
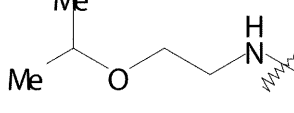
【1372】

10

20

30

【表 1 8 - 8】

729		788.97
730		836.97
731		821.00
732		862.06
733		860.99
734		835.02

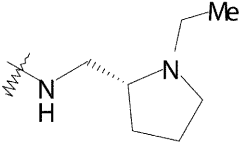
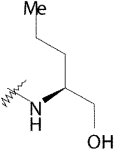
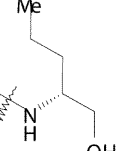
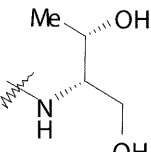
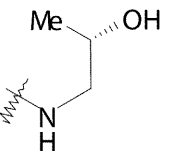
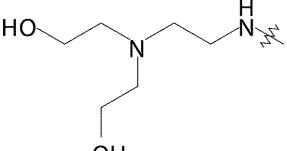
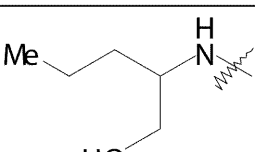
【 1 3 7 3】

10

20

30

【表 1 8 - 9】

735		860.03
736		835.00
737		835.01
738		836.99
739		806.97
740		880.01
741		835.00

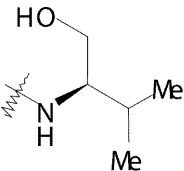
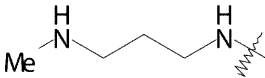
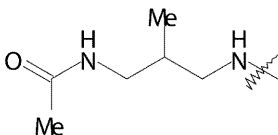
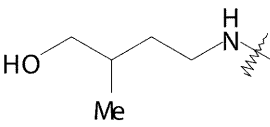
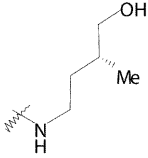
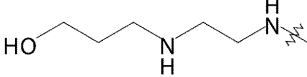
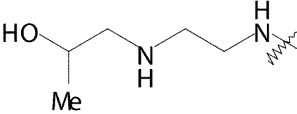
【 1 3 7 4】

10

20

30

【表 1 8 - 1 0】

742		835.00
743		820.00
744		862.00
745		835.00
746		834.99
747		850.00
748		850.01

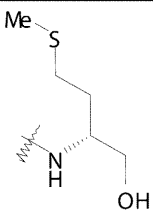
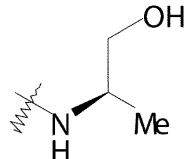
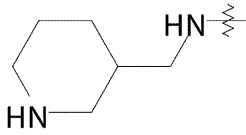
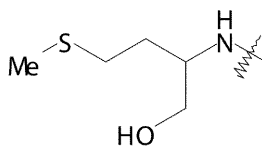
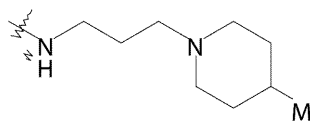
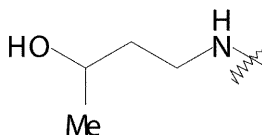
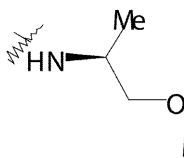
【 1 3 7 5】

10

20

30

【表 1 8 - 1 1】

749		866.96
750		806.97
751		846.01
752		867.03
753		888.11
754		821.04
755		821.04

【 1 3 7 6】

10

20

30

【表 1 8 - 1 2】

756		819.06
757		890.09
758		860.05
759		849.04
760		861.00
761		889.09
762		860.08

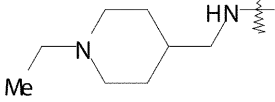
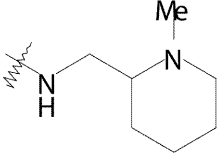
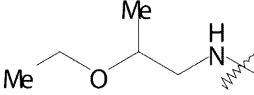
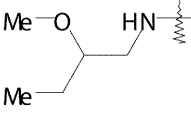
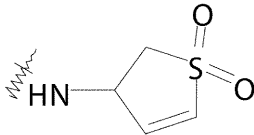
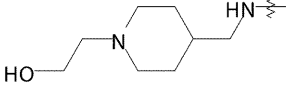
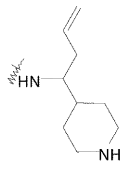
【 1 3 7 7 】

10

20

30

【表 1 8 - 1 3】

763		874.09
764		860.08
765		835.06
766		835.05
767		865.03 (APCI)
768		890.08
769		886.09

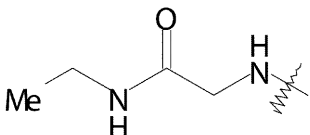
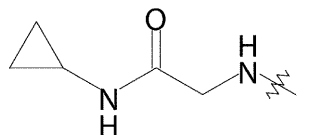
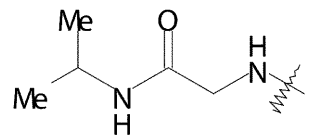
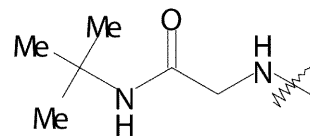
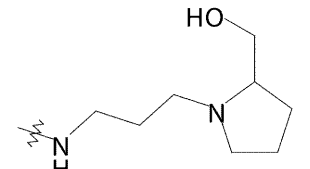
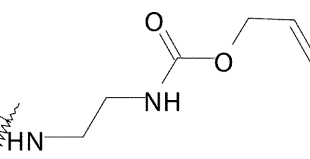
【 1 3 7 8】

10

20

30

【表 1 8 - 1 4】

770	 <chem>CCNC(=O)CN</chem>	834.03
771	 <chem>C1CC1NCC(=O)N</chem>	846.03
772	 <chem>CC(C)NCC(=O)N</chem>	848.04
773	 <chem>CC(C)(C)NCC(=O)N</chem>	862.06
774	 <chem>OC1CCCN1CCCCN</chem>	890.08
775	 <chem>C=CCOC(=O)NCCN</chem>	876.02

10

20

30

【 1 3 7 9】

【表 18-15】

776		874.07
777		878.01
778		819.04

10

【 1 3 8 0 】

20

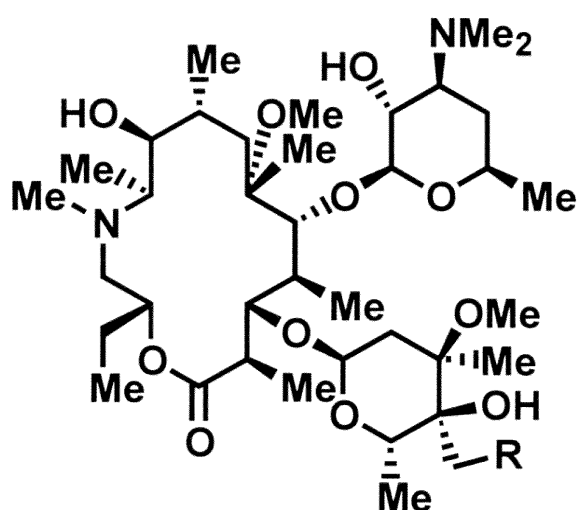
実施例 779 から実施例 822 の合成

実施例 4 1 2 (1) で得られた化合物とアミン試薬を原料として実施例 3 6 8 (2) と同様の方法にて表 1 9 で規定した R をもつ、式 (AF) で示される化合物を得た。

【 1 3 8 1 】

【化 3 5】

表 19



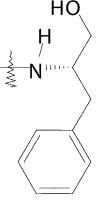
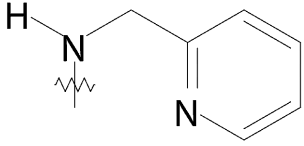
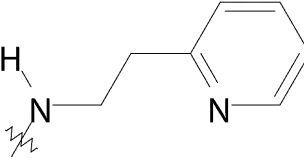
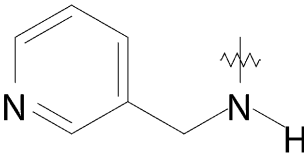
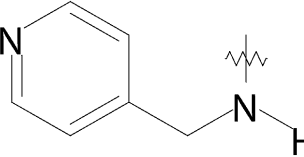
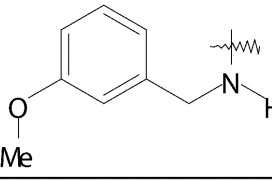
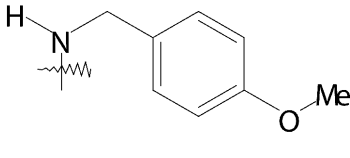
30

式 (AF)

40

【 1 3 8 2 】

【表 1 9 - 1】

実施例	R	ESI MS
779		882.94
780		839.94
781		853.97
782		839.95
783		839.95
784		868.98
785		868.98

10

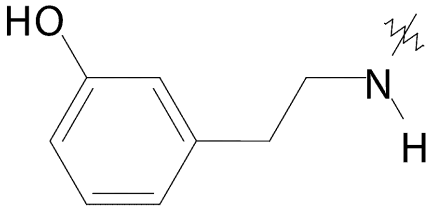
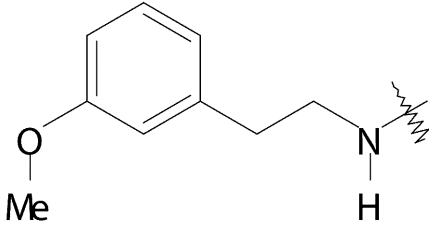
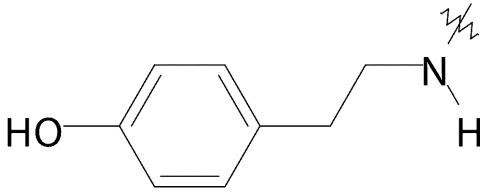
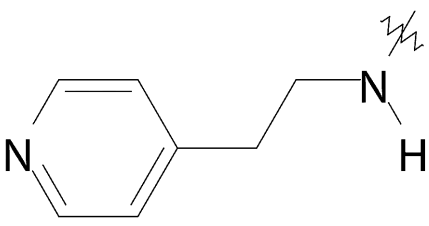
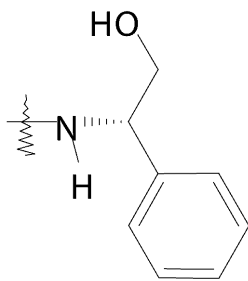
20

30

40

【 1 3 8 3 】

【表 1 9 - 2】

786		868.99
787		883.00
788		868.98
789		853.99
790		868.99

【 1 3 8 4】

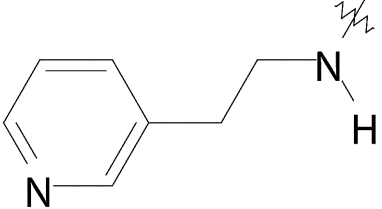
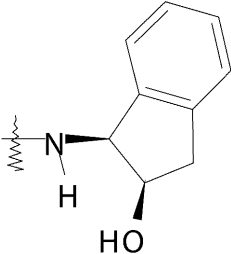
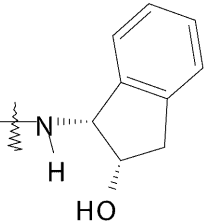
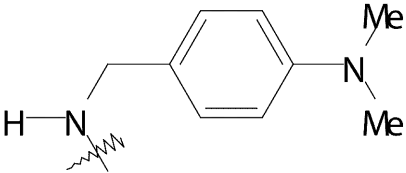
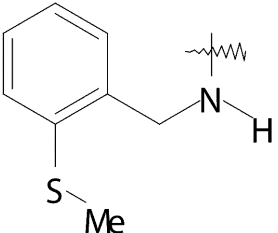
10

20

30

40

【表 1 9 - 3】

791		853.99
792		881.00
793		880.99
794		882.03
795		884.97

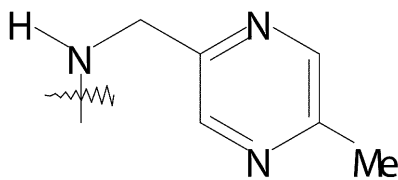
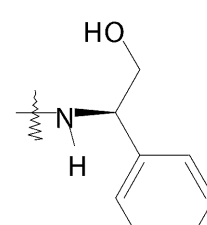
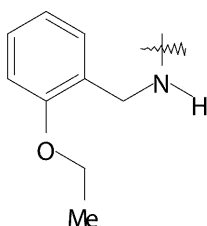
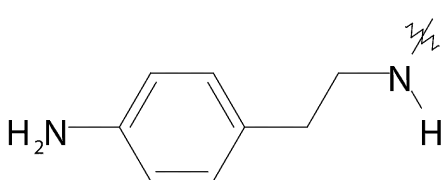
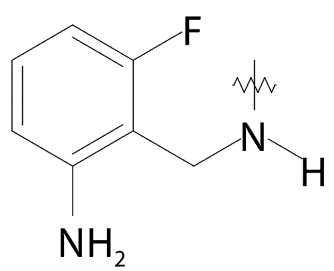
【 1 3 8 5 】

10

20

30

【表 1 9 - 4】

796		855.00
797		869.00
798		883.02
799		868.03
800		872.00

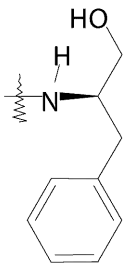
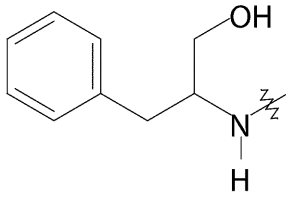
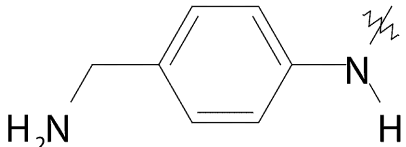
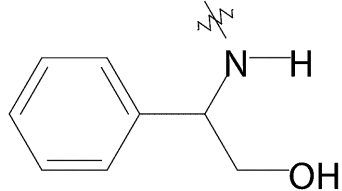
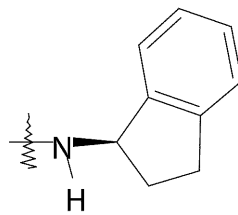
10

20

30

【 1 3 8 6 】

【表 1 9 - 5】

801		883.03
802		883.02
803		854.02
804		869.02
805		865.01

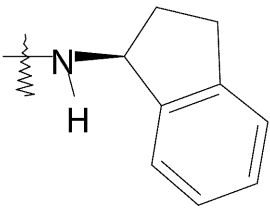
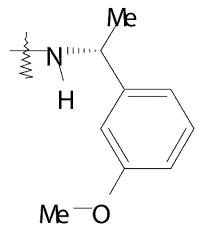
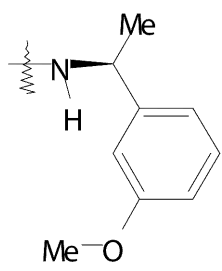
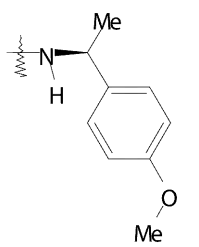
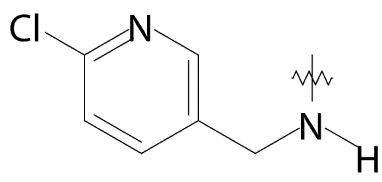
【 1 3 8 7 】

10

20

30

【表 1 9 - 6】

806		865.02
807		883.03
808		883.03
809		883.03
810		873.95

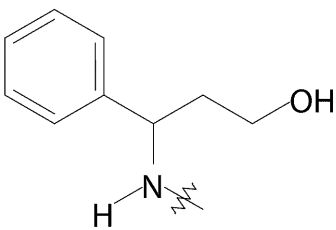
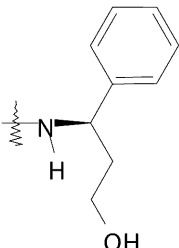
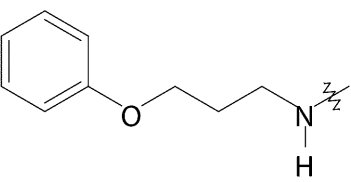
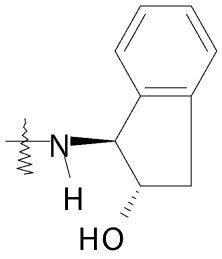
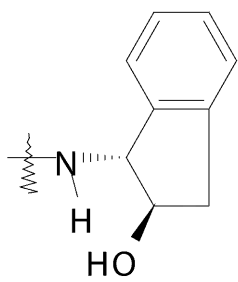
【 1 3 8 8 】

10

20

30

【表 1 9 - 7】

811		883.03
812		883.04
813		883.03
814		881.02
815		881.02

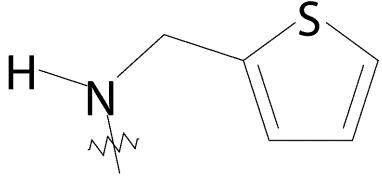
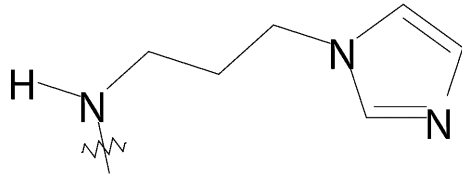
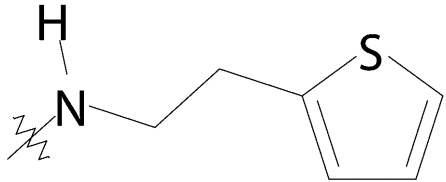
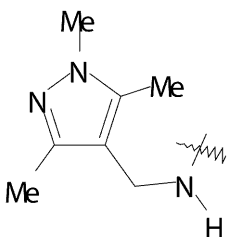
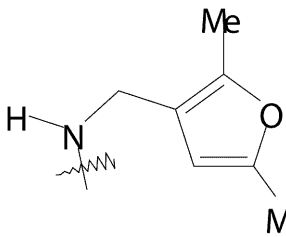
【 1 3 8 9】

10

20

30

【表 1 9 - 8】

816		844.99
817		857.05
818		858.99
819		871.04
820		857.03

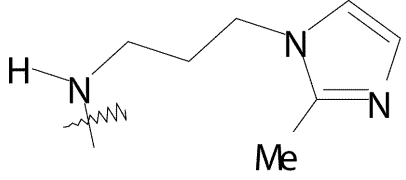
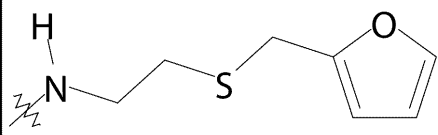
10

20

30

【 1 3 9 0 】

【表 19-9】

821		871.05
822		888.99

10

【1391】

試験例 1 (インビトロ抗菌活性)

本発明品の各種試験菌に対するインビトロ抗菌力は、微量液体希釈法(NCCLS法)に準じて測定した。検体として実施例 7、23、114、126、131、210、214、231、257、261、287、363、366 及び 563 の化合物、比較薬剤 1：クラリスロマイシンを用いた。使用した試験菌を表 20 に示した。また、結果を MIC 値(微生物生育最小阻止濃度 $\mu\text{g}/\text{ml}$)で表し、表 21 に示した。

20

【1392】

【表 20】

表20

試験菌	菌体番号
<i>H. influenzae</i> ATCC43095	A
<i>S. pneumoniae</i> ATCC49619	B
<i>S. pneumoniae</i> 205	C

30

【1393】

【表 2 1】

表21

化合物	A	B	C
比較薬剤1	4	0.03	>128
実施例7	1	0.03	>128
実施例23	4	0.03	8
実施例114	8	0.016	0.06
実施例126	4	0.06	0.03
実施例131	16	0.03	0.12
実施例210	4	0.06	32
実施例214	1	0.03	>128
実施例231	8	0.06	2
実施例257	8	0.03	4
実施例261	4	0.12	64
実施例287	8	0.06	0.12
実施例363	2	0.12	4
実施例366	4	0.12	2
実施例563	16	0.25	64

【産業上の利用可能性】

【1394】

本発明の化合物は、インフルエンザ菌、エリスロマイシン耐性肺炎球菌などに対して優れた抗菌活性を有することから、感染症の治療剤として利用可能である。

フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I
A 6 1 K 31/706 (2006.01) A 6 1 K 31/706
A 6 1 P 31/04 (2006.01) A 6 1 P 31/04

(72)発明者 真中 晃
東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内
(72)発明者 萩田 晴久
東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内
(72)発明者 黒坂 淳
東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内
(72)発明者 川村 円
東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内
(72)発明者 檜村 政人
東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内
(72)発明者 笹本 直樹
東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内
(72)発明者 三浦 知明
神奈川県横浜市港北区師岡町 7 6 0 明治製菓株式会社内
(72)発明者 兼本 憲一
神奈川県横浜市港北区師岡町 7 6 0 明治製菓株式会社内
(72)発明者 小澤 智宏
神奈川県横浜市港北区師岡町 7 6 0 明治製菓株式会社内
(72)発明者 近内 健
神奈川県横浜市港北区師岡町 7 6 0 明治製菓株式会社内
(72)発明者 設楽 永紀
神奈川県横浜市港北区師岡町 7 6 0 明治製菓株式会社内
(72)発明者 窪田 大
神奈川県小田原市栢山 7 8 8 明治製菓株式会社内

審査官 井上 明子

(56)参考文献 国際公開第 2 0 0 7 / 0 6 9 5 5 5 (WO, A 1)
国際公開第 2 0 0 5 / 0 1 9 2 3 8 (WO, A 1)
国際公開第 2 0 0 3 / 0 1 4 1 3 6 (WO, A 1)
Tetrahedron Letters, 1 9 9 9 年, Vol.40, No.27, p.4965-4968

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07H 15/04
C07H 17/08
A61K 31/7032
A61K 31/7052
A61K 31/7056
A61K 31/706
CAplus(STN)
REGISTRY(STN)