(19)日本国特許庁(JP)　(12)特　許　公　報(B2)　(11)特許番号

特許第4042160号

(P4042160)

(45)発行日　平成20年2月6日(2008.2.6)　(24)登録日　平成19年11月22日(2007.11.22)

(51)Int.Cl.		F I	
C07D 295/18	(2006.01)	C07D 295/18	A
A61K 31/495	(2006.01)	A61K 31/495	
A61P 9/04	(2006.01)	A61P 9/04	
A61P 9/12	(2006.01)	A61P 9/12	
A61P 13/12	(2006.01)	A61P 13/12	

請求項の数 3　(全 130 頁)　最終頁に続く

(21)出願番号	特願平9-502896
(86)(22)出願日	平成8年6月6日(1996.6.6)
(65)公表番号	特表平11-508244
(43)公表日	平成11年7月21日(1999.7.21)
(86)国際出願番号	PCT/JP1996/001533
(87)国際公開番号	WO1996/041795
(87)国際公開日	平成8年12月27日(1996.12.27)
審査請求日	平成15年4月24日(2003.4.24)
(31)優先権主張番号	9511694.3
(32)優先日	平成7年6月9日(1995.6.9)
(33)優先権主張国	英国(GB)

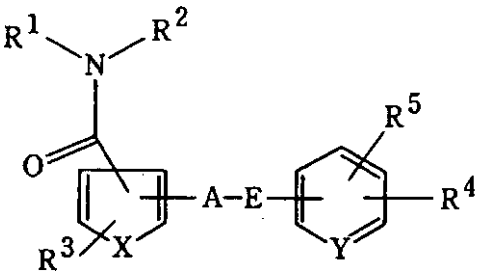
(73)特許権者
アステラス製薬株式会社
東京都中央区日本橋本町２丁目３番１１号
アステラス製薬株式会社知的財産部
(74)代理人
弁理士　濱井　康丞
(72)発明者　瀬戸井　宏行
茨城県つくば市並木４丁目１３－１
(72)発明者　大川　武彦
茨城県結城郡石下町向石下９４４－２
(72)発明者　善光　龍哉
茨城県北相馬郡守谷町けやき台６－３－３－Ａ１０１
(72)発明者　澤田　仁
茨城県つくば市松代２－２５－１０
最終頁に続く

(54)【発明の名称】バソプレッシン拮抗物質としてのベンズアミド誘導体およびその用途

(57)【特許請求の範囲】

【請求項１】

式



(I)

［式中、

R^1が、各々にＮ－低級アルキルピペラジニルカルボニルで置換された低級アルコキシで置換されているフェニルまたはトリルであり

R^2が低級アルキルであり；

R^3が低級アルコキシであり；

R^4がアミノで置換されている低級アルコキシであり；

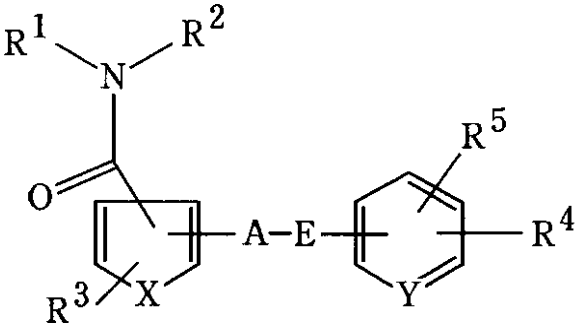
R^5が水素であり；

ＡがＮＨであり；

Ｅが－ＣＯ－であり；

Ｘが－ＣＨ＝ＣＨ－であり；

ＹがＣＨである］
の化合物およびその医薬として許容される塩。
【請求項２】
有効成分として請求項１の化合物と製薬上許容される実質的に無毒性の担体または賦形剤とを含有することを特徴とする医薬組成物。
【請求項３】
医薬とし使用するための請求項１の化合物。
【発明の詳細な説明】
技術分野
この発明は、医薬として有用な新規ベンズアミド誘導体およびそれらの医薬として許容される塩に関する。
背景技術
いくつかのベンズアミド誘導体が、たとえばPCT国際公開番号WO91/05549およびWO95/29152ならびにEP出願公開番号0620216においてバソプレッシン拮抗物質として知られている。
発明の開示
この発明は、新規ベンズアミド誘導体およびそれらの医薬として許容される塩に関する。より詳しくは、この発明は、バソプレッシン拮抗作用、血管拡張作用、降圧作用、肝中糖質放出抑制作用、メサンギウム細胞成長抑制作用、水利尿作用、血小板凝集抑制作用、オキシトシン拮抗作用などの活性を有する新規ベンズアミド誘導体およびそれらの医薬として許容される塩、それらを含有する医薬組成物ならびにヒトまたは動物における高血圧、心不全、腎不全、浮腫、腹水、バソプレッシン分泌異常症候群、肝硬変、低ナトリウム血症、低カリウム血症、糖尿病、循環障害、脳血管疾患（たとえば脳浮腫、脳梗塞など）、メニエール症候群（たとえばメニエール病など）、乗物酔いなどの治療および／または予防法に関するものである。
この発明の一目的は、前記の活性を有する新規かつ有用なベンズアミド誘導体を提供することである。
この発明の他の一目的は、該ベンズアミド誘導体およびそれらの塩の製造法を提供することである。
この発明の別の一目的は、該ベンズアミド誘導体およびそれらの医薬として許容される塩を有効成分として含有する医薬組成物を提供することである。
この発明のさらに一つの目的は、該ベンズアミド誘導体およびそれらの医薬として許容される塩を用いて、ヒトまたは動物における前記諸疾患を治療および／または予防するための医療方法を提供することである。
この発明が目的とするベンズアミド誘導体は新規であり、つぎの一般式（Ｉ）によって表わすことができる：



(I)

式中、
R^1はアリール、シクロ低級アルキルまたは複素環基であり、それらの各々は、ハロゲン；ヒドロキシ；ニトロ；アミノ；アシル；置換アシル；アシル低級アルキルスルフィニル；アシル低級アルキルスルホニル；アシルオキシ；低級アルキルアミノ低級アルキルカルバモイルオキシ；アリール；シアノ；複素環基；アシル、置換アシル、アリールもしくはアシル置換アリールで置換されていてもよい低級アルケニル；アミノ、アシルアミノもし

くは置換アシルアミノで置換されていてもよい低級アルキニル；ハロゲン、アミノ、低級アルキルアミノ、アシルアミノ、置換アシルアミノ、ヒドロキシ、アシルオキシ、アシル低級アルカノイルオキシ、アシル、置換アシル、アシル低級アルコキシイミノ、アリールもしくはアシル置換アリールで置換されていてもよい低級アルキル；アシルもしくは置換アシルで置換されていてもよい低級アルキルチオ；アリール、置換アリール、ヒドロキシ、アシルオキシ、アミノ、低級アルキルアミノ、保護されたアミノ、複素環基、アシル置換ピリジル、置換アシル置換ピリジル、ハロゲン、アシル低級アルキルアミノ、Ｎ－保護されたアシル低級アルキルアミノ、Ｎ－アシル低級アルキル－Ｎ－低級アルキルアミノ、アシル、置換アシル、アシルアミノ、置換アシルアミノ、低級アルキルヒドラジノカルボニルアミノ、ヒドロキシイミノ、アシル低級アルコキシイミノ、置換アシル低級アルコキシイミノ、アシル低級アルコキシ、グアニジノもしくはＮ－保護されたグアニジノで置換されていてもよいアルコキシ；および、アシルもしくは置換アシルで置換されていてもよい低級アルケニルオキシからなる群から選ばれた置換基で置換されていてもよく；

R^2は水素；ヒドロキシ、アリールもしくはアシルで置換されていてもよい低級アルキル；またはシクロ低級アルキルであり；

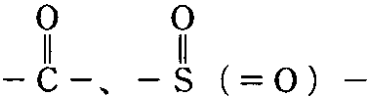
R^3は水素；ハロゲン；ヒドロキシ；アシルオキシ；置換アシルオキシ；ヒドロキシもしくは低級アルコキシで置換されていてもよい低級アルキル；アリール、アミノ、保護されたアミノ、アシル、ヒドロキシ、シアノもしくは低級アルキルチオで置換されていてもよい低級アルコキシ；ニトロ；アミノ；アシル；置換アシル；またはシクロ低級アルキルオキシであり；

R^4はヒドロキシ；ハロゲン；ニトロ；アミノ；保護されたアミノ；低級アルキルアミノ；アシルオキシ；アミノ低級アルキルアミノ；Ｎ－保護されたアミノ低級アルキルアミノ；ヒドロキシ、アリール、置換アリール、アシル、置換アシル、アミノ、低級アルキルアミノ、アシルアミノ、置換アシルアミノ、保護されたアミノ、複素環基もしくはグアニジノで置換されていてもよい低級アルコキシ；アシル、置換アシル、アミノ、低級アルキルアミノ、アシルアミノ、置換アシルアミノ、保護されたアミノ、複素環基、ヒドロキシ、低級アルキルスルホニルオキシ、アリールスルホニルオキシ、アル低級アルコキシもしくは置換アル低級アルコキシで置換されていてもよい低級アルキルチオ；アシル、置換アシル、アミノ、低級アルキルアミノ、アシルアミノ、置換アシルアミノ、保護されたアミノ、複素環基、ヒドロキシ、低級アルキルスルホニルオキシもしくはアリールスルホニルオキシで置換された低級アルキル；アシルで置換されていてもよい低級アルケニル；ヒドロキシ、アミノ、保護されたアミノ、低級アルキルスルホニルオキシもしくはアリールスルホニルオキシで置換されていてもよい低級アルキニル；アミノ低級アルキルスルホニル；Ｎ－保護されたアミノ低級アルキルスルホニル；低級アルキルアミノスルホニル；複素環スルホニル；アミノ低級アルキルスルフィニル；Ｎ－保護されたアミノ低級アルキルスルフィニル；ピペリジルオキシ；またはＮ－保護されたピペリジルオキシであり；

R^5は水素、低級アルキル、低級アルコキシまたはハロゲンであり；

Ａは単結合、ＯまたはNHであり；

Ｅは低級アルキレン、低級アルケニレン、



または式－Ｇ－Ｊ－

〔ここに、Ｇは低級アルキレンであり、ＪはＯまたは－Ｎ（R^6）－（ここに、R^6は水素またはＮ－保護基である）である〕の基であり；

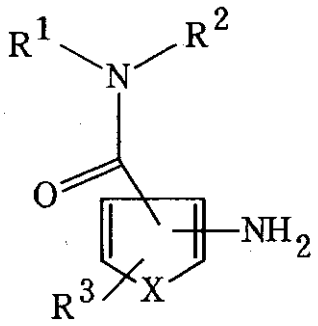
Ｘは－CH＝CH－、－CH＝Ｎ－またはＳであり；

ＹはCHまたはＮである；

ならびにそれらの医薬として許容される塩である。

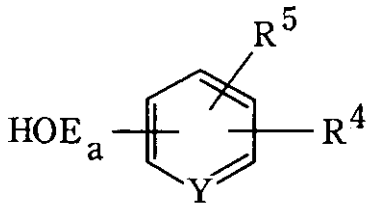
目的化合物（Ｉ）またはその塩は、つぎの反応式で示される諸方法により製造できる。

方法１

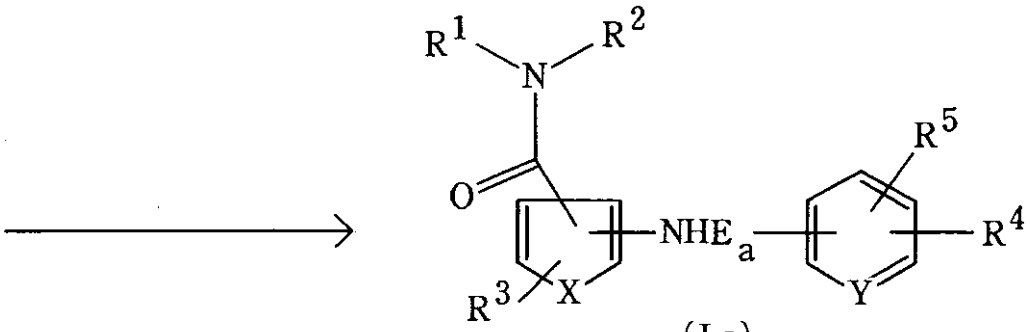


(II)
またはその塩

＋

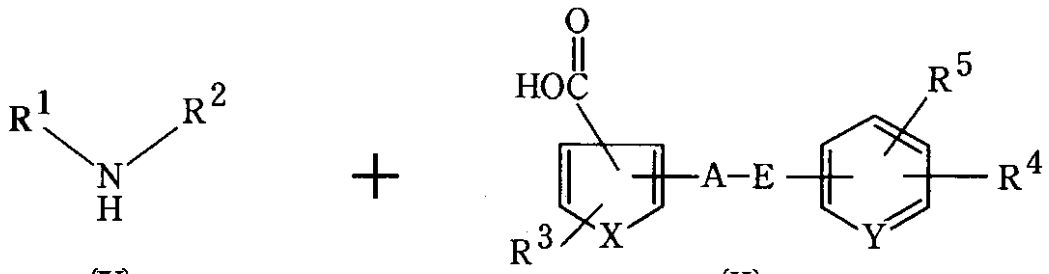


(III)
またはそのカルボキシ基またはスルホ基における反応性誘導体もしくはそれらの塩



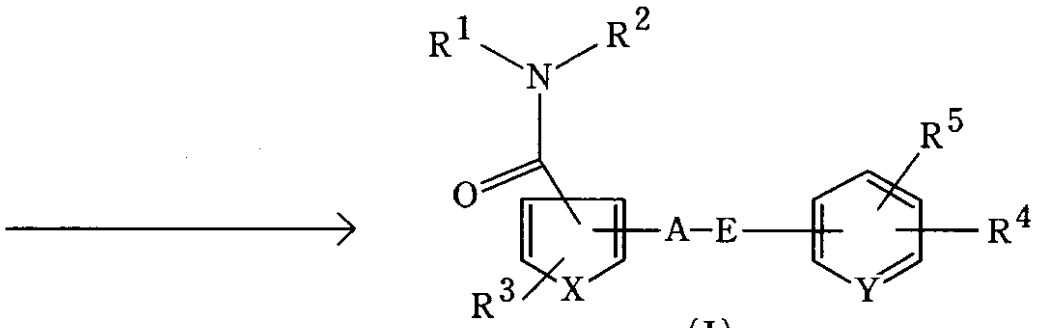
(I a)
またはその塩

方法２



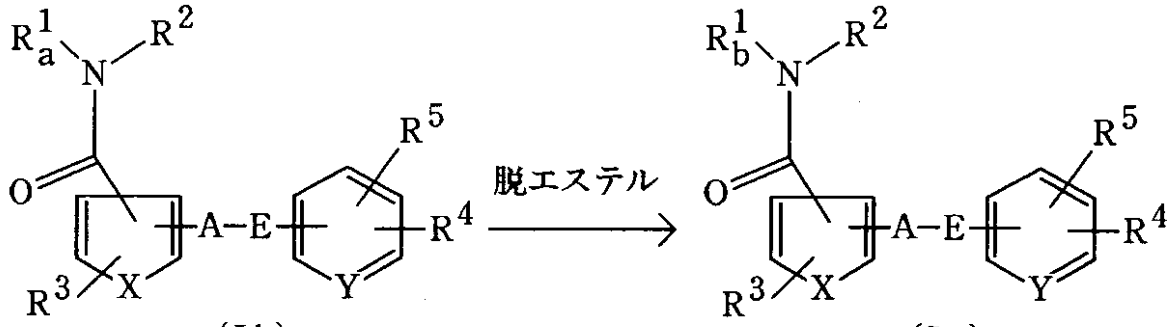
(Ⅳ)
またはその塩

(Ⅴ)
またはそのカルボキシ基における
反応性誘導体もしくはそれらの塩



(Ⅰ)
またはその塩

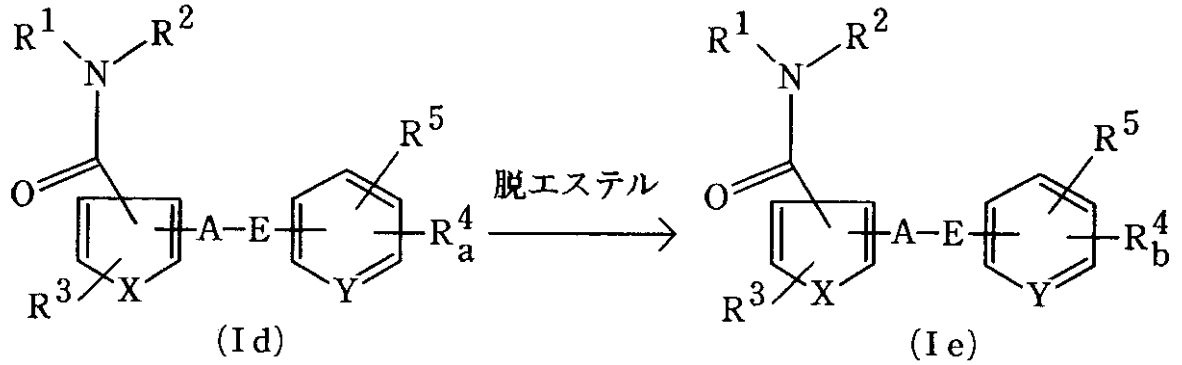
方法３



(Ⅰb)
またはその塩

(Ⅰc)
またはその塩

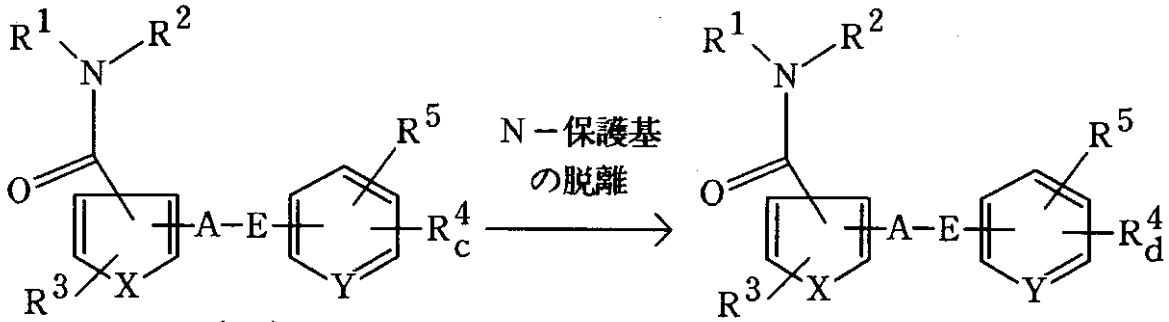
方法４



(Id)
またはその塩

(Ie)
またはその塩

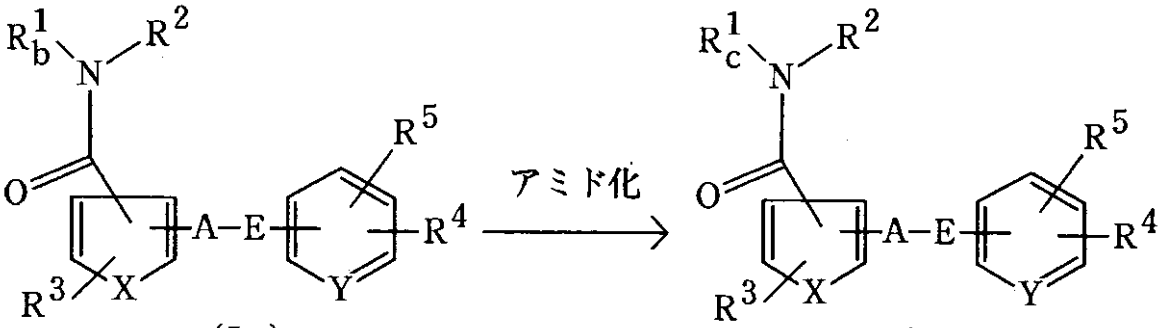
方法５



(If)
またはその塩

(Ig)
またはその塩

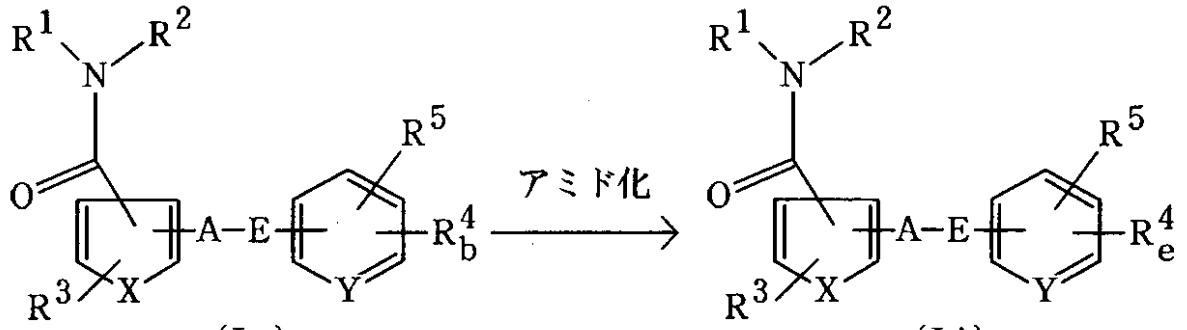
方法６



(Ic)
またはそのカルボキシ基における
反応性誘導体もしくはそれらの塩

(Ih)
またはその塩

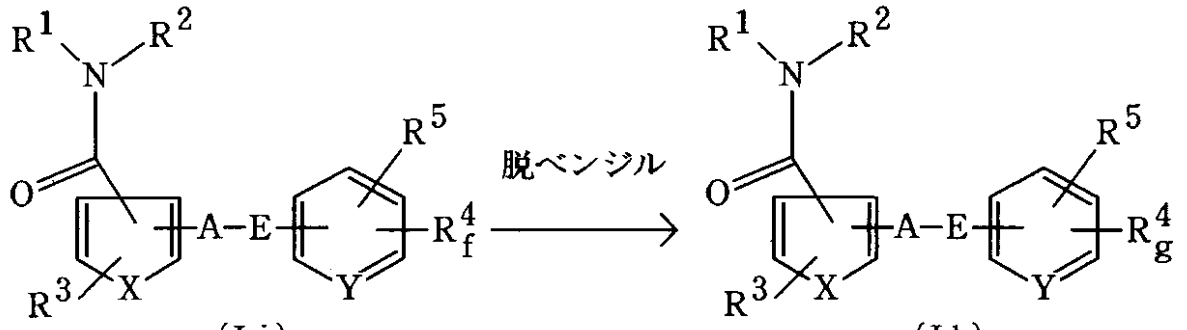
方法７



(Ｉｅ)
またはそのカルボキシ基における
反応性誘導体もしくはそれらの塩

(Ｉｉ)
またはその塩

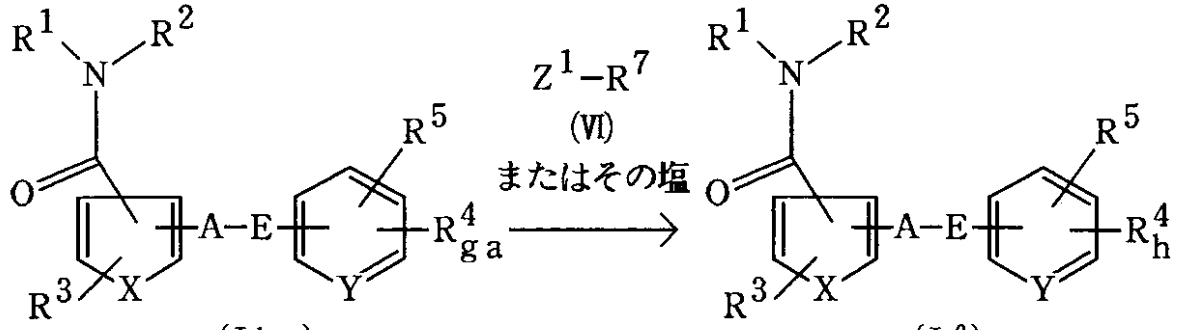
方法８



(Ｉｊ)
またはその塩

(Ｉｋ)
またはその塩

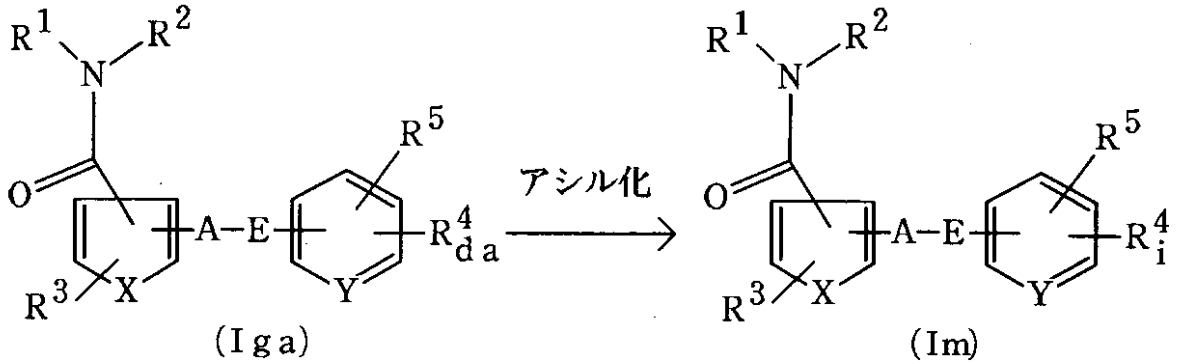
方法９



(Ｉｋａ)
またはその塩

(Ｉℓ)
またはその塩

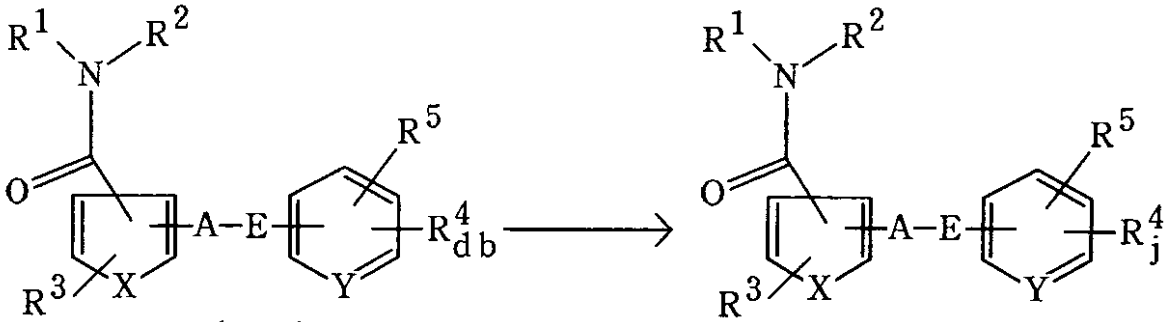
方法10



(Iga)
またはその塩

(Im)
またはその塩

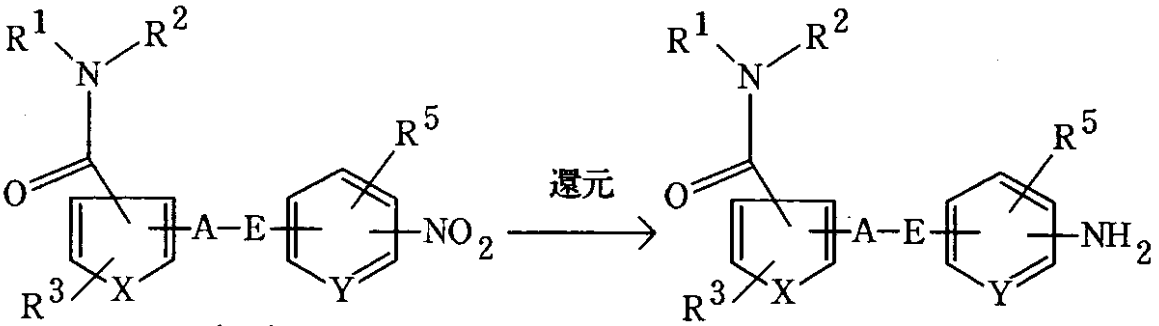
方法11



(Igb)
またはその塩

(In)
またはその塩

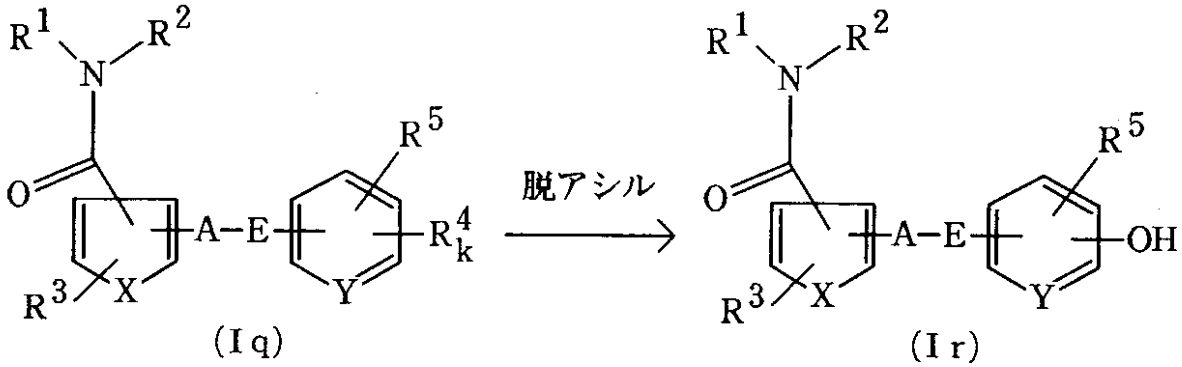
方法12



(Io)
またはその塩

(Ip)
またはその塩

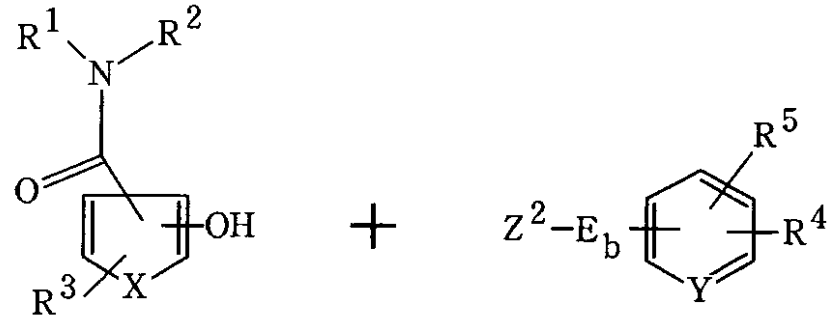
方法13



(Iq)
またはその塩

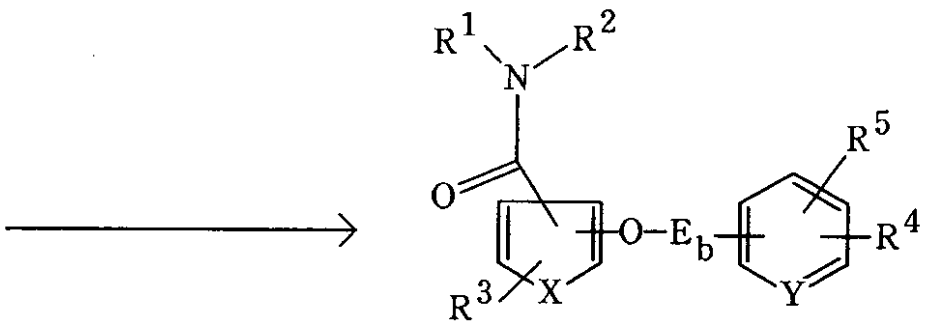
(Ir)
またはその塩

方法14



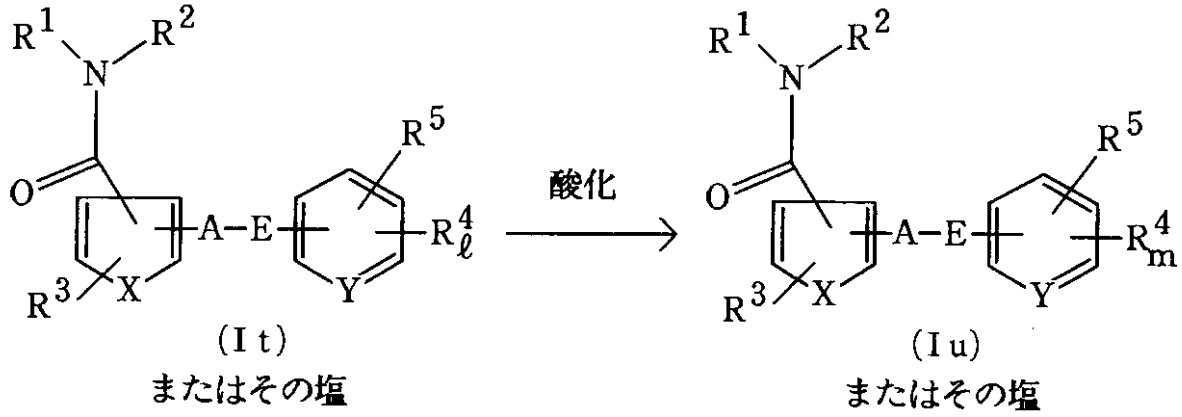
(VII)
またはその塩

(VIII)
またはその塩



(Is)
またはその塩

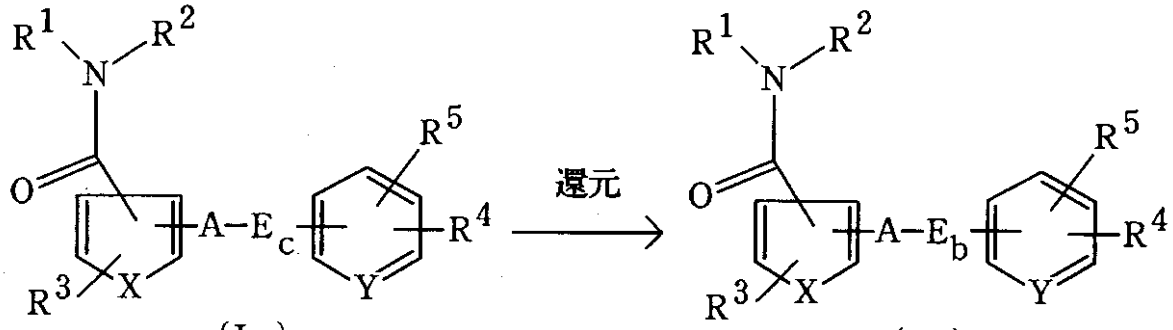
方法15



(I t)
またはその塩

(I u)
またはその塩

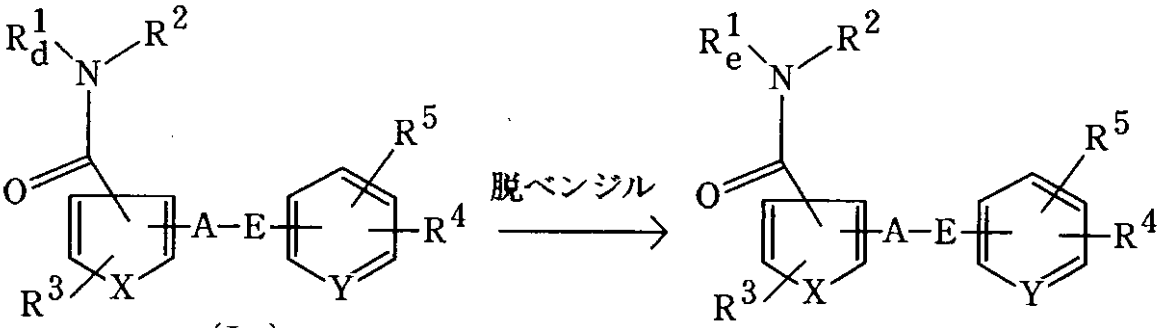
方法16



(I v)
またはその塩

(I w)
またはその塩

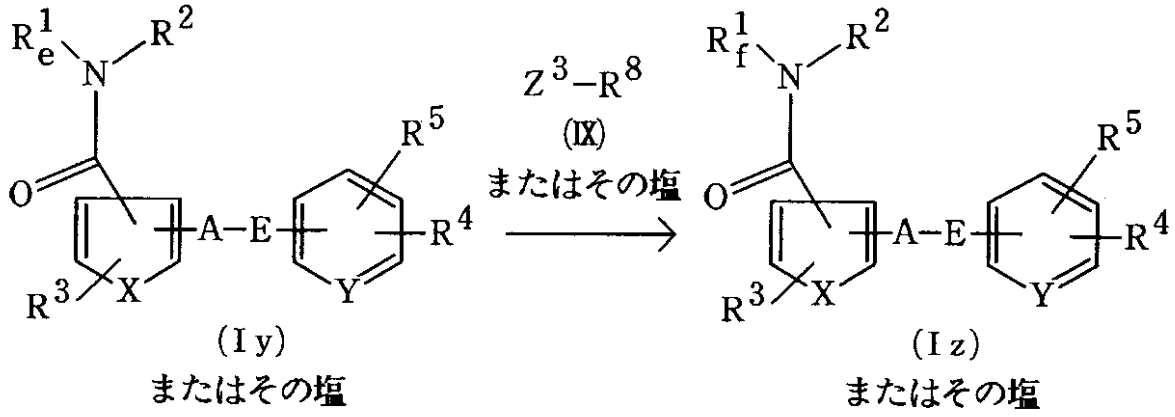
方法17



(I x)
またはその塩

(I y)
またはその塩

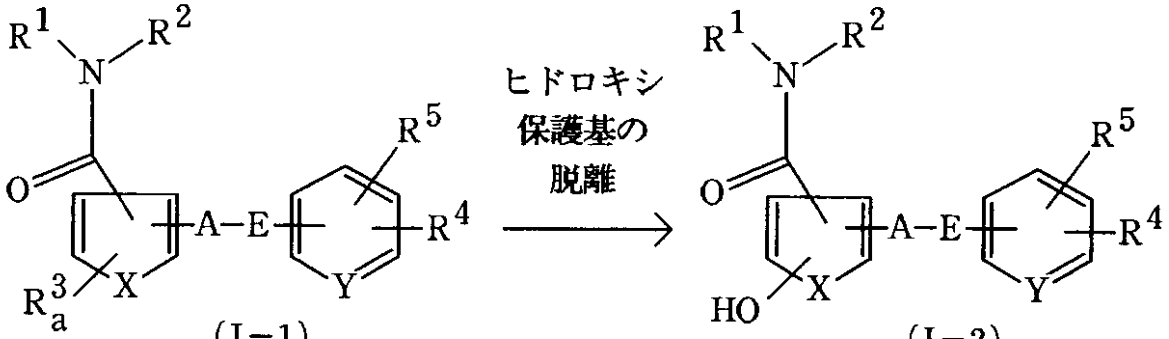
方法18



(Iy)
またはその塩

(Iz)
またはその塩

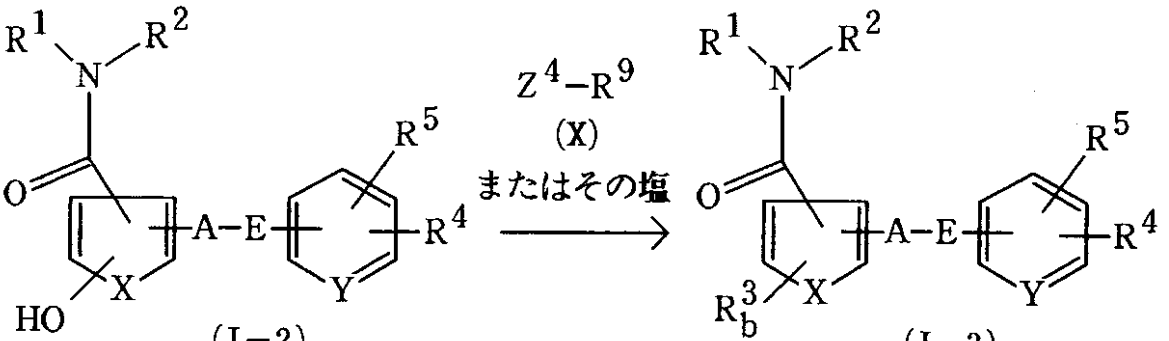
方法19



(I−1)
またはその塩

(I−2)
またはその塩

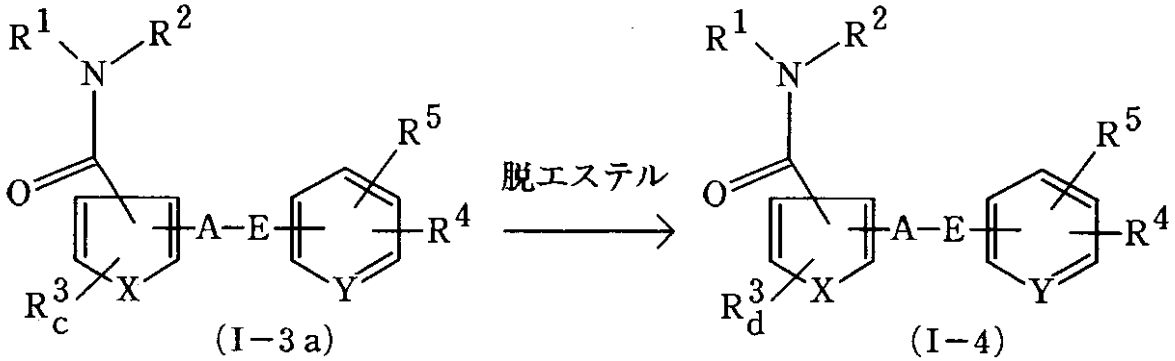
方法20



(I−2)
またはその塩

(I−3)
またはその塩

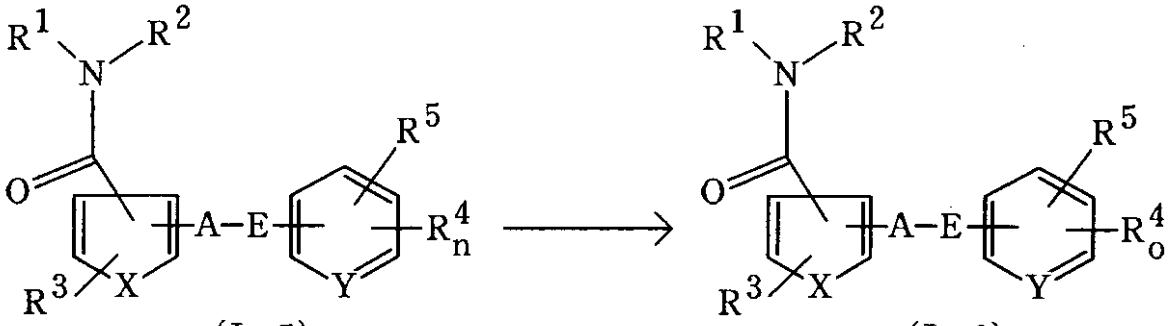
方法21



(I−3a)
またはその塩

(I−4)
またはその塩

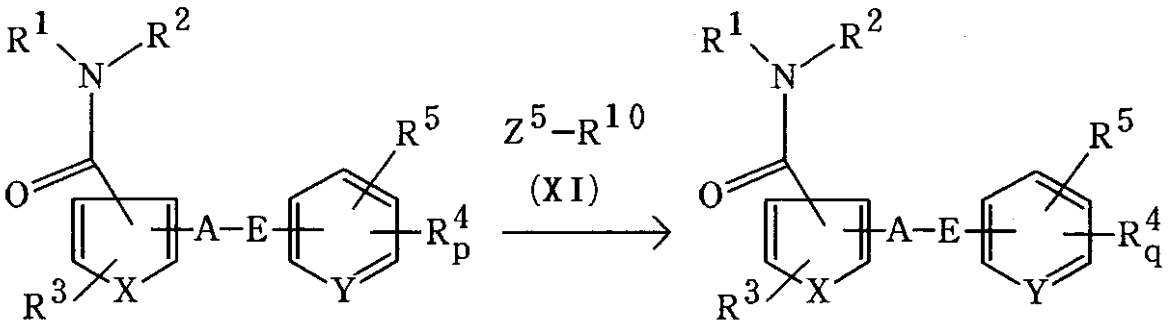
方法22



(I−5)
またはその塩

(I−6)
またはその塩

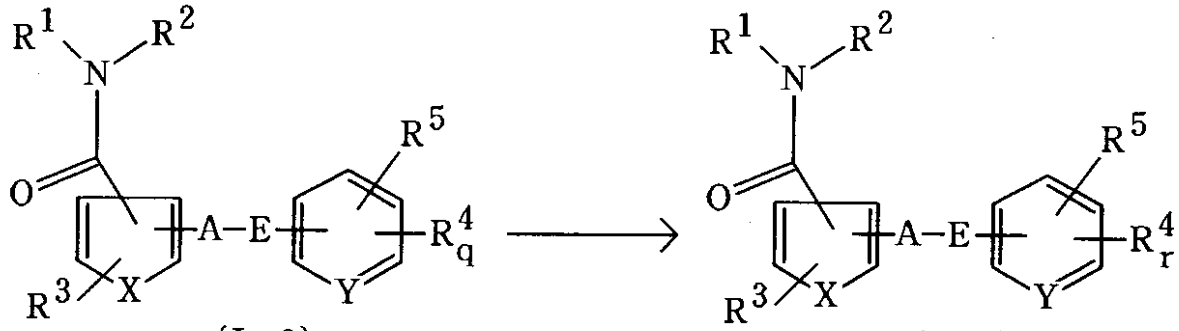
方法23



(I−7)
またはその塩

(I−8)
またはその塩

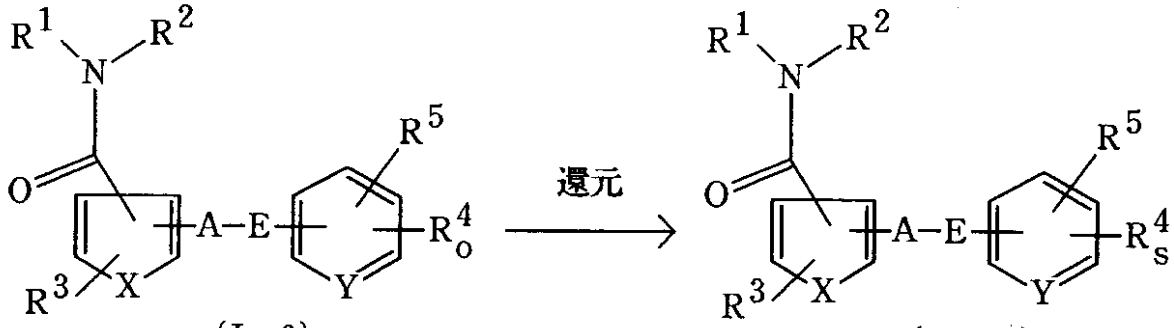
方法24



(I−8)
またはその塩

(I−9)
またはその塩

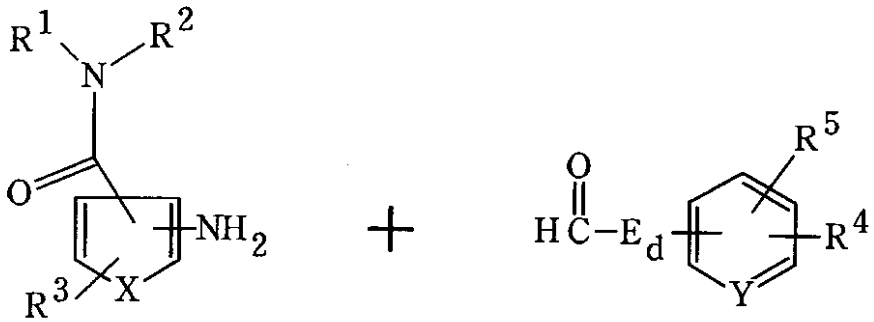
方法25



(I−6)
またはその塩

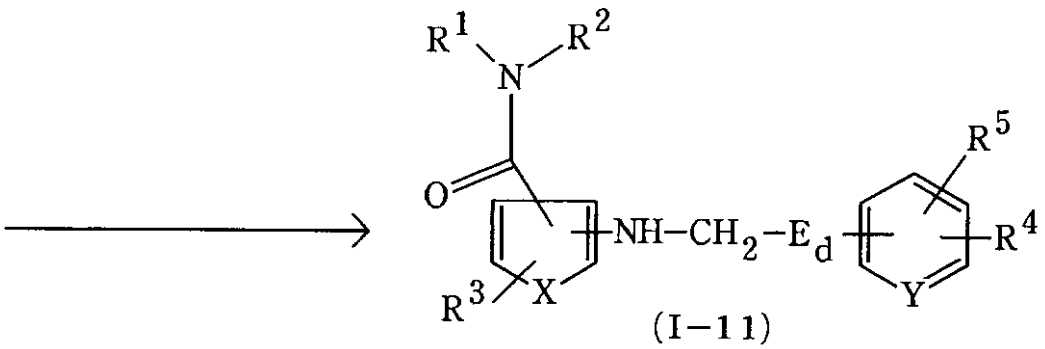
(I−10)
またはその塩

方法26



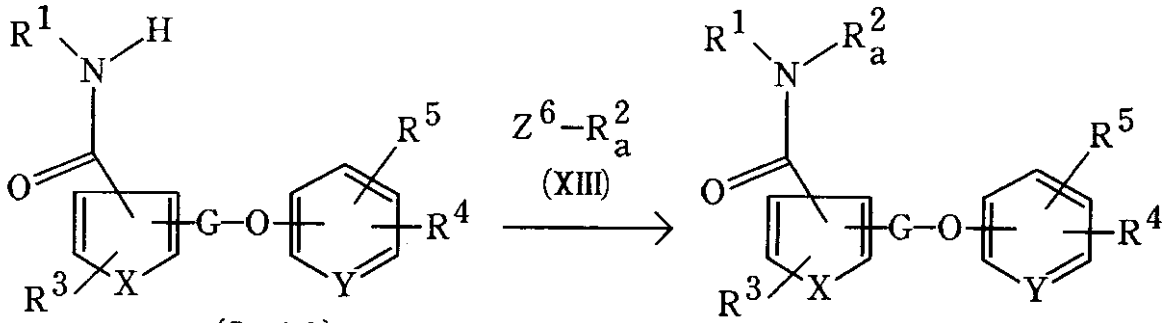
(II)
またはその塩

(XII)
またはその塩



(I−11)
またはその塩

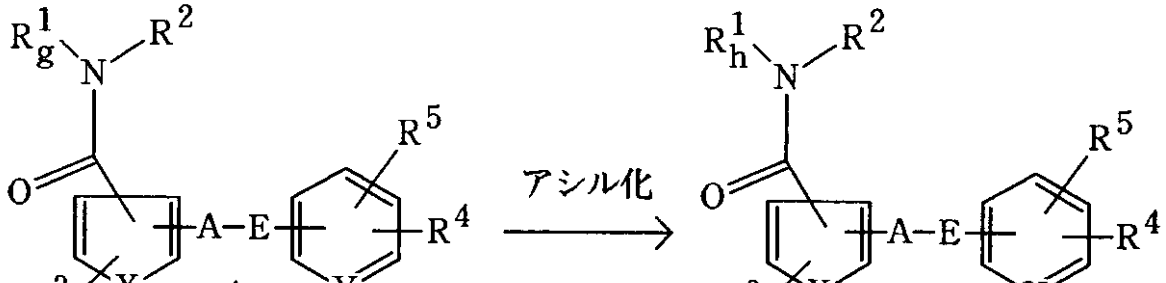
方法27



(I−12)
またはその塩

(I−13)
またはその塩

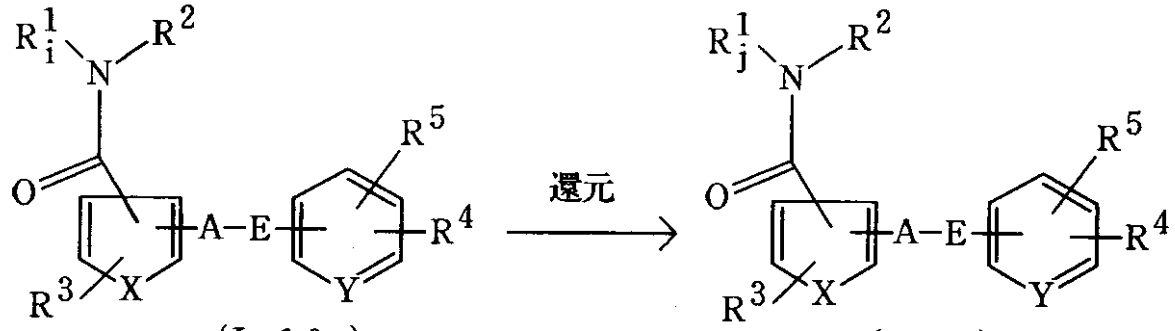
方法28



(I−14)
またはその塩

(I−15)
またはその塩

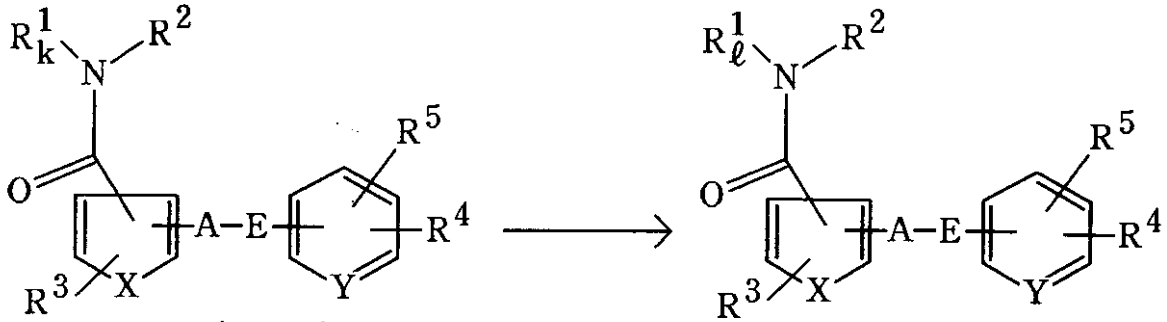
方法29



(I−16a)
またはその塩

(I−17)
またはその塩

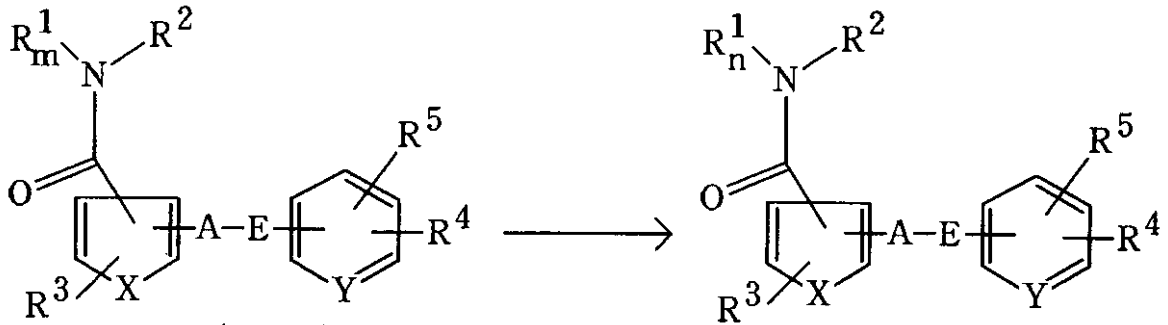
方法30



(I−16)
またはその塩

(I−18)
またはその塩

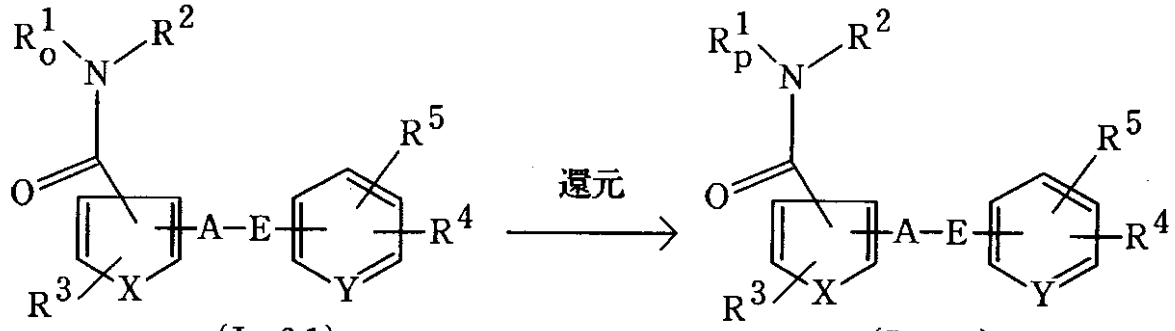
方法31



(I−19)
またはその塩

(I−20)
またはその塩

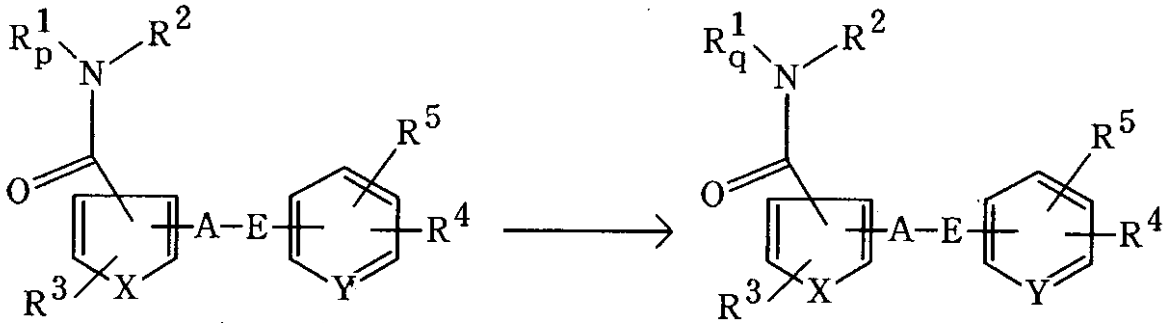
方法32



(I−21)
またはその塩

(I−22)
またはその塩

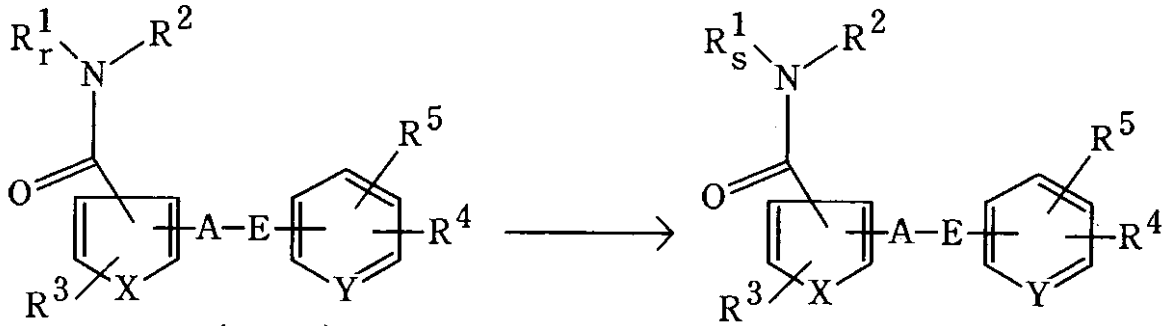
方法33



(I−22)
またはその塩

(I−23)
またはその塩

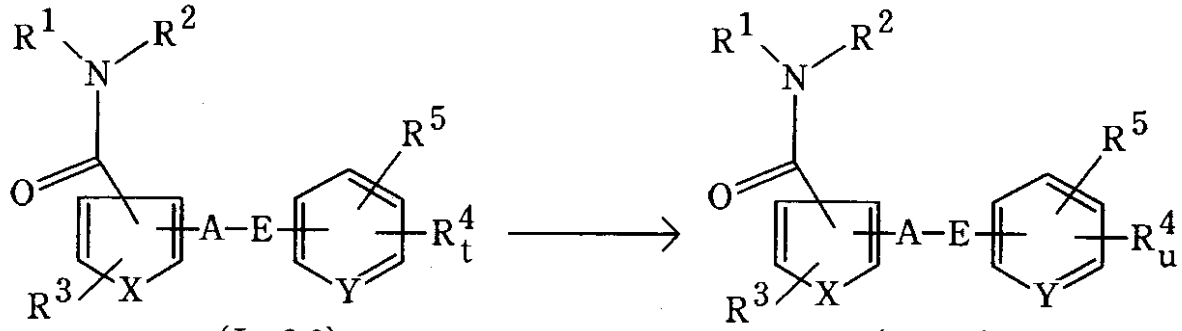
方法34



(I−24)
またはその塩

(I−25)
またはその塩

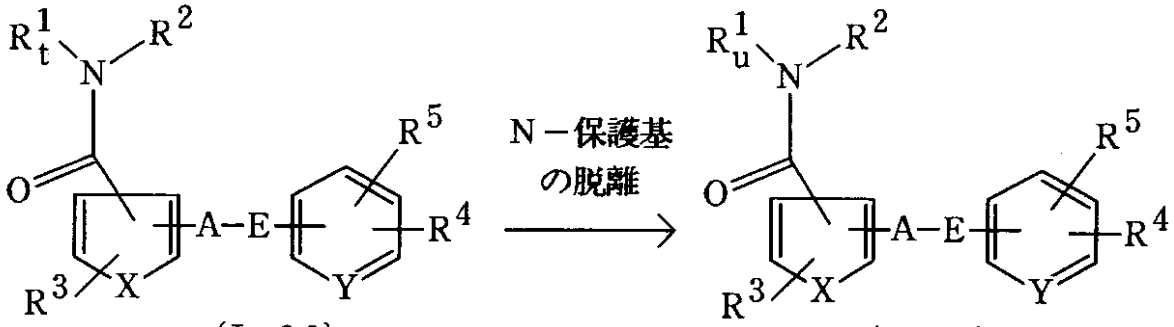
方法35



(I−26)
またはその塩

(I−27)
またはその塩

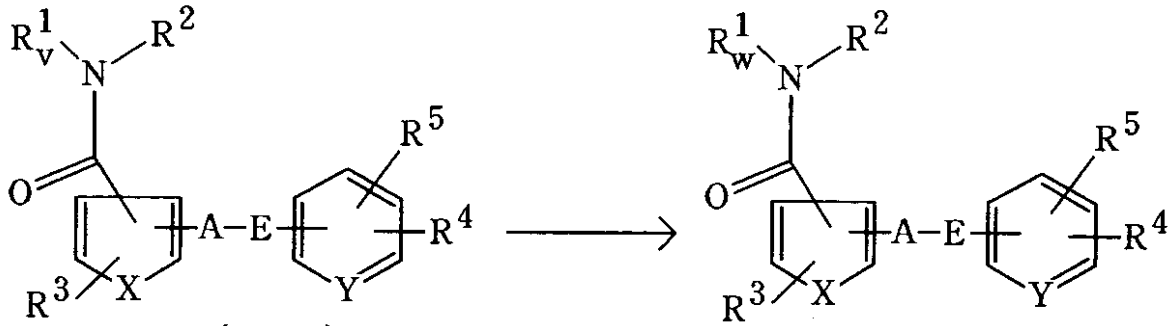
方法36



(I−28)
またはその塩

(I−29)
またはその塩

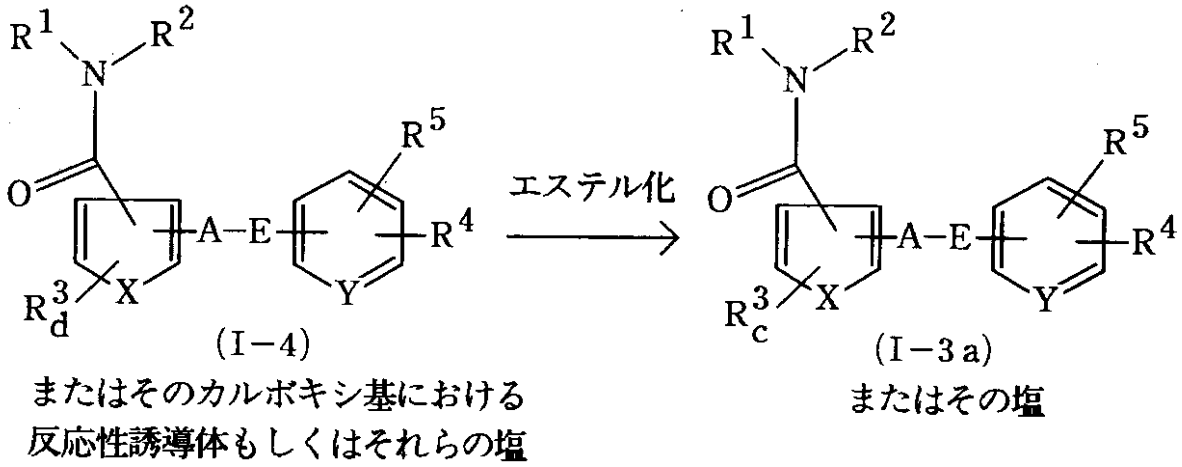
方法37



(I−30)
またはその塩

(I−31)
またはその塩

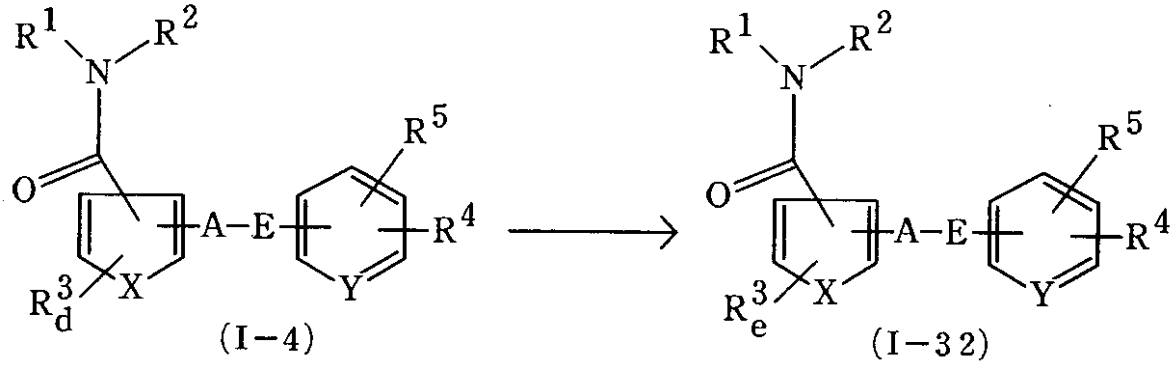
方法38



(I−4)
またはそのカルボキシ基における
反応性誘導体もしくはそれらの塩

(I−3a)
またはその塩

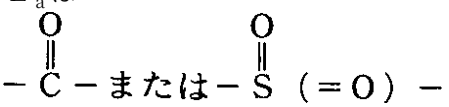
方法39



(I−4)
またはそのカルボキシ基における
反応性誘導体もしくはそれらの塩

(I−32)
またはその塩

上記反応式中、
R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、A、E、XおよびYは各々上に定義した通りであり、
E_aは



であり；
$R^1{}_a$は、各々にエステル化されたカルボキシ；エステル化されたカルボキシもしくはエステル化されたカルボキシ置換アリールで置換された低級アルケニル；エステル化されたカルボキシ、エステル化されたカルボキシ低級アルカノイルオキシもしくはエステル化されたカルボキシ低級アルコキシイミノで置換された低級アルキル；エステル化されたカルボキシで置換された低級アルキルチオ；エステル化されたカルボキシ置換アリール、エステル化されたカルボキシ置換ピリジル、エステル化されたカルボキシ低級アルキルアミノ、N−保護されたエステル化されたカルボキシ低級アルキルアミノ、N−エステル化されたカルボキシ低級アルキル−N−低級アルキルアミノ、エステル化されたカルボキシもしくはエステル化されたカルボキシ低級アルコキシイミノで置換されたアルコキシ；もしくはエステル化されたカルボキシで置換された低級アルケニルオキシ；で置換されたアリール、ハロアリール、シクロ低級アルキルもしくは複素環基であり；
$R^1{}_b$は、各々にカルボキシ；カルボキシもしくはカルボキシ置換アリールで置換された低級アルケニル；カルボキシ、カルボキシ低級アルカノイルオキシもしくはカルボキシ低級

アルコキシイミノで置換された低級アルキル；カルボキシで置換された低級アルキルチオ；カルボキシ置換アリール、カルボキシ置換ピリジル、カルボキシ低級アルキルアミノ、Ｎ－保護されたカルボキシ低級アルキルアミノ、Ｎ－カルボキシ低級アルキル－Ｎ－低級アルキルアミノ、カルボキシもしくはカルボキシ低級アルコキシイミノで置換されたアルコキシ；もしくはカルボキシで置換された低級アルケニルオキシ；で置換されたアリール、ハロアリール、シクロ低級アルキルもしくは複素環基であり；

$R^4{}_a$は、エステル化されたカルボキシで置換された低級アルコキシ；エステル化されたカルボキシで置換された低級アルキルチオ；エステル化されたカルボキシで置換された低級アルキル；または、エステル化されたカルボキシで置換された低級アルケニルであり；

$R^4{}_b$は、カルボキシで置換された低級アルコキシ；カルボキシで置換された低級アルキルチオ；カルボキシで置換された低級アルキル；または、カルボキシで置換された低級アルケニルであり；

$R^4{}_c$は保護されたアミノ；Ｎ－保護されたピペリジルオキシ；Ｎ－保護されたアミノ低級アルキルアミノ；保護されたアミノで置換された低級アルコキシ；保護されたアミノで置換された低級アルキルチオ；保護されたアミノで置換された低級アルキル；保護されたアミノで置換された低級アルキニル；または、Ｎ－保護されたアミノ低級アルキルスルホニルであり；

$R^4{}_d$はアミノ；ピペリジルオキシ；アミノ低級アルキルアミノ；アミノで置換された低級アルコキシ；アミノで置換された低級アルキルチオ；アミノで置換された低級アルキル；アミノで置換された低級アルキニル；またはアミノ低級アルキルスルホニルであり；

$R^1{}_c$は、各々に置換または無置換Ｎ－含有複素環カルボニル；カルバモイル；置換または無置換低級アルキルカルバモイル；置換または無置換Ｎ－含有複素環カルボニル、カルバモイル、置換または無置換低級アルキルカルバモイルもしくはＮ－含有複素環カルボニル置換アリールで置換された低級アルケニル；置換または無置換Ｎ－含有複素環カルボニル、カルバモイル、置換または無置換低級アルキルカルバモイル、置換または無置換Ｎ－含有複素環カルボニル低級アルカノイルオキシ、カルバモイル低級アルカノイルオキシ、置換または無置換低級アルキルカルバモイル低級アルカノイルオキシ、置換または無置換Ｎ－含有複素環カルボニル低級アルコキシイミノ、カルバモイル低級アルコキシイミノもしくは置換または無置換低級アルキルカルバモイル低級アルコキシイミノで置換された低級アルキル；置換または無置換Ｎ－含有複素環カルボニル、カルバモイルもしくは置換または無置換低級アルキルカルバモイルで置換された低級アルキルチオ；置換または無置換Ｎ－含有複素環カルボニル置換アリール、カルバモイル置換アリール、置換または無置換低級アルキルカルバモイル置換アリール、置換または無置換Ｎ－含有複素環カルボニル置換ピリジル、カルバモイル置換ピリジル、置換または無置換低級アルキルカルバモイル置換ピリジル、置換または無置換Ｎ－含有複素環カルボニル低級アルキルアミノ、カルバモイル低級アルキルアミノ、置換または無置換低級アルキルカルバモイル低級アルキルアミノ、Ｎ－保護された（置換または無置換Ｎ－含有複素環）カルボニル低級アルキルアミノ、Ｎ－保護されたカルバモイル低級アルキルアミノ、Ｎ－保護された置換または無置換低級アルキルカルバモイル低級アルキルアミノ、Ｎ－（置換または無置換Ｎ－含有複素環）カルボニル低級アルキル－Ｎ－低級アルキルアミノ、Ｎ－カルバモイル低級アルキル－Ｎ－低級アルキルアミノ、置換または無置換Ｎ－低級アルキルカルバモイル－Ｎ－低級アルキルアミノ、置換または無置換Ｎ－含有複素環カルボニル、カルバモイル、アミノカルバモイル、ピリジルカルバモイル、Ｎ－低級アルキルピペラジニルカルボニル、置換または無置換低級アルキルカルバモイル、置換または無置換Ｎ－含有複素環カルボニル低級アルコキシイミノ、カルバモイル低級アルコキシイミノもしくは置換または無置換低級アルキルカルバモイル低級アルコキシイミノで置換されたアルコキシ；もしくは置換または無置換Ｎ－含有複素環カルボニル、カルバモイルもしくは置換または無置換低級アルキルカルバモイルで置換された低級アルケニルオキシ；で置換されているアリール、ハロアリール、シクロ低級アルキルもしくは複素環基であり；

$R^4{}_e$は、各々に置換または無置換Ｎ－含有複素環カルボニル、カルバモイルもしくは置換

または無置換低級アルキルカルバモイルで置換されている低級アルコキシ、低級アルキルチオ、低級アルキルもしくは低級アルケニルであり；
$R^{4}{}_{f}$は、アリールもしくは置換アルールで置換されているメトキシ；またはアリールもしくは置換アリールで置換されたメトキシで置換されている低級アルキルチオであり；
$R^{4}{}_{g}$はヒドロキシ；またはヒドロキシで置換された低級アルキルチオであり；
$R^{4}{}_{ga}$はヒドロキシであり；
R^{7}は、ヒドロキシ、アリール、置換アリール、アシル、アミノ、低級アルキルアミノ、アシルアミノ、保護されたアミノもしくは複素環基で置換されている低級アルキル；またはＮ－保護されたピペリジルであり；
Z^{1}はヒドロキシ；または酸残基であり；
$R^{4}{}_{h}$は、ヒドロキシ、アリール、置換アリール、アシル、アミノ、低級アルキルアミノ、アシルアミノ、保護されたアミノもしくは複素環基で置換されている低級アルコキシ；またはＮ－保護されたピペリジルオキシであり；
$R^{4}{}_{da}$はアミノで置換された低級アルコキシ；アミノで置換された低級アルキルチオ；またはアミノで置換された低級アルキルであり；
$R^{4}{}_{i}$は、アシルアミノもしくは置換アシルアミノで置換された低級アルコキシ；アシルアミノもしくは置換アシルアミノで置換された低級アルキルチオ；またはアシルアミノもしくは置換アシルアミノで置換された低級アルキルであり；
$R^{4}{}_{db}$はアミノ；アミノで置換された低級アルコキシ；アミノで置換された低級アルキルチオ；またはアミノで置換された低級アルキルであり；
$R^{4}{}_{j}$は低級アルキルアミノで置換された低級アルコキシ；低級アルキルアミノで置換された低級アルキルチオ；低級アルキルアミノで置換された低級アルキル；またはＮ－保護されたアミノ低級アルキルアミノであり；
$R^{4}{}_{k}$はアシルオキシであり；
Z^{2}は酸残基であり；
E_{b}は低級アルキレンであり；
R^{4}lは、アミノもしくは保護されたアミノで置換された低級アルキルチオであり；
$R^{4}{}_{m}$は、アミノもしくは保護されたアミノで置換された低級アルキルスルフィニルまたはアミノもしくは保護されたアミノで置換された低級アルキルスルホニルであり；
E_{c}は低級アルケニレンであり；
$R^{1}{}_{d}$は、アリールもしくは置換アリールで置換されたメトキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{e}$はヒドロキシで置換されているアリールであり；
Z^{3}はヒドロキシ；または酸残基であり；
R^{8}は、アシル、アシルアミノ、保護されたアミノ、アリール、置換アリール、アシル置換ピリジルもしくはＮ－保護されたグアニジノで置換されていてもよい低級アルキルであり；
$R^{1}{}_{f}$は、アシル、アシルアミノ、保護されたアミノ、アリール、置換アリール、アシル置換ピリジルもしくはＮ－保護されたグアニジノで置換されていてもよい低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{3}{}_{a}$はアリールで置換されているメトキシ；アシルオキシ；または置換アシルオキシであり；
Z^{4}は酸残基であり；
R^{9}はエステル化されたカルボキシで置換されていてもよい低級アルキルであり；
$R^{3}{}_{b}$はエステル化されたカルボキシで置換されていてもよい低級アルコキシであり；
$R^{3}{}_{c}$はエステル化されたカルボキシで置換された低級アルコキシであり；
$R^{3}{}_{d}$はカルボキシで置換された低級アルコキシであり；
$R^{4}{}_{n}$はハロゲンであり；
$R^{4}{}_{o}$は、ヒドロキシ、アミノ、保護されたアミノ、低級アルキルスルホニルオキシもしくはアリールスルホニルオキシで置換されていてもよい低級アルキニルであり；

$R^{4}{}_{p}$は、各々にヒドロキシで置換されている低級アルキルチオ、低級アルキルもしくは低級アルキニルであり；
Z^{5}はハロゲンであり；
R^{10}は低級アルキルスルホニルまたはアリールスルホニルであり；
$R^{4}{}_{q}$は、各々に低級アルキルスルホニルオキシもしくはアリールスルホニルオキシで置換されている低級アルキルチオ、低級アルキルもしくは低級アルキニルであり；
$R^{4}{}_{r}$は、各々にフタルイミドで置換されている低級アルキルチオ、低級アルキルもしくは低級アルキニルであり；
$R^{4}{}_{s}$は、ヒドロキシ、アミノ、保護されたアミノ、低級アルキルスルホニルオキシもしくはアリールスルホニルオキシで置換されていてもよい低級アルキルであり；
E_{d}は単結合または低級アルキレンであり；
Z^{6}は酸残基であり；
$R^{2}{}_{a}$は、アリールもしくはアシルで置換されていてもよい低級アルキルであり；
$R^{1}{}_{g}$はアミノで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{h}$は、アシルアミノもしくは置換アシルアミノで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{i}$はオキソピペリジルカルボニルで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{j}$はヒドロキシピペリジルカルボニルで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{k}$は、ホルミルもしくはオキソピペリジルカルボニルで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
R^{1}lは、アミノピペリジルカルボニルもしくはＮ－低級アルキルピペラジニルで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{m}$はカルボキシで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{n}$は低級アルキルアミノ低級アルコキシカルボニルで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{o}$はエステル化されたカルボキシで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{p}$はヒドロキンで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{q}$はホルミルで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{r}$はシアノ置換アリールで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{s}$はテトラゾリル置換アリールで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{4}{}_{t}$はアミノで置換された低級アルコキシであり；
$R^{4}{}_{u}$はグアニジノで置換された低級アルコキシであり；
$R^{1}{}_{t}$は、保護されたアミノ、Ｎ－保護されたアミノ低級アルカノイルアミノ、Ｎ－保護されたピペラジニルカルボニルもしくはＮ－保護されたグアニジノで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{u}$は、アミノ、アミノ低級アルカノイルアミノ、ピペラジニルカルボニルもしくはグアニジノで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{v}$フェノキシカルボニルアミノで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{1}{}_{w}$は、Ｎ－低級アルキルピペラジニルカルボニルアミノ、ジメチルアミノピペリジルカルボニルアミノ、カルバモイルアミノもしくはジメチルカルバモイルアミノで置換された低級アルコキシで置換されているアリールであり；
$R^{3}{}_{e}$は低級アルキルで置換されていてもよいカルバモイルで置換されている低級アルコキシである。
本明細書の上記および後記の説明において本発明の範囲に包含されるべき種々の定義の好

適な例を、以下に詳細に説明する。
「低級」なる語は、とくに断らないかぎり、炭素原子数１～６の基を意味するものとする。
「高級」なる語は、とくに断らないかぎり、炭素原子数７～２０の基を意味するものとする。
「シクロ低級アルキル」および「シクロ低級アルキルオキシ」なる表現における低級なる部分は、炭素原子数３～６の基を意味するものとする。
「低級アルケニル」、「低級アルケニルオキシ」および「低級アルキニル」なる表現における低級なる部分は、炭素原子数２～６の基を意味するものとする。
「アルコキシ」なる表現は、低級アルコキシおよび高級アルコキシを包含しうるものである。
好適な「低級アルコキシ」ならびに「アシル低級アルコキシ」、「アシル低級アルコキシイミノ」、「エステル化されたカルボキシ低級アルコキシイミノ」、「カルボキシ低級アルコキシイミノ」、「Ｎ－含有複素環カルボニル低級アルコキシイミノ」、「カルバモイル低級アルコキシイミノ」、「低級アルキルカルバモイル低級アルコキシイミノ」、「低級アルコキシカルボニル」および「アル低級アルコキシ」なる表現における好適な低級アルコキシ部分としては、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、メチルプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、第三級ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシなどの直鎖状または分枝鎖状のC_1～C_6アルコキシが挙げられる。
好適な「高級アルコキシ」としては、ヘプチルオキシ、オクチルオキシ、ノニルオキシ、デシルオキシ、ウンデシルオキシ、ドデシルオキシ、トリデシルオキシ、テトラデシルオキシ、ペンタデシルオキシ、ヘキサデシルオキシ、ヘプタデシルオキシ、オクタデシルオキシ、ノナデシルオキシ、イコシルオキシ、メチルヘプチルオキシ、メチルオクチルオキシ、メチルノニルオキシ、メチルデシルオキシ、エチルヘプチルオキシ、エチルオクチルオキシ、エチルノニルオキシ、エチルデシルオキシなどの直鎖状または分枝鎖状のC_7～C_{20}アルコキシが挙げられ、なかでも好ましいのはヘプチルオキシである。
好適な「低級アルキル」ならびに「アシル低級アルキルスルフィニル」、「アシル低級アルキルスルホニル」、「低級アルキルアミノ低級アルキルカルバモイルオキシ」、「アシル低級アルキルアミノ」、「Ｎ－保護されたアシル低級アルキルアミノ」、「Ｎ－アシル低級アルキル－Ｎ－低級アルキルアミノ」、「低級アルキルヒドラジノカルボニルアミノ」、「エステル化されたカルボキシ低級アルキルアミノ」、「Ｎ－保護されたエステル化されたカルボキシ低級アルキルアミノ」、「Ｎ－エステル化されたカルボキシ低級アルキル－Ｎ－低級アルキルアルキルアミノ」、「カルボキシ低級アルキルアミノ」、「Ｎ－保護されたカルボキシ低級アルキルアミノ」、「Ｎ－カルボキシ低級アルキル－Ｎ－低級アルキルアルキルアミノ」、「低級アルキルカルバモイル」、「低級アルキルカルバモイル低級アルカノイルオキシ」、「低級アルキルカルバモイル低級アルコキシイミノ」、「低級アルキルチオ」、「Ｎ－保護された（置換または無置換Ｎ－含有複素環）カルボニル低級アルキルアミノ」、「Ｎ－保護されたカルバモイル低級アルキルアミノ」、「Ｎ－保護された置換または無置換低級アルキルカルバモイル低級アルキルアミノ」、「Ｎ－（置換または無置換Ｎ－含有複素環）カルボニル低級アルキル－Ｎ－低級アルキルアミノ」、「Ｎ－カルバモイル低級アルキル－Ｎ－低級アルキルアミノ」、「Ｎ－低級アルキルカルバモイル－Ｎ－低級アルキルアミノ」、「低級アルキルカルバモイル低級アルコキシイミノ」、「１－ヒドロキシ低級アルキル」、「１－低級アルキルアミノ低級アルキル」、「モノ低級アルキルアミノ」、「アシル低級アルキル」、「ジ低級アルキルアミノ」、「低級アルキルスルフィニル」、「低級アルキルスルホニル」、「低級アルキルアミノ」、「アミノ低級アルキルアミノ」、「Ｎ－保護されたアミノ低級アルキルアミノ」、「低級アルキルスルホニルオキシ」、「アミノ低級アルキルスルホニル」、「Ｎ－保護されたアミノ低級アルキルスルホニル」、「低級アルキルアミノスルホニル」、「アミノ低級アルキルスルフィニル」および「Ｎ－保護されたアミノ低級アルキルスルフィニル」なる表現における好適な低級アルキル部分としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチ

ル、イソブチル、第三級ブチル、ペンチル、エチルプロピル、ヘキシルなどの直鎖状または分枝鎖状のC_1～C_6アルキルが挙げられる。
好適な「シクロ低級アルキル」ならびに「シクロ低級アルキルオキシ」なる表現における好適なシクロ低級アルキル部分としては、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどのシクロC_3～C_6アルキルが挙げられ、なかでも好ましいのはシクロペンチルまたはシクロヘキシルである。
好適な「低級アルケニル」ならびに「低級アルケニルオキシ」なる表現における好適な低級アルケニル部分としては、エテニル、プロペニル、ペンテニル、イソプロペニル、ブテニル、ヘキセニルなどの直鎖状または分枝鎖状のC_2～C_6アルケニルが挙げられ、なかでも好ましいのはエテニル、プロペニル、ペンテニル、ヘキセニルである。
好適な「低級アルキニル」としては、エチニル、プロパルギル、ブチニルなどのC_2～C_6アルキニルが挙げられ、なかでも好ましいのはブチニルである。
好適な「アリール」ならびに「ハロアリール」、「アリールスルホニル」、「アシル置換アリール」、「アル低級アルコキシ」、「置換アル低級アルコキシ」および「アリールスルホニルオキシ」なる表現における好適なアリール部分としては、フェニル、ナフチル、低級アルキルで置換されたフェニル（たとえばトリル、キシリル、メシチル、クメニル、ジ第三級ブチルフェニルなど）などが挙げられ、なかでも好ましいのはフェニル、トリル、キシリルである。
好適な「置換アリール」としては、アシル、置換アシル、Ｎ－保護されたピペラジニルスルホニル、ピペラジニルスルホニル、Ｎ－低級アルキルピペラジニルスルホニル、ヒドロキシ低級アルキル、複素環低級アルキル、ハロゲン、ニトロ、アミノ、低級アルキルアミノ、複素環基〔たとえばチアゾリル、オキサゾリル、テトラゾリル、オキサゾリニル、ピリジル、ピリミジニル、低級アルキルおよびシアノで置換されていてもよいピロリルなど〕、シアノ、低級アルコキシなどの適当な置換基で置換されたアリールが挙げられ、なかでも、R^1のアルコキシの置換基として好ましいのは、Ｎ－メチルピペラジニルスルホニル、Ｎ－ｔ－ブトキシカルボニルピペラジニルスルホニル、ピペラジニルスルホニル、カルボキシ、エステル化されたカルボキシ、Ｎ－低級アルキルピペラジニルカルボニル、低級アルカノイル、ヒドロキシ低級アルキル、Ｎ－低級アルキルピペラジニル低級アルキル、チアゾリル、オキサゾリル、テトラゾリル、オキサゾリニル、ピリジル、ピリミジニル、低級アルキルおよびシアノで置換されたピロリル、シアノ、低級アルコキシ、低級アルキルアミノピペリジルカルボニルで置換されたアリールであり、R^4のそれとして好ましいのは、ハロゲン、ニトロ、アミノ、低級アルキルアミノもしくは低級アルコキシで置換されたアリールである。
好適な「ハロゲン」ならびに「ハロアリール」なる表現における好適なハロゲン部分としては、弗素、塩素、臭素および沃素が挙げられ、なかでも好ましいのは塩素、臭素である。
好適な「低級アルキルアミノ」ならびに「低級アルキルアミノ低級アルキルカルバモイルオキシ」、「アシル低級アルキルアミノ」、「エステル化されたカルボキシ低級アルキルアミノ」、「カルボキシ低級アルキルアミノ」、「Ｎ－含有複素環カルボニル低級アルキルアミノ」、「カルバモイル低級アルキルアミノ」、「低級アルキルカルバモイル低級アルキルアミノ」、「アミノ低級アルキルアミノ」、「Ｎ－保護されたアミノ低級アルキルアミノ」、「低級アルキルアミノスルホニル」および「低級アルキルアミノピペリジルカルボニル」なる表現における好適な低級アルキルアミノ部分としては、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、第三級ブチルアミノ、イソブチルアミノ、ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ、ジイソプロピルアミノ、ジペンチルアミノ、ジヘキシルアミノ、Ｎ－メチルエチルアミノなどのモノまたはジ低級アルキルアミノが挙げられ、なかでも好ましいのはメチルアミノ、ジメチルアミノまたはジエチルアミノである。
好適な「１－ヒドロキシ低級アルキル」としては、ヒドロキシメチル、１－ヒドロキシエ

チル、１－ヒドロキシプロピル、１－ヒドロキシブチル、１－ヒドロキシ－３－メチルプロピルなどの１－ヒドロキシC_1～C_6アルキルが挙げられ、なかでも好ましいのはヒドロキシメチル、１－ヒドロキシエチルである。
好適な「１－低級アルキルアミノ低級アルキル」としては、メチルアミノメチル、ジメチルアミノメチル、１－メチルアミノエチル、１－ジメチルアミノエチル、エチルアミノメチル、１－エチルアミノエチルなどの１－モノまたはジC_1～C_6アルキルアミノC_1～C_6アルキルが挙げられ、なかでも好ましいのはメチルアミノメチル、ジメチルアミノメチル、１－メチルアミノエチル、１－ジメチルアミノエチルである。
好適な「複素環基」としては、窒素原子、硫黄原子および酸素原子のうちから選ばれた少なくとも１個のヘテロ原子を含有するものが挙げられ、これには置換または無置換単環式または多環式複素環基が包含され、好ましい複素環基としては、Ｎ－含有複素環基、たとえば、１～４個の窒素原子を含有する不飽和３～６員複素単環基、たとえばピロリル、ピロリニル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、トリアゾリル〔たとえば４Ｈ－１，２，４－トリアジニル、１Ｈ－１，２，３－トリアジニル、２Ｈ－１，２，３－トリアジニルなど〕、テトラゾリル〔たとえば１Ｈ－テトラゾリル、２Ｈ－テトラゾリルなど〕など；
１～４個の窒素原子を含有する飽和３～７員複素単環基、たとえばピロリジニル、イミダゾリジニル、ピペリジル、ピペラジニル、ホモピペラジニルなど；
１～５個の窒素原子を含有する不飽和縮合複素環基、たとえばインドリル、イソインドリル、インドリジニル、ベンゾイミダゾリル、キノリル、イソキノリル、イミダゾピリジル、インダゾリル、ベンゾトリアゾリル、テトラゾロピリダジニル〔たとえばテトラゾロ〔１，５－ｂ〕ピリダジニルなど〕など；
１個の酸素原子を含有する不飽和３～６員複素単環基、たとえばピラニル、フリルなど；
１個の酸素原子を含有する飽和３～６員複素単環基、たとえば１Ｈ－テトラヒドロピラニル、テトラヒドロフリルなど；
１～２個の硫黄原子を含有する不飽和３～６員複素単環基、たとえばチエニルなど；
１～２個の酸素原子および１～３個の窒素原子を含有する不飽和３～６員複素単環基、たとえばオキサゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル〔たとえば１，２，４－オキサジアゾリル、１，３，４－オキサジアゾリル、１，２，５－オキサジアゾリルなど〕、オキサゾリニル〔たとえば２－オキサゾリニルなど〕など；
１～２個の酸素原子および１～３個の窒素原子を含有する飽和３～６員複素単環基〔たとえばモルホリニルなど〕；
１～２個の酸素原子および１～３個の窒素原子を含有する不飽和縮合複素環基〔たとえばベンゾフラザニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾオキサジアゾリルなど〕；
１～２個の硫黄原子および１～３個の窒素原子を含有する不飽和３～６員複素単環基、たとえばチアゾリル、チアジアゾリル〔たとえば１，２，４－チアジアゾリル、１，３，４－チアジアゾリル、１，２，５－チアジアゾリルなど〕など；
１～２個の硫黄原子および１～３個の窒素原子を含有する飽和３～６員複素単環基〔たとえばチアゾリジニルなど〕；
１～２個の硫黄原子および１～３個の窒素原子を含有する不飽和縮合複素環基〔たとえばベンゾチアゾリル、ベンゾチアジアゾリルなど〕；
１～２個の酸素原子を含有する不飽和縮合複素環基〔たとえばベンゾフラニル、ベンゾジオキソリルなど〕などが挙げられる。
該「複素環基」は、上に例示したごとき低級アルキルまたはオキソで置換されていてもよく、なかでも好ましいのはＮ－メチルピペラジニル、テトラゾリル、モルホリニル、ピロリジニル、Ｎ－メチルピペリジル、Ｎ－メチルホモピペラジニル、１Ｈ－テトラヒドロピラニル、チエニル、ピリジル、ピペリジル、オキソピペリジルである。
好適な「アシル」ならびに「アシル低級アルキルスルフィニル」、「アシル低級アルキルスルホニル」、「アシルオキシ」、「アシルアミノ」、「アシル低級アルカノイルオキシ」、「アシル低級アルコキシイミノ」、「アシル低級アルキルアミノ」、「Ｎ－保護され

たアシル低級アルキルアミノ」、「Ｎ－アシル低級アルキル－Ｎ－低級アルキルアミノ」および「アシル低級アルコキシ」なる表現における好適なアシル部分としては、カルボキシ、エステル化されたカルボキシ、カルバモイル、低級アルキルカルバモイル、低級アルカノイル、アロイル、複素環カルボニルなどが挙げられる。
該エステル化されたカルボキシとしては、置換または無置換低級アルコキシカルボニル〔たとえばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、第三級ブトキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、２－ヨードエトキシカルボニル、２，２，２－トリクロロエトキシカルボニル、ジメチルアミノプロポキシカルボニル、ジメチルアミノエトキシカルボニルなど〕、置換または無置換アリールオキシカルボニル〔たとえばフェノキシカルボニル、４－ニトロフェノキシカルボニル、２－ナフチルオキシカルボニルなど〕、置換または無置換アル低級アルコキシカルボニル〔たとえばベンジルオキシカルボニル、フェネチルオキシカルボニル、ベンズヒドリルオキシカルボニル、４－ニトロベンジルオキシカルボニル、３－メトキシ－４－ニトロベンジルオキシカルボニルなど〕、Ｎ－含有複素環オキシカルボニル〔たとえばＮ－メチルピペリジルオキシカルボニルなど〕などが挙げられ、なかでも好ましいのは低級アルコキシカルボニル、Ｎ－メチルピペリジルオキシカルボニル、ジメチルアミノプロポキシカルボニル、ジメチルアミノエトキシカルボルである。
該低級アルキルカルバモイルとしては、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル、プロピルカルバモイル、ジメチルカルバモイル、ジエチルカルバモイル、Ｎ－メチル－Ｎ－エチルカルバモイルなどのモノまたはジ低級アルキルカルバモイルが挙げられる。
該低級アルカノイルとしては、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ヘキサノイル、トリフルオロアセチルなどの置換または無置換C_1～C_6アルカノイルが挙げられ、なかでも好ましいのはホルミル、アセチル、ブチリルである。
該アロイルとしては、ベンゾイル、ナフトイル、トルオイル、ジ第三級ブチルベンゾイルなどが挙げられ、なかでも好ましいのはベンゾイルである。
「複素環カルボニル」、「複素環オキシカルボニルアミノ」および「複素環スルホニル」なる表現における複素環部分としては、複素環基として上に述べたものが挙げられる。
好ましい「複素環カルボニル」は、Ｎ－含有複素環カルボニルである。
該「Ｎ－含有複素環カルボニル」は、上記複素環基中に少なくとも１個の窒素原子を含有するものであり、なかでも好ましいのはＮ－低級アルキルピペラジニルカルボニル（たとえばＮ－メチルピペラジニルカルボニルなど）、Ｎ－低級アルキルホモピペラジニルカルボニル（たとえばＮ－メチルホモピペラジニルカルボニルなど）、ピペラジニルカルボニル、ピロリジニルカルボニル、ピペリジルカルボニル、モルホリノカルボニル、低級アルキルピペリジルカルボニル（たとえばメチルピペリジルカルボニルなど）またはオキソピペリジルカルボニルである。
好適な「置換アシル」としては、アミノ、複素環基〔たとえばＮ－低級アルキルピペラジニル、ピリジルなど〕、低級アルキルスルホニルもしくはアリールスルホニルで置換されたカルバモイル、置換低級アルキルカルバモイル〔たとえばＮ－低級アルキルアミノ－Ｎ－低級アルキルカルバモイル、ピリジル低級アルキルカルバモイル、モルホリノ低級アルキルカルバモイル、ビス（ヒドロキシ低級アルキル）カルバモイル、ヒドロキシ低級アルキルカルバモイル、カルバモイル低級アルキルカルバモイル、低級アルキルアミノ低級アルキルカルバモイル、Ｎ－低級アルキル－Ｎ－低級アルキルカルバモイルなど〕、置換Ｎ－含有複素環カルボニル〔たとえばトリフルオロアセチルピペラジニルカルボニル、ピリジルピペラジニルカルボニル、ヒドロキシピペリジルカルボニル、ジメチルアミノピペリジルカルボニル、ジエチルアミノピペリジルカルボニル、カルバモイルピロリジニルカルボニル、ジメチルアミノピペラジニルカルボニル、ヒドロキシエトキシエチルピペラジニルカルボニル、ピロリジニルカルボニルメチルピペラジニルカルボニルなど〕、Ｎ－保護されたＮ－含有複素環カルボニル〔たとえばＮ－ｔ－ブトキシカルボニルピペリジルカルボニル、Ｎ－ｔ－ブトキシカルボニルピペラジニルカルボニルなど〕、Ｎ－保護されたア

ミノ低級アルカノイル、アミノ低級アルカノイル、ベンジルオキシベンゾイルなどが挙げられる。
「保護されたアミノ」における「Ｎ－保護基」としては、置換または無置換低級アルカノイル〔たとえばホルミル、アセチル、プロピオニル、トリフルオロアセチルなど〕、フタロイル、低級アルコキシカルボニル〔たとえば第三級ブトキシカルボニル、第三級アミルオキシカルボニルなど〕、置換または無置換アラルキルオキシカルボニル〔たとえばベンジルオキシカルボニル、ｐ－ニトロベンジルオキシカルボニルなど〕、９－フルオレニルメトキシカルボニル、置換または無置換アレーンスルホニル〔たとえばベンゼンスルホニル、トシルなど〕、ニトロフェニルスルフェニル、アラルキル〔たとえばトリチル、ベンジルなど〕などの常用のＮ－保護基が挙げられ、なかでも好ましいのはフタロイル、第三級ブトキシカルボニル、９－フルオレニルメトキシカルボニルである。
「Ｎ－保護されたグアニジノ」における「Ｎ－保護基」としては、低級アルコキシカルボニル〔たとえば第三級ブトキシカルボニルなど〕などの常用のＮ－保護基が挙げられる。
好適な「酸残基」としては、ハロゲン〔たとえばフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード〕、アレーンスルホニルオキシ〔たとえばベンゼンスルホニルオキシ、トシルオキシなど〕、アルカンスルホニルオキシ〔たとえばメシルオキシ、エタンスルホニルオキシなど〕などが挙げられ、なかでも好ましいのはハロゲンである。
好適な「低級アルキルスルホニル」ならびに「低級アルキルスルホニルオキシ」なる表現における好適な低級アルキルスルホニル部分としては、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニルなどのC_1～C_6アルキルスルホニルが挙げられ、なかでも好ましいのはメチルスルホニルである。
好適な「低級アルキレン」としては、メチレン、エチレン、プロピレンなどの直鎖状または分枝鎖状のC_1～C_6アルキレンが挙げられ、なかでも好ましいのはメチレン、エチレンである。
好適な「低級アルケニレン」としては、エテニレン、プロペニレンなどの直鎖状または分枝鎖状のC_2～C_6アルケニレンが挙げられ、なかでも好ましいのはエテニレンである。
R^1におけるアリールの置換基は複数でもよく、かかる場合の置換基は同一であっても異なっていてもよい。
R^1における好ましい「アリール」はフェニルもしくは低級アルキルで置換されたフェニルである。
R^1における好ましい「シクロ低級アルキル」はシクロペンチルである。
R^1における好ましい「複素環基」はピリジルまたはチエニルである。
好ましい化合物（Ｉ）は、R^1が、アシルアミノもしくはアシルで置換されていてもよい低級アルコキシで置換されていてもよいアリール（より好ましくはフェニルまたは低級アルキルで置換されたフェニル）であり、R^2が低級アルキルであり、R^3が水素、低級アルキルまたは低級アルコキシであり、R^4がヒドロキシまたは各々にヒドロキシ、アリール、置換アリール、アシル、アミノ、低級アルキルアミノ、アシルアミノ、保護されたアミノもしくは複素環基で置換されていてもよい低級アルコキシ、低級アルキルチオまたは低級アルキルであり、R^5が水素、低級アルキル、低級アルコキシまたはハロゲンであり、ＡがNHであり、Ｅが－Ｃ（＝Ｏ）－であり、Ｘが－CH＝CH－であり、ＹがCHであるものである。
より好ましい化合物（Ｉ）は、R^1が各々にＮ－低級アルキルピペラジニルカルボニルで置換された低級アルコキシで置換されているフェニルまたはトリルであり、R^2が低級アルキルであり、R^3が水素、低級アルキルまたは低級アルコキシであり、R^4がアミノで置換された低級アルコキシであり、R^5が水素であり、ＡがNHであり、Ｅが－Ｃ（＝Ｏ）－であり、Ｘが－CH＝CH－であり、ＹがCHであるものである。
とくに好ましい化合物（Ｉ）は、R^1がＮ－低級アルキルピペラジニルカルボニルで置換された低級アルコキシで置換されているトリルであり、R^2が低級アルキルであり、R^3が低級アルコキシであり、R^4がアミノで置換された低級アルコキシであり、R^5が水素であり、ＡがNHであり、Ｅが－Ｃ（＝Ｏ）－であり、Ｘが－CH＝CH－であり、ＹがCHであるも

のである。
目的化合物（Ｉ）の医薬として許容される好適な塩は、慣用の無毒性塩であって、それらとしては、無機酸付加塩〔たとえば塩酸塩、臭化水素酸塩、硫酸塩、燐酸塩など〕、有機酸付加塩〔たとえば蟻酸塩、酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、マレイン酸塩、酒石酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、トルエンスルホン酸塩など〕などの酸付加塩、アルカリ金属塩〔たとえばナトリウム塩、カリウム塩など〕、アルカリ土類金属塩〔たとえばカルシウム塩、マグネシウム塩など〕などが挙げられる。
目的化合物（Ｉ）の製造法を以下に詳細に説明する。
方法１
目的化合物（Ｉａ）またはその塩は、化合物（II）またはその塩を化合物（III）またはそのカルボキシ基またはスルホ基における反応性誘導体もしくはそれらの塩と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉａ）および（II）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
化合物（III）およびそのカルボキシ基またはスルホ基における反応性誘導体の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じ塩基塩を挙げることができる。
化合物（III）のカルボキシ基またはスルホ基における好適な反応性誘導体としては、酸ハロゲン化物、分子内酸無水物、分子間酸無水物および混合酸無水物を含めての酸無水物、活性アミド、活性エステルなどが挙げられる。該反応性誘導体の好適な例としては、酸塩化物；酸アジ化物；置換燐酸〔たとえばジアルキル燐酸、フェニル燐酸、ジフェニル燐酸、ジベンジル燐酸、ハロゲン化燐酸など〕、ジアルキル亜燐酸、亜硫酸、チオ硫酸、硫酸、スルホン酸〔たとえばメタンスルホン酸など〕、脂肪族カルボン酸〔たとえば酢酸、プロピオン酸、酪酸、イソ酪酸、ピバル酸、ペンタン酸、イソペンタン酸、２－エチル酪酸、トリクロロ酢酸など〕、芳香族カルボン酸〔たとえば安息香酸など〕などの酸との混合酸含無水物；対称酸無水物；イミダゾール、４－置換イミダゾール、ジメチルピラゾール、トリアゾールまたはテトラゾールとの活性アミド；活性エステル〔たとえばシアノメチルエステル、メトキシメチルエステル、ジメチルイミノメチル〔$(CH_3)_2N^+=CH-$〕エステル、ビニルエステル、プロパルギルエステル、ｐ－ニトロフェニルエステル、２，４－ジニトロフェニルエステル、トリクロロフェニルエステル、ペンタクロロフェニルエステル、メシルフェニルエステル、フェニルアゾフェニルエステル、フェニルチオエステル、ｐ－ニトロフェニルチオエステル、ｐ－クレジルチオエステル、カルボキシメチルチオエステル、ピラニルエステル、ピリジルエステル、ピペリジルエステル、８－キノリルチオエステルなど〕、Ｎ－ヒドロキシ化合物〔たとえばＮ，Ｎ－ジメチルヒドロキシルアミン、１－ヒドロキシ－２（ＩＨ）－ピリドン、Ｎ－ヒドロキシスクシンイミド、Ｎ－ヒドロキシフタルイミド、１－ヒドロキシ－１Ｈ－ベンゾトリアゾールなど〕とのエステルなどが挙げられる。これらの反応性誘導体は、使用する化合物（III）の種類に応じてそれらの中から適宜選択することができる。
反応は、通常、慣用の溶媒、たとえば水、アルコール〔たとえばメタノール、エタノールなど〕、アセトン、ジオキサン、アセトニトリル、クロロホルム、塩化メチレン、塩化エチレン、テトラヒドロフラン、酢酸エチル、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、ピリジンまたは反応に悪影響を及ぼさないその他の任意の有機溶媒中で実施する。これらの慣用の溶媒は水との混合物として用いることもできる。
この反応において、化合物（III）を遊離酸の形で、またはその塩の形で用いるときには、Ｎ，Ｎ’－ジシクロヘキシルカルボジイミド；Ｎ－シクロヘキシル－Ｎ’－モルホリノエチルカルボジイミド；Ｎ－シクロヘキシル－Ｎ’－（４－ジエチルアミノシクロヘキシル）カルボジイミド；Ｎ，Ｎ’－ジエチルカルボジイミド；Ｎ，Ｎ’－ジイソプロピルカルボジイミド；Ｎ－エチル－Ｎ’－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド；Ｎ，Ｎ’－カルボニルビス（２－メチルイミダゾール）；ペンタメチレンケテン－Ｎ－シクロヘキシルイミン；ジフェニルケテン－Ｎ－シクロヘキシルイミン；エトキシアセチレン；１－アルコキシ－１－クロロエチレン；亜燐酸トリアルキル；ポリ燐酸エチル；ポリ燐

酸イソプロピル；オキシ塩化燐（塩化ホスホリル）；三塩化燐；ジフェニルホスホリルアジド；クロロ燐酸ジフェニル；ジフェニルホスフィン酸クロリド；塩化チオニル；塩化オキサリル；ハロ蟻酸低級アルキル〔たとえばクロロ蟻酸エチル、クロロ蟻酸イソプロピルなど〕；トリフェニルホスフィン；２－エチル－７－ヒドロキシベンゾイソオキサゾリウム塩；水酸化２－エチル－５－（ｍ－スルホフェニル）イソオキサゾリウム分子内塩；１－（ｐ－クロロベンゼンスルホニルオキシ）－６－クロロ－１Ｈ－ベンゾトリアゾール；Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミドと塩化チオニル、ホスゲン、クロロ蟻酸トリクロロメチル、オキシ塩化燐などとの反応により調製されるいわゆるヴィルスマイヤー試薬；などの慣用の縮合剤の存在下で反応を実施するのが好ましい。

反応は、アルカリ金属重炭酸塩、トリ低級アルキルアミン、ピリジン、４－ジメチルアミノピリジン、Ｎ－低級アルキルモルホリン、Ｎ，Ｎ－ジ低級アルキルベンジルアミンなどの無機または有機塩基の存在下で実施することもできる。

反応温度はとくに限定されず、通常、冷却下ないし加熱下で反応を実施する。

方法２

目的化合物（Ｉ）またはその塩は、化合物（IV）またはその塩を化合物（Ｖ）またはそのカルボキシ基における反応性誘導体もしくはそれらの塩と反応させることにより製造できる。

化合物（IV）ならびに（Ｖ）およびそのカルボキシ基における反応誘導体の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。

この反応は方法１と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法１のところでの説明を参照されたい。

方法３

目的化合物（Ｉｃ）またはその塩は、化合物（Ｉｂ）またはその塩を脱エステル反応に付すことにより製造できる。

化合物（Ｉｃ）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。

化合物（Ｉｂ）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じ酸付加塩を挙げることができる。

反応は、加水分解、還元などの常法に従って実施する。

加水分解は、塩基もしくはルイス酸を含めての酸の存在下で実施するのが好ましい。好適な塩基としては、アルカリ金属〔たとえばリチウム、ナトリウム、カリウムなど〕、アルカリ土類金属〔たとえばマグネシウム、カルシウムなど〕、これらの水酸化物もしくは炭酸塩もしくは重炭酸塩、トリアルキルアミン〔たとえばトリメチルアミン、トリエチルアミンなど〕、ピコリン、１，５－ジアザビシクロ〔４．３．０〕ノナ－５－エン、１，４－ジアザビシクロ〔２．２．２〕オクタン、１，８－ジアザビシクロ〔５．４．０〕ウンデカ－７－エンなどの無機塩基および有機塩基が挙げられる。好適な酸としては、有機酸〔たとえば蟻酸、酢酸、プロピオン酸、トリクロロ酢酸、トリフルオロ酢酸など〕、無機酸〔たとえば塩酸、臭化水素酸、沃化水素酸、硫酸など〕およびルイス酸〔たとえば三臭化硼素など〕が挙げられる。

反応は、通常、水、アルコール〔たとえばメタノール、エタノールなど〕、キシレン、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、塩化メチレン、テトラヒドロフラン、これらの混合物などの溶媒または反応に悪影響を及ぼさないその他の任意の溶媒中で実施する。液状の塩基または酸は溶媒としても使用できる。

反応温度はとくに限定されないが、通常は、冷却下ないし加温下で反応を実施する。

還元は、４－ニトロベンジル、２－ヨードエチル、２，２，２－トリフルオロエチルなどのエステル部分の脱離に好ましく適用できる。該脱離反応に適用できる還元法としては、化学還元および接触還元が挙げられる。

化学還元に使用するのに好適な還元剤は、金属〔たとえば錫、亜鉛、鉄など〕もしくは金属化合物〔たとえば塩化クロム、酢酸クロムなど〕と有機酸もしくは無機酸〔たとえば蟻

酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、ｐ－トルエンスルホン酸、塩酸、臭化水素酸など〕との組合せである。
接触還元に使用するのに好適な触媒は、白金触媒〔たとえば白金板、海綿状白金、白金黒、コロイド白金、酸化白金、白金線など〕、パラジウム触媒〔たとえば海綿状パラジウム、パラジウム黒、酸化パラジウム、パラジウム炭、コロイドパラジウム、パラジウム／硫酸バリウム、パラジウム／炭酸バリウムなど〕、ニッケル触媒〔たとえば還元ニッケル、酸化ニッケル、ラネーニッケルなど〕、コバルト触媒〔たとえば還元コバルト、ラネーコバルトなど〕、鉄触媒〔たとえば還元鉄、ラネー鉄など〕、銅触媒〔たとえば還元銅、ラネー銅、ウルマン銅など〕などの慣用のものである。
該還元は、通常、水、アルコール〔たとえばメタノール、エタノール、プロパノールなど〕、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、これらの混合物などの、反応に悪影響を及ぼさない慣用の溶媒中で実施する。なお、化学還元に使用する上記の酸が液状である場合には、それらを溶媒としても利用できる。また、接触還元に使用すべき好適な溶媒としては、上記の溶媒のほか、他の慣用の溶媒、たとえばジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフランなど、またはそれらの混合物が挙げられる。
この還元の反応温度はとくに限定されないが、通常は、冷却下ないし加温下に反応を実施する。
この反応において、R^2がエステル化されたカルボキシで置換された低級アルキルであり、かつ／またはR^4がアシルオキシ、エステル化されたカルボキシで置換された低級アルコキシ、エステル化されたカルボキシで置換された低級アルキルチオまたはエステル化されたカルボキシで置換された低級アルキルである化合物（Ｉｂ）を出発化合物として使用した場合には、反応条件に応じて、R^2がカルボキシで置換された低級アルキルであり、かつ／またはR^4がヒドロキシ、カルボキシで置換された低級アルコキシ、カルボキシで置換された低級アルキルチオまたはカルボキシで置換された低級アルキルである化合物（Ｉｃ）が得られることがある。この場合もこの反応の範囲に包含されるものである。
方法４
目的化合物（Ｉｅ）またはその塩は、化合物（Ｉｄ）またはその塩を脱エステルに付すことにより製造できる。
化合物（Ｉｄ）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じ酸付加塩を挙げることができる。
化合物（Ｉｅ）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
この反応は、方法３での加水分解と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法３における加水分解のところでの説明を参照されたい。
この反応において、R^1が、各々にエステル化されたカルボキシ；エステル化されたカルボキシで置換された低級アルケニル；エステル化されたカルボキシ、エステル化されたカルボキシ低級アルカノイルオキシもしくはエステル化されたカルボキシ低級アルコキシイミノで置換された低級アルキル；エステル化されたカルボキシで置換された低級アルキルチオ；エステル化されたカルボキシ置換アリール、エステル化されたカルボキシ置換ピリジル、エステル化されたカルボキシ低級アルキルアミノ、Ｎ－保護されたエステル化されたカルボキシ低級アルキルアミノ、Ｎ－エステル化されたカルボキシ低級アルキル－Ｎ－低級アルキルアミノ、エステル化されたカルボキシもしくはエステル化されたカルボキシ低級アルコキシイミノで置換されたアルコキシ；もしくはエステル化されたカルボキシで置換された低級アルケニルオキシ；で置換されているアリール、ハロアリール、シクロ低級アルキルまたは複素環基であり、かつ／またはR^2がエステル化されたカルボキシで置換された低級アルキルである化合物（Ｉｄ）を出発化合物として用いた場合には、反応条件にもよるが、R^1が、各々にカルボキシ；カルボキシで置換された低級アルケニル；カルボキシ、カルボキシ低級アルカノイルオキシもしくはカルボキシ低級アルコキシイミノで置換された低級アルキル；カルボキシで置換された低級アルキルチオ；カルボキシ置換

アリール、カルボキシ置換ピリジル、カルボキシ低級アルキルアミノ、Ｎ－保護されたカルボキシ低級アルキルアミノ、Ｎ－カルボキシ低級アルキル－Ｎ－低級アルキルアミノ、カルボキシもしくはカルボキシ低級アルコキシイミノで置換されたアルコキシ；もしくはカルボキシで置換された低級アルケニルオキシ；で置換されているアリール、ハロアリール、シクロ低級アルキルまたは複素環基であり、かつ／またはR^2がカルボキシで置換された低級アルキルである化合物（Ｉｅ）が得られることもある。この場合もこの反応の範囲内に包含されるものである。

方法５

目的化合物（Ｉｇ）またはその塩は、化合物（Ｉｆ）またはその塩をＮ－保護基脱離反応に付すことにより製造できる。

化合物（Ｉｆ）および（Ｉｇ）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じ酸付加塩が挙げられる。

この反応は、加水分解、還元などの常法に従って実施する。

加水分解は、塩基もしくはルイス酸を含めての酸の存在下で実施するのが好ましい。

好適な塩基としては、アルカリ金属〔たとえばナトリウム、カリウムなど〕、アルカリ土類金属〔たとえばマグネシウム、カルシウムなど〕、これらの水酸化物もしくは炭酸塩もしくは重炭酸塩、ヒドラジン、アルキルアミン〔たとえばメチルアミン、トリメチルアミン、トリエチルアミンなど〕、ピコリン、１，５－ジアザビシクロ〔４．３．０〕ノナ－５－エン、１，４－ジアザビシクロ〔２．２．２〕オクタン、１，８－ジアザビシクロ〔５．４．０〕ウンデカ－７－エンなどの無機塩基および有機塩基が挙げられる。

好適な酸としては、有機酸〔たとえば蟻酸、酢酸、プロピオン酸、トリクロロ酢酸、トリフルオロ酢酸など〕、無機酸〔たとえば塩酸、臭化水素酸、硫酸、塩化水素、臭化水素、弗化水素など〕および酸付加塩化合物〔たとえばピリジン塩酸塩など〕が挙げられる。

トリハロ酢酸〔たとえばトリクロロ酢酸、トリフルオロ酢酸など〕などを用いての脱離は、カチオン捕捉剤〔たとえばアニソール、フェノールなど〕の存在下で実施するのが好ましい。

反応は、通常、水、アルコール〔たとえばメタノール、エタノールなど〕、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、テトラヒドロフラン、これらの混合物などの溶媒または反応に悪影響を及ぼさないその他の任意の溶媒中で実施する。液状の塩基または酸は溶媒としても利用できる。反応温度はとくに限定されず、通常、冷却下ないし加熱下に反応を実施する。

該脱離反応に適用しうる還元法としては、化学還元および接触還元が挙げられる。

化学還元に使用するのに好適な還元剤は、金属〔たとえば錫、亜鉛、鉄など〕もしくは金属化合物〔たとえば塩化クロム、酢酸クロムなど〕と有機酸もしくは無機酸〔たとえば蟻酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、ｐ－トルエンスルホン酸、塩酸、臭化水素酸など〕との組合せである。

接触還元に使用するのに好適な触媒は、白金触媒〔たとえば白金板、海綿状白金、白金黒、コロイド白金、酸化白金、白金線など〕、パラジウム触媒〔たとえば海綿状パラジウム、パラジウム黒、酸化パラジウム、パラジウム炭、コロイドパラジウム、パラジウム／硫酸バリウム、パラジウム／炭酸バリウムなど〕、ニッケル触媒〔たとえば還元ニッケル、酸化ニッケル、ラネーニッケルなど〕、コバルト触媒〔たとえば還元コバルト、ラネーコバルトなど〕、鉄触媒〔たとえば還元鉄、ラネー鉄など〕、銅触媒〔たとえば還元銅、ラネー銅、ウルマン銅など〕などの慣用のものである。

Ｎ－保護基がベンジルである場合、パラジウム触媒〔たとえばパラジウム黒、パラジウム炭など〕と蟻酸またはその塩〔たとえば蟻酸アンモニウムなど〕との組合せの存在下で還元を実施するのが好ましい。

該還元は、通常、反応に悪影響を及ぼさない慣用の溶媒、たとえば水、メタノール、エタノール、プロパノール、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミドまたはこれらの混合物中で実施する。なお、化学還元に使用する上記の酸が液状である場合には、それらを溶媒としても利用できる。また、接触還元に使用すべき好適な溶媒としては、上記の溶媒、ジエチルエー

テル、ジオキサン、テトラヒドロフランなどの他の慣用溶媒、またはそれらの混合物が挙げられる。
この還元の反応温度はとくに限定されず、通常、冷却下ないし加熱下で反応を実施する。
この反応において、R^1が、保護されたアミノ、Ｎ－保護されたアミノ低級アルカノイルアミノ、Ｎ－保護されたピペラジニルカルボニルもしくはＮ－保護されたグアニジノで置換されたアルコキシで置換されているアリールである化合物（Ｉｆ）を出発化合物として用いた場合には、反応条件にもよるが、R^1が、アミノ、アミノ低級アルカノイルアミノ、ピペラジニルカルボニルもしくはグアニジノで置換されたアルコキシで置換されているアリールである化合物（Ｉｇ）が得られることもある。この場合もこの反応の範囲に包含されるものである。

方法６

目的化合物（Ｉｈ）またはその塩は、化合物（Ｉｃ）またはそのカルボキシ基における反応誘導体もしくはそれらの塩をアミンまたはその塩と反応させることにより製造できる。
アミンの好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示した通りの酸付加塩が挙げられる。
化合物（Ｉｈ）ならびに（Ｉｃ）およびそのカルボキシ基における反応性誘導体の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
好適な「アミン」としては、アンモニア、置換または無置換低級アルキルアミン、置換または無置換Ｎ－含有複素環式化合物、アミノで置換された複素環式化合物などが挙げられる。
該置換または無置換低級アルキルアミンとしては、モノまたはジ低級アルキルアミン（たとえばメチルアミン、エチルアミン、プロピルアミン、イソプロピルアミン、ブチルアミン、イソブチルアミン、ペンチルアミン、ヘキシルアミン、ジメチルアミン、ジエチルアミン、ジプロピルアミン、ジブチルアミン、ジイソプロピルアミン、ジペンチルアミン、ジヘキシルアミンなど）、ピリジル低級アルキルアミン（たとえばピリジルメチルアミンなど）、低級アルキルアミノ低級アルキルアミン（たとえばＮ－ジメチルアミノエチルアミン、Ｎ－ジメチルアミノプロピルアミン、Ｎ－ジエチルアミノエチル－Ｎ－メチルアミンなど）、モルホリノ低級アルキルアミン（たとえばモルホリノエチルアミンなど）などが挙げられる。
該置換または無置換Ｎ－含有複素環式化合物としては、アミノで置換された複素環化合物（たとえばアミノピリジン、Ｎ－メチル－Ｎ’－アミノピペラジンなど）、Ｎ－含有、Ｎ－およびＳ－含有、またはＮ－およびＳ－含有飽和５または６員複素環式化合物、たとえばピロリジン、イミダゾリジン、ピペリジン、ピペリドン、ピペラジン、低級アルキルアミノピペリジン（たとえばジメチルアミノピペリジンなど）、Ｎ－低級アルキルホモピペラジン（たとえばＮ－メチルホモピペラジンなど）、Ｎ－低級アルキルピペラジン（たとえばＮ－メチルピペラジン、Ｎ－エチルピペラジンなど）、モルホリン、チオモルホリン、Ｎ－ピリジルピペラジン、Ｎ－ヒドロキシ低級アルコキシ低級アルキルピペラジン（たとえばＮ－ヒドロキシエトキシエチルピペラジンなど）、Ｎ－ピロリジニルカルボニル低級アルキルピペラジン（たとえばＮ－ピロリジニルカルボニルメチルピペラジンなど）などが挙げられ、なかでも好ましいのはＮ－メチルピペラジンである。
この反応は、方法１と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法１のところでの説明を参照されたい。

方法７

目的化合物（Ｉｉ）またはその塩は、化合物（Ｉｅ）またはそのカルボキシ基における反応性誘導体もしくはそれらの塩をアミンまたはその塩と反応させることにより製造できる。
アミンの好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示した通りの酸付加塩が挙げられる。
化合物（Ｉｉ）ならびに（Ｉｅ）およびそのカルボキシ基における反応性誘導体の好適な

塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
この反応は、方法１および６と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえばアミン、溶媒、反応温度など）については、方法１および６のところでの説明を参照されたい。

方法８

目的化合物（Ｉｋ）またはその塩は、化合物（Ｉｊ）またはその塩を脱ベンジル反応に付すことにより製造できる。
化合物（Ｉｊ）および（Ｉｋ）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
この反応は、方法５における酸を用いての加水分解または接触還元と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法５における酸を用いての加水分解または接触還元のところでの説明を参照されたい。
この接触還元において、R^3がニトロである化合物（Ｉｊ）を出発化合物として用いた場合には、反応条件にもよるが、R^3がアミノである化合物（Ｉｋ）が得られることがある。この場合もこの反応の範囲に包含されるものである。

方法９

目的化合物（Ｉｌ）またはその塩は、化合物（ＩKa）またはその塩を化合物（VI）またはその塩と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉka）、（Ｉｌ）または（VI）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
Z^1がハロゲンである化合物（VI）をこの反応に用いるときには、アルカリ金属（たとえばナトリウム、カリウムなど）、アルカリ土類金属（たとえばマグネシウム、カルシウムなど）、これらの水酸化物もしくは炭酸塩もしくは重炭酸塩などの塩基の存在下で反応を実施するのが好ましい。
Z^1がヒドロキシである化合物（VI）をこの反応に用いるときには、アゾジ炭酸ジエチルおよびトリフェニルホスフィンの存在下で反応を実施するのが好ましい。
反応は、通常、反応に悪影響を及ぼさない慣用の溶媒、たとえば水、ジオキサン、アルコール（たとえばメタノール、エタノールなど）、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、酢酸、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミドまたはこれらの混合物中で実施する。
反応温度はとくに限定されず、通常、冷却下ないし加熱下で反応を実施することができる。

方法10

目的化合物（Ｉｍ）またはその塩は、化合物（Ｉga）またはその塩をアシル化剤と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉga）および（Ｉｍ）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
アシル化剤としては、式R^{11}－OH（ここに、R^{11}は上に説明した通りのアシルまたは置換アシルである）で表される有機酸またはその反応性誘導体が挙げられる。
有機酸の好適な反応性誘導体としては、酸ハロゲン化物〔たとえば酸塩化物、酸臭化物など〕、酸アジ化物、分子間酸無水物および分子内酸無水物を含む酸無水物、活性アミド、活性エステルなどが挙げられる。
遊離酸をアシル化剤として用いるときには、Ｎ，Ｎ’－ジシクロヘキシルカルボジイミドなどの慣用の縮合剤の存在下でアシル化反応を好ましく実施することができる。
反応は、通常、慣用の溶媒、たとえば水、ピリジン、アセトン、ジオキサン、クロロホルム、塩化メチレン、アセトニトリル、塩化エチレン、テトラヒドロフラン、酢酸エチル、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、ピリジン、反応に悪影響を及ぼさないその他の任意の有機溶媒またはこれらの混合物中で実施する。
反応を、トリエチルアミン、ピリジン、水酸化ナトリウムなどの慣用の塩基の存在下で実施することも好ましい。

反応温度はとくに限定されず、冷却下ないし加熱下で反応を実施できる。

方法11

目的化合物（Ｉｎ）またはその塩は、化合物（Ｉgb）またはその塩を、還元剤の存在下に、低級アルカナールまたはＮ－保護されたアミノ低級アルカナールと反応させることにより製造できる。

化合物（Ｉgb）および（Ｉｎ）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。

好適な低級アルカナールとしては、ホルムアルデヒド、エタナール、プロパナールなどの$Ｃ_{1}$～$Ｃ_{6}$アルカナールが挙げられ、なかでも好ましいのはホルムアルデヒドである。

好適なＮ－保護されたアミノ低級アルカナールとしては、フタルイミドプロパナールなどのＮ－保護されたアミノ$Ｃ_{1}$～$Ｃ_{6}$アルカナールが挙げられる。

好適な還元剤としては、ジボラン、ボラン－有機アミン錯体〔たとえばボラン－ピリジン錯体など〕、水素化シアノ硼素アルカリ金属〔たとえば水素化シアノ硼素ナトリウム、水素化シアノ硼素リチウムなど〕、水素化硼素ナトリウムなどが挙げられる。

反応は、モレキュラーシーブの存在下で実施するのが好ましい。

反応は、通常、慣用の溶媒、たとえば水、アルコール〔たとえばメタノール、エタノールなど〕、ジオキサン、テトラヒドロフラン、これらの混合物もしくは反応に悪影響を及ぼさないその他の任意の有機溶媒中で実施する。

反応は、酸性条件下〔たとえば酢酸、硫酸などの存在下〕で実施してもよく、反応温度はとくに限定されないが、通常は、冷却下ないし加温下で反応を実施する。

方法12

目的化合物（Ｉｐ）またはその塩は、化合物（Ｉｏ）またはその塩を還元に付すことにより製造できる。

化合物（Ｉｏ）および（Ｉｐ）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。

還元には、化学還元および接触還元が包含され、これらは常法に従って実施する。

化学還元に使用すべき好適な還元剤は、金属〔たとえば錫、亜鉛、鉄、ニッケルなど〕、そのような金属および／もしくは金属化合物〔たとえば塩化ニッケル、塩化クロム、酢酸クロムなど〕と有機酸もしくは無機酸〔たとえば蟻酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、ｐ－トルエンスルホン酸、塩酸、臭化水素酸など〕との組合せ、そのような金属および／もしくは金属化合物と塩基〔たとえばアンモニア、塩化アンモニウム、水酸化ナトリウムなど〕との組合せ、水素化金属化合物、たとえば水素化アルミニウム化合物〔たとえば水素化アルミニウムリチウム、水素化アルミニウムナトリウム、水素化アルミニウム、水素化トリメトキシアルミニウムリチウム、水素化トリ－ｔ－ブトキシアルミニウムリチウムなど〕、水素化硼素化合物〔たとえば水素化硼素ナトリウム、水素化硼素リチウム、水素化シアノ硼素ナトリウム、水素化硼素テトラメチルアンモニウム、ボラン、ジボランなど〕、燐化合物〔たとえば三塩化燐、三臭化燐、トリフェニルホスフィン、トリエチルホスフィンなど〕などである。

接触還元に使用するのに好適な触媒は、白金触媒〔たとえば白金板、海綿状白金、白金黒、コロイド白金、酸化白金、白金線など〕、パラジウム触媒〔たとえば海綿状パラジウム、パラジウム黒、酸化パラジウム、パラジウム炭、コロイドパラジウム、パラジウム／硫酸バリウム、パラジウム／炭酸バリウムなど〕、ニッケル触媒〔たとえば還元ニッケル、酸化ニッケル、ラネーニッケルなど〕、コバルト触媒〔たとえば還元コバルト、ラネーコバルトなど〕、鉄触媒〔たとえば還元鉄、ラネー鉄など〕、銅触媒〔たとえば還元銅、ラネー銅、ウルマン銅など〕などの慣用のものである。

還元は、通常、溶媒中で実施する。使用するのに好適な溶媒としては、水、アルコール〔たとえばメタノール、エタノール、プロパノールなど〕、アセトニトリル、または、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフランなどのその他の任意の慣用有機溶媒、もしくはそれらの混合物が挙げられる。

反応温度はとくに限定されず、通常、冷却下ないし加熱下に反応を実施する。

方法13
目的化合物（Ｉｒ）またはその塩は、化合物（Ｉｑ）またはその塩を脱アシル反応に付すことにより製造できる。
化合物（Ｉｑ）および（Ｉｒ）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
この反応は、方法３と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法３のところでの説明を参照されたい。
方法14
目的化合物（Ｉｓ）またはその塩は、化合物（VII）またはその塩を化合物（VIII）またはその塩と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉｓ）、（VII）および（VIII）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
この反応は、方法９と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法９のところでの説明を参照されたい。
方法15
目的化合物（Ｉｕ）またはその塩は、化合物（Ｉｔ）またはその塩を酸化剤と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉｔ）または（Ｉｕ）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
好適な酸化剤としては、過酸化水素、ジョーンズ試薬、過酸類〔たとえば過酢酸、過安息香酸、ｍ－クロロ過安息香酸など〕、クロム酸、過マンガン酸カリウム、過沃素酸アルカリ金属〔たとえば過沃素酸ナトリウムなど〕などが挙げられる。
この反応は、通常、反応に悪影響を及ぼさない溶媒、たとえば酢酸、ジクロロメタン、アセトン、酢酸エチル、クロロホルム、水、アルコール〔たとえばメタノール、エタノールなど〕、これらの混合物などの中で実施する。
反応温度はとくに限定されないが、通常は、冷却下ないし加温下で反応を実施する。
方法16
目的化合物（Ｉｗ）またはその塩は、化合物（Ｉｖ）またはその塩を接触還元に付すことにより製造できる。
化合物（Ｉｖ）および（Ｉｗ）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
この反応は、方法５の接触還元と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法５の接触還元ところでの説明を参照されたい。
方法17
目的化合物（Ｉｙ）またはその塩は、化合物（Ｉｘ）またはその塩を脱ベンジルに付すことにより製造できる。
化合物（Ｉｘ）および（Ｉｙ）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
この反応は、方法８と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法８のところでの説明を参照されたい。
方法18
目的化合物（Ｉｚ）またはその塩は、化合物（Ｉｙ）またはその塩を化合物（IX）またはその塩と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉｙ）、（Ｉｚ）および（IX）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
この反応は、方法９と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および

反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法９のところでの説明を参照されたい。

方法19

目的化合物（Ｉ－２）またはその塩は、化合物（Ｉ－１）またはその塩をヒドロキシ保護基脱離反応に付すことにより製造できる。

化合物（Ｉ－１）および（Ｉ－２）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。

好適なヒドロキシ保護基としては、ベンジルオキシ、アシルオキシ、置換アシルオキシなどが挙げられる。

この反応は、方法８および13と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法８および13のところでの説明を参照されたい。

方法20

目的化合物（Ｉ－３）またはその塩は、化合物（Ｉ－２）またはその塩を化合物（Ｘ）と反応させることにより製造できる。

化合物（Ｉ－２）、（Ｉ－３）および（Ｘ）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。

この反応は、方法９と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法９のところでの説明を参照されたい。

方法21

目的化合物（Ｉ－４）またはその塩は、化合物（Ｉ－3a）またはその塩を脱エステル反応に付すことにより製造できる。

化合物（Ｉ－3a）および（Ｉ－４）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。

この反応は、方法３と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法３のところでの説明を参照されたい。

方法22

目的化合物（Ｉ－６）またはその塩は、化合物（Ｉ－５）またはその塩をパラジウム化合物および銅化合物の存在下でアルキン化合物と反応させることにより製造できる。

化合物（Ｉ－５）および（Ｉ－６）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。

好適なアルキン化合物としては、ヒドロキシ、アミノ、保護されたアミノ、低級アルキルスルホニル、アリールスルホニルなどで置換されていてもよい低級アルキン化合物が挙げられ、なかでも好ましいのは３－ブチン－１－オールである。

好適なパラジウム化合物としては、塩化ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（II）などが挙げられる。

好適な銅化合物としては、沃化銅（II）などが挙げられる。

反応は、通常、反応に悪影響を及ぼさない慣用の溶媒、たとえばテトラヒドロフラン、ジオキサン、エチルアミン、またはそれらの混合物中で実施する。

反応温度はとくに限定されないが、通常は、加温下ないし加熱下で反応を実施する。

方法23

目的化合物（Ｉ－8a）またはその塩は、化合物（Ｉ－７）またはその塩を化合物（ＸＩ）と反応させることにより製造できる。

化合物（Ｉ－７）および（Ｉ－8a）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。

反応は、トリアルキルアミン（たとえばトリメチルアミン、トリエチルアミンなど）などの塩基の存在下に実施するのが好ましい。

反応は、通常、反応に悪影響を及ぼさない慣用の溶媒、たとえばテトラヒドロフラン、塩

化メチレンなどの中で実施する。
反応温度はとくに限定されず、通常、冷却下ないし加熱下で反応を実施する。
方法24
目的化合物（Ｉ－９）またはその塩は、化合物（Ｉ－８）またはその塩をアルカリ金属フタルイミドと反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉ－８）および（Ｉ－９）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
反応は、反応に悪影響を及ぼさない慣用の溶媒、たとえばジメチルスルホキシド、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミドなどの中で実施する。
反応温度はとくに限定されず、通常、冷却下ないし加熱下で反応を実施する。
方法25
目的化合物（Ｉ－10）またはその塩は、化合物（Ｉ－６）またはその塩を還元剤と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉ－６）および（Ｉ－10）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
好適な還元剤としては、塩化ニッケルと水素化硼素ナトリウムとの組合せなどが挙げられる。
反応は、反応に悪影響を及ぼさない慣用の溶媒、たとえばアルコール（たとえばメタノール、エタノールなど）、テトラヒドロフラン、それらの混合物などの中で実施する。
反応温度はとくに限定されないが、通常は、冷却下ないし加温下で反応を実施する。
方法26
目的化合物（Ｉ－11）またはその塩は、化合物（II）またはその塩を化合物（ＸII）またはその塩と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉ－11）、（II）および（ＸII）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
この反応は、方法11と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法11のところでの説明を参照されたい。
方法27
目的化合物（Ｉ－13）またはその塩は、化合物（Ｉ－12）またはその塩を塩基の存在下に化合物（ＸIII）と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉ－12）および（Ｉ－13）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
好適な塩基としては、アルカリ金属（たとえばナトリウム、カリウムなど）、アルカリ金属水素化物（たとえば水素化ナトリウムなど）などが挙げられる。
反応は、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、ジオキサン、これらの混合物もしくは反応に悪影響を及ぼさないその他の任意の溶媒中で実施する。
反応温度はとくに限定されないが、通常は、冷却下ないし加温下で反応を実施する。
方法28
目的化合物（Ｉ－15）またはその塩は、化合物（Ｉ－14）またはその塩をアシル化剤と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉ－14）および（Ｉ－15）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
この反応は、方法10と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法10のところでの説明を参照されたい。
方法29
目的化合物（Ｉ－17）またはその塩は、化合物（Ｉ－16a）またはその塩を還元剤と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉ－16a）および（Ｉ－17）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示し

たものと同じものを挙げることができる。
好適な還元剤としては、水素化硼素アルカリ金属（たとえば水素化硼素ナトリウムなど）などが挙げられる。
反応は、アルコール（たとえばメタノール、エタノールなど）、テトラヒドロフランなどの溶媒中で実施する。
反応温度はとくに限定されないが、通常は、冷却下ないし加温下で反応を実施する。
方法30
目的化合物（Ｉ－18）またはその塩は、化合物（Ｉ－16）またはその塩を還元剤の存在下にアミン化合物またはその塩と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉ－16）および（Ｉ－18）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
好適なアミン化合物としては、アンモニア、Ｎ－低級アルキルピペラジンなどが挙げられる。
アミン化合物の好適な塩としては、酸付加塩（たとえば酢酸塩、塩酸塩など）などが挙げられる。
この反応は、方法11と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法11のところでの説明を参照されたい。
方法31
目的化合物（Ｉ－20）またはその塩は、化合物（Ｉ－19）またはそのカルボキシ基における反応性誘導体もしくはそれらの塩を低級アルキルアミノ低級アルカノールと反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉ－20）ならびに（Ｉ－19）およびそのカルボキシ基における反応性誘導体の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
好適な低級アルキルアミノ低級アルカノールとしては、ジメチルアミノエタノールなどが挙げられる。
この反応は、方法１と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法１のところでの説明を参照されたい。
方法32
目的化合物（Ｉ－22）またはその塩は、化合物（Ｉ－21）またはその塩を還元剤と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉ－21）および（Ｉ－22）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
好適な還元剤としては、ジボラン、水素化アルミニウムリチウムなどが挙げられる。
反応は、通常、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランなどの、反応に悪影響を及ぼさない溶媒中で実施する。
反応温度はとくに限定されず、冷却下ないし加熱下で反応を実施できる。
方法33
目的化合物（Ｉ－23）またはその塩は、化合物（Ｉ－22）またはその塩を酸化反応に付すことにより製造できる。
化合物（Ｉ－22）および（Ｉ－23）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
この反応に使用するのに好適な酸化剤としては、二酸化マンガン、ジメチルスルホキシド、ジメチルスルホキシドと塩化オキサリルとの組合せなどが挙げられる。
反応は、通常、慣用の溶媒、たとえばペンタン、ヘキサン、ベンゼン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、アセトン、クロロホルム、ジクロロメタン、反応に悪影響を及ぼさないその他の任意の溶媒中で実施する。
なお、上記の酸化剤が液状である場合には、それを溶媒としても利用できる。
この反応において、ジメチルスルホキシドまたはジメチルスルホキシドと塩化オキサリル

との組合せを酸化剤として用いる場合には、アルカリ金属沃化物（たとえば沃化ナトリウムなど）およびアルカリ金属炭酸塩（たとえば炭酸ナトリウムなど）の存在下で反応を実施するのが好ましい。
反応温度はとくに限定されず、通常、冷却下ないし加熱下に反応を実施する。
方法34
目的化合物（Ｉ－25）またはその塩は、化合物（Ｉ－24）またはその塩をアジド化合物と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉ－24）および（Ｉ－25）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
好適なアジド化合物としては、アジ化ナトリウム、アジ化トリメチル錫などが挙げられる。
反応は、通常、ジオキサン、芳香族炭化水素（たとえばベンゼン、トルエン、キシレン）などの、反応に悪影響を及ぼさない溶媒中で実施する。
反応温度はとくに限定されないが、通常は、加温下ないし加熱下に反応を実施する。
方法35
目的化合物（Ｉ－27）またはその塩は、化合物（Ｉ－26）またはその塩をイソ尿素化合物と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉ－26）および（Ｉ－27）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
好適なイソ尿素化合物としては、Ｏ－アルキルイソ尿素（たとえばＯ－メチルイソ尿素など）などが挙げられる。
反応は、通常、アルコール（たとえばメタノール、エタノールなど）などの、反応に悪影響を及ぼさない溶媒中で実施する。
反応温度はとくに限定されないが、通常は、加温下ないし加熱下に反応を実施する。
方法36
目的化合物（Ｉ－29）またはその塩は、化合物（Ｉ－28）またはその塩をＮ－保護基脱離反応に付すことにより製造できる。
化合物（Ｉ－28）および（Ｉ－29）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
この反応は、方法５と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法５のところでの説明を参照されたい。
方法37
目的化合物（Ｉ－31）またはその塩は、化合物（Ｉ－30）またはその塩を低級アルキルピペラジン、ジメチルアミノピペリジン、アンモニアまたはＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドと反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉ－30）および（Ｉ－31）の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
反応は、通常、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、ジオキサンなどの、反応に悪影響を及ぼさない溶媒中で実施する。
反応温度はとくに限定されないが、通常は、加温下ないし加熱下に反応を実施する。
方法38
目的化合物（Ｉ－３ａ）またはその塩は、化合物（Ｉ－４）またはそのカルボキシ基における反応性誘導体もしくはそれらの塩をヒドロキシ化合物またはジアゾ化合物と反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉ－３ａ）ならびに（Ｉ－４）およびそのカルボキシ基における反応性誘導体の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
（Ｉ－４）のカルボキシ基における好適な反応性誘導体としては、酸ハロゲン化物（たとえば酸塩化物、酸臭化物など）などが挙げられる。

好適なヒドロキシ化合物としては、アルコール（たとえばメタノール、エタノールなど）、フェノール、ナフトールなどが挙げられる。
好適なジアゾ化合物としては、メチルジアゾメタン、トリメチルシリルジアゾメタンなどが挙げられる。
反応は、通常、慣用の溶媒、たとえばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、塩化メチレン、反応に悪影響を及ぼさないその他の任意の有機溶媒中で実施する。
なお、上記ヒドロキシ化合物が液状である場合には、それを溶媒としても利用できる。
反応温度はとくに限定されず、通常、冷却下ないし加熱下で反応を実施する。
方法39
目的化合物（Ｉ－32）またはその塩は、化合物（Ｉ－４）またはそのカルボキシ基における反応性誘導体もしくはそれらの塩をアミンと反応させることにより製造できる。
化合物（Ｉ－32）ならびに（Ｉ－４）およびそのカルボキシ基における反応性誘導体の好適な塩としては、化合物（Ｉ）について例示したものと同じものを挙げることができる。
好適なアミンとしては、アンモニア、低級アルキルアミン（たとえばメチルアミン、ジメチルアミンなど）などが挙げられる。
この反応は、方法６と実質的に同様にして実施でき、従って、この反応の反応態様および反応条件（たとえば溶媒、反応温度など）については、方法６のところでの説明を参照されたい。
上記の諸方法によって得られた化合物は、粉末化、再結晶、カラムクロマトグラフィー、再沈澱などの常法によって単離、精製できる。
化合物（Ｉ）およびその他の化合物は、不斉炭素原子および二重結合に基づく光学異性体または幾何異性体などの一つ以上の立体異性体を包含することもあるが、それら異性体ならびにそれらの混合物もこの発明の範囲に包含されるものである。
なお、化合物（Ｉ）の水和物もこの発明の範囲に包含されるものである。
目的化合物（Ｉ）およびそれらの医薬として許容しうる塩は、バソプレッシン拮抗作用、血管拡張作用、降圧作用、肝中糖質放出抑制作用、メサンギウム細胞成長抑制作用、水利尿作用、血小板凝集抑制作用、オキシトシン拮抗作用などの活性を有し、ヒトまたは動物における高血圧、心不全、腎不全、浮腫、腹水、バソプレッシン分泌異常症候群、肝硬変、低ナトリウム血症、低カリウム血症、糖尿病、循環障害、脳血管疾患（たとえば脳浮腫、脳梗塞など）、メニエール症候群（たとえばメニエール病など）、乗物酔いなどの治療および／または予防に有用である。
目的化合物（Ｉ）の有用性を例証するために、化合物（Ｉ）の薬理学的データを以下に示す。
試験例１
バソプレッシン１（Ｖ１）受容体結合
（ｉ）試験方法：
健常被験者から静脈穿刺によって血液を得た。全血を200xgで10分間遠心分離して、多血小板血漿（PRP）を調製した。PRPを45,000xgで30分間遠心分離した。残ったペレットを10容の氷冷100mMトリス－塩酸（pH7.4）緩衝液（5mM　塩化マグネシウム、0.1%ウシ血清アルブミンおよび１mM　EDTAを含有）に再懸濁させ、45,000xgで30分間再度遠心分離した。最終ペレットを100mMトリス－塩酸に再懸濁させた。得られた膜標品調製物を直ちに結合アッセイに使用した。
100mMトリス－塩酸（pH7.4）緩衝液中の1.5nM　^{3}Ｈ－バソプレッシン（40～87Ci／ミリモル；ニュー・イングランド・ニュークリアー）を用い、平衡状態で競合アッセイを実施した（30℃で15分間）。１μmのバソプレッシンを用いて、非特異性結合を求めた。インキュベーションののち、氷冷100mMトリス－塩酸（pH7.4）緩衝液５mlを添加して反応を停止させ、つぎにワットマンガラスフィルター（GF／Ｃ）で速やかに▲濾▼過した。フィルターを同じ緩衝液で２回洗った。ガラスフィルターを液体シンチレーションカクテルと混合し、液体シンチレーションカウンターで放射能を計数した。試験化合物の競合活性を、IC_{50}値で表わした。

（ｉｉ）試験結果：

試験化合物（実施例番号）	IC_{50}（nM）
5－ 2)	51
16	14
17－20)	31

試験例２

バソプレッシン２（Ｖ２）受容体結合

（ｉ）試験方法：

結合アッセイのため、受容体cDNAをチャイニーズハムスター卵巣（CHO）細胞中で持続的に発現させた。ヒトＶ２受容体cDNAの発現を誘導するベクターによるCHO細胞のトランスフェクションおよびヒトＶ２受容体を発現するクローン細胞系の樹立を、本質的に、先に記載されている（Ｙ．ナカジマら、ジャーナル・オブ・バイオロジカル・ケミストリー（Ｊ．Ｂｉｏｌ．Ｃｈｅｍ．），1992年，267巻，2437頁）通りにして、行なった。

DNAでトランスフェクトされた細胞を採取し、25mMトリス－塩酸（pH7.4）、10mM　塩化マグネシウム、１mM　EDTAおよび５μg／mlの弗化ｐ－アミジノフェニルメチルスルホニル（Ａ－PMSF）を含有する氷冷250mMスクロース緩衝液中でホモジナイズした。ホモジネートを500xgで10分間遠心分離した。上澄みを100,000xgで１時間遠心分離した。最終ペレットを25mMトリス－塩酸（pH7.4）緩衝液（10mM　塩化マグネシウム、１mM　EDTAおよび５μg／ml　Ａ－PMSFを含有）に懸濁させ、少量ずつのアリコートとして－80℃で保存した。

100mMトリス－塩酸（pH7.4）緩衝液（５mM　塩化マグネシウム、５μg／ml　Ａ－PMSF、４μg／mlロイペプチン、40μg／mlバシトラシン、20μg／mlキモスタチンおよび0.1％ウシ血清アルブミンを含有）中の0.5nM ^{3}H－バソプレッシン（40～87Ci／ミリモル；ニュー・イングランド・ニュークリアー）を用い、平衡状態で競合アッセイを実施した（22℃で２時間）。１μmのバソプレッシンを用いて、非特異性結合を求めた。インキュベーションののち、ワットマンガラスフィルター（GF／Ｃ）で速やかに▲濾▼過した。フィルターを同じ緩衝液で２回洗った。液体シンチレーションカウンターで放射能を計数した。試験化合物の競合活性を、IC_{50}値で表わした。

（ｉｉ）試験結果：

試験化合物（実施例番号）	IC_{50}（nM）
5－ 2)	1300
16	1400
17－20)	1300

医療目的には、本発明の化合物（Ｉ）は、経口投与、非経口投与または外用（局所適用）に適した有機または無機の固体、半固体または液状の賦形剤などの製薬上許容される担体との混合物の形で該化合物のいずれかを有効成分として含有する医薬製剤として使用できる。該医薬製剤としては、カプセル剤、錠剤、糖衣錠、顆粒剤、坐剤、液剤、ローション剤、懸濁剤、乳剤、軟膏剤、ゲル剤などが挙げられる。所望により、これらの製剤に、佐剤、補助剤、安定剤、湿潤または乳化剤、緩衝剤、その他の常用の添加剤を含有させることもできる。

化合物（Ｉ）の用量は、患者の年齢および状態によっても変るであろうが、平均１回量が約0.1mg、１mg、10mg、50mg、100mg、250mg、500mgおよび1000mgの化合物（Ｉ）が、前記諸疾患の治療に有効でありうる。一般に、１日当り0.1mg／個体～約1,000mg／個体の間の量を投与すればよい。

以下の製造例および実施例は、この発明を説明する目的で示すものである。

製造例１

Ｎ－メチル－Ｎ－（４－ニトロベンゾイル）－２－ヒドロキシアニリン（1.2ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（30ml）溶液に、60℃で、炭酸カリウム（1.22ｇ）、６－ブロモヘキサン酸エチル（1.03ｇ）および沃化ナトリウム（触媒量）を加えた。反応混合物を同温度で８時間攪拌した。反応混合物を氷浴中で冷却し、１Ｎ塩酸（10ml）および水（30ml）で反応を終焉させた。混合物を酢酸エチルで抽出した。有機層を水および食塩水で洗った。有機溶液を硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を蒸発させて除去して、２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）－〔Ｎ－メチル－Ｎ－（４－ニトロベンゾイル）〕アニリン（1.7ｇ）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.26(3H,t,J=7.5Hz),1.45-1.58(2H,m),1.67-1.76(2H,m),1.79-1.88(2H,m),2.34(2H,t,J=7.5Hz),3.38(3H,s),3.84-4.00(2H,m),4.13(2H,t),6.72-6.82(2H,m),7.01(1H,d,J=7Hz),7.17(1H,t,J=7Hz),7.45(2H,d,J=8.5Hz),7.98(2H,d,J=8.5Hz)

製造例２

３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（7.6ｇ）のエタノール（76ml）溶液を、外界温度で、１Ｎ水酸化ナトリウム溶液（33ml）で処理し、混合物を同温度で６時間攪拌した。１Ｎ塩酸（35ml）を滴下して、反応を終焉させた。混合物を濃縮し、残留物を酢酸エチル－１Ｎ塩酸混合物に溶解させた。抽出有機層を食塩水で洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。懸濁液を▲濾▼過し、溶媒を蒸発させて除去して、３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イルオキシ）－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（7.1ｇ）を油状物として得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.48-1.63(2H,m),1.66-1.91(4H,m),2.28(3H,s),2.41(2H,t,J=7Hz),3.34(3H,s),3.78(3H,s),3.81-3.98(2H,m),6.58-6.67(2H,m),6.89(1H,d,J=8Hz),6.94(1H,d,J=8Hz),7.09(1H,s),7.61(1H,d,J=8Hz)

製造例３

３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イルオキシ）－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（5.2ｇ）、１－メチルピペラジン（1.45ｇ）および１－ヒドロキシベンゾトリアゾール（1.96ｇ）をＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（50ml）に溶解させ、溶液を氷浴中で冷却した。混合物に、Ｎ－エチル－Ｎ’－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（2.78ｇ）を加え、溶液を同温度で30分間攪拌した。反応混合物を外界温度まで昇温するにまかせ、攪拌をさらに20時間継続した。反応混合物を酢酸エチルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウムおよび食塩水で順次洗い、硫酸ナトリウムで乾燥した。硫酸ナトリウムを除去し、溶媒を蒸発させて除去し、油状物を得た。この粗製物をシリカゲルクロマトグラフィー（SiO_2；120ｇ、２％メタノール含有クロロホルム）に付して、３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イルカルボニル）ペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（6.2ｇ）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.43-1.60(2H,m),1.60-1.92(4H,m),2.28(3H,s),2.30(3H,s),2.25-2.47(6H,m),3.34(3H,s),3.44-3.54(2H,m),3.58-3.70(2H,m),3.78(3H,s),3.82-4.03(2H,m),6.56-6.66(2H,m),6.86(1H,d,J=8Hz),6.94(1H,d,J=8Hz),7.07(1H,s),7.61(1H,d,J=8Hz)

製造例４

３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イルカルボニル）ペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（6.2ｇ）と鉄粉（3.43ｇ）とのエタノール（65ml）－酢酸エチル（６ml）混合物中混合物を、２時間、還流下に加熱した。外界温度まで冷却後、溶液をセライト層を通して▲濾▼過し、▲濾▼液を減圧下で蒸発させた。残留物を酢酸エチルで希釈し、溶液を飽和炭酸水素ナトリウムおよび食塩水で洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で蒸発させて、４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イルカルボニル）ペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（4.7ｇ）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.43-1.58(2H,m),1.61-1.91(4H,m),2.26(3H,s),2.30(3H,s),2.23-2.44(6H

,m),3.29(3H,s),3.41-3.53(2H,m),3.61(3H,s),3.57-3.68(2H,m),3.75-4.03(4H,m),6.36-6.46(1H,m),6.53-6.67(2H,m),6.76-6.89(3H,m)

製造例５

製造例４と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.26(3H,t,J=7.5Hz),1.41-1.54(2H,m),1.62-1.73(2H,m),1.75-1.84(2H,m),2.32(2H,t,J=7.5Hz),3.30(3H,s),3.84(2H,br),3.90(2H,br),4.13(2H,t),6.38(2H,d,J=8.5Hz),6.79(2H,d,J=8.5Hz),6.99(2H,s),7.09-7.18(3H,m)

２）４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.29-1.95(10H,m),2.23-2.43(12H,m),2.57(1H,m),3.01(1H,m),3.31(3H,s),3.62(3H,s),3.73-4.03(5H,m),4.63(1H,m),6.42(1H,d,J=9Hz),6.54-6.67(2H,m),6.77-6.89(3H,m)

３）４－アミノ－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

MASS(m/z):399(M+1)

４）４－アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.27(3H,s),2.32(3H,s),2.35-2.55(4H,m),3.31(3H,s),3.38-3,54(2H,m),3.66-3.87(4H,m),4.90-5.10(2H,m),6.38(2H,d,J=8Hz),6.62-6.69(2H,m),6.94(1H,d,J=7Hz),7.13(2H,d,J=8Hz),7.31-7.43(4H,m)

５）２－（４－メトキシカルボニル）フェニルメトキシ－４－メチルアミン

NMR($CDCl_3$,δ):2.24(3H,s),3.90(3H,s),5.11(3H,s),6.60-6.68(3H,m),7.50(2H,d,J=8Hz),8.05(2H,d,J=8Hz)

６）４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.28(3H,s),2.33(3H,s),2.37-2.53(4H,m),3.36(3H,s),3.41-3.54(2H,m),3.57(3H,s),3.65-3.90(4H,m),4.90(1H,d,J=14Hz),5.06(1H,d,J=14Hz),6.38(1H,d,J=7Hz),6.62-6.70(2H,m),6.78(1H,d,J=7Hz),6.84(1H,s),6.98(1H,d,J=7Hz),7.33(2H,d,J=8Hz),7.41(2H,d,J=8Hz)

７）４－〔（ＥおよびＺ）－２－（２－アミノフェニル）エテン－１－イル〕安息香酸メチル

NMR($CDCl_3$,δ):3.72(2H,br),3.86(2H×2/3,s),3.90(3H×1/3,s),6.57-7.43(7H,m),7.55(1H,d,J=7Hz),7.86(1H,d,J=7Hz),8.01(7H,d)

８）４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔（ＥおよびＺ）－２－（４－メトキシカルボニルフェニル）エテン－１－イル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):3.39(3H×2/3,s),3.40(3H×1/3,s),3.50(3H×2/3,s),3.51(3H×1/3,s),3.81-3.96(2H,m),3.84(3H×2/3,s),3.41(3H×1/3,s),6.30-8.05(13H,m)

９）４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－メトキシカルボニル）フェニルメトキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.21(3H,s),3.34(3H,s),3.50(3H,s),3.83(2H,s),3.90(3H,s),4.79-5.14(2H,m),6.37(1H,d,J=7Hz),6.60(1H,s),6.70(1H,d,J=7Hz),6.77(1H,d,J=7Hz),6.81(1H,s),6.99(1H,d,J=7Hz),7.34(2H,d,J=8Hz),8.01(2H,d,J=8Hz)

10）２－〔３－（エトキシカルボニルメチル）オキシプロプ－１－イル〕オキシアニリン

NMR($CDCl_3$,δ):1.27(3H,t,J=7.5Hz),2.08-2.28(2H,m),3.72(2H,t,J=7.5Hz),3.79(2H,s),4.09(2H,s),4.14(2H,t,J=7.5Hz),4.21(2H,q,J=7.5Hz),6.65-6.82(4H,m)

11）４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔３－エトキシカルボニルメチル）オキシプロプ－１－イル〕オキシ〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.26(3H,t,J=7.5Hz),2.03-2.15(2H,m),3.31(3H,s),3.61(3H,s),3.69-3.77(4H,m),4.02(2H,s),4.20(2H,q,J=7.5Hz),6.41(1H,d,J=7.5Hz),6.64-6.89(4H,m),7.00(1H,d,J=7Hz),7.13(1H,t,J=7Hz)

12）２－〔（Ｅ）－５－エトキシカルボニル－４－ペンテン－１－イル〕オキシ－４－メチルアニリン

NMR($CDCl_3$,δ):1.29(3H,t,J=7.5Hz),1.90-2.05(2H,m),2.23(3H,s),2.35-2.50(2H,m),3.65(2H,br),4.00(2H,t,J=7.5Hz),4.18(2H,q,J=7.5Hz),5.98(1H,d,J=15Hz),6.53-6.67(2H,m),6.81(1H,s),7.00(1H,dt,J=15,7.5Hz)

13）４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔（Ｅ）－５－エトキシカルボニル－４－ペンテン－１－イル〕オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.27(3H,t,J=7.5Hz),1.84-1.98(2H,m),2.36(3H,s),2.31-2.41(2H,m),3.29(3H,s),3.62(3H,s),3.75-3.96(4H,m),4.18(2H,q,J=7.5Hz),5.84(1H,d,J=15Hz),6.40(1H,d,J=7Hz),6.58-6.63(2H,m),6.78-7.01(4H,m)

14）２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）－４－メチルアニリン

NMR($CDCl_3$,δ):1.26(3H,t,J=7Hz),1.45-1.60(2H,m),1.63-1.89(4H,m),2.25(3H,s),2.33(2H,t,J=7Hz),3.98(2H,t,J=7Hz),4.13(2H,q,J=7Hz),6.54-6.68(3H,m)

15）３－メトキシ－４－アミノ－Ｎ－（２－ベンジルオキシ－４－メチルフェニル）－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.28(3H,s),3.32(3H,s),3.49(3H,s),3.83(2H,br),4.80-5.11(2H,br),6.34(1H,d,J=8Hz),6.62-6.84(5H,m),6.92(1H,d,J=8Hz),7.25-7.39(4H,m)

16）４－アミノ－３－メチル－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.48-1.59(2H,m),1.63-1.88(4H,m),2.00(3H,s),2.28(3H,s),2.30(3H,s),2.32-2.40(6H,m),3.29(3H,s),3.43-3.48(2H,m),3.62(4H,br),3.90(2H,br),6.32(1H,d,J=7Hz),6.56-6.61(2H,m),6.83(1H,d,J=7Hz),6.90(1H,d,J=7Hz),7.17(1H,s)

17）４－アミノ－３－ヒドロキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.62(6H,br),2.28(3H,s),2.31(3H,s),2.38-2.49(6H,m),3.28(3H,s),3.52(2H,br),3.67(2H,br),3.78(2H,br),3.91(2H,br),6.32-6.38(1H,m),6.57-6.67(3H,m),7.00-7.03(2H,m)

製造例６

製造例４と同様にして調製した化合物を塩化水素と反応させて、次の化合物を得た。

１）４－アミノ－３－ベンジルオキシ安息香酸ベンジル塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):5.18(2H,s),5.25(2H,s),5.98(2H,br),6.78(1H,d,J=7Hz),7.29-7.52(12H,m)

２）２－アミノ－５－チオフェンカルボン酸メチル塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):3.68(3H,s),5.90(1H,d,J=5Hz),7.32-7.37(2H,m)

製造例７

製造例１と同様にして、次の化合物を得た。

１）２－（３－ヒドロキシプロプ－１－イル）オキシニトロベンゼン

NMR($CDCl_3$,δ):2.07-2.14(2H,m),2.22(1H,t,J=7.5Hz),3.90(2H,dd,J=7.5,7.5Hz),4.29(2H,t,J=7Hz),7.01(1H,t,J=7Hz),7.12(1H,t,J=7Hz),7.54(1H,t,J=7Hz),7.89(1H,d,J=7Hz)

２）３－（３－エトキシカルボニルプロプ－１－イル）オキシ－４－ニトロトルエン

NMR($CDCl_3$,δ):1.24(3H,t,J=7.5Hz),2.09-2.19(2H,m),2.56(2H,t,J=7.5Hz),4.08-4.20(4H,m)6.81(1H,d,J=7Hz),6.97(1H,s),7.77(7H,d)

３）２－（３－フタルイミドプロポキシ）安息香酸ベンジル

NMR($CDCl_3$,δ):2.08-2.23(2H,m),3.85(2H,t,J=7Hz),4.07(2H,t,J=7Hz),5.32(2H,s),6.86-7.02(2H,m),7.20-7.50(6H,m),7.61-7.74(2H,m),7.75-7.90(3H,m)

４）２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）－４－メチルニトロベンゼ

ン
NMR($CDCl_3$,δ):1.25(3H,t,J=7Hz),1.46-1.63(2H,m),1.63-1.78(2H,m),1.79-1.94(2H,m),2.34(2H,t,J=7Hz),2.40(3H,s),4.00-4.19(4H,m),6.80(1H,d,J=9Hz),6.84(1H,s),7.76(1H,d,J=9Hz)
５）２－ベンジルオキシ－Ｎ－第三級ブトキシカルボニルアニリン
NMR($CDCl_3$,δ):1.49(9H,s),5.10(2H,s),6.88-6.98(3H,m),7.09(1H,s),7.32-7.43(5H,m),8.10(1H,br)
６）４－〔Ｎ－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕フェニル〕第三級ブトキシアルボニルアミノ〕メチル－３－メトキシ安息香酸メチル
NMR($CDCl_3$,δ):1.33および1.42(計18H,s),1.92-2.00(2H,m),3.26-3.32(2H,m),3.70および3.77(計3H,s),3.90(3H,s),4.03(2H,br),4.72(2H,br),6.72-6.97(3H,m),7.10-7.23(2H,m),7.40-7.53(2H,m),7.62(1H,br)
７）１－ベンジルオキシ－２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゼン
NMR($CDCl_3$,δ):1.40および1.47(9H,s),1.98-2.06(2H,m),3.23-3.47(2H,m),4.10(2H,t,J=6Hz),5.18(2H,s),5.42(1H,br),6.82-6.90(4H,m),7.28-7.47(5H,m)
８）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシメチル－３－メトキシ安息香酸メチル
NMR($CDCl_3$,δ):1.38(9H,s),2.02(2H,br),3.38(2H,br),3.90-3.92(6H,m),4.10-4.16(2H,m),5.23(1H,s),5.25(1H,s),5.44(1H,br),6.83-6.92(4H,m),7.53-7.57(2H,m),7.65-7.69(1H,m)
９）３－ベンジルオキシ－４－ニトロ安息香酸ベンジル
NMR($CDCl_3$,δ):5.28(2H,s),5.89(2H,s),7.30-7.48(9H,m),7.70-7.73(1H,m),7.81-7.85(2H,m)
10）３－ベンジルオキシ－４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイルアミノ安息香酸ベンジル
NMR($CDCl_3$,δ):1.38(9H,s),1.60-1.70(2H,m),2.95-3.02(2H,m),3.80(2H,t,J=6Hz),4.42(1H,br),5.22(2H,s),5.38(2H,s),6.93(1H,d,J=8Hz),7.10(1H,t,J=7Hz),7.32-7.50(12H,m),7.71-7.72(1H,m),7.80-7.83(1H,m),8.23-8.28(1H,m),8.78(1H,d,J=7Hz)
11）２－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－５－チオフェンカルボン酸メチル
この化合物は、精製せずに、さらなる反応に用いた。
製造例８
製造例２と同様にして、次の化合物を得た。
１）４－〔Ｎ－メチル－２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ安息香酸
NMR($CDCl_3$,δ):1.45(9H,s),1.97-2.06(2H,m),3.33-3.42(5H,m),3.87(3H,s),3.98-4.07(2H,m),5.27-5.35(1H,br),6.67-6.76(2H,m),7.03-7.19(3H,m),7.44-7.50(2H,m)
ESI-MASS(m/z):459(M+H)
２）４－ニトロ－Ｎ－〔２－（４－カルボキシフェニル）メトキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.27(3H,s),3.40(3H,s),4.97(1H,d,J=14Hz),5.10(1H,d,J=14Hz),6.65(1H,s),6.68(1H,d,J=7Hz),7.00(1H,d,J=7Hz),7.33-7.49(4H,m),7.97(2H,d,J=8Hz),8.10(2H,d,J=8Hz)
３）３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－〔２－（４－カルボキシ）フェニルメトキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.30(3H,s),3.42(3H,s),3.61(3H,s),4.92(1H,d,J=14Hz),5.11(1H,d,J=14Hz),6.65(1H,s),6.73(1H,d,J=7Hz),6.86(1H,d,J=7Hz),7.02-7.08(2H,m),7.48(2H,d,J=8Hz),7.54(1H,d,J=7Hz),8.16(2H,d,J=8Hz)
４）２－（４－カルボキシフェニルメチル）オキシ－４－メチル－Ｎ，Ｎ－ジメチルアニ

リン
NMR($CDCl_3$,δ):2.31(3H,s),2.89(6H,s),5.08(2H,s),6.76-7.82(2H,m),7.03(1H,d,J=7Hz),7.40(2H,d,J=8Hz),7.77(2H,d,J=8Hz)
５）２－〔３－（４－メトキシフェニル）メトキシプロプ－１－イル〕チオ安息香酸
NMR($CDCl_3$,δ):1.95-2.06(2H,m),3.03(2H,t,J=7.5Hz),3.59(2H,t,J=7.5Hz),3.77(3H,s),4.46(2H,s),6.89(2H,d,J=8Hz),7.19(1H,t,J=7Hz),7.16(2H,d,J=8Hz),7.36(1H,d,J=7Hz),7.45(1H,t,J=7Hz),8.10(1H,d,J=7Hz)
６）４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－カルボキシ）フェニルメトキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($DMSO\text{-}d_6$,δ):2.21(3H,s),3.15(3H,s),3.41(3H,s),4.95-5.23(2H,m),6.33(1H,d,J=7Hz),6.63-6.72(3H,m),6.87(1H,s),7.04(1H,d,J=7Hz),7.44(2H,d,J=8Hz),7.95(2H,d,J=8Hz)
７）４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔３－（カルボキシメチル）オキシプロプ－１－イル〕オキシフェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.00-2.12(2H,m),3.32(3H,s),3.60(3H,s),3.63-3.74(2H,m),3.89-4.14(2H,m),4.05(2H,s),4.50(2H,br),6.40(1H,d,J=7Hz),6.80-6.95(4H,m),6.95(1H,d,J=7Hz),7.16(1H,t,J=7Hz)
８）４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔（Ｅ）－５－エトキシカルボニル－４－ペンテン－１－イル〕オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.87-1.99(2H,m),2.28(3H,s),2.34-2.45(2H,m),3.31(3H,s),3.61(3H,s),3.71-4.00(2H,m),5.87(1H,d,J=15Hz),6.41(1H,d,J=7Hz),6.57-6.68(2H,m),6.80-7.12(4H,m)
９）３－（５－カルボキシペント－１－イルオキシ）－４－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）トルエン
NMR($CDCl_3$,δ):1.45-1.63(11H,m),1.64-1.95(4H,m),2.28(3H,s),2.42(2H,t,J=7Hz),3.99(2H,t,J=7Hz),6.65(1H,s),6.72(1H,d,J=8Hz),6.98(1H,s),7.87(1H,m)
10）４－〔（２－ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－クロロ安息香酸
NMR($CDCl_3$,δ):5.49(2H,s),7.18(1H,t,J=6Hz),7.32-7.42(4H,m),7.50-7.62(3H,m),7.89-7.93(2H,m),8.10(1H,d,J=7Hz),8.58-8.62(1H,m)
11）４－〔２－（ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－２－ニトロ安息香酸
NMR($DMSO\text{-}d_6$,δ):5.22(2H,s),7.10(1H,t,J=7Hz),7.28-7.38(4H,m),7.50-7.58(3H,m),7.65-7.69(1H,m),7.86(2H,s),8.16(1H,s)
12）２－〔２－（ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－５－ピリジンカルボン酸
NMR($DMSO\text{-}d_6$,δ):5.18(1H,s),5.32(2H,s),6.98-7.20(2H,m),7.29-7.67(6H,m),7.84-7.88(1H,m),8.28-8.37(2H,m),8.80(1H,s)
13）４－〔Ｎ－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕フェニル〕第三級ブトキシカルボニルアミノ〕メチル－３－メトキシ安息香酸
NMR($CDCl_3$,δ):1.35および1.43(計18H,s),1.92-2.00(2H,m),3.28および3.32(計2H,m),3.20および3.28(計3H,s),4.02(2H,br),4.77(2H,br),6.77-7.99(3H,m),7.10-7.20(2H,m),7.44-7.56(2H,m),7.69(1H,br)
14）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシメチル－３－メトキシ安息香酸
NMR($CDCl_3$,δ):1.37(9H,s),2.05(2H,br),3.40(2H,br),3.93(3H,s),4.10-4.17(2H,m),5.27(2H,s),5.50(1H,br),6.87-6.93(4H,m),7.59(2H,s),7.72-7.77(1H,m)
15）３－ベンジルオキシ－４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ安息香酸
NMR($DMSO\text{-}d_6$,δ):1.30(9H,s),1.62-1.72(2H,m),2.88-2.92(2H,m),3.95(2H,t,J=6Hz),5.37(2H,s),6.80(1H,br),7.13(1H,t,J=7Hz),7.21(1H,d,J=7Hz),7.30-7.67(9H,m),8.08(1H,d,J=7Hz),8.60(1H,d,J=7Hz)
16）２－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－５－チオフェンカルボン酸

NMR(DMSO-d_6,δ):1.32(9H,s),1.82-1.90(2H,m),3.08-3.14(2H,m),4.10(2H,t,J=6Hz),6.81(1H,d,J=5Hz),6.93-7.00(1H,m),7.07(1H,t,J=7Hz),7.19(1H,d,J=7Hz),7.50-7.58(2H,m),7.67(1H,d,J=7Hz)

製造例９

製造例３と同様にして、次の化合物を得た。

１）３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.30-1.96(10H,m),2.28(9H,s),2.30-2.41(3H,m),2.58(1H,m),3.02(1H,m),3.33(3H,s),3.77(3H,s),3.82-4.00(3H,m),4.63(1H,m),6.56-6.66(2H,m),6.84(1H,d,J=9Hz),6.93(1H,d,J=9Hz),7.06(1H,s),7.61(1H,d,J=9Hz)

２）４－ニトロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.26(3H,s),2.32(3H,s),2.36-2.57(4H,m),3.37(3H,s),3.42-3.59(2H,m),3.71-3.89(2H,m),4.94(1H,d,J=14Hz),5.07(1H,d,J=14Hz),6.60-6.69(2H,m),6.94(1H,d,J=7Hz),7.36-7.50(5H,m),7.95(2H,d,J=8Hz)

３）４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.28(3H,s),2.33(3H,s),2.37-2.53(4H,m),3.36(3H,s),3.41-3.54(2H,m),3.57(3H,s),3.65-3.90(4H,m),4.90(1H,d,J=14Hz),5.06(1H,d,J=14Hz),6.38(1H,d,J=7Hz),6.62-6.70(2H,m),6.78(1H,d,J=7Hz),6.84(1H,s),6.98(1H,d,J=7Hz),7.33(2H,d,J=8Hz),7.41(2H,d,J=8Hz)

４）４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.14-1.58(2H,m),1.75-2.00(2H,m),2.26(3H,s),2.30(3H,s),2.40(1H,m),2.73-3.10(4H,m),3.36(3H,s),3.57(3H,s),3.87(3H,s),4.83-5.12(2H,m),6.39(1H,d,J=7Hz),6.61-6.71(2H,m),6.28(1H,d,J=7Hz),6.33(1H,s),6.97(1H,d,J=7Hz),7.33(2H,d,J=8Hz),7.40(2H,d,J=8Hz)

５）４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルメトキシプロプ－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.98-2.13(2H,m),2.27(3H,s),2.29-2.38(4H,m),3.30(3H,s),3.36-3.47(2H,m),3.52-3.74(4H,m),3.60(3H,s),3.94-4.17(2H,m),4.11(2H,s),6.42(1H,d,J=7Hz),6.78-6.92(4H,m),7.00(1H,d,J=7Hz),7.14(1H,t,J=7Hz)

６）４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（Ｅ）－５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニル－４－ペンテン－１－イル〕オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.30-1.47(2H,m),1.80-1.98(2H,m),2.21(3H,s),2.26(6H,s),2.26-2.43(2H,m),2.45-3.67(6H,m),3.30(3H,s),3.61(3H,s),3.85(2H,br),3.85-4.04(2H,m),4.62(1H,m),6.29(1H,d,J=15Hz),6.41(1H,d,J=7Hz),6.57-6.63(2H,m),6.77-6.90(4H,m)

７）３－［５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）トルエン

NMR($CDCl_3$,δ):1.27-2.00(19H,m),2.21-2.44(12H,m),2.58(1H,m),3.01(1H,m),3.89(1H,m),4.00(2H,t,J=7Hz),4.64(1H,m),6.64(1H,s),6.72(1H,d,J=8Hz),6.94(1H,s),7.89(1H,m)

製造例10

実施例１と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ安息香酸メチル

NMR($CDCl_3$,δ):3.50(3H,s),3.90(3H,s),5.36(2H,s),7.08(1H,d,J=9Hz),7.15(1H,t,J=9Hz),7.33-7.49(8H,m),7.73(1H,dd,J=1,8Hz),8.30(1H,d,J=8Hz),8.72(1H,d,J=8Hz)

ESI-MASS(m/z):392(M+H)

２）４－（２－アセトキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ安息香酸メチル
NMR(CDCl$_3$,δ):2.38(3H,s),3.92(3H,s),3.99(3H,s),7.19(1H,d,J=8Hz),7.38(1H,t,J=8Hz),7.55(1H,t,J=8Hz),7.60(1H,s),7.75(1H,dd,J=2,9Hz),7.99(1H,dd,J=1,9Hz),8.66(1H,d,J=8Hz),9.03-9.07(1H,br s)
ESI-MASS(m/z):344(M+H)
３）３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－〔２－（４－メトキシカルボニル）フェニルメトキシ－４－メチル〕フェニルベンズアミド
NMR(DMSO-d$_6$,δ):2.31(3H,s),3.84(3H,s),3.98(3H,s),5.27(2H,s),6.81(1H,d,J=7Hz),7.00(1H,s),7.49(1H,d,J=7Hz),7.62(2H,d,J=8Hz),7.79(1H,s),7.92(2H,d,J=8Hz),8.00(1H,d,J=7Hz),9.85(1H,s)
４）４－ニトロ－３－メトキシ－Ｎ－〔（ＥおよびＺ）－２－（４－メトキシカルボニルフェニル）エテン－１－イル〕フェニルベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):3.87(3H×2/3,s),3.91(3H×1/3,s),3.95(3H×2/3,s),4.00(3H×1/3,s),6.71-8.20(13H,m)
５）３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－〔２－〔３－（エトキシカルボニルメチル）オキシプロプ－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):1.22(3H,t,J=7.5Hz),2.10-2.23(2H,m),3.78(2H,t,J=7.5Hz),4.01(2H,s),4.06(3H,s),4.14(2H,q,J=7.5Hz),4.26(2H,t,J=7.5Hz),6.91-7.06(3H,m),7.42(1H,d,J=7Hz),7.74(1H,s),7.93(1H,d,J=7Hz),8.49(1H,d,J=7Hz),7.78(1H,s)
６）３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－〔２－〔（Ｅ）－５－エトキシカルボニル－４－ペンテン－１－イル〕オキシ－４－メチル〕フェニルベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):1.27(3H,t,J=7.5Hz),1.93-2.08(2H,m),2.27-2.50(2H,m),2.32(3H,s),4.02(3H,s),4.01-4.11(2H,m),4.18(2H,q,J=7.5Hz),5.88(1H,d,J=15Hz),6.72(1H,s),6.83(1H,t,J=7Hz),6.99(1H,dt,J=15,7.5Hz),7.35(1H,d,J=7Hz),7.81(1H,s),7.92(1H,d,J=7Hz),8.28(1H,d,J=7Hz),8.45(1H,s)
７）４－ベンジルオキシ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR(DMSO-d$_6$,δ):1.35-1.49(2H,m),1.49-1.63(2H,m),1.64-1.79(2H,m),2.23(3H,s),2.37(2H,t,J=7Hz),2.72(3H,m),2.78-3.11(2H,m),3.16(3H,s),3.28-3.60(5H,m),3.71-4.13(5H,m),4.43(1H,m),4.99(2H,s),6.63(1H,d,J=8Hz),6.80(2H,d,J=2Hz),6.86(2H,s),6.98(1H,d,J=8Hz),7.26-7.44(5H,m)
８）３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－（２－ベンジルオキシ－４－メチルフェニル）ベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):2.38(3H,s),3.90(3H,s),5.12(2H,s),6.88(1H,s),7.30(1H,s),7.51(4H,s),7.59(1H,s),7.82(1H,d,J=8Hz),8.37(1H,d,J=8Hz),8.53(1H,br)
９）３－メチル－４－ニトロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):1.48-1.60(2H,m),1.69-1.77(2H,m),1.79-1.90(2H,m),2.25(3H,s),2.29(3H,s),2.33-2.42(6H,m),2.47(3H,s),3.32(3H,s),3.45-3.50(2H,m),3.58-3.63(2H,m),3.82-3.95(2H,m),6.55-6.59(2H,m),6.83(1H,d,J=7Hz),7.14(1H,d,J=7Hz),7.37(1H,s),7.70(1H,d,J=7Hz)
10）４－〔（２－ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－クロロ安息香酸エチル
NMR(CDCl$_3$,δ):1.38(3H,t,J=7Hz),4.34(2H,q,J=7Hz),5.38(1H,s),5.39(1H,s),7.03-7.16(2H,m),7.33-7.50(6H,m),7.92-7.99(2H,m),8.24-8.32(1H,m),8.73-8.29(1H,m)
11）３－ヒドロキシ－４－ニトロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):1.48-1.60(2H,m),1.68-1.80(2H,m),1.82-1.91(2H,m),2.28(3H,s),2.30(3H,s),2.37-2.42(6H,m),3.32(3H,s),3.48-3.50(2H,m),3.62-3.68(2H,m),3.90-3.97(2H,m),6

.57-6.58(2H,m),6.80-6.87(2H,m),7.08-7.10(1H,m),7.85(1H,d,J=7Hz)
12）４－〔２－（ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－２－ニトロ安息香酸エチル
NMR($CDCl_3$,δ):1.32(3H,t,J=7Hz),4.32(2H,q,J=7Hz),5.22-5.30(2H,m),7.12-7.27(2H,m),7.37-7.69(9H,m),8.20-8.34(1H,m)
13）２－〔２－（ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－５－ピリジンカルボン酸メチル
NMR($CDCl_3$,δ):3.92(3H,s),5.12(1H,s),5.36(2H,s),6.90-7.01(1H,m),7.10-7.18(2H,m),7.32-7.55(5H,m),8.27-8.34(2H,m),8.46(1H,d,J=6Hz),8.87-8.88(1H,m)
14）４－（２－アセトキシベンゾイル）アミノ－３－ベンジルオキシ安息香酸ベンジル
NMR($CDCl_3$,δ):2.05(3H,s),5.20(2H,s),5.87(2H,s),7.13(1H,d,J=8Hz),7.32-7.47(10H,m),7.50-7.57(1H,m),7.73(1H,s),7.80(1H,d,J=8Hz),7.96(1H,d,J=8Hz),8.68(1H,d,J=7Hz),9.13(1H,s)
15）２－（２－アセトキシベンゾイル）アミノ－５－チオフェンカルボン酸メチル
NMR($CDCl_3$,δ):2.39(3H,s),3.88(3H,s),6.69(1H,d,J=5Hz),7.19-7.21(1H,m),7.35-7.30(1H,m),7.52-7.59(1H,m),7.63-7.66(1H,m),7.92-7.95(1H,m),9.18(1H,s)

製造例11

実施例１と同様にして調製した化合物を塩化水素と反応させて、次の化合物を得た。
４－ベンジルオキシ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド塩酸塩
NMR($DMSO\text{-}d_6$,δ):1.35-1.49(2H,m),1.49-1.63(2H,m),1.64-1.79(2H,m),2.23(3H,s),2.37(2H,t,J=7Hz),2.72(3H,m),2.78-3.11(2H,m),3.16(3H,s),3.28-3.60(5H,m),3.71-4.13(5H,m),4.43(1H,m),4.99(2H,s),6.63(1H,d,J=8Hz),6.80(2H,d,J=2Hz),6.86(2H,s),6.98(1H,d,J=8Hz),7.26-7.44(5H,m)

製造例12

実施例４と同様にして、次の化合物を得た。
４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ安息香酸
NMR($DMSO\text{-}d_6$,δ):1.35(9H,s),2.04(2H,五重線,J=7Hz),3.13(2H,q,J=7Hz),3.98(3H,s),4.29(2H,t,J=7Hz),6.95-7.00(1H,m),7.16(1H,t,J=8Hz),7.28(1H,d,J=8Hz),7.57-7.65(3H,m),8.11(1H,dd,J=1,8Hz),8.63(1H,d,J=8Hz)
ESI-MASS(m/z):445(M+H)

製造例13

実施例10と同様にして、次の化合物を得た。
１）４－ヒドロキシ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.44-1.59(2H,m),1.62-1.92(4H,m),2.22-2.45(12H,m),3.31(3H,s),3.42-3.53(2H,m),3.58-3.74(5H,m),3.77-4.02(2H,m),6.53-6.70(3H,m),6.80-6.96(3H,m)
２）４－（Ｎ－メチル－２－ヒドロキシベンゾイルアミノ）－３－メトキシ安息香酸メチル
NMR($CDCl_3$,δ):3.37(3H,s),3.69(3H,s),3.91(3H,s),6.38(1H,t,J=8Hz),6.72(1H,d,J=8Hz),6.91(1H,d,J=8Hz),7.15(1H,t,J=8Hz),7.21(1H,d,J=9Hz),7.49(1H,d,J=1Hz),7.62(1H,dd,J=1,9Hz)
ESI-MASS(m/z):316(M+H)
３）４－ヒドロキシ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.25-2.00(10H,m),2.06-2.40(6H,m),2.52(1H,m),2.73(6H,br s),3.02(1H,m),3.30(3H,s),3.67(3H,s),3.76-4.07(3H,m),4.82(1H,m),6.56-6.72(3H,m),6.78-6.96(3H,m)

４）４－〔Ｎ－（２－ヒドロキシフェニル）第三級ブトキシカルボニルアミノ〕メチル－３－メトキシ安息香酸メチル
NMR($CDCl_3$,δ):1.38(9H,s),3.82および3.85(計3H,s),3.90および3.91(計3H,s),4.88(2H,s),6.80-6.87(1H,m),6.95(1H,br),7.03-7.12(2H,m),7.25-7.30(2H,m),7.48-7.50(1H,m),7.58-7.60(1H,m)
５）２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシフェノール
NMR($CDCl_3$,δ):1.45(9H,s),1.95-2.07(2H,m),3.25-3.45(2H,m),4.10(2H,t,J=6Hz),4.68(1H,br),6.22(1H,br),6.78-6.97(4H,m)

製造例14

実施例12と同様にして、次の化合物を得た。
１）４－〔Ｎ－メチル－２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ安息香酸メチル
NMR($CDCl_3$,δ):1.43(9H,s),1.95-2.05(2H,m),3.30-3.40(5H,m),3.83(3H,s),3.85(3H,s),3.96-4.04(2H,m),5.23-5.32(1H,br),6.65-6.73(2H,m),7.00-7.16(3H,m),7.38-7.45(2H,m)
ESI-MASS(m/z):473(M+H)
２）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ安息香酸メチル
NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),2.13-2.21(2H,m),3.33(2H,q,J=7Hz),3.92(3H,s),4.00(3H,s),4.29(2H,t,J=7Hz),4.72-4.78(1H,br),7.03(1H,d,J=8Hz),7.23(1H,t,J=8Hz),7.49(1H,t,J=8Hz),7.60(1H,s),7.75(1H,d,J=8Hz),8.27(1H,d,J=8Hz),8.77(1H,d,J=8Hz)
ESI-MASS(m/z):459(M+H)
３）４－ニトロ－Ｎ－〔２－（４－メトキシカルボニルフェニル）メトキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.27(3H,s),3.40(3H,s),3.94(3H,s),4.95(1H,d,J=14Hz),5.09(1H,d,J=14Hz),6.62(1H,s),6.69(1H,d,J=7Hz),6.97(1H,d,J=7Hz),7.31-7.49(4H,m),7.95(2H,d,J=8Hz),8.10(2H,d,J=8Hz)

製造例15

実施例16と同様にして、次の化合物を得た。
４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.33-1.64(4H,m),1.64-1.81(2H,m),2.20(3H,s),2.29-2.43(2H,m),2.73(3H,s),2.79-3.10(4H,m),3.14(3H,s),3.22-3.56(4H,m),3.62(3H,s),3.72-4.18(3H,m),4.42(1H,m),6.62(1H,d,J=8Hz),6.74-6.92(3H,m),6.92-7.10(2H,m)

製造例16

実施例43と同様にして、次の化合物を得た。
１）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ安息香酸メチル
NMR($CDCl_3$,δ):3.93(3H,s),4.03(3H,s),6.96(1H,t,J=8Hz),7.04(1H,d,J=8Hz),7.47(1H,t,J=8Hz),7.54(1H,dd,J=1,8Hz),7.62(1H,s),7.76(1H,d,J=8Hz),8.51(1H,d,J=8Hz),8.85-8.89(1H,br s)
ESI-MASS(m/z):302(M+H)
２）３－ベンジルオキシ－４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ安息香酸ベンジル
NMR($CDCl_3$,δ):5.23(2H,s),5.38(2H,s),6.82(1H,t,J=7Hz),7.01(1H,d,J=7Hz),7.30-7.49(12H,m),7.70-7.73(1H,m),7.80-7.83(1H,m),7.52(1H,d,J=7Hz),8.95(1H,s)
３）２－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－５－チオフェンカルボン酸メチル
NMR(DMSO-d_6,δ):3.79(3H,s),6.95-7.03(3H,m),7.42-7.48(1H,m),7.62-7.64(1H,m),7.88(1H,d,J:7Hz)

製造例17

実施例30と同様にして、次の化合物を得た。
３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピ

ペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.29(3H,s),2.35(3H,s),2.38-2.54(4H,m),3.39(3H,s),3.43-3.53(2H,m),3.66(3H,s),3.71-3.88(2H,m),4.92(1H,d,J=14Hz),5.07(1H,d,J=14Hz),6.65-6.72(2H,m),6.87(1H,d,J=7Hz),6.98(1H,d,J=7Hz),7.03(1H,s),7.37(2H,d,J=8Hz),7.45(2H,d,J=8Hz),7.56(1H,d,J=7Hz)

製造例18

２－（４－メトキシカルボニルフェニル）メトキシ－４－メチルアニリン（420mg）と37％ホルムアルデヒド溶液（69.7mg）とのメタノール（10ml）－酢酸（0.1ml）混合物中混合物に、水素化シアノ硼素ナトリウム（146mg）を加え、混合物を外界温度で３時間攪拌した。溶液を酢酸エチル（30ml）で希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水および食塩水で順次洗った。有機溶液を硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で溶媒を蒸発させた。残留物をシリカゲルカラム（クロロホルム）により精製して、２－（４－メトキシカルボニルフェニル）メトキシ－４－メチル－Ｎ－メチルアニリン（356mg）を得た。
NMR($CDCl_3$,δ):2.22(3H,s),2.80(3H,s),3.91(3H,s),5.11(2H,s),6.53(1H,d,J=7Hz),6.63(1H,s),6.72(1H,d,J=7Hz),7.49(2H,d,J=8Hz),8.04(2H,d,J=8Hz)

製造例19

２－ベンジルオキシ－Ｎ－第三級ブトキシカルボニルアニリン（１ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（40ml）溶液を、０℃で、水素化ナトリウム（147mg、鉱油中60％w/w）により処理した。反応混合物を０℃で30分間攪拌し、つぎに外界温度で１時間攪拌した。４－ブロモメチル－３－メトキシ安息香酸メチル（909mg）を加え、混合物を外界温度で30分間攪拌した。水で希釈して反応を終焉させ、混合物を酢酸エチルで希釈した。有機層を0.5Ｎ塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水で洗った。溶液を減圧下で濃縮し、残留物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＝９：１）により精製して、４－〔Ｎ－〔２－（ベンジルオキシ）フェニル〕第三級ブトキシカルボニルアミノ〕メチル－３－メトキシ安息香酸メチル（1.38ｇ）を得た。
NMR($CDCl_3$,δ):1.32および1.40(計9H,s),3.65および3.71(計3H,s),3.90(3H,s),4.77(2H,s),5.07(2H,s),6.78-7.00(3H,m),7.09-7.20(1H,m),7.27-7.55(8H,m)

製造例20

製造例19と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－ニトロ－３－メトキシ－Ｎ－〔（ＥおよびＺ）－２－（４－メトキシカルボニルフェニル）エテン－１－イル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):3.40(3H×2/3,s),3.49(3H×1/3,s),3.54(3H×1/3,s),3.60(3H×2/3,s),3.86(3H×2/3,s),3.95(3H×1/3,s),6.41-8.07(7H,m)

２）３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－〔２－〔３－（エトキシカルボニルメチル）オキシプロプ－１－イル〕オキシ〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.27(3H,t,J=7.5Hz),2.04-2.17(2H,m),3.37(3H,s),3.71(2H,t,J=7.5Hz),3.76(3H,s),4.06(3H,s),4.20(2H,q,J=7.5Hz),6.78-7.01(4H,m),7.04(1H,s),7.19(1H,t,J=7Hz),7.60(1H,d,J=7Hz)

３）３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－（２－ベンジルオキシ－４－メチルフェニル）－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.28(3H,s),3.39(3H,s),3.58(3H,s),4.85(1H,d,J=12Hz),5.07(1H,d,J=12Hz),6.68(2H,s),6.83(1H,d,J=9Hz),6.96(1H,d,J=9Hz),7.00(1H,s),7.30-7.44(5H,m),7.52(1H,d,J=9Hz)

製造例21

２－（３－ヒドロキシプロプ－１－イル）チオ安息香酸メチル（3.7ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（30ml）溶液に、氷浴で冷却下、水素化ナトリウム（油中60％、719mg）を加え、溶液を同温度で30分間攪拌した。この溶液に、塩化４－メトキシベンジル（2.56ｇ）を加え、混合物を外界温度で５時間攪拌した。混合物を酢酸エチル（100ml）で希釈し、溶液を水および食塩水で洗った。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧下で蒸発させて、粗製の油状物を得た。この粗製品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）により精製して、２－〔３－（４－メトキシフェニル）メトキシプロプ－１－イル〕チオ安息香酸メチル（2.13ｇ）を得た。
NMR(CDCl$_3$,δ):1.94-2.07(2H,m),3.03(2H,t,J=7.5Hz),3.58(2H,t,J=7.5Hz),3.80(3H,s),3.90(3H,s),4.39(2H,q,J=7.5Hz),4.45(2H,s),6.87(2H,d,J=8Hz),7.13(1H,t,J=7Hz),7.21-7.46(4H,m),7.96(1H,d,J=7Hz)

製造例22

製造例21と同様にして、次の化合物を得た。
２－〔３－（エトキシカルボニルメチル）オキシプロプ－１－イル〕オキシニトロベンゼン
NMR(CDCl$_3$,δ):1.25(3H,t,J=7.5Hz),2.08-2.20(2H,m),3.73(2H,t,J=7.5Hz),4.06(2H,s),4.13-4.32(4H,m),7,01(1H,m),7.10(1H,d,J=7Hz),7.50(1H,t,J=7Hz),7.82(1H,d,J=7Hz)

製造例23

３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－〔２－（４－メトキシカルボニル）フェニルメトキシ－４－メチル〕フェニルベンズアミド（7.67ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（50ml）溶液に、氷浴で冷却下、水素化ナトリウム（油中60％、817mg）を加え、溶液を外界温度で３０分間攪拌した。この溶液にヨードメタン（1.27ml）を加え、混合物を外界温度で２時間攪拌した。混合物を酢酸エチル（100ml）で希釈し、溶液を水および食塩水で洗った。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧下で蒸発させて、油状物を得た。この油状物をジエチルエーテルを用いて固化させて、３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－〔２－（４－メトキシカルボニル）フェニルメトキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド（6.65ｇ）を得た。
NMR(CDCl$_3$,δ):2.28(3H,s),3.40(3H,s),3.60(3H,s),3.94(3H,s),4.91(1H,d,J=14Hz),5.09(1H,d,J=14Hz),6.64(1H,s),6.71(1H,d,J=7Hz),6.84(1H,d,J=7Hz),7.00-7.04(2H,m),7.42(2H,d,J=8Hz),7.52(1H,d,J=7Hz),8.08(2H,d,J=8Hz)

製造例24

製造例23と同様にして、次の化合物を得た。
３－メトキシ－４－ニトロ－Ｎ－〔２－〔（Ｅ）－５－エトキシカルボニル－４－ペンテン－１－イル〕オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):1.28(3H,t,J=7.5Hz),1.90-2.00(2H,m),2.00(3H,s),2.34-2.45(2H,m),3.35(3H,s),3.77(3H,s),3.84-3.97(2H,m),4.19(2H,q,J=7.5Hz),5.88(1H,d,J=15Hz),6.58-6.64(2H,m),6.84-7.02(3H,m),7.07(1H,s),7.60(1H,d,J=7Hz)

製造例25

実施例45と同様にして、次の化合物を得た。
２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルアニリン
NMR(CDCl$_3$,δ):1.18-2.00(10H,m),2.14-2.69(13H,m),2.99(1H,m),3.44-4.07(5H,m),4.64(1H,m),6.45-6.70(3H,m)

製造例26

実施例38と同様にして、次の化合物を得た。
２－ヒドロキシ－Ｎ－第三級ブトキシカルボニルアニリン
NMR(CDCl$_3$,δ):1.55(9H,s),6.63(1H,s),6.82-6.89(1H,m),6.97-6.99(1H,m),7.02-7.08(2H,m),8.13(1H,br)

製造例27

実施例87と同様にして、次の化合物を得た。
２－ニトロ－５－チオフェンカルボン酸メチル
NMR(CDCl$_3$,δ):3.95(3H,s),7.70(1H,d,J=5Hz),7.86-7.88(1H,m)

製造例28

臭化ホスホニウム（1.9ｇ）のテトラヒドロフラン（35ml）懸濁液に、０℃で、1.0Mリチウムビス（トリメチルシリル）アミド・テトラヒドロフラン溶液（7.88ml）を５分間かけて加えた。40分後、冷却浴を取り去り、赤色の懸濁液を外界温度で15分間攪拌した。懸濁

液を-78℃に再冷却し、２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシベンズアルデヒド（1.16ｇ）のテトラヒドロフラン（10ml）溶液（プラス５ml洗浄液）をカニューレを通して加えた。赤色の反応混合物を０℃～外界温度で攪拌した。２０時間後、０℃で0.5Ｎ塩酸により溶液を希釈して、反応を終焉させた。生じた混合物を濃縮し、クロロホルムで抽出した。有機抽出液を食塩水で洗い、硫酸マグネシウムで乾燥し、▲濾▼過し、濃縮して、４－〔２－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシ〕フェニル〕ビニル－３－メトキシ安息香酸（2.4ｇ）を得た。

NMR(DMSO-d_6,δ):1.99-2.22(2H,m),3.72-3.94(5H,m),3.98-4.17(2H,m),6.38-7.88(11H,m)

製造例29

水素化ナトリウム（60%油中懸濁液、88.3mg）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（６ml）懸濁液に、４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ安息香酸メチル（600mg）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（４ml）溶液を加え、混合物を０℃で１時間攪拌した。この溶液に沃化メチル（0.14ml）を加え、混合物を０℃で30分間攪拌した。反応温度を30分間かけて外界温度まで上昇させ、１Ｎ塩酸で反応を終焉させ、つぎに、生じた溶液を酢酸エチルで抽出した。乾燥し、▲濾▼過し、溶媒を除去して、粗製の生成物を得た。この粗製品をカラムクロマトグラフィー（溶離剤；ヘキサン：酢酸エチル＝３：１）により精製して、４－（Ｎ－メチル－２－ベンジルオキシベンゾイルアミノ）－３－メトキシ安息香酸メチル（650mg）を得た。

NMR(CDCl$_3$,δ):3.35(3H,s),3.72(3H,s),3.87(3H,s),4.93-5.00(2H,m),6.65(1H,d,J=8Hz),6.76(1H,t,J=8Hz),7.00-7.12(2H,m),7.18-7.23(1H,m),7.30-7.43(6H,m),8.02(1H,s)

ESI-MASS(m/z):406(M+H)

製造例30

（Ｓ）－１，３－ブタンジオール（1.0ｇ）とトリエチルアミン（1.12ｇ）とのジクロロメタン（30ml）溶液に、０℃で、塩化ｐ－トルエンスルホニル（2.12ｇ）を少量ずつに分割して加え、混合物を外界温度で３時間攪拌し、一夜放置した。生じた溶液をジクロロメタン（30ml）で希釈し、有機層を１Ｎ塩酸、飽和重炭酸ナトリウム水溶液および食塩水で順次洗った。乾燥し、▲濾▼過し、溶媒を除去して、ｐ－トルエンスルホン酸（Ｓ）－３－ヒドロキシブチル（2.26ｇ）を得た。

NMR(CDCl$_3$,δ):1.20(3H,d,J=8Hz),1.63-1.77(1H,m),1.78-1.93(1H,m),2.47(3H,s),3.89-4.00(1H,m),4.08-4.16(1H,m),4.20-4.29(1H,m),7.37(2H,d,J=9Hz),7.80(2H,d,J=9Hz)

製造例31

ｐ－トルエンスルホン酸（Ｓ）－３－ヒドロキシブチル（2.25ｇ）とフタルイミドカリウム塩（3.41ｇ）とのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（40ml）中混合物を、60℃で3.5時間攪拌した。生じた混合物を水（50ml）で希釈し、水層を酢酸エチルで抽出した。乾燥し、▲濾▼過し、溶媒を除去して、粗製生成物を得た。この粗製品をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離剤：ヘキサン－酢酸エチル＝２：１）に付して、（Ｓ）－４－（フタルイミド－１－イル）－２－ブタノール（910mg）を得た。

NMR(CDCl$_3$,δ):1.22(3H,d,J=7Hz),1.64-1.88(2H,m),2.73(1H,d,J=4Hz),3.68-3.78(1H,m),3.82-3.89(2H,m),7.70-7.77(2H,m),7.83-7.89(2H,m)

製造例32

氷浴で冷却した臭化４－メトキシカルボニルフェニルメチル－トリフェニルホスホニウム（9.75ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド（50ml）溶液に、カリウム第三級ブトキシド（2.23ｇ）を加えた。氷浴中で30分間攪拌したのち、溶液に２－ニトロベンズアルデヒド（3.0ｇ）を加え、混合物を同温度で１時間攪拌した。混合物を酢酸エチルで希釈し、溶液を水および食塩水で洗った。有機溶液を硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧下で蒸発させて、油状物を得た。この油状物をシリカゲルカラムに付した（ｎ－ヘキサン中10%酢酸エチル）。トランス異性体（1.4ｇ）がまず溶出され、つぎにシス－トランス混合物（3.7ｇ）が溶出された。

４－〔（Ｅ）－２－（２－ニトロフェニル）エテン－１－イル〕安息香酸メチル

NMR(CDCl$_3$,δ):3.92(3H,s),7.10(1H,d,J=15Hz),7.41-7.50(2H,m),7.55-7.79(4H,m),8.00(

1H,d,J=7Hz),8.07(2H,d,J=8Hz)
４－〔（ＥおよびＺ）－２－（２－ニトロフェニル）エテン－１－イル〕安息香酸メチル
NMR(CDCl$_3$,δ):3.83(3H×2/3(Z),s),3.91(3H×1/3(E),s),6.79(1H×2/3,d,J=12Hz),6.98-8.14(9H+1/3H,m)

製造例33

３－（３－エトキシカルボニルプロプ－１－イル）オキシ－４－ニトロトルエン（2.67ｇ）のジクロロメタン（30ml）溶液に、-78℃で、水素化ジイソブチルアルミニウム（1.5Mトルエン溶液、７ml）を加え、溶液を同温度で２時間攪拌した。少量の水を添加して反応を終焉させ、クロロホルム（30ml）と１Ｎ塩酸（20ml）との混合物を加えた。有機層を水および食塩水で洗った。有機溶液を硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧下で蒸発させて、油状物を得た。この粗製アルデヒドとカルボエトキシメチレントリフェニルホスホラン（3.49ｇ）とのテトラヒドロフラン（20ml）中混合物を外界温度で一夜攪拌し、溶媒を減圧下で蒸発させた。残留物をシリカゲルカラムに付し、10％酢酸エチル－ｎ－ヘキサンで溶出して、３－〔（Ｅ）－５－エトキシカルボニル－４－ペンテン－１－イル〕オキシ－４－ニトロトルエン（2.29ｇ）を得た。
NMR(CDCl$_3$,δ):1.27(2H,t,J=7.5Hz),1.93-2.04(2H,m),2.37(3H,s),2.40-2.50(2H,m),4.09(2H,t,J=7.5Hz),4.18(2H,q,J=7.5Hz),5.89(1H,d,J=15Hz),6.80(1H,d,J=7Hz),6.82(1H,s),7.00(1H,dt,J=15,7.5Hz),7.78(1H,d,J=7Hz)

製造例34

水素化用300ml耐圧瓶を窒素置換し、10％パラジウム炭（1.5ｇ）を瓶に入れた。２－（３－フタルイミドプロピルオキシ）安息香酸ベンジル（1.50ｇ）のメタノール（50ml）－１，４－ジオキサン（50ml）溶液を、酢酸１滴とともに、瓶に加えた。混合物を、パー装置中、３気圧の水素下、35℃で８時間振盪した、触媒をセライト層を通しての▲濾▼過により除去し、１，４－ジオキサン（20mlx2）で洗った。合わせた溶液を回転蒸発器で濃縮して、粗製の固体を得た。この粗製の固体をメタノール（57ml）および１，４－ジオキサン（10ml）中で加熱し、冷却して、生成物を再結晶した。結晶を▲濾▼取し、冷メタノール（５ml）で洗い、風乾して、２－（３－フタルイミドプロピルオキシ）安息香酸（4.18ｇ）を得た。
mp:155-157℃
NMR(DMSO-d$_6$,δ):1.98-2.14(2H,m),3.79(2H,t,J=7Hz),4.08(2H,t,J=7Hz),6.99(1H,dd,J=8,8Hz),7.08(1H,d,J=8Hz),7.47(1H,m),7.62(1H,d,J=8Hz),7.77-7.92(4H,m)

製造例35

４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－カルボキシフェニルメチル）オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（500mg）、エタノールアミン（109mg）、トリフェニルホスフィン（936mg）および四塩化炭素（0.57ml）のピリジン－アセトニトリル（１：１、15ml）中混合物を、外界温度で18時間攪拌した。溶媒を蒸発させ、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（SiO$_2$、０～10％メタノール含有クロロホルム）により精製して、４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）カルバモイル〕フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（392mg）を得た。
NMR(CDCl$_3$,δ):2.27(3H,s),3.33(3H,s),3.48(3H,s),3.60(2H,q,J=5Hz),3.78-3.84(2H,m),4.97(2H,br),6.35(1H,d,J=8Hz),6.61(1H,s),6.68-6.79(3H,m),7.04(1H,d,J=8Hz),7.11(1H,br),7.26(2H,d,J,8Hz),7.76(2H,d,J,8Hz)

製造例36

氷冷４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）カルバモイル〕フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（387mg）に、塩化チオニル（129mg）を滴下し、混合物を外界温度で１時間攪拌した。生じた混合物に炭酸水素ナトリウム水溶液（15ml）を加えた。溶液を酢酸エチル（10mlx3）で抽出した。有機層を食塩水で洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で除去して、４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（２－オキサゾリン－２－イル）フェ

ニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（315mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):2.26(3H,s),3.35(3H,s),3.52(3H,s),4.08(2H,t,J=10Hz),4.25(2H,t,J=10Hz),4.94(1H,br),5.07(1H,br),6.40(1H,d,J=8Hz),6.40-6.88(4H,m),7.00(1H,d,J=8Hz),7.36(2H,d,J=8Hz),7.96(2H,d,J=8Hz)

製造例37

３－ブロモプロピルアミン塩酸塩（5.0ｇ）とジイソプロピルエチルアミン（5.90ｇ）とのジクロロメタン（80ml）中混合物に、塩化９－フルオレニルメトキシカルボニル（5.91ｇ）を加え、混合物を外界温度で３時間攪拌し、一夜放置した。生じた混合物をジクロロメタン（50ml）で希釈し、有機層を１Ｎ塩酸および食塩水で順次洗った。乾燥し、▲濾▼過し、溶媒を除去して、粗生成物を得た。この粗製品をジエチルエーテル－ヘキサン（１：５）を用いて粉末化して、臭化３－（９－フルオレニルメトキシカルボニルアミノ）プロピル（7.82ｇ）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):2.02-2.12(2H,m),3.30-3.45(4H,m),4.21(1H,t,J=8Hz),4.44(2H,d,J=8Hz),4.82-4.90(1H,br),7.32(2H,t,J=8Hz),7.40(2H,t,J=8Hz),7.58(2H,d,J=8Hz),7.78(2H,d,J=8Hz)

ESI-MASS(m/z):360(M+H)

製造例38

チオサリチル酸（500mg）のエタノール（15ml）－２Ｎ水酸化ナトリウム水溶液（3.2ml）溶液に、外界温度で、臭化３－（９－フルオレニルメトキシカルボニルアミノ）プロピルを加え、懸濁液を２時間攪拌した。生じた透明な溶液を水（20ml）で希釈し、１Ｎ塩酸（6.5ml）で酸性化した。白色結晶を▲濾▼取し、この固体をエタノール－水（１：３、15ml）で、つぎにｎ－ヘキサン－ジエチルエーテル（２：１、15ml）で洗って、２－〔３－（９－フルオレニルメトキシカルボニルアミノ）プロピルチオ〕安息香酸（1.07ｇ）を得た。

NMR(DMSO-d_6,δ):1.69-1.79(2H,m),2.90(2H,t,J=8Hz),3.08-3.18(2H,m),4.21(1H,t,J=6Hz),4.32(2H,d,J=6Hz),7.20(1H,t,J=8Hz),7.28-7.45(6H,m),7.50(1H,t,J=8Hz),7.68(2H,d,J=8Hz),7.85-7.91(3H,m)

ESI-MASS(m/z):434(M+H)

実施例１

２－ベンゾイルオキシ安息香酸（1.17ｇ）と塩化オキサリル（0.536ml）とのジクロロメタン（30ml）中混合物に、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド２滴を加え、混合物を外界温度で１時間攪拌した。溶媒を蒸発させて除去したのち、残留酸塩化物のジクロロメタン（５ml）溶液を、４－アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミド（1.97ｇ）とトリエチルアミン（1.07ml）とのジクロロメタン（５ml）中混合物に加え、得られた溶液を外界温度で３時間攪拌した。反応混合物を１Ｎ塩酸、水（20ml）および食塩水（20ml）で順次洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を蒸発させて、油状物を得た。この粗製品をシリカゲルカラム（クロロホルム）で精製して、４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミド（2.89ｇ）を無色油状物として得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.23(3H,t,J=7.5Hz),1.41-1.54(2H,m),1.63-1.75(2H,m),1.75-1.85(2H,m),2.32(2H,t,J=7.5Hz),3.32(3H,s),3.80-3.95(2H,br),4.12(2H,q,J=7.5Hz),5.18(2H,s),6.82-6.90(2H,m),6.92-7.00(3H,m),7.07-7.19(5H,m),7.38-7.52(6H,m),8.27(1H,d,J=7Hz)

実施例２

実施例１と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルアミノプロプ－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.00(2H,m),2.26(3H,s),2.32-2.39(4H,m),3.32(3H,s),3.34-3.41(6H,m),3

.81-4.02(2H,m),5.20(2H,s),6.78-7.26(9H,m),7.38-7.53(7H,m),8.27(1H,d,J=7Hz)
２）３－メトキシ－４－（２－ニトロベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.43-1.60(2H,m),1.61-1.90(4H,m),2.30(6H,s),2.31-2.44(6H,m),3.33(3H,s),3.44-3.53(2H,m),3.57-3.67(2H,m),3.71(3H,s),3.81-4.03(2H,m),6.56-6.69(2H,m),6.82-6.99(2H,m),7.03(1H,s),7.57-7.66(2H,m),7.67-7.76(1H,m),8.02-8.13(2H,m),8.21(1H,d,J=8Hz)
３）４－（２－メトキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.25(3H,t,J=7Hz),1.43-1.59(2H,m),1.63-1.90(4H,m),2.26(3H,s),2.34(2H,t,J=7Hz),3.32(3H,s),3.79-3.99(2H,m),4.02(3H,s),4.11(2H,q,J=7Hz),6.53-6.66(2H,m),6.87(1H,d,J=8Hz),7.01(1H,d,J=8Hz),7.12(1H,dd,J=8,8Hz),7.29-7.40(2H,m),7.42-7.56(3H,m),8.18-8.28(1H,m),9.81(1H,br s)
４）４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.25(3H,t,J=7Hz),1.42-1.58(2H,m),1.62-1.90(4H,m),2.32(2H,t,J=7Hz),3.28(3H,s),3.33(3H,s),3.78-4.03(2H,m),4.12(2H,q,J=7Hz),5.30(2H,s),6.72-7.22(8H,m),7.28-7.55(6H,m),8.20-8.29(1H,m),8.38(1H,d,J=8Hz)
５）４－〔２－（アセチルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.32-2.01(10H,m),2.21-2.46(15H,m),1.57(1H,m),3.02(1H,m),3.32(3H,s),3.79(3H,s),3.83-4.03(3H,m),4.69(1H,m),6.54-6.67(2H,m),6.80-8.33(8H,m)
６）４－〔２－（アセチルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.26(3H,t,J=7Hz),1.44-1.91(6H,m),2.21-2.41(8H,m),3.32(3H,s),3.80(3H,s),3.82-4.03(2H,m),6.54-6.67(2H,m),6.80-6.95(2H,m),7.07(1H,s),7.15(1H,d,J=8Hz),7.35(1H,m),7.51(1H,m),7.94(1H,m),8.28(1H,d,J=8Hz),8.87(1H,s)
７）４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－２－クロロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.26(3H,t,J=7Hz),1.47-1.98(6H,m),2.36(2H,t,J=7Hz),3.34(3H,s),3.96(2H,t,J=7Hz),4.14(2H,q,J=7Hz),5.17(2H,s),6.64-6.82(3H,m),6.96(1H,d,J=8Hz),7.02-7.21(5H,m),7.41-7.62(6H,m),8.25(1H,m)
８）４－（２－アセトキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチルフェニル）ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.21(3H,s),2.31(3H,s),3.38(3H,s),3.73(3H,s),6.87(1H,d,J=8Hz),7.00(1H,s),7.03-7.24(5H,m),7.29-7.43(1H,m),7.51(1H,dd,J=8,8Hz),7.92(1H,d,J=8Hz),8.30(1H,d,J=8Hz),8.87(1H,br s)
９）４－（３－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.32-1.42(2H,m),1.50-1.58(2H,m),1.67-1.90(6H,m),2.28(3H,s),2.29(6H,s),2.37(2H,t,J=8Hz),2.52-2.62(1H,m),2.98-3.07(1H,m),3.34(3H,s),3.78(3H,s),3.85-3.98(3H,m),4.59-4.67(1H,m),5.12(2H,s),6.58(1H,d,J=8Hz),6.63(1H,d,J=8Hz),6.84(1H,d,J=8Hz),6.92(1H,d,J=8Hz),7.02(1H,s),7.12-7.17(1H,m),7.33-7.50(8H,m),8.28(1H,d,J=8Hz),8.48(1H,s)
ESI-MASS(m/z):721(M+H)
10）４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニ

ルペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.25(3H,t,J=7.5Hz),1.43-1.56(2H,m),1.65-1.84(4H,m),2.25(3H,s),2.32(2H,t,J=7.5Hz),3.29(3H,s),3.77-3.93(2H,m),4.12(2H,q,J=7.5Hz),5.19(2H,s),6.51(2H,m),6.81(1H,d,J=7Hz),6.98(2H,d,J=8Hz),7.07-7.19(4H,m),7.39-7.53(6H,m),8.27(1H,d,J=7Hz)
11）４－（２－ヨードベンゾイル）アミノ－Ｎ－〔２－（４－メトキシフェニル）メトキシ〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):3.35(3H,s),3.82(3H,s),4.90-5.05(2H,m),6.83(1H,t,J=7Hz),6.89-6.96(3H,m),7.04(1H,d,J=7Hz),7.10-7.19(2H,m),7.22-7.32(4H,m),7.37-7.48(3H,m),7.53(1H,s),7.88(1H,d,J=7Hz)
12）３－メトキシ－４－〔２－（４－メトキシフェニルメチル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.27(3H,s),2.31(3H,s),2.35-2.52(2H,m),3.24(3H,s),3.37(3H,s),3.40-3.53(2H,m),3.62-3.81(2H,m),3.39(3H,s),4.89(1H,d,J=14Hz),5.06(1H,d,J=14Hz),5.21(2H,s),6.61-6.70(2H,m),6.80-7.18(7H,m),7.30-7.45(7H,m),8.22(1H,d,J=7Hz),8.31(1H,d,J=7Hz)
13）４－〔２－（Ｅ）－（２－エトキシカルボニルエテン－１－イル）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.30(3H,t,J=7.5Hz),1.49-1.60(2H,m),1.67-1.77(2H,m),1.79-1.90(2H,m),2.29(6H,s×2),2.33-2.43(6H,m),3.33(3H,s),3.45-3.53(2H,m),3.60-3.67(2H,m),3.71(3H,s),3.85-4.01(2H,m),4.23(2H,q,J=7.5Hz),6.40(1H,d,J=15Hz),6.58-6.67(2H,m),6.86(1H,d,J=7Hz),6.92(1H,d,J=7Hz),7.02(1H,s),7.40-7.52(2H,m),7.58(1H,d,J=7Hz),7.68(1H,d,J=7Hz),8.02-8.15(2H,m),8.27(1H,d,J=7Hz)
14）４－（２－ジメチルアミノ－４－メチル）フェノキシメチル－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.20(3H,t,J=7.5Hz),1.45-1.58(2H,m),1.66-1.77(2H,m),1.80-1.95(2H,m),2.25(3H,s),2.29-2.34(2H,m),2.31(3H,s),2.80(6H,s),4.00-4.16(4H,m),5.20(2H,s),6.68-6.89(5H,m),7.58(2H,d,J=8Hz),7.88(2H,d,J=8Hz),8.37(1H,d,J=7Hz),8.50(1H,s)
15）４－（２－ベンジルオキシ）ベンゾイルアミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔（ＥおよびＺ）－２－（４－メトキシカルボニルフェニル）エテン－１－イル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):3.06(3H×2/3,s),3.10(3H×1/3,s),3.40(3H×2/3,s),3.43(3H×1/3,s),3.46(3H×2/3,s),3.91(3H×1/3,s),5.20(2H×2/3,s),5.27(2H×1/3,s),6.38-8.37(22H,m)
16）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（４－メトキシフェニル）メトキシプロプ－１－イル）チオベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.44-1.58(2H,m),1.61-1.73(2H,m),1.68-1.92(4H,m),2.25(3H,s),2.27(3H,s),2.30-2.41(6H,m),2.99(2H,t,J=7.5Hz),3.30(3H,s),3.43-3.52(4H,m),3.57-3.66(2H,m),3.70(3H,s),3.78(3H,s),3.82-3.90(2H,m),4.38(2H,s),6.53-6.65(2H,m),6.79-6.93(3H,m),7.02(1H,s),7.17-7.29(4H,m),7.33-7.45(2H,m),7.65(1H,d,J=7Hz),8.29(1H,d,J=7Hz),8.80(1H,s)
17）４－（２，４－ジメトキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.43-1.57(2H,m),1.64-1.72(2H,m),1.72-1.91(2H,m),2.24(3H,s),2.27(3H,s),2.30-2.40(6H,m),3.31(3H,s),3.42-3.50(2H,m),3.59-3.65(2H,m),3.77(3H,s),3.80(3H,s),3.80-4.02(2H,m),3.96(3H,s),6.52-6.63(2H,m),6.81-7.04(5H,m),7.79(1H,m),8.38(1H,d,J=7Hz)

18）４－〔２－（アセトキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.61(2H,m),1.64-1.93(4H,m),2.22-2.46(15H,m),3.33(3H,s),3.44-3.53(2H,m),3.58-3.68(2H,m),3.79(3H,s),3.82-4.04(2H,m),6.54-6.68(2H,m),6.80-6.95(2H,m),7.04(1H,s),7.14(1H,d,J=8Hz),7.35(1H,m),7.51(1H,m),7.92(1H,m),8.29(1H,br d,J=8Hz),8.86(1H,s)
19）４－（２－ベンジルオキシ－４－メチルベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.48-1.61(2H,m),1.69-1.91(4H,m),2.28(3H,s),2.30(3H,s),2.32-2.44(6H,m),2.38(3H,s),3.20(3H,s),3.32(3H,s),3.50(2H,t,J=5Hz),3.64(2H,t,J=4Hz),3.85-4.06(2H,m),4.89(2H,s),6.60-6.68(2H,m),6.82-6.95(4H,m),7.18(1H,dd,J=2.7Hz),7.27-7.40(5H,m),7.98(1H,d,J=8Hz),8.38(1H,d,J=8Hz)
20）４－（２－ベンジルオキシ－４－メチルベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.86(6H,m),2.28(3H,s),2.30(3H,s),2.36(3H,s),2.32-2.48(6H,m),3.30(3H,s),3.45-3.51(2H,m),3.60-3.66(2H,m),3.63(3H,s),3.79-4.00(2H,m),5.24(2H,d,J=9Hz),6.56-6.68(2H,m),6.80-6.93(5H,m),7.31-7.58(5H,m),8.11(1H,d,J=8Hz),8.36(1H,d,J=8Hz)
21）４－（２－ベンジルオキシ－５－メチルベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.99(8H,m),2.28(3H,s),2.31(3H,s),2.31-2.45(6H,m),3.25(3H,s),3.29(2H,s),3.48(3H,s),3.48-3.53(2H,m),3.60-3.64(2H,m),3.82-4.01(2H,m),5.27(2H,s),6.54-6.63(2H,m),6.81-6.95(4H,m),7.19-7.47(7H,m),8.02(1H,s),8.36(1H,d,J=8Hz)
22）４－（２－ベンジルオキシ－４－クロロベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イルカルボニル）ペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.46-1.86(6H,m),2.15-2.31(2H,m),2.29(6H,s),2.30-2.58(4H,m),3.28(3H,s),3.49(2H,t,J=5Hz),3.60(3H,s),3.61(2H,t,J=5Hz),3.85-4.00(2H,m),5.15(2H,s),6.54-6.67(2H,m),6.83-7.16(4H,m),7.34-7.49(7H,m),8.01(1H,d,J=8Hz),8.19(1H,d,J=8Hz)
23）４－（２－ベンジルオキシ－４－メトキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イルカルボニル）ペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.44-1.59(2H,m),1.63-1.84(4H,m),2.28(3H,s),2.30(3H,s),2.25-2.40(6H,m),3.28(3H,s),3.30(3H,s),3.48(2H,t,J=4Hz),3.62(2H,t,J=4Hz),3.89-4.01(2H,m),5.26(2H,s),6.52-6.67(4H,m),6.81-6.92(4H,m),7.35-7.48(5H,m),8.21(1H,d,J=9Hz),8.38(1H,d,J=8Hz)
24）４－（２－アセトキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－（２－ベンジルオキシ－４－メチルフェニル）－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.29(3H,s),3.39(3H,s),3.60(3H,s),4.88(1H,d,J=12Hz),5.02(1H,d,J=12Hz),6.68-6.73(2H,m),6.82(1H,d,J=8Hz),7.02(1H,s),7.11-7.20(2H,m),7.31-7.42(5H,m),7.46-7.53(1H,m),7.93(1H,d,J=8Hz),8.27(1H,d,J=8Hz),8.86(1H,br)
25）４－（２－アセトキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（２－オキサゾリン－２－イル）フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.27(3H,s),2.31(3H,s),3.39(3H,s),3.63(3H,s),4.07(2H,t,J=10Hz),4.42(2H,t,J=10Hz),4.91(1H,d,J=12Hz),5.11(1H,d,J=12Hz),6.61(1H,br),6.77(1H,d,J=8Hz),6

.82-7.15(5H,m),7.24-7.50(4H,m),7.90(2H,d,J=8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz)
26）４－〔２－〔３－（９－フルオレニルメチル）オキシカルボニルアミノプロプ－１－イル〕チオベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.32-1.92(12H,m),2.29(9H,s),2.39(2H,t,J=5Hz),2.60(1H,t,J=10Hz),2.90-3.12(3H,m),3.29(2H,q,J=5Hz),3.33(3H,s),3.75(3H,s),3.82-4.00(4H,m),4.38(2H,t,J=4Hz),6.55-6.67(3H,m),6.83(1H,d,J=8Hz),6.92(1H,d,J=8Hz),7.02(1H,s),7.25-7.46(6H,m),7.59(2H,d,J=7Hz),7.63(1H,d,J=8Hz),7.77(2H,d,J=8Hz),8.30(1H,d,J=8Hz),8.70(1H,s)
27）４－〔２－（アセチルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－メチル－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.53(2H,br),1.63-1.89(4H,m),2.22(3H,s),2.30(3H,s),2.36(3H,s),2.22-2.50(10H,m),3.32-3.38(3H,m),3.52-3.57(2H,m),3.67(2H,br),3.95(2H,br),6.61(2H,s),6.83-6.93(2H,m),7.02-7.20(2H,m),7.32-7.58(2H,m),7.68(1H,d,J=7Hz),7.85(1H,br)
28）４－〔（２－ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－〔（２－ベンジルオキシ）ベンゾイル〕オキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.44-1.53(2H,m),1.60-1.87(4H,m),2.28(3H,s),2.29(3H,s),2.32-2.38(7H,m),3.33(3H,s),3.43(2H,br),3.60(2H,br),3.90(2H,br),4.79(2H,s),4.93(2H,s),6.11-6.20(3H,m),6.82-7.43(18H,m),7.83-7.88(1H,m),8.12-8.15(1H,m),8.37-8.42(1H,m)
29）４－〔４－（ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.30-1.45(1H,m),1.47-1.58(2H,m),1.60-1.75(4H,m),1.78-1.91(2H,m),2.27(9H,s),2.30-2.40(3H,m),2.50-2.63(1H,m),2.95-3.07(1H,m),3.30(3H,s),3.77(3H,s),3.82-3.98(4H,m),4.56-4.67(1H,m),5.11(2H,s),6.56-6.62(2H,m),6.80-6.93(2H,m),7.00-7.05(3H,m),7.34-7.45(4H,m),7.78-7.82(2H,m),8.22-8.30(1H,m),8.46(1H,s)
30）４－〔４－（ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.48-1.59(2H,m),1.69-1.90(4H,m),2.28(3H,s),2.30(3H,s),2.35-2.42(6H,m),3.31(3H,s),3.48-3.50(2H,m),3.62-3.66(2H,m),3.78(3H,s),3.82-4.00(2H,m),5.13(2H,s),6.57-6.60(2H,m),6.81-6.92(2H,m),7.00.7.02(3H,m),7.30-7.43(5H,m),7.78-7.82(2H,m),8.27 1H,d,J=7Hz),8.43(1H,s)
31）４－〔２－（ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－２－ニトロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.30-1.44(2H,m),1.50-1.94(8H,m),2.20(3H,s),2.27(6H,s),2.30-2.43(3H,m),2.52-2.63(1H,m),2.97-3.10(1H,m),3.32(3H,s),3.85-3.97(4H,m),4.57-4.68(1H,m),5.20(2H,s),6.41-6.48(2H,m),6.52(1H,s),6.90-6.93(1H,m),7.11-7.20(3H,m),7.32(1H,s),7.48-7.59(6H,m),7.69-7.73(1H,m),8.29(1H,d,J=7Hz)
32）２－〔２－（ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕－５－ピリジンカルボキシアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.30-1.44(2H,m),1.44-1.60(2H,m),1.60-1.95(6H,m),2.20および2.28(計9H,s),2.29-2.41(3H,m),2.47-2.64(1H,m),2.93-3.09(1H,m),3.32(3H,s),3.79-3.98(4H,m),4.57-4.69(1H,m),4.97-5.17(1H,m),5.32(1H,s),6.39-6.50(1H,m),6.60-6.78(2H,m),6.85-6.90(1H,m),7.00-7.12(2H,m),7.27-7.50(7H,m),7.56-8.25(2H,m)

実施例３

２－ベンジルオキシ安息香酸（1.55ｇ）と塩化オキサリル（1.18ml）とのジクロロメタン（30ml）中混合物に、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド１滴を加え、混合物を外界温度で１時間攪拌した。溶媒を蒸発させて除去後、残留酸塩化物のジクロロメタン（40ml）溶液を、４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イルカルボニル）ペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（3.28ｇ）とピリジン（1.1ml）とのジクロロメタン（50ml）中混合物に加え、混合物を外界温度で2.5時間攪拌した。混合物を飽和炭酸水素ナトリウム溶液および食塩水で洗い、硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を蒸発させて除去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（SiO_2；85ｇ、２％メタノール含有ジクロロメタン）により精製して、４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イルカルボニル）ペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（4.5ｇ）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.44-1.59(2H,m),1.62-1.90(4H,m),2.27(3H,s),2.28(3H,s),2.30-2.43(6H,m),3.30(3H,s),3.32(3H,s),3.43-3.53(2H,m),3.57-3.67(2H,m),3.78-4.03(2H,m),5.30(2H,s),6.52-6.66(2H,m),6.78-6.96(3H,m),7.04(1H,d,J=9Hz),7.10(1H,dd,J=9,9Hz),7.30-7.49(6H,m),8.20-8.28(1H,m),8.37(1H,d,J=9Hz)

実施例４

４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミド（2.80ｇ）のエタノール（50ml）－１Ｎ水酸化ナトリウム（10ml）混合物溶液を、外界温度で４時間攪拌した。エタノールを蒸発させて除去後、水溶液を１Ｎ塩酸でpH２に調整し、混合物をクロロホルム（30mlx2）で抽出した。有機層を水（40ml）および食塩水（30ml）で洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を蒸発させて、４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－カルボキシルペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミド（1.76ｇ）を無色油状物として得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.45-1.57(2H,m),1.66-1.83(4H,m),2.37(2H,t,J=7.5Hz),3.32(3H,s),3.78-3.96(2H,br),5.17(2H,s),6.75-6.82(2H,m),6.93-7.02(3H,m),7.10-7.22(5H,m),7.36-7.51(6H,m),8.28(1H,d,J=7Hz)

実施例５

実施例４と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－（カルボキシメトキシ）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.63(2H,m),1.73(2H,m),1.85(2H,m),2.28(3H,s),2.35-2.41(6H,m),3.36(3H,s),3.47(2H,m),3.61(2H,m),3.91(2H,m),4.76(2H,s),6.72-6.82(2H,m),6.86-7.01(2H,m),7.07-7.18(2H,m),7.35(2H,d,J=8.5Hz),7.47(1H,t,J=7Hz),7.72(2H,d,J=8.5Hz),8.25(1H,d,J=7Hz)

２）４－（２－アミノベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イルオキシ）－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.45-1.59(2H,m),1.64-1.85(4H,m),2.27(3H,s),2.38(2H,t,J=7Hz),3.32(3H,s),3.73-4.00(2H,m),6.56-6.76(4H,m),6.93(1H,d,J=9Hz),7.18-7.48(6H,m),7.86(1H,br s)

３）４－（２－メトキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イルオキシ）－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.46-1.62(2H,m),1.65-1.88(4H,m),2.26(3H,s),2.39(2H,t,J=7Hz),3.33(3H,s),3.73-4.00(2H,m),4.01(3H,s),6.54-6.68(2H,m),6.91(1H,br d,J=9Hz),6.99(1H,d,J=9Hz),7.10(1H,dd,J=9,9Hz),7.35(2H,br d,J=9Hz),7.41-7.57(3H,m),8.17-8.27(1H,m),9.84(1H,br s)

４）４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.43-1.60(2H,m),1.62-1.88(4H,m),2.38(2H,t,J=7Hz),3.28(3H,s),3.34(3H,s),3.76-4.02(2H,m),5.28(2H,s),6.74-6.85(2H,m),6.86-6.97(2H,m),6.97-7.20(4H,m),7.28-7.50(6H,m),8.16-8.27(1H,m),8.36(1H,d,J=8Hz)

５）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イルオキシ）－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.31-1.96(17H,m),2.00-2.48(6H,m),3.14-3.39(5H,m),3.62-4.07(5H,m),4.10-4.30(2H,m),4.86(1H,m),6.52-6.72(2H,m),6.81-7.16(5H,m),7.37-7.53(2H,m),8.11-8.51(2H,m)

６）４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－２－クロロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.50-1.67(2H,m),1.68-1.98(4H,m),2.42(2H,t,J=7Hz),3.34(3H,s),3.99(2H,t,J=7Hz),5.16(2H,s),6.65-6.80(3H,m),6.98(1H,d,J=8Hz),7.02-7.22(5H,m),7.40-7.61(6H,m),8.24(1H,m)

７）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－－〔４－（５－カルボキシペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.45-1.80(8H,m),2.18-2.27(2H,m),2.32-2.40(2H,m),3.25-3.35(2H,m),3.48(3H,s),3.80(3H,s),3.93(2H,t,J=6Hz),4.19-4.28(2H,m),4.73-4.83(1H,br),6.73-6.80(3H,m),6.93-7.12(6H,m),7.46(1H,t,J=8Hz),8.17-8.27(1H,m)

ESI-MASS(m/z):686(M+Na)

８）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR(DMSO-d_6,δ):1.31-1.80(6H,m),1.95-2.07(4H,m),2.22(3H,s),2.86(2H,t,J=7.5Hz),3.16(3H,s),3.70(1H,m),3.93(1H,m),4.16(2H,t,J=7.5Hz),6.65(1H,d,J=7Hz),6.78(1H,s),7.00-7.10(2H,m),7.20(1H,d,J=7Hz),7.23(2H,d,J=8Hz),7.43-7.62(4H,m)

９）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.36-1.50(2H,m),1.41(9H,s),1.50-1.62(2H,m),1.66-1.84(2H,m),2.05-2.19(2H,m),2.25(3H,s),2.36-2.44(2H,m),3.23-3.41(2H,m),3.31(3H,s),3.77-4.00(2H,m),4.16-4.29(2H,m),4.88(1H,br),6.53-6.67(2H,m),6.98(2H,d,J=8Hz),7.08(1H,m),7.30-7.53(3H,m),8.11(1H,m)

10）４－〔（２－ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（３－カルボキシプロプ－１－イル）オキシ〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR(DMSO-d_6,δ):1.90-2.01(2H,m),2.42(2H,t,J=7.5Hz),3.20(3H,s),3.85-4.02(2H,m),5.20(2H,s),6.85(1H,t,J=7Hz),6.98(1H,d,J=7Hz),7.09(1H,t,J=7Hz),7.15-7.37(6H,m),7.49(2H,d,J=8Hz),7.62(1H,d,J=7Hz)

11）４－（２－ヨードベンゾイル）アミノ－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イル）オキシ〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.45-1.58(2H,m),2.65-2.75(2H,m),2.75-2.84(2H,m),2.35(2H,t,J=7.5Hz),3.32(3H,s),3.82-3.98(2H,m),6.77-6.86(2H,m),7.04(1H,d,J=7Hz),7.09-7.21(2H,m),7.28-7.48(5H,m),7.82-7.90(2H,m)

12）４－（２－ジメチルアミノ－４－メチル）フェノキシメチル－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イル）オキシ〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.38-1.52(2H,m),1.59-1.69(2H,m),1.72-1.85(2H,m),2.23(3H,s),2.25(3H,s),2.30(2H,t,J=7.5Hz),2.75(6H,s),3.33(3H,s),3.11-3.25(2H,m),3.88-4.00(2H,m),5.02(2H,s),6.56-6.67(3H,m),6.71(1H,d,J=7Hz),6.90-6.99(2H,m),7.24(2H,d,J=8Hz),7.38(2H,d,J=8Hz)

13）３－メトキシ－４－〔２－〔１－（第三級ブトキシカルボニル）ピペリジン－４－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.40-1.57(2H,m),1.45(9H,s),1.60-1.94(6H,m),2.01-2.22(2H,m),2.29(3H,s),2.38(2H,t,J=7.5Hz),2.97-3.20(2H,m),3.33(3H,s),3.41(2H,t,J=7.5Hz),3.71(3H,s),3.78-4.00(2H,m),4.67(1H,m),6.60-6.65(2H,m),6.87-7.12(5H,m),7.44(1H,t,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)
14）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノ－１－メチルプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.42(3H,d,J=7.5Hz),1.43-1.96(8H,m),2.25(3H,s),2.33-2.42(2H,m),3.11-3.33(2H,m),3.33(3H,s),3.65-3.97(5H,m),4.70(1H,m),6.53-6.70(2H,m),6.79-7.13(4H,m),7.44(1H,t,J=7Hz),8.23(1H,m),8.39(1H,m)
15）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（３－カルボキシピリド－６－イル）メトキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),2.05-2.16(2H,m),2.27(3H,s),3.28(2H,br),3.42(3H,br),3.58(3H,br),3.86-4.00(2H,m),4.10-4.25(2H,m),4.95(1H,br),5.16(1H,br),6.62(3H,br),6.86-7.18(4H,m),7.41(3H,br),8.14(1H,br),8.33(1H,br),9.17(1H,br)
16）４－〔２－（Ｅ）－（２－カルボキシエテン－１－イル）ベンゾイルアミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.50-2.00(6H,m),2.27-2.52(10H,m),2.60-2.81(2H,m),3.31(3H,s),3.43-3.66(2H,m),3.83-4.22(7H,m),5.60(1H,m),6.57(1H,m),6.65-6.76(4H,m),7.01-7.12(2H,m),7.21(1H,d,J=7Hz),7.42-7.60(3H,m),7.85(1H,m)
17）４－〔２－（３－カルボキシプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.44-1.57(2H,m),1.64-1.75(2H,m),1.75-1.87(2H,m),2.20(3H,s),2.34(3H,s),2.35-2.50(6H,m),2.61-2.74(2H,m),3.30(3H,s),3.33-3.46(2H,m),3.49-3.69(4H,m),3.75(3H,s),3.90-4.02(2H,m),4.17-4.27(2H,m),6.56-6.72(2H,m),6.83-6.92(2H,m),6.93-7.00(2H,m),7.07(1H,t,J=7Hz),7.43(1H,t,J=7Hz),7.43(1H,t,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)
18）４－〔２－（カルボキシメトキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.51-1.92(6H,m),2.02(3H,s),2.30(3H,s),2.32(2H,t,J=5Hz),2.43-2.68(4H,m),3.33(3H,s),3.40-3.55(4H,m),3.72(3H,s),3.75-4.07(2H,m),4.73(2H,s),6.57-6.68(2H,m),6.81-7.10(6H,m),7.35-7.45(1H,m),8.18(1H,d,J=7Hz),8.32(1H,d,J=8Hz)

実施例６

４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシ〕ベンゾイルアミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（470mg）とヒドラジン水和物（158mg）とのエタノール（５ml）中混合物を、外界温度で６時間攪拌し、セライト層を通して▲濾▼過した。▲濾▼液を蒸発させて濃縮し、残留物をシリカゲルカラムに付した。クロロホルム－メタノール－アンモニア水（10：１：0.1）によりカラムから溶出させた。目的画分から溶媒を蒸発させて、４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（２５６ｍｇ）を無色の無定形物として得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.56(2H,m),1.74(2H,m),1.87(2H,m),2.09(2H,m),2.29(3H,s),2.34-2.43(6H,m),2.97(2H,t,J=7.5Hz),3.33(3H,s),3.50(2H,m),3.65(2H,m),3.96(2H,m),4.30(2H,t,J=7.5Hz),6.73-6.83(2H,m),6.95-7.03(2H,m),7.77-7.16(2H,m),7.34(2H,d,J=8.5Hz),7.42-7.50(3H,m),8.22(1H,d,J=7Hz)

実施例７

実施例６と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイルアミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルアミノプロプ－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.00(2H,m),2.10(2H,m),2.27(3H,s),2.34-2.39(4H,m),2.98(2H,t,J=7.5Hz),3.35(3H,s),3.35-3.61(6H,m),3.98(2H,m),4.30(2H,t,J=7.5Hz),6.80-6.91(2H,m),7.02(2H,d,J=7Hz),7.07-7.21(3H,m),7.33-7.51(5H,m),8.22(1H,d,J=7Hz)

２）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.53(2H,m),1.70(2H,m),1.84(2H,m),2.07(2H,m),2.26(3H,s),2.28(3H,s),2.31-2.40(6H,m),2.90(2H,t,J=7.5Hz),3.32(3H,s),3.49(2H,m),3.60(2H,m),3.89(3H,s),3.82-3.99(2H,m),4.28(2H,t,J=7.5Hz),6.54-6.64(2H,m),6.82-6.94(2H,m),7.00-7.11(3H,m),7.45(1H,m),8.20(1H,m),8.39(1H,m)

３）（Ｒ）－４－〔２－〔（４－アミノブト－２－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.42および1.45(計3H,s),1.50-1.89(8H,m),2.02-2.12(1H,m),2.29(3H,s),2.31(3H,s),2.33-2.42(6H,m),2.84-2.90(2H,m),3.33(3H,s),3.46-3.52(2H,m),3.60-3.67(2H,m),3.80(3H,s),3.87-4.00(2H,m),4.78-4.87(1H,m),6.58(1H,d,J=7Hz),6.65(1H,s),6.82-6.92(2H,m),7.03-7.10(3H,m),7.45(1H,t,J=8Hz),8.21(1H,dd,J=1,8Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)

ESI-MASS(m/z):674(M+H)

４）（Ｒ）－４－〔２－〔（４－アミノブト－２－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.43および1.45(計3H,s),1.46-1.91(12H,m),2.02-2.12(1H,m),2.29(9H,s),2.30-2.41(4H,m),2.52-2.63(1H,m),2.87(2H,t,J=8Hz),2.97-3.07(1H,m),3.35(3H,s),3.80(3H,s),3.87-3.98(4H,m),4.59-4.68(1H,m),4.79-4.88(1H,m),6.59(1H,d,J=8Hz),6.64(1H,s),6.83-6.93(2H,m),7.05-7.10(3H,m),7.45(1H,t,J=8Hz),8.23(1H,d,J=9Hz),8.42(1H,d,J=8Hz)

ESI-MASS(m/z):702(M+H)

５）（Ｓ）－４－〔２－〔（４－アミノブト－２－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.43および1.45(計3H,s),1.46-1.92(12H,m),2.02-2.13(1H,m),2.28(9H,s),2.30-2.40(4H,m),2.52-2.63(1H,m),2.86(2H,t,J=8Hz),2.97-3.07(1H,m),3.35(3H,s),3.81(3H,s),3.87-3.98(4H,m),4.60-4.68(1H,m),4.79-4.89(1H,m),6.59(1H,d,J=8Hz),6.54(1H,s),6.83-6.93(2H,m),7.05-7.10(3H,m),7.46(1H,t,J=8Hz),8.23(1H,d,J=9Hz),8.43(1H,d,J=8Hz)

ESI-MASS(m/z):702(M+H)

６）４－〔２－（４－アミノブト－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.74(8H,m),1.77-1.88(2H,m),1.95-2.06(2H,m),2.27(3H,s),2.31-2.

40(4H,m),2.78(2H,t,J=7.5Hz),3.32(3H,s),3.45-3.50(2H,m),3.58-3.65(2H,m),3.84-3.98(2H,m),4.20(2H,t,J=7.5Hz),6.72-6.80(2H,m),6.93-7.00(2H,m),7.04-7.14(2H,m),7.30(2H,d,J=8Hz),7.40-7.48(3H,m),8.19(1H,d,J=7Hz)

７）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.24(3H,t,J=7.5Hz),1.44-1.56(2H,m),1.63-1.87(6H,m),2.06-2.16(2H,m),2.28(3H,s),2.33(2H,t,J=7.5Hz),2.97(2H,t,J=7.5Hz),3.30(3H,s),3.82-3.96(2H,m),4.11(2H,q,J=7.5Hz),4.30(2H,t,J=7.5Hz),6.54-6.60(2H,m),6.83(1H,d,J=7Hz),7.00(1H,d,J=7Hz),7.09(1H,t,J=7Hz),7.30(2H,d,J=8Hz),7.41-7.48(3H,m),8.20(1H,d,J=7Hz)

８）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルプロプ－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.03-2.17(2H,m),2.29(3H,s),2.33-2.42(2H,m),2.53(2H,t,J=7.5Hz),2.96(2H,t,J=7.5Hz),3.38(3H,s),3.46-3.53(2H,m),3.59-3.68(2H,m),3.92-4.08(2H,m),4.28(2H,t,J=7.5Hz),6.77-6.83(2H,m),6.98-7.18(4H,m),7.31(2H,d,J=8Hz),7.43-7.50(3H,m),8.20(1H,d,J=7Hz)

９）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.02-2.14(2H,m),2.37(3H,s),2.30(3H,s),2.32-2.51(4H,m),2.94(2H,t,J=7.5Hz),3.35(3H,s),3.41-3.57(2H,m),3.67-3.86(2H,m),4.30(2H,t,J=7.5Hz),4.96(1H,d,J=14Hz),5.08(1H,d,J=14Hz),6.63-6.71(2H,m),6.95-7.02(2H,m),7.11(1H,t,J=7Hz),7.31(2H,d,J=8Hz),7.36-7.50(7H,m),8.22(1H,d,J=7Hz)

10）４－〔２－（４－アミノ－１－ブチン－１－イル）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.42-1.90(10H,m),2.28(3H,s),2.32-2.41(6H,m),3.37(3H,s),3.46-3.51(2H,m),3.59-3.67(2H,m),3.82-4.02(2H,m),6.73-6.82(2H,m),7.00(1H,d,J=7Hz),7.08-7.20(2H,m),7.35-7.64(5H,m),7.81-7.88(2H,m)

11）４－〔２－（４－アミノブト－１－イル）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニルベンズアミド

MASS(m/z):614(M+1)

12）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.01-2.11(2H,m),2.28(3H,s),2.31(3H,s),2.33-2.51(4H,m),2.90(2H,t,J=7.5Hz),3.39(3H,s),3.40-3.52(2H,m),3.61-3.86(2H,m),3.67(3H,s),4.79(2H,t,J=7.5Hz),4.90(1H,d,J=14Hz),5.08(1H,d,J=14Hz),6.61-6.70(2H,m),7.86(1H,d,J=7Hz),6.94-7.10(4H,m)7.31-7.46(5H,m),8.20(1H,d,J=7Hz),8.37(1H,d,J=7Hz)

13）３－メトキシ－４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕フェニルメチル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキン〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.45-1.54(2H,m),1.62-1.71(2H,m),1.76-1.85(2H,m),1.87-2.00(2H,m),2.27(3H,s),2.30(3H,s),2.31-2.40(4H,m),2.90(2H,t,J=7.5Hz),3.28(3H,s),3.45-3.50(2H,m),3.57-3.64(2H,m),3.61(3H,s),3.80-3.97(2H,m),4.07(2H,t,J=7.5Hz),4.27(2H,s),4.70(1H,br),6.37(1H,d,J=7Hz),6.59(1H,d,J=7Hz),6.62(1H,s),6.78(1H,s),6.82-6.90(4H,m),7.16-7.71(2H,m)

14）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキ

シ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルエト－１－イル〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.00-2.11(2H,m),2.29(3H,s),2.32-2.50(4H,m),2.61-2.93(6H,m),3.32(3H,s),3.35-3.89(2H,m),3.59-3.81(2H,m),3.71(3H,s),4.22-4.32(2H,m),6.83(1H,d,J=7Hz),6.94-7.33(11H,m),7.43(1H,t,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz),8.39(1H,d,J=7Hz)
15）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）チオベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
MASS(m/z):676(M+1)
16）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）スルホニルベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
MASS(m/z):724(M+1)
17）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
MASS(m/z):708(M+1)
18）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルメトキシプロプ－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.00-2.14(4H,m),2.23(3H,s),2.29-2.38(4H,m),2.88(2H,t,J=7.5Hz),3.35(3H,s),3.37-3.45(2H,m),3.54-3.61(2H,m),3.66-3.76(2H,m),3.77(3H,s),3.94-4.17(4H,m),4.30(2H,t,J=7.5Hz),6.75-7.18(8H,m),7.45(1H,t,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz),8.42(1H,d,J=7Hz)
19）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔（Ｅ）－５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニル－４－ペンテン－１－イル〕オキシ－４－メチル〕フェニル－メチルベンズアミド
MASS(m/z):686(M+1)
20）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（４－アミノブト－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.41(9H,s),1.50-1.67(2H,m),1.77-1.89(2H,m),2.06-2.21(2H,m),2.27(3H,s),2.80(2H,t,J=7.5Hz),3.23-3.36(2H,m),3.36(3H,s),3.80(3H,s),3.84-4.03(2H,m),4.26(2H,t,J=7.5Hz),6.57-6.68(2H,m),6.83-7.15(5H,m),7.45(1H,t,J=7Hz),8.21(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)
21）４－〔２－（３－アミノ－１－メチルプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－（２－ベンジルオキシ－４－メチル）フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.41(3H,d,J=7.5Hz),1.70-1.83(1H,m),1.96-2.10(1H,m),2.26(3H,s),2.80-2.89(2H,m),3.37(3H,s),3.62(3H,s),4.82(1H,m),4.89(1H,d,J=14Hz),5.07(1H,d,J=14Hz),6.63-6.72(2H,m),7.86(1H,d,J=7Hz),6.98(1H,d,J=7Hz),7.02-78.11(3H,m),7.28-7.49(6H,m),8.22(1H,d,J=7Hz),8.37(1H,d,J=7Hz)
22）４－〔２－（４－アミノブト－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.46-2.03(10H,m),2.24(3H,s),2.28(3H,s),2.31-2.40(6H,m),2.73(2H,t,J=7.5Hz),3.31(3H,s),3.44-3.50(2H,m),3.59-3.65(2H,m),3.77(3H,s),3.83-4.00(2H,m),4.20(2H,t,J=7.5Hz),6.58(1H,d,J=7Hz),7.61(1H,s),6.85(1H,d,J=7Hz),6.90(1H,d,J=7Hz),6.87-7.10(3H,m),7.45(1H,t,J=7Hz),8.21(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)
23）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ－３－メチルベンゾイル〕アミノ

－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.49-1.91(6H,m),1.96-2.07(2H,m),2.27(3H,s),2.30(3H,s),2.35(3H,s),2.32-2.40(6H,m),2.95(2H,t,J=5Hz),3.32(3H,s),3.46-3.53(2H,m),3.60-3.67(2H,m),3.81(3H,s),3.85-4.02(4H,m),6.56-6.66(2H,m),6.82-7.18(4H,m),7.33(1H,d,J=8Hz),7.80(1H,d,J=7Hz),8.36(1H,d,J=7Hz)

24）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ－４－メチルベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イルカルボニル）ペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.46-1.90(6H,m),2.13-2.25(2H,m),2.26(3H,s),2.28(3H,s),2.30-2.58(6H,m),2.37(3H,s),2.99(2H,t,J=5Hz),3.30(3H,s),3.49(3H,s),3.49(2H,t,J=5Hz),3.61(2H,t,J=5Hz),3.79(3H,s),3.83-3.92(2H,m),4.28(2H,t,J=5Hz),6.56-6.65(2H,m),6.80-6.93(4H,m),7.00(1H,s),8.02(1H,d,J=8Hz),8.39(1H,d,J=8Hz)

25）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ－５－メチルベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.49-1.90(6H,m),1.98-2.20(4H,m),2.28(3H,s),2.29(3H,s),2.31(3H,s),2.31-2.42(4H,m),2.95(2H,t,J=5Hz),3.31(3H,s),3.50(2H,t,J=4Hz),3.62(2H,t,J=4Hz),3.79(3H,s),3.80-4.00(2H,m),4.25(2H,t,J=5Hz),6.57-6.68(2H,m),6.82-7.04(4H,m),7.24(1H,d,J=8Hz),7.95(1H,s),8.39(1H,d,J=8Hz)

26）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ－４－クロロベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.48-1.60(2H,m),1.62-1.90(2H,m),2.10(2H,t,J=6Hz),2.27(3H,s),2.29(3H,s),2.30-2.41(4H,m),2.93(2H,t,J=5Hz),3.31(3H,s),3.45-3.53(2H,m),3.58-3.66(2H,m),3.78(3H,s),3.82-4.01(2H,m),4.29(2H,t,J=5Hz),6.55-6.68(2H,m),6.80-6.91(2H,m),6.99-7.10(4H,m),8.13(1H,d,J=8Hz),8.36(1H,d,J=8Hz)

27）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ－４－メトキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.89(6H,m),2.04-2.15(2H,m),2.28(3H,s),2.30(3H,s),2.31-2.42(6H,m),2.93(2H,t,J=5Hz),3.31(3H,s),3.44-3.52(2H,m),3.57-3.65(2H,m),3.79(3H,s),3.83(3H,s),3.83-4.00(2H,m),4.26(2H,t,J=5Hz),7.50-7.68(4H,m),6.82-6.95(2H,m),7.03(3H,s),8.16(1H,d,J=8Hz),8.38(1H,d,J=8Hz)

実施例８

４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミド（1.76ｇ）、Ｎ－エチル－Ｎ’－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（714mg）、Ｎ－メチルピペラジン（311mg）および１－ヒドロキシベンゾトリアゾール（504mg）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（20ml）中混合物を、外界温度で２時間攪拌し、混合物を酢酸エチル（40ml）で希釈した。溶液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（40ml）、水（40ml）および食塩水（40ml）で順次洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を蒸発させて除去し、４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（1.98ｇ）を無色の油状物として得た。
NMR($CDCl_3$,δ):1.46-1.58(2H,m),1.64-1.88(4H,m),2.30(3H,s),2.32-2.41(6H,m),3.32(3H,s),3.49(2H,m),3.62(2H,m),3.81-4.00(2H,br),5.20(2H,s),6.73-6.82(2H,m),6.94-7.00(3H,m),7.08-7.20(5H,m),7.40-7.53(6H,m),8.28(1H,d,J=7Hz)

実施例９

出発化合物として４－〔２－（カルボキシメトキシ）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－

Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミドを用い、実施例８と同様にして、次の化合物を得た。
４－〔２－〔（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルメトキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
MASS:699(M+1)

実施例10

４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（1.90ｇ）のメタノール（30ml）溶液を、水酸化パラジウム（400mg）の存在下、大気圧下で６時間水素化処理し、▲濾▼過して触媒を除去した。▲濾▼液から溶媒を蒸発させて、４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（1.60ｇ）を無色の無定形物として得た。
NMR($CDCl_3$,δ):1.51(2H,m),1.66(2H,m),1.79(2H,m),2.30(2H,m),2.63(3H,s),2.82-2.95(4H,m),3.33(3H,s),3.72(2H,m),3.86(2H,m),3.99(2H,m),6.78-6.93(3H,m),7.05(2H,m),7.17(1H,t,J=7Hz),7.27(2H,d,J=8.5Hz),7.40(1H,t,J=7Hz),7.53(2H,d,J=8.5Hz),7.91(1H,m),9.21(1H,br)

実施例11

実施例10と同様にして、次の化合物を得た。
１）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルアミノプロプ－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.00(2H,m),2.71(3H,s),2.90-3.09(4H,m),3.33(3H,s),3.50-3.80(6H,m),3.97(2H,m),6.76-7.03(5H,m),7.11-7.22(2H,m),7.29-7.44(3H,m),7.45-7.54(2H,m),7.88(1H,m)
２）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イルカルボニル）ペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.46-1.62(2H,m),1.65-1.90(4H,m),2.29(3H,s),2.30-2.43(2H,m),2.82(3H,s),2.88-3.30(4H,m),3.31(3H,s),3.48(3H,s),3.79(3H,s),3.77-4.07(6H,m),6.58-6.69(2H,m),6.84-7.08(5H,m),7.43(1H,dd,J=9,9Hz),7.52(1H,d,J=9Hz),8.20(1H,d,J=9Hz),8.82(1H,br s)
３）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.63(2H,m),1.64-1.90(4H,m),2.38(2H,t,J=7Hz),2.78(3H,s),2.90-3.31(4H,m),3.33(3H,s),3.77(3H,s),3.80-4.07(6H,m),6.77-7.11(7H,m),7.12-7.23(1H,m),7.37-7.58(2H,m),8.21(1H,d,J=9Hz),8.79(1H,s)
４）２－クロロ－４－〔２－（ヒドロキシ）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.38-1.98(6H,m),2.21-2.46(2H,m),2.73(3H,br s),2.92-3.25(4H,m),3.36(3H,s),3.70-4.20(6H,m),6.67-6.82(2H,m),6.82-7.08(4H,m),7.08-7.20(2H,m),7.21-7.50(2H,m),7.70(1H,br s),7.92(1H,br d,J=8Hz),9.48(1H,s)
５）４－（３－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.34-1.58(4H,m),1.64-1.97(6H,m),2.28(3H,s),2.32(6H,s),2.33-2.38(3H,m),2.51-2.61(1H,m),2.97-3.06(1H,m),3.34(3H,s),3.78-3.81(3H,br s),3.85-3.97(3H,m

),4.60-4.69(1H,m),6.58-6.65(2H,m),6.84-7.06(4H,m),7.38-7.60(3H,m),8.17-8.23(1H,m)
ESI-MASS(m/z):631(M+H)
６）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.23(3H,t,J=7.5Hz),1.41-1.53(2H,m),1.62-1.84(4H,m),2.27(3H,s),2.32(2H,t,J=7.5Hz),3.31(3H,s),3.78-3.97(2H,m),4.13(2H,q,J=7.5Hz),6.56-6.61(2H,m),6.84-6.91(2H,m),7.02(1H,d,J=7Hz),7.28-7.45(4H,m),7.62(1H,d,J=7Hz),8.47(1H,s)
７）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルプロプ－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.00(2H,m),2.71(3H,s),2.90-3.09(4H,m),3.33(3H,s),3.50-3.80(6H,m),3.97(2H,m),6.76-7.03(5H,m),7.11-7.22(2H,m),7.29-7.44(3H,m),7.45-7.54(2H,m),7.88(1H,m)
８）４－（２－ヒドロキシ）ベンゾイルアミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルエト－１－イル〕フェニルベンズアミド
MASS(m/z):607(M+1)
９）４－（２－ヒドロキシ－３－メチルベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.50-1.90(6H,m),2.27(6H,s),2.28(3H,s),2.33-2.40(4H,m),2.70-2.78(2H,m),3.30(3H,s),3.80(3H,s),3.85-4.10(6H,m),6.59-6.65(2H,m),6.77-6.97(6H,m),8.19(1H,d,J=8Hz),8.70(1H,br s)
10）４－（２－ヒドロキシ－４－メチルベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.49-1.91(6H,m),2.24(3H,s),2.29(3H,s),2.32(3H,s),2.30-2.42(6H,m),3.32(3H,s),3.49(2H,t,J=5Hz),3.63(2H,t,J=5Hz),3.80(3H,s),3.88-4.01(2H,m),6.68-6.65(2H,m),6.80(1H,s),6.84(1H,d,J=8Hz),6.93(1H,d,J=7Hz),7.03(1H,s),7.37(1H,d,J=7Hz),8.19(1H,d,J=8Hz),8.71(1H,br)
11）４－（２－ヒドロキシ－５－メチルベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.50-1.91(10H,m),2.28(3H,s),2.34(3H,s),2.35(3H,s),2.30-2.41(6H,m),2.80(2H,br),3.31(3H,s),3.80(3H,s),3.81-4.09(4H,m),6.60-6.68(2H,m),6.84-7.02(4H,m),7.20-7.30(2H,m),8.20(1H,br),8.37(1H,br)
12）４－（２－ヒドロキシ－４－クロロベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.46-1.89(6H,m),2.23-2.45(6H,m),2.27(3H,s),2.32(3H,s),3.30(3H,s),3.44-3.68(4H,m),3.80(3H,s),3.80-3.99(2H,m),6.56-6.65(2H,m),6.72-7.03(5H,m),7.41(1H,d,J=8Hz),8.12(1H,d,J=8Hz),8.74(1H,br)
13）４－（２－ヒドロキシ－４－メトキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イルカルボニル）ペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.48-1.60(2H,m),1.63-1.84(4H,m),2.28(3H,s),2.37(2H,t,J=5Hz),2.25-2.40(6H,m),2.79(3H,s),3.30(3H,s),3.79(3H,s),3.82(3H,s),3.90-4.01(2H,m),6.44-6.50(2H,m),6.60-6.66(2H,m),6.88-6.97(3H,m),7.41(1H,d,J=8Hz),8.18(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,br)

14）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.22-1.45(2H,m),1.45-1.58(2H,m),1.62-1.78(2H,m),1.80-1.96(4H,m),2.30(6H,s),2.30-2.40(3H,m),2.50-2.62(1H,m),2.97-2.37(1H,m),3.37(3H,s),3.78(3H,s),3.82-4.02(4H,m),4.57-4.68(1H,m),6.77-7.02(8H,m),7.10-7.20(1H,m),7.37-7.45(1H,m),7.46-7.62(1H,m),8.20(1H,br)
15）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－クロロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.30-2.08(10H,m),2.20-2.60(13H,m),2.89-3.05(1H,m),3.30(3H,s),3.82-4.02(4H,m),4.62-4.79(1H,m),6.62(2H,s),6.73-7.02(4H,m),7.28-7.57(3H,m),7.99(1H,d,J=7Hz),8.42(1H,d,J=7Hz)
16）３－エトキシ－４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.40(3H,t,J=6Hz),1.47-1.57(2H,m),1.65-1.72(2H,m),1.78-1.88(2H,m),2.27(3H,s),2.30(3H,s),2.31-2.42(7H,m),3.30(3H,s),3.48-3.50(2H,m),3.52-3.65(2H,m),3.82-4.02(4H,m),6.58-6.61(2H,m),6.82-6.94(3H,m),6.98-7.02(2H,m),7.40-7.47(2H,m),8.20(1H,d,J=7Hz),8.83(1H,s)
17）３－ヒドロキシ－４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.62(2H,br),1.75(2H,br),1.85(2H,br),2.27(3H,s),2.30(3H,s),2.42(7H,br),3.30(3H,s),3.53(2H,br),3.68(3H,br),3.90(1H,br),6.52(1H,s),6.63-6.73(2H,m),6.87(1H,t,J=7Hz),6.97(1H,d,J=7Hz),7.08(1H,d,J=7Hz),7.15(1H,s),7.38(1H,t,J=7Hz),7.58(1H,d,J=7Hz),7.98(1H,br),9.02(1H,br)
18）２－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕－５－ピリジンカルボキシアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.32-2.15(10H,m),2.29-2.42(12H,m),2.47-2.62(1H,m),2.95-3.09(1H,m),3.32(3H,s),3.75-4.10(4H,m),4.58-4.77(2H,m),6.33-8.47(15H,m)
19）４－（４－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.38-1.55(4H,m),1.62-1.72(2H,m),1.72-1.83(2H,m),1.83-1.97(2H,m),2.27(3H,s),2.32-2.37(8H,m),2.43-2.60(2H,m),2.93-3.05(1H,m),3.31(3H,s),3.70(3H,s),3.78-3.95(4H,m),4.60-4.70(1H,m),6.57-6.60(2H,m),6.80-6.97(5H,m),7.67(2H,d,J=7Hz),8.22(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,s)
20）４－（４－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.58(2H,m),1.67-1.75(2H,m),1.75-1.87(2H,m),2.27(3H,s),2.32(3H,s),2.38-2.48(7H,m),3.35(3H,s),3.48-3.53(2H,m),3.60-3.70(2H,m),3.70(3H,s),3.80-3.90(1H,m),3.90-4.00(1H,m),3.58-3.60(2H,m),6.82-6.97(5H,m),7.68(2H,d,J=7Hz),8.24(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,s)

実施例12

４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（400mg）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（15ml）溶液に、炭酸カリウム（99mg）および

Ｎ－（３－ブロモプロピル）フタルイミド（192mg）を加え、混合物を60℃で４時間攪拌した。混合物を水（30ml）中に注ぎ、水性溶液を酢酸エチル（20mlx2）で抽出した。有機層を水（20ml）および食塩水（20ml）で洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を蒸発させて、４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシ〕ベンゾイルアミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（484mg）を無色の無定形物として得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.56(2H,m),1.63-1.76(4H,m),1.86(2H,m),2.30(3H,s),2.32-2.41(6H,m),3.35(3H,s),3.50(2H,m),3.63(2H,m),3.83-3.97(4H,m),4.20(2H,t,J=7.5Hz),6.73-6.81(2H,m),6.92(1H,d,J=7Hz),7.00-7.14(3H,m),7.32(2H,d,J=8.5Hz),7.42(1H,m),7.50(2H,d,J=8.5Hz),7.65-7.74(4H,m),8.08(1H,d,J=7Hz),9.69(1H,s)

実施例13

実施例12と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－（エトキシカルボニルメトキシ）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.31(3H,t,J=7.5Hz),1.62(2H,m),1.71(2H,m),1.83(2H,m),2.29(3H,s),2.33-2.41(6H,m),3.35(3H,s),3.49(2H,m),3.62(2H,m),3.93(2H,m),4.33(2H,q,J=7.5Hz),4.76(2H,s),6.72-6.82(2H,m),6.87(1H,d,J=7Hz),7.00(1H,d,J=7Hz),7.07-7.18(2H,m),7.33(2H,d,J=8.5Hz),7.46(1H,t,J=7Hz),7.71(2H,d,J=8.5Hz),8.26(1H,d,J=7Hz)

２）４－〔２－（３－ピペリジノプロプ－１－イルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.45(2H,m),1.50-1.60(4H,m),1.71(2H,m),1.85(2H,m),2.14(2H,m),2.28(3H,s),2.30-2.41(10H,m),2.49(2H,t,J=7.5Hz),3.34(3H,s),3.49(2H,m),3.63(2H,m),3.94(2H,m),4.23(2H,t,J=7.5Hz),6.73-6.82(2H,m),6.96-7.02(2H,m),7.04-7.15(2H,m),7.32(2H,d,J=8.5Hz),7.43-7.50(3H,m),8.22(1H,d,J=7Hz)

３）４－〔２－〔２－（ジメチルアミノ）エト－１－イルオキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.56(2H,m),1.70(2H,m),1.85(2H,m),2.23(6H,s),2.30(3H,s),2.33-2.41(6H,m),2.78(2H,t,J=7.5Hz),3.35(3H,s),3.50(2H,m),3.64(2H,m),3.93(2H,m),4.22(2H,t,J=7.5Hz),6.74-6.81(2H,m),6.95-7.01(2H,m),7.06-7.15(2H,m),7.30(2H,d,J=8.5Hz),7.43(1H,m),7.56(2H,d,J=8.5Hz),8.21(1H,d,J=7Hz)

４）４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシ〕ベンゾイルアミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルアミノプロプ－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.01(2H,m),2.25(3H,s),2.25-2.38(6H,m),3.33-3.45(6H,m),3.35(3H,s),3.87-4.00(4H,m),4.21(2H,t,J=7.5Hz),6.78-7.00(3H,m),7.06-7.20(3H,m),7.33-7.56(4H,m),7.65-7.75(4H,m),7.86(1H,m),8.10(1H,d,J=7Hz),9.73(1H,br)

５）４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシ〕ベンゾイルアミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イルカルボニル）ペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.46-1.62(2H,m),1.63-1.93(4H,m),2.10-2.46(14H,m),3.33(3H,s),3.40-3.53(2H,m),3.57-3.68(2H,m),3.78(3H,s),3.79-4.04(4H,m),4.26(2H,t,J=7Hz),6.54-6.68(2H,m),6.74-7.11(5H,m),7.37-7.48(1H,m),7.52-7.63(3H,m),7.66-7.77(1H,m),7.80-7.90(1H,m),8.06-8.23(2H,m)

６）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.63(2H,m),1.63-1.93(6H,m),2.29(3H,s),2.29-2.44(6H,m),3.36(3H

,s),3.44-3.53(2H,m),3.58-3.68(2H,m),3.76(3H,s),3.81-4.05(4H,m),4.27(2H,t,J=7Hz),6.74-6.91(3H,m),6.92-7.20(5H,m),7.38-7.48(1H,m),7.58(3H,s),7.68-7.77(1H,m),7.82-7.90(1H,m),8.09-8.16(1H,m),8.20(1H,d,J=9Hz)

７）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.32-2.00(12H,m),2.16-2.48(12H,m),2.57(1H,m),3.02(1H,m),3.33(3H,s),3.78(3H,s),3.80-4.05(5H,m),4.27(2H,t,J=7Hz),4.64(1H,m),6.56-6.70(2H,m),6.78-7.12(5H,m),7.43(1H,m),7.59(2H,s),7.66-7.91(2H,m),8.05-8.24(2H,m)

８）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.26(3H,t,J=7Hz),1.34-1.92(17H,m),2.23-2.40(5H,m),3.20-3.40(5H,m),3.78(3H,s),3.82-4.01(2H,m),4.12(2H,q,J=7Hz),4.25(2H,t,J=7Hz),4.78(1H,m),6.52-6.69(2H,m),6.79-7.15(5H,m),7.40-7.52(2H,m),8.21(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz)

９）２－クロロ－４－［２－［３－（フタルイミド）プロプ－１－イル］オキシベンゾイル］アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.51-1.67(2H,m),1.68-1.82(2H,m),1.82-2.01(2H,m),2.22-2.48(11H,m),3.38(3H,s),3.47-3.56(2H,m),3.58-3.69(2H,m),3.90(2H,t,J=7Hz),3.94-4.11(2H,m),4.21(2H,t,J=7Hz),6.69-6.82(2H,m),6.93(1H,d,J=8Hz),7.02-7.20(4H,m),7.30(1H,m),7.43(1H,m),7.68(4H,s),8.07(1H,m),9.62(1H,s)

10）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチルフェニル）ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.41(9H,s),2.02-2.18(2H,m),2.21(3H,s),3.21-3.34(2H,m),3.39(3H,s),3.75(3H,s),4.24(2H,t,J=7Hz),4.74(1H,m),6.83-7.22(9H,m),7.44(1H,m),8.20(1H,m),8.42(1H,d,J=8Hz)

11）４－〔３－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.32-1.45(2H,m),1.43(9H,s),1.49-1.58(2H,m),1.64-1.90(6H,m),1.97-2.03(2H,m),2.29(3H,s),2.30(6H,s),2.33-2.39(3H,m),2.51-2.61(1H,m),2.97-3.07(1H,m),3.28-3.38(2H,m),3.33(3H,s),3.79(3H,s),3.86-3.97(3H,m),4.08(2H,t,J=7Hz),4.59-4.67(1H,m),4.70-4.78(1H,m),6.57-6.64(2H,m),6.84(1H,d,J=8Hz),6.93(1H,d,J=8Hz),7.02(1H,s),7.03-7.07(1H,m),7.33-7.40(3H,m),8.27(1H,d,J=8Hz),8.49(1H,s)

ESI-MASS(m/z):788(M+1)

12）４－〔２－〔４－（フタルイミド）ブト－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.48-1.60(2H,m),1.65-1.77(4H,m),1.80-2.06(6H,m),2.29(3H,s),2.33-2.41(6H,m),3.38(3H,s),3.45-3.51(2H,m),3.60-3.67(2H,m),3.78(2H,t,J=7.5Hz),3.88-4.00(2H,m),4.23(2H,d,J=7.5Hz),6.73-6.42(2H,m),6.99(2H,d,J=8Hz),7.08-7.17(2H,m),7.36(2H,d,J=8Hz),7.44-7.50(3H,m),7.68-7.77(2H,m),7.81-7.91(2H,m),8.22(1H,d,J=7Hz)

13）４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.24(3H,t,J=7.5Hz),1.45-1.57(2H,m),1.64-1.88(4H,m),2.25(3H,s),2.28-2.37(4H,m),3.31(3H,s),3.84-3.95(4H,m),4.10(2H,q,J=7.5Hz),4.20(2H,t,J=7.5Hz),6.5

2-6.62(2H,m),6.88(1H,d,J=7Hz),6.92(1H,d,J=7Hz),7.07(1H,t,J=7Hz),7.31(2H,d,J=8Hz),7.39-7.50(3H,m),7.62-7.64(4H,m),8.10(1H,d,J=7Hz),9.68(1H,s)

14）４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルプロプ－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

MASS(m/z):718(M+1)

15）４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.25(3H,s),2.25-2.31(2H,m),2.31(3H,s),2.36-2.51(4H,m),3.38(3H,s),3.63-3.85(4H,m),3.91(2H,t,J=7.5Hz),4.20(2H,t,J=7.5Hz),4.98(1H,d,J=14Hz),5.08(1H,d,J=14Hz),6.63-6.70(2H,m),6.90-7.00(2H,m),7.09(1H,t,J=7Hz),7.32(2H,d,J=8Hz),7.40-7.77(7H,m),8.10(1H,d,J=7Hz),9.70(1H,s)

16）４－〔２－〔３－ヒロドキシプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.43-1.56(2H,m),1.60-1.86(4H,m),2.11-2.23(2H,m),2.14(3H,s),2.37-2.90(6H,m),3.33(3H,s),3.40-3.47(2H,m),3.51-3.59(2H,m),3.86(2H,t,J=7.5Hz),3.86-4.00(2H,m),4.32(2H,t,J=7.5Hz),6.78-6.85(2H,m),6.99-7.19(4H,m),7.31(2H,d,J=8Hz),7.41-7.53(3H,m),8.21(1H,d,J=8Hz)

17）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.43-1.54(2H,m),1.60-1.70(2H,m),1.74-1.85(2H,m),2.10-2.21(2H,m),2.26(6H,s×2),2.30-2.41(6H,m),3.32(3H,s),3.40-3.48(2H,m),3.55-3.61(2H,m),3.77(3H,s),3.77-4.00(4H,m),4.31(2H,t,J=7.5Hz),6.57-6.63(2H,m),6.85-6.92(2H,m),7.00-7.11(3H,m),7.44(1H,t,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)

18）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.19-2.32(2H,m),2.25(3H,s),2.33(3H,s),2.36-2.52(4H,m),3.33-3.50(2H,m),3.39(3H,s),3.67(3H,s),3.71-3.91(4H,m),4.28(2H,t,J=7.5Hz),4.95(1H,d,J=14Hz),5.09(1H,d,J=14Hz),6.62-6.72(2H,m),6.81(1H,d,J=7Hz),6.93-7.08(4H,m),7.34-7.47(4H,m),7.59(1H,m),7.68-7.75(2H,m),7.82-7.88(2H,m),8.10-8.19(2H,m)

19）４－〔２－（３－エトキシカルボニルプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル〕カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.22(3H,t,J=7.5Hz),1.45-1.57(2H,m),1.63(3H,s),1.63-1.73(2H,m),1.76-1.88(2H,m),2.20-2.32(2H,m),2.24(3H,s),2.27(3H,s),2.32-2.40(6H,m),2.50(2H,t,J=7.5Hz),3.31(3H,s),3.43-3.50(2H,m),3.58-3.67(2H,m),3.78(3H,s),3.83-4.00(2H,m),4.12(2H,q,J=7.5Hz),4.22(2H,t,J=7.5Hz),6.57(1H,d,J=7Hz),6.62(1H,s),6.80-6.90(2H,m),6.97-7.11(3H,m),7.45(1H,t,J=7Hz),8.21(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)

20）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシ〕フェニルメチルアミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.44-1.57(2H,m),1.62-1.72(2H,m),1.72-1.95(4H,m),2.18(2H,t,J=7.5Hz),2.25(3H,s),2.28(3H,s),2.28-2.43(4H,m),3.28(3H,s),3.43-3.50(2H,m),3.57-3.65(2H,m),3.58(3H,s),3.80-3.96(2H,m),4.02(2H,t,J=7.5Hz),4.24(2H,s),4.80(1H,s),6.27(1H,d,J=7Hz),6.60(1H,d,J=7Hz),6.64(1H,s),6.80-6.95(5H,m),7.12-7.21(2H,m),7.64-7.88(4H,m)

21）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルエト－１－イル〕フェニルベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):2.20-2.50(6H,m),2.29(3H,s),2.61-2.94(6H,m),3.30(3H,s),3.37-3.68(2H,m),3.68(3H,s),3.68-3.92(2H,m),4.20-4.30(2H,m),6.80(1H,d,J=7Hz),6.90-6.98(2H,m),7.05(1H,t,J=7Hz),7.10-7.49(9H,m),7.53-7.89(4H,m),8.12(1H,d,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz)
22）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－〔４－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
MASS(m/z):824(M+1)
23）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルメトキシプロプ－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):2.04-2.17(2H,m),2.25(3H,s),2.28-2.40(6H,m),3.33(3H,s),3.38-3.46(2H,m),3.54-3.62(2H,m),3.66-3.76(2H,m),3.74(3H,s),3.80-3.90(2H,m),3.98-4.11(4H,m),4.28(2H,t,J=7.5Hz),6.78-7.10(7H,m),7.14(1H,t,J=7Hz),7.43(1H,t,J=7Hz),7.55(2H,s),7.68-7.75(1H,m),7.81-7.90(1H,m),8.13(1H,d,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz)
24）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－〔（Ｅ）－５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル〕カルボニル－４－ペンテン－１－イル〕オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):1.27-1.47(2H,m),1.83-2.02(2H,m),2.10-2.48(6H,m),2.23(3H,s),2.26(6H,s),2.50-4.13(8H,m),3.32(3H,s),3.78(3H,s),4.26(2H,t,J=7.5Hz),4.62(2H,m),6.32(1H,d,J=15Hz),6.57-6.67(2H,m),6.80-7.16(5H,m),7.44(1H,t,J=7Hz),7.53-7.88(5H,m),7.57(2H,s),8.09-8.19(2H,m)
25）３－メトキシ－４－［２－（ピリド－３－イル）メトキシベンゾイル］アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):1.44-1.57(2H,m),1.63-1.72(2H,m),1.75-1.86(2H,m),2.27(3H,s),2.30(3H,s),2.32-2.40(6H,m),3.29(3H,s),3.31(3H,s),3.45-3.51(2H,m),3.58-3.65(2H,m),3.80-4.00(2H,m),5.30(2H,s),6.58(1H,d,J=7Hz),6.61(1H,s),6.83(1H,d,J=7Hz),6.88-6.92(2H,m),7.05(1H,d,J=7Hz),7.14(1H,t,J=7Hz),7.29(1H,m),7.46(1H,t,J=7Hz),7.79(1H,d,J=7Hz),8.22(1H,d,J=7Hz),8.37(1H,d,J=7Hz),8.62(6H,d,J=7Hz),8.73(1H,s)
26）３－メトキシ－４－〔２－〔４－（フタルイミド）ブト－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):1.46-1.59(2H,m),1.65-1.74(2H,m),1.78-2.03(6H,m),2.26(3H,s),2.30(3H,s),2.32-2.41(6H,m),3.31(3H,s),3.43-3.50(2H,m),3.60-3.65(2H,m),3.74(2H,t,J=7.5Hz),3.77(3H,s),3.82-4.01(2H,m),4.22(2H,t,J=7.5Hz),6.58(1H,d,J=7Hz),6.63(1H,s),6.85(1H,d,J=7Hz),6.90(1H,d,J=7Hz),7.00(1H,d,J=7Hz),7.02(1H,s),7.08(1H,t,J=7Hz),7.45(1H,t,J=7Hz),7.70-7.76(2H,m),7.80-7.87(2H,m),8.21(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)
27）４－〔２－（３－ジメチルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):1.50-1.91(6H,m),2.07-2.18(2H,m),2.25(6H,s),2.28(3H,s),2.30(3H,s),2.32-2.44(2H,m),2.48(2H,t,J=5Hz),3.32(3H,s),3.49(2H,t,J=5Hz),3.63(2H,t,J=3Hz),3.78(3H,s),3.81-3.92(2H,m),4.25(2H,t,J=5Hz),6.54-6.64(2H,m),6.80-6.91(2H,m),6.99-7.11(4H,m),7.40-7.48(1H,m),8.18(1H,d,J=7Hz),8.38(1H,d,J=7Hz)
28）４－〔２－（エトキシカルボニルメトキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ

－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.23(3H,t,J=5Hz),1.50-1.91(6H,m),2.28(3H,s),2.31(3H,s),2.35-2.47(6H,m),3.33(3H,s),3.52(2H,t,J=5Hz),3.67(2H,t,J=5Hz),3.76(3H,s),3.84-4.02(2H,m),4.24(2H,q,J=5Hz),4.85(2H,s),6.55-6.67(2H,m),6.81-7.19(6H,m),7.41-7.49(1H,m),8.20(1H,d,J=8Hz),8.34(1H,d,J=7Hz)
29）４－〔２－〔３－（フタルイミド－１－イル）プロプ－１－イルオキシ〕－３－メチルベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.50-1.92(6H,m),2.14-2.44(8H,m),2.25(3H,s),2.28(3H,s),2.36(3H,s),3.33(3H,s),3.50(2H,t,J=5Hz),3.58(2H,t,J=5Hz),3.63(2H,t,J=5Hz),3.81(3H,s),3.81-4.03(8H,m),6.55-6.68(2H,m),6.82-7.38(6H,m),7.59-7.88(5H,m),8.32(1H,d,J=8Hz)
30）４－〔２－〔３－（フタルイミド－１－イル）プロプ－１－イル〕オキシ－４－メチルベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.50-1.91(8H,m),2.27(3H,s),2.30(3H,s),2.31-2.42(6H,m),2.38(3H,s),3.32(3H,s),3.50(2H,t,J=5Hz),3.63(2H,t,J=5Hz),3.78(3H,s),3.85-4.02(6H,m),4.28(2H,t,J=5Hz),6.58-6.67(2H,m),6.77(1H,s),6.80-6.92(4H,m),7.00(1H,s),7.58(4H,s),8.01(1H,d,J=8Hz),8.18(1H,d,J=8Hz)
31）４－〔２－〔３－（フタルイミド－１－イル）プロピルオキシ〕－５－メチルベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.52-1.91(10H,m),2.25(3H,s),2.30(3H,s),2.31(3H,s),2.31-2.45(2H,m),3.31(3H,s),3.50(2H,t,J=4Hz),3.59(2H,t,J=5Hz),3.64(2H,t,J=4Hz),3.78(3H,s),3.85-4.02(4H,m),4.24(2H,t,J=5Hz),6.58(2H,m),6.81-6.92(3H,m),7.00(1H,s),7.25(1H,d,J=8Hz),7.59(3H,s),7.71-7.79(1H,m),7.82-7.89(1H,m),7.92(1H,s),8.20(1H,d,J=8Hz)
32）４－〔２－〔３－（フタルイミド－１－イル）プロピルオキシ〕－４－クロロベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.45-1.92(6H,m),2.25(3H,s),2.30(3H,s),2.29-2.44(8H,m),3.32(3H,s),3.46-3.54(2H,m),3.61-3.68(2H,m),3.78(3H,s),3.80-4.01(4H,m),4.25(2H,t,J=5Hz),6.56-6.77(2H,m),6.79-7.04(7H,m),7.44(2H,s),7.70-7.78(1H,m),7.81-7.88(1H,m),8.06(1H,d,J=8Hz)
33）４－〔２－〔３－（フタルイミド－１－イル）プロピルオキシ〕－４－メトキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.49-1.90(6H,m),2.15-2.24(2H,m),2.28(3H,s),2.32(3H,s),2.30-2.42(6H,m),3.33(3H,s),3.50(2H,t,J=4Hz),3.60(2H,t,J=5Hz),3.63(2H,t,J=4Hz),3.79(3H,s),3.85(3H,s),3.82-4.02(6H,m),4.24(2H,t,J=5Hz),6.57-6.68(2H,m),6.82(1H,d,J=8Hz),6.89(1H,d,J=8Hz),7.00(1H,s),7.57(2H,s),7.71-7.76(2H,m),7.82-7.88(2H,m),8.11(1H,d,J=9Hz),8.17(1H,d,J=8Hz)
34）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－（２－ベンジルオキシ－４－メチルフェニル）－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),2.10(2H,t,J=5Hz),2.29(3H,s),3.28(2H,q,J=5Hz),3.39(3H,s),3.62(3H,s),4.21(2H,t,J=5Hz),4.90(1H,d,J=13Hz),5.08(1H,d,J=13Hz),6.63-6.71(3H,m),6.87(1H,d,J=7Hz),6.96-7.11(6H,m),7.31-7.48(6H,m),8.21(1H,d,J=8Hz),8.38(1H,d,J=8Hz)

35）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（２－オキサゾリン－２－イル〕フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),2.09-2.17(2H,m),2.28(3H,s),3.27(1H,q,J=5Hz),3.40(3H,s),3.65(3H,s),4.05(2H,t,J=10Hz),4.23(2H,t,J=5Hz),4.40(2H,t,J=10Hz),4.88(1H,d,J=12Hz),5.08(1H,d,J=12Hz),6.62(1H,s),6.68(1H,d),6.97-7.11(6H,m),7.32(1H,d,J=8Hz),7.41(1H,d,J=8Hz),7.92(2H,d,J=8Hz),8.21(1H,d,J=8Hz),8.37(1H,d,J=8Hz)
36）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.22-1.47(2H,m),1.47-1.80(6H,m),1.80-1.92(4H,m),2.29(6H,s),2.31-2.41(3H,m),2.50-2.63(1H,m),2.95-3.07(1H,m),3.36(3H,s),3.48(1H,s),3.49(1H,s),3.75(3H,s),3.82-4.03(4H,m),4.22-4.30(2H,m),4.60-4.70(1H,m),6.78-6.90(3H,m),6.92-7.20(4H,m),7.40-7.50(1H,m),7.55-7.63(3H,m),7.70-7.80(1H,m),7.82-7.90(1H,m),8.10-8.22(2H,m)
37）３－メチル－４－〔２－〔〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
MASS(m/z):774(M+H)
38）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－クロロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.32-1.45(2H,m),1.41(9H,s),1.48-1.59(2H,m),1.62-1.91(8H,m),2.08-2.18(2H,m),2.27(6H,s),2.28(3H,s),2.30-2.40(3H,m),2.52-2.61(1H,m),2.97-3.07(1H,m),3.22-3.30(2H,m),3.30(3H,s),3.83-4.00(3H,m),4.30(2H,t,J=6Hz),4.57-4.68(1H,m),6.60-6.63(2H,m),6.87-6.90(1H,m),7.02-7.15(3H,m),7.46-7.57(2H,m),8.20-8.22(1H,m),8.40(1H,d,J=7Hz)
39）３－エトキシ－４－〔２－〔〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
MASS(m/z):804(M+H)
40）３－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ－４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.40および1.43(計18H,s),1.49-1.60(2H,m),1.62-1.98(6H,m),2.00-2.10(2H,m),2.27(3H,s),2.29(3H,s),2.31-2.41(6H,m),3.17-3.29(4H,m),3.30(3H,s),3.45-3.50(2H,m),3.59-3.69(2H,m),3.84-4.05(4H,m),4.22-4.30(2H,m),5.04(2H,br),6.55-6.63(2H,m),6.85(1H,d,J=7Hz),6.93(1H,d,J=7Hz),6.98-7.03(2H,m),7.09(1H,t,J=7Hz),7.43(1H,t,J=7Hz),8.14(1H,d,J=7Hz),8.36(1H,d,J=7Hz)
41）２－アミノ－４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.25-1.39(2H,m),1.42および1.46(計9H,s),1.48-1.60(2H,m),1.62-1.93(8H,m),2.08-2.18(2H,m),2.27および2.28(計9H,s),2.33-2.39(3H,m),2.50-2.60(1H,m),2.96-3.05(1H,m),3.29(3H,s),3.31-3.40(2H,m),3.85-3.98(3H,m),4.19(2H,t,J=6Hz),4.57-4.67(1H,m),6.57-6.59(1H,m),6.63(2H,s),6.78-6.89－(2H,m),6.96(1H,d,J=7Hz),7.09(1H,t,J=6Hz),7.15(1H,s),7.40-7.46(1H,m),8.17(1H,d,J=6Hz)

42）２－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕－５－ピリジンカルボキシアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.30(9H,s),1.35-1.93(12H,m),2.10-2.22(2H,m),2.28(9H,s),2.30-2.40(3H,m),2.50-2.62(1H,m),2.95-3.08(1H,m),3.33(3H,s),3.38-3.49(2H,m),3.82-3.98(4H,m),4.29(2H,t,J=6Hz),4.57-4.67(1H,m),6.60-6.62(2H,m),6.90(1H,d,J=6Hz),6.99(1H,d,J=7Hz),7.09(1H,t,J=7Hz),7.44-7.55(2H,m),8.13-8.21(2H,m),8.39(1H,s)

実施例14

氷浴で冷却した４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（200mg）のジクロロメタン（10ml）溶液に、トリエチルアミン（36.2mg）および無水酢酸（36.5mg）を加え、混合物を外界温度で４時間攪拌した。反応混合物を水（10ml）、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（10ml）および食塩水（10ml）で順次洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を蒸発させて、４－〔２－〔（３－アセチルアミノプロプ－１－イル)オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（201mg）を無色の無定形物として得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.51(2H,m),1.62-1.86(4H,m),1.93(3H,s),2.11(2H,m),2.29(3H,s),2.30-2.40(6H,m),3.35(3H,s),3.40-3.50(4H,m),3.59(2H,m),3.92(2H,m),4.18(2H,t,J=7.5Hz),6.28(1H,m),6.75-6.83(2H,m),6.94-7.17(4H,m),7.31(2H,d,J=8.5Hz),7.40-7.49(3H,m),8.08(1H,d,J=7Hz),9.18(1H,s)

実施例15

４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（220mg）と37％含水ホルムアルデヒド（290mg）とのメタノール（10ml）－酢酸（0.2ml）混合物中混合物に、水素化シアノ硼素ナトリウム（44.8mg）を加え、混合物を外界温度で４時間攪拌した。反応混合物をクロロホルム（20ml）で希釈し、溶液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（20ml）、水（10ml）および食塩水（10ml）で順次洗った。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を蒸発させて、４－〔２－〔（３－ジメチルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル)カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（215mg）を無色の無定形物として得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.55(2H,m),1.73(2H,m),1.84(2H,m),2.11(2H,m),2.20(6H,s),2.30(3H,s),2.32-2.40(6H,m),2.46(2H,t,J=7.5Hz),3.35(3H,s),3.49(2H,m),3.62(2H,m),4.24(2H,t,J=7.5Hz),6.74-6.83(2H,m),6.97-7.03(2H,m),7.07-7.16(2H,m),7.32(2H,d,J=8.5Hz),7.42-7.50(3H,m),8.22(2H,d,J=7Hz)

実施例16

４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（250mg）の溶液に、４Ｎ塩化水素酢酸エチル溶液（１ml）を加え、溶液を外界温度で10時間攪拌した。白色固体を▲濾▼取し、減圧下で乾燥して、４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイルアミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩（205mg）を白色粉末として得た。

NMR(D_2O,δ):1.40(2H,m),1.59(2H,m),1.70(2H,m),2.09(2H,m),2.42(2H,t,J=7.5Hz),2.92(3H,s),2.96-3.17(6H,m),3.24(3H,s),3.41-3.59(2H,m),3.69(1H,m),3.82(1H,m),4.04-4.20(3H,m),4.53(1H,m),6.72(1H,d,J=7Hz),6.81(1H,t,J=7Hz),6.93-7.60(11H,m)

実施例17

実施例16と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－〔（３－アセチルアミノプロプ－１－イル)オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド塩酸塩
NMR(D_2O,δ):1.38(2H,m),1.50-1.68(4H,m),1.48(2H,m),1.81(3H,s),2.42(2H,m),2.90(3H,s),2.97-3.15(6H,m),3.24(3H,s),3.40-3.61(4H,m),3.71-3.92(2H,m),4.14(1H,m),4.54(1H,m),6.62-6.77(2H,m),6.79-6.90(2H,m),7.00(1H,m),7.11(1H,m),7.19-7.33(5H,m),7.59(1H,d,J=7Hz)
２）４－〔２－〔（３－ジメチルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(D_2O,δ):1.51(2H,m),1.67(2H,m),1.81(2H,m),2.22(2H,m),2.53(2H,t,J=7.5Hz),2.65(6H,s),2.82(3H,s),3.00-3.17(2H,m),3.23(2H,t,J=7.5Hz),3.37(3H,s),3.89(1H,m),4.13(1H,m),4.07-4.20(3H,m),4.58(1H,m),6.92-7.00(2H,m),7.11-7.18(2H,m),7.26-7.48(6H,m),7.54-7.60(2H,m)
３）４－〔２－〔（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルメトキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(D_2O,δ):1.36(2H,m),1.53(2H,m),1.66(2H,m),2.98(6H,s),2.91-3.25(10H,m),3.30(3H,s),3.37-3.69(4H,m),3.77-3.96(2H,m),4.35-4.56(2H,m),4.82(2H,s),6.75(1H,d,J=7Hz),6.84(1H,t,J=7Hz),6.92(1H,d,J=7Hz),7.03-7.15(2H,m),7.22(1H,d,J=7Hz),7.29(2H,d,J=8.5Hz),7.43-7.58(3H,m),7.80(1H,d,J=7Hz)
４）４－〔２－（３－ピペリジノプロプ－１－イルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(D_2O,δ):1.42-1.67(10H,m),1.78(2H,m),2.20(2H,m),2.51(2H,t,J=7.5Hz),2.65(2H,m),2.94(3H,s),2.95-3.21(6H,m),3.32(2H,m),3.35(3H,s),3.57(2H,m),3.92-4.04(2H,m),4.16-4.25(4H,m),6.91-6.99(2H,m),7.08-7.17(2H,m),7.23-7.47(6H,m),7.52-7.60(2H,m)
５）４－〔２－〔２－（ジメチルアミノ）エト－１－イルオキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(D_2O,δ):1.52(2H,m),1.68(2H,m),1.81(2H,m),2.52(2H,t,J=7.5Hz),2.82(6H,s),2.93(3H,s),2.97-3.21(4H,m),3.37(3H,s),3.48-3.62(2H,m),3.87(1H,m),4.01(1H,m),4.24(1H,m),4.47(2H,m),4.57(1H,m),6.92-7.00(2H,m),7.13-7.48(8H,m),7.52-7.62(2H,m)
６）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイルアミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルアミノプロプ－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(D_2O,δ):2.01(2H,m),2.17(2H,m),2.91(3H,s),2.95-3.46(8H,m),3.40(3H,s),3.54(2H,m),4.02-4.16(4H,m),4.27(2H,m),6.93-7.00(2H,m),7.12-7.21(2H,m),7.26-7.37(2H,m),7.39-7.48(4H,m),7.54-7.64(2H,m)
７）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(D_2O,δ):1.43(2H,m),1.60(2H,m),1.72(2H,m),2.07(2H,m),2.18(3H,s),2.45(2H,t,J=7.5Hz),2.90(3H,s),2.92-3.13(4H,m),3.30(3H,s),3.41-3.63(4H,m),3.64(3H,s),3.82(1H,m),3.92(1H,m),4.04-4.61(3H,m),4.50(1H,m),6.66-6.74(3H,m),6.93-7.04(3H,m),7.10(1H,d,J=7Hz),7.41(1H,t,J=7Hz),7.73(1H,d,J=7Hz),7.95(1H,d,J=7Hz)
８）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ－４－メチルベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.48-1.96(8H,m),2.27(3H,s),2.32-2.42(2H,m),2.78(3H,s),3.11-3.22(2H

,m),3.28(3H,s),3.79(3H,s),3.80-4.11(2H,m),4.22-4.32(2H,m),6.58-6.67(2H,m),6.79-6.96(5H,m),7.87(1H,d,J=8Hz),8.69-8.75(1H,m),9.41(1H,br)

９）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ－３－メチルベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):1.46-1.92(6H,m),2.15-2.57(4H,m),2.24(3H,s),2.30(3H,s),2.62-2.98(6H,m),2.80(3H,s),3.02-3.29(4H,m),3.28(3H,s),3.73-4.18(5H,m),4.46(1H,br),4.62(1H,br),6.56-6.68(2H,m),6.81-6.96(3H,m),7.10(1H,dd,J=2,8Hz),7.30(1H,d,J=8Hz),7.66-7.77(1H,m),8.28-8.52(4H,m),9.65(1H,br)

10）４－〔２－（３－アセチルアミノプロプ－１－イル)オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):1.48-1.92(6H,m),1.91(3H,s),1.96-2.25(2H,m),2.30(3H,s),2.30-2.39(2H,m),2.68(6H,s),3.32(3H,s),3.35-3.47(2H,m),3.76(3H,s),4.26(2H,br),4.75(1H,br),6.56-7.12(6H,m),7.47(1H,br),8.10(1H,br),8.39(1H,br)

11）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（３－アミノプロピオニル）アミノブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド二塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):1.59-1.90(4H,m),2.04-2.15(2H,m),2.27(3H,s),2.30-2.44(2H,m),2.87-3.08(4H,m),3.21-3.38(2H,m),3.30(3H,s),3.75-3.94(2H,m),3.76(3H,s),4.21-4.33(2H,m),6.55-6.68(2H,m),6.86-7.10(5H,m),7.29-7.48(2H,m),8.17(1H,br),8.35(1H,br)

12）４－〔２－（３－グアニジノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):1.49-1.93(6H,m),2.05-2.41(8H,m),2.27(3H,s),2.75(6H,s),3.08(2H,br),3.29(3H,s),3.47(2H,br),3.67-4.10(4H,m),3.77(3H,s),4.27(2H,br),6.56-6.71(2H,m),6.81-7.09(5H,m),7.44(1H,br),7.98-8.19(2H,m),8.28-8.45(1H,m)

13）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド塩酸塩

NMR($DMSO\text{-}d_6$,δ):1.35-1.66(4H,m),1.66-1.83(2H,m),2.22(3H,s),2.39(2H,t,J=7Hz),2.74および2.76(計3H,s),2.80-3.10(4H,m),3.18(3H,s),3.28-3.63(2H,m),3.68(3H,s),3.77-4.18(3H,m),4.34-4.52(1H,m),6.64(1H,d,J=9Hz),6.75-7.12(6H,m),7.40(1H,m),7.98(1H,d,J=9Hz),8.23(1H,d,J=9Hz)

14）（Ｓ）－４－〔２－〔（３－アミノ－１－メチルプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR($DMSO\text{-}d_6$,δ):1.35(3H,d,J=7Hz),1.40-1.65(4H,m),1.66-1.82(2H,m),1.92-2.20(2H,m),2.23(3H,s),2.38(2H,t,J=7Hz),2.64(3H,s),2.78-3.43(11H,m),3.51-4.07(7H,m),4.93-5.09(1H,m),6.65(1H,d,J=8Hz),6.82(1H,s),6.89(1H,d,J=8Hz),6.98(1H,s),7.04(1H,d,J=8Hz),7.12(1H,dd,J=8,8Hz),7.36(1H,d,J=8Hz),7.57(1H,dd,J=8,8Hz),7.98-8.35(4H,m)

15）４－（２－アミノベンゼンスルホニル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR($DMSO\text{-}d_6$,δ):1.36-1.45(2H,m),1.50-1.59(2H,m),1.65-1.73(2H,m),2.23および2.29(計3H,s),2.34-2.42(4H,m),2.77(3H,d,J=1Hz),2.92-3.00(2H,m),3.11および3.13(計3H,s),3.19(1H,s),3.36-3.70(10H,m),4.03-4.11(1H,m),4.40-4.48(1H,m),6.44-6.50(1H,m),6.60-6.88(6H,m),6.94-7.10(2H,m),7.27-7.32(1H,m)

ESI-MASS(m/z):638(M+H)

16）（Ｒ）－４－〔２－〔（４－アミノブト－２－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.37および1.39(計3H,s),1.40-1.78(8H,m),1.94-2.12(3H,m),2.23(3H,s),2.30-2.40(4H,m),2.87-2.96(2H,m),3.18(3H,s),3.32(3H,s),3.46-3.58(2H,m),3.77(3H,s),3.83-3.99(3H,m),4.94-5.02(1H,m),6.65(1H,d,J=8Hz),6.82(1H,s),6.88(1H,d,J=8Hz),6.98(1H,s),7.03(1H,d,J=8Hz),7.13(1H,t,J=8Hz),7.33(1H,d,J=9Hz),7.58(1H,t,J=8Hz),7.88-8.02(2H,br),8.04(1H,d,J=9Hz),8.27(1H,d,J=8Hz)
ESI-MASS(m/z):674(M+H)
17）（Ｒ）－４－〔２－〔（４－アミノブト－２－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.36および1.38(計3H,s),1.40-1.80(12H,m),1.88-2.13(3H,m),2.24(3H,s),2.35(2H,t,J=8Hz),2.51(6H,s),2.89-3.03(4H,m),3.19(3H,s),3.76(3H,s),3.83-4.00(3H,m),4.43-4.51(1H,m),4.96-5.03(1H,m),6.65(1H,d,J=8Hz),6.83(1H,s),6.87-6.92(1H,m),6.98(1H,s),7.03(1H,d,J=8Hz),7.14(1H,t,J=8Hz),7.34(1H,d,J=8Hz),7.58(1H,t,J=8Hz),8.04(1H,d,J=8Hz),8.24-8.30(1H,m)
ESI-MASS(m/z):702(M+H)
18）（Ｓ）－４－〔２－〔（４－アミノブト－２－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.35および1.38(計3H,s),1.42-1.79(12H,m),1.88-2.14(3H,m),2.25(3H,s),2.36(2H,t,J=8Hz),2.51(6H,s),2.89-3.02(4H,m),3.20(3H,s),3.76(3H,s),3.84-4.00(3H,m),4.43-4.50(1H,m),4.97-5.03(1H,m),6.65(1H,d,J=8Hz),6.82(1H,s),6.88-6.92(1H,m),6.98(1H,s),7.02(1H,d,J=8Hz),7.15(1H,t,J=8Hz),7.34(1H,d,J=8Hz),7.58(1H,t,J=8Hz),8.03(1H,d,J=8Hz),8.24-8.30(1H,m)
ESI-MASS(m/z):702(M+H)
19）４－〔２－（４－アミノブト－２－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド二塩酸塩
NMR(D_2O,δ):1.35-1.50(2H,m),1.56-1.64(2H,m),1.68-1.83(4H,m),2.47(2H,t,J=7.5Hz),2.82-3.12(5H,m),2.92(3H,s),3.33(3H,s),3.43-3.61(3H,m),3.81(1H,m),3.95(1H,m),6.84(1H,d,J=7Hz),6.91(1H,t,J=7Hz),7.00-7.08(3H,m),7.19(1H,t,J=7Hz),7.26-7.37(4H,m),7.48(1H,t,J=7Hz),7.62(1H,d,J=7Hz)
20）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.16(3H,t,J=7.5Hz),1.38-1.49(2H,m),1.55-1.64(2H,m),1.67-1.77(2H,m),1.98-2.08(2H,m),2.21(3H,s),2.31(2H,t,J=7.5Hz),2.87-2.97(2H,m),3.16(3H,s),3.80-3.98(2H,m),4.03(2H,q,J=7.5Hz),4.19(2H,t,J=7.5Hz),6.62(1H,d,J=7Hz),6.80(1H,s),6.98-7.07(2H,m),7.15(1H,d,J=7Hz),7.22(2H,d,J=8Hz),7.43-7.57(4H,m),7.86-8.00(3H,br)
21）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.38-1.49(2H,m),1.52-1.62(2H,m),1.68-1.78(2H,m),1.96-2.09(2H,m),2.21(3H,s),2.38(2H,t,J=7.5Hz),2.73(3H×1/2,s),2.75(3H×1/2,s),2.81-3.07(4H,m),3.15(3H,s),3.30-3.54(4H,m),3.81-4.21(5H,m),4.45(1H,m),6.65(1H,d,J=7Hz),6.81(1H,s),6.99-7.08(2H,m),7.15(1H,d,J=7Hz),7.22(2H,d,J=8Hz),7.45-7.60(4H,m),8.04(2H,br)
22）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルプロプ－１－イル〕

オキシ〕フェニルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.90-2.09(4H,m),2.48-2.59(2H,m),2.72(3H×1/2,s),2.73(3H×1/2,s),2.83-3.10(4H,m),3.20(3H,s),3.33-3.56(3H,m),3.88-4.09(3H,m),4.18(2H,t,J=7.5Hz),4.47(1H,m),4.80(1H,m),6.87(1H,t,J=7Hz),6.98(1H,d,J=7Hz),7.04(1H,t,J=7Hz),7.11-7.26(5H,m),7.44-7.59(4H,m),8.05(2H,br)
23）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－（４－メチルピペラジン－１－イルカルボニル)フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.97-2.07(2H,m),2.26(3H,s),2.75(3H×1/2,s),2.77(3H×1/2,s),2.82-2.95(2H,m),3.02-3.14(2H,m),3.21(3H,s),3.30-3.49(4H,m),3.97-4.21(4H,m),5.09(1H,d,J=14Hz),5.20(1H,d,J=14Hz),6.70(1H,d,J=7Hz),6.93(1H,s),7.02-7.25(5H,m),7.43-7.57(8H,m),7.92-8.04(3H,br)
24）４－〔２－（３－ヒドロキシプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.39-1.50(2H,m),1.52-1.62(2H,m),1.69-1.79(2H,m),1.84-1.93(2H,m),2.40(2H,t,J=7.5Hz),2.70(3H×1/2,s),2.72(3H×1/2,s),2.82-3.07(4H,m),3.19(3H,s),3.28-3.60(4H,m),3.80-3.98(2H,m),4.10(1H,m),4.17(2H,t,J=7.5Hz),4.45(1H,m),6.85(1H,t,J=7Hz),6.98(1H,d,J=7Hz),7.03(1H,t,J=7Hz),7.13-7.24(5H,m),7.43-7.54(3H,m),7.62(1H,d,J=7Hz)
25）４－〔２－（４－ヒドロキシ－１－ブチン－１－イル）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.42-1.52(2H,m),1.54-1.64(2H,m),1.70-1.82(2H,m),2.37-2.47(6H,m),2.49(3H,s),2.51(3H,s),2.84-3.05(2H,m),3.32-3.46(4H,m),3.84-3.98(2H,m),4.08(1H,m),4.47(1H,m),6.84(1H,t,J=7Hz),6.97(1H,d,J=7Hz),7.13-7.25(4H,m),7.41-7.53(6H,m)
26）４－〔２－（４－アミノブト－１－イル）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.39-1.62(8H,m),1.67-1.80(2H,m),2.39(3H,t,J=7.5Hz),2.50(3H,s),2.63-2.73(4H,m),2.81-3.08(2H,m),3.18(3H,s),3.31-3.42(4H,m),3.85-4.00(2H,m),4.04(1H,m),4.43(1H,m),6.84(1H,t,J=7Hz),6.99(1H,d,J=7Hz),7.11-7.42(6H,m),7.50-7.56(2H,m),7.75-7.91(2H,m)
27）４－［２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.40-1.51(2H,m),1.53-1.62(2H,m),1.69-1.80(2H,m),1.98(3H,s),1.98-2.03(2H,m),2.22(3H,s),2.39(2H,t,J=7.5Hz),2.71(3H×1/2,s),2.74(3H×1/2,s),2.83-3.05(2H,m),3.31-3.50(3H,m),3.56(2H,t,J=7.5Hz),3.72(3H,s),3.81-4.11(5H,m),4.32(2H,t,J=7.5Hz),4.43(1H,m),6.65(1H,d,J=7Hz),6.81(1H,s),6.87-6.95(2H,m),7.05(1H,d,J=7Hz),7.11(1H,t,J=7Hz),7.26(1H,d,J=7Hz),7.54(1H,t,J=7Hz),8.03(1H,d,J=7Hz),8.28(1H,d,J=7Hz)
28）３－メトキシ－４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):2.23(3H,s),2.75(3H×1/2,s),2.77(3H×1/2,s),2.97-3.15(2H,m),3.21(3H,s),3.24-3.80(6H,m),5.06(1H,d,J=14Hz),5.19(1H,d,J=14Hz),6.70(1H,d,J=7Hz),6.90-7.01(3H,m),7.10(1H,d,J=7Hz),7.22(2H,d,J=8Hz),7.41(1H,d,J=7Hz),7.44-7.55(7H,m),7.87(1H,d,J=7Hz)
29）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキ

シ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル)カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):2.06-2.19(2H,m),2.23(3H,s),2.75(3H,s),2.87-2.98(2H,m),3.02-3.15(2H,m),3.23(3H,s),3.32-3.49(2H,m),3.65(3H,s),3.71-3.96(4H,m),4.29-4.40(2H,m),5.04(1H,d,J=14Hz),5.20(1H,d,J=14Hz),6.76(1H,d,J=7Hz),6.88(1H,d,J=7Hz),6.90-6.98(2H,m),7.09-7.19(2H,m),7.28(1H,d,J=7Hz),7.50-7.62(2H,m),7.98-8.15(4H,m),8.23(1H,d,J=7Hz)
30）３－メトキシ－４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕フェニルメチル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.35-1.47(2H,m),1.49-1.59(2H,m),1.64-1.74(2H,m),2.00-2.10(2H,m),2.22(3H,s),2.30-2.38(2H,m),2.69(3H×1/2,s),2.73(3H×1/2,s),2.82-3.03(6H,m),3.09(3H,s),3.29-3.41(2H,m),3.53(3H,s),3.83-4.12(6H,m),4.22(2H,s),4.70(1H,br),6.21(1H,d,J=7Hz),6.58-6.66(2H,m),6.71-6.99(5H,m),7.09(1H,d,J=7Hz),7.20(1H,t,J=7Hz),8.02(2H,br d)
31）４－（２－ジメチルアミノ－４－メチル）フェノキシメチル－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.37-1.47(2H,m),1.50-1.61(2H,m),1.67-1.80(2H,m),2.20(3H,s),2.29(3H,s),2.39(2H,t,J=7.5Hz),2.71(3H×1/2,s),2.73(3H×1/2,s),2.80-3.58(4H,m),3.03(6H,s),3.17(3H,s),3.72-4.48(6H,m),5.21(2H,s),6.62(1H,d,J=7Hz),6.78(1H,s),6.91(1H,d,J=7Hz),7.02(1H,d,J=7Hz),7.11(1H,d,J=7Hz),7.26(2H,d,J=8Hz),7.37(2H,d,J=8Hz),7.70(1H,d,J=7Hz)
32）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルエト－１－イル〕フェニルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):2.06-2.19(2H,m),2.55-3.12(10H,m),2.71(3H×1/2,s),2.73(3H×1/2,s),3.18(3H,s),3.23-3.48(2H,m),3.66(3H,s),3.66-3.81(2H,m),4.30-4.40(2H,m),6.86-6.90(2H,m),7.11(1H,t,J=7Hz),7,20-7.42(9H,m),7.59(1H,t,J=7Hz),8.01(1H,d,J=7Hz),8.08(2H,br),8.27(1H,d,J=7Hz)
33）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）チオベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.40-1.51(3H,m),1.52-1.63(2H,m),1.70-1.88(4H,m),2.23(3H,s),2.40(3H,t,J=7.5Hz),2,71(3H×1/2,s),2.72(3H×1/2,s),2.80-2.91(2H,m),2.94-3.06(2H,m),3.17(3H,s),3.32-3.67(8H,m),3.60(3H,s),3.81-4.10(3H,m),4.41(1H,m),6.65(1H,d,J=7Hz),6.82(1H,s),6.86-6.92(2H,m),7.02(1H,d,J=7Hz),7.27(1H,t,J=7Hz),7.41-7.52(3H,m),7.71(1H,d,J=7Hz),9.37(1H,s)
34）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔４－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.57-1.73(2H,m),2.00-2.20(4H,m),2.23(3H,s),2.70(3H,s),2.71(3H,s),2.87-3.05(3H,m),3.24(3H,s),3.33-3.50(1H,m),3.66(3H,s),3.71-4.05(4H,m),4.37(2H,t,J=7.5Hz),5.02(1H,d,J=14Hz),5.20(1H,d,J=14Hz),6.73(1H,d,J=7Hz),6.86(1H,d,J=7Hz),6.96(2H,s),7.10-7.19(2H,m),7.29(1H,d,J=7Hz),7.43-7.52(4H,m),7.58(1H,t,J=7Hz),8.00(1H,d,J=7Hz),8.03(1H,d,J=7Hz)
35）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルメトキシプロプ－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.94-2.04(2H,m),2.10-2.20(2H,m),2.71(3H×1/2,s),2.23(3H×1/2,s),

2.84-3.10(6H,m),3.21(3H,s),3.31-3.50(2H,m),3.57-3.81(4H,m),3.74(3H,s),3.90-4.01(2H,m),4.20(2H×1/2,s),4.22(2H×1/2,d),4.35(2H,t,J=7.5Hz),6.82-6.97(3H,m),7.01(1H,d,J=7Hz),7.10-7.28(4H,m),7.58(1H,t,J=7Hz),8.03(1H,d,J=7Hz),8.27(1H,d,J=7Hz)

36）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔（Ｅ）－５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニル－４－ペンテン－１－イル〕オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド二塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.36-1.63(2H,m),1.84-1.92(2H,m),1.97-2.08(2H,m),2.10-2.22(2H,m),2.22(3H,s),2.29-2.43(2H,m),2.63(3H,s),2.65(3H,s),2.70-2.86(2H,m),2.88-3.00(2H,m),3.14(3H×1/2,s),3.17(3H×1/2,s),3.28-3.42(2H,m),3.71(3H,s),3.84-4.06(2H,m),4.37(2H,t,J=7.5Hz),4.51(1H,m),6.52(1H,d,J=15Hz),6.60(1H,m),6.73-7.07(5H,m),7.13(1H,t,J=7Hz),7.27(1H,d,J=7Hz),7.56(1H,t,J=7Hz),8.01(1H,d,J=7Hz),8.30(1H,d,J=7Hz)

37）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペリジン－１－イル)カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):0.88(3H,d,J=7.5Hz),0.90-1.10(2H,m),1.34-1.61(6H,m),1.70-1.80(2H,m),2.10-2.20(2H,m),2.23(3H,s),2.30(2H,t,J=7.5Hz),2.45(1H,m),2.85-3.00(3H,m),3.18(3H,s),3.74(3H,s),3.75-4.02(4H,m),4.38(2H,t,J=7.5Hz),4.78(1H,m),6.65(1H,d,J=7Hz),6.82(1H,s),6.88(1H,d,J=7Hz),6.98(1H,s),7.02(1H,d,J=7Hz),7.13(1H,t,J=7Hz),7.26(1H,d,J=7Hz),7.59(1H,t,J=7Hz),8.00(1H,d,J=7Hz),8.22(1H,d,J=7Hz)

38）４－（２，４－ジメトキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.40-1.51(2H,m),1.51-1.64(2H,m),1.69-1.82(2H,m),2.22(3H,s),2.38(2H,t,J=7.5Hz),2.73(3H,s),2.81-3.09(4H,m),3.19(3H,s),3.25-3.50(2H,m),3.76(6H,s×2),3.77-4.15(3H,m),4.00(3H,s),4.44(1H,m),6.64(1H,d,J=7Hz),6.81(1H,s),6.88-6.95(2H,m),7.03(1H,d,J=7Hz),7.12-7.23(2H,m),7.57(1H,m),8.29(1H,d,J=7Hz)

39）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド二塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):2.00-2.11(2H,m),2.13-2.20(2H,m),2.25(3H,s),2.87-3.00(4H,m),3.19(3H,s),3.77(3H,s),3.89-4.10(2H,m),4.36(2H,t,J=7.5Hz),6.69(1H,d,J=7Hz),6.82(1H,s),6.89(1H,d,J=7Hz),7.04(1H,s),7.05(1H,d,J=7Hz),7.15(1H,d,J=7Hz),7.38(1H,d,J=7Hz),7.56(1H,t,J=7Hz),8.01(1H,d,J=7Hz),8.28(1H,d,J=7Hz)

40）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－アミノブト－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド二塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.66-1.85(4H,m),2.10-2.20(2H,m),2.22(3H,s),2.80-3.01(4H,m),3.18(3H,s),3.75(3H,s),3.81-4.03(2H,m),4.36(2H,t,J=7.5Hz),6.64(1H,d,J=7Hz),6.34(1H,s),6.90(1H,d,J=7Hz),6.96(1H,s),7.01(1H,d,J=7Hz),7.14(1H,t,J=7Hz),7.27(1H,d,J=7Hz),7.57(1H,t,J=7Hz),8.00(1H,d,J=7Hz),8.25(7H,d,J=7Hz)

41）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－アセチルアミノブト－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.49-1.59(2H,m),1.67-1.77(2H,m),1.80(3H,s),2.06-2.20(2H,m),2.21(3H,s),2.86-3.00(2H,m),3.03-3.13(2H,m),3.18(3H,s),3.74(3H,s),3.80-4.02(2H,m),4.35(2H,t,J=7.5Hz),6.64(1H,d,J=7Hz),7.82(1H,s),7.88(1H,d,J=7Hz),7.96(1H,s),7.02(1H,d,J=7Hz),7,13(1H,t,J=7Hz),7.26(1H,d,J=7Hz),7.57(1H,t,J=7Hz),8.00(1H,d,J=7Hz),8.23(1H,d,J=7Hz)

42）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキ

シ－Ｎ－〔２－（４－アミノアセチルアミノブト－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.53-1.64(2H,m),1.70-1.81(2H,m),2.09.2.21(2H,m),2.22(3H,s),2.86-2.98(2H,m),3.11-3.23(2H,m),3.17(3H,s),3.47-3.56(2H,m),3.65-4.00(2H,m),3.76(3H,s),4.38(2H,t,J=7.5Hz),6.65(1H,d,J=7Hz),6.82(1H,s),6.89(1H,d,J=7Hz),6.95(1H,s),7.03(1H,d,J=7Hz),7.12(1H,t,J=7Hz),7.25(1H,d,J=7Hz),7.56(1H,t,J=7Hz),8.00(1H,d,J=7Hz),8.22(1H,d,J=7Hz)
43）３－メトキシ－４－〔２－（ピペリジン－４－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.38-1.49(2H,m),1.49-1.61(2H,m),1.66-1.76(2H,m),1.85-1.97(2H,m),2.20(3H,s),2.67(2H,t,J=7.5Hz),2.73(3H×1/2,s),2.74(3H×1/2,s),2.80-3.13(6H,m),3.13(3H,s),3.22-3.51(6H,m),3.60-4.13(3H,m),3.74(3H,s),4.43(1H,m),4.91(1H,m),6.65(1H,d,J=7Hz),6.81(1H,s),6.89(1H,d,J=7Hz),6.96(1H,s),7.03(1H,d,J=7Hz),7.12(1H,t,J=7Hz),7.35(1H,d,J=7Hz),7.56(1H,t,J=7Hz),7.81(1H,d,J=7Hz),8.27(1H,d,J=7Hz)
44）４－〔２－（３－アミノ－１－メチルプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.35(3H,d,J=7.5Hz),1.40-1.63(4H,m),1.67-1.80(2H,m),1.90-2.18(2H,m),2.22(3H,s),2.39(2H,t,J=7.5Hz),2.71(3H×1/2,s),2.74(3H×1/2,s),2.80-3.09(4H,m),3.18(3H,s),3.30-3.52(4H,m),3.77(3H,s),3.83-4.18(3H,m),4.42(1H,m),5.01(1H,m),6.64(1H,d,J=7Hz),6.81(1H,s),6.89(1H,d,J=7Hz),6.96(1H,s),7.03(1H,d,J=7Hz),7.12(1H,t,J=7Hz),7.34(1H,d,J=7Hz),7.58(1H,t,J=7Hz),8.03(1H,d,J=7Hz),8.28(1H,d,J=7Hz)
45）３－メトキシ－４－〔２－（ピリド－３－イル）メトキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.36-1.49(2H,m),1.49-1.60(2H,m),1.66-1.79(2H,m),2.20(3H,s),2.39(2H,t,J=7.5Hz),2.68(3H×1/2,s),2.70(3H×1/2,s),2.80-3.10(4H,m),3.16(3H,s),3.35(3H,s),3.35-3.60(2H,m),3.79-4.11(3H,m),4.41(1H,m),5.58(2H,s),6.64(1H,d,J=7Hz),6.80-6.90(3H,m),7.02(1H,d,J=7Hz),7.16(1H,t,J=7Hz),7.33(1H,d,J=7Hz),7.57(1H,t,J=7Hz),7.93-8.00(2H,m),8.19(1H,d,J=7Hz),8.55(1H,d,J=7Hz),8.88(1H,d,J=6Hz),9.04(1H,s)
46）４－〔２－（４－アミノブト－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.40-1.50(2H,m),1.50-1.61(2H,m),1.66-1.79(4H,m),1.86-1.95(2H,m),2.21(3H,s),2.39(2H,t,J=7.5Hz),2.73(3H×1/2,s),2.75(3H×1/2,s),2.79-3.10(4H,m),3.19(3H,s),3.31-3.52(4H,m),3.74(3H,s),3.82-4.12(3H,m),4.30(2H,t,J=7.5Hz),4.43(1H,m),6.65(1H,d,J=7Hz),7.81(1H,s),6.89(1H,d,J=7Hz),6.97(1H,s),7.03(1H,d,J=7Hz),7.12(1H,t,J=7Hz),7.30(1H,d,J=7Hz),7.58(1H,d,J=7Hz),8.04(1H,d,J=7Hz),8.30(1H,d,J=7Hz)
47）４－（２－ヒドロキシ－５－メチルベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.53-1.96(6H,m),2.29(3H,s),2.31(3H,s),2.33-2.40(2H,m),2.79(3H,s),3.30(3H,s),3.79(3H,s),3.80-4.03(2H,m),6.63(2H,br),6.88-6.98(4H,m),7.25(1H,d,J=8Hz),8.19(1H,d,J=8Hz),8.71(1H,br)
48）４－（２－ヒドロキシ－４－メトキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.48.1.92(6H,m),2.28(3H,s),2.32.2.45(2H,m),2.64-3.05(4H,m),2.79(3H,s),3.29(3H,s),3.29-3.51(4H,m),3.76(3H,s),3.80(3H,s),3.81-4.05(4H,m),6.43-6.50(2

H,m),6.61(1H,br),6.85-6.96(3H,m),7.36-7.43(1H,m),8.12-8.18(1H,m),8.58(1H,br)

実施例18

実施例４と同様にして調製した化合物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより分離して、次の化合物を得た。

１）４－（２－ベンジルオキシ）ベンゾイルアミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔（Ｅ）－２－（４－カルボキシフェニル）エテン－１－イル〕フェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):3.08(3H,s),3.41(3H,s),5.19(2H,s),6.47(1H,d,J=14Hz),6.58(1H,d,J=14Hz),6.73(2H,d,J=8Hz),6.84(1H,d,J=7Hz),6.90-7.10(5H,m),7.20-7.40(8H,m),7.71(2H,d,J=8Hz),8.26(1H,d,J=7Hz),8.38(1H,d,J=7Hz)

２）４－（２－ベンジルオキシ）ベンゾイルアミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔（Ｚ）－２－（４－カルボキシフェニル）エテン－１－イル〕フェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):3.09(3H,s),3.48(3H,s),5.25(2H,s),6.72-7.42(15H,m),7.51-7.64(3H,m),8.10(2H,d,J=8Hz),8.22(1H,d,J=7Hz),8.33(1H,d,J=7Hz)

実施例19

出発化合物として４－〔２－（アセトキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミドを用い、実施例４と同様にして、次の化合物を得た。

４－〔２－（ヒドロキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－（５－カルボキシペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.46-1.61(2H,m),1.63-1.90(4H,m),2.28(3H,s),2.39(2H,t,J=7Hz),3.33(3H,s),3.73-4.00(5H,m),6.61(2H,br s),6.82-7.11(5H,m),7.35-7.53(2H,m),8.16(1H,d,J=8Hz),8.75(1H,br s)

実施例20

実施例８と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－（４－メトキシベンジル）オキシベンゾイル」アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.27(3H,s),2.31(3H,s),2.35-2.53(4H,m),3.32(3H,s),3.39-3.54(2H,m),3.67-3.85(3H,m),3.82(3H,s),4.95(1H,d,J=14Hz),5.06(1H,d,J=14Hz),5.12(2H,s),6.59-6.67(2H,m),6.86-7.02(5H,m),7.07-7.21(4H,m),7.33-7.52(7H,m),8.28(1H,d,J=7Hz)

２）４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.46-1.60(2H,m),1.63-1.92(4H,m),2.30(3H,s),2.31-2.46(6H,m),3.28(3H,s),3.35(3H,s),3.44-3.54(2H,m),3.58-3.69(2H,m),3.80-4.04(2H,m),5.30(2H,s),6.73-7.22(8H,m),7.30-7.49(6H,m),8.19-8.28(1H,m),8.38(1H,d,J=9Hz)

３）４－〔２－（ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－２－クロロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.48-1.65(2H,m),1.65-1.97(4H,m),2.30(3H,s),2.32-2.48(6H,m),3.34(3H,s),3.43-3.56(2H,m),3.58-3.70(2H,m),3.97(2H,t,J=7Hz),5.16(2H,s),6.63-6,81(3H,m),6.96(1H,d,J=8Hz),7.02-7.20(5H,m),7.40-7.59(6H,m),8.24(1H,m)

４）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.42(9H,s),1.45-1.82(8H,m),2.10-2.19(2H,m),2.30(3H,s),2.31-2.41(6H,m),3.27-3.35(2H,m),3.43-3.50(5H,m),3.60-3.67(2H,m),3.82(3H,s),3.90(1H,t,J=7Hz),4.27(1H,t,J=7Hz),4.75-4.82(1H,br),6.76(2H,d,J=8Hz),6.82(1H,d,J=8Hz),6.95-7.04(3H,m),7.07-7.13(1H,m),7.47(1H,t,J=8Hz),8.22(1H,dd,J=1,8Hz),8.42(1H,d,J=8Hz)

ESI-MASS(m/z):746(M+H)

５）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニル）アミノプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.45-1.60(2H,m),1.65-1.74(2H,m),1.78-1.89(2H,m),2.04-2.15(2H,m),2.27(3H,s),2.30(3H,s),2.32-2.42(6H,m),3.27-3.39(2H,m),3.33(3H,s),3.44-3.50(2H,m),3.58-3.64(2H,m),3.82-4.00(2H,m),4.19(2H,t,J=7.5Hz),4.86(1H,br),6.55-6.62(2H,m),6.86(1H,d,J=7Hz),6.97(1H,d,J=7Hz),7.08(1H,t,J=7Hz),7.31(2H,d,J=8Hz),7.40-7.53(3H,m),8.13(1H,d,J=7Hz),9.88(1H,s)
６）４－（２－ヨードベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.43-1.54(2H,m),1.61-1.70(2H,m),1.74-1.86(2H,m),2.28(3H,s),2.28-2.41(6H,m),3.34(3H,s),3.44-3.50(2H,m),3.52-3.59(2H,m),3.73-3.99(2H,m),6,77-6.84(2H,m),7.03(1H,d,J=7Hz),7.10-7.19(2H,m),7.29-7.50(5H,m),7.80(1H,s),7.89(1H,d,J=7Hz)
７）４－（２－ジメチルアミノ－４－メチル）フェノキシメチル－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.58(2H,m),1.64-1.75(2H,m),1.77-1.88(2H,m),2.22(3H,s),2.25(3H,s),2.28(3H,s),2.31-2.41(6H,m),2.72(6H,s),3.32(3H,s),3.43-3.51(2H,m),3.58-3.67(2H,m),3.79-3.97(2H,m),5.02(2H,s),6.49-6.61(3H,m),6.71(1H,d,J=7Hz),7.80-7.85(2H,m),7.19(2H,d,J=8Hz),7.28(2H,d,J=8Hz)
８）４－（２－ベンジルオキシ）ベンゾイルアミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔（Ｅ）－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルエテン－１－イル〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.11-2.40(4H,m),2.17(3H,s),3.11(3H,s),3.18-3.38(2H,m),3.44(3H,s),3.49-3.68(2H,m),5.27(2H,s),6.41(1H,d,J=14Hz),6.56(1H,d,J=14Hz),6.70(2H,d,J=8Hz),6.88-7.48(16H,m),8.26(1H,d,J=7Hz),8.38(1H,d,J=7Hz)
９）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):0.93(3H,d,J=7.5Hz),0.98-1.14(2H,m),1.40(9H,s),1.42-1.87(8H,m),2.07-2.17(2H,m),2.25(3H,s),2.32(2H,t,J=7.5Hz),2.50(1H,m),2.97(1H,m),3.21-3.32(2H,m),3.32(1H,s),3,79(1H,s),3.79-4.00(4H,m),4.24(2H,t,J=7.5Hz),4.55(1H,m),4.84(1H,m),6.59(1H,d,J=7Hz),6.63(1H,s),6.85(1H,d,J=7Hz),6.92(1H,d,J=7Hz),6.95-7.13(3H,m),7.45(1H,t,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)
10）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－〔５－〔（２Ｓ）－カルバモイルピロリジン－１－イル〕カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.28-2.20(12H,m),1.39(9H,s),2.27(3H,s),3.19-3.25(2H,m),3.21(3H,s),3.25-3.61(2H,m),3.78(3H,s),3.81-4.03(2H,m),4.16-4.29(2H,m),4.57(1H,m),6.55-6.68(2H,m),6.80-7.13(5H,m),7.44(1H,t,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)
11）３－メトキシ－４－〔２－〔１－（第三級ブトキシカルボニル）ピペリジン－４－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.41-1.59(2H,m),1.46(9H,s),1.69-1.94(6H,m),2.00-2.13(2H,m),2.26(3H,s),2.29(3H,s),2.33-2.41(8H,m),2.96-3.17(2H,m),3.31(3H,s).3.45-3.51(2H,m),3.59-3.67(2H,m),3.74(3H,s),3.80-4.01(2H,m),4.68(1H,m),6.58-6.63(2H,m),6.85(1H,d,J=7Hz),6.90(1H,d,J=7Hz),6.99-7.11(2H,m),7.35-7.61(2H,m),8.19(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)

12）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノ－１－メチルプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.30(9H,s),1.31(3H,d,J=7.5Hz),1.45-2.10(8H,m),2.27(3H,s),2.29(3H,s),2.32-2.43(6H,m)3.20-3.30(2H,m),3.32(3H,s),3.45-3.50(2H,m),3.60-3.66(2H,m),3.79(3H,s),3.82-4.00(2H,m),4.72(1H,m),6.60(1H,d,J=7Hz),6.64(1H,s),6.81-6.93(2H,m),7.00-7.11(3H,m),7.43(1H,t,J=7Hz),8.21(1H,d,J=7Hz),8.42(1H,d,J=7Hz)

13）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－アミノカルボニルペント－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.42(9H,s),1.50-1.92(6H,m),2.12-2.26(2H,m),2.29(2H,t,J=5Hz),2.30(3H,s),3.30(2H,q,J=5Hz),3.35(3H,s),3.77(3H,s),3.80-4.02(2H,m),4.25(2H,t,J=5Hz),6.61-6.70(2H,m),6.93-7.15(6H,m),7.41-7.51(1H,m),8.20(1H,d,J=7Hz),8.42(1H,d,J=7Hz)

14）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－〔４－（第三級ブトキシカルボニル）ピペラジン－１－イル〕カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.49(9H,s),1.50-1.90(6H,m),2.12-2.23(2H,m),2.30(3H,s),2.39(2H,t,J=5Hz),3.30(2H,q,J=5Hz),3.33(3H,s),3.35-3.42(4H,m),3.44(4H,s),3.55-3.62(2H,m),3.80(3H,s),3.85-4.06(2H,m),4.24(2H,t,J=5Hz),4.93(1H,br),6.57-6.66(2H,m),6.85-7.13(6H,m),7.44-7.52(1H,m),8.20(1H,d,J=7Hz),8.41(1H,d,J=7Hz)

15）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－モルホリン－４－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.41(9H,s),1.50-1.88(6H,m),2.10-2.21(2H,m),2.30(3H,s),2.36(2H,t,J=5Hz),3.30(2H,q,J=5Hz),3.34(3H,s),347(2H,t,J=4Hz),3.58-3.70(6H,m),3.79(3H,s),3.84-4.03(2H,m),4.25(2H,t,J=5Hz),4.89(1H,br),6.56-6.68(2H,m),6.84-7.16(6H,m),7.41-7.51(2H,m),8.20(1H,d,J=8Hz),8.41(1H,d,J=8Hz)

16）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルホモピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.41(9H,s),1.46-1.97(8H,m),2.09-2.21(2H,m),2.29(3H,s),2.32(2H,t,J=5Hz),2.33(3H,s),2.52-2.66(4H,m),3.30(2H,q,J=5Hz),3.33(3H,s),3.50-3.69(4H,m),3.79(3H,s),3.84-4.03(2H,m),4.24(2H,t,J=5Hz),4.94(1H,br),6.56-6.67(2H,m),6.82-7.12(6H,m),7.40-7.49(1H,m),8.20(1H,d,J=7Hz),8.41(1H,d,J=8Hz)

17）４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（２－ジメチルアミノエト－１－イル）アミノカルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.42-1.59(4H,m),1.67-1.90(4H,m),1.97-2.32(4H,m),2.28(3H,s),2.34(6H,s),2.56(2H,br),3.25-3.42(4H,m),3.32(2H,s),3.50(1H,s),3.78-4.01(2H,m),3.80(3H,s),4.25(2H,t,J=6Hz),4.91(1H,br),6.52-6.76(3H,m),6.87-7.13(7H,m),7.45(1H,m),8.19(1H,d,J=8Hz),8.41(1H,br)

18）４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－〔Ｎ－（３－ジメチルアミノプロプ－１－イル）－Ｎ－メチルカルバモイルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.41(9H,s),1.50-1.96(6H,m),2.11-2.25(2H,m),2.27(3H,s).2.30-2.43(2H

,m),2.50(6H,s),2.91および3.02(計3H,s,回転異性体),3.08および3.32(計2H,q,回転異性体,J=5Hz),3.33(3H,s),3.43(2H,t,J=5Hz),3.79(3H,s),3.83-4.02(2H,m),4.25(2H,t,J=5Hz),6.57-6.68(2H,m),6.82-7.13(6H,m),7.42-7.50(1H,m),8.21(1H,d,J=8Hz),8.41(1H,d,J=8Hz)

19）４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－〔ビス（２－ヒロドキシエト－１－イル）アミノ〕カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.55-1.89(6H,m),2.11-2.20(2H,m),2.28(3H,s),2.40-2.56(2H,m),3.29(2H,t,J=5Hz),3.40-3.57(4H,m),3.68-4.02(6H,m),4.26(2H,t,J=5Hz),6.60-6.68(2H,m),6.90-7.15(6H,m),7.42-7.51(1H,m),8.19(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz)

20）４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（２，２－ジメチルヒドラジノ）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR(DMSO-d_6,δ):1.40(9H,s),1.45-1.90(6H,m),2.08-2.20(2H,m),2.28(3H,s),2.30-2.45(2H,m),2.51(3H,s),2.60(3H,s),3.29(2H,t,J=5Hz),3.33(3H,s),3.75(3H,s),3.79-4.02(2H,m),4.25(2H,t,J=5Hz),6.57-6.68(2H,m),6.80-7.14(5H,m),7.41-7.50(1H,m),8.21(1H,d,J=8Hz),8.40-8.48(1H,br)

21）４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（カルバモイルメチルアミノ）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.41(9H,s),1.50-1.90(6H,m),2.12-2.19(2H,m),2.28(3H,s),2.53(2H,t,J=5Hz),3.30(2H,t,J=5Hz),3.33(3H,s),3.80(3H,s),3.84-3.99(2H,m),4.05(2H,br),4.25(2H,t,J=5Hz),4.84(1H,br),6.58-6.67(2H,m),6.72-7.12(6H,m),7.42-7.50(1H,m),8.18-8.23(1H,m),8.41(1H,d,J=8Hz)

22）４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（カルバモイルエチルアミノ）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.41(9H,s),1.46-1.86(6H,m),2.12-2.25(4H,m),2.30(3H,s),2.41(2H,t,J=5Hz),3.30(1H,q,J=5Hz),3.37(3H,s),3.49(1H,q,J=5Hz),3.79(3H,s),3.92-4.03(2H,m),4.27(2H,t,J=5Hz),6.45-6.67(4H,m),6.88-7.15(6H,m),7.43-7.51(1H,m),8.20(1H,d,J=8Hz),8.41(1H,d,J=8Hz)

23）４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジエチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.12(6H,t,J=5Hz),1.41(9H,s),1.42-1.92(6H,m),2.10-2.18(2H,m),2.27(3H,s),2.27-2.69(9H,m),3.26(2H,t,J=5Hz),3.31(3H,s),3.77(3H,s),3.87-4.02(4H,m),4.23(2H,t,J=5Hz),6.54-6.67(2H,m),6.72-7.15(6H,m),7.42-7.51(1H,m),8.19(1H,d,J=8Hz),8.42(1H,d,J=8Hz)

24）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルピリド－６－イル〕メトキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.39(9H,s),2.06-2.18(2H,m),2.28(3H,s),2.31(3H,s),2.35-2.51(4H,m),3.27(2H,q,J=5Hz),3.38-3.49(2H,m),3.41(1H,s),3.63(3H,s),3.68-3.76(2H,m),4.21(2H,t,J=5Hz),4.97(1H,d,J=12Hz),5.14(1H,d,J=12Hz),6.58(1H,s),6.72(1H,d,J=8Hz),6.91-7.11(7H,m),7.20-7.25(1H,m),7.43(1H,dd,J=2,8Hz),7.68(1H,d,J=8Hz),8.19(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz),8.60(1H,s)

25）４－〔２－（ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ

－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.30-1.42(2H,m),1.48-1.58(2H,m),1.63-1.93(6H,m),2.29(6H,s),2.30-2.40(3H,m),2.50-2.60(1H,m),2.95-3.06(1H,m),3.29(3H,s),3.38(3H,s),3.80-4.00(4H,m),4.57-4.70(1H,m),5.30(2H,s),6.74-7.20(9H,m),7.32-7.45(5H,m),8.20-8.37(1H,m),8.37-8.42(1H,m)
26）４－〔（２－ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルプロプ－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.05-2.16(2H,m),2.28(3H,s),2.32-2.40(4H,m),2.50(2H,t,J=7.5Hz),3.33(3H,s),3.43-3,50(2H,m),3.59-3.65(2H,m),3.88-4.05(2H,m),5.19(2H,s),6.77-6.84(2H,m),6.95-7.02(3H,m),7.09-7.20(5H,m),7.39-7.52(6H,m),8.27(1H,d,J=7Hz)

実施例21

実施例８および16と同様にして、次の化合物を得た。
１）４－（６－ヒドロキシ－２－ピリジルカルボニル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.58(2H,m),1.64-1.73(2H,m),1.78-1.87(2H,m),2.27(3H,s),2.29(3H,s),2.28-2.41(8H,m),3.33(3H,s),3.45-3.51(2H,m),3.59-3.68(6H,m),3.86-3.94(1H,br),6.55-6.61(2H,m),6.86(1H,d,J=8Hz),7.30-7.38(4H,m),7.47-7.54(2H,m),8.06-8.10(1H,m)
ESI-MASS(m/z):574(M+H)
２）４－〔２－（メトキシ）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.36-1.66(4H,m),1.66-1.83(2H,m),2.23(3H,s),2.39(2H,t,J=7Hz),2.74(3H,s),2.80-3.10(3H,m),3.17(3H,s),3.23-3.53(3H,m),3.86(3H,s),3.79-3.99(2H,m),4.00-4.17(1H,m),4.37-4.52(1H,m),6.64(1H,d,J=9Hz),6.79(1H,s),6.98-7.09(2H,m),7.11-7.28(3H,m),7.43-7.64(4H,m)

実施例22

４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（327mg）とピリジン（80.3mg）とのジクロロメタン（6ml）溶液に、外界温度で、塩化２－ニトロベンゼンスルホニル（150mg）を滴下し、混合物を外界温度で５時間攪拌した。得られた混合物をジクロロメタン（10ml）で希釈し、有機層を飽和重炭酸ナトリウム水溶液および食塩水で順次洗った。乾燥し、▲濾▼過し、溶媒を除去して、粗製品を得た。この粗製品をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離剤；２～４％メタノール含有クロロホルム）に付して、４－（２－ニトロベンゼンスルホニル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（460mg）を得た。
NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.82(6H,m),2.28(3H,s),2.31(3H,s),2.35-2.42(6H,m),3.30(3H,s),3.46-3.53(5H,m),3.60-3.68(4H,m),6.56-6.96(6H,m),7.53-7.88(4H,m)

実施例23

４－〔２－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシ〕フェニル〕ビニル－３－メトキシ安息香酸（370mg）のテトラヒドロフラン（20ml）溶液を、外界温度で、トリエチルアミン（246mg）、Ｎ－メチル－４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕アニリン（297mg）およびジフェニルホスホロクロリデート（326mg）により処理した。反応混合物を80℃で18時間攪拌した。濃縮したのち、残留物をクロロホルムに溶解させ、食塩水で洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。粗製品をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(SiO_2 30ｇ、３％メタノール含有クロロホルム）により精製して、４－〔２－〔２－〔（３－（フタルイミド）プロプ

－１－イル）オキシ〕フェニル〕ビニル〕－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（550mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.95(8H,m),2.18-2.44(12H,m),3.31および3.34(計3H,s),3.42-3.52(2H,m),3.57-3.72(5H,m),3.82-4.16(6H,m),6.30-7.80(16H,m)

実施例24

実施例23と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔Ｎ－メチル－２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40-1.75(8H,m),1.44(9H,s),1.89-1.97(2H,m),2.29(6H,s),2.32-2.42(6H,m),3.24(6H,s),3.26-3.34(2H,m),3.44-3.67(6H,m),3.77-3.88(3H,m),6.48-6.82(9H,m),6.90-6.96(1H,m),7.06-7.13(1H,m)

ESI-MASS(m/z):774(M+H)

２）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－（４－ベンジルオキシフェニル）ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.42(9H,s),2.09-2.20(2H,m),3.28-3.37(2H,m),3.48(3H,s),3.81(3H,s),4.22-4.33(2H,m),4.70-4.78(1H,br),5.00(2H,s),6.82-6.88(3H,m),6.97-7.13(6H,m),7.31-7.48(6H,m),8.23(1H,d,J=8Hz),8.44(1H,d,J=8Hz)

ESI-MASS(m/z):640(M+H)

３）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－ベンジルオキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－シクロヘキシルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.01-1.12(2H,br),1.40(9H,s),1.45-1.82(10H,m),2.81-3.07(5H,m),3.80-3.89(2H,m),4.40-4.49(1H,m),5.18(2H,s),6.94(1H,d,J=8Hz),7.02(1H,d,J=8Hz),7.07-7.15(2H,m),7.35-7.48(6H,m),8.27(1H,d,J=8Hz),8.68(1H,d,J=8Hz)

ESI-MASS(m/z):616(M+H)

４）４－〔（２－ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－クロロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.30-1.45(2H,m),1.45-1.57(2H,m),1.62-1.93(6H,m),2.22-2.40(12H,m),2.50-2.63(1H,m),2.95-3.08(1H,m),3.31(3H,s),3.80-4.00(4H,m),4.58-4.70(1H,m),5.37(2H,s),6.56-6.62(2H,m),6.83-6.88(1H,m),7.02-7.13(3H,m),7.36-7.47(7H,m),8.27(1H,d,J=7Hz),8.42(1H,d,J=7Hz)

５）４－〔Ｎ－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕フェニル〕第三級ブトキシカルボニルアミノ〕メチル－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.30および1.33(計9H,s),1.43(9H,s),1.49-1.60(2H,m),1.62-1.98(6H,m),2.28(3H,s),2.30(3H,s),2.32-2.42(6H,m),3.20-3.29(2H,m),3.32(3H,s),3.39(1H,s),3.46-3.55(4H,m),3.62(2H,br),3.82(1H,br),3.88-4.03(3H,m),6.50-6.60(2H,m),6.65-7.00(6H,m),7.06-7.22(2H,m)

６）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕フェノキシ〕メチル－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.37(9H,s),1.47-1.57(2H,m),1.66-1.73(2H,m),1.73-1.88(2H,m),1.93-2.02(2H,m),2.28(3H,s),2.30(3H,s),2.32-2.40(6H,m),3.32(3H,m),3.25-3.38(2H,m),3.47-3.50(2H,m),3.62-3.67(2H,m),3.70(3H,s),3.80-3.88(1H,m),3.90-3.98(2H,m),4.07-4.17(2

H,m),5.10(2H,s),5.50(1H,br),6.53-6.60(2H,m),6.70-6.90(7H,m),7.15-7.20(1H,m)
７）３－ベンジルオキシ－４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.45-1.85(10H,m),2.28(3H,s),2.29(3H,s),2.32-2.39(6H,m),2.90-2.98(2H,m),3.30(3H,s),3.47-3.49(2H,m),3.60-3.63(2H,m),3.77-3.98(4H,m),4.97(2H,s),6.56-6.60(2H,m),6.80(1H,d,J=7Hz),6.89-6.97(2H,m),7.04-7.12(2H,m),7.33-7.45(6H,m),8.19(1H,d,J=6Hz),8.41(1H,d,J=7Hz)
８）２－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕－５－チオフェンカルボキシアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.37(9H,s),1.48-1.62(2H,m),1.62-1.76(6H,m),1.97-2.11(2H,m),2.17-2.38(9H,m),2.39(3H,s),3.31(3H,s),3.33-3.65(6H,m),3.87(1H,br),3.94(1H,br),4.02(1H,s),4.13-4.20(2H,m),6.40-6.57(2H,m),6.74-6.82(2H,m),6.92-7.14(3H,m),7.40-7.52(1H,m),8.10-8.27(1H,m)
実施例25
（Ｓ）－４－〔２－〔１－メチル－３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（1.1ｇ）のメタノール（30ml）溶液を攪拌し、40％メチルアミンメタノール溶液（10ml）で処理した。反応混合物を30分間還流下に加熱した。つぎに、溶媒を蒸発させて濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（SiO_2 40ｇ、クロロホルム／メタノール／アンモニア＝90／10／0.5）により精製して、（Ｓ）－４－〔２－〔（３－アミノ－１－メチルプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミドを得た。
NMR($CDCl_3$,δ):1.42(3H,d,J=7Hz),1.46-1.92(9H,m),1.98-2.16(1H,m),2.20-2.45(12H,m),2.86(2H,t,J=7Hz),3.32(3H,s),3.42-3.53(2H,m),3.57-3.67(2H,m),3.79(3H,s),3.82-4.03(2H,m),4.73-4.90(1H,m),6.51-6.68(2H,m),6.79-6.95(2H,m),6.98-7.12(3H,m),7.37-7.49(1H,m),8.21(1H,d,J=8Hz),8.41(1H,d,J=8Hz)
実施例26
４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イルオキシ）－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（3.5ｇ）の酢酸エチル（30ml）溶液を、外界温度で、トリエチルアミン（575mg）、Ｎ－メチルピペラジン（569mg）およびジフェニルホスホリルアジド（1.56ｇ）により処理した。反応混合物を同温度で17時間攪拌した。反応混合物を食塩水で洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。粗製品をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(SiO_2 100ｇ、３％メタノール含有クロロホルム)により精製して、４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（2.93ｇ）を得た。
NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.42-1.60(2H,m),1.62-1.90(4H,m),2.06-2.20(2H,m),2.22-2.42(12H,m),3.21-3.36(5H,m),3.42-3.51(2H,m),3.56-3.67(2H,m),3.77(3H,s),3.81-4.02(2H,m),4.23(2H,t,J=7Hz),4.86(1H,m),6.51-6.67(2H,m),6.79-6.93(2H,m),6.94-7.13(3H,m),7.44(1H,m),8.20(1H,d,J=8Hz),8.41(1H,d,J=8Hz)
実施例27
実施例26と同様にして、次の化合物を得た。

４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.41(9H,s),1.46-1.95(8H,m),2.06-2.42(16H,m),2.56(1H,m),3.00(1H,m),3.22-3.38(5H,m),3.79(3H,s),3.83-4.03(3H,m),4.25(2H,t,J=7Hz),4.61(1H,m),4.87(1H,m),6.52-6.68(2H,m),6.79-6.95(2H,m),6.96-7.17(3H,m),7.46(1H,m),8.21(1H,d,J=8Hz),8.41(1H,d,J=8Hz)

実施例28

４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（300mg）とＮ－メチルモルホリン（45mg）とのＮ,Ｎ－ジメチルホルムアミド（5ml）溶液に、-15℃で、クロロ蟻酸イソブチル（61mg）を加え、溶液を同温度で５分間攪拌した。溶液に、Ｎ,Ｎ,Ｎ’－トリメチルエチレンジアミン（54mg）を加え、混合物を-15℃で30分間攪拌し、つぎに、外界温度で１時間攪拌した。混合物を酢酸エチル（20ml）で希釈し、溶液を炭酸水素ナトリウム水溶液、水（15mlx3）および食塩水で順次洗った。溶液を炭酸カリウムで乾燥し、溶媒を減圧下で除去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(SiO_2 40ｇ、１～５％メタノール含有クロロホルム)により精製して、４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－〔（２－ジメチルアミノエト－１－イル）－Ｎ－メチルアミノカルボニル〕ペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（312mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.44-2.21(8H,m),2.25(3H,s),2.27(6H,s),2.29-2.50(4H,m),2.91(1H,s),3.00(2H,s),3.26-3.51(4H,m),3.31(3H,s),3.77(3H,s),3.81-4.02(2H,m),4.22(2H,t,J=5Hz),4.88(1H,br),6.52-6.68(2H,m),6.79-7.11(5H,m),7.43(1H,m),8.20(1H,d,J=9Hz),8.40(1H,d,J=8Hz)

実施例29

実施例28と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（３－ジメチルアミノプロプ－１－イル）アミノカルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.42-1.57(2H,m),1.61-1.85(6H,m),2.04-2.35(8H,m),2.25(3H,s),2.29(9H,s),2.46(2H,t,J=6Hz),3.20-3.38(4H,m),3.30(3H,s),3.76(3H,s),3.80-4.00(2H,m),4.24(2H,t,J=5Hz),4.90(1H,br),6.61-6.72(2H,m),6.84-7.12(6H,m),7.43(1H,d,J=8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.41(1H,d,J=8Hz)

２）４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－オキソピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.50-1.92(8H,m),2.15(2H,t,J=6Hz),2.29(2H,t,J=5Hz),2.38-2.51(6H,m),3.30(2H,t,J=5Hz),3.32(3H,s),3.70-4.05(6H,m),3.80(3H,s),4.25(2H,t,J=5Hz),4.85(1H,br),6.55-6.67(2H,m),6.83-7.15(6H,m),7.40-7.51(1H,m),8.20(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,br)

３）４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ピリジルアミノカルボニル）ペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.50-1.61(2H,m),1.75-1.93(4H,m),2.09-2.20(2H,m),2.30(3H,s),2.42(2H,br),3.30(1H,q,J=5Hz),3.36(3H,s),3.70(3H,s),3.72-4.00(2H,m),4.25(2H,t,J=5Hz),4.90(1H,br),6.60(1H,br),6.72(1H,d,J=8Hz),6.99-7.12(6H,m),7.43-7.51(1H,m),7.63(1H,d,J=8Hz),8.19(1H,d,J=8Hz),8.42(1H,d,J=7Hz),8.46(1H,br),9.22(1H,br)

実施例30

４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（250mg）とＮ－メチルモルホリン（37mg）とのジクロロメタン（５ml）溶液に、-15℃で、塩化ピバロイル（45mg）を加えた。同温度で５分間攪拌後、混合物に１－アミノ－４－メチルピペラジン（47mg）を加え、混合物を-15℃で１時間攪拌し、つぎに外界温度でさらに２時間攪拌した。生じた混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（20ml）中に注ぎ、溶液をクロロホルム（15mlx3）で抽出した。有機層を食塩水で洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を蒸発させ、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(SiO_2 30g、１～15%メタノール含有クロロホルム）により精製して、４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）アミノカルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（208mg）を得た。

NMR($CDCl_3$, δ):1.40(9H,s),1.45-1.90(6H,m),2.10-2.19(2H,m),2.24(3H,s),2.25(3H,s),2.51(2H,t,J=5Hz),2.54-2.91(8H,m),3.30(2H,t,J=5Hz),3.34(3H,s),3.75(3H,s),3.80-4.03(2H,m),4.24(2H,t,J=5Hz),4.78-4.97(1H,br),6.53-6.67(2H,m),6.73-7.14(6H,m),7.40-7.50(1H,m),8.21(1H,d,J=8Hz),8.45(1H,d,J=8Hz)

実施例31

実施例９と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－（Ｅ）－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルエテン－１－イル〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$, δ):1.48-1.59(2H,m),1.67-1.76(2H,m),1.79-1.87(2H,m),2.21(3H,s),2.26(3H,s),2.31(3H,s),2.31-2.44(10H,m),3.17-3.25(2H,m),3.34(3H,s),3.47-3.52(2H,m),3.56-3.67(3H,m),3.62(3H,s),3.82-3.99(3H,m),5.71(1H,m),6.60-6.67(2H,m),6.86(1H,d,J=7Hz),6.92(1H,d,J=7Hz),6.98-7.03(2H,m),7.14(1H,d,J=7Hz),7.43-7.62(4H,m),7.85(1H,d,J=7Hz)

２）４－〔２－〔（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルメトキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$, δ):1.30-1.90(6H,m),2.14(3H,s),2.26(3H,s),2.35-2.46(3H,m),3.34(3H,s),3.46-3.55(4H,m),3.59-3.68(4H,m),3.72(3H,s),3.80-4.01(2H,m),4.90(2H,s),6.58-6.68(2H,m),6.82-7.06(4H,m),7.13-7.20(2H,m),7.46-7.51(1H,m),8.19(1H,d,J=8Hz),8.39(1H,d,J=8Hz)

実施例32

４－（２－ヨードベンゾイル）アミノ－Ｎ－〔２－（４－メトキシフェニル）メトキシ〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド（2.30ｇ）のジクロロメタン（30ml）－トリフルオロ酢酸（15ml）混合物溶液を、外界温度で２時間攪拌し、溶媒を減圧下で蒸発させた。残留油状物をクロロホルム（50ml）に溶解させ、溶液を水（50ml）、炭酸水素ナトリウム水溶液（50ml）および食塩水（25ml）で順次洗った。溶液を硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧下で蒸発させて、４－（２－ヨードベンゾイル）アミノ－Ｎ－（２－ヒドロキシ）フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド（1.20ｇ）を得た。

NMR(DMSO-d_6, δ):3.20(3H,s),6.69(1H,t,J=7Hz),6.82(1H,d,J=7Hz),6.98-7.05(3H,m),7.40-7.54(4H,m),7.90(1H,d,J=7Hz),9.84(1H,s)

実施例33

実施例32と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベン

ズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.28(3H,s),2.32(3H,s),2.35-2.51(4H,m),3.36(3H,s),3.59-3.89(2H,m),5.02(2H,s),6.63-6.72(2H,m),6.88(1H,t,J=7Hz),7.00(2H,d,J=8Hz),7.20-7.46(9H,m),7.70(1H,d,J=7Hz),8.68(1H,s)
２）３－メトキシ－４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.23(3H,s),2.30(3H,s),2.33-2.51(4H,m),3.37(3H,s),3.41-3.56(2H,m),3.68(3H,s),3.72-3.87(2H,m),4.91(1H,d,J=14Hz),5.09(1H,d,J=14Hz),6.63-6.71(2H,m),6.35-6.93(2H,m),7.00(2H,d,J=8Hz),7.33-7.50(7H,m),8.14(1H,d,J=7Hz),8.72(1H,s)
３）４－〔２－（３－ヒドロキシプロプ－１－イル）チオベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.44-1.58(2H,m),1.61-1.73(2H,m),1.77-1.89(2H,m),2.28(3H,s),2.31-2.40(6H,m),3.02(2H,t,J=7.5Hz),3.31(3H,s),3.42-3.50(2H,m),3.56-3.65(2H,m),3.67-3.78(7H,m),3.81-4.01(2H,m),6.58-6.67(2H,m),6.81-6.95(2H,m),7.03(1H,s),7.25(1H,m),7.36-7.50(2H,m),7.64(1H,d,J=7Hz),8.30(1H,d,J=7Hz),8.77(1H,s)

実施例34

出発化合物として２－ニトロ－４－（２－ベンジルオキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミドを用い、実施例10と同様にして、次の化合物を得た。
２－アミノ－４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.21-2.02(10H,m),2.28-2.44(12H,m),2.48-2.69(1H,m),2.93-3.08(1H,m),3.30(3H,s),3.80-4.06(4H,m),4.68(1H,br),4.73(2H,s),5.32(1H,s),6.53-6.62(3H,m),6.78-6.96(5H,m),7.33-7.44(1H,m),7.78-7.88(1H,m)

実施例35

４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－（２－ベンジルオキシ－４－メチル）フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド（550mg）、１－（第三級ブトキシカルボニル）－４－ヒドロキシピペリジン（223mg）、アゾジカルボン酸ジエチル（193mg）およびトリフェニルホスフィン（291mg）のテトラヒドロフラン（15ml）溶液を、外界温度で８時間攪拌し、混合物を酢酸エチル（25ml）で希釈した。溶液を水および食塩水で洗い、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で蒸発させ、残留物をシリカゲルカラム（30％酢酸エチル含有ｎ－ヘキサン）により精製して、３－メトキシ－４－〔２－〔１－（第三級ブトキシカルボニル）ピペリジン－４－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－（２－ベンジルオキシ－４－メチル）フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド（562mg）を得た。
NMR($CDCl_3$,δ):1.44(9H,s),1.72-1.90(2H,m),1.95-2.12(2H,m),2.27(3H,s),2.95-3.16(4H,m),3.37(3H,s),3.60(3H,s),3.73-4.00(2H,m),4.64(1H,m),4.88(1H,d,J=14Hz),5.08(1H,d,J=14Hz),6.65-6.71(2H,m),6.86(1H,d,J=7Hz),6.95-7.03(3H,m),7.09(1H,t,J=7Hz),7.25-7.50(6H,m),8.18(1H,d,J=7Hz),8.35(1H,d,J=7Hz)

実施例36

実施例35と同様にして、次の化合物を得た。
１）（Ｓ）－４－〔２－〔１－メチル－３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.43(3H,d,J=7Hz),1.47-1,92(7H,m),1.98-2.13(1H,m),2.20-2.47(12H,m),

3.32(3H,s),3.42-3.53(2H,m),3.57-3.67(2H,m),3.73-4.05(7H,m),4.77(1H,m),6.51-6.69(2H,m),6.78-7.12(5H,m),7.42(1H,m),7.57(4H,s),8.08-8.24(2H,m)

２）（Ｒ）－４－〔２－〔〔４－（フタルイミド－１－イル）ブト－２－イル〕オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.44および1.47(計3H,s),1.52-1.92(8H,m),2.02-2.12(1H,m),2.28(3H,s),2.30(3H,s),2.33-2.42(6H,m),3.35(3H,s),3.47-3.53(2H,m),3.60-3.67(2H,m),3.80(3H,s),3.85-4.00(2H,br),3.88(2H,t,J=8Hz),4.74-4.82(1H,br),6.57-6.69(2H,m),6.81-6.95(2H,m),6.98-7.09(3H,m),7.43(1H,t,J=8Hz),7.53-7.60(4H,br),8.14(1H,d,J=8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz)

ESI-MASS(m/z):804(M+H)

３）（Ｒ）－４－〔２－〔〔４－（フタルイミド－１－イル）ブト－２－イル〕オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.42および1.45(計3H,s),1.50-1.90(12H,m),2.02-2.10(1H,m),2.28(9H,s),2.32-2.41(4H,m),2.52-2.62(1H,m),2.97-3.06(1H,m),3.35(3H,s),3.80(3H,s),3.87(2H,t,J=8Hz),3.90-3.97(2H,m),4.58-4.68(1H,m),4.72-4.81(1H,m),6.57-6.67(2H,m),6.81-6.93(2H,m),6.98-7.08(3H,m),7.43(1H,t,J=8Hz),7.53-7.59(4H,br s),8.13(1H,d,J=8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz)

４）（Ｓ）－４－〔２－〔〔４－（フタルイミド－１－イル）ブト－２－イル〕オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.42および1.44(計3H,s),1.50-1.91(12H,m),2.02-2.10(1H,m),2.29(9H,s),2.32-2.41(4H,m),2.52-2.62(1H,m),2.95-3.05(1H,m),3.36(3H,s),3.80(3H,s),3.86(2H,t,J=8Hz),3.90-3.97(2H,m),4.58-4.66(1H,m),4.72-4.80(1H,m),6.57-6.67(2H,m),6.81-6.92(2H,m),6.98-7.08(3H,m),7.44(1H,t,J=8Hz),7.53-7.60(4H,br s),8.13(1H,d,J=8Hz),8.21(1H,d,J=8Hz)

ESI-MASS(m/z):832(M+1)

５）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（フタルイミド）－１－メチルプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－（２－ベンジルオキシ－４－メチル）フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.41(3H,d,J=7.5Hz),1.96-2.12(2H,m),2.24(3H,s),2.27-2.42(2H,m),3.39(3H,s),3.60-3.69(2H,m),3.86(2H,t,J=7.5Hz),4.77(1H,m),4.94(1H,d,J=14Hz),5.08(1H,d,J=14Hz),6.66-6.82(3H,m),6.95-7.08(4H,m),7.20-7.71(10H,m),8.10-8.21(2H,m)

実施例37

実施例14と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－（３－アセチルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－（２－アセトキシ－４－メチルフェニル）－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.86(3H,s),2.10-2.19(2H,m),2.30(3H,s),3.41(2H,q,J=5Hz),3.72(3H,s),4.21(2H,t,J=5Hz),5.94(1H,br),6.85(1H,s),6.90-7.11(6H,m),7.42-7.49(1H,m),8.10(1H,d,J=8Hz),8.42(1H,d,J=8Hz)

２）４－〔２－（３－アセチルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.48-1.64(2H,m),1.58-1.85(4H,m),1.88(3H,s),2.12(2H,t,J=5Hz),2.29(6H,s),2.34-2.42(2H,m),2.57(2H,t,J=5Hz),3.30(2H,q,J=5Hz),3.32(3H,s),3.39(2H,q,J=5Hz),3.72-3.79(2H,m),3.76(3H,s),3.83-4.00(2H,m),4.20(2H,t,J=5Hz),6.33(1H,br),6.57-

6.67(2H,m),6.83-7.10(6H,m),7.43(1H,dd,J=2.7Hz),8.10(1H,d,J=8Hz),8.38(1H,d,J=8Hz)

実施例38

氷浴で冷却した４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド（650mg）のジクロロメタン（20ml）溶液に、トリエチルアミン（137mg）および二炭酸ジ第三級ブチル（296mg）を加え、混合物を外界温度で一夜攪拌した。溶液を水、10％塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水で順次洗い、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で蒸発させて、４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド（749mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.25(3H,t,J=7.5Hz),1.40(9H,s),1.44-1.56(2H,m),1.66-1.76(2H,m),1.76-1.87(2H,m),2.06-2.15(2H,m),2.28(3H,s),2.34(2H,t,J=7.5Hz),3.31(3H,s),3.31-3.40(2H,m),3.85-3.97(2H,m),4.13(2H,q,J=7.5Hz),4.21(2H,t,J=7.5Hz),4.74(1H,br),6.54-6.62(2H,m),6.86(1H,d,J=7Hz),6.98(1H,d,J=7Hz),7.09(1H,d,J=7Hz),7.32(2H,d,J=8Hz),7.41-7.52(3H,m),8.11(1H,d,J=7Hz),9.87(1H,s)

実施例39

実施例38と同様にして、次の化合物を得た。

３－メトキシ－４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノ－１－メチルプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－（２－ベンジルオキシ－４－メチル）フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.37(9H,s),1.41(3H,d,J=7.5Hz),1.84-2.11(2H,m),2.28(3H,s),3.20-3.31(2H,m),3.40(3H,s),3.64(3H,s),4.61(1H,br),4.72(1H,m),4.90(1H,d,J=14Hz),5.09(1H,d,J=14Hz),6.62-6.70(2H,m),6.84(1H,d,J=7Hz),6.93-7.12(4H,m),7.28-7.72(6H,m),8.22(1H,d,J=7Hz),8.38(1H,d,J=7Hz)

実施例40

４Ｍ硫酸水溶液（0.5ml）と３－（フタルイミド－１－イル）プロパナール（189mg）とのテトラヒドロフラン（10ml）溶液を、４－（２－アミノベンゾイルアミノ）－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニルベンズアミド（560mg）のテトラヒドロフラン（10ml）溶液に加え、続いて、０℃で、水素化硼素ナトリウム（59.8mg）を少量ずつに分割して加えた。混合物を１，４－ジオキサン（5ml）で希釈し、外界温度でさらに1.5時間攪拌した。混合物に水（0.5ml）を加えて反応を終焉させ、濃縮した。残留物を酢酸エチルと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液とに分配した。有機抽出液を食塩水で洗い、硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(SiO_2、30ｇ、３％メタノール含有クロロホルム）により精製して、３－メトキシ－４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕アミノ〕ベンゾイルアミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（200mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.44-1.62(2H,m),1.63-1.93(4H,m),1.97-2.12(2H,m),2.21-2.46(12H,m),3.17-3.38(5H,m),3.42-3.56(2H,m),3.57-3.69(2H,m),3.70-4.04(7H,m),6.51-6.73(4H,m),6.78-6.96(2H,m),7.00(1H,s),7.20-7.35(1H,m),7.40(1H,d,J=8Hz),7.53-7.67(3H,m),7.72-7.86(2H,m),8.13(1H,d,J=8Hz),8.34(1H,s)

実施例41

４－（２－ニトロベンゾイル）アミノ－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（800mg）、20％水酸化パラジウム（200mg）のエタノール（20ml）溶液を、外界温度で、大気圧の水素下に攪拌した。２時間後、反応混合物をセライト層を通して▲濾▼過し、溶媒を回転蒸発により除去し、粗製品をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(SiO_2 30ｇ、酢酸エチル／ヘキサン＝３／１）により精製して、４－（２－アミノベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－

〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（700mg）を得た。
NMR($CDCl_3$,δ):1.25(3H,t,J=7Hz),1.41-1.57(2H,m),1.63-1.87(4H,m),2.27(3H,s),2.33(2H,t,J=7Hz),3.32(3H,s),3.78-4.00(2H,m),4.12(2H,q,J=7Hz),5.38-5.56(2H,m),6.55-6.64(2H,m),6.64-6.76(2H,m),6.87(1H,d,J=9Hz),7.22(1H,d,J=9Hz),7.28-7.50(5H,m),7.79(1H,br s)

実施例42

製造例４と同様にして、次の化合物を得た。
４－（２－アミノベンゼンスルホニル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.45-1.54(2H,m),1.65-1.82(4H,m),2.30(3H,s),2.33(3H,s),2.35-2.43(6H,m),3.29(3H,s),3.46-3.51(5H,m),3.60-3.65(4H,m),4.84-4.89(2H,m),6.56-6.89(6H,m),7.28-7.48(4H,m)
ESI-MASS(m/z):638(M+H)

実施例43

４－〔２－（アセチルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（400mg）のメタノール（10ml）溶液を、外界温度で、１Ｎ水酸化ナトリウム溶液（３ml）で処理した。６時間後、反応混合物を減圧下で濃縮し、ジクロロメタン－希塩酸混合物で抽出した。有機層を食塩水で洗い、硫酸ナトリウムで乾燥した。粗製品をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(SiO_2 30ｇ、５％メタノール含有クロロホルム）により精製して、４－〔２－（ヒドロキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（290mg）を得た。
NMR($CDCl_3$,δ):1.27-2.00(10H,m),2.21-2.46(12H,m),2.56(1H,m),3.00(1H,m),3.33(3H,s),3.80(3H,s),3.82-4.05(4H,m),4.63(1H,m),6.55-6.68(2H,m),6.82-7.09(5H,m),7.42(1H,m),7.55(1H,m),8.20(1H,m)

実施例44

実施例43と同様にして、次の化合物を得た。
１）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.26(3H,t,J=7Hz),1.42-1.58(2H,m),1.61-1.90(4H,m),2.28(3H,s),2.33(2H,t,J=7Hz),3.32(3H,s),3.80(3H,s),3.81-4.02(2H,m),4.12(2H,q,J=7Hz),6.53-6.67(2H,m),6.80-6.98(3H,m),7.01(1H,d,J=8Hz),7.07(1H,s),7.42(1H,dd,J=8,8Hz),7.49(1H,d,J=8Hz),8.18(1H,d,J=8Hz),8.72(1H,s)
２）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチルフェニル）ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.21(3H,s),3.40(3H,s),3.78(3H,s),6.82-7.23(9H,m),7.37-7.53(2H,m),8.18(1H,d,J=8Hz),8.69(1H,br s)
３）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.42-1.59(2H,m),1.60-1.89(4H,m),2.20-2.46(12H,m),3.32(3H,s),3.42-3.53(2H,m),3.57-3,69(2H,m),3.71-4.02(6H,m),6.51-6.68(2H,m),6.79-7.08(5H,m),7.40(1H,m),7.51(1H,d,J=8Hz),8.18(1H,d,J=8Hz),8.86(1H,br s)
４）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－（２－ベンジルオキシ－４－メチルフェニル）－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.30(3H,s),3.38(3H,s),3.63(3H,s),4.89(1H,d,J=13Hz),5.08(1H,d,J=13H

z),6.62-6.68(2H,m),6.82-7.00(6H,m),7.28-7.42(5H,m),7.47(1H,d,J=8Hz),8.13(1H,d,J=8Hz),8.79(1H,s)

５）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（２－オキサゾリン－２－イル）フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.28(3H,s),3.40(3H,s),3.67(3H,s),4.06(2H,t,J=10Hz),4.41(2H,t,J=10Hz),4.92(1H,d,J=12Hz),5.10(1H,d,J=12Hz),6.60(1H,s),6.71(1H,d,J=8Hz),6.87-7.08(5H,m),7.28(1H,d,J=8Hz),7.42(1H,dd,J=2,8Hz),7.52(1H,d,J=8Hz),8.16(1H,d,J=8Hz),8.82(1H,s)

６）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メチル－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.48(2H,br),1.60-1.81(4H,m),2.19(3H,s),2.28(3H,s),2.30-2.35(3H,m),2.38(3H,s),2.50(4H,br),3.30(3H,s),3.52(2H,br),3.69(2H,br),3.83(1H,br),3.92(1H,br),6.62(2H,s),6.89-6.93(2H,m),7.02-7.10(2H,m),7.35(1H,s),7.40-7.47(1H,m),7.63-7.70(2H,m),8.52(1H,br)

実施例45

４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド（542mg）の90％トリフルオロ酢酸（10ml）溶液を、外界温度で３時間攪拌し、溶媒を減圧下で蒸発させた。残留物をクロロホルム（20ml）および飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（10ml）とともに攪拌し、有機層を分離した。溶液を食塩水で洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で蒸発させて、４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド（465mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.59(2H,m),1.67-2.00(6H,m),2.06-2.66(2H,m),2.35(3H,s),2.39(3H,s),2.32-2.41(4H,m),2.96(2H,t,J=7.5Hz),3.31(3H,s),3.45-3.50(2H,m),3.58-3.65(2H,m),3.89-3.99(2H,m),4.29(2H,d,J=7.5Hz),6.54-6.62(2H,m),6.85(1H,d,J=7Hz),7.01(1H,d,J=7Hz),7.10(1H,t,J=7Hz),7.32(2H,d,J=8Hz),7.43-7.50(3H,m),8.20(1H,d,J=7Hz)

実施例46

実施例45と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40-1.92(6H,m),1.98-2.12(2H,m),2.19-2.44(12H,m),2.90(2H,t,J=7Hz),3.32(3H,s),3.40-3.53(2H,m),3.56-3.68(2H,m),3.78(3H,s),3.80-4.02(2H,m),4.28(2H,t,J=7Hz),6.51-6.67(2H,m),6.78-6.95(2H,m),6.97-7.16(3H,m),7.44(1H,m),8.21(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz)

２）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.26-1.92(12H,m),1.98-2.12(2H,m),2.27(9H,s),2.29-2.42(3H,m),2.56(1H,m),2.89(2H,t,J=7Hz),3.00(1H,m),3.32(3H,s),3.78(3H,s),3.82-4.02(3H,m),4.27(2H,t,J=7Hz),4.61(1H,m),6.52-6.67(2H,m),6.79-6.96(2H,m),6.97-7.12(3H,m),7.43(1H,m),8.21(1H,d,J=8Hz),8.41(1H,d,J=8Hz)

３）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):0.95(3H,d,J=7.5Hz),1.00-1.14(2H,m),1.46-1.90(8H,m),2.01-2.12(2H,m)

,2.26(3H,s),2.34(2H,t,J=7.5Hz),2.52(1H,m),2.85-3.03(3H,m),3.31(3H,s),3.79(3H,s),3.79-4.00(4H,m),4.32(2H,t,J=7.5Hz),4.55(1H,m),6.58(1H,d,J=7Hz),6.62(1H,s),6.84(1H,d,J=7Hz),6.90(1H,d,J=7Hz),7.00-7.11(3H,m),7.42(1H,t,J=7Hz),8.21(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)

４）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔５－〔（２Ｓ）－カルバモイルピロリジン－１－イル〕カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.48-2.20(12H,m),2.28(3H,s),2.32-2.40(2H,m),2.88-3.00(2H,m),3.31(3H,s),3.33-3.61(2H,m),3.80(3H,s),3.82-3.99(2H,m),4.29(2H,t,J=7Hz),4.54(1H,m),6.52-6.63(2H,m),6.81-7.10(5H,m),7.43(1H,t,J=7Hz),8.14(1H,d,J=7Hz),8.38(1H,d,J=7Hz)

５）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－アミノブト－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.63-1.94(4H,m),1.99-2.18(2H,m),2.23(3H,s),2.62-3.07(2H,m),3.29(3H,s),3.29-3.51(2H,m),3.75-4.00(2H,m),3.76(3H,s),4.21(2H,t,J=7.5Hz),6.56-6.85(4H,m),7.28-7.62(2H,m),8.13(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)

６）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－アセチルアミノブト－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.60-1.86(4H,m),2.00(3H,s),2.08-2.20(2H,m),2.27(3H,s),2.93-3.03(2H,m),3.30(3H,s),3.30-3.50(2H,m),3.77(3H,s),3.83-3.98(2H,m),4.26(2H,t,J=7.5Hz),6.53-6.65(2H,m),6.86-7.12(5H,m),7.42(1H,t,J=7Hz),8.12(1H,d,J=7Hz),8.37(1H,d,J=7Hz)

７）３－メトキシ－４－〔２－（ピペリジン－４－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－（２－ヒドロキシ－４－メチル）フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR(DMSO-d_6,δ):1.50-1.62(2H,m),1.94-2.05(2H,m),2.14(3H,s),2.57(2H,t,J=7.5Hz),2.91-3.00(2H,m),3.16(3H,s),3.75(3H,s),4.73(1H,m),6.48(1H,d,J=7Hz),6.64(1H,s),7.87(1H,d,J=7Hz),7.92(1H,d,J=7Hz),7.01(1H,s),7.09(1H,t,J=7Hz),7.32(1H,d,J=7Hz),7.52(1H,t,J=7Hz),8.02(1H,d,J=7Hz),8.27(1H,d,J=7Hz)

８）３－メトキシ－４－〔２－（ピペリジン－４－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.46-1.88(8H,m),2.07-2.19(2H,m),2.26(3H,s),2.29(3H,s),2.32-2.41(6H,m),2.72(2H,t,J=7.5Hz),3.10-3.20(2H,m),3.32(3H,s),3.45-3.50(2H,m),3.60-3.66(2H,m),3.80(3H,s),3.83-4.00(2H,m),4.57(1H,m),6.58(1H,d,J=7Hz),6.62(1H,s),6.82-6.91(2H,m),6.98-7.11(3H,m),7.43(1H,t,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)

９）４－〔２－（３－アミノ－１－メチルプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.42(3H,d,J=7.5Hz),1.46-1.89(6H,m),1.99-2.11(2H,m),2.28(3H,s),2.30(3H,s),2.31-2.42(6H,m),2.85(2H,t,J=7.5Hz),3.33(3H,s),3.45-3.50(2H,m),3.59-3.66(2H,m),3.80(3H,s),3.84-4.01(2H,m),4.80(1H,m),6.59(1H,d,J=7Hz),6.63(1H,s),6.82-6.92(2H,m),7.01-7.10(3H,m),7.44(1H,t,J=7Hz),8.22(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)

10）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－アミノカルボニルペント－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40-1.59(2H,m),1.61-1.90(4H,m),2.11-2.30(4H,m),2.35(3H,s),3.00(2H,t,J=6Hz),3.11(2H,br),3.29(3H,S),3.75(3H,s),3.76-4.02(2H,m),4.23(2H,t,J=5Hz),6.00(1H,br),6.50(1H,br),6.55-6.71(2H,m),6.87-7.12(5H,m),7.42(1H,dd,J=2,7Hz),8.10(1H,d,J=9Hz),8.36(1H,d,J=8Hz)

11）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキ

シ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（モルホリン－４－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):1.48-1.90(6H,m),2.11(2H,t,J=5Hz),2.26(3H,s),2.21-2.52(6H,m),2.79-2.90(3H,m),2.96(2H,t,J=5Hz),3.31(3H,s),3.40-3.49(2H,m),3.52-3.62(2H,m),3.80(3H,s),3.83-4.04(2H,m),4.29(2H,t,J=5Hz),6.57-6.68(2H,m),6.81-7.12(6H,m),7.41-7.50(1H,m),8.17(1H,d,J=8Hz),8.39(1H,d,J=8Hz)
12）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－オキソピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):1.45-2.05(8H,m),2.11(2H,t,J=5Hz),2.28(3H,s),2.41-2.52(2H,m),2.96(2H,t,J=5Hz),3.31(3H,s),3.70-4.61(8H,m),6.52-7.55(8H,m),8.02-8.46(3H,m)
13）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－（２－メトキシ－４－メチルフェニル）－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR(DMSO-d$_6$,δ):1.90-1.98(2H,m),2.25(3H,s),2.71(2H,t,J=6Hz),3.19(3H,s),3.73(3H,s),4.32(2H,t,J=5Hz),6.67(1H,d,J=8Hz),6.80-6.96(2H,m),7.26(1H,d,J=8Hz),7.55(1H,dd,J=2,8Hz),8.03(1H,d,J=8Hz),8.29(1H,d,J=8Hz)
14）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（チアゾール－２－イル）フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):2.02-2.10(2H,m),2.29(3H,s),2.89(2H,t,J=5Hz),3.40(3H,s),3.64(3H,s),4.25(2H,t,J=5Hz),4.90(1H,d,J=11Hz),5.09(1H,d,J=11Hz),6.62-6.71(2H,m),6.88(1H,d,J=8Hz),6.98-7.10(5H,m),7.24-7.48(4H,m),7.81(1H,d,J=3Hz),7.95(1H,d,J=8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.37(1H,d,J=8Hz)
15）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（オキサゾール－２－イル）フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):2.00-2.11(2H,m),2.29(3H,s),2.89(2H,t,J=5Hz),3.40(3H,s),3.66(3H,s),4.91(1H,d,J=12Hz),5.10(1H,d,J=12Hz),6.64(1H,s),6.70(1H,d,J=8Hz),6.87(1H,d,J=8Hz),7.00-7.12(4H,m),7.21(1H,s),7.25-7.49(4H,m),7.65(1H,s),8.04(1H,d,J=8Hz),8.23(1H,d,J=8Hz),8.37(1H,d,J=8Hz)
16）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（２－オキサゾリン－２－イル）フェニルメチル〕オキシメチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):2.02-2.11(2H,m),2.28(3H,s),2.90(2H,t,J=5Hz),3.39(3H,s),3.67(3H,s),4.05(2H,t,J=9Hz),4.29(2H,t,J=5Hz),4.41(2H,t,J=5Hz),4.89(1H,d,J=12Hz),5.09(1H,d,J=12Hz),6.63(1H,s),6.70(1H,d,J=8Hz),6.84(1H,d,J=8Hz),7.00-7.12(4H,m),7.37(2H,d,J=8Hz),7.41(1H,d,J=8Hz),7.93(2H,d,J=5Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.36(1H,d,J=8Hz)
17）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（ピリミジン－２－イル）フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):2.05-2.14(2H,m),2.27(3H,s),2.89(2H,t,J=5Hz),3.38(3H,s),3.64(3H,s),4.24(2H,t,J=5Hz),4.94(1H,d,J=13Hz),5.12(1H,d,J=13Hz),6.65-6.72(2H,m),6.85(1H,d,J=8Hz),6.97-7.18(5H,m),7.39-7.46(3H,m),8.13(1H,d,J=8Hz),8.35(1H,d,J=8Hz),8.41(2H,d,J=8Hz),8.24(2H,d,J=3Hz)
18）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－シアノフェニルメチル）オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR(CDCl$_3$,δ):2.09-2.20(2H,m),2.28(3H,s),2.97(2H,t,J=5Hz),3.35(3H,s),3.65(3H,s),4.24(2H,br),4.88(1H,d,J=12Hz),5.06(1H,d,J=12Hz),6.57(1H,s),6.67-6.80(2H,m),6.95-7.08(5H,m),7.35-7.45(3H,m),7.62(2H,d,J=8Hz),8.11(1H,d,J=8Hz),8.30(1H,d,J=8Hz)

19）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（２－ジメチルアミノエト－１－イル）オキシカルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.60(2H,m),1.67-1.88(4H,m),2.05-2.14(2H,m),2.27(9H,s),2.38(2H,t,J=6Hz),2.58(2H,t,J=5Hz),2.92(2H,t,J=5Hz),3.33(3H,s),3.80(3H,s),3.86-4.00(2H,m),4.19(2H,t,J=5Hz),4.30(2H,t,J=5Hz),6.57-6.67(2H,m),6.87(1H,dd,J=2,8Hz),7.00-7.11(4H,m),7.44(1H,dd,J=2,8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.38(1H,d,J=8Hz)
20）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－（２－ヒドロキシ－４－メチルフェニル）－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($DMSO\text{-}d_6$,δ):1.92-2.03(2H,m),2.16(3H,s),2.75(2H,t,J=5Hz),3.20(3H,s),3.75(3H,s),4.34(2H,t,J=5Hz),6.49(1H,d,J=8Hz),6.66(1H,s),6.87(1H,d,J=8Hz),6.92(1H,d,J=8Hz),7.12(1H,dd,J=7,8Hz),7.29(1H,d,J=8Hz),7.58(1H,dd,J=2,8Hz),8.05(1H,d,J=8Hz),8.27(1H,d,J=8Hz)
21）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（１，５－ジメチル－３－シアノピロール－２－イル）フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.00-2.11(2H,m),2.14(3H,s),2.21(3H,s),2.89(2H,t,J=5Hz),3.40(3H,s),3.45(3H,s),3.62(3H,s),4.27(2H,t,J=5Hz),4.89(1H,d,J=13Hz),5.13(1H,d,J=13Hz),6.22(1H,s),6.68-6.75(2H,m),6.89(1H,d,J=8Hz),7.00-7.12(5H,m),7.38-7.47(6H,m),8.19(1H,d,J=8Hz),8.38(1H,d,J=8Hz)
22）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（Ｎ，Ｎ－ジメチルウレイド）ブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.62-1.88(4H,m),1.90-2.15(2H,m),2.27(3H,s),2.86-2.94(2H,m),2.90(6H,s),3.22-3.35(2H,m),3.31(3H,s),3.77(3H,s),3.75-3.98(2H,m),4.27(2H,t,J=5Hz),6,57-6.70(2H,m),6.88-7.11(6H,m),7.42(1H,dd,J=2,8Hz),8.19(1H,d,J=8Hz),8.38(1H,d,J=8Hz)
23）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルピリド－６－イル〕メトキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.09-2.20(2H,m),2.28(3H,s),2.31(3H,s),2.34-2.52(4H,m),2.96(2H,t,J=5Hz),3.40(3H,s),3.42-3.50(2H,m),3.69(3H,s),3.70-3.84(2H,m),4.29(2H,t,J=5Hz),4.98(1H,d,J=13Hz),5.18(1H,d,J=13Hz),6.62(1H,s),6.72(1H,d,J=8Hz),6.98-7.11(5H,m),7.26-7.34(1H,m),7.45(1H,dd,J=2,8Hz),7.73(1H,d,J=8Hz),8.16(1H,d,J=8Hz),8.36(1H,d,J=8Hz),8.63(1H,s)
24）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（３－ジメチルアミノプロプ－１－イルオキシカルボニル）アミノブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.62-1.87(6H,m),2.02-2.11(2H,m),2.27(6H,s),2.41(2H,t,J=5Hz),2.91(2H,t,J=5Hz),3.22(2H,q,J=5Hz),3.30(3H,s),3.78(3H,s),3.84-3.95(2H,m),4.08(2H,t,J=5Hz),4.27(2H,t,J=5Hz),6.60-6.66(2H,m),6.90(1H,d,J=8Hz),6.99-7.10(3H,m),7.44(1H,dd,J=2,8Hz),8.18(1H,d,J=8Hz),8.38(1H,d,J=8Hz)
25）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルホモピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.50-2.18(8H,m),2.30(3H,s),2.32(2H,t,J=5Hz),2.33(3H,s),2.53-2.70(4H,m),2.93(2H,t,J=5Hz),3.35(3H,s),3.52-3.72(4H,m),3.80(3H,s),3.82-4.09(2H,m),4.31(2H,t,J=5Hz),6.55-6.70(2H,m),6.82-7.18(6H,m),7.42-7.53(1H,m),8.20(1H,d,J=8Hz),8.41(1H,d,J=8Hz)
26）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（２－ジメチルアミノエチル）アミノカルボニルペン

ト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.45-1.60(2H,m),1.66-2.15(8H,m),2.22(6H,s),2.26(3H,s),2.41(2H,t,J=5Hz),3.22-3.39(2H,m),3.31(3H,s),3.70-4.00(2H,m),3.78(3H,s),4.28(2H,t,J=5Hz),6.37(1H,br),6.59(2H,br),6.81-7.13(6H,m),7.42(1H,dd,J=2,8Hz),8.18(1H,d,J=8Hz),8.36(1H,d,J=8Hz)

27）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－〔Ｎ－（２－ジメチルアミノエチル）－Ｎ－メチルアミノカルボニル〕ペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.44-2.21(8H,m),2.25(3H,s),2.27(6H,s),2.29-2.50(4H,m),2.91(1H,s),3.00(2H,s),3.26-3.51(4H,m),3.31(3H,s),3.77(3H,br s),3.81-4.02(2H,m),4.22(2H,t,J=5Hz),4.88(1H,br),6.52-6.68(2H,br),6.79-7.11(5H,m),7.43-7.50(1H,m),8.20(1H,d,J=8Hz),8.39(1H,d,J=8Hz)

28）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－〔Ｎ－（３－ジメチルアミノプロプ－１－イル）カルバモイル〕ペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.46-1.60(2H,m),1.63-1.99(8H,m),2.03-2.14(2H,m),2.21(2H,t,J=5Hz),2.24(6H,s),2.29(3H,s),2.39(2H,t,J=5Hz),2.90(2H,t,J=6Hz),3.25-3.37(2H,m),3.32(3H,s),3.79(3H,s),3.81-4.01(2H,m),4.30(2H,t,J=5Hz),6.61(2H,br),6.85-7.14(6H,m),7.39-7.50(1H,m),8.20(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,br)

29）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－〔Ｎ－（３－ジメチルアミノプロプ－１－イル）－Ｎ－メチルカルバモイル〕ペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.52-1.94(6H,m),2.05-2.14(2H,m),2.20(3H,s),2.21(3H,s),2.26(3H,s),2.20-2.45(6H,s),2.90(2H,t,J=5Hz),2.91および2.99(計3H,s,回転異性体),3.32(3H,s),3.40(2H,t,J=5Hz),3.80(3H,s),4.31(2H,t,J=5Hz),6.55-6.67(2H,m),7.41-7.49(2H,m),8.21(1H,d,J=8Hz),8.42(1H,d,J=8Hz)

30）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ヒドロキシピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.43-1.95(6H,m),2.03-2.51(8H,m),2.29(3H,s),2.94(2H,t,J=5Hz),2.98-3.22(4H,m),3.32(3H,s),3.46-3.58(1H,m),3.79(3H,s),3.80-4.26(6H,m),4.28(2H,t,J=5Hz),6.56-6.67(2H,m),6.81-7.13(6H,m),7.36(1H,dd,J=8,8Hz),8.10-8.20(1H,m),8.33-8.49(1H,m)

31）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－アミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.51-2.03(6H,m),2.09-2.19(2H,m),2.27(3H,s),2.29-2.42(4H,m),2.59-2.71(2H,m),2.94(2H,t,J=5Hz),2.96-3.11(3H,m),3.33(3H,s),3.78(3H,s),3.85-4.02(2H,m),4.22(2H,t,J=5Hz),6.55-6.67(2H,m),6.81-7.12(6H,m),7.44(1H,dd,J=8,8Hz),8.19(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz)

32）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）アミノカルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.46-1.89(6H,m),1.93-2.05(4H,m),2.25(6H,s),2.49(2H,t,J=5Hz),2.52-2.62(2H,m),2.79-2.89.(2H,m),2.92(2H,t,J=5Hz),3.31(3H,s),3.79(3H,s),3.80-4.01(2H,m),4.28(2H,t,J=5Hz),6.56-6.64(2H,m),6.80-7.12(6H,m),7.41-7.50(1H,m),8.18(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz)

33）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－〔ビス（２－ヒドロキシエト－１－イル）アミノカルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.54-1.91(6H,m),2.11-2.20(2H,m),2.26(3H,s),2.38-2.59(4H,m),3.40-3.57(4H,m),3.61-3.97(6H,m),4.22(2H,t,J=5Hz),6.60-6.68(2H,m),6.88-7.16(6H,m),7.44-7.54(1H,m),8.12(1H,d,J=8Hz),8.41(1H,d,J=8Hz)

34）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（２，２－ジメチルヒドラジノ）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.91(6H,m),2.06-2.40(4H,m),2.28(3H,s),2.51(3H,s),2.57(3H,s),2.92(2H,t,J=5Hz),3.32(3H,s),3.78(3H,s),3.80-4.02(2H,m),4.28(2H,t,J=5Hz),6.55-6.68(2H,m),6.80-7.13(5H,m),7.46(1H,dd,J=8Hz),8.19(1H,d,J=8Hz),8.38(1H,br)

35）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（カルバモイルメチルアミノ）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.58(2H,m),1.68-1.85(4H,m),2.06-2,17(2H,m),2.27(3H,s),2.94(2H,t,J=5Hz),3.31(3H,s),3.80(3H,s),3.81-4.00(2H,m),3.89(2H,d,J=5Hz),4.28(2H,t,J=5Hz),5.78(1H,br),6.60-6.74(3H,m),6.90-7.13(6H,m),7.41-7.49(1H,m),8.17(1H,d,J=8Hz),8.39(1H,d,J=8Hz)

36）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（２－カルバモイルエチルアミノ）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.45-1.58(2H,m),1.62-1.84(4H,m),2.14(2H,t,J=5Hz),2.22(2H,t,J=5Hz),2.29(3H,s),2.40(2H,t,J=5Hz),2.98(2H,br),3.30(3H,s),3.40-3.55(2H,m),3.78(3H,s),3.80-4.01(2H,m),4.27(2H,t,J=5Hz),6.58-6.79(4H,m),6.88-7.12(6H,m),7.41-7.49(1H,m),8.16(1H,d,J=8Hz),8.39(1H,d,J=7Hz)

37）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ピリジルアミノカルボニル）ペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.52-1.89(6H,m),2.10-2.22(2H,m),2.26(3H,s),2.45(2H,br),2.95(2H,t,J=5Hz),3.32(3H,s),3.72(3H,s),3.82-4.00(2H,m),4.27(2H,t,J=5Hz),6.57-6.72(2H,m),6.90-7.15(6H,m),7.46(1H,dd,J=2,8Hz),7.56(2H,br),8.12(1H,d,J=8Hz),8.35-8.50(3H,m),9.46(1H,br)

38）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－〔４－（ジエチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.05(6H,t,J=5Hz),1.35-1.95(10H,m),2.04-2.13(2H,m),2.28(3H,s),2.36(2H,t,J=5Hz),2.54(4H,q,J=5Hz),2.56-2.80(2H,m),2.91(2H,t,J=5Hz),2.93-3.07(2H,m),3.33(3H,s),3.80(3H,s),3.82-4.03(2H,m),4.30(2H,t,J=5Hz),6.56-6.68(2H,m),6.81-7.12(6H,m),7.42-7.49(1H,m),8.22(1H,d,J=7Hz),8.41(1H,d,J=8Hz)

39）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔６－（４－メチルピペラジン－１－イル）ヘキス－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.45-1.58(2H,m),1.62-1.84(4H,m),2.14(2H,t,J=5Hz),2.29(3H,s),2.40(2H,t,J=5Hz),2.98(2H,br),3.30(3H,s),3.40-3.55(2H,m),3.78(3H,s),3.80-4.01(2H,m),4.27(2H,t,J=5Hz),6.58-6.79(4H,m),7.41-7.49(1H,m),8.16(1H,d,J=8Hz),8.39(1H,d,J=8Hz)

40）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（２－ピリジル）フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチル－ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.97-2.08(2H,m),2.26(3H,s),2.85(2H,t,J=5Hz),3.40(3H,s),3.62(3H,s),4.26(2H,t,J=5Hz),4.96(1H,d,J=12Hz),5.14(1H,d,J=12Hz),6.54-6.62(2H,m),6.40(1H,d,J=7Hz),6.98-7.14(5H,m),7.39(1H,d,J=8Hz),7.39-7.49(1H,m),7.70(2H,s),7.98(1H,d,J=8Hz),8.22(1H,d,J=8Hz),8.39(1H,d,J=8Hz),8.68(1H,br)

41）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－〔（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルアミノ〕ブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.62-1.88(4H,m),2.30-2.15(2H,m),2.28(6H,s),2.34-2.42(4H,m),2.93(2H,t,J=5Hz),3.25-3.48(6H,m),3.33(3H,s),3.79(3H,s),3.79-3.99(2H,m),4.30(2H,t,J=5Hz),6.58-6.70(2H,m),6.90-7.11(5H,m),7.45(1H,dd,J=2,8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz)
42）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－〔（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルアミノ〕ブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.44-1.98(8H,m),2.26(3H,s),2.49(6H,s),2.66-2.93(3H,m),3.05(2H,t,J=5Hz),3.25-3.32(2H,m),3.29(3H,s),3.79(3H,s),3.81-3.99(2H,m),4.15-4.29(4H,m),6.57-6.64(2H,m),6.91-7.12(5H,m),7.46(1H,dd,J=2,8Hz),8.04(1H,d,J=8Hz),8.35(1H,d,J=8Hz)

実施例47

出発化合物として４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミドを用い、実施例45と同様にして、次の化合物を得た。
４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.87-1.98(2H,m),2.00-2.09(2H,m),2.25(3H,s),2.83-2.96(4H,m),3.30(3H,s),3.78(3H,s),3.87-4.10(2H,m),4.27(2H,t,J=7.5Hz),6.57-6.66(2H,m),6.90(1H,m),7.00-7.10(3H,m),7.42(1H,t,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz),8.39(1H,d,J=7Hz)

実施例48

実施例47と同様にして、次の化合物を得た。
１）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－アミノアセチルアミノブト－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
MASS(m/z):592(M+1)
２）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（ピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.48-1.95(6H,m),2.07-2.20(2H,m),2.28(3H,s),2.32-2.63(5H,m),2.75-3.01(3H,m),3.21(3H,s),3.40-3.64(4H,m),3.78(3H,s),3.83-4.08(2H,m),4.27(2H,t,J=5Hz),6.55-6.70(2H,m),6.82-7.17(6H,m),7.20-7.50(1H,m),8.29(1H,d,J=7Hz),8.39(1H,d,J=8Hz)
３）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（３－アミノプロピオニル）アミノブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.64-1.88(4H,m),2.06-2.19(2H,m),2.28(3H,s),2.32-2.46(2H,m),2.90-3.13(4H,m),3.23-3.44(2H,m),3.30(3H,s),3.77(3H,s),3.78-4.01(2H,m),4.27(2H,br),6.55-6.68(2H,m),6.88-7.11(5H,m),7.28-7.50(2H,m),8.20(1H,d,J=8Hz),8.31(1H,d,J=8Hz)
４）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル)オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（ピペリジン－４－イル）カルボニルアミノブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.60-1.91(8H,m),2.09-2.21(2H,m),2.28(3H,s),2.70(1H,br),2.97(2H,t,J=5Hz),3.11-3.40(8H,m),3.30(3H,s),3.72-3.96(2H,m),3.78(3H,s),4.28(2H,t,J=5Hz),6.57-6.65(2H,m),6.90-7.08(4H,m),7.23-7.28(2H,m),7.38-7.49(2H,m),8.13(1H,d,J=8Hz),8,38(1H,d,J=8Hz)

５）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－グアニジノブト－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.62-1.80(4H,m),2.05-2.14(2H,m),2.20(3H,s),2.55-2.70(2H,m),2.94(2H,t,J=5Hz),3.31(3H,s),3.62-3.73(2H,m),3.72(3H,s),4.22(1H,d,J=5Hz),6.48(1H,d,J=8Hz),6.61(1H,s),6.75(1H,d,J=8Hz),6.95-7.09(5H,m),7.43(1H,dd,J=2,8Hz),8.03(1H,d,J=8Hz),8.32(1H,d,J=8Hz)

実施例49

４－ヒドロキシ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（320mg）のＮ,Ｎ－ジメチルホルムアミド（８ml）溶液を、０℃で、水素化ナトリウム（29.1mg、鉱油中60％ｗ／ｗ）で処理した。反応混合物を０℃で15分間攪拌し、つぎに外界温度で10分間攪拌した。臭化ｏ－ニトロベンジル（143mg）を加え、反応混合物を2.5時間攪拌した。水で反応を終焉させ、混合物を酢酸エチルで希釈した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水で洗った。有機溶液を硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（SiO_2 15ｇ、３％メタノール含有ジクロロメタン）により精製して、３－メトキシ－４－（２－ニトロベンジルオキシ）－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（210mg）を得た。
NMR($CDCl_3$,δ):1.43-1.59(2H,m),1.61-1.88(4H,m),2.21-2.44(12H,m),3.31(3H,s),3.42-3.52(2H,m),3.56-3.67(2H,m),3.71(3H,s),3.78-4.00(2H,m),5.46(3H,s),6.52-6.67(3H,m),6.77-6.91(2H,m),6.95(1H,br s),7.46(1H,m),7.64(1H,m),7.84(1H,d,J=8Hz),8.14(1H,d,J=8Hz)

実施例50

４－〔２－（３－アミノプロピルチオ）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（160mg）のメタノール（５ml）溶液に、メタ過沃素酸ナトリウム（50.6mg）と水５mlとからなる懸濁液を加えた。混合物を氷浴温度で20時間攪拌し、クロロホルムで希釈した。下方のクロロホルム層を分取し、水層をクロロホルムで抽出した。有機抽出液を合わせ、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下で溶媒を除去し、分取薄層クロマトグラフィー（メタノール／ジクロロメタン／アンモニア＝10／90／２）により精製して、遊離アミン（70mg）を得た。このアミンのエタノール（３ml）溶液に、１Ｎ塩酸（0.2ml）を加え、５分間攪拌した。溶液を濃縮して、４－〔２－（３－アミノプロピルスルフィニル）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩を得た。
NMR(DMSO-d_6,δ):1.38-1.67(4H,m),1.68-1.88(2H,m),1.94-2.13(2H,m),2.22(3H,s),2.40(2H,t,J=7Hz),2.69-3.12(9H,m),3.12-3.58(7H,m),3.62(3H,s),3.80-4.17(3H,m),4.43(1H,m),6.64(1H,d,J=8Hz),6.83(1H,s),6.91(2H,br s),7.04(1H,d,J=8Hz),7.53(1H,m),7.68(1H,dd,J=8,8Hz),7.85(1H,dd,J=8,8Hz),7.90-8.19(3H,s),9.84(1H,s)

実施例51

３－メトキシ－４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕チオベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル)カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド（150mg）のジクロロメタン（10ml）溶液に、ｍ－クロロ過安息香酸（80.3mg）を加え、混合物を外界温度で２時間攪拌した。溶液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水および食塩水で順次洗い、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下で溶媒を蒸発させ、残留物をシリカゲルカラム（２％メタノール含有クロロホルム）により精製して、３－メトキシ－４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕スルホニルベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル

〕オキシ〕フェニルベンズアミド（150mg）を得た。
MASS(m/z):839(M+1)
実施例52
４－〔２－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕フェニル〕ビニル〕－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（100mg）、20％水酸化パラジウム（30mg）のメタノール（５ml）溶液を、外界温度で、大気圧の水素のもとに攪拌した。12時間後、反応混合物をセライト層を通して▲濾▼過し、回転蒸発により溶媒を蒸発させ、粗製品をNH－シリカゲル（クロマトレックス）カラムクロマトグラフィー（SiO_2 10ｇ、１％メタノール含有クロロホルム）により精製して、遊離アミンを得た。アミン（80mg）のエタノール（３ml）溶液に、１Ｎ塩酸（0.25ml）を加え、５分間攪拌した。溶液を蒸発させて溶媒を除去し、４－〔２－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕フェニル〕エチル〕－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩（70mg）を得た。
NMR(DMSO-d_6,δ):1.36-1.65(4H,m),1.65-1.82(2H,m),1.97-2.13(2H,m),2.22(3H,s),2.39(2H,t,J=7Hz),2.58-3.11(13H,m),3.17(3H,s),3.26-3.68(5H,m),3.72-4.21(5H,m),4.42(1H,m),6.63(1H,d,J=8Hz),6.70-7.05(8H,m),7.13(1H,dd,J=8,8Hz),8.00-8.24(2H,m)
実施例53
実施例10と同様にして、次の化合物を得た。
１）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－（４－ヒドロキシフェニル）ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.43(9H,s),1.60-1.68(2H,m),3.16-3.25(2H,m),3.49(3H,s),3.63(3H,s),4.16-4.23(2H,m),4.73-4.80(1H,br),6.67-6.74(3H,m),6.84-7.01(5H,m),7.07-7.14(2H,m),7.47(1H,t,J=8Hz),8.16(1H,d,J=8Hz),8.52(1H,d,J=8Hz)
ESI-MASS(m/z):550(M+H)
２）３－メトキシ－４－〔２－〔１－（第三級ブトキシカルボニル）ピペリジン－４－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－（２－ヒドロキシ－４－メチル）フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.43(9H,s),1.68-2.10(4H,m),2.23(3H,s),2.96-3.17(2H,m),3.36(3H,s),3.64-3.98(5H,m),4.60(1H,m),6.36-7.03(7H,m),7.10(1H,t,J=7Hz),7.43(1H,t,J=7Hz),8.19(1H,d,J=7Hz)
３）４－〔２－（３－アミノ－１－メチルプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－（２－ヒドロキシ－４－メチル）フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR(DMSO-d_6,δ):1.33(3H,d,J=7.5Hz),1.63-1.76(1H,m),1.87-1.98(1H,m),2.14(3H,s),2.65(2H,t,J=7.5Hz),3.18(3H,s),3.74(3H,s),4.96(1H,m),6.47(1H,d,J=7Hz),6.63(1H,s),6.86(1H,d,J=7Hz),7.91(1H,d,J=7Hz),7.01(1H,s),7.09(1H,t,J=7Hz),7.32(1H,d,J=7Hz),7.52(1H,t,J=7Hz),8.04(1H,d,J=7Hz),8.30(1H,d,J=7Hz)
４）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノ－１－メチルプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－（２－ヒドロキシ－４－メチル）フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.36(3H,d,J=7.5Hz),1.40(9H,s),1.80-2.10(2H,m),2.22(3H,s),3.16-3.28(2H,m),3.35(3H,s),3.69(3H,s),4.64(1H,m),4.79(1H,br),6.52(1H,m),6.70-6.82(2H,m),6.91-7.11(4H,m),7.41(1H,t,J=7Hz),8.21(1H,d,J=7Hz),8.47(1H,m)
５）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－（２－ヒドロキシ－４－メチル）フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):2.26(3H,s),3.36(3H,s),6.56(1H,m),6.65-6.86(4H,m),6.96-7.08(2H,m),7.35-7.44(2H,m),8.20(1H,br),8.61(1H,br)

６）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－（２－ヒドロキシ－４－メチルフェニル）－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.42(9H,s),1.68(2H,br),1.99(2H,br),2.22(3H,s),3.19(2H,br),3.39(3H,s),3.49(2H,br),5.03(1H,br),6.43-6.72(6H,m),7.08(2H,br),7.39(1H,br),8.21(1H,d,J=8Hz),8.45(1H,br)

実施例54

実施例12と同様にして、次の化合物を得た。
１）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－（５－エトキシカルボニルペント－１－イルオキシ）フェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.21-1.29(3H,m),1.40(9H,s),1.42-1.90(8H,m),2.09-2.19(2H,m),3.27-3.34(2H,m),3.47(3H,s),3.82(3H,s),3.89(2H,t,J=8Hz),4.08-4.17(2H,m),4.26(2H,t,J=8Hz),4.70-4.77(1H,br),6.75(2H,d,J=8Hz),6.83(1H,d,J=8Hz),6.94-7.02(3H,m),7.07-7.13(2H,m),7.46(1H,t,J=8Hz),8.21(1H,d,J=8Hz),8.42(1H,d,J=8Hz)
ESI-MASS(m/z):692(M+H)
２）４－〔２－（ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（３－エトキシカルボニルプロプ－１－イル）オキシ〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.26(3H,t,J=7.5Hz),2.03-2.17(2H,m),2.50(2H,t,J=7.5Hz),3.32(3H,s),3.87-4.04(2H,m),4.16(2H,q,J=7.5Hz),5.19(2H,s),6.78(2H,d,J=8Hz),6.92-7.00(3H,m),7.07-7.21(5H,m),7.38-7.53(6H,m),8.26(1H,d,J=7Hz)
３）４－（２－ヨードベンゾイル）アミノ－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イル）オキシ〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.24(3H,t,J=7.5Hz),1.42-1.55(2H,m),1.63-1.72(2H,m),1.76-1.88(2H,m),2.31(2H,t,J=7.5Hz),3.31(3H,s),3.81-3.99(2H,m),4.11(2H,q,J=7.5Hz),6.76-6.83(2H,m),7.00(1H,d,J=7Hz),8.08-8.17(2H,m),7.29-7.49(5H,m),7.66(1H,s),7.88(1H,d,J=7Hz)
４）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノプロプ－１－イル〕オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.39(9H,s),1.41(9H,s),1.93-1.97(2H,m),2.07-2.17(2H,m),2.26(3H,s),3.22-3.32(4H,m),3.30(3H,s),3.78(3H,s),3.82-4.05(2H,m),6.60-6.66(2H,m),6.86-6.91(2H,m),7.00(1H,d,J=7Hz),7.03-7.10(2H,m),7.43(1H,t,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz),8.39(1H,d,J=7Hz)
５）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（フタルイミド）ブト－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.85-1.92(2H,m),2.10-2.17(2H,m),2.27(3H,s),3.22-3.32(2H,m),3.28(3H,s),3.74-3.81(2H,m),3.81(3H,s),3.92-4.15(2H,m),4.24(2H,t,J=7.5Hz),6.57-6.65(2H,m),6.83-6.90(2H,m),6.97-7.14(3H,m),7.24(1H,t,J=7Hz),7.69-7.77(2H,m),7.82-7.91(2H,m),8.21(1H,d,J=7Hz),8.40(1H,d,J=7Hz)
６）３－メトキシ－４－〔２－〔１－（第三級ブトキシカルボニル）ピペリジン－４－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.25(3H,t,J=7.5Hz),1.42-1.91(6H,m),1.45(9H,s),2.02-2.12(2H,m),2.27(3H,s),2.27-2.88(2H,m),2.97-3.18(2H,m),3.32(3H,s),3.40(2H,t,J=7Hz),3.74(3H,s),3.89-4.00(2H,m),4.13(2H,q,J=7.5Hz),4.66(1H,m),6.59(1H,d,J=7Hz),6.61(1H,s,J=7Hz),6.80-6.92(2H,m),6.98-7.12(3H,m),7.43(1H,t,J=7Hz),8.19(1H,d,J=7Hz),8.39(1H,d,J=7Hz)
７）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノ－１－メチルプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.24(3H,t,J=7.5Hz),1.38(9H,s),1.40(2H,d,J=7.5Hz),1.41-2.10(8H,m),2.26(3H,s),2.27-2.33(2H,m),3.23-3.30(2H,m),3.30(3H,s),3.79(3H,s),3.83-3.99(2H,m),4.12(2H,q,J=7.5Hz),4.62-4.77(2H,m),6.58-6.63(2H,m),6.82(1H,t,J=7Hz),7.01(1H,d,J=7Hz),7.05-7.12(2H,m),7.43(1H,t,J=7Hz),8.21(1H,d,J=7Hz),8.39(1H,d,J=7Hz)

８）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－（２－メトキシ－４－メチルフェニル）－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),2.08-2.20(2H,m),2.29(3H,s),3.28(2H,q,J=5Hz),3.31(3H,s),3.75(3H,s),3.80(3H,s),4.25(2H,t,J=5Hz),4.74(1H,br),6.59-6.65(2H,m),6.89(1H,d,J=8Hz),7.00(1H,d,J=8Hz),7.06-7.13(2H,m),7.46(1H,dd,J=2,8Hz),8.21(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz)

９）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（２－ピリジル）フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.39(9H,s),2.09(2H,t,J=5Hz),2.29(3H,s),3.27(2H,q,J=5Hz),3.40(3H,s),3.61(3H,s),4.21(2H,t,J=5Hz),4.82(1H,br),4.97(1H,d,J=12Hz),5.14(1H,d,J=12Hz),6.55-6.74(2H,m),6.89-7.12(7H,m),7.19-7.24(1H,m),7.39(1H,d,J=8Hz),7.41-7.49(1H,m),7.70(2H,s),7.99(1H,d,J=8Hz),8.21(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz),8.67(1H,d,J=5Hz)

10）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（１，５－ジメチル－３－シアノピロール－２－イル）フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),2.03-2.15(2H,m),2.13(3H,s),2.30(3H,s),3.26(2H,q,J=5Hz),3.40(3H,s),3.46(3H,s),3.58(3H,s),4.19(2H,t,J=5Hz),4.86(1H,d,J=12Hz),5.10(1H,d,J=12Hz),6.65-6.73(2H,m),6.82(1H,d,J=8Hz),6.95-7.10(4H,m),7.34-7.44(6H,m),8.00(1H,s),8.19(1H,d,J=8Hz),8.36(1H,d,J=8Hz)

11）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（チアゾール－２－イル）フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),2.05-2.16(2H,m),3.27(2H,q,J=5Hz),3.40(3H,s),3.62(3H,s),4.20(2H,t,J=5Hz),4.76(1H,br),4.89(1H,d,J=12Hz),5.07(1H,d,J=12Hz),6.62-6.72(2H,m),6.89(1H,d,J=8Hz),6.96-7.11(4H,m),7.28(1H,d,J=3Hz),7.31(2H,d,J=8Hz),7.42(1H,dd,J=2,8Hz),7.81(1H,d,J=8Hz),7.93(2H,d,J=8Hz),8.00(1H,s),8.20(1H,d,J=8Hz),8.38(1H,d,J=8Hz)

12）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（オキサゾール－２－イル）フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),2.05-2.16(2H,m),2.29(3H,s),3.27(2H,q,J=5Hz),3.40(3H,s),3.65(3H,s),4.21(2H,t,J=5Hz),4.78(1H,br),4.90(1H,d,J=13Hz),5.10(1H,d,J=13Hz),6.64(1H,s),6.70(1H,d,J=8Hz),6.85(1H,d,J=8Hz),6.98-7.17(5H,m),7.20(1H,s),7.30-7.49(3H,m),7.63(1H,s),8.03(1H,d,J=8Hz),8.22(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz)

13）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（ピリミジン－２－イル）フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),2.05-2.16(2H,m),2.28(3H,s),3.28(2H,q,J=5Hz),3.40(3H,s),3.65(3H,s),4.22(2H,t,J=5Hz),4.78(1H,br),4.95(1H,d,J=12Hz),5.14(1H,d,J=12Hz),6.65-6.70(2H,m),6.88(1H,d,J=8Hz),6.96-7.19(5H,m),7.38-7.46(3H,m),8.21(1H,d,J=8Hz),8.35-8.44(3H,m),8.74(1H,d,J=3Hz)

14）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－シアノフェニルメチル）オキシ－４

－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.41(9H,s),2.08-2.20(2H,m),2.30(3H,s),3.30(2H,q,J=5Hz),3.40(3H,s),3.68(3H,s),4.26(2H,t,J=5Hz),4.89(1H,d,J=13Hz),5.09(1H,d,J=13Hz),6.60(1H,s),6.73(1H,d,J=8Hz),6.98-7.12(5H,m),7.39-7.52(3H,m),7.68(1H,d,J=8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.34(1H,d,J=8Hz)
15）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－フタルイミドブト－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.72-1.95(4H,m),2.08-2.19(2H,m),2.29(3H,s),3.31(2H,q,J=5Hz),3.33(3H,s),3.79(2H,t,J=5Hz),3.81(3H,s),3.84-4.06(2H,m),4.25(2H,t,J=5Hz),4.82(1H,br),6.57(1H,d,J=8Hz),6.62(1H,s),6.81-6.89(2H,m),6.97(1H,d,J=8Hz),7.04-7.10(2H,m),7.40-7.48(1H,m),7.68-7.74(2H,m),7.81-7.89(2H,m),8.20(1H,d,J=8Hz),8.39(1H,d,J=8Hz)
16）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（３－メトキシカルボニルピリド－６－イル）メトキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.39(9H,s),2.07-2.16(2H,m),2.27(3H,s),3.29(2H,q,J=5Hz),3.42(3H,s),3.63(3H,s),3.89(3H,s),4.24(2H,t,J=5Hz),4.95(1H,d,J=12Hz),5.08(1H,d,J=12Hz),6.58(1H,s),6.73(1H,d,J=8Hz),6.89(1H,d,J=8Hz),6.98(2H,d,J=8Hz),7.05-7.12(3H,m),7.34(1H,d,J=8Hz),7.44(1H,dd,J=2,8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.28(1H,d,J=8Hz),8.37(1H,d,J=8Hz),9.14(1H,s)

実施例55

実施例35と同様にして、次の化合物を得た。
４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（第三級ブトキシカルボニルグアニジノ）ブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.43(9H,s),1.44(9H,s),1.52-1.60(2H,m),1.65-1.74(2H,m),1.92-2.07(2H,m),2.21(3H,s),3.10-3.25(4H,m),3.38(3H,s),3.50(2H,br),3.66(3H,br),3.78-4.05(2H,m),6.49(2H,br),6.63-6.82(3H,m),7.01-7.10(2H,m),7.38(1H,dd,J=2,8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.44(1H,br)

実施例56

実施例10と同様にして、次の化合物を得た。
１）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－ヒドロキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－シクロヘキシルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.07-1.17(2H,m),1.41(9H,s),1.47-1.76(8H,m),2.10-2.20(2H,m),2.92-3.00(2H,m),3.36-3.44(2H,m),3.49(3H,s),4.19-4.27(2H,m),4.98-5.06(1H,br),6.87-6.92(1H,br),6.98-7.03(2H,m),7.12(1H,t,J=8Hz),7.47(1H,t,J=8Hz),8.12-8.22(1H,br),8.28(1H,d,J=8Hz),9.72-9.80(1H,br)
ESI-MASS(m/z):526(M+H)
２）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－ヒドロキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.42(9H,s),1.50-1.90(8H,m),2.20-2.22(2H,m),2.27(3H,s),2.32(3H,s),2.35-2.53(6H,m),3.29(3H,s),3.32-3.42(2H,m),3.50-3.66(3H,m),3.72(2H,br),3.89(1H,br),4.20(2H,t,J=6Hz),5.29(1H,br),6.54(1H,s),6.67(1H,d,J=7Hz),6.72(1H,br),6.96-7.10(4H,m),7.40-7.47(1H,m),8.10(1H,br),8.27(1H,d,J=6Hz)

実施例57

４－〔（２－ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－〔（２－ベンジルオキシベンゾイル〕オキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カル

ボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（1.2ｇ）のエタノール（20ml）溶液に、１Ｎ水酸化ナトリウム溶液（10ml）を加え、混合物を外界温度で２時間攪拌した。混合物を減圧下で濃縮し、溶液を１Ｎ塩酸でpH７に調整した。この溶液を酢酸エチル（20ml）で抽出し、有機層を食塩水（20ml）で洗った。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、溶液を減圧下で濃縮して、４－〔（２－ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－ヒドロキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（930mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.48-1.59(2H,m),1.70(4H,br),2.29-2.42(13H,m),3.29(3H,s),3.48(2H,br),3.53(2H,br),3.80(1H,br),3.90(1H,br),5.28(2H,s),6.53-6.65(3H,m),6.72(1H,br),6.90-7.12(4H,m),7.34-7.37(3H,m),7.40-7.49(4H,m),8.20-8.27(1H,m)

実施例58

実施例12と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－エトキシカルボニルメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－シクロヘキシルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.29(3H,t,J=8Hz),1.41(9H,s),1.45-1.85(10H,m),2.07-2.12(2H,m),2.86-3.06(3H,br),3.25-3.32(2H,m),4.22-4.33(4H,m),4.76(2H,s),4.98-5.07(1H,br),6.91(1H,s),7.01-7.15(3H,m),7.48(1H,t,J=8Hz),8.23(1H,d,J=8Hz),8.69(1H,d,J=8Hz)

ESI-MASS(m/z):634(M+Na)

２）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－イソプロポキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.19-1.28(6H,m),1.38(9H,s),1.46-1.58(2H,m),1.65-1.88(6H,m),1.99-2.10(2H,m),2.25(3H,s),2.29(3H,s),2.32-2.42(6H,m),3.15-3.23(2H,m),3.31(3H,s),3.45-3.50(2H,m),3.60-3.64(2H,m),3.84-3.97(2H,m),4.24-4.36(3H,m),6.56-6.65(2H,m),6.85(1H,d,J=7Hz),6.94-7.02(3H,m),7.10(1H,t,J=6Hz),7.47(1H,t,J=7Hz),8.15(1H,d,J=7Hz),8.41(1H,d,J=7Hz)

３）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕－３－プロポキシベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):0.97(3H,t,J=7Hz),1.42(9H,s),1.47-1.58(2H,m),1.67-1.88(8H,m),1.98-2.10(2H,m),2.27(3H,s),2.28(3H,s),2.31-2.41(6H,m),3.16-3.26(2H,m),3.31(3H,s),3.45-3.50(2H,m),3.58-3.65(2H,m),3.84-3.97(4H,m),4.26(2H,t,J=7Hz),6.58(1H,d,J=7Hz),6.64(1H,s),6.84(1H,d,J=6Hz),6.95(1H,d,J=7Hz),6.99-7.03(2H,m),7.09(1H,t,J=7Hz),7.45(1H,t,J=7Hz),8.16(1H,d,J=7Hz),8.38(1H,d,J=7Hz)

４）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－（３－エトキシカルボニルプロプ－１－イル）オキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.11および1.23(計3H,t,J=6Hz),1.40(9H,s),1.48-1.60(2H,m),1.60-1.75(4H,m),1.75-1.88(2H,m),1.98-2.10(4H,m),2.26(3H,s),2.29(3H,s),2.32-2.42(8H,m),3.18-3.28(2H,m),3.30(3H,s),3.45-3.50(2H,m),3.62(2H,br),3.88-4.10(5H,m),4.27(2H,t,J=6Hz),6.57(1H,d,J=7Hz),6.63(1H,s),6.82(1H,d,J=7Hz),6.87-6.92(1H,m),6.98-7.10(3H,m),7.42(1H,t,J=6Hz),8.10-8.13(1H,m),8.37(1H,d,J=7Hz)

５）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－エトキシカルボニルメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフ

ェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.29(3H,t,J=7Hz),1.39(9H,s),1.46-1.90(8H,m),2.00-2.10(2H,m),2.28(3H,s),2.29(3H,s),2.30-2.42(6H,m),3.18-3.29(2H,m),3.30(3H,s),3.42-3.50(2H,m),3.58-3.65(2H,m),3.85-3.97(2H,m),4.18-4.29(4H,m),4.52(2H,s),6.52-6.13(2H,m),6.80(1H,d,J=7Hz),6.89-6.99(3H,m),7.38-7.48(1H,m),8.15(1H,d,J=7Hz),8.41(1H,d,J=7Hz)
６）４－〔（２－ベンジルオキシ）ベンゾイル〕アミノ－３－エトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.08(3H,t,J=6Hz),1.45-1.57(2H,m),1.60-1.75(2H,m),1.77-1.87(2H,m),2.25(3H,s),2.29(3H,s),2.31-2.39(7H,m),3.30(3H,s),3.46-3.49(2H,m),3.60-3.63(2H,m),3.70-3.80(2H,m),3.82-3.98(2H,m),5.34(2H,s),6.52-6.60(2H,m),6.80-7.10(5H,m),7.27-7.38(6H,m),8.20-8.22(1H,m),8.38-8.43(1H,m)

実施例59

実施例４と同様にして、次の化合物を得た。
１）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－カルボキシメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－シクロヘキシルベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):1.03-1.17(2H,m),1.39(9H,s),1.45-1.85(8H,m),2.03-2.12(2H,m),2.85-2.98(3H,m),3.21-3.33(2H,m),4.23-4.31(2H,m),4.73(3H,s),5.08-5.13(1H,br),6.98-7.07(3H,m),7.10(1H,t,J=8Hz),7.48(1H,t,J=8Hz),8.18-8.24(1H,m),8.56-8.61(1H,m)
ESI-MASS(m/z):606(M+Na)
２）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－カルボキシメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($DMSO\text{-}d_6$,δ):1.38-1.49(2H,m),1.49-1.62(2H,m),1.67-1.78(2H,m),2.02-2.34(13H,m),2.78-2.89(2H,m),3.38-3.43(4H,m),3.58(3H,s),3.89-3.96(2H,m),4.00-4.18(2H,m),4.30(2H,br),6.62(1H,d,J=6Hz),6.72-6.87(3H,m),6.89-6.97(1H,m),7.11(1H,t,J=7Hz),7.19(1H,d,J=7Hz),7.54(1H,t,J=6Hz),7.94(1H,d,J=6Hz),8.22(1H,d,J=7Hz)
３）４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－カルボキシメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
MASS(m/z):804(M+H)

実施例60

４－（２－ヨードベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド（1.12ｇ）と３－ブチン－１－オール（153mg）とのテトラヒドロフラン（15ml）－エチルアミン（15ml）中混合物に、塩化ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（II）（23.5mg）および沃化銅（Ｉ）（3.19mg）を加え、混合物を８時間還流下に加熱した。溶液をクロロホルム（50ml）で希釈し、溶液を水および食塩水で洗った。溶液を硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で溶媒を蒸発させて、油状物を得た。この油状物をシリカゲルカラム（２％メタノール含有クロロホルム）により精製して、４－〔２－（４－ヒドロキシ－１－ブチン－１－イル）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド（755mg）を得た。
NMR($CDCl_3$,δ):1.44-1.57(2H,m),1.61-1.86(4H,m),2.27(3H,s),2.29-2.40(6H,m),2.70(2H,t,J=7.5Hz),3.33(3H,s),3.44-3.49(2H,m),3.53-3.60(2H,m),3.74(2H,t,J=7.5Hz),3.79-3.99(2H,m),6.76-6.84(2H,m),7.06(1H,d,J=7Hz),7.13(1H,t,J=7Hz),7.34(2H,d,J=8Hz),7.40-7.47(2H,m),7.48-7.56(3H,m),7.99(1H,m),9.19(1H,s)

実施例61

氷冷した４－〔２－（４－ヒドロキシ－１－ブチン－１－イル）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド（755mg）のジクロロメタン（20ml）溶液に、トリエチルアミン（150mg）および塩化メタンスルホニル（156mg）を加え、混合物を氷浴中で２時間攪拌した。溶液を水、10％塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水で順次洗い、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下で溶媒を蒸発させて、４－〔２－（４－メタンスルホニルオキシ－１－ブチン－１－イル）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド（789mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.49-1.60(2H,m),1.67-1.86(2H,m),1.87-1.90(2H,m),2.37(2H,t,J=7.5Hz),2.68(3H,s),2.86-3.06(6H,m),2.92(3H,s),3.31(3H,s),3.77-4.02(6H,m),4.32(2H,t,J=7.5Hz),6.77-6.87(2H,m),7.04(1H,d,J=7Hz),7.17(1H,t,J=7Hz),7.32(2H,d,J=8Hz),7.41-7.53(5H,m),7.90(1H,m),8.86(1H,s)

実施例62

実施例61と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－（４－メタンスルホニルオキシブト－１－イル）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

MASS(m/z):693(M+1)

２）４－〔２－（３－メタンスルホニルオキシプロプ－１－イル）チオベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.48-1.60(2H,m),1.65-1.74(2H,m),1.75-1.86(2H,m),1.98-2.07(2H,m),2.26(3H,s),2.30-2.39(2H,m),2.70-2.78(4H,m),2.79-3.42(2H,m),2.90(3H,s),2.95-3.07(2H,m),3.26(3H,s),3.71(3H,s),3.80-4.01(4H,m),4.29(2H,t,J=7.5Hz),6.56-6.66(2H,m),6.82-7.00(3H,m),7.30(1H,m),7.39-7.47(2H,m),7.60(1H,d,J=7Hz),8.27(1H,d,J=7Hz),8.58(1H,s)

実施例63

４－〔２－（４－メタンスルホニルオキシ－１－ブチン－１－イル）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド（800mg）とフタルイミドカリウム（430mg）とのジメチルスルホキシド（20ml）中混合物を、60℃で、５時間攪拌し、溶液を酢酸エチル（60ml）で希釈した。溶液を水および食塩水で洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下で溶媒を蒸発させて、４－〔２－〔４－（フタルイミド）－１－ブチン－１－イル〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド（620mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.50-1.61(2H,m),1.67-1.92(6H,m),2.30(3H,s),2.33-2.44(6H,m),3.38(3H,s),3.48-3.52(2H,m),3.60-3.67(2H,m),3.84-4.01(4H,m),6.78-6.85(2H,m),7.02(1H,d,J=7Hz),7.09-7.19(2H,m),7.30-7.70(6H,m),7.70-7.77(2H,m),7.81-7.90(2H,m),8.18(1H,m)

実施例64

実施例63と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－〔４－（フタルイミド）ブト－１－イル〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

MASS(m/z):693(M+1)

２）３－メトキシ－４－〔２－〔３－（フタルイミド）プロプ－１－イル〕チオベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.59(2H,m),1.61-1.74(2H,m),1.78-1.87(2H,m),1.92-2.03(2H,m),2.26(3H,s),2.29(3H,s),2.31-2.42(6H,m),2.94(2H,t,J=7.5Hz),3.31(3H,s),3.45-3.53(2H,m

),3.58-3.67(2H,m),3.69-3.81(2H,m),3.73(3H,s),3.84-4.00(2H,m),6.55-6.66(2H,m),6.80-6.92(2H,m),7.02(1H,s),7.27(1H,m),7.34-7.44(2H,m),7.60-7.90(5H,m),8.25(1H,d,J=7Hz),8.82(1H,s)

実施例65

４－〔２－（４－アミノ－１－ブチン－１－イル）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド（310mg）、塩化ニッケル六水和物（181mg）のテトラヒドロフラン（５ml）－メタノール（５ml）混合物中混合物に、氷冷下、水素化硼素ナトリウム（96.2mg）を少量ずつに分割して加え、混合物を同温度で２時間攪拌した。混合物をセライト層を通して▲濾▼過し、▲濾▼液を減圧下で蒸発させて濃縮した。残留物をクロロホルム（20ml）に溶解させ、水および食塩水で洗った。有機溶液を硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で溶媒を蒸発させて、シロップ状物を得た。この残留物をシリカゲルカラム（クロロホルム：メタノール：アンモニア＝100：10：１）により精製して、４－〔２－（４－アミノブト－１－イル）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド（295mg）を得た。

MASS(m/z):597(M+1)

実施例66

実施例65と同様にして、次の化合物を得た。

４－〔２－（４－ヒドロキシブト－１－イル）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

MASS(m/z):615(M+1)

実施例67

４－アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド（200mg）とサリチルアルデヒド（48.6mg）とのメタノール（10ml）中混合物を、３Åのモレキュラーシーブ（100mg）の存在下、一夜還流下に加熱した。溶液を▲濾▼過し、５℃で、水素化硼素ナトリウム（15.1ml）により２時間処理した。反応混合物をクロロホルム（20ml）で希釈し、溶液を水および食塩水で洗った。有機溶液を硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下、溶媒を蒸発させて、粗製油状物を得た。この製品をシリカゲルカラム（２％メタノール含有クロロホルム）により精製して、３－メトキシ－４－（２－ヒドロキシフェニル）メチルアミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔４－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニル〕フェニルメトキシ〕フェニルベンズアミド（152mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):2.27(3H,s),2.32(3H,s),2.32-2.59(4H,m),3.34(3H,s),3.40-3.55(2H,m),3.52(3H,s),3.75-3.88(2H,m),4.25-4.34(2H,m),4.63(1H,br),4.42(1H,d,J=14Hz),5.08(1H,d,J=14Hz),6.43(1H,d,J=7Hz),6.62(1H,s),6.70(1H,d,J=7Hz),6.80-6.88(4H,m),7.00(1H,d,J=7Hz),7.09-7.18(2H,m),7.28(2H,d,J=8Hz),7.38(2H,d,J=8Hz)

実施例68

実施例67と同様にして、次の化合物を得た。

３－メトキシ－４－（２－ヒドロキシフェニル）メチルアミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.41-1.52(2H,m),1.60-1.69(2H,m),1.70-1.80(2H,m),2.25(3H,s),2.29(3H,s),2.30-2.43(6H,m),3.28(3H,s),3.34-3.48(2H,m),3.55(3H,s),3.65-4.00(2H,m),4.30(2H,d,J=7Hz),4,62(1H,br t,J=7Hz),6.51(1H,d,J=7Hz),6.57-6.64(2H,m),6.76-6.95(5H,m),7.61-7.68(2H,m)

実施例69

氷浴で冷却した４－（２－ジメチルアミノ－４－メチル）フェノキシメチル－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イル）オキシ〕フェニルベンズアミド（860mg）

のＮ,Ｎ－ジメチルホルムアミド（15ml）溶液に、水素化ナトリウム（油中60％、71mg）を加え、溶液を同温度で30分間攪拌した。溶液にヨードメタン（0.121ml）を加え、混合物を外界温度で３時間攪拌した。混合物を酢酸エチル（50ml）で希釈し、溶液を水および食塩水で洗った。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で溶媒を蒸発させて、粗製油状物を得た。この粗製品をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（１％メタノール含有クロロホルム）により精製して、４－（２－ジメチルアミノ－４－メチル）フェノキシメチル－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イル）オキシ〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド（632mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.26(3H,t,J=7.5Hz),1.42-1.55(2H,m),1.63-1.74(2H,m),1.76-1.87(2H,m),2.20(3H,s),2.23(3H,s),2.33(2H,t,J=7.5Hz),2.72(6H,s),3.30(3H,s),3.76-3.97(2H,m),4.12(2H,q,J=7.5Hz),5.02(2H,s),6.52-6.60(3H,m),6,70(1H,d,J=7Hz),6.80-6.88(2H,m),7.20(2H,d,J=8Hz),7.31(2H,d,J=8Hz)

実施例70

出発化合物として３－メトキシ－４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（４－アミノブト－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミドを用い、実施例14と同様にして、次の化合物を得た。

３－メトキシ－４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（４－アセチルアミノブト－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.65-1.82(4H,m),1.76(3H,s),2.05(3H,s),2.07-2.21(2H,m),2.26(3H,s),3.22-3.38(2H,m),3.38(3H,s),3.77(3H,s),3.77-3.96(2H,m),4.24(2H,t,J=7.5Hz),6.53-6.71(2H,m),6.93-7.14(5H,m),7.25(1H,t,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz),8.43(7H,d,J=7Hz)

実施例71

３－メトキシ－４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－（４－アミノブト－１－イル）オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド（365mg）とＮ－（第三級ブトキシカルボニル）グリシン（111mg）とのＮ,Ｎ－ジメチルホルムアミド（15ml）中混合物に、Ｎ－エチル－Ｎ’－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（162mg）およびヒドロキシベンゾトリアゾール（93.2mg）を加え、混合物を外界温度で一夜攪拌した。溶液を酢酸エチル（30ml）で希釈し、溶液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水および食塩水で順次洗った。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で溶媒を蒸発させて、無定形物を得た。この粗製品をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（１％メタノール含有クロロホルム）により精製して、３－メトキシ－４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－Ｎ－〔２－〔４－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）アセチルアミノブト－１－イル〕オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド（320mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.39(9H,s),1.42(9H,s),1.58-1.70(2H,m),1.70-1.80(2H,m),2.05-2.17(2H,m),2.27(3H,s),3.20-3.34(4H,m),3.30(3H,s),3.70-3.95(4H,m),3.74(3H,s),4.22(2H,t,J=7.5Hz),6.56-6.68(2H,m),6.88-7.11(5H,m),7.45(1H,t,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz),8.28(1H,d,J=7Hz)

実施例72

実施例71と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノプロピオニルアミノ〕ブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.41(9H,s),1.60-1.82(4H,m),2.10-2.19(2H,m),2.29(3H,s),2.48(2H,br),3.25-3.42(6H,m),3.32(3H,s),3.79(3H,s),3.80-3.97(2H,m),4.25(2H,t,J=5Hz

),6.59(1H,s),6.67(1H,d,J=8Hz),6.94-7.11(5H,m),7.45(1H,dd,J=2,8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.39(1H,d,J=8Hz)

２）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－〔〔１－（第三級ブトキシカルボニル）ピペリジン－４－イル〕カルボニルアミノ〕ブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕」４－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.44(9H,s),1.60-1.81(8H,m),2.08-2.18(2H,m),2.29(3H,s),2.70(1H,br),3.30(2H,q,J=5Hz),3.32(3H,s),3.76(3H,s),3.76-4.15(6H,m),4.22(2H,t,J=5Hz),6.59(1H,s),6.65(1H,d,J=8Hz),6.94-7.10(6H,m),7.44(1H,dd,J=2,8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.39(1H,d,J=8Hz)

実施例73

氷冷した４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－アミノブト－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（430mg）とトリエチルアミン（68mg）とのジクロロメタン（10ml）中混合物に、クロロ炭酸フェニル（106mg）を滴下し、溶液を同温度で30分間攪拌した。生じた混合物をジクロロメタン（10ml）で希釈し、溶液を１Ｎ塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水で順次洗った。溶媒を硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で除去して、４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－フェノキシカルボニルアミノブト－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（471mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.60-1.90(4H,m),2.08-2.17(2H,m),2.29(3H,s),3.27(2H,q,J=5Hz),3.31(2H,t,J=5Hz),3.36(3H,s),3.78(3H,s),3.82-4.00(2H,m),4.21(2H,t,J=5Hz),4.73(1H,br),5.38(1H,br),6.61-6.68(2H,m),6.91-6.99(4H,m),7.06-7.20(5H,m),7.30-7.38(2H,m),7.42(1H,dd,J=2,8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz)

実施例74

４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－アミノブト－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（120mg）とフェニル炭酸３－（ジメチルアミノ）プロプ－１－イル（127mg）とのＮ,Ｎ－ジメチルホルムアミド（５ml）中混合物を、50℃で、８時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチル（15ml）で希釈し、溶液を飽和重炭酸ナトリウム水溶液および食塩水で順次洗った。溶液を炭酸カリウムで乾燥した。溶媒を蒸発させ、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（SiO_2 20ｇ、３～15％メタノール含有クロロホルム）により精製して、４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（３－ジメチルアミノプロプ－１－イル）オキシカルボニルアミノ〕ブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（64mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.62-1.87(6H,m),2.05-2.18(2H,m),2.28(3H,s),2.30(6H,s),2.44(2H,t,J=5Hz),3.20-3.32(4H,m),3.32(3H,s),3.78(3H,s),3.80-4.00(2H,m),4.12(2H,t,J=5Hz),4.24(2H,t,J=5Hz),6.59-6.64(2H,m),6.88-7.12(5H,m),7.44(1H,dd,J=2,8Hz),8.21(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,br)

実施例75

４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－オキソピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（192mg）のメタノール（５ml）溶液に、外界温度で、水素化硼素ナトリウム（19mg）を加え、混合物を同温度で１時間攪拌した。0.5Ｎ塩酸（10ml）で反応を終焉させ、混合物をクロロホルム（15mlx3）で抽出した。有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水で洗い、溶液を硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下で溶媒を蒸発させて、４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－

３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ヒドロキシピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（199mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.39(9H,s),1.41-1.99(10H,m),2.05-2.20(2H,m),2.27(3H,s),2.30-2.51(2H,m),3.01-3.22(2H,m),3.30(3H,s),3.65-4.14(7H,m),3.76(3H,s),4.22(2H,t,J=5Hz),6.52-6.67(2H,m),6.78-7.10(5H,m),7.38-7.47(1H,m),8.19(1H,d,J=7Hz),8.39(1H,d,J=7Hz)

実施例76

４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－オキソピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（250mg）、酢酸アンモニウム（51mg）および酢酸（0.5ml）のエタノール（10ml）中混合物に、０℃で、水素化シアノ硼素ナトリウム（21mg）を加え、混合物を外界温度で12時間攪拌した。混合物を氷冷１Ｎ水酸化ナトリウム水溶液（15ml）中に注ぎ、溶液をクロロホルム（15mlx3）で抽出した。有機層を食塩水で洗い、炭酸カリウムで乾燥した。減圧下で溶媒を蒸発させ、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（SiO_2 40ｇ、５～15%メタノール含有クロロホルム)により精製して、４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－アミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（91mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.41(9H,s),1.45-2.01(12H,m),2.09-2.20(2H,m),2.28(3H,s),2.23-2.45(4H,m),2.56-2.71(1H,br),2.93-3.12(2H,m),3.25-3.36(2H,m),3.32(3H,s),3.79(3H,s),3.81-4.02(2H,m),4.23(2H,t,J=5Hz),4.91-4.08(1H,br),6.56-6.68(2H,m),6.82-7.13(5H,m),7.45(2H,d,J=8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz)

実施例77

実施例76と同様にして、次の化合物を得た。

４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔６－（４－メチルピペラジン－１－イル）ヘキス－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.39(9H,s),1.45-1.84(8H,m),2.09-2.22(2H,m),2.27(3H,s),2.28(3H,s),2.32-2.59(8H,m),3.32(1H,q,J=5Hz),3.34(3H,s),3.80(3H,s),3.82-4.01(2H,m),4.28(2H,t,J=5Hz),6.56-6.65(2H,m),6.82-7.12(6H,m),7.43-7.50(1H,m),8.20(1H,d,J=8Hz),8.38(1H,d,J=8Hz)

実施例78

４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－カルボキシペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（250mg）、２－ジメチルアミノエタノール（99mg）および４－ジメチルアミノピリジン（36mg）のジクロロメタン（10ml）中混合物に、０℃で、Ｎ－エチル－Ｎ’－（３－ジメチルアミノプロプ－１－イル）カルボジイミド塩酸塩（71mg）を加え、同温度で７時間攪拌した。混合物をクロロホルム（20ml）で希釈し、溶液を水（20mlx2）および食塩水で洗った。溶液を硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で溶媒を除去した。この残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(SiO_2 30ｇ、１～10%メタノール含有クロロホルム）により精製して、４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（２－ジメチルアミノエト－１－イル）オキシカルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（238mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.45-1.57(2H,m),1.65-1.90(4H,m),2.10-2.21(2H,m),2.28(9H,s),2.39(2H,t,J=5Hz),2.55(2H,t,J=5Hz),3.30(2H,t,J=5Hz),3.32(3H,s),3.79(3H,s),3.82-4.00(2H,m),4.18(2H,t,J=5Hz),4.24(2H,t,J=5Hz),4.75-4.86(1H,br),6.54-6.67(2H,m),6.81-7.11(5H,m),7.41-7.49(1H,m),8.20(1H,d,J=8Hz),8.49(1H,d,J=8Hz)

実施例79

４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－エトキシカルボニルペント－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（400mg）のテトラヒドロフラン（５ml）溶液に、-23℃で、水素化アルミニウムリチウム（12mg）を加え、混合物を０℃で３時間攪拌した。0.5Ｎ塩酸（15ml）を徐々に加えて反応を終焉させ、溶液を外界温度で20分間攪拌した。溶液をクロロホルム（15mlx3）で抽出し、有機層を飽和重炭酸ナトリウム水溶液および食塩水で洗った。溶液を硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で溶媒を除去して、４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（６－ヒドロキシヘキス－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（456mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.45-2.20(10H,m),2.27(3H,s),3.30(2H,q,J=5Hz),3.32(3H,s),3.64(2H,t,J=5Hz),3.78(3H,s),3.81-4.02(2H,m),4.23(2H,t,J=5Hz),6.57-6.63(2H,m),6.84-7.13(6H,m),7.41-7.49(1H,m),8.20(1H,d,J=7Hz),8.41(1H,d,J=7Hz)

実施例80

塩化オキサリル（95mg）のジクロロメタン（10ml）溶液に、-78℃でジメチルスルホキシド（117mg）を加えた。混合物を-15℃まで昇温させ、４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（６－ヒドロキシヘキス－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（450mg）のジクロロメタン（10ml）溶液をそれに加えた。同温度で10分間攪拌したのち、反応混合物にトリエチルアミン（343mg）を加え、同温度で５分間攪拌した。生じた溶液を外界温度まで昇温させ、水中に注いだ。混合物をクロロホルム（15mlx3）で抽出し、有機層を食塩水で洗った。溶液を硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を蒸発させて、４－〔２－（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－ホルミルペント－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（546mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.50-1.91(6H,m),2.11-2.23(2H,m),2.27(3H,s),2.50(2H,t,J=5Hz),3.31(1H,q,J=5Hz),3.34(3H,s),3.79(3H,s),3.85-4.00(2H,m),4.27(2H,t,J=5Hz),6.60-6.68(2H,m),6.81-7.12(6H,m),7.42-7.51(1H,m),8.21(1H,d,J=7Hz),8.41(1H,d,J=7Hz),9.89(1H,s)

実施例81

４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニル）アミノプロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－シアノフェニルメチル）オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（360mg）のキシレン（８ml）溶液に、アジ化トリメチル錫（218mg）を加え、溶液を120℃で３日間攪拌した。溶液を外界温度まで冷却し、12Ｎ塩酸（10ml）を溶液に加えて、テトラゾール化合物の錫塩および過剰の試薬を分解させた。つぎに、溶液を０℃で飽和水酸化ナトリウム水溶液によりpH７に調整し、溶液を酢酸エチル（50mlx3）で抽出した。有機層を食塩水で洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を蒸発させて、粗製品を得た。この粗製品をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（SiO_2 30ｇ、２～25%メタノール含有クロロホルム）により精製して、４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（テトラゾール－５－イル）フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（227mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):2.15(3H,br s),2.14-2.26(2H,m),3.17(2H,q,J=5Hz),3.40(3H,s),3.57(3H,s),4.20(2H,t,J=5Hz),4.95(1H,d,J=12Hz),5.22(1H,d,J=12Hz),6.55-6.64(2H,m),6.80(1H,s),6.92-7.08(6H,m),7.23(1H,br),7.43(1H,dd,J=2,8Hz),7.78(2H,d,J=8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz)

実施例82

４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（275mg）とＯ－メチルイソ尿素（44m

g）とのエタノール（5ml）中混合物を、３日間、還流下に加熱した。減圧下で溶媒を蒸発させ、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（SiO_2 17ｇ、１～80%メタノール含有クロロホルム）により精製して、４－〔２－（３－グアニジノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（53mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.40-1.97(6H,m),2.06-2.20(2H,m),2.27(6H,s),2.28(3H,s),2.29-2.41(4H,m),2.50(1H,br),3.04(2H,br),3.30(3H,s),3.42(2H,br),3.76(3H,s),3.78(2H,br),3.82-4.01(2H,m),4.25(2H,br),6.55-6.68(2H,m),6.81-7.09(5H,m),7.28(1H,s),7.42(1H,dd,J=2,8Hz),7.99(1H,d,J=8Hz),8.29(1H,br)

実施例83

実施例６と同様にして、次の化合物を得た。

４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－アミノブト－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.81-1.99(4H,m),2.05-2.14(2H,m),2.24(3H,s),3.08(2H,br),3.29(2H,br),3.30(3H,s),3.70(3H,s),3.76-3.96(2H,m),4.14(2H,t,J=5Hz),5.07(1H,br),6.54-6.61(2H,m),6.85-7.04(4H,m),7.25(1H,s),7.37(1H,dd,J=2,8Hz),8.14(1H,d,J=8Hz),8.38(1H,d,J=8Hz)

実施例84

４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（フェノキシカルボニルアミノ）ブト－１－イル〕－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（200mg）のＮ,Ｎ－ジメチルホルムアミド（5ml）溶液に、１－メチルピペラジン（88μl）を加え、溶液を80℃で７時間攪拌した。溶液を酢酸エチル（15ml）で希釈し、水（20mlx4）および食塩水で順次洗った。溶媒を硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下で除去した。粗製品をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（SiO_2 25ｇ、クロロホルム－メタノール２～10%）により精製して、４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－〔（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルアミノ〕ブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（124mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.60-1.81(4H,m),2.13-2.22(2H,m),2.29(6H,s),2.39(4H,br),3.79(3H,s),3.25-3.51(8H,m),3.32(3H,s),3.75-3.99(2H,m),4.26(2H,t,J=5Hz),6.57-6.71(2H,m),6.92-7.18(6H,m),7.48(1H,dd,J=2,8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.41(1H,d,J=8Hz)

実施例85

実施例84と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－〔（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルアミノ〕ブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.65-1.90(4H,m),2.29(3H,s),2.30(6H,s),2.77(1H,t,J=11Hz),3.29(2H,q,J=5Hz),3.32(3H,s),3.78(3H,s),3.85-4.11(6H,m),4.25(2H,t,J=5Hz),6.55-6.70(2H,m),6.92-7.13(5H,m),7.45(1H,dd,J=2,8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz)

２）４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イル〕オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－ウレイドブト－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.45-1.80(4H,m),2.01-2.11(2H,m),2.27(3H,s),3.22-3.31(2H,m),3.30(3H,s),3.65-3.77(2H,m),3.71(3H,s),4.22(2H,t,J=5Hz),5.16(2H,br),6.48(1H,s),6.71(1H,d,J=8Hz),6.90-7.15(5H,m),7.41(1H,dd,J=2,8Hz),8.11(1H,d,J=8Hz),8.35(1H,d,J=8Hz)

実施例86

４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イルオキシ〕ベンゾイルアミノ〕－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（フェノキシカルボニルアミノ）ブト－１－イル〕－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（150mg）のＮ,Ｎ－ジメチルホルムアミド（５ml）溶液に、ジメチルアミン塩酸塩（40mg）を加え、混合物を80℃で７時間攪拌した。混合物を外界温度まで冷却し、酢酸エチル（15ml）で希釈した。溶液を水（15mlx5）および食塩水で洗い、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下で溶媒を除去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（SiO_2 20ｇ、クロロホルム－メタノール１～５％）により精製して、４－〔２－〔３－（第三級ブトキシカルボニルアミノ）プロプ－１－イルオキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（Ｎ,Ｎ－ジメチルウレイド）ブト－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド（115mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.40(9H,s),1.60-1.87(4H,m),2.06-2.18(2H,m),2.28(3H,s),2.90(6H,s),3.30(2H,q,J=5Hz),3.34(3H,s),3.79(3H,s),3.85-4.02(2H,m),4.23(2H,t,J=5Hz),6.57-6.64(2H,m),6.90-7.10(5H,m),7.44(1H,dd,J=2,8Hz),8.20(1H,d,J=8Hz),8.41(1H,d,J=8Hz)

実施例87

４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－カルボキシメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（128mg）のメタノール（５ml）溶液に、トリメチルシリルジアゾメタン（５ml、2.0Ｍ　ｎ－ヘキサン溶液）を滴下し、外界温度で30分間攪拌した。溶液を減圧下で濃縮し、残留物を分取薄層シリカゲル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、50：５：１）により精製して、４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシカルボニルメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（85mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.39(9H,s),1.45-1.37(8H,m),2.00-2.10(2H,m),2.26(3H,s),2.29(3H,s),2.30-2.42(6H,m),3.18-3.27(2H,m),3.30(3H,s),3.45-3.51(2H,m),3.63(2H,br),3.79(3H,s),3.87-3.96(2H,m),4.22-4.29(2H,m),4.54(2H,s),6.53-6.13(2H,m),6.77-6.85(1H,m),6.89(1H,br),6.92-7.02(2H,m),7.02-7.10(1H,m),7.43-7.47(1H,m),8.14-8.19(1H,m),8.40-8.45(1H,m)

実施例88

実施例８と同様にして、次の化合物を得た。

４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－ジメチルアミノカルボニルメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.39(9H,s),1.48-1.58(2H,m),1.63-1.88(6H,m),1.97-2.09(2H,m),2.28(3H,s),2.30(3H,s),2.31-2.42(6H,m),2.99(3H,s),3.02(3H,s),3.17-3.27(2H,m),3.32(3H,s),3.50(2H,br),3.63(2H,br),3.83-3.97(2H,m),4.22-4.29(2H,m),4.67(2H,s),6.53-6.63(2H,m),6.80-6.90(2H,m),6.96-7.09(3H,m),7.93(1H,t,J=6Hz),8.14(1H,d,J=6Hz),8.38(1H,d,J=7Hz)

実施例89

４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－エトキシカルボニルメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（102mg）の7.5Ｎメタノール性アンモニア（５ml）溶液を、外界温度で24時間攪拌した。溶液を減圧下で濃縮して、４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－アミノカルボニルメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペン

ト－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（92mg）を得た。
NMR($CDCl_3$,δ):1.37(9H,s),1.48-1.60(2H,m),1.60-1.75(4H,m),1.75-1.88(2H,m),1.97-2.08(2H,m),2.27(3H,s),2.28(3H,s),2.30-2.41(6H,m),3.17-3.27(2H,m),3.30(3H,s),3.47(3H,s),3.52-3.62(2H,m),3.90-3.97(2H,m),4.16-4.29(4H,m),5.85(1H,br),6.57(1H,d,J=7Hz),6.67(1H,s),6.75-6.90(2H,m),7.00(1H,d,J=7Hz),7.07-7.17(2H,m),8.00(1H,s),8.18-8.21(1H,m),8.25(1H,d,J=7Hz)

実施例90

実施例89と同様にして、次の化合物を得た。
４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メチルアミノカルボニルメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド
NMR($CDCl_3$,δ):3.37(9H,s),1.45-1.77(6H,m),1.77-1.88(2H,m),1.96-2.08(2H,m),2.28(3H,s),2.29(3H,s),2.29-2.40(6H,m),2.82-2.83(3H,s),3.18-3.27(2H,m),3.30(3H,s),3.43-3.50(3H,m),3.57(2H,br),3.90-3.97(2H,m),4.18-4.30(3H,m),6.57(1H,d,J=6Hz),6.65(1H,s),6.76-6.83(2H,m),7.00(1H,d,J=7Hz),7.06-7.15(2H,m),7.45(1H,t,J=7Hz),8.16-8.22(2H,m)

実施例91

実施例８および16と同様にして、次の化合物を得た。
４－（２－アミノベンゾイル）アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.35-1.66(4H,m),1.66-1.82(2H,m),2.22(3H,s),2.40(2H,t,J=7Hz),2.73(3H,s),2.77-3.11(3H,m),3.17(3H,s),3.28-3.56(3H,m),3.76-4.17(3H,m),4.35-4.52(1H,m),6.63(1H,d,J=9Hz),6.79(1H,s),6.91(1H,dd,J=9,9Hz),6.98-7.11(2H,m),7.22(2H,d,J=9Hz),7.36(1H,dd,J=9,9Hz),7.54(2H,d,J=9Hz),7.69(1H,d,J=9Hz)

実施例92

実施例６および16と同様にして、次の化合物を得た。
１）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）アミノ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド三塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.36-1.65(4H,m),1.66-1.92(4H,m),2.23(3H,s),2.38(2H,t,J=7Hz),2.68-2.77(3H,m)2.77-3.12(4H,m)3.18(3H,s),3.22(2H,t,J=7Hz),3.28-3.56(3H,m),3.63(3H,s),3.75-4.32(4H,m),4.42(1H,m),6.58-6.69(2H,m),6.78(1H,d,J=8Hz),6.83(1H,s),6.86-6.96(2H,m),7.03(1H,d,J=8Hz),7.34(1H,dd,J=8,8Hz),7.61(1H,d,J=8Hz),7.67(1H,d,J=8Hz),7.91-8.17(3H,m),9.23(1H,s)
２）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.34-1.66(4H,m),1.66-1.83(2H,m),2.04-2.24(2H,m),2.32-2.46(2H,m),2.74(3H,s),2.79-3.12(4H,m),3.22(3H,s),3.29-3.58(3H,m),3.63-4.19(7H,m),4.28-4.52(3H,m),6.80-7.08(4H,m),7.08-7.36(4H,m),7,58(1H,dd,J=9,9Hz),8.02(1H,d,J=9Hz),8.13(2H,br s),8.28(1H,d,J=9Hz)
３）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.28-1.82(8H,m),1.90-2.51(11H,m),2.64(6H,s),2.74-3.06(3H,m),3.18(3H,s),3.22-4.08(6H,m),4.29-4.41(2H,m),4.51(1H,m),6.64(1H,d,J=8Hz),6.75-7.20(5H,m),7.27(1H,d,J=8Hz),7.58(1H,m),7.94-8.32(5H,m)
４）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－２－クロロ

－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イルカルボニル）ペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.39-1.68(4H,m),1.69-1.90(2H,m),1.92-2.12(2H,m),2.31-2.50(2H,m),2.73(3H,br s),2.79-3.10(4H,m),3.17-3.61(7H,m),3.92-4.26(5H,m),4.42(1H,m),6.77(1H,m),6.92-7.23(6H,m),7.34-7.58(3H,m),7.81(1H,s),7.90-8.14(3H,m)
５）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ－５－メチルベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.50-1.93(8H,m),2.28(3H,s),2.28-2.36(2H,m),2.31(3H,s),2.79(3H,s),3.09-3.20(2H,m),3.29(3H,s),3.80(3H,s),3.85-4.04(2H,m),4.18-4.28(2H,m),6.57-6.66(2H,m),6.80-6.95(4H,m),7.20-7.25(1H,m),7.72(1H,br),8.51(1H,br)
６）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ－４－クロロベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.45-1.86(8H,m),2.23(3H,s),2.29-2.43(2H,m),2.78(3H,s),3.05-3.16(2H,m),3.23(3H,s),3.78(3H,s),3.82-4.03(2H,m),4.18-4.32(2H,m),6.54-6.64(2H,m),6.78-7.08(4H,m),7.94(1H,d,J=8Hz),8.58(1H,br)
７）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ－４－メトキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.40-1.89(6H,m),2.28(3H,s),2.30-2.61(6H,m),2.70-3.04(4H,m),3.08-3.25(2H,m),3.28(3H,s),3.80(6H,s),3.82-4.08(2H,m),4.26(2H,br),6.49-6.66(4H,m),6.78-7.00(3H,m),7.93-8.02(1H,m),8.30(1H,br),8.52(2H,br)
８）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.42(2H,br),1.53(2H,br),1.74(2H,br),2.03(2H,br),2.13-2.20(2H,m)2.30-2.38(2H,m),2.66(3H,s),2.67(3H,s),2.94(4H,br),3.20(3H,s),3.28-3.40(2H,m),3.73(3H,s),3.82-4.08(4H,m),4.33-4.40(2H,m),4.47-4.57(1H,m),6.82-7.00(4H,m),7.10-7.29(4H,m),7.53-7.60(1H,m),8.00(1H,d,J=7Hz),8.22-8.30(1H,m)
９）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メチル－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.40-1.53(2H,m),1.53-1.65(2H,m),1.66-1.82(2H,m),2.01-2.13(2H,m),2.18(3H,s),2.23(3H,s),2.36-2.46(2H,m),2.73-2.74(3H,s),2.78-3.08(6H,m),3.18(3H,s),4.27(2H,br),4.40-4.50(1H,m),6.65(1H,d,J=6Hz),6.82(1H,s),6.98-7.13(3H,m),7.17-7.30(2H,m),7.45-7.57(2H,m),7.22(1H,d,J=6Hz),9.67(1H,s)
10）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－エトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.23(3H,t,J=6Hz),1.38-1.50(2H,m),1.50-1.65(2H,m),1.65-1.82(2H,m),2.05-2.17(2H,m),2.21(3H,s),2.32-2.43(2H,m),2.70-2.73(3H,m),2.80-3.08(7H,m),3.18(3H,s),3.22-3.55(6H,m),3.92-4.15(2H,m),4.32-4.48(4H,m),6.63(1H,d,J=7Hz),6.83(1H,s),6.89-6.92(2H,m),7.02(1H,d,J=7Hz),7.13(1H,t,J=6Hz),7.29(1H,d,J=7Hz),7.58(1H,t,J=7Hz),7.99(1H,d,J=7Hz),8.18-8.27(1H,m)

実施例93

実施例１および16と同様にして、次の化合物を得た。
１）４－〔２－（ジメチルアミノ）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.36-1.65(4H,m),1.67-1.82(2H,m),2.22(3H,s),2.38(2H,t,J=7Hz),2.64-3.14(12H,m),3.18(3H,s),3.28-3.42(2H,m),3.50(1H,m),3.73(3H,s),3.79-4.14(3H,m),4.42(1H,m),6.64(1H,d,J=8Hz),6.82(1H,s),6.83-6.97(2H,m),7.02(1H,d,J=8Hz),7.35(1H,m),7.52-7.67(2H,m),8.07(1H,d,J=8Hz),8.14(1H,m)

２）４－〔２－（ジメチルアミノスルホニル）ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.38.1.64(4H,m),1.67-1.82(2H,m),2.23(3H,s),2.38(2H,t,J=7Hz),2.69(6H,s),2.74(3H,s),2.80-3.12(4H,m),3.18(3H,s),3.23-3.52(2H,m),3.59(3H,s),3.81-4.16(3H,m),4.44(1H,m),6.66(1H,d,J=9Hz),6.77-6.96(3H,m),7.02(1H,d,J=9Hz),7.51(1H,m),7.60-7.92(4H,m)

３）３－メトキシ－４－〔２－（モルホリノスルホニル）ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.37-1.65(4H,m),1.66-1.83(2H,m),2.23(3H,s),2.32-2.44(2H,m),2.73(3H,s),2.81-3.10(6H,m),3.18(3H,s),3.25-3.71(11H,m),3.80-4.20(3H,m),4.42(1H,m),6.66(1H,d,J=8Hz),6.76-6.96(3H,m),7.02(1H,d,J=8Hz),7.53(1H,d,J=8Hz),7.62-7.93(4H,m),8.31(1H,s)

４）４－〔２－（イソプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.39(6H,d,J=7Hz),1.38-1.66(4H,m),1.67-1.83(2H,m),2.22(3H,s),2.39(2H,t,J=7Hz),2.76(3H,s),2.82-3.11(4H,m),3.18(3H,s),3.74(3H,s),3.79-4.18(5H,m),4.36-4.52(1H,m),4.98(1H,m),6.65(1H,d,J=8Hz),6.73-7.17(5H,m),7.30(1H,d,J=8Hz),7.54(1H,dd,J=8,8Hz),8.04(1H,d,J=8Hz),8.31(1H,d,J=8Hz)

実施例94

実施例16および30と同様にして、次の化合物を得た。

４－〔２－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕フェニル〕ビニル〕－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.33-1.64(4H,m),1.64-1.83(2H,m),1.95-2.17(2H,m),2.22(3H,s),2.39(2H,t,J=7Hz),2.72(3H,s),2.78-3.10(6H,m),3.15および3.16(計3H,s),3.28-3.60(2H,m),3.64(3H,s),3.80-4.20(5H,m),4.42(1H,m),6.44-7.60(12H,m),8.00-8.26(2H,m)

実施例95

実施例１および43と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－（２－ヒドロキシベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニル－４－メチル〕フェニルメトキシ〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

MASS(m/z):637(M+1)

２）４－（２－ヒドロキシ）ベンゾイルアミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルメトキシプロプ－１－イル〕オキシ〕フェニルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):2.05-2.16(2H,m),2.28(3H,s),2.33-2.40(4H,m),3.35(3H,s),3.40-3.45(2H,m),3.57-3.63(2H,m),3.69(2H,t,J=7.5Hz),3.78(3H,s),3.94-4.11(2H,m),4.12(2H,s),6.79-7.04(7H,m),7.18(1H,t,J=7Hz),7.42(1H,t,J=7Hz),7.50(1H,d,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz),8.81(1H,s)

３）４－（２－ヒドロキシ）ベンゾイル－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔（Ｅ）－５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニル－４－ペンテン－１－イル〕オキシ－４－メチル〕フェニル－Ｎ－メチルベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.33-1.53(2H,m),1.84-2.05(4H,m),2.27(3H,s),2.33(3H,s),2.40(3H,s),2

.30-4.13(11H,m),3.32(3H,s),4.67(1H,m),6.30(1H,d,J=15Hz),6.55-6.66(2H,m),6.78-7.56(8H,m),8.18(1H,m)

実施例96

実施例４、16および45と同様にして、次の化合物を得た。

４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－（３－カルボキシプロプ－１－イル）オキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.38-1.52(2H,m),1.52-1.65(2H,m),1.67-1.93(4H,m),2.05-2.16(2H,m),2.01(3H,s),2.29-2.43(5H,m),2.73(3H,s),3.22-3.56(4H,m),3.82-4.14(5H,m),4.30-4.47(3H,m),8.63(1H,d,J=7Hz),8.81(1H,s),8.88-8.92(2H,m),7.03(1H,d,J=7Hz),7.13(1H,t,J=7Hz),7.27(1H,d,J=7Hz),7.56(1H,t,J=6Hz),7.96(1H,d,J=6Hz),8.22(1H,d,J=7Hz)

実施例97

製造例４および実施例16と同様にして、次の化合物を得た。

４－（２－アミノベンジルオキシ）－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.35-1.64(4H,m),1.64-1.81(2H,m),2.23(3H,s),2.39(2H,t,J=7Hz),2.75(3H,s),2.80-3.09(2H,m),3.16(3H,s),3.27-3.50(2H,m),3.57(3H,s),3.73-4.15(5H,m),4.43(1H,m),5.08(2H,s),6.64(1H,d,J=8Hz),6.76-7.42(9H,m)

実施例98

実施例14および16と同様にして、次の化合物を得た。

４－〔２－（３－アセチルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.36-1.50(2H,m),1.50-1.64(2H,m),1.67-1.84(2H,m),1.92-2.06(2H,m),2.22(3H,s),2.32-2.44(2H,m),2.50(3H,s),2.74および2.75(計3H,s),2.81-3.08(3H,m),3.19(3H,s),3.30-3.54(3H,m),3.70(3H,s),3.79-4.16(3H,m),4.20-4.30(2H,m),6.64(1H,d,J=8Hz),6.81(1H,s),6.83-6.97(2H,m),7.03(1H,d,J=8Hz),7.12(1H,dd,J=8,8Hz),7.25(1H,d,J=8Hz),7.51-7.61(1H,m),7.92-8.08(2H,m),8.28(1H,d,J=8Hz)

実施例99

実施例15および26と同様にして、次の化合物を得た。

４－〔２－（３－ジメチルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):1.46-1.87(6H,m),2.26(3H,s),2.37(2H,t,J=5Hz),2.50(2H,br),2.76(6H,s),2.77(6H,s),3.02-3.30(3H,m),3.29(3H,s),3.79(3H,s),3.80-4.04(2H,m),4.33(2H,br),6.54-6.62(2H,m),6.72-7.13(5H,m),8.05(1H,d,J=8Hz),8.37(1H,d,J=8Hz),9.85(1H,br)

実施例100

実施例８および45と同様にして、次の化合物を得た。

４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－（５－ジメチルアミノカルボニル）ペント－１－イルオキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.51-2.19(10H,m),2.27(3H,s),2.35(2H,t,J=6Hz),2.92(3H,s),3.00(3H,s),3.32(3H,s),3.77(3H,s),3.80-4.08(2H,m),4.29(2H,t,J=4Hz),6.55-6.76(2H,m),6.83-7.20(5H,m),7.46(1H,br),8.21(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz)

実施例101

実施例16および41と同様にして、次の化合物を得た。

４－（２－アミノベンゾイル）アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フ

ェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.38-1.66(4H,m),1.68-1.83(2H,m),2.24(3H,s),2.34-2.44(2H,m),2.76(3H,s),2.80-3.09(3H,m),3.19(3H,s),3.30-3.53(3H,m),3.64(3H,s),3.80-4.51(4H,m),6.60-6.76(2H,m),6.79-6.97(4H,m),7.05(1H,d,J=9Hz),7.26(1H,dd,J=9,9Hz),7.58-7.72(2H,m),9.19(1H,br s)

実施例102

４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（7.35ｇ）のエタノール（230ml）溶液に、80℃で、0.5M硫酸エタノール溶液（22.3ml）を加えた。混合物を外界温度で24時間攪拌した。ガラス漏斗を通して沈澱を▲濾▼別し、エタノールで洗った。得られた白色の結晶性固体を７日間風乾して、４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド硫酸塩（5.2ｇ）を得た。
NMR(DMSO-d_6,δ):1.35-1.63(4H,m),1.65-1.81(2H,m),2.04-2.40(14H,m),2.96(2H,t,J=7Hz),3.03-4.06(12H,m),4.35(2H,t,J=7Hz),6.64(1H,d,J=8Hz),6.83(1H,s),6.89(1H,d,J=8Hz),6.98(1H,s),7.02(1H,d,J=8Hz),7.13(1H,dd,J=8,8Hz),7.26(1H,d,J=8Hz),7.59(1H,dd,J=8,8Hz),8.01(1H,d,J=8Hz),8.23(1H,d,J=8Hz)

実施例103

４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド（10.7ｇ）のエタノール（155ml）溶液に、80℃で、Ｌ－（＋）酒石酸（2.43ｇ）のエタノール（60ml）溶液を加えた。溶液を外界温度で１時間攪拌した。減圧下で溶媒を除去し、得られた固体を蒸留水（１ｌ）に溶解させ、溶液をミクロフィルターで▲濾▼過し、▲濾▼液を凍結乾燥して、４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド酒石酸塩（5.2ｇ）を得た。
NMR(DMSO-d_6,δ):1.34-1.62(4H,m),1.66-1.81(2H,m),2.03-2.38(14H,m),2.96(2H,t,J=7Hz),3.18(3H,s),3.37-3.48(4H,m),3.74(3H,s),3.80-4.04(4H,m),4.33(2H,t,J=7Hz),6.64(1H,d,J=8Hz),6.83(1H,s),6.89(1H,d,J=8Hz),6.97(1H,s),7.02(1H,d,J=8Hz),7.13(1H,dd,J=8,8Hz),7.26(1H,d,J=8Hz),7.58(1H,dd,J=8,8Hz),8.02(1H,d,J=8Hz),8.25(1H,d,J=8Hz)

実施例104

実施例16および45と同様にして、次の化合物を得た。

１）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチルフェニル)ベンズアミド塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):2.06-2.32(5H,m),2.87-3.05(2H,m),3.26(3H,s),3.72(3H,s),4.35(2H,t,J=7Hz),6.84-6.98(2H,m),7.08-7.36(6H,m),7.58(1H,dd,J=8,8Hz),7.89-8.16(4H,m),8.26(1H,d,J=8Hz)

２）４－〔３－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.38-1.78(12H,m),1.98-2.07(4H,m),2.24(3H,s),2.36(2H,t,J=8Hz),2.43-2.54(1H,m),2.67(3H,s),2.69(3H,s),2.92-3.01(2H,m),3.19(3H,s),3.64(3H,s),3.88-4.03(1H,m),4.13(2H,t,J=8Hz),4.48-4.57(1H,m),6.65(1H,d,J=8Hz),6.82(1H,s),6.88-6.93(2H,m),7.03(1H,d,J=8Hz),7.17(1H,d,J=8Hz),7.38-7.52(3H,m),7.62(1H,d,J=8Hz),7.92-8.01(2H,br),9.33(1H,s)
ESI-MASS(m/z):688(M+H)

３）４－〔Ｎ－メチル－２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕ア

ミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－メチル－２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.32-1.65(8H,m),2.27(3H,s),2.33-2.40(2H,m),2.77(3H,s),2.86-3.02(5H,m),3.12(3H,s),3.33-3.70(13H,m),4.00-4.10(1H,m),4.40-4.50(1H,m),6.58-6.78(6H,m),6.84-7.00(3H,m),7.20(1H,t,J=8Hz),7.89-7.97(2H,br s)
ESI-MASS(m/z):674
４）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔４－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕フェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.37-1.73(8H,m),2.12-2.20(2H,m),2,37(2H,t,J=8Hz),2.72-2.79(4H,m),2.89-3.01(4H,m),3.29-3.40(4H,m),3.80(3H,s),3.89(2H,t,J=8Hz),3.98-4.04(1H,m),4.34-4.41(3H,m),6.80-6.86(3H,m),7.04-7.19(4H,m),7.29(1H,t,J=8Hz),7.59(1H,t,J=8Hz),7.95-8.06(4H,m),8.27(1H,d,J=8Hz)
ESI-MASS(m/z):646(M+H)
５）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルホモピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.47-1.89(8H,m),2.27(3H,s),2.30-2.46(4H,m),2.77-2.96(2H,m),3.15-3.63(11H,m),3.30(3H,s),3.76-4.04(5H,m),4.15-4.40(2H,m),6.60(2H,br),6.78-7.11(5H,m),7.43(1H,br),7.98-8.05(1H,m),8.29-8.37(1H,m),8.52(2H,br)
６）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（２－ジメチルアミノエチル）アミノカルボニル〕ペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.38-1.87(6H,m),2.06-2.45(4H,m),2.22(3H,s),2.25-2.44(2H,m),2.76(3H,s),2.80(3H,s),3.07-3.22(2H,m),3.24(3H,s),3.54(2H,br),3.77-3.95(2H,m),3.80(3H,s),4.24(2H,br),6.57-6.62(2H,m),6.80-7.08(4H,m),7.39-7.47(1H,m),7.97(1H,d,J=8Hz),8.20-8.38(2H,m)
７）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－〔Ｎ－（２－ジメチルアミノエチル）－Ｎ－メチルアミノカルボニル〕ペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.37-1.82(6H,m),2.22(3H,s),2.29-2.47(4H,m),2.85(6H,s),3.02(3H,s),3.08-3.33(6H,m),3.26(3H,s),3.58-3.95(4H,m),3.83(3H,s),4.28(3H,br),6.55-6.65(2H,m),6.82-7.06(5H,m),7.39-7.47(1H,m),8.03(1H,d,J=8Hz),8.33(1H,br)
８）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－〔Ｎ－（３－ジメチルアミノプロプ－１－イル）カルバモイル〕ペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.37-1.99(8H,m),2.23(3H,s),2.25-2.44(4H,m),2.76(6H,s),3.05-3.41(6H,m),3.22(3H,s),3.78-3.94(2H,m),4.22(2H,br),6.56(2H,br),6.81-7.04(5H,m),7.39(1H,br),8.00(1H,br),8.29(1H,br),8.56(3H,br)
９）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－〔Ｎ－（３－ジメチルアミノプロプ－１－イル）－Ｎ－メチルカルバモイル〕ペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.33-1.99(8H,m),2.26(3H,S),2.26-2.47(4H,m),2.78(6H,s),2.96(3H,s),3.05-3.39(6H,m),3.26(3H,s),3.79-3.99(2H,m),3.78(3H,s),4.30(2H,br),6.62(2H,m),6.83-7.08(5H,m),7.45(1H,br),8.01(1H,br),8.35(1H,br),8.64(2H,br)
10）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ヒドロキシピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):1.32-2.06(10H,m),2.23(3H,s),2.25-2.40(4H,m),2.99-3.07(2H,m),3.23(3H,s),3.43-4.00(7H,m),4.23(2H,br),6.52-6.63(2H,m),6.81-7.12(4H,m),7.38-7.49(1H,m),7.97(1H,br),8.30(1H,br)

11）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－アミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):1.40-1.85(12H,m),2.24(3H,s),2.28-2.45(2H),2.87-3.11(7H,m),3.25(3H,s),3.84-4.00(2H,m),3.79(3H,s),4.25(2H,br),6.54-6.63(2H,m),6.95-7.09(4H,m),7.43(1H,br),8.04(1H,br),8.41(1H,br)

12）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）アミノカルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド三塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):1.32-1.80(6H,m),2.04-2.15(2H,m),2.26(3H,s),2,90-3.36(10H,m),3.24(3H,s),3.76(3H,s),3.85-4.02(2H,m),4.26(2H,br),6.54-6.63(2H,m),6.75-7.09(4H,m),7.40-7.49(1H,m),8.00(1H,d,J=8Hz),8.39(1H,br),8,62(1H,br)

13）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－〔ビス（２－ヒドロキシエト－１－イル）アミノ〕カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):1.50-1.88(6H,m),2.05-2.54(4H,m),2.28(3H,s),3.03(2H,br),3.30(3H,s),3.41-3.69(8H,m),3.78(3H,s),3.82-4.00(2H,m),4.23(2H,br),6.59-6.69(2H,m),6.81-7.22(4H,m),7.46(1H,br),8.09(1H,br),8.38(1H,br)

14）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（２，２－ジメチルヒドラジノ）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):1.36-1.82(6H,m),2.22(3H,s),2.26-2.39(4H,m),2.88-3.11(2H,m),3.11(6H,s),3.32(3H,s),3.70-3.94(2H,m),3.77(3H,s),4.21(2H,br),6.52-6.61(2H,m),6.80-7.14(5H,m),7.42(1H,br),7.97(1H,br),8.25(3H,br)

15）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（カルバモイルメチルアミノ）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):1.20-1.68(6H,m),2.08-2.41(7H,m),2.97-3.35(5H,m),3.29-4.27(9H),6.38-7.04(6H,m),7.90-8.29(6H,m)

16）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（２－カルバモイルエチルアミノ）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):1.36-1.81(6H,m),2.06-2.40(6H,m),2.23(3H,s),3.13(2H,br),3.22(3H,s),3.32(2H,br),3.55-3.93(2H,m),3.78(3H,s),4.22(2H,br),6.53-6.63(2H,m),6.81-7.04(5H,m),7.39(1H,br),7.77(1H,br),7.99(1H,br),8.28-8.47(3H,m)

17）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ピリジルアミノカルボニル）ペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):1.25-1.83(6H,m),2.10-2.49(4H,m),2.22(3H,s),2.90-3.37(2H,m),3.23(3H,s),3.68-3.95(2H,m),3.76(3H,s),4.21(2H,br),6.51-6.63(2H,m),6.66-7.04(6H,m),7.88-8.51(7H,m)

18）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－〔４－（ジエチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR($CDCl_3$,δ):1.38(6H,t,J=8Hz),1.45-1.90(10H,m),1.93-2.08(2H,m),2.28(3H,s),2.30-2.48(2H,m),2.92-3.23(5H,m),3.25-3.36(4H,m),3.29(3H,s),3.69(3H,s),3.75-4.08(3H,m),4.28(2H,br),6.54-6.65(2H,m),6.81-7.08(5H,m),7.45(1H,br),7.93(1H,br),8.36(1H,br)

19）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔６－（４－メチルピペラジン－１－イル）ヘキス－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド三塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.36-1.94(8H,m),2.21(3H,s),2.25-2.42(2H,m),2.90-3.39(6H,m),3.10(3H,s),3.19(3H,s),3.58-4.04(6H,m),3.82(3H,s),4.18(1H,br),6.46-6.63(2H,m),6.74-6.98(4H,m),7.38(1H,br),7.97(1H,br),8.28(1H,br),8.45(2H,br)
20）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－（２－ピリジル）フェニルメチル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド二塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):2.29(3H,s),2.39(2H,br),3.17(2H,br),3.37(3H,s),3.44(3H,br),4.12-4.30(2H,m),4.73(1H,br),5.07(1H,br),6.61(1H,br),6.70-6.79(2H,m),6.94-7.03(2H,m),7.12(1H,d,J=8Hz),7.38-7.47(3H,m),7.89-8.23(5H,m),8.73(3H,br),8.90(1H,br)
21）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－〔（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルアミノ〕ブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド二塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.62-2.04(4H,m),2.23(3H,s),2.27-2.40(2H,m),2.74(3H,s),3.03-3.14(2H,m),3.22(3H,s),3.35-3.51(4H,m),3.78(3H,s),3.85-3.96(2H,m),4.26(2H,br),6.57-6.64(2H,m),6.67-7.09(5H,m),7.42(1H,m),7.96(1H,d,J=8Hz),8.30(1H,d,J=8Hz),8.60(3H,br)
22）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイルアミノ〕－３－メトキシ－Ｎ－〔２－〔４－〔（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルアミノ〕ブト－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド二塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.58-2.12(10H,m),2.27(3H,s),2.30-2.48(2H,m),2.57-2.81(8H,m),3.05-3.31(7H,m),3.27(3H,s),3.75-3.99(5H,m),4.27(1H,br),6.57-6.63(2H,m),6.85-7.09(5H,m),7.44(2H,br),7.96(1H,br),8.34(1H,br),8.75(1H,br)
23）４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－〔２－（４－ウレイドブト－１－イル）オキシ－４－メチルフェニル〕－Ｎ－メチルベンズアミド塩酸塩
NMR($CDCl_3$,δ):1.42-1.81(4H,m),2.00-2.15(2H,m),2.25(3H,s),2.88(2H,t,J=5Hz),2.92(2H,br),3.30(3H,s),3.63-3.80(2H,m),3.71(3H,s),4.21(2H,t,J=5Hz),6.51(1H,s),6.71(1H,d,J=8Hz),6.85-7.12(5H,m),7.44(1H,dd,J=2,8Hz),8.12(1H,d,J=8Hz),8.36(1H,d,J=8Hz)
24）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－クロロ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.34-1.50(2H,m),1.50-1.62(2H,m),1.65-1.80(2H,m),1.98-2.17(4H,m),2.22(3H,s),2.30-2.40(2H,m),2.66(3H,s),2.67(3H,s),2.85-3.05(3H,m),3.17(3H,s),3.33(1H,br),3.80-4.07(3H,m),4.33-4.42(2H,m),4.47-4.57(1H,m),6.68(1H,d,J=7Hz),6.82(1H,s),7.08-7.23(3H,m),7.29(1H,d,J=7Hz),7.41(1H,s),7.68(1H,t,J=6Hz),7.92(1H,d,J=7Hz),8.09(1H,d,J=7Hz)
25）３－（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ－４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド三塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.37-1.50(2H,m),1.50-1.62(2H,m),1.67-1.80(2H,m),1.97-2.19(4H,m),2.22(3H,s),2.30-2.41(2H,m),2.57(1H,s),2.92(6H,br),3.17(3H,s),3.68(1H,br),3.93(2H,br),4.10(2H,br),4.40(2H,br),6.66(1H,d,J=6Hz),6.78-6.87(2H,m),6.95-7.04(2H,m),7.12(1H,t,J=6Hz),7.29(1H,d,J=7Hz),7.57(1H,t,J=6Hz),7.93(1H,d,J=6Hz),8.14(1H,d,J=7Hz)
26）２－アミノ－４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド三塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.41-1.51(2H,m),1.51-1.66(1H,m),1.74-1.84(1H,m),1.98-2.12(4H,m),2.30-2.40(2H,m),2.67(3H,s),2.68(3H,s),2.89-3.06(4H,m),3.16(3H,s),3.33(2H,br),3.96-4.10(4H,m),4.13-4.20(2H,m),4.47-4.58(1H,m),6.60(1H,d,J=7Hz),6.78(2H,s),6.85(1H,s),6.97-7.07(2H,m),7.13(1H,d,J=7Hz),7.27(1H,s),7.43-7.56(2H,m)

27）２－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕－５－ピリジンカルボキシアミド三塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.32-1.80(8H,m),1.97-2.20(4H,m),2.22(3H,s),2.27-2.40(3H,m),2.65(3H,s),2.67(3H,s),2.92-3.10(4H,m),3.19(3H,s),3.33(1H,br),3.80-4.07(3H,m),4.22-4.29(2H,m),6.69(1H,d,J=7Hz),6.82(1H,s),7.07-7.14(2H,m),7.20(1H,d,J=7Hz),7.56(1H,t,J=6Hz),7.66(1H,d,J=6Hz),7.78(1H,d,J=7Hz),8.00-8.04(1H,m),8.23(1H,s)

28）４－〔Ｎ－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕フェニル〕アミノ〕メチル－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド三塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.35-1.49(2H,m),1.49-1.62(2H,m),1.62-1.79(2H,m),2.01-2.16(2H,m),2.23(3H,s),2.34-2.40(2H,m),2.71および2.72(計3H,s),2.76-3.12(8H,m),3.17(3H,s),3.27-3.41(2H,m),3.41-3.54(4H,m),3.70-3.81(1H,m),3.89-3.98(1H,m),4.02-4.08(3H,m),4.25(2H,s),4.39-4.45(1H,m),6.60-6.80(6H,m),6.93(2H,s),6.98(1H,d,J=7Hz),7.10(1H,d,J=7Hz)

29）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕フェニル〕オキシメチル－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.39-1.50(2H,m),1.50-1.63(2H,m),1.65-1.82(2H,m),1.97-2.10(2H,m),2.21(3H,s),2.35-2.41(2H,m),2.71および2.72(計3H,s),2.78-3.10(7H,m),3.18(3H,s),3.29-3.41(2H,m),3.41-3.67(4H,m),3.82(1H,br),3.89-4.00(1H,m),4.00-4.12(3H,m),4.38-4.48(1H,m),4.57および4.93(計2H,s),6.61(1H,d,J=7Hz),6.69-6.97(6H,m),6.97-7.07(2H,m),7.20-7.25(1H,m)

30）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－ベンジルオキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.37-1.50(2H,m),1.50-1.63(2H,m),1.63-1.79(2H,m),1.79-1.91(2H,m),2.22(3H,s),2.39(2H,t,J=6Hz),2.60-2.77(5H,m),2.79-3.10(4H,m),3,15(3H,s),3.30-3.67(3H,m),3.77-4.12(5H,m),4.37-4.49(1H,m),5.06(2H,s),6.62(1H,d,J=6Hz),6,82(1H,s),6.90(1H,d,J=7Hz),6.97(1H,d,J=7Hz),7.03(1H,s),7.12(1H,t,J=7Hz),7.22(1H,d,J=7Hz),7.30-7.46(5H,m),7.54(1H,t,J=6Hz),7.97(1H,d,J=7Hz),8.23(1H,d,J=7Hz)

31）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－ヒドロキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.43(2H,br),1.49-1.62(2H,m),1.63-1.82(2H,m),2.00-2.40(16H,m),2.90-2.97(2H,m),3.14(3H,s),3.30-3.50(5H,m),3.89(2H,br),4.20-4.38(2H,m),6.50-6.68(2H,m),6.80(1H,s),6.87-6.99(2H,m),7.12(1H,t,J=6Hz),7.22(1H,d,J=6Hz),7.49-7.60(1H,m),7.97-8.18(2H,m)

32）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル)オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－エトキシカルボニルメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.09および1.22(計3H,t,J=6Hz),1.37-1.51(2H,m),1.51-1.66(2H,m),1.67-1.80(2H,m),2.05-2.18(2H,m),2.23(3H,s),2.38(2H,t,J=6Hz),2.73-2.74(3H,m),2.90-3.10(5H,m),3.17(3H,s),3.30-3.58(2H,m),3.80-4.00(2H,m),4.00-4.20(3H,m),4.32-4.50(3H,m),4.80(2H,s),6.62(1H,d,J=6Hz),6.82(1H,s),6.89-6.92(2H,m),7.01(1H,d,J=7Hz),7.15

(1H,t,J=6Hz),7.27(1H,d,J=7Hz),7.58(1H,t,J=6Hz),8.00(1H,d,J=6Hz),8.27(1H,d,J=7Hz)
33）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシカルボニルメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.35-1.50(2H,m),1.50-1.63(2H,m),1.63-1.90(2H,m),2.00-2.14(2H,m),2.21(3H,s),2.25-2.43(2H,m),2.71(3H,s),2.77-3.05(5H,m),3.15(3H,s),3.18-3.57(6H,m),3.70(3H,s),3.73-4.12(3H,m),4.12-4.49(3H,m),4.80(2H,s),6.63(1H,d,J=7Hz),6.70-7.20(5H,m),7.27(1H,d,J=7Hz),7.57(1H,t,J=7Hz),7.93-8.10(1H,m),8.23(1H,d,J=6Hz)
34）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－ジメチルアミノカルボニルメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.37-1.49(2H,m),1.50-1.62(2H,m),1.63-1.79(2H,m),1.98-2.10(2H,m),2.21.(3H,s),2.32-2.43(2H,m),2.71(3H,s),2.86(3H,s),2.98(3H,s),2.82-3.05(5H,m),3.15(3H,s),3.90(2H,br),4.02-4.12(2H,m),4.28-4.38(2H,m),4.38-4.48(1H,m),4.83(2H,s),6.62(1H,d,J=7Hz),6.80(1H,s),6.82-6.92(2H,m),7.00(1H,d,J=7Hz),7.12(1H,t,J=7Hz),7.23(1H,d,J=7Hz),7.55(1H,t,J=7Hz),8.20(1H,d,J=7Hz)
35）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メチルアミノカルボニルメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.38-1.51(1H,m),1.51-1.65(2H,m),1.68-1.80(2H,m),2.00-2.23(2H,m),2.22(3H,s),2.34-2.40(3H,m),2.50(3H,s),2.58(2H,br),2.62(3H,s),2.63(3H,s),2.90(4H,br),3.15(3H,s),3.88-3.97(2H,m),4.26-4.33(2H,m),4.37-4.54(2H,m),6.62(1H,d,J=7Hz),6.82(2H,s),6.88(1H,d,J=7Hz),6.97(1H,d,J=7Hz),7.12(1H,t,J=7Hz),7.22(1H,d,J=7Hz),7.57(1H,t,J=7Hz),7.90(1H,d,J=7Hz),8.12-8.25(2H,m)
36）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－アミノカルボニルメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.38-1.52(2H,m),1.52-1.67(2H,m),1.68-1.83(2H,m),2.00-2.15(2H,m),2.23(3H,s),2.39(2H,t,J=6Hz),2.62および2.63(計3H,s),2.72および2.73(計3H,s),2.80-3.10(6H,m),3.15(3H,s),3.87-3.98(2H,m),4.03-4.13(1H,m),6.27-6.37(1H,m),6.37-6.56(2H,m),6.62(1H,d,J=7Hz),6.82(2H,s),6.90(1H,d,J=7Hz),6.98(1H,d,J=6Hz),7.12(1H,t,J=7Hz),7.26(1H,d,J=7Hz),7.57(1H,t,J=6Hz),7.92(1H,d,J=7Hz),8.13-8.30(2H,m)
37）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕－３－プロポキシベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):0.89(3H,t,J=6Hz),1.37-1.50(2H,m),1.50-1.68(4H,m),1.68-1.80(2H,m),2.02-2.18(2H,m),2.20(3H,s),2.38(2H,t,J=6Hz),2.47(3H,s),2.75-3.12(5H,m),3.17(3H,s),3.30-3.42(2H,m),3.42-3.56(1H,m),3.80-4.00(4H,m),4.00-4.13(1H,m),4.32-4.50(4H,m),6.61(1H,d,J=7Hz),6.82(1H,s),6.88(1H,s),6.94(1H,d,J=7Hz),7.02(1H,d,J=7Hz),7.13(1H,t,J=7Hz),7.29(1H,d,J=7Hz),7.56(1H,t,J=7Hz),7.97(1H,d,J=7Hz),8.22(1H,d,J=7Hz)
38）４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－イソプロポキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩
NMR(DMSO-d_6,δ):1.10-1.27(6H,m),1.37-1.50(2H,m),1.50-1.64(2H,m),1.67-1.82(2H,m),2.03-2.07(2H,m),2.22(3H,s),2.39(2H,t,J=6Hz),2.72および2.73(計3H,s),2.78-3.12(6H,m),3.17(3H,s),3.30-3.43(2H,m),3.43-3.60(1H,m),3.80-4.02(2H,m),4.02-4.13(1H,m),4.

23-4.50(4H,m),6.64(1H,d,J=7Hz),6.81-6.90(2H,m),6.98(1H,d,J=7Hz),7.03(1H,d,J=7Hz),7.13(1H,t,J=6Hz),7.32(1H,d,J=7Hz),7.56(1H,t,J=6Hz),7.94(1H,d,J=6Hz),8.22(1H,d,J=7Hz)

39）２－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－メチルピペラジン－１－イル）カルボニルペント－１－イルオキシ〕－４－メチルフェニル〕－５－チオフェンカルボキシアミド二塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.20-1.38(2H,m),1.38-1.52(2H,m),1.53-1.70(2H,m),1.98-2.10(2H,m),2.22-2.32(2H,m),2.33(3H,s),2.69-2.72(3H,m),2.76-3.07(5H,m),3.16(3H,s),3.27-3.54(3H,m),3.78-4.09(3H,m),4.10-4.20(2H,m),4.33-4.47(2H,m),6.15(1H,br),6.55(1H,d,J=5Hz),6.81(1H,d,J=7Hz),6.97(1H,s),7.07(1H,t,J=6Hz),7.13-7.20(2H,m),7.44-7.60(2H,m)

実施例105

４－〔２－〔（３－第三級ブトキシカルボニルアミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－（４－ヒドロキシフェニル）ベンズアミド（50mg）のクロロホルム（3.0ml）溶液に、４Ｎ塩化水素酢酸エチル溶液（1.0ml）を加え、混合物を外界温度で２時間攪拌した。生じた混合物を減圧下で蒸発させて濃縮し、残留物をジエチルエーテルを用いて粉末化した。減圧下でジエチルエーテルを除去して、４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－（４－ヒドロキシフェニル）ベンズアミド塩酸塩（40mg）を得た。

NMR(DMSO-d_6,δ):2.11-2.21(2H,m),2.96(2H,q,J=8Hz),3.30(3H,s),3.78(3H,s),4.37(2H,t,J=8Hz),6.66(2H,d,J=8Hz),6.88(1H,d,J=8Hz),6.97(1H,s),6.99(2H,d,J=8Hz),7.15(1H,t,J=8Hz),7.27(1H,d,J=8Hz),7.55-7.62(1H,m),7.97-8.05(3H,m),8.28(1H,d,J=8Hz),9.54-9.59(1H,br s)

ESI-MASS(m/z):450(M+H)

実施例106

実施例105と同様にして、次の化合物を得た。

４－〔２－〔（３－アミノプロプ－１－イル）オキシ〕ベンゾイル〕アミノ－３－カルボキシメトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－シクロヘキシルベンズアミド塩酸塩

NMR(DMSO-d_6,δ):1.02-1.10(2H,m),1.46-1.80(8H,m),2.08-2.12(2H,m),2.80(3H,s),2.92-2.99(2H,m),3.30-3.47(2H,br),4.39(2H,t,J=7Hz),4.96(2H,s),6.98-7.04(2H,br s),7.18(1H,t,J=8Hz),7.30(1H,d,J=8Hz),7.60(1H,t,J=8Hz),7.95-8.05(3H,br),8.07(1H,d,J=8Hz),8.51(1H,d,J=8Hz)

ESI-MASS(m/z):484(M+H)

実施例107

１）４－〔２－〔３－（９－フルオレニルメチル）オキシカルボニルアミノプロプ－１－イル〕チオベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド（110mg）のＮ,Ｎ－ジメチルホルムアミド－ピペリジン（４：１、５ml）混合物溶液を、外界温度で30分間攪拌し、生じた溶液を酢酸エチル（20ml）で希釈した。溶液を水（10mlx3）および食塩水で洗い、炭酸カリウムで乾燥した。溶媒を蒸発させ、残留物を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー（SiO_2 30ｇ、１～15％メタノール含有クロロホルム）で精製して、４－〔２－（３－アミノプロプ－１－イル）チオベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミドを得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.36-1.92(12H,m),2.29(6H,s),2.30(3H,s),2.36(2H,t,J=5Hz),2.59(1H,t,J=11Hz),2.77(2H,t,J=5Hz),2.99(2H,t,J=5Hz),3.32(3H,s),3.75(3H,s),3.85-4.03(4H,m),6.57-6.66(2H,m),6.84-6.90(1H,d,J=8Hz),7.02(1H,s),7.39-7.48(3H,m),7.65(1H,d,J=8Hz),8.30(1H,d,J=8Hz),8.80(1H,s)

２）得られた化合物のエタノール（５ml）溶液に、１Ｎ塩酸（0.15ml）を加えた。揮発性の溶媒を蒸発させて除去し、残留物を凍結乾燥して、４－〔２－（３－アミノプロプ－１

－イル）チオベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド二塩酸塩（45mg）を得た。

NMR($CDCl_3$,δ):1.44-1.92(6H,m),2.02-2.16(2H,m),2.28(3H,s),2.30-2.41(2H,m),2.73(6H,br),2.99-3.14(2H,m),3.27-3.33(1H,m),3.31(3H,s),3.62-3.79(4H,m),3.71(3H,s),3.82-4.10(2H,m),6.55-6.67(2H,m),6.83-7.02(5H,m),7.35-7.52(2H,m),8.23(1H,br),8.54(2H,br)

実施例108

実施例15と同様にして、次の化合物を得た。

４－〔２－（３－ジメチルアミノプロプ－１－イル）オキシベンゾイル〕アミノ－３－メトキシ－Ｎ－メチル－Ｎ－〔２－〔５－（４－ジメチルアミノピペリジン－１－イル）カルボニルペント－１－イル〕オキシ－４－メチルフェニル〕ベンズアミド

NMR($CDCl_3$,δ):1.49-1.60(2H,m),1.66-1.95(4H,m),2.21(6H,s),2.27(6H,s),2.35-2.48(4H,m),2.58(2H,t,J=11Hz),3.32(2H,t,J=11Hz),3.33(3H,s),3.80(3H,s),3.82-4.00(2H,m),4.25(2H,t,J=5Hz),4.64(1H,br),6.55-6.64(2H,m),6.85(1H,d,J=8Hz),6.89(1H,d,J=8Hz),7.00-7.11(3H,m),7.26(1H,s),7.40-7.48(1H,m),8.21(1H,d,J=8Hz),8.40(1H,d,J=8Hz)

フロントページの続き

(51)Int.Cl. FI
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01) Ａ６１Ｐ 43/00 １０１

(72)発明者 佐藤 健太郎
茨城県つくば市松代２－２５－１０
(72)発明者 田中 洋和
兵庫県宝塚市花屋敷荘園３－１０－２１

審査官 冨永 保

(56)参考文献 ソ連国特許発明第０１７９４９４１（ＳＵ，Ａ）
ソ連国特許発明第０１７５４７１２（ＳＵ，Ａ）
ソ連国特許発明第０１１５６３６２（ＳＵ，Ａ）
特開昭６２－０１００５７（ＪＰ，Ａ）
特開昭６０－２５５７６０（ＪＰ，Ａ）
特開昭６０－００８２４７（ＪＰ，Ａ）
米国特許第０４５１０１３９（ＵＳ，Ａ）
米国特許第０４１４６３８６（ＵＳ，Ａ）
英国特許第００８６５７３５（ＧＢ，Ｂ）
米国特許第０２９９５４８８（ＵＳ，Ａ）
米国特許第０２８０２０２９（ＵＳ，Ａ）
特開平０８－３３３３４６（ＪＰ，Ａ）
特開平０９－１９００１４（ＪＰ，Ａ）
特表平１１－５００７１６（ＪＰ，Ａ）
Boll.Chim.Farm.,(1983),122(4),p.190-5

(58)調査した分野(Int.Cl., ＤＢ名)
C07C237/42
C07C237/44
C07D295/18
CAplus(STN)
REGISTRY(STN)