(19)日本国特許庁(JP)　(12)特　許　公　報(B2)　(11)特許番号
特許第5349056号
(P5349056)
(45)発行日　平成25年11月20日(2013.11.20)　(24)登録日　平成25年8月30日(2013.8.30)

(51)Int.Cl.		F I		
C07D 471/14	(2006.01)	C07D	471/14	102
A61P 35/00	(2006.01)	C07D	471/14	CSP
A61P 43/00	(2006.01)	A61P	35/00	
A61K 45/00	(2006.01)	A61P	43/00	105
A61P 35/02	(2006.01)	A61P	43/00	111

請求項の数 32　(全 317 頁)　最終頁に続く

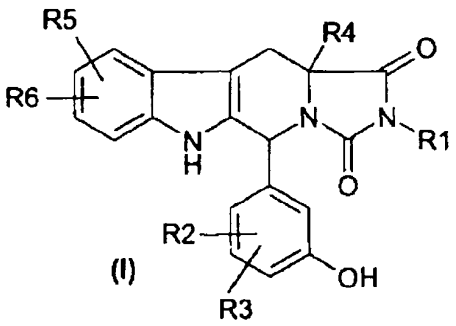
(21)出願番号	特願2008-555789 (P2008-555789)
(86)(22)出願日	平成19年2月21日 (2007.2.21)
(65)公表番号	特表2009-527533 (P2009-527533A)
(43)公表日	平成21年7月30日 (2009.7.30)
(86)国際出願番号	PCT/EP2007/051688
(87)国際公開番号	WO2007/096393
(87)国際公開日	平成19年8月30日 (2007.8.30)
審査請求日	平成22年2月22日 (2010.2.22)
(31)優先権主張番号	06110295.0
(32)優先日	平成18年2月22日 (2006.2.22)
(33)優先権主張国	欧州特許庁 (EP)
(31)優先権主張番号	06119038.5
(32)優先日	平成18年8月16日 (2006.8.16)
(33)優先権主張国	欧州特許庁 (EP)

(73)特許権者　507208200
４エスツェー　アクチェンゲゼルシャフト
ドイツ連邦共和国，８２１５２　プラネック－マルティンスリート，アム　クロファーシュピッツ　１９アー
(74)代理人　100099759
弁理士　青木　篤
(74)代理人　100077517
弁理士　石田　敬
(74)代理人　100087871
弁理士　福本　積
(74)代理人　100087413
弁理士　古賀　哲次
(74)代理人　100117019
弁理士　渡辺　陽一

最終頁に続く

(54)【発明の名称】Ｅｇ５キネシンモジュレーターとしてのインドロピリジン類

(57)【特許請求の範囲】
【請求項１】
式Ｉ：
【化１】



〔式中、
Ｒ１は、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、Ｃ2～Ｃ4アルケニル、Ｃ2～Ｃ4アルキニル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、又は、Ｒ11により置換されたＣ2～Ｃ7アルキルであり、ここで

Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112又はハロゲンであり、ここで
Ｒ111は、水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ2～Ｃ4アルケニル、Ｃ2～Ｃ4アルキニル、Ｃ3～Ｃ7シクロアキキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、ヒドロキシ－Ｃ2～Ｃ4アルキル、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ－Ｃ2～Ｃ4アルキル、１Ｎ－（Ｃ1～Ｃ4アルキル）ピラゾリル、１Ｎ－（Ｈ）－ピラゾリル、イソオキサゾリル、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルキルであり、
Ｒ112は水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、又はＣ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキルであり、
あるいはＲ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合される窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、Ｓ－オキソ－チオモルホリン－４－イル、Ｓ，Ｓ－ジオキソ－チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、ホモピペリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ホモピペラジン－１－イル、２，５－ジヒドロピロール－１－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、トリアゾール－１－イル、又はテトラゾール－１－イルであり、ここで
Ｒ113は水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ1～Ｃ4アルキルカルボニル、アミジノ、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルキルであり、
ここで前記Hetは場合により、フッ素及びＣ1～Ｃ4アルキルから独立に選択された１個もしくは2個の置換基により置換されることがあり、
Ｒ２は、水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ又はヒドロキシルであり、
Ｒ３は、水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル又はＣ１～Ｃ4アルコキシであり、
Ｒ４は、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、又はハロゲン、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキルであり、
Ｒ５は、Ｃ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシル、フェニル－Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ－Ｃ2～Ｃ4アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ2～Ｃ4アルコキシ、Ｃ3～Ｃ7シクロアルコキシ、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルコキシであり、
Ｒ６は水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル又はハロゲンである〕
により示される化合物、並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩。
【請求項２】
Ｒ１がＣ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、又はＲ11により置換されたＣ2～Ｃ7アルキルであり、ここで
Ｒ11が－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112又はハロゲンであり、
Ｒ111が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、ヒドロキシ－Ｃ2～Ｃ4アルキル、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ－Ｃ2～Ｃ4アルキル、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルキルであり、
Ｒ112が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、又はＣ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキルであるか、あるいは
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合される窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、Ｓ－オキソ－チオモルホリン－４－イル、Ｓ，Ｓ－ジオキソ－チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、ホモピペリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ホモピペラジン－１－イル、ピロール－

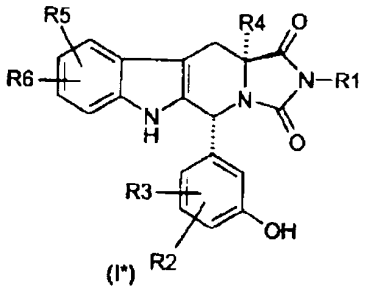
１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、トリアゾール－１－イル、又はテトラゾール－１－イルであり、ここで
Ｒ113は水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ1～Ｃ4アルキルカルボニル、アミジノ、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルキルであり、
ここで前記Hetは場合により、フッ素及びＣ1～Ｃ4アルキルから独立に選択された１個もしくは２個の置換基により置換されることがあり、
Ｒ２が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ又はヒドロキシルであり、
Ｒ３が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル又はＣ1～Ｃ4アルコキシであり、
Ｒ４がＣ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル又はＣ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキルであり、
Ｒ５がＣ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシル、フェニル－Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ－Ｃ2～Ｃ4アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ2～Ｃ4アルコキシ、Ｃ3～Ｃ7シクロアルコキシ、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルコキシであり、
Ｒ６が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル又はハロゲンである、
請求項１に記載の式Ｉの化合物並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩。
【請求項３】
Ｒ１がＣ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、又はR11により置換されたＣ2～Ｃ7アルキルであり、ここで
R11が－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、
Ｒ111が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル又はＣ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキルであり、
Ｒ112が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル又はＣ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキルであるか、あるいは
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合される窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、Ｓ－オキソ－チオモルホリン－４－イル、Ｓ，Ｓ－ジオキソ－チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル又はトリアゾール－１－イルであり、ここで
Ｒ113がＣ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル又はＣ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキルであり、
Ｒ２が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ又はヒドロキシルであり、
Ｒ３が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル又はＣ1～Ｃ4アルコキシであり、
Ｒ４がＣ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル又はＣ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキルであり、
Ｒ５がＣ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシル、フェニル－Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ－Ｃ2～Ｃ4アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ2～Ｃ4アルコキシ、Ｃ3～Ｃ7シクロアルコキシ、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルコキシであり、
Ｒ６が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル又はハロゲンである、

請求項１に記載の式Ｉの化合物並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩。

【請求項４】

前記化合物が、３ａ位と10位に関して、式Ｉ*：

【化２】



に示される立体配置を有する、請求項１、２又は３に記載の化合物、及びそれの塩。

【請求項５】

Ｒ１がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、Ｒ11により置換されたエチル、Ｒ11により置換されたプロピル、又はＲ11により置換されたブチルであり、ここで

Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112、フッ素、塩素又は臭素であり、ここで

Ｒ111が水素であり、そして

Ｒ112が水素であるか、

又は

Ｒ111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして

Ｒ112が水素であるか、

又は

Ｒ111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして

Ｒ112がメチルであるか、

又は

Ｒ111がエチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして

Ｒ112がエチル、イソプロピル又はシクロプロピルであるか、

又は

Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成する

のいずれかであり、ここで

Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、ホモピペリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ホモピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、トリアゾール－１－イル、又はテトラゾール－１－イルであり、

R113が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、アセチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、
ここで前記Hetは場合により、フッ素及びメチルから独立に選択された１個又は２個の置換基により置換されることがあり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
Ｒ５がメチル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している、
請求項１に記載の式Ｉの化合物、並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩。
【請求項６】
Ｒ１が２－（R11）－エチル又は３－（R11）－プロピルであり、ここでR11は－Ｎ（R111）R112であり、
R111が水素であり、そして
R112が水素であるか、
又は
R111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、tertブチル、アリル、プロパルギル、１－メチルプロパルギル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
R112が水素であるか、
又は
R111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、tertブチル、アリル、プロパルギル、１－メチルプロパルギル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
R112メチルであるか、
又は
R111がエチル、プロピル、イソプロピル、アリル、プロパルギル、１－メチルプロパルギル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
R112がエチルであるか、
又は
R111とR112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成する
のいずれかであり、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、ホモピペリジン－１－イル、４Ｎ－（R113）－ピペラジン－１－イル、４Ｎ－（R113）－ホモピペラジン－１－イル、２，５－ジヒドロピロール－１－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－１－イル、４－メチルピペリジン－１－イル、４－フルオロピペリジン－１－イル、４，４－ジフルオロピペリジン－１－イル、（Ｓ）－３－フルオロピロリジン－１－イル、（Ｒ）－３－フルオロピロリジン－１－イル、又は３，３－ジフルオロピロリジン－１－イルであり、

R113はメチル又はアセチルであるか、
又は
Hetはピラゾール－１－イル又はイミダゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素又はフッ素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合しており、そして
Ｒ６は骨格の５位又は特に７位に結合している、
請求項１に記載の式Ｉの化合物、それらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩。

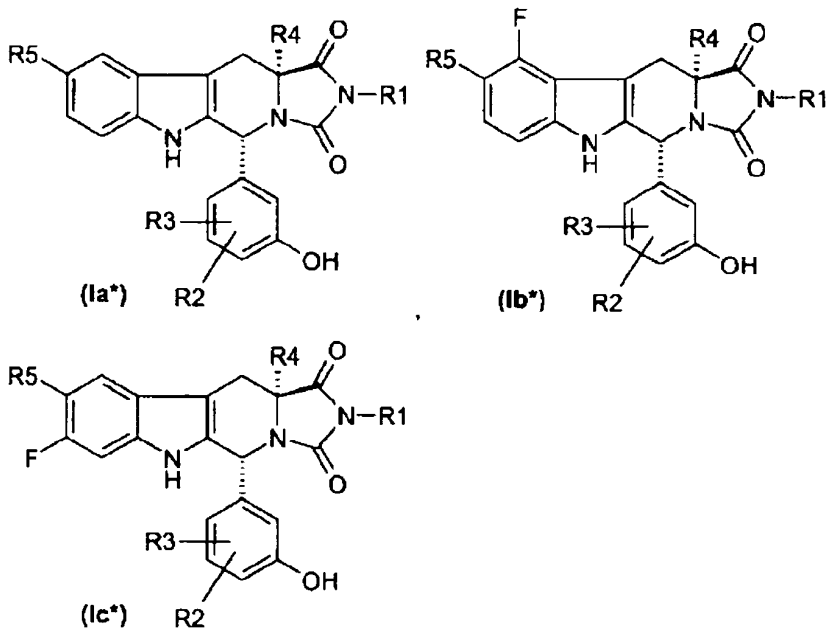
【請求項７】
Ｒ１が２－（R11）－エチル又は３－（R11）－プロピルであり、ここでR11は－Ｎ（R111）R112であり、
R111がメチル、エチル、イソプロピル、イソブチル、tert－ブチル、アリル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、又は２－メトキシエチルであり、そして
R112が水素であるか、
又は
R111がメチル、エチル、イソプロピル、イソブチル、アリル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、又は２－メトキシエチルであり、そして
R112がメチルであるか、
R111がエチル、２－ヒドロキシエチル、又は２－メトキシエチルであり、そして
R112がエチルであるか、
又は
R111とR112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成する
のいずれかであり、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、２，５－ジヒドロピロール－１－イル、又は１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素又はフッ素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合しており、そして
Ｒ６は骨格の７位に結合している
請求項４記載の式Ｉ*からのものである、請求項１に記載の化合物、及びそれらの化合物の塩。

【請求項８】
Ｒ１がメチル、２－（R11）－エチル、又は３－（R11）－プロピルであり、ここで
R11は－Ｎ（R111）R112であり、ここで
R111が水素であり、そして
R112が水素であるか、
又は
R111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シク

ロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－フルオロエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111がエチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
Ｒ112がエチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成する
のいずれかであり、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イルであり、ここで
Ｒ113は水素、メチル、エチル、イソプロピル、アセチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、
前記Hetは場合によりフッ素及びメチルから独立に選択された１個又は２個の置換基により置換されることがあり、
又は
Hetはピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチル、エチル、イソプロピル又はシクロプロピルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
請求項４記載の式Ｉ＊からのものである、請求項１又は２に記載の化合物、及びそれらの化合物の塩。
【請求項９】
Ｒ１が２－（Ｒ11）－エチル、又は３－（Ｒ11）－プロピルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111が水素であり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル又はシクロプロピルメチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチル、エチル、イソプロピル又はシクロプロピルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、

又は
Ｒ111がエチル、イソプロピル又はシクロプロピルであり、そして
Ｒ112がエチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成する
のいずれかであり、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、４－メチルピペリジン－１－イル、４－フルオロピペリジン－１－イル、４，４－ジフルオロピペリジン－１－イル、（Ｓ）－３－フルオロピロリジン－１－イル、（Ｒ）－３－フルオロピロリジン－１－イル、３，３－ジフルオロピロリジン－１－イル、３－フルオロアゼチジン－１－イル、又は３,３－ジフルオロアゼチジン－１－イルであり、ここで
Ｒ113は水素、メチル又はアセチルであり、又は
Hetはピラゾール－１－イル、又はイミダゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチル又はエチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
請求項４記載の式Ｉ*からのものである、請求項１又は２に記載の化合物、及びそれらの化合物の塩。
【請求項１０】
Ｒ１がメチル、２－（Ｒ11）－エチル、又は３－（Ｒ11）－プロピルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111がメチルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチル、エチル、イソプロピル又はシクロプロピルであり、
Ｒ５がメチル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルメトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している、
請求項４記載の式Ｉ*からのものである、請求項１、２又は３に記載の化合物、及びそれらの化合物の塩。
【請求項１１】
式Ｉａ*，Ｉｂ*及びＩｃ*：

【化３】



（式中、Ｒ２とＲ３は共に水素であり、
Ｒ４はメチル又はエチルであり、そして
Ｒ１とＲ５は下表の1.1～1.891のいずれかの意味を有する）
のいずれかからのものである、請求項１に記載の化合物
【表１】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.1	メチル	$-CH_3$
1.2	メチル	-Br
1.3	メチル	-F
1.4	メチル	$-OCH_3$
1.5	メチル	$-OCH_2CH_3$
1.6	メチル	-Cl
1.7	メチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.8	メチル	シクロプロピルメトキシ
1.9	メチル	$-CF_3$
1.10	メチル	ジフルオロメトキシ
1.11	メチル	トリフルオロメトキシ
1.12	２－(ジメチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.13	２－(ジメチルアミノ)エチル	-Br
1.14	２－(ジメチルアミノ)エチル	-F
1.15	２－(ジメチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.16	２－(ジメチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.17	２－(ジメチルアミノ)エチル	-Cl

【表２】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.18	２－(ジメチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.19	２－(ジメチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.20	２－(ジメチルアミノ)エチル	$-CF_3$
1.21	２－(ジメチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.22	２－(ジメチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.23	２－(ジメチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.24	２－(ジメチルアミノ)プロピル	-Br
1.25	２－(ジメチルアミノ)プロピル	-F
1.26	２－(ジメチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.27	２－(ジメチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.28	２－(ジメチルアミノ)プロピル	-Cl
1.29	２－(ジメチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.30	２－(ジメチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.31	２－(ジメチルアミノ)プロピル	$-CF_3$
1.32	２－(ジメチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.33	２－(ジメチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.34	２－(モルホリン－４－イル)エチル	$-CH_3$
1.35	２－(モルホリン－４－イル)エチル	-Br
1.36	２－(モルホリン－４－イル)エチル	-F
1.37	２－(モルホリン－４－イル)エチル	$-OCH_3$
1.38	２－(モルホリン－４－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.39	２－(モルホリン－４－イル)エチル	-Cl
1.40	２－(モルホリン－４－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.41	２－(モルホリン－４－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.42	２－(モルホリン－４－イル)エチル	$-CF_3$
1.43	２－(モルホリン－４－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.44	２－(モルホリン－４－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.45	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.46	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	-Br
1.47	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	-F
1.48	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.49	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.50	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	-Cl
1.51	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.52	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.53	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	$-CF_3$
1.54	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ

【表３】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.55	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.56	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.57	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	-Br
1.58	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	-F
1.59	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.60	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.61	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	-Cl
1.62	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.63	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.64	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	$-CF_3$
1.65	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.66	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.67	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.68	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	-Br
1.69	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	-F
1.70	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.71	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.72	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	-Cl
1.73	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.74	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.75	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	$-CF_3$
1.76	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.77	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.78	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	$-CH_3$
1.79	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	-Br
1.80	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	-F
1.81	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.82	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.83	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	-Cl
1.84	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.85	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.86	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	$-CF_3$
1.87	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.88	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.89	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.90	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	-Br
1.91	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	-F

【表４】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.92	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.93	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.94	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	-Cl
1.95	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.96	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.97	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	$-CF_3$
1.98	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.99	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.100	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.101	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	-Br
1.102	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	-F
1.103	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.104	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.105	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	-Cl
1.106	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.107	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.108	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	$-CF_3$
1.109	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.110	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.111	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.112	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	-Br
1.113	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	-F
1.114	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.115	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.116	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	-Cl
1.117	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.118	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.119	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-CF_3$
1.120	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.121	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.122	３－アミノプロピル	$-CH_3$
1.123	３－アミノプロピル	-Br
1.124	３－アミノプロピル	-F
1.125	３－アミノプロピル	$-OCH_3$
1.126	３－アミノプロピル	$-OCH_2CH_3$
1.127	３－アミノプロピル	-Cl
1.128	３－アミノプロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$

【表５】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.129	２－アミノプロピル	シクロプロピルメトキシ
1.130	２－アミノプロピル	トリフルオロメチル
1.131	２－アミノプロピル	ジフルオロメトキシ
1.132	２－アミノプロピル	トリフルオロメトキシ
1.133	２－アミノエチル	$-CH_3$
1.134	２－アミノエチル	-Br
1.135	２－アミノエチル	-F
1.136	２－アミノエチル	$-OCH_3$
1.137	２－アミノエチル	$-OCH_2CH_3$
1.138	２－アミノエチル	-Cl
1.139	２－アミノエチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.140	２－アミノエチル	シクロプロピルメトキシ
1.141	２－アミノエチル	トリフルオロメチル
1.142	２－アミノエチル	ジフルオロメトキシ
1.143	２－アミノエチル	トリフルオロメトキシ
1.144	２－（メチルアミノ）エチル	$-CH_3$
1.145	２－（メチルアミノ）エチル	-Br
1.146	２－（メチルアミノ）エチル	-F
1.147	２－（メチルアミノ）エチル	$-OCH_3$
1.148	２－（メチルアミノ）エチル	$-OCH_2CH_3$
1.149	２－（メチルアミノ）エチル	-Cl
1.150	２－（メチルアミノ）エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.151	２－（メチルアミノ）エチル	シクロプロピルメトキシ
1.152	２－（メチルアミノ）エチル	トリフルオロメチル
1.153	２－（メチルアミノ）エチル	ジフルオロメトキシ
1.154	２－（メチルアミノ）エチル	トリフルオロメトキシ
1.155	２－（エチルアミノ）エチル	$-CH_3$
1.156	２－（エチルアミノ）エチル	-Br
1.157	２－（エチルアミノ）エチル	-F
1.158	２－（エチルアミノ）エチル	$-OCH_3$
1.159	２－（エチルアミノ）エチル	$-OCH_2CH_3$
1.160	２－（エチルアミノ）エチル	-Cl
1.161	２－（エチルアミノ）エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.162	２－（エチルアミノ）エチル	シクロプロピルメトキシ
1.163	２－（エチルアミノ）エチル	トリフルオロメチル
1.164	２－（エチルアミノ）エチル	ジフルオロメトキシ
1.165	２－（エチルアミノ）エチル	トリフルオロメトキシ

【表６】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.166	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.167	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	-Br
1.168	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	-F
1.169	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.170	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.171	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	-Cl
1.172	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.173	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.174	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	トリフルオロメチル
1.175	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.176	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.177	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.178	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	-Br
1.179	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	-F
1.180	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.181	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.182	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	-Cl
1.183	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.184	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.185	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	トリフルオロメチル
1.186	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.187	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.188	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.189	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	-Br
1.190	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	-F
1.191	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.192	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.193	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	-Cl
1.194	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.195	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.196	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメチル
1.197	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.198	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.199	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.200	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	-Br
1.201	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	-F
1.202	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_3$

【表７】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.203	2－(2－フルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.204	2－(2－フルオロエチルアミノ)エチル	-Cl
1.205	2－(2－フルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.206	2－(2－フルオロエチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.207	2－(2－フルオロエチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.208	2－(2－フルオロエチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.209	2－(2－フルオロエチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.210	2－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.211	2－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)エチル	-Br
1.212	2－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)エチル	-F
1.213	2－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.214	2－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.215	2－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)エチル	-Cl
1.216	2－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.217	2－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.218	2－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.219	2－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.220	2－(2，2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.221	2－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.222	2－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	-Br
1.223	2－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	-F
1.224	2－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.225	2－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.226	2－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	-Cl
1.227	2－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.228	2－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.229	2－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.230	2－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.231	2－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.232	2－(イソプロピルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.233	2－(イソプロピルアミノ)エチル	-Br
1.234	2－(イソプロピルアミノ)エチル	-F
1.235	2－(イソプロピルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.236	2－(イソプロピルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.237	2－(イソプロピルアミノ)エチル	-Cl
1.238	2－(イソプロピルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.239	2－(イソプロピルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ

【表８】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.240	２－(イソプロピルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.241	２－(イソプロピルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.242	２－(イソプロピルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.243	２－(イソブチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.244	２－(イソブチルアミノ)エチル	-Br
1.245	２－(イソブチルアミノ)エチル	-F
1.246	２－(イソブチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.247	２－(イソブチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.248	２－(イソブチルアミノ)エチル	-Cl
1.249	２－(イソブチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.250	２－(イソブチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.251	２－(イソブチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.252	２－(イソブチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.253	２－(イソブチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.254	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.255	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	-Br
1.256	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	-F
1.257	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.258	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.259	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	-Cl
1.260	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.261	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.262	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.263	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.264	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.265	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.266	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	-Br
1.267	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	-F
1.268	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.269	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.270	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	-Cl
1.271	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.272	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.273	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.274	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.275	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.276	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	$-CH_3$

【表９】

No.	R１	R５
1.277	２－(シクロブチルアミノ)エチル	-Br
1.278	２－(シクロブチルアミノ)エチル	-F
1.279	２－(シクロブチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.280	２－(シクロブチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.281	２－(シクロブチルアミノ)エチル	-Cl
1.282	２－(シクロブチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.283	２－(シクロブチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.284	２－(シクロブチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.285	２－(シクロブチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.286	２－(シクロブチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.287	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.288	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-Br
1.289	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-F
1.290	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.291	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.292	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-Cl
1.293	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.294	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.295	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.296	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.297	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.298	２－(ジエチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.299	２－(ジエチルアミノ)エチル	-Br
1.300	２－(ジエチルアミノ)エチル	-F
1.301	２－(ジエチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.302	２－(ジエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.303	２－(ジエチルアミノ)エチル	-Cl
1.304	２－(ジエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.305	２－(ジエチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.306	２－(ジエチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.307	２－(ジエチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.308	２－(ジエチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.309	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.310	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-Br
1.311	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-F
1.312	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.313	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$

【表１０】

No.	R 1	R 5
1. 314	2－(N－イソプロピル－N－メチルアミノ)エチル	-Cl
1. 315	2－(N－イソプロピル－N－メチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1. 316	2－(N－イソプロピル－N－メチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1. 317	2－(N－イソプロピル－N－メチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1. 318	2－(N－イソプロピル－N－メチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1. 319	2－(N－イソプロピル－N－メチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1. 320	2－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	$-CH_3$
1. 321	2－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	-Br
1. 322	2－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	-F
1. 323	2－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	$-OCH_3$
1. 324	2－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1. 325	2－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	-Cl
1. 326	2－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1. 327	2－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1. 328	2－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	トリフルオロメチル
1. 329	2－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1. 330	2－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1. 331	2－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	$-CH_3$
1. 332	2－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	-Br
1. 333	2－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	-F
1. 334	2－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	$-OCH_3$
1. 335	2－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1. 336	2－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	-Cl
1. 337	2－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1. 338	2－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1. 339	2－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	トリフルオロメチル
1. 340	2－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1. 341	2－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1. 342	2－(4－メチルピペリジン－1－イル)エチル	$-CH_3$
1. 343	2－(4－メチルピペリジン－1－イル)エチル	-Br
1. 344	2－(4－メチルピペリジン－1－イル)エチル	-F
1. 345	2－(4－メチルピペリジン－1－イル)エチル	$-OCH_3$
1. 346	2－(4－メチルピペリジン－1－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1. 347	2－(4－メチルピペリジン－1－イル)エチル	-Cl
1. 348	2－(4－メチルピペリジン－1－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1. 349	2－(4－メチルピペリジン－1－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1. 350	2－(4－メチルピペリジン－1－イル)エチル	シトリフルオロメチル

【表１１】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.351	２－(４－メチルピペリジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.352	２－(４－メチルピペリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.353	３－(メチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.354	３－(メチルアミノ)プロピル	-Br
1.355	３－(メチルアミノ)プロピル	-F
1.356	３－(メチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.357	３－(メチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.358	３－(メチルアミノ)プロピル	-Cl
1.359	３－(メチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.360	３－(メチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.361	３－(メチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.362	３－(メチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.363	３－(メチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.364	３－(エチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.365	３－(エチルアミノ)プロピル	-Br
1.366	３－(エチルアミノ)プロピル	-F
1.367	３－(エチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.368	３－(エチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.369	３－(エチルアミノ)プロピル	-Cl
1.370	３－(エチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.371	３－(エチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.372	３－(エチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.373	３－(エチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.374	３－(エチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.375	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.376	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	-Br
1.377	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	-F
1.378	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.379	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.380	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	-Cl
1.381	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.382	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.383	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.384	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.385	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.386	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.387	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	-Br

【表１２】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.388	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	-F
1.389	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.390	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.391	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	-Cl
1.392	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.393	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.394	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.395	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.396	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.397	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.398	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-Br
1.399	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-F
1.400	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.401	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.402	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-Cl
1.403	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.404	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.405	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.406	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.407	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.408	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.409	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	-Br
1.410	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	-F
1.411	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.412	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.413	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	-Cl
1.414	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.415	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.416	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.417	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.418	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.419	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.420	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	-Br
1.421	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	-F
1.422	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.423	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.424	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	-Cl

【表１３】

No.	R 1	R 5
1.425	3－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.426	3－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.427	3－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.428	3－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.429	3－(2，2－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.430	3－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.431	3－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	-Br
1.432	3－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	-F
1.433	3－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.434	3－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.435	3－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	-Cl
1.436	3－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.437	3－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.438	3－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.439	3－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.440	3－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.441	3－(イソプロピルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.442	3－(イソプロピルアミノ)プロピル	-Br
1.443	3－(イソプロピルアミノ)プロピル	-F
1.444	3－(イソプロピルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.445	3－(イソプロピルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.446	3－(イソプロピルアミノ)プロピル	-Cl
1.447	3－(イソプロピルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.448	3－(イソプロピルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.449	3－(イソプロピルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.450	3－(イソプロピルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.451	3－(イソプロピルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.452	3－(イソブチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.453	3－(イソブチルアミノ)プロピル	-Br
1.454	3－(イソブチルアミノ)プロピル	-F
1.455	3－(イソブチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.456	3－(イソブチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.457	3－(イソブチルアミノ)プロピル	-Cl
1.458	3－(イソブチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.459	3－(イソブチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.460	3－(イソブチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.461	3－(イソブチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ

【表１４】

No.	R１	R５
1.462	３－(イソブチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.463	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.464	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	-Br
1.465	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	-F
1.466	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.467	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.468	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	-Cl
1.469	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.470	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.471	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.472	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.473	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.474	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.475	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	-Br
1.476	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	-F
1.477	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.478	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.479	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	-Cl
1.480	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.481	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.482	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.483	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.484	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.485	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.486	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	-Br
1.487	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	-F
1.488	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.489	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.490	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	-Cl
1.491	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.492	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.493	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.494	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.495	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.496	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.497	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	-Br
1.498	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	-F

【表１５】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.499	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.500	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.501	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	-Cl
1.502	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.503	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.504	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.505	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.506	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.507	３－(ジエチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.508	３－(ジエチルアミノ)プロピル	-Br
1.509	３－(ジエチルアミノ)プロピル	-F
1.510	３－(ジエチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.511	３－(ジエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.512	３－(ジエチルアミノ)プロピル	-Cl
1.513	３－(ジエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.514	３－(ジエチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.515	３－(ジエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.516	３－(ジエチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.517	３－(ジエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.518	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.519	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	-Br
1.520	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	-F
1.521	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.522	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.523	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	-Cl
1.524	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.525	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.526	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.527	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.528	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.529	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.530	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-Br
1.531	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-F
1.532	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.533	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.534	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-Cl
1.535	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$

【表１６】

No.	R１	R５
1.536	3－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.537	3－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.538	3－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.539	3－((R)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.540	3－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	$-CH_3$
1.541	3－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	-Br
1.542	3－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	-F
1.543	3－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.544	3－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.545	3－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	-Cl
1.546	3－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.547	3－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.548	3－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.549	3－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.550	3－((S)－3－フルオロピロリジン－1－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.551	3－(4－メチルピペリジン1－イル)プロピル	$-CH_3$
1.552	3－(4－メチルピペリジン1－イル)プロピル	-Br
1.553	3－(4－メチルピペリジン1－イル)プロピル	-F
1.554	3－(4－メチルピペリジン1－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.555	3－(4－メチルピペリジン1－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.556	3－(4－メチルピペリジン1－イル)プロピル	-Cl
1.557	3－(4－メチルピペリジン1－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.558	3－(4－メチルピペリジン1－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.559	3－(4－メチルピペリジン1－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.560	3－(4－メチルピペリジン1－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.561	3－(4－メチルピペリジン1－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.562	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	$-CH_3$
1.563	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	-Br
1.564	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	-F
1.565	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	$-OCH_3$
1.566	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.567	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	-Cl
1.568	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.569	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.570	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	トリフルオロメチル
1.571	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	ジフルオロメトキシ
1.572	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	トリフルオロメトキシ

【表１７】

No.	R 1	R 5
1.573	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	$-CH_3$
1.574	3－〔N－(2－メトキシエチル)アミノ〕プロピル	-Br
1.575	3－〔N－(2－メトキシエチル)アミノ〕プロピル	-F
1.576	3－〔N－(2－メトキシエチル)アミノ〕プロピル	$-OCH_3$
1.577	3－〔N－(2－メトキシエチル)アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.578	3－〔N－(2－メトキシエチル)アミノ〕プロピル	-Cl
1.579	3－〔N－(2－メトキシエチル)アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.580	3－〔N－(2－メトキシエチル)アミノ〕プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.581	3－〔N－(2－メトキシエチル)アミノ〕プロピル	トリフルオロメチル
1.582	3－〔N－(2－メトキシエチル)アミノ〕プロピル	ジフルオロメトキシ
1.583	3－〔N－(2－メトキシエチル)アミノ〕プロピル	トリフルオロメトキシ
1.584	3－(第三ブチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.585	3－(第三ブチルアミノ)プロピル	-Br
1.586	3－(第三ブチルアミノ)プロピル	-F
1.587	3－(第三ブチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.588	3－(第三ブチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.589	3－(第三ブチルアミノ)プロピル	-Cl
1.590	3－(第三ブチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.591	3－(第三ブチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.592	3－(第三ブチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.593	3－(第三ブチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.594	3－(第三ブチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.595	3－(アリルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.596	3－(アリルアミノ)プロピル	-Br
1.597	3－(アリルアミノ)プロピル	-F
1.598	3－(アリルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.599	3－(アリルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.600	3－(アリルアミノ)プロピル	-Cl
1.601	3－(アリルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.602	3－(アリルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.603	3－(アリルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.604	3－(アリルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.605	3－(アリルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.606	3－(プロパルギルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.607	3－(プロパルギルアミノ)プロピル	-Br
1.608	3－(プロパルギルアミノ)プロピル	-F
1.609	3－(プロパルギルアミノ)プロピル	$-OCH_3$

【表１８】

No.	R 1	R 5
1.610	3－(プロパルギルアミノ) プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.611	3－(プロパルギルアミノ) プロピル	-Cl
1.612	3－(プロパルギルアミノ) プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.613	3－(プロパルギルアミノ) プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.614	3－(プロパルギルアミノ) プロピル	トリフルオロメチル
1.615	3－(プロパルギルアミノ) プロピル	ジフルオロメトキシ
1.616	3－(プロパルギルアミノ) プロピル	トリフルオロメトキシ
1.617	3－(N－アリル－N－メチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.618	3－(N－アリル－N－メチルアミノ)プロピル	-Br
1.619	3－(N－アリル－N－メチルアミノ)プロピル	-F
1.620	3－(N－アリル－N－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.621	3－(N－アリル－N－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.622	3－(N－アリル－N－メチルアミノ)プロピル	-Cl
1.623	3－(N－アリル－N－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.624	3－(N－アリル－N－メチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.625	3－(N－アリル－N－メチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.626	3－(N－アリル－N－メチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.627	3－(N－アリル－N－メチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.628	3－(N－メチル－N－プロパルギルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.629	3－(N－メチル－N－プロパルギルアミノ)プロピル	-Br
1.630	3－(N－メチル－N－プロパルギルアミノ)プロピル	-F
1.631	3－(N－メチル－N－プロパルギルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.632	3－(N－メチル－N－プロパルギルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.633	3－(N－メチル－N－プロパルギルアミノ)プロピル	-Cl
1.634	3－(N－メチル－N－プロパルギルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.635	3－(N－メチル－N－プロパルギルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.636	3－(N－メチル－N－プロパルギルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.637	3－(N－メチル－N－プロパルギルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.638	3－(N－メチル－N－プロパルギルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.639	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)－N－メチル－アミノ〕プロピル	$-CH_3$
1.640	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)－N－メチル－アミノ〕プロピル	-Br
1.641	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)－N－メチル－アミノ〕プロピル	-F
1.642	3－〔N－(2－ヒドロキシエチル)－N－メチル－アミノ〕プロピル	$-OCH_3$

【表１９】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.643	３－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.644	３－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルアミノ〕プロピル	-Cl
1.645	３－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルアミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.646	３－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルアミノ〕プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.647	３－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルアミノ〕プロピル	トリフルオロメチル
1.648	３－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルアミノ〕プロピル	ジフルオロメトキシ
1.649	３－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルアミノ〕プロピル	トリフルオロメトキシ
1.650	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	$-CH_3$
1.651	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	-Br
1.652	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	-F
1.653	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	$-OCH_3$
1.654	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.655	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	-Cl
1.656	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.657	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.658	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	トリフルオロメチル
1.659	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	ジフルオロメトキシ
1.660	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	トリフルオロメトキシ

【表２０】

No.	R 1	R 5
1. 661	3－〔N－エチル－N－(2－ヒドロキシエチル) アミノ〕プロピル	$-CH_3$
1. 662	3－〔N－エチル－N－(2－ヒドロキシエチル) アミノ〕プロピル	-Br
1. 663	3－〔N－エチル－N－(2－ヒドロキシエチル) アミノ〕プロピル	-F
1. 664	3－〔N－エチル－N－(2－ヒドロキシエチル) アミノ〕プロピル	$-OCH_3$
1. 665	3－〔N－エチル－N－(2－ヒドロキシエチル) アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_3$
1. 666	3－〔N－エチル－N－(2－ヒドロキシエチル) アミノ〕プロピル	-Cl
1. 667	3－〔N－エチル－N－(2－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1. 668	3－〔N－エチル－N－(2－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	シクロプロピルメトキシ
1. 669	3－〔N－エチル－N－(2－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	トリフルオロメチル
1. 670	3－〔N－エチル－N－(2－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	ジフルオロメトキシ
1. 671	3－〔N－エチル－N－(2－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	トリフルオロメトキシ
1. 672	3－〔N－エチル－N－(2－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	$-CH_3$
1. 673	3－〔N－エチル－N－(2－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	-Br
1. 674	3－〔N－エチル－N－(2－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	-F
1. 675	3－〔N－エチル－N－(2－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	$-OCH_3$
1. 676	3－〔N－エチル－N－(2－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_3$
1. 677	3－〔N－エチル－N－(2－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	-Cl
1. 678	3－〔N－エチル－N－(2－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$

【表２１】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.679	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.680	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	トリフルオロメチル
1.681	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	ジフルオロメトキシ
1.682	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	トリフルオロメトキシ
1.683	３－(ピペリジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.684	３－(ピペリジン－１－イル)プロピル	-Br
1.685	３－(ピペリジン－１－イル)プロピル	-F
1.686	３－(ピペリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.687	３－(ピペリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.688	３－(ピペリジン－１－イル)プロピル	-Cl
1.689	３－(ピペリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.690	３－(ピペリジン－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.691	３－(ピペリジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.692	３－(ピペリジン－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.693	３－(ピペリジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.694	３－(ホモピペリジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.695	３－(ホモピペリジン－１－イル)プロピル	-Br
1.696	３－(ホモピペリジン－１－イル)プロピル	-F
1.697	３－(ホモピペリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.698	３－(ホモピペリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.699	３－(ホモピペリジン－１－イル)プロピル	-Cl
1.700	３－(ホモピペリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.701	３－(ホモピペリジン－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.702	３－(ホモピペリジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.703	３－(ホモピペリジン－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.704	３－(ホモピペリジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.705	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.706	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	-Br
1.707	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	-F
1.708	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.709	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.710	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	-Cl
1.711	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$

【表２２】

No.	R１	R５
1.712	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.713	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.714	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.715	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.716	３-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	$-CH_3$
1.717	３-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	-Br
1.718	３-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	-F
1.719	３-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	$-OCH_3$
1.720	３-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.721	３-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	-Cl
1.722	３-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.723	３-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.724	３-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.725	３-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.726	３-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.727	２－〔N－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕エチル	$-CH_3$
1.728	２－〔N－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕エチル	-Br
1.729	２－〔N－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕エチル	-F
1.730	２－〔N－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕エチル	$-OCH_3$
1.731	２－〔N－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_3$
1.732	２－〔N－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕エチル	-Cl
1.733	２－〔N－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.734	２－〔N－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕エチル	シクロプロピルメトキシ
1.735	２－〔N－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕エチル	トリフルオロメチル
1.736	２－〔N－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕エチル	ジフルオロメトキシ
1.737	２－〔N－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕エチル	トリフルオロメトキシ
1.738	２－〔N－(２－メトキシエチル)アミノ〕エチル	$-CH_3$
1.739	２－〔N－(２－メトキシエチル)アミノ〕エチル	-Br
1.740	２－〔N－(２－メトキシエチル)アミノ〕エチル	-F
1.741	２－〔N－(２－メトキシエチル)アミノ〕エチル	$-OCH_3$
1.742	２－〔N－(２－メトキシエチル)アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.743	２－〔N－(２－メトキシエチル)アミノ〕エチル	$-CH_3$
1.744	２－〔N－(２－メトキシエチル)アミノ〕エチル	シクロプロピルメトキシ
1.745	２－〔N－(２－メトキシエチル)アミノ〕エチル	トリフルオロメチル
1.747	２－〔N－(２－メトキシエチル)アミノ〕エチル	ジフルオロメトキシ
1.748	２－〔N－(２－メトキシエチル)アミノ〕エチル	トリフルオロメトキシ

【表２３】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.749	２－(第三ブチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.750	２－(第三ブチルアミノ)エチル	-Br
1.751	２－(第三ブチルアミノ)エチル	-F
1.752	２－(第三ブチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.753	２－(第三ブチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.754	２－(第三ブチルアミノ)エチル	-Cl
1.755	２－(第三ブチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.756	２－(第三ブチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.757	２－(第三ブチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.758	２－(第三ブチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.759	２－(第三ブチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.760	２－(アリルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.761	２－(アリルアミノ)エチル	-Br
1.762	２－(アリルアミノ)エチル	-F
1.763	２－(アリルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.764	２－(アリルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.765	２－(アリルアミノ)エチル	-Cl
1.766	２－(アリルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.767	２－(アリルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.768	２－(アリルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.769	２－(アリルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.770	２－(アリルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.771	２－(プロパルギルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.772	２－(プロパルギルアミノ)エチル	-Br
1.773	２－(プロパルギルアミノ)エチル	-F
1.774	２－(プロパルギルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.775	２－(プロパルギルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.776	２－(プロパルギルアミノ)エチル	-Cl
1.777	２－(プロパルギルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.778	２－(プロパルギルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.779	２－(プロパルギルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.780	２－(プロパルギルアミノ)チル	ジフルオロメトキシ
1.781	２－(プロパルギルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.782	２－(Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.783	２－(Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-Br
1.784	２－(Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-F
1.785	２－(Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-OCH3

【表２４】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.786	２－(Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.787	２－(Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-Cl
1.788	２－(Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.789	２－(Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.790	２－(Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.791	２－(Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.792	２－(Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.793	２－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.794	２－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)エチル	-Br
1.795	２－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)エチル	-F
1.796	２－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.797	２－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.798	２－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)エチル	-Cl
1.799	２－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.800	２－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.801	２－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.802	２－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.803	２－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.804	２－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-CH_3$
1.805	２－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	-Br
1.806	２－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	-F
1.807	２－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-OCH_3$
1.808	２－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_3$
1.809	２－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	-Cl
1.810	２－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.811	２－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	シクロプロピルメトキシ
1.812	２－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	トリフルオロメチル

【表２５】

No.	R１	R５
1.813	２－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	ジフルオロメトキシ
1.814	２－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	トリフルオロメトキシ
1.815	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-CH_3$
1.816	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	-Br
1.817	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	-F
1.818	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-OCH_3$
1.819	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_3$
1.820	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	-Cl
1.821	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.822	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	シクロプロピルメトキシ
1.823	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	トリフルオロメチル
1.824	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	ジフルオロメトキシ
1.825	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	トリフルオロメトキシ
1.826	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	$-CH_3$
1.827	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	-Br
1.828	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	-F
1.829	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	$-OCH_3$
1.830	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_3$

【表２６】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.831	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	-Cl
1.832	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.833	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	シクロプロピルメトキシ
1.834	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	トリフルオロメチル
1.835	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	ジフルオロメトキシ
1.836	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	トリフルオロメトキシ
1.837	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕エチル	$-CH_3$
1.838	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕エチル	-Br
1.839	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕エチル	-F
1.840	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕エチル	$-OCH_3$
1.841	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_3$
1.842	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕エチル	-Cl
1.843	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.844	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕エチル	シクロプロピルメトキシ
1.845	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕エチル	トリフルオロメチル
1.846	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕エチル	ジフルオロメトキシ
1.847	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕エチル	トリフルオロメトキシ
1.848	２－(ピペリジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.849	２－(ピペリジン－１－イル)エチル	-Br
1.850	２－(ピペリジン－１－イル)エチル	-F

【表２７】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.851	２－(ピペリジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.852	２－(ピペリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.853	２－(ピペリジン－１－イル)エチル	-Cl
1.854	２－(ピペリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.855	２－(ピペリジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.856	２－(ピペリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメチル
1.857	２－(ピペリジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.858	２－(ピペリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.859	２－(ホモピペリジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.860	２－(ホモピペリジン－１－イル)エチル	-Br
1.861	２－(ホモピペリジン－１－イル)エチル	-F
1.862	２－(ホモピペリジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.863	２－(ホモピペリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.864	２－(ホモピペリジン－１－イル)エチル	-Cl
1.865	２－(ホモピペリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.866	２－(ホモピペリジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.867	２－(ホモピペリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメチル
1.868	２－(ホモピペリジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.869	２－(ホモピペリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.870	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.871	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	-Br
1.872	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	-F
1.873	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.874	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.875	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	-Cl
1.876	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.877	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.878	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	トリフルオロメチル
1.879	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.880	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.881	２－(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-１-イル)エチル	$-CH_3$
1.882	２－(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-１-イル)エチル	-Br
1.883	２－(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-１-イル)エチル	-F
1.884	２－(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-１-イル)エチル	$-OCH_3$
1.885	２－(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-１-イル)エチル	$-OCH_2CH_3$

【表２８】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.886	２－(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-１-イル)エチル	-Cl
1.887	２－(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-１-イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.888	２－(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-１-イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.889	２－(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-１-イル)エチル	トリフルオロメチル
1.890	２－(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-１-イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.891	２－(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-１-イル)エチル	トリフルオロメトキシ

【請求項１２】

下記化合物：

１．（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ-10－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕

フルオレン－１，３－ジオン；
2.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
3.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
4.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
5.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
6.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
7.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
8.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
9.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
10.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
11.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
12.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
13.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
14.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（４－ジメチルアミノブチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
15.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
16.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
17.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－プロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
18.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－３ａ－エチル－10－（３

－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
19.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
20.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イミダゾール－１－イルプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
21.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－シクロプロピルメトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
22.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
23.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
24.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
25.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
26.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
27.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
28.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
29.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼチジン－１－イルエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
30.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アミノエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
31.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
32.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
33.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼチジン－１－イルエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
34.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（３，３－ジフルオロピロリジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジ

オン；
35. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－エチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
36. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
37. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－エチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
38. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
39. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
40. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
41. （３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
42. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
43. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
44. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼチジン－１－イルエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
45. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
46. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼチジン－１－イルエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
47. （３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
48. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
49. （３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
50. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－シクロブチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

51. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－エチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
52. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
53. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－シクロプロピルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
54. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
55. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－クロロプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
56. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－クロロプロピル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
57. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－クロロプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
58. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（３－クロロプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
59. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－クロロプロピル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
60. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
61. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
62. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
63. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－クロロプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
64. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－クロロプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
65. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－クロロプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
66. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－６－ヒドロキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
67. （３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソプロピルアミノプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，

９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
68.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
69.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジエチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
70.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
71.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
72.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
73.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（２，２－ジフルオロエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
74.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼパン－１－イルエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
75.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペリジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
76.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
77.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
78.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
79.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
80.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
81.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
82.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（２－ヒドロキシエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
83.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－〔２－

（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
84.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
85.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－プロパ－２－イニルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
86.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロブチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
87.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼチジン－１－イルプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
88.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
89.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
90.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
91.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
92.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソブチルアミノプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
93.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロプロピルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
94.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
95.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
96.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
97.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
98.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

99. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
100. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
101. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
102. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－シクロプロピルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
103. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－シクロブチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
104. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼパン－１－イルエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
105. （３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
106. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
107. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジエチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
108. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
109. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
110. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－ジエチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
111. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
112. （３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
113. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
114. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕

－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
115.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
116.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
117.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
118.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛２－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
119.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
120.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
121.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
122.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（２－ヒドロキシエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
123.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（２，２－ジフルオロエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
124.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
125.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
126.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛２－（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
127.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－プロパ－２－イニルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
128.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

129. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（３，３－ジフルオロピロリジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
130. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
131. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－エチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
132. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
133. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
134. （３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（２－メチル－２Ｈ－ピラゾール－３－イルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
135. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソブチルアミノプロピル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
136. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（（Ｒ及びＳ）１－メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
137. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－ジエチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
138. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－シクロブチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
139. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アリルアミノプロピル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
140. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
141. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼチジン－１－イルプロピル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
142. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（２，２－ジフルオロエチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
143. （３ａＳ，10Ｒ）－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－

ジオン；
144. （３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
145. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（２－ヒドロキシエチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
146. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アリルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
147. （３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－プロパ－２－イニルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
148. （３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
149. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
150. （３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
151. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
152. （３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
153. （３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
154. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
155. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－シクロブチルアミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
156. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
157. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
158. （３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

159. （３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－〔２－（２－ヒドロキシエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
160. （３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
161. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－シクロプロピルアミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
162. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジエチルアミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
163. （３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
164. （３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
165. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
166. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼパン－１－イルエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
167. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－tert－ブチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
168. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
169. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
170. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
171. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
172. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
173. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
174. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４

，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
175.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
176.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジエチルアミノプロピル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
177.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
178.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
179.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
180.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
181.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
182.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
183.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
184.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
185.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
186.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
187.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－（３－エチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
188.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テト

ラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
189.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（２－メトキシエチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
190.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロプロピルアミノプロピル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
191.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アリルアミノプロピル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
192.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
193.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
194.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
195.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
196.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
197.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
198.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼチジン－１－イルプロピル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
199.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソブチルアミノプロピル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
200.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
201.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－〔３－（２－ヒドロキシエチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
202.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロプロピルアミノプロピル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

203. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
204. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
205. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（２－メトキシエチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
206. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アリルアミノプロピル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
207. （３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
208. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
209. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
210. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
211. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
212. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（３－エチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
213. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソブチルアミノプロピル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
214. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（２－メトキシエチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
215. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（３－シクロプロピルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
216. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
217. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10

－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
218.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
219.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
220.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
221.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
222.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
223.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
224.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペリジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
225.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－プロパ－２－イニルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
226.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
227.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
228.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
229.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
230.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
231.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

232. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
233. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
234. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
235. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－〔３－（２－ヒドロキシエチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
236. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
237. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
238. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－〔３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
239. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
240. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
241. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
242. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
243. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
244. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
245. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－２－〔２－（２－ヒドロキシエチルアミノ）

エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
246.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－２－｛２－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
247.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
248.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
249.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－エチルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
250.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
251.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
252.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
253.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
254.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
255.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
256.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－tert－ブチルエミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
257.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
258.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジエチルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
259.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－

ジオン；
260. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
261. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
262. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
263. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
264. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペリジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
265. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
266. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
267. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
268. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
269. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
270. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
271. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
272. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－シクロブチルアミノエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

273. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
274. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
275. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
276. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
277. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
278. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
279. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
280. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
281. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
282. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼパン－１－イルエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
283. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アミノエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
284. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－（２－エチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
285. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－〔２－（２－ヒドロキシエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
286. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキ

シフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－プロパ－２－イニルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
287.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－プロパ－２－イニルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
288.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－｛２－〔２－（ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
289.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－｛２－〔エチル－（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
290.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
291.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
292.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
293.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
294.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
295.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
296.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－（２－エチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
297.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－｛２－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
298.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

299. （３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－｛２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
300. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
301. （３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
302. （３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペリジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
303. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
304. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
305. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－２－〔３－（２－ヒドロキシエチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
306. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－〔３－（２－メトキシエチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
307. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロプロピルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
308. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－tert－ブチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
309. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－プロパ－２－イニルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
310. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
311. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
312. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

313. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジエチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
314. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
315. （３ａＳ，10Ｒ）－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
316. （３ａＳ，10Ｒ）－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
317. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
318. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
319. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－アミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
320. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼチジン－１－イルプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
321. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
322. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
323. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
324. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
325. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

326. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
327. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペリジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
328. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
329. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
330. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－エチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
331. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソプロピルアミノプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
332. （３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソブチルアミノプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
333. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロブチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
334. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アリルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
335. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
336. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－ジエチルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
337. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
338. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－エチルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
339. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
340. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
341. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９

，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
342.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－２－〔２－（２－ヒドロキシエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
343.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
344.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－シクロブチルアミノエチル）７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
345.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
346.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
347.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
348.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－２－｛２－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
349.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
350.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
351.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
352.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
353.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
354.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
355.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ

，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
356.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
357.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペリジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
358.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
359.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
360.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
361.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼパン－１－イルエチル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
362.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
363.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アリルアミノプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
364.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
365.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
366.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
367.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペリジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
368.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

369. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（３－シクロブチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
370. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
371. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
372. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
373. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
374. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
375. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
376. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
377. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
378. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
379. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
380. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－｛２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
381. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
382. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
383. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
384. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－｛２－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10

－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
385.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（２－ジエチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
386.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
387.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
388.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
389.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
390.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
391.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
392.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソプロピルアミノプロピル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
393.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（２－エチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
394.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
395.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
396.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼパン－１－イルエチル）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
397.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
398.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼパン－１－イルエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
399.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

400. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
401. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
402. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペリジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
403. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
404. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）エチル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
405. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
406. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
407. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－エチルアミノエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
408. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
409. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
410. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
411. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）エチル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
412. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
413. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－シクロブチルアミノエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
414. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－５－フルオロ－10

－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
415.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
416.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－プロパ－２－イニルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
417.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
418.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
419.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－２－｛２－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
420.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジエチルアミノエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
421.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
422.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
423.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
424.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
425.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
426.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－シクロブチルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
427.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
428.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－エチルアミノプロピル）－５－フルオロ－10－（

３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
429.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソプロピルアミノプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
430.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソブチルアミノプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
431.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
432.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－２－〔３－（２－ヒドロキシエチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
433.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－〔３－（２－メトキシエチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
434.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロプロピルアミノプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
435.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロブチルアミノプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
436.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（tert－ブチルアミノプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
437.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－プロパ－２－イニルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
438.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
439.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
440.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジエチルアミノプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
441.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
442.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10

－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
443.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
444.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
445.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
446.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
447.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
448.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
449.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
450.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
451.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
452.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
453.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
454.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
455.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メト

キシ－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
456.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
457.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－エチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
458.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソプロピルアミノプロピル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
459.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソブチルアミノプロピル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
460.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
461.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－２－〔３－（２－ヒドロキシエチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
462.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（２－メトキシエチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
463.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－シクロブチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
464.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－tert－ブチルアミノプロピル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
465.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アリルアミノプロピル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
466.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－プロパ－２－イニルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
467.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
468.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
469.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－ジエチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒ

ドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
470.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
471.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
472.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
473.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
474.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
475.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
476.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
477.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
478.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
479.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペリジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
480.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
481.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
482.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

483. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
484. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
485. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペリジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
486. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
487. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペリジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
488. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
489. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－tert－ブチルアミノプロピル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；及び
490. （３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－〔３－（２－メトキシエチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
から選択される、請求項１に記載の式Ｉの化合物、又はその塩。

【請求項１３】
Ｒ１が２－（Ｒ11）－エチル又は３－（Ｒ11）－プロピルであり；
Ｒ２及びＲ３が共に水素であり；
Ｒ４がメチルであり；
Ｒ５が骨格の６位に結合しており、そして塩素、臭素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり；そして
Ｒ６が水素である
化合物、並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩
の中の１つ又は複数を含んで成る、請求項１～１２のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１４】
Ｒ１が２－（Ｒ11）－エチルであり；
Ｒ２及びＲ３が共に水素であり；
Ｒ４がメチルであり；
Ｒ５が骨格の６位に結合しており、そして塩素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり；そして
Ｒ６が水素である
化合物、並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩
の中の１つ又は複数を含んで成る、請求項１～１３のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１５】
疾病の治療のために用いられる、請求項１～１４のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１６】
請求項１～１４のいずれか一項に記載の１又は複数の化合物を常用の医薬助剤及び／又は賦形剤と一緒に含んで成る医薬組成物。

【請求項１７】
良性及び／又は悪性の新形成及び／又は癌を包含する、過剰増殖性疾患及び／又は増殖

性疾患及び／又はアポトーシスの誘導に応答性である疾患を治療するための医薬組成物の製造における、請求項１～１４のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項１８】

請求項１～１４のいずれか一項に記載の１又は複数の化合物の治療上有効で且つ許容される量を含む、良性及び／又は悪性の新形成及び／又は癌を包含する、過剰増殖性疾患及び／又は増殖性疾患及び／又はアポトーシスの誘導に応答性である疾患を治療、予防又は緩和するための医薬組成物。

【請求項１９】

請求項１～１４のいずれか一項に記載の１又は複数の化合物の治療上有効で且つ許容される量を投与することを含む、Eg5キネシン活性を活性調節するための医薬組成物。

【請求項２０】

療法において別々に、連続的に、同時に又は時差的に交互に使用するための組合せ物であって、

請求項１～１４のいずれか一項に記載の少なくとも１つの化合物である第一の活性成分と、化学療法抗癌剤及び標的特異的抗癌剤から成る群より選択された少なくとも１つの抗癌剤である第二の活性成分とを含有し、前記療法が、良性もしくは悪性新形成及び／又は癌を包含する、良性もしくは悪性の過剰増殖性疾患及び／又は増殖性疾患及び／又はアポトーシスの誘導に応答性である疾患の療法を包含する、前記組合せ物。

【請求項２１】

請求項１～１４のいずれか一項に記載の化合物である第一の活性化合物の一定量と、化学療法抗癌剤及び標的特異的抗癌剤から成る群より選択された抗癌剤である少なくとも１つの第二の活性化合物の一定量を含み、ここで前記第一の活性化合物の一定量と前記第二の活性化合物の一定量が治療効果をもたらす、良性もしくは悪性の新形成及び／又は癌を包含する、過剰増殖性疾病及び／又は増殖性疾病及び／又はアポトーシス誘導に応答性である疾患を治療するための医薬組成物。

【請求項２２】

前記化学療法抗癌剤が、

(i) アルキル化／カルバミル化剤；(ii) 白金誘導体；(iii) 有糸分裂抑制剤／チューブリン阻害剤；(iv) トポイソメラーゼ阻害剤；(v) ピリミジンアンタゴニスト；(vi) プリンアンタゴニスト、及び(vii) 葉酸アンタゴニスト

から選択される、請求項２０に記載の組合せ物。

【請求項２３】

前記化学療法抗癌剤が、

シクロホスファミド、イホスファミド、チオテパ、メルファラン、クロロエチルニトロソウレア、シスプラチン、オキサリプラチン、サトラプラチン、カルボプラチン、ビンクリスチン、ビンブラスチン、ビンオレルビン、パクリタキセル、ドセタキセル、アブラキサン、エポチロンＢ、アザエポチロン、サゴピロン（Sagopilone）（ZK-EPO）、ドキソルビシン、エトポシド、カンプトセシン、イリノテカン、テポテカン、５－フルオロウラシル、カペシタビン、アラビノシルシトシン／シタラビン、ゲムシタビン、６－メルカプトプリン、６－チオグアニン、フルダラビン、メトトレキセート、及びペメトレキセド

から成る群から選択される、請求項２０に記載の組合せ物。

【請求項２４】

前記化学療法抗癌剤が、

(i) アルキル化／カルバミル化剤；(ii) 白金誘導体；(iii) 有糸分裂抑制剤／チューブリン阻害剤；(iv) トポイソメラーゼ阻害剤；(v) ピリミジンアンタゴニスト；(vi) プリンアンタゴニスト、及び(vii) 葉酸アンタゴニスト

から選択される、請求項２１に記載の医薬組成物。

【請求項２５】

前記化学療法抗癌剤が、

シクロホスファミド、イホスファミド、チオテパ、メルファラン、クロロエチルニトロソ

ウレア、シスプラチン、オキサリプラチン、サトラプラチン、カルボプラチン、ビンクリスチン、ビンブラスチン、ビンオレルビン、パクリタキセル、ドセタキセル、アブラキサン、エポチロンＢ、アザエポチロン、サゴピロン（Sagopilone）（ZK-EPO）、ドキソルビシン、エトポシド、カンプトセシン、イリノテカン、テポテカン、５－フルオロウラシル、カペシタビン、アラビノシルシトシン／シタラビン、ゲムシタビン、６－メルカプトプリン、６－チオグアニン、フルダラビン、メトトレキセート、及びペメトレキセド
から選択される、請求項２１に記載の医薬組成物。
【請求項２６】
前記標的特異的抗癌剤が、
(i) キナーゼ阻害剤；(ii) プロテアソーム阻害剤；(iii) ヒストン・デアセチラーゼ阻害剤；(iv) 熱ショックタンパク質90阻害剤；(v) 血管標的薬剤（VTA）；抗血管新生薬；(vi) モノクローナル抗体、モノクローナル抗体の変異体及び接合体、及び抗体断片；(vii) オリゴヌクレオチド系治療薬；(viii) Toll様受容体／TLR9アゴニスト；TLR7アゴニスト；TLR7/8アゴニスト；TLR7/8アゴニストとしての免疫感受性RNA；(ix) プロテアーゼ阻害剤；(x) ホルモン治療薬；LHRH類似体；アロマターゼ阻害剤；レチノイド類；DNAメチルトランスフェラーゼ阻害剤；サイトカイン類；インターフェロン類；死受容体アゴニスト
から選択される、請求項２０、２２及び２３のいずれか一項に記載の組合せ物。
【請求項２７】
前記標的特異的抗癌剤が、
イマチニブ、ゲフィチニブ、ソラフェニブ、スニチニブ、エルロチニブ、ダサチニブ、ラパチニブ、バタラニブ、バンデタニブ、パゾパニブ、ボルテゾミブ、ボリノスタット（Vorinostat）、ベリノスタット（Belinostat）、エンチノスタット（Entinostat）、モセチノスタット（Mocetinostat）、ロミデプシン（Romidepsin）、パノビノスタット（Panobinostat）、ダシノスタット（Dacinostat）、バルプロン酸、アベキシノスタット（Abexinostat）、ギビノスタット（Givinostat）、プラシノスタット（Pracinostat）及び酪酸塩、17－アリルアミノゲルダナマイシン、17－ジメチルアミノゲルダナマイシン、コンブレタスタチンA4リン酸塩、オンブラブリン（Ombrabulin）、バタラニブ、バンデタニブ、パゾパニブ、トラスツズマブ、リツキシマブ、エレムツズマブ、トシツモマブ、セツキシマブ、ベバシズマブ、パニツムマブ、ゲムツマブ－オゾガミシン、イブリズモマブ－チウキセタン、オブリメルセン、DNMT1阻害剤MG98、イミキモド及びその類似体並びにイサトリビン及びその類似体、レシキモド、タモキシフェン、ラロキシフェン、フルタミド、カソデックス、ロイプロリド、ゴセレリン、トリプトレリン、ブレオマイシン、全トランス型レチノイン酸、デシタビン、５－アザシチジン、アラノシン、インターロイキン－２、インターフェロン－α２、インターフェロン－γ、TRAIL、DR4/5アゴニスト抗体、FasL、マパツムバム、及びレキサツムマブ
から選択される、請求項２０、２２及び２３のいずれか一項に記載の組合せ物。
【請求項２８】
前記標的特異的抗癌剤が、
(i) キナーゼ阻害剤；(ii) プロテアソーム阻害剤；(iii) ヒストン・デアセチラーゼ阻害剤；(iv) 熱ショックタンパク質90阻害剤；(v) 血管標的薬剤（VTA）；抗血管新生薬；(vi) モノクローナル抗体、モノクローナル抗体の変異体及び接合体、及び抗体断片；(vii) オリゴヌクレオチド系治療薬；(viii) Toll様受容体／TLR9アゴニスト；TLR7アゴニスト；TLR7/8アゴニスト；TLR7/8アゴニストとしての免疫感受性RNA；(ix) プロテアーゼ阻害剤；(x) ホルモン治療薬；LHRH類似体；アロマターゼ阻害剤；レチノイド類；DNAメチルトランスフェラーゼ阻害剤；サイトカイン類；インターフェロン類；死受容体アゴニスト
から選択される、請求項２１、２４及び２５のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項２９】
前記標的特異的抗癌剤が、

イマチニブ、ゲフィチニブ、ソラフェニブ、スニチニブ、エルロチニブ、ダサチニブ、ラパチニブ、バタラニブ、バンデタニブ、パゾパニブ、ボルテゾミブ、ボリノスタット（Vorinostat）、ベリノスタット（Belinostat）、エンチノスタット（Entinostat）、モセチノスタット（Mocetinostat）、ロミデプシン（Romidepsin）、パノビノスタット（Panobinostat）、ダシノスタット（Dacinostat）、バルプロン酸、アベキシノスタット（Abexinostat）、ギビノスタット（Givinostat）、プラシノスタット（Pracinostat）及び酪酸塩、17－アリルアミノゲルダナマイシン、17－ジメチルアミノゲルダナマイシン、コンブレタスタチンA4リン酸塩、オンブラブリン（Ombrabulin）、バタラニブ、バンデタニブ、パゾパニブ、トラスツズマブ、リツキシマブ、エレムツズマブ、トシツモマブ、セツキシマブ、ベバシズマブ、パニツムマブ、ゲムツマブ－オゾガミシン、イブリズモマブ－チウキセタン、オブリメルセン、DNMT1阻害剤MG98、イミキモド及びその類似体並びにイサトリビン及びその類似体、レシキモド、タモキシフェン、ラロキシフェン、フルタミド、カソデックス、ロイプロリド、ゴセレリン、トリプトレリン、ブレオマイシン、全トランス型レチノイン酸、デシタビン、５－アザシチジン、アラノシン、インターロイキン－２、インターフェロン－α２、インターフェロン－γ、TRAIL、DR4/5アゴニスト抗体、FasL、マパツムバム、及びレキサツムマブ
から選択される、請求項２１、２４及び２５のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項３０】
前記癌が
胸部、膀胱、骨、脳、中枢神経系及び末梢神経系、結腸、内分泌腺、食道、子宮内膜、生殖細胞、頭部及び頚部、腎臓、肝臓、肺、喉頭及び下咽頭の腫瘍、中皮腫、肉腫、卵巣、膵臓、前立腺、直腸、腎、小腸、軟組織、精巣、胃、皮膚、尿管、膣及び肛門の癌：
遺伝性癌、網膜芽細胞腫及びウィルムス腫瘍；
白血病、リンパ腫、非ホジキン病、慢性及び急性骨髄性白血病、急性リンパ芽球性白血病、ホジキン病、多発性骨髄腫及びＴ細胞リンパ腫；
骨髄異形成症候群、形質細胞新形成、腫瘍随伴症候群、未知の原発部位の癌並びにエイズ（AIDS）関連悪性疾患
から選択される、請求項１７に記載の使用。

【請求項３１】
前記癌が
胸部、膀胱、骨、脳、中枢神経系及び末梢神経系、結腸、内分泌腺、食道、子宮内膜、生殖細胞、頭部及び頚部、腎臓、肝臓、肺、喉頭及び下咽頭の腫瘍、中皮腫、肉腫、卵巣、膵臓、前立腺、直腸、腎、小腸、軟組織、精巣、胃、皮膚、尿管、膣及び肛門の癌：
遺伝性癌、網膜芽細胞腫及びウィルムス腫瘍；
白血病、リンパ腫、非ホジキン病、慢性及び急性骨髄性白血病、急性リンパ芽球性白血病、ホジキン病、多発性骨髄腫及びＴ細胞リンパ腫；
骨髄異形成症候群、形質細胞新形成、腫瘍随伴症候群、未知の原発部位の癌並びにエイズ（AIDS）関連悪性疾患
から選択される、請求項２０に記載の組合せ物。

【請求項３２】
前記癌が
胸部、膀胱、骨、脳、中枢神経系及び末梢神経系、結腸、内分泌腺、食道、子宮内膜、生殖細胞、頭部及び頚部、腎臓、肝臓、肺、喉頭及び下咽頭の腫瘍、中皮腫、肉腫、卵巣、膵臓、前立腺、直腸、腎、小腸、軟組織、精巣、胃、皮膚、尿管、膣及び肛門の癌：
遺伝性癌、網膜芽細胞腫及びウィルムス腫瘍；
白血病、リンパ腫、非ホジキン病、慢性及び急性骨髄性白血病、急性リンパ芽球性白血病、ホジキン病、多発性骨髄腫及びＴ細胞リンパ腫；
骨髄異形成症候群、形質細胞新形成、腫瘍随伴症候群、未知の原発部位の癌並びにエイズ（AIDS）関連悪性疾患
から選択される、請求項１８又は２１に記載の医薬組成物。

【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は、医薬産業において医薬組成物の製造に用いることができるインドロピリジン誘導体に関する。
【背景技術】
【０００２】
Hotha他、Angew. Chem. 2003, 115, 2481-2484の文献には、インドロピリジン化合物HR 22C16が、Eg5を標的することによる細胞分裂の阻害剤として記載されている。
【０００３】
EP357122号明細書は、特に細胞増殖抑制化合物としてのインドロピリジン、ベンゾフラノピリジン及びベンゾチエノピリジン誘導体を包含する。
【０００４】
国際出願WO9632003号及びWO0228865号明細書では、インドロピリジン誘導体がPDE阻害活性に関して記載されている。
【０００５】
国際出願WO2004/004652号明細書には、特にトランス－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザ－シクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオンが、キネシンスピンドルタンパク質（KSP）との結晶化複合体として記載されている。
【０００６】
米国出願US2005/0004156号明細書には、インドロピリジン誘導体、特にモナストロリン誘導体がEg5阻害剤として記載されている。
【０００７】
Bioorg. Med. Chem 13 (2005) 6094-6111には、テトラヒドロ－β－カルボリンがEg5阻害剤として記載されている。
J. Org. Chem., 第59巻, ６号, 1994, 1583-1585頁とChem. Pharm. Bull. 第42巻, 10号, 1994, 2108-2112頁には、テトラヒドロ－β－カルボリン－３－カルボン酸とイソシアネート及びイソチオシアネートとの反応が記載されている。
【０００８】
J. Med. Chem., 第46巻, 21号, 2003, 4525-4532頁には、インドロピリジン誘導体がPDE5阻害活性に関して記載されている。
国際出願WO2005/089752号明細書は、VEGF生産の阻害剤としての四環式カルボリン誘導体を記載している。
【０００９】
DE19744257明細書は、悪性疾患の治療に使用することができる、チロシンキナーゼ阻害剤としての２Ｈ－ピロロ〔３，４－ｃ〕－β－カルボリンを記載している。
【発明の開示】
【００１０】
下記に更に詳細に記載するインドロピリジン誘導体が、予想外の構造的特徴により従来技術化合物と異なり、且つ意外で特に有利な特性を有することが判明した。
例えば、本発明に係る化合物はEg5キネシンの阻害剤として働くことができる。より詳しくは、予想外にもこれらの誘導体が、細胞（過剰）増殖の強力且つ非常に有効な阻害剤及び／又は癌細胞における細胞周期特異的なアポトーシス誘導剤であることが判明した。
【００１１】
従って、これらの化合物は、（過剰）増殖性疾病及び／又はアポトーシスの誘導に応答性である疾患、とりわけ癌、を治療するのに特に有用となり得る。細胞周期特異的な作用形態を有することにより、これらの誘導体は、ＤＮＡのような簡易な細胞分子を標的とする標準化学療法薬に比較して、より高い治療指数を有するだろう。
【００１２】

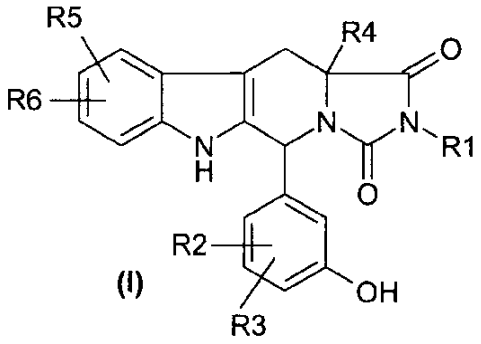
従って、本発明に係る化合物は、標的癌療法において有用であると期待される。

【発明を実施するための最良の形態】

【００１３】

従って、本発明は、第一の局面（局面Ａ）においては、式Ｉ：

【化１】



【００１４】

〔式中、

Ｒ１は、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、Ｃ2～Ｃ4アルケニル、Ｃ2～Ｃ4アルキニル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、又は、Ｒ11により置換されたＣ2～Ｃ7アルキルであり、ここで

Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112又はハロゲンであり、ここで

Ｒ111は、水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ2～Ｃ4アルケニル、Ｃ2～Ｃ4アルキニル、Ｃ3～Ｃ7シクロアキキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、ヒドロキシ－Ｃ2～Ｃ4アルキル、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ－Ｃ2～Ｃ4アルキル、１Ｎ－（Ｃ1～Ｃ4アルキル）ピラゾリル、１Ｎ－（Ｈ）－ピラゾリル、イソオキサゾリル、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルキルであり、

Ｒ112は水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、又はＣ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキルであり、

あるいはＲ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合される窒素原子を含めて、環Hetを形成し、ここで

Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、Ｓ－オキソ－チオモルホリン－４－イル、Ｓ，Ｓ－ジオキソ－チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、ホモピペリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ホモピペラジン－１－イル、２，５－ジヒドロピロール－１－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、トリアゾール－１－イル、又はテトラゾール－１－イルであり、ここで

Ｒ113は水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ1～Ｃ4アルキルカルボニル、アミジノ、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルキルであり、

ここで前記Hetは場合により、フッ素及びＣ1～Ｃ4アルキルから独立に選択された１個もしくは2個の置換基により置換されることがあり、

【００１５】

Ｒ２は、水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ又はヒドロキシルであり、

Ｒ３は、水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル又はＣ１～Ｃ4アルコキシであり、

Ｒ４は、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、又はＣ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキルであり、
Ｒ５は、Ｃ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシル、フェニル－Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ－Ｃ2～Ｃ4アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ2～Ｃ4アルコキシ、Ｃ3～Ｃ7シクロアルコキシ、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルコキシであり、
Ｒ６は水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル又はハロゲンである〕
により示される化合物、並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩に関する。

【００１６】
本発明は、更に、局面Ａの一態様である第二の局面（局面Ｂ）において、
Ｒ１がＣ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、又はR11により置換されたＣ2～Ｃ7アルキルであり、ここで
R11が－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112又はハロゲンであり、
Ｒ111が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、ヒドロキシ－Ｃ2～Ｃ4アルキル、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ－Ｃ2～Ｃ4アルキル、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルキルであり、
Ｒ112が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、又はＣ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキルであるか、あるいは
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合される窒素原子を含めて、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、Ｓ－オキソ－チオモルホリン－４－イル、Ｓ，Ｓ－ジオキソ－チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、ホモピペリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ホモピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、トリアゾール－１－イル、又はテトラゾール－１－イルであり、ここで
Ｒ113は水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ1～Ｃ4アルキルカルボニル、アミジノ、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルキルであり、
ここで前記Hetは場合により、フッ素及びＣ1～Ｃ4アルキルから独立に選択された１個もしくは2個の置換基により置換されることがあり、
Ｒ２が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ又はヒドロキシルであり、
Ｒ３が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル又はＣ1～Ｃ4アルコキシであり、
Ｒ４がＣ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル又はＣ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキルであり、
Ｒ５がＣ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシル、フェニル－Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ－Ｃ2～Ｃ4アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ2～Ｃ4アルコキシ、Ｃ3～Ｃ7シクロアルコキシ、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルコキシであり、
Ｒ６が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル又はハロゲンである、
式Ｉの化合物並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩に関する。

【００１７】
本発明は更に、局面Ａの一態様である第三の局面（局面Ｃ）において、
Ｒ１がＣ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、又はR11により置換されたＣ2～Ｃ7アルキルであり、ここで

R11が－N（R111）R112であり、
R111が水素、C1～C4アルキル、C3～C7シクロアルキル又はC3～C7シクロアルキル－C1～C4アルキルであり、
R112が水素、C1～C4アルキル、C3～C7シクロアルキル、又はC3～C7シクロアルキル－C1～C4アルキルであるか、あるいは
R111とR112が一緒になってそしてそれらが結合される窒素原子を含めて、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、Ｓ－オキソ－チオモルホリン－４－イル、Ｓ，Ｓ－ジオキソ－チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４Ｎ－（R113）－ピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル又はトリアゾール－１－イルであり、ここで
R113がC1～C4アルキル、C3～C7シクロアルキル又はC3～C7シクロアルキル－C1～C4アルキルであり、
Ｒ２が水素、C1～C4アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル、C1～C4アルコキシ又はヒドロキシルであり、
Ｒ３が水素、C1～C4アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル又はC1～C4アルコキシであり、
Ｒ４がC1～C4アルキル、C3～C7シクロアルキル又はC3～C7シクロアルキル－C1～C4アルキルであり、
Ｒ５がC1～C4アルキル、ハロゲン、C1～C4アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシル、フェニル－C1～C4アルコキシ、C1～C4アルコキシ－C2～C4アルコキシ、ヒドロキシ－C2～C4アルコキシ、C3～C7シクロアルコキシ、C3～C7シクロアルキル－C1～C4アルコキシ、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたC1～C4アルコキシであり、
Ｒ６が水素、C1～C4アルキル又はハロゲンである、
式Ｉの化合物並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩に関する。

【００１８】

本明細書中で用いる時、単独の又は別の基の一部としての「アルキル」は、特定数の炭素原子を有する分枝状及び直鎖状の両方の飽和脂肪族炭化水素基を指し、例えば：

C1～C4アルキルは、１～４個の炭素原子を有する直鎖状又は分枝鎖状アルキル基である。その例は、ブチル、イソブチル、sec－ブチル、tert－ブチル、プロピル、イソプロピル、エチル及びメチル基であり、その中でプロピル、イソプロピルが好ましく、特にエチル及びメチル基がより好ましい例である。

【００１９】

C2～C7アルキルは、２～７個の炭素原子を有する直鎖状又は分枝鎖状アルキル基である。その例は、ヘプチル、イソヘプチル（５－メチルヘキシル）、ヘキシル、イソヘキシル（４－メチルペンチル）、ネオヘキシル（３，３－ジメチルブチル）、ペンチル、イソペンチル（３－メチルブチル）、ネオペンチル（２，２－ジメチルプロピル）、ブチル、イソブチル、sec－ブチル、tert－ブチル、イソプロピル基であり、特にプロピル及びエチル基である。

C2～C4アルキルは、２～４個の炭素原子を有する直鎖状又は分枝鎖状アルキル基である。その例は、ブチル、イソブチル、sec－ブチル、tert－ブチル、イソプロピル、及び特にプロピル及びエチル基である。

【００２０】

本発明の意味でのハロゲンは、ヨウ素、又は特に臭素、塩素又はフッ素である。

C1～C4アルコキシは、酸素原子に加えて、１～４個の炭素原子を有する直鎖状又は分枝状アルキル基を含有する基を表す。例として挙げられるのは、ブトキシ、イソブトキシ、sec－ブトキシ、tert－ブトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、エトキシ及びメトキシ基であり、その中でプロポキシ、イソプロポキシ、及び特にエトキシ及びメトキシがよ

り好ましい。

【００２１】

単独で又は別の基の一部分としての「シクロアルキル」という用語は、特定数の環炭素原子を有する単環式飽和脂肪族炭化水素基を指す。例えば：

Ｃ3～Ｃ7シクロアルキルは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル及びシクロヘプチルを表し、その中でシクロプロピル、シクロブチル及びシクロペンチルが特に言及されるべきである。

【００２２】

Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキルは、前記Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル基の１つによって置換されている前記Ｃ1～Ｃ4アルキル基の１つを表す。例として挙げられるのは、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキルメチル基、例えばシクロプロピルメチル、シクロブチルメチル又はシクロペンチルメチル基であり、その中でシクロプロピルメチルが特に言及されるべきである。

【００２３】

Ｃ2～Ｃ4アルケニルは、２～４個の炭素原子を有する直鎖状又は分枝状アルケニル基である。その例は２－ブテニル、３－ブテニル（ホモアリル）、１－プロペニル、２－プロペニル（アリル）及びエテニル（ビニル）基である。

【００２４】

Ｃ2～Ｃ4アルキニルは、２～４個の炭素原子を有する直鎖状又は分枝状アルキニル基である。その例は２－ブチニル、３－ブチニル（ホモプロパルギル）、１－プロピニル、２－プロピニル（プロパルギル）、１－メチル－２－プロピニル（１－メチルプロパルギル）及びエチニル基である。

【００２５】

Ｃ2～Ｃ4アルコキシは、酸素原子に加えて２～４個の炭素原子を有する直鎖状又は分枝状アルキル基を含有する基を表す。例として挙げられるのは、ブトキシ、イソブトキシ、sec－ブトキシ、tert－ブトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ及び特にはエトキシ基である。

【００２６】

Ｃ1～Ｃ4アルコキシ－Ｃ2～Ｃ4アルコキシは、前記Ｃ1～Ｃ4アルコキシ基の１つにより置換されている前記Ｃ2～Ｃ4アルコキシ基の１つを表す。例として挙げられるのは、２－メトキシエトキシ、２－エトキシエトキシ及び２－イソプロポキシエトキシ基である。

【００２７】

ヒドロキシ－Ｃ2～Ｃ4アルコキシは、ヒドロキシル基により置換されている前記Ｃ2～Ｃ4アルコキシ基の１つを表す。例として挙げられるのは、２－ヒドロキシエトキシ及び３－ヒドロキシプロポキシ基である。

【００２８】

Ｃ3～Ｃ7シクロアルコキシは、シクロプロピルオキシ、シクロブチルオキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシ又はシクロヘプチルオキシを表し、その中でシクロプロピルオキシ、シクロブチルオキシ及びシクロペンチルオキシが特に挙げられる。

【００２９】

Ｃ3～Ｃ7－シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4－アルコキシは、前記Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル基の１つにより置換されている前記Ｃ1～Ｃ4アルコキシ基の１つを表す。例として挙げられるのは、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキルメトキシ基、例えばシクロプロピルメトキシ、シクロブチルメトキシ又はシクロペンチルメトキシであり、その中でシクロプロピルメトキシが特に言及される。

【００３０】

完全に又は大部分フッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルコキシは、例えば、２，２，３，３，３－ペンタフルオロプロポキシ、ペルフルオロエトキシ、１，２，２－トリフルオロエトキシ基、特に１，１，２，２－テトラフルオロエトキシ、２，２，２－トリフルオロエトキシ、トリフルオロメトキシ及びジフルオロメトキシ基であり、その中でトリフルオロ

メトキシ及びジフルオロメトキシ基が好ましい。この関連での「大部分」とは、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ基中の水素原子の半分より多くがフッ素原子により置換されていることを意味する。

【００３１】

フェニル－Ｃ1～Ｃ4アルコキシは、フェニル基により置換されている前記Ｃ1～Ｃ4アルコキシ基の１つを表す。例として挙げられるのは、フェネトキシ及びベンジルオキシ基である。

Ｃ1～Ｃ4アルキルカルボニルは、前記Ｃ1～Ｃ4アルキル基の１つが結合されているカルボニル基である。その例はアセチル基（CH_3CO-）である。

【００３２】

１Ｎ－（Ｃ１～Ｃ4アルキル）ピラゾリル又は１Ｎ－（Ｈ）－ピラゾリルは、それぞれ、１位にある環窒素原子上でそれぞれＣ1～Ｃ4アルキルにより又は水素により置換されているピラゾリル基を表し、例えば特に１－メチルピラゾール－５－イル又は１－メチルピラゾール－３－イル基を表す。

【００３３】

完全に又は部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルキルとしては、例えば、２，２，３，３，３－ペンタフルオロプロピル、ペルフルオロエチル、１，２，２－トリフルオロエチル、１，１，２，２－テトラフルオロエチル、２，２，２－トリフルオロエチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、モノフルオロメチル、２－フルオロエチル及び２，２－ジフルオロエチル基を挙げることができ、特に２，２，２－トリフルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル及び２－フルオロエチル基を挙げることができる。

【００３４】

Hetは、Ｃ1～Ｃ4アルキル及びフッ素から独立に選択された１個又は２個の置換基により場合により置換されることがあり、そしてピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、Ｓ－オキソチオモルホリン－４－イル、Ｓ，Ｓ－ジオキソチオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、ホモピペリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ホモピペラジン－１－イル、２，５－ジヒドロピロール－１－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、トリアゾール－１－イル又はテトラゾール－１－イルであり、ここで

Ｒ21は水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル、Ｃ3～Ｃ7シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ1～Ｃ4アルキルカルボニル、アミジノ、又は完全にもしくは部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ4アルキルであり、

特に

Ｒ21は水素、Ｃ1～Ｃ3アルキル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、Ｃ1～Ｃ2アルキルカルボニル、又は部分的にフッ素で置換されたＣ1～Ｃ3アルキル（例えば２－フルオロエチル、２，２，２－トリフルオロエチル、又は特に２，２－ジフルオロエチル）である。

【００３５】

第一態様では、Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル又はアゼチジン－１－イルである。

【００３６】

第二態様では、Hetは４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イルであり、ここで

Ｒ21は水素、メチル、エチル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、Ｃ1～Ｃ2アルキルカルボニル、２－フルオロエチル、２，２，２－トリフルオロエチル又は２，２－ジフルオロエチルであり、

例えばHetは４－メチルピペラジン－１－イル又は４－アセチルピペラジン－１－イルである。

【００３７】

第三態様では、Hetはメチル及びフッ素から独立に選択された１個又は２個の置換基に

より場合により置換されることがあり、そしてHetはピペリジン－１－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、又はホモピペリジン－１－イル；例えばピペリジン－１－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、又は４－メチルピペリジン－１－イル、４－フルオロピペリジン－１－イル、４，４－ジフルオロピペリジン－１－イル、（Ｓ）－３－フルオロピロリジン－１－イル、（Ｒ）－３－フルオロピロリジン－１－イル、３，３－ジフルオロピロリジン－１－イル、３－フルオロアゼチジン－１－イル又は３，３－ジフルオロアゼチジン－１－イルである。

【００３８】

第四態様では、Hetはピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル又はトリアゾール－１－イル、特にイミダゾール－１－イルである。

第五態様では、Hetは２，５－ジヒドロピロール－１－イル又は１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－１－イルである。

【００３９】

アミノ－Ｃ1～Ｃ4アルキルは、アミノ基により置換されている前記Ｃ1～Ｃ4アルキル基を表す。例として挙げられるのは、アミノメチル、２－アミノエチル及び３－アミノプロピル基である。

【００４０】

ヒドロキシ－Ｃ2～Ｃ4アルキルは、ヒドロキシル基により置換されている前記Ｃ2～Ｃ4アルキル基を表す。例として挙げられるのは、２－ヒドロキシエチル及び３－ヒドロキシプロピル基である。

Ｃ1～Ｃ4アルコキシ－Ｃ2～Ｃ4アルキルは、前記Ｃ1～Ｃ4アルコキシ基の１つにより置換されているＣ2～Ｃ4アルキル基を表す。例として挙げられるのは、２－メトキシエチル及び３－メトキシプロピル基である。

【００４１】

モノ－又はジ－Ｃ1～Ｃ4アルキルアミノは、窒素原子に加えて、上記Ｃ1～Ｃ4アルキル基の１つ又は２つを含有する。例として挙げられるのは、モノ－Ｃ1～Ｃ4アルキルアミノ基、同様にメチルアミノ、エチルアミノ又はイソプロピルアミノ、並びにジ－Ｃ1～Ｃ4アルキルアミノ基、同様にジメチルアミノ、ジエチルアミノ又はジイソプロピルアミノである。

【００４２】

モノ－又はジ－Ｃ1～Ｃ4アルキルアミノ－Ｃ1～Ｃ4アルキルは、前記モノ－又はジ－Ｃ1～Ｃ4アルキルアミノ基の１つにより置換されている前記Ｃ1～Ｃ4アルキル基の１つを表す。例として挙げられるのは、メチルアミノメチル、ジメチルアミノメチル、２－メチルアミノエチル、２－ジメチルアミノエチル、３－メチルアミノプロピル又は３－ジメチルアミノプロピル基である。

【００４３】

４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル又は４Ｎ－（Ｒ113）－ホモピペラジン－１－イルは、４位にある環窒素原子上でＲ113により置換されているピペラジン－１－イル又はホモピペラジン－１－イル基をそれぞれ表す。

２－（Ｒ11）－エチルという語は、Ｒ11により２位が置換されているエチルを表す。３－（Ｒ11）－プロピルは、Ｒ11により３位が置換されているプロピルを表す。４－（Ｒ11）－ブチルは、Ｒ11により４位が置換されているブチルを表す。

【００４４】

一般に、別記しない限り、複素環は全ての可能な異性体形、例えばその位置異性体を包含する。例えば、トリアゾール－１－イルという語は、〔１，２，３〕トリアゾール－１－イル、〔１，３，４〕トリアゾール－１－イル及び〔１，２，４〕トリアゾール－１－イルを包含し、イソキサゾリルという語はイソキサゾール－３－イル、イソキサゾール－４－イル及びイソキサゾール－５－イルを包含する。

【００４５】

本明細書中で言及する時の場合により置換されることがある成分は、異なって記載され

ない限り、任意の可能な位置において置換され得る。
別記しない限り、本明細書中で言及される炭素環式基は、任意の可能な位置においてそれの置換基又は親分子基によって置換可能である。
【００４６】
本明細書中で言及される複素環式基は、別記しない限り、任意の可能な位置において、例えば任意の置換可能な環炭素原子又は環窒素原子のところで、それらの特定の置換基又は親分子基により置換され得る。
別記しない限り、四級化可能であるアミノ型又はイミノ型環窒素原子（－Ｎ＝）を含有する環は、好ましくはそれらのアミノ型又はイミノ型環窒素原子上では上述した置換基又は親の分子基により四級化されない。
【００４７】
任意の変数がいずれかの成分において１回以上存在する場合、各々の定義は独立的である。
【００４８】
本発明に係る式Ｉの化合物についての適当な塩（置換に依存して）は、全ての酸付加塩又は全ての塩基との塩である。特に言及されるのは、薬学において常用の薬理学的に許容される無機酸及び有機酸並びに塩基から形成されるものである。適当であるのは、一方で、酸、例えば塩酸、臭化水素酸、リン酸、硝酸、硫酸、酢酸、クエン酸、Ｄ－グルコン酸、安息香酸、２－（４－ヒドロキシベンゾイル）安息香酸、酪酸、スルホサリチル酸、マレイン酸、ラウリン酸、リンゴ酸、例えば（－）－Ｌ－リンゴ酸もしくは（＋）－Ｄ－リンゴ酸、フマル酸、コハク酸、シュウ酸、酒石酸、例えば（＋）－Ｌ－酒石酸もしくは（－）－Ｄ－酒石酸もしくはメソ酒石酸、エンボン酸、ステアリン酸、トルエンスルホン酸、メタンスルホン酸又は３－ヒドロキシ－２－ナフトエ酸のような酸との水不溶性酸付加塩及び特に水溶性酸付加塩であり、前記酸は、一塩基酸又は多塩基酸のどちらが関係するかに依存して、そしてどの塩が望ましいかに依存して、等モル量比又はそれとは異なる比で、塩調製に使用される。
【００４９】
上述との関連で、式Ｉの化合物の可能な塩の調製において使用することができる更なる酸として、例えば、アジピン酸、Ｌ－アスコルビン酸、Ｌ－アスパラギン酸、ベンゼンスルホン酸、４－アセトアミド安息香酸、（＋）－ショウノウ酸、（＋）－カンファー－10－スルホン酸、カプリル酸（オクタン酸）、ドデシルスルホン酸、エタン－１，２－ジスルホン酸、エタンスルホン酸、２－ヒドロキシエタンスルホン酸、蟻酸、ガラクタル酸、ゲンチシン酸、Ｄ－グルコヘプトン酸、Ｄ－グルクロン酸、グルタミン酸、２－オキソグルタル酸、馬尿酸、乳酸、例えばＤ－乳酸もしくはＬ－乳酸、マロン酸、マンデル酸、例えば（＋）－マンデル酸もしくは（－）－マンデル酸、ナフタレン－１，５－ジスルホン酸、ナフタレン－２－スルホン酸、ニコチン酸、パルミチン酸、ピログルタミン酸、例えばＬ－ピログルタミン酸、ヨウ化水素酸、シクラミン酸、チオシアン酸、２，２－ジクロロ酢酸、グリセロリン酸、１－ヒドロキシ－２－ナフトエ酸、サリチル酸、４－アミノサリチル酸、グリコール酸、オレイン酸、グルタル酸、桂皮酸、カプロン酸、イソ酪酸、プロピオン酸、カプリル酸、ウンデシレン酸及びオロチン酸より選択されたいずれかのものを挙げることができる。
【００５０】
他方で、置換に依存して、塩基との塩も適当である。塩基との塩の例としては、リチウム、ナトリウム、カリウム、カルシウム、アルミニウム、マグネシウム、チタン、アンモニウム、メグルミン又はグアニジン塩も挙げることができ、その際、前記塩基は等モル量比又はそれとは異なる比で塩調製に使用される。
【００５１】
医薬用途には不適切であるが、例えば、式Ｉの遊離化合物又はそれらの医薬上許容される塩の単離又は精製に使用することができる塩も含まれる。
例えば、工業規模での本発明化合物の調製の間に工程生成物として得られる薬理学的に

許容できない塩は、当業者に既知の方法により薬理学的に許容される塩に変換される。

【００５２】

専門家の知識によれば、本発明に係る式Ｉの化合物並びにそれらの塩は、例えば結晶形で単離された場合、種々の量の溶媒を含有することがある。従って、本発明に係る式Ｉの化合物の全ての溶媒和物、特に全ての水和物、並びに本発明に係る式Ｉの化合物の塩の全ての溶媒和物、特に全ての水和物が、本発明の範囲に包含される。

【００５３】

本発明の一態様では、式Ｉの化合物の塩は、式Ｉの化合物と塩酸との塩（塩酸塩）を包含する。

本発明の別の態様では、式Ｉの化合物の塩は、塩酸塩、リン酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、メシル酸塩、トシル酸塩及び硫酸塩を包含する。

【００５４】

式Ｉの化合物の置換基Ｒ２及びＲ３は、フェニル環が骨格に結合される結合位置に対してオルト位、メタ位又はパラ位に結合することができる。一態様では、Ｒ３が水素である。特定の態様ではＲ２とＲ３が共に水素である。

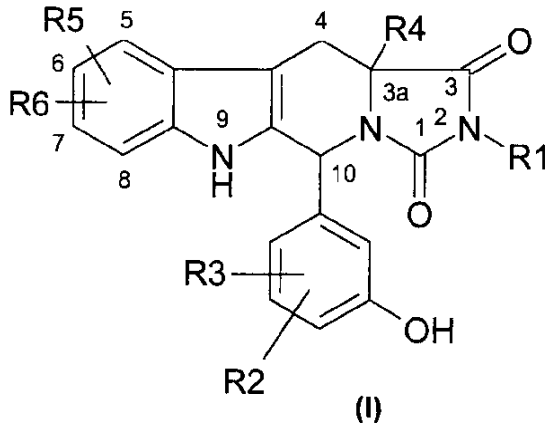
【００５５】

置換基Ｒ５及びＲ６は、特に断らない限り、骨格のベンゼン成分の任意の位置に取り付けることができるが、骨格の８位にはＲ５とＲ６のどちらも結合しないのが好ましい。一態様では、Ｒ５は骨格の５位に置かれ；別の態様では、Ｒ５は骨格の７位に置かれ；更に別の態様では、Ｒ５は骨格の６位に置かれ；それらの場合、特に、それぞれＲ６は水素であるか、又はそれぞれＲ６はフッ素である。特定の態様では、Ｒ５は骨格の６位に取り付けられる。より特定の態様では、Ｒ５は骨格の６位に置かれ、そしてＲ６は水素である。別の態様では、Ｒ５は骨格の６位に置かれ、そしてＲ６は骨格の７位に置かれたフッ素である。更に別の態様では、Ｒ５は骨格の６位に置かれ、そしてＲ６は骨格の５位に置かれたフッ素である。

【００５６】

番号付け法

【化２】



(I)

【００５７】

式Ｉの化合物は、少なくとも３ａ位及び10位に不斉中心を有する不斉化合物である。

【００５８】

本発明は、実質的に純粋形で並びに任意の混合比（例えばラセミ体）での、全ての考えられる立体異性体、例えばジアステレオマー及び鏡像体、並びにその塩を包含する。

【００５９】

従って、本発明に係る化合物の実質的に純粋な立体異性体、特に下記実施例の実質的に

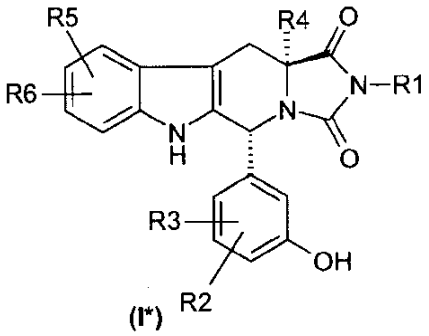
純粋な立体異性体は、全て本発明の部分であり、そして当業者に周知の手順に従って、例えば対応する混合物の分離により、立体化学的に純粋な出発物質を使うことにより、そして／又は立体選択的合成法により、得ることができる。

【００６０】

ここで、３ａ位及び10位に関して式Ｉ*に示されるのと同じ立体配置を有する、式Ｉの化合物が好ましい。

【００６１】

【化３】



【００６２】

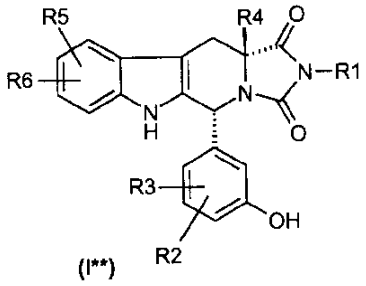
例えば、式Ｉ*の化合物において、Ｒ４がメチル又はエチルを意味するならば、カーン・インゴールド・プレログ則に従ったその立体配置は、３ａ位がＳであり、且つ10位がＲである。例えば、式Ｉ*の化合物において、Ｒ４がイソプロピル又はシクロプロピルを意味するならば、カーン・インゴールド・プレログ則に従ったその立体配置は、３ａ位がＲであり、且つ10位がＲである。

【００６３】

更に、言及するに値する式Ｉの化合物は、３ａ位及び10位に関して、式Ｉ**に示されるのと同じ立体配置を有するものである。

【００６４】

【化４】



【００６５】

例えば、式Ｉ**の化合物において、Ｒ４がメチル又はエチルを意味するのであれば、カーン・インゴールド・プレログ則に従った立体配置は、３ａ位がＲであり且つ10位がＲである。

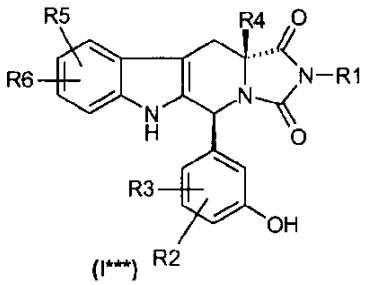
例えば、式Ｉ**の化合物において、Ｒ４がイソプロピル又はシクロプロピルを意味するのであれば、カーン・インゴールド・プレログ則に従った立体配置は、３ａ位がＳであり

且つ10位がＲである。

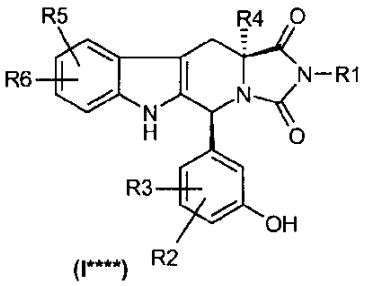
【００６６】

更に、同じく言及すべき式Ｉの化合物は、３ａ位及び10位に関して、式Ｉ***又は式Ｉ***に示されるのと同じ立体配置を有するものである：

【化５】



(I***)



(I****)

【００６７】

例えば、式Ｉ***の化合物において、Ｒ４がメチル又はエチルを意味するならば、カーン・インゴールド・プレログ則に従った立体配置は、３ａ位がＲであり且つ10位がＳである。

例えば、式Ｉ***の化合物において、Ｒ４がイソプロピル又はシクロプロピルを意味するならば、カーン・インゴールド・プレログ則に従った立体配置は、３ａ位がＳであり且つ10位がＳである。

【００６８】

例えば、式Ｉ****の化合物において、Ｒ４がメチル又はエチルを意味するならば、カーン・インゴールド・プレログ則に従った立体配置は、３ａ位がＳであり且つ10位がＳである。

例えば、式Ｉ****の化合物において、Ｒ４がイソプロピル又はシクロプロピルを意味するならば、カーン・インゴールド・プレログ則に従った立体配置は、３ａ位がＲであり且つ10位がＳである。

【００６９】

これに関連して、別の態様では、比旋光度〔α〕$^{20}_{D}$＝－159°（ｃ＝0.5400，メタノール）を有する化合物（－）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザ－シクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオンと３ａ位及び10位に関して同じ絶対配置を有する式Ｉの化合物、並びにその塩が好ましい。

【００７０】

一般に、本発明の鏡像体的に純粋な化合物は、当該技術分野で既知の方法に従って、例えば不斉合成を介して、例えば、既知方法（例えば、クロマトグラフィー分離又は適当な溶媒からの（分別）結晶法により）により分離することができる、適当なジアステレオ異性体化合物／中間体の調製と分離により；不斉シントン又は不斉試薬を用いることにより；不斉分離カラム上での対応するラセミ化合物のクロマトグラフィー分離により；ラセミ化合物と光学活性酸（例えば本明細書中に後述するもの）又は塩基とのジアステレオマー塩の形成と、それに続く該塩の分割及び該塩からの所望の化合物の遊離により；不斉補助試薬を用いた対応するラセミ化合物の誘導体化と、それに続くジアステレオマー分離及び不斉補助基の除去により；ラセミ体の速度論的分割により（例えば酵素的分割により）；適切な条件下での鏡像形態をもつ結晶の集成体からの鏡像選択的結晶化（又はエントレインメントによる結晶化）により；又は不斉補助薬の存在下での適当な溶媒からの結晶化により、調製することができる。

【００７１】
好ましくは、鏡像異性的に純粋な化合物は、既知の鏡像異性的に純粋な出発化合物から出発して、既知の方法（例えばクロマトグラフィー分離又は結晶化）により又は適当な不斉分離カラム上での対応するラセミ体のクロマトグラフィー分割により分離することができるジアステレオマー中間体の合成を介して得ることができる。
【００７２】
式Ｉ*を有する鏡像体及びその塩が本発明の好ましい部分である。
【００７３】
本発明の状況では、過剰増殖及びその類似語は、異常な／無調節な細胞増殖、つまり癌のような疾病の特徴を説明するために使用される。この過剰増殖は、各細胞において単一の又は多数の細胞／分子の変化によって引き起こされ、そして生物全体に関しては、良性又は悪性の性質であることができる。細胞増殖の阻害及びその類似語は、ある化合物と接触せしめた細胞の増殖を遅延させる及び／又は細胞を死滅させる該化合物の能力を、該化合物と接触していない細胞と比較して示すために使用される。この細胞増殖の最も好ましい阻害は100％であり、これは全ての細胞の増殖が停止しそして／又は細胞がプログラム細胞死を受けることを意味する。幾つかの有利な態様では、接触される細胞は新生（腫瘍）細胞である。新生細胞は、異常な細胞増殖を有する細胞及び／又は異なる組織もしくは器官に転移する可能性を有する細胞として定義される。良性新生物形成は、進行性で転移性の腫瘍を生体内で形成できない、細胞の過剰増殖により説明される。それに対して、悪性新生物形成は、様々な細胞性及び生化学的な異常を有し、例えば腫瘍転移を形成することができる細胞により説明される。悪性新生細胞の後天的機能異常（「癌の特徴」としても定義される）は、無限の複製能力、増殖シグナルにおける自給自足、抗増殖シグナルに対する不感受性、アポトーシスからの回避、持続的な血管形成、組織浸潤及び転移である。
【００７４】
アポトーシスの誘導及びその類似語は、ある化合物と接触した細胞においてプログラム細胞死を誘導する化合物を特定するために用いられる。アポトーシスは、接触細胞内での複雑な生化学的現象、例えばシステイン特異的プロテイナーゼ（「カスパーゼ」）の活性化及びクロマチンの断片化により定義される。該化合物と接触した細胞におけるアポトーシスの誘導は、必ずしも細胞増殖の阻害と連関するわけではない。好ましくは、細胞増殖の阻害及び／又はアポトーシスの誘導は、異常な細胞増殖（過剰増殖）を有する細胞に特異的である。このように、異常な細胞増殖を有する細胞と比較すると、正常増殖細胞又は静止細胞は、該化合物の増殖阻害活性又はアポトーシス誘導活性に対して低感受性であるか又は不感受性でさえある。最後に、細胞毒性という用語は、例えば細胞周期依存又は細胞周期非依存的方式でのアポトーシス／プログラム細胞死の誘導をはじめとする様々な機構により細胞を死滅させる化合物を特定するために、より一般的な意味で使用される。
【００７５】
細胞周期特異的及びそれの類似語は、細胞周期の特定の段階を能動的に通過する増殖細胞においてのみアポトーシス／細胞死を誘導するが、静止した非分裂細胞では誘導しない化合物を特定するために用いられる。連続的に増殖する細胞は、癌のような疾病に典型的であり、且つ細胞分裂周期の全段階、つまりＧ（「間隙」）１期、Ｓ（「ＤＮＡ合成」）期、Ｇ２期及びＭ（「有糸分裂」）期にある細胞により特徴付けられる。
【００７６】
言及するに値する本発明の局面Ａに係る化合物は、
Ｒ１が、Ｃ1～Ｃ4アルキル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、Ｃ2～Ｃ4アルケニル、Ｃ2～Ｃ4アルキニル、又はR11により置換されたＣ2～Ｃ4アルキルであり、ここで
R11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112又はハロゲンであり、
R111は水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、Ｃ2～Ｃ4アルケニル、Ｃ2～Ｃ4アルキニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、ヒドロキシ－Ｃ2～Ｃ4アルキル、Ｃ1～Ｃ2アルコキシ－Ｃ2～Ｃ4アルキル、イソオキサゾリル、１Ｎ－（Ｃ1～Ｃ3アルキル）ピ

ラゾリル、又はモノ－、ジ－もしくはトリ－フッ素置換Ｃ1～Ｃ4アルキルであり、
Ｒ112は水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであるか、あるいはＲ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合される窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、Ｓ－オキソチオモルホリン－４－イル、Ｓ，Ｓ－ジオキソモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、ホモピペリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ホモピペラジン－１－イル、２，５－ジヒドロピロール－１－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、トリアゾール－１－イル、又はテトラゾール－１－イルであり、
Ｒ113は水素、Ｃ1～Ｃ3アルキル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、Ｃ1～Ｃ3アルキルカルボニル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチル又はエチルであり、
特に
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されたＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
特に
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素又はフッ素であり、
Ｒ５は骨格の５位、７位又は特に６位に結合しており、そして
Ｒ６は骨格の５位又は７位に結合している
式Ｉの化合物、並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩である。

【００７７】

言及するに値する本発明の局面Ａに係る化合物は、
Ｒ１が、メチル、ビニル、２－（Ｒ11）－エチル、又は３－（Ｒ11）－プロピルであり、
Ｒ11が－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112、フッ素、塩素又は臭素であり、ここで
Ｒ111が水素であり、そして
Ｒ112が水素であり、
又は
Ｒ111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、tertブチル、ビニル、アリル、プロパルギル、１－メチルプロパルギル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、イソオキサゾリル、１Ｎ－（メチル）－ピラゾリル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
Ｒ112が水素であり、
又は
Ｒ111がエチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、tertブチル、ビニル、アリル、プロパルギル、１－メチルプロパルギル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
Ｒ112がメチルであり、
又は

R111がエチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、tertブチル、ビニル、アリル、プロパルギル、１－メチルプロパルギル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
R112がエチル、イソプロピル又はシクロプロピルであり、
又は
R111とR112が一緒になってそしてそれらが結合した窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、ホモピペリジン－１－イル、４Ｎ－（R113）－ピペラジン－１－イル、４Ｎ－（R113）－ホモピペラジン－１－イル、２，５－ジヒドロピロール－１－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、トリアゾール－１－イル、又はテトラゾール－１－イルであり、
R113が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、アセチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、
ここで前記Hetは場合により、フッ素及びメチルから独立に選択された１個又は２個の置換基により置換されることがあり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
より特定的には
Ｒ５が塩素、臭素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素又はフッ素であり、
Ｒ５は骨格の６位に結合しており、そして
Ｒ６は骨格の５位又は７位に結合している
式Ｉの化合物、並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩である。

【００７８】

言及するに特に値する本発明の局面Ａに係る化合物は、
Ｒ１が２－（R11）－エチル又は３－（R11）－プロピルであり、
R11は－Ｎ（R111）R112であり、ここで
R111が水素であり、そして
R112が水素であるか、
又は
R111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、tertブチル、アリル、プロパルギル、１－メチルプロパルギル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
R112が水素であるか、
又は
R111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、tertブチル、アリル、プロパルギル、１－メチルプロパルギル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
R112メチルであるか、
又は
R111がエチル、プロピル、イソプロピル、アリル、プロパルギル、１－メチルプロパルギル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、

２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
Ｒ112がエチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成する
のいずれかであり、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、ホモピペリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ホモピペラジン－１－イル、２，５－ジヒドロピロール－１－イル、１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－１－イル、４－メチルピペリジン－１－イル、４－フルオロピペリジン－１－イル、４，４－ジフルオロピペリジン－１－イル、（Ｓ）－３－フルオロピロリジン－１－イル、（Ｒ）－３－フルオロピロリジン－１－イル、又は３，３－ジフルオロピロリジン－１－イルであり、
Ｒ113はメチル又はアセチルであるか、
又は
Hetはピラゾール－１－イル又はイミダゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
より特定的には、
Ｒ５が塩素、臭素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素又はフッ素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合しており、そして
Ｒ６は骨格の５位又は特に７位に結合している
式Ｉの化合物、それらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩である。

【００７９】

言及するに特に値する本発明の局面Ａに係る化合物は、
Ｒ１が２－（Ｒ11）－エチル又は３－（Ｒ11）－プロピルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、
Ｒ111がメチル、エチル、イソプロピル、イソブチル、tertブチル、アリル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、又は２－メトキシエチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチル、エチル、イソプロピル、アリル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、又は２－メトキシエチルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111がエチル、２－ヒドロキシエチル、又は２－メトキシエチルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成する
のいずれかであり、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、２，５－ジヒドロピロール－１－イル、又は１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－１－イルであり、

Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素又はフッ素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合しており、そして
Ｒ６は骨格の７位に結合している
式Ｉの化合物、それらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩である。
【００８０】
強調すべき本発明の局面Ａに係る化合物は、
Ｒ１が２－（Ｒ11）－エチル又は３－（Ｒ11）－プロピルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111がメチル、エチル、イソプロピル、イソブチル、tertブチル、アリル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、又は２－メトキシエチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチル、エチル、イソプロピル、アリル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、又は２－メトキシエチルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111がエチル、２－ヒドロキシエチル、又は２－メトキシエチルであり、そして
Ｒ112がエチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成する
のいずれかであり、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、２，５－ジヒドロピロール－１－イル、又は１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
式Ｉ*の化合物、それらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩である。
【００８１】
言及するに値する本発明の局面Ｂに係る化合物は、
Ｒ１がＣ1～Ｃ4アルキル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、又はＲ11により置換されたＣ2～Ｃ4アルキルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112又はハロゲンであり、
Ｒ111が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、
Ｒ112が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、Ｓ－

オキソチオモルホリン－４－イル、Ｓ，Ｓ－ジオキソチオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、ホモピペリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ホモピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、トリアゾール－１－イル、又はテトラゾール－１－イルであり、
Ｒ113が水素、Ｃ1～Ｃ3アルキル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、Ｃ1～Ｃ3アルキルカルボニル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、
ここで前記Hetは場合によりフッ素及びＣ1～Ｃ3アルキルから独立に選択された１個又は２個の置換基により置換されることがあり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がＣ1～Ｃ4アルキル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
Ｒ５がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は特に６位に結合している
式Ｉの化合物、並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩である。

【００８２】

言及するに一層値する本発明の局面Ｂに係る化合物は、
Ｒ１がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、Ｒ11により置換されたエチル、Ｒ11により置換されたプロピル、又はＲ11により置換されたブチルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112、フッ素、塩素又は臭素であり、ここで
Ｒ111が水素であり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111がエチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
Ｒ112がエチル、イソプロピル又はシクロプロピルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成する
のいずれかであり、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロ

リジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、ホモピペリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ホモピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、トリアゾール－１－イル、又はテトラゾール－１－イルであり、
Ｒ113が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、アセチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、
ここで前記Hetは場合によりフッ素及びメチルから独立に選択された１個又は２個の置換基により置換されることがあり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
特に
Ｒ４がメチル、エチル、イソプロピル又はシクロプロピルであり、
より特定的には
Ｒ４がメチル又はエチルであり、
更に特定的には
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
特に
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
より特定的には
Ｒ５が塩素、臭素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
式Ｉの化合物、並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩である。

【００８３】

言及するに特に値する本発明の局面Ｂに係る化合物は、
Ｒ１がメチル、２－（Ｒ11）－エチル、又は３－（Ｒ11）－プロピルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111が水素であり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111がエチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－ト

リフルオロエチルであり、そして
Ｒ112がエチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成する
のいずれかであり、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、又は４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イルであり、
Ｒ113は水素、メチル、エチル、イソプロピル、アセチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、
ここで前記Hetは場合によりフッ素及びメチルから独立に選択された１個又は２個の置換基により置換されることがあり、又は
Hetはピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチル、エチル、イソプロピル又はシクロプロピルであり、
特に
Ｒ４がメチル又はエチルであり、
より特定的には
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
特に
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
更に特に
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
式Ｉ*の化合物、並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩である。

【００８４】

言及するに更に一層値する本発明の局面Ｂに係る化合物は、
Ｒ１が２－（Ｒ11）－エチル、又は３－（Ｒ11）－プロピルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111が水素であり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル又はシクロプロピルメチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチル、エチル、イソプロピル又はシクロプロピルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111がエチル、イソプロピル又はシクロプロピルであり、そして
Ｒ112がエチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成す

る
のいずれかであり、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、４－メチルピペリジン－１－イル、４－フルオロピペリジン－１－イル、４，４－ジフルオロピペリジン－１－イル、（Ｓ）－３－フルオロピロリジン－１－イル、（Ｒ）－３－フルオロピロリジン－１－イル、３，３－ジフルオロピロリジン－１－イル、３－フルオロアゼチジン－１－イル、又は３，３－ジフルオロアゼチジン－１－イルであり、
Ｒ113が水素、メチル又はアセチルであり、
又は
Hetはピラゾール－１－イル又はイミダゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチル、エチル、イソプロピル又はシクロプロピルであり、
特に
Ｒ４がメチル又はエチルであり、
より特定的には
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
特に
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
より特には
Ｒ５が塩素、臭素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり、
更により特定的には
Ｒ５が塩素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
式Ｉ*の化合物、並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩である。

【００８５】
本発明の局面Ｂの一態様（態様Ｂ１）において、強調すべき本発明の局面Ｂに係る化合物は、
Ｒ１がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、Ｒ11により置換されたエチル、Ｒ11により置換されたプロピル、又はＲ11により置換されたブチルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112、又はハロゲンであり、ここで
Ｒ111が水素であり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして

R112がメチルであるか、
又は
R111がエチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
R112がエチル、イソプロピル又はシクロプロピルであるか、
又は
R111とR112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成する
のいずれかであり、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、ホモピペリジン－１－イル、４Ｎ－（R113）－ピペラジン－１－イル、４Ｎ－（R113）－ホモピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、トリアゾール－１－イル、又はテトラゾール－１－イルであり、
R113が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、Ｃ1～Ｃ2アルキルカルボニル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、
ここで前記Hetは場合により、フッ素及びメチルから独立に選択された１個又は２個の置換基により置換されることがあり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５がメチル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
特に
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、シクロプロピルメトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
更に特に
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
より特定的には
Ｒ５が塩素、臭素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は特に６位に結合している
式Ｉの化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【００８６】

言及するに値する本発明の局面Ｂの態様Ｂ１に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、２－（R11）－エチル、又は３－（R11）－プロピルであり、ここで
R11は－Ｎ（R111）R112、フッ素、塩素又は臭素であり、ここで
R111が水素であり、そして
R112が水素であるか、
又は
R111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
R112が水素であるか、

又は
R111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
R112がメチルであるか、
又は
R111がエチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－ヒドロキシエチル、２－メトキシエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
R112がエチルであるか、
又は
R111とR112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成する
のいずれかであり、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、ホモピペリジン－１－イル、４Ｎ－（R113）－ピペラジン－１－イル、又は４Ｎ－（R113）－ホモピペラジン－１－イルであり、
R113が水素、メチル、エチル、イソプロピル、アセチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、
ここで前記Hetは場合により、フッ素及びメチルから独立に選択された１個又は２個の置換基により置換されることがあり、
又は
Hetはピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
特に
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
更に特に
Ｒ５が塩素、臭素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【００８７】

言及するに特に値する本発明の局面Ｂの態様Ｂ１に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、２－（R11）－エチル、又は３－（R11）－プロピルであり、ここで
R11は－Ｎ（R111）R112であり、ここで
R111が水素であり、そして
R112が水素であるか、
又は
R111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
R112が水素であるか、

又は
R111がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロプロピルメチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
R112がメチルであるか、
又は
R111がエチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、そして
R112がエチルであるか、
又は
R111とR112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成する
のいずれかであり、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、４Ｎ－（R113）－ピペラジン－１－イル、４－メチルピペリジン－１－イル、４－フルオロピペリジン－１－イル、４，４－ジフルオロピペリジン－１－イル、（Ｓ）－３－フルオロピロリジン－１－イル、（Ｒ）－３－フルオロピロリジン－１－イル、３，３－ジフルオロピロリジン－１－イル、３－フルオロアゼチジン－１－イル、又は３，３－ジフルオロアゼチジン－１－イルであり、
R113が水素、メチル、エチル、イソプロピル、アセチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、又は２，２，２－トリフルオロエチルであり、
又は
Hetはピラゾール－１－イル又はイミダゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合しており；
より特定の各態様では、Ｒ５が塩素であり、
別のより特定の各態様では、Ｒ５がメトキシであり、
別のより特定の各態様では、Ｒ５がエトキシであり、
別のより特定の各態様では、Ｒ５がジフルオロメトキシである；
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。
【００８８】
言及するに特に値する本発明の局面Ｂの態様Ｂ１に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、２－（R11）－エチル、又は３－（R11）－プロピルであり、ここで
R11は－Ｎ（R111）R112であり、ここで
R111が水素であり、そして
R112が水素であるか、
又は
R111がメチルであり、そして
R112が水素であるか、
又は
R111がエチルであり、そして
R112が水素であるか、
又は
R111がイソプロピルであり、そして
R112が水素であるか、

又は
Ｒ111がイソブチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がシクロプロピルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がシクロブチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がシクロプロピルメチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111がエチルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111がイソプロピルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111がエチルであり、そして
Ｒ112がエチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成する
のいずれかであり、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、４－アセチルピペラジン－１－イル、４－メチルピペリジン－１－イル、４－フルオロピペリジン－１－イル、４，４－ジフルオロピペリジン－１－イル、（Ｓ）－３－フルオロピロリジン－１－イル、（Ｒ）－３－フルオロピロリジン－１－イル、３，３－ジフルオロピロリジン－１－イル、３－フルオロアゼチジン－１－イル、又は３，３－ジフルオロアゼチジン－１－イル、又はイミダゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
特に、Ｒ５が塩素、臭素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合しており；
より特定の各態様では、Ｒ５が塩素であり、
別のより特定の各態様では、Ｒ５がメトキシであり、
別のより特定の各態様では、Ｒ５がエトキシであり、
別のより特定の各態様では、Ｒ５がジフルオロメトキシである；
式Ｉ*の化合物及びこれらの化合物の塩である。

【００８９】

言及するに更に特に値する本発明の局面Ｂの態様Ｂ１に係る化合物は、

Ｒ１が２－（Ｒ11）－エチルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111が水素であり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がエチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がイソプロピルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がイソブチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がシクロプロピルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がシクロブチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がシクロプロピルメチルであり、そして
Ｒ112が水素であるか、
又は
Ｒ111がメチルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111がエチルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111がイソプロピルであり、そして
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ２とＲ３が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成するのいずれかであり、ここで
HetBはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、アゼチジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、４－アセチルピペラジン－１－イル、又は３，３－ジフルオロピロリジン－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、フッ素、エトキシ、メトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
特に
Ｒ５が塩素、臭素、エトキシ、メトキシ又はジフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素であり
ここでＲ５は骨格の６位に結合しており；
より特定の各態様では、Ｒ５が塩素であり、

別のより特定の各態様では、Ｒ５がメトキシであり、
別のより特定の各態様では、Ｒ５がエトキシであり、
別のより特定の各態様では、Ｒ５がジフルオロメトキシである；
式Ｉ*の化合物及びこれらの化合物の塩である。
【００９０】
言及するに値する本発明の局面Ｃに係る化合物は、
Ｒ１がＣ1～Ｃ4アルキル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、又はR11により置換されたＣ2～Ｃ4アルキルであり、ここで
R11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
Ｒ112が水素、Ｃ1～Ｃ4アルキル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、Ｓ－オキソチオモルホリン－４－イル、Ｓ，Ｓ－ジオキソチオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ113がＣ1～Ｃ4アルキル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がＣ1～Ｃ4アルキル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
Ｒ５がＣ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシル、フェニル－Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ－Ｃ2～Ｃ4アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ2～Ｃ4アルコキシ、Ｃ3～Ｃ5シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ4アルコキシであり、
Ｒ６が水素である
式Ｉの化合物、並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩である。
【００９１】
言及するに一層値する本発明の局面Ｃに係る化合物は、
Ｒ１がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、又はR11により置換されたＣ2～Ｃ4アルキルであり、ここで
R11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
Ｒ112が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ113がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
Ｒ５がＣ1～Ｃ4アルキル、ハロゲン、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ、トリフルオロメチル、フェニ

ル－Ｃ1～Ｃ2アルコキシ、Ｃ1～Ｃ4アルコキシ－Ｃ2～Ｃ3アルコキシ、Ｃ3～Ｃ5シクロアルコキシ、Ｃ3～Ｃ5シクロアルキル－Ｃ1～Ｃ2アルコキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ4アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は６位に結合している
式Ｉの化合物、並びにそれらの化合物の塩、立体異性体及び該立体異性体の塩である。
【００９２】
言及するに特に値する本発明の局面Ｃに係る化合物は、
Ｒ１がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、又はR11により置換されたＣ2～Ｃ4アルキルであり、ここで
R11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
R111が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
R112が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであるか、
又は
R111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
R113がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
Ｒ５がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。
【００９３】
言及するに特に値する本発明の局面Ｃに係る化合物は、
Ｒ１がメチル、エチル、R11により置換されたエチル、R11により置換されたプロピル、又はR11により置換されたブチルであり、ここで
R11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
R111が水素、メチル又はエチルであり、
R112が水素、メチル又はエチルであるか、
又は
R111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
R113がメチルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、

Ｒ４がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
Ｒ５がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は特に６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【００９４】

言及するに更に一層値する本発明の態様Ｃに係る化合物は、
Ｒ１がメチル、２－（Ｒ11）－エチル、又は３－（Ｒ11）－プロピルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111がメチルであり、
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル又はシクロプロピルであり、
Ｒ５がメチル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリトリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルメトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオトメトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【００９５】

本発明の局面Ｃの一態様（態様Ｃ１）において、強調されるべき本発明の局面Ｃに係る化合物は、
Ｒ１がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、又はＲ11により置換されたＣ2～Ｃ4アルキルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
Ｒ112がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ113がメチルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、

Ｒ５がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【００９６】

言及するに値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ１に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、エチル、又はR11により置換されたＣ2～Ｃ4アルキルであり、ここで
R11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
R111が水素又はメチルであり、
R112が水素又はメチルであるか、
又は
R111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は特に６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【００９７】

言及するに一層値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ１に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、R11により置換されたエチル、R11により置換されたプロピル、又はR11により置換されたブチルであり、ここで
R11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
R111が水素又はメチルであり、
R112が水素又はメチルであるか、
又は
R111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５がメチル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルメトキシ、シクロプロピルオキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されたＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は特に６位に結合している

式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。
【００９８】
言及するに特に値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ１に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、２－（Ｒ11）－エチル、又は３－（Ｒ11）－プロピルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111がメチルであり、
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５がメチル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルメトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。
【００９９】
言及するに更に特に値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ１に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、２－（Ｒ11）－エチル、又は３－（Ｒ11）－プロピルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111がメチルであり、
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、又はイミダゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がメチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、メトキシ、エトキシ又は２－メトキシエトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。
【０１００】
本発明の局面Ｃの別の態様（態様Ｃ２）において、強調すべき本発明の局面Ｂに係る化合物は、
Ｒ１がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、又はＲ11により置換されたＣ2～Ｃ4アルキルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
Ｒ112が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであるか、

又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ113がメチルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がエチルであり、
Ｒ５がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【０１０１】

言及するに一層値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ２に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、エチル、又はＲ11により置換されたエチルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111が水素又はメチルであり、
Ｒ112が水素又はメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、ピロール１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がエチルであり、
Ｒ５がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は特に６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【０１０２】

言及するに一層値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ２に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、Ｒ11により置換されたエチル、Ｒ11により置換されたプロピル、又はＲ11により置換されたブチルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111が水素又はメチルであり、
Ｒ112が水素又はメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチ

ルピペラジン－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がエチルであり、
Ｒ５がメチル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルメトキシ、シクロプロピルオキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は特に６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【０１０３】

言及するに特に値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ２に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、２－（Ｒ11）－エチル、又は２－（Ｒ11）－プロピルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111がメチルであり、
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がエチルであり、
Ｒ５がメチル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルメトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【０１０４】

言及するに一層特に値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ２に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、２－（Ｒ11）－エチル、又は３－（Ｒ11）－プロピルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111がメチルであり、
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、又はイミダゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がエチルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、又は２－メトキシエトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【０１０５】
本発明の局面Ｃの更に別の態様（態様Ｃ３）において、強調すべき本発明の態様Ｂに係る化合物は、
Ｒ１がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、又はR11により置換されたＣ2～Ｃ4アルキルであり、ここで
R11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
R111が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
R112が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであるか、
又は
R111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
R113がメチルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がイソプロピルであり、
Ｒ５がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。
【０１０６】
言及するに値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ３に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、エチル、又はR11により置換されたＣ2～Ｃ4アルキルであり、ここで
R11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
R111が水素又はメチルであり、
R112が水素又はメチルであるか、
又は
R111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がイソプロピルであり、
Ｒ５がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は特に６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。
【０１０７】

言及するに一層値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ３に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、Ｒ11により置換されたエチル、Ｒ11により置換されたプロピル、又はＲ11により置換されたブチルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111が水素又はメチルであり、
Ｒ112が水素又はメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がイソプロピルであり、
Ｒ５がメチル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルメトキシ、シクロプロピルオキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は特に６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【０１０８】

言及するに特に値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ３に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、２－（Ｒ11）－エチル、又は３－（Ｒ11）－プロピルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111がメチルであり、
Ｒ112がメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がイソプロピルであり、
Ｒ５がメチル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルメトキシ、ジフルオロメトキシ、又はトリフルオロメトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【０１０９】

言及するに一層特に値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ３に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、２－（Ｒ11）－エチル、又は３－（Ｒ11）－プロピルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111がメチルであり、
Ｒ112がメチルであるか、
又は

Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、又はイミダゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がイソプロピルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、メトキシ、エトキシ又は２－メトキシエトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【０１１０】

本発明の局面Ｃの更に別の一態様（態様Ｃ４）において、強調すべき本発明の局面Ｂに係る化合物は、
Ｒ１がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、又はＲ11により置換されたＣ2～Ｃ4アルキルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであり、
Ｒ112が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル又はシクロプロピルメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４Ｎ－（Ｒ113）－ピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がシクロプロピルであり、
Ｒ５がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【０１１１】

言及するに値する本発明の局面Ｃの態様（態様Ｃ４）に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、エチル、又はＲ11により置換されたＣ2～Ｃ4アルキルであり、ここで
Ｒ11は－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112であり、ここで
Ｒ111が水素又はメチルであり、
Ｒ112が水素又はメチルであるか、
又は
Ｒ111とＲ112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、ピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、

Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がシクロプロピルであり、
Ｒ５がメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメトキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は特に６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【０１１２】

言及するに一層値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ４に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、R11により置換されたエチル、R11により置換されたプロピル、又はR11により置換されたブチルであり、ここで
R11は－Ｎ（R111）R112であり、ここで
R111が水素又はメチルであり、
R112が水素又はメチルであるか、
又は
R111とR112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル、又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がシクロプロピルであり、
Ｒ５がメチル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルメトキシ、シクロプロピルオキシ、又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換されているＣ1～Ｃ2アルコキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の５位、７位又は特に６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。

【０１１３】

言及するに特に値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ４に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、２－（R11）－エチル、又は３－（R11）－プロピルであり、ここで
R11は－Ｎ（R111）R112であり、ここで
R111がメチルであり、
R112がメチルであるか、
又は
R111とR112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはピペリジン－１－イル、モルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル、ピラゾール－１－イル、イミダゾール－１－イル又はトリアゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がシクロプロピルであり、
Ｒ５がメチル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルメトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、

Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。
【０１１４】
言及するに一層特に値する本発明の局面Ｃの態様Ｃ４に係る化合物は、
Ｒ１がメチル、２－（R11）－エチル、又は３－（R11）－プロピルであり、ここで
R11は－Ｎ（R111）R112であり、ここで
R111がメチルであり、
R112がメチルであるか、
又は
R111とR112が一緒になってそしてそれらが結合する窒素原子を含んで、環Hetを形成し、ここで
Hetはモルホリン－４－イル、ピロリジン－１－イル、４－メチルピペラジン－１－イル又はイミダゾール－１－イルであり、
Ｒ２が水素であり、
Ｒ３が水素であり、
Ｒ４がシクロプロピルであり、
Ｒ５が塩素、臭素、メトキシ、エトキシ又は２－メトキシエトキシであり、
Ｒ６が水素であり、
ここでＲ５は骨格の６位に結合している
式Ｉ*の化合物、及びそれらの化合物の塩である。
【０１１５】
本発明に係る化合物の中の特別な着目とは、本発明の範囲内で、下記の特定態様のうちの１つ、又は可能ならば、複数の組合せにより、包含される式Ｉの化合物のことを言う：
本発明に係る式Ｉの化合物の特定の態様（態様１）は、
Ｒ１がメチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の特定の態様（態様２）は、
Ｒ１がエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の特定の態様（態様３）は、
Ｒ１が２－（R11）－エチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の特定の態様（態様４）は、
Ｒ１が３－（R11）－プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の特定の態様（態様５）は、
Ｒ１が４－（R11）－ブチルである式Ｉの化合物を指す。
【０１１６】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様６）は、
Ｒ１が２－ジメチルアミノエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様７）は、
Ｒ１が２－（Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ）エチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様８）は、
Ｒ１が２－（Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ）エチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様９）は、
Ｒ１が２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルアミノ〕エチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様10）は、
Ｒ１が２－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－メチルアミノ〕エチルである式Ｉの化合物を指す。
【０１１７】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様11）は、
Ｒ１が２－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）エチルである式Ｉの化合物を指す。

本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様12）は、
Ｒ１が２－（Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ）エチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様13）は、
Ｒ１が２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様14）は、
Ｒ１が２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕エチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様15）は、
Ｒ１が２－ジエチルアミノエチルである式Ｉの化合物を指す。

【０１１８】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様16）は、
Ｒ１が２－メチルアミノエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様17）は、
Ｒ１が２－エチルアミノエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様18）は、
Ｒ１が２－イソプロピルアミノエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様19）は、
Ｒ１が２－イソブチルアミノエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様20）は、
Ｒ１が２－シクロプロピルアミノエチルである式Ｉの化合物を指す。

【０１１９】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様21）は、
Ｒ１が２－シクロブチルアミノエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様22）は、
Ｒ１が２－（シクロプロピルメチル）アミノエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様23）は、
Ｒ１が２－モルホリン－４－イルエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様24）は、
Ｒ１が２－ピロリジン－１－イルエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様25）は、
Ｒ１が２－アゼチジン－１－イルエチルである式Ｉの化合物を指す。

【０１２０】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様26）は、
Ｒ１が２－ピペリジン－１－イルエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様27）は、
Ｒ１が２－（４－メチルピペリジン－１－イル）エチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様28）は、
Ｒ１が２－ホモピペリジン－１－イルエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様29）は、
Ｒ１が２－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）エチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様30）は、
Ｒ１が２－（１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－１－イル）エチルである式Ｉの化合物を指す。

【０１２１】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様31）は、
Ｒ１が２－イミダゾール－１－イルエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様32）は、
Ｒ１が２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様33）は、

Ｒ１が２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様34）は、
Ｒ１が２－アミノエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様35）は、
Ｒ１が２－〔（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチルである式Ｉの化合物を指す。
【０１２２】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様36）は、
Ｒ１が２－〔（２－メトキシエチル）アミノ〕エチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様37）は、
Ｒ１が２－tertブチルアミノエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様38）は、
Ｒ１が２－アリルアミノエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様39）は、
Ｒ１が２－プロパルギルアミノエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様40）は、
Ｒ１が２－〔（１－メチルプロパルギル）アミノ〕エチルである式Ｉの化合物を指す。
【０１２３】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様41）は、
Ｒ１が２－〔（２，２－ジフルオロエチル）アミノ〕エチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様42）は、
Ｒ１が３－ジメチルアミノプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様43）は、
Ｒ１が３－エチルアミノプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様44）は、
Ｒ１が３－イミダゾール－１－イルプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様45）は、
Ｒ１が３－（Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ）プロピルである式Ｉの化合物を指す。
【０１２４】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様46）は、
Ｒ１が３－（Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ）プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様47）は、
Ｒ１が３－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルアミノ〕エチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様48）は、
Ｒ１が３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）－Ｎ－メチルアミノ〕プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様49）は、
Ｒ１が３－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様50）は、
Ｒ１が３－（Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ）プロピルである式Ｉの化合物を指す。
【０１２５】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様51）は、
Ｒ１が３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様52）は、
Ｒ１が３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様53）は、

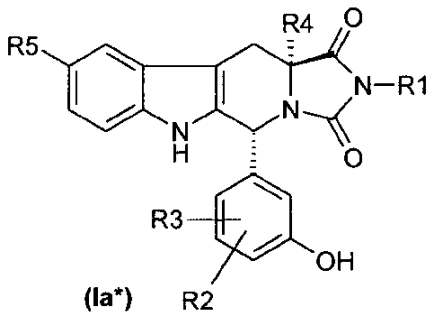
Ｒ１が３－ジエチルアミノプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様54）は、
Ｒ１が３－メチルアミノプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様55）は、
Ｒ１が３－イソプロピルアミノプロピルである式Ｉの化合物を指す。
【０１２６】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様56）は、
Ｒ１が３－イソブチルアミノプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様57）は、
Ｒ１が３－シクロプロピルアミノプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様58）は、
Ｒ１が３－シクロブチルアミノプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様59）は、
Ｒ１が３－（シクロプロピルメチル）アミノプロピルである式Ｉの化合物を指す。
【０１２７】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様60）は、
Ｒ１が３－モルホリン－４－イルプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様61）は、
Ｒ１が３－ピロリジン－１－イルプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様62）は、
Ｒ１が３－アゼチジン－１－イルプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様63）は、
Ｒ１が３－ピペリジン－１－イルプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様64）は、
Ｒ１が３－（４－メチルピペリジン－１－イル）プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様65）は、
Ｒ１が３－ホモピペリジン－１－イルプロピルである式Ｉの化合物を指す。
【０１２８】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様66）は、
Ｒ１が３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様67）は、
Ｒ１が３－（１，２，３，６－テトラヒドロピリジン－１－イル）プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様68）は、
Ｒ１が３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様69）は、
Ｒ１が３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様70）は、
Ｒ１が３－アミノプロピルである式Ｉの化合物を指す。
【０１２９】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様71）は、
Ｒ１が３－〔（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様72）は、
Ｒ１が３－〔（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様73）は、
Ｒ１が３－tertブチルアミノプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様74）は、
Ｒ１が３－アリルアミノプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様75）は、

Ｒ１が３－プロパルギルアミノプロピルである式Ｉの化合物を指す。
【０１３０】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様76）は、
Ｒ１が３－〔（１－メチルプロパルギル）アミノ〕プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様77）は、
Ｒ１が３－〔（２，２－ジフルオロエチル）アミノ〕プロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様78）は、
Ｒ１が４－ジメチルアミノブチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様79）は、
Ｒ２が水素である式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様80）は、
Ｒ３が水素である式Ｉの化合物を指す。
【０１３１】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様81）は、
Ｒ２とＲ３が共に水素である式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様82）は、
Ｒ４がメチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様83）は、
Ｒ４がエチルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様84）は、
Ｒ４がイソプロピルである式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様85）は、
Ｒ４がシクロプロピルである式Ｉの化合物を指す。
【０１３２】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様86）は、
Ｒ５とＲ６のどちらも骨格の８位に結合していない式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様87）は、
Ｒ６が水素である式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様88）は、
Ｒ５が骨格の５位、６位又は７位に結合しており、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様89）は、
Ｒ５が骨格の６位に結合しており、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様90）は、
Ｒ６がフッ素である式Ｉの化合物を指す。
【０１３３】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様91）は、
Ｒ５が骨格の６位に結合しており、そして
Ｒ６が骨格の５位又は特に７位に結合しており且つフッ素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様92）は、
Ｒ５が臭素であり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様93）は、
Ｒ５がフッ素であり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様94）は、
Ｒ５がメチルであり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。

本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様95）は、
Ｒ５がメトキシであり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
【０１３４】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様96）は、
Ｒ５がエトキシであり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様97）は、
Ｒ５が塩素であり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様98）は、
Ｒ５がシクロプロピルメトキシであり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様99）は、
Ｒ５が２－メトキシエトキシであり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様100）は、
Ｒ５がトリフルオロメチルであり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
【０１３５】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様101）は、
Ｒ５がトリフルオロメトキシであり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様102）は、
Ｒ５がジフルオロメトキシであり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様103）は、
Ｒ５がシクロプロピルオキシであり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様104）は、
Ｒ５が骨格の６位に結合しておりそしてメチル、トリフルオロメチル、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、２－メトキシエトキシ、シクロプロピルメトキシ、トリフルオロメトキシ又はジフルオロメトキシであり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様105）は、
Ｒ５が骨格の６位に結合しておりそしてフッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシであり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
【０１３６】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様106）は、
Ｒ５が骨格の６位に結合しておりそして塩素、臭素、メトキシ又はエトキシであり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様107）は、
Ｒ５が骨格の６位に結合しておりそして塩素、臭素、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、そして
Ｒ６が水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様108）は、
Ｒ５が骨格の６位に結合しておりそして塩素、臭素、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、そして

Ｒ６が骨格の５位に結合しておりそしてフッ素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様109）は、
Ｒ５が骨格の６位に結合しておりそして塩素、臭素、メトキシ、エトキシ又はジフルオロメトキシであり、そして
Ｒ６が骨格の７位に結合しておりそしてフッ素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様110）は、
Ｒ５が骨格の６位に結合しておりそしてメトキシであり、そして
Ｒ６が骨格の５位に結合しておりそしてフッ素である、式Ｉの化合物を指す。
【０１３７】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様111）は、
Ｒ５が骨格の６位に結合しておりそしてメトキシであり、そして
Ｒ６が骨格の７位に結合しておりそしてフッ素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様112）は、
Ｒ５が骨格の６位に結合しておりそして塩素であり、そして
Ｒ６が骨格の７位に結合しておりそして水素である、式Ｉの化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様113）は、
上記に示すような式Ｉ*からのものである化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様114）は、
ＲＲ２とＲ３が共に水素である、下記に示すような式Ｉａ*からのものである化合物を指す。
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様115）は、
ＲＲ２とＲ３が共に水素であり、そしてＲ１とＲ５が下記に与える第１表に示される意味1.1～1.891のいずれかを有する、上記に示すような式Ｉ*からのものである化合物を指す。
【０１３８】
本発明に係る式Ｉの化合物の別の特定の態様（態様116）は、
ＲＲ２とＲ３が共に水素であり、そしてＲ１とＲ５が下記に与える第１表に示される意味1.1～1.891のいずれかを有する、上記に示すような式Ｉａ*からのものである化合物を指す。
【０１３９】
上述した特定の態様３～５のうち、態様３と４が強調され、そして態様３が特に強調されるべきである。
上述した特定の態様79～81のうち、態様81が強調されるべきである。
上述した特定の態様82～85のうち、態様82と83が強調され、そして態様82が特に強調されるべきである。
上述した特定の態様86～89のうち、態様89が強調されるべきである。
【０１４０】
上述した特定の態様90～91のうち、態様91が強調される。
上述した特定の態様92～103のうち、態様92，93，95，96，97，101及び102が強調され、態様92，95，96，97及び102が特に強調される。
上述した態様104～107のうち、態様105～107が強調されるべきである。
上述した態様110～112のうち、態様111と112が強調される。
【０１４１】
本発明は、上記に与えた特定の態様のいずれかの又は全ての組合せと部分集合を包含すると解釈すべきである。
【０１４２】
本発明に係る例示的化合物として、次の式Ｉａ*の化合物：

【化６】



（式中、Ｒ２とＲ３は共に水素であり、そして
Ｒ４はメチルである）
及びそれらの塩を、下記に与える第１表中のＲ１とＲ５についての置換基の意味によって言及することができる。

【０１４３】

本発明に係る更なる例示的化合物として、Ｒ２とＲ３が共に水素であり、そしてＲ４がエチルである式Ｉａ*の化合物を、下記に与える第１表中のＲ１とＲ５についての置換基の意味によって言及することができる。

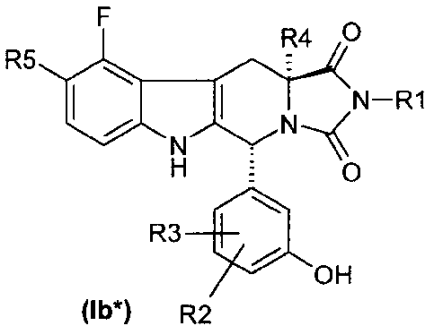
本発明に係る更なる例示的化合物として、Ｒ２とＲ３が共に水素であり、そしてＲ４がイソプロピルである式Ｉａ*の化合物を、下記に与える第１表中のＲ１とＲ５についての置換基の意味によって言及することができる。

本発明に係る更なる例示的化合物として、Ｒ２とＲ３が共に水素であり、そしてＲ４がシクロプロピルである式Ｉａ*の化合物を、下記に与える第１表中のＲ１とＲ５についての置換基の意味によって言及することができる。

【０１４４】

本発明に係る別の例示的化合物として、次の式Ｉｂ*の化合物：

【化７】

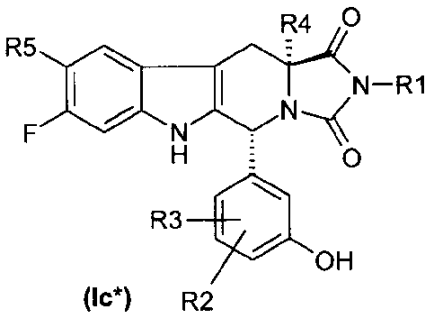


（式中、Ｒ２とＲ３は共に水素であり、そして
Ｒ４はメチルである）
及びそれらの塩を、下記に与える第１表中のＲ１とＲ５についての置換基の意味によって言及することができる。

【０１４５】

本発明に係る別の例示的化合物として、次の式Ｉｃ*の化合物：

【化８】



（式中、Ｒ２とＲ３は共に水素であり、そして
Ｒ４はメチルである）
及びそれらの塩を、下記に与える第１表中のＲ１とＲ５についての置換基の意味によって言及することができる。

【０１４６】

上記式Ｉａ*、Ｉｂ*及びＩｃ*の化合物の中で、各々のＲ４がメチルである当該式Ｉａ*、Ｉｂ*及びＩｃ*の化合物が強調される。

上記式Ｉａ*、Ｉｂ*及びＩｃ*の化合物の中で、各々のＲ４がメチルである該式Ｉａ*及びＩｃ*の化合物が特に強調される。

上記式Ｉａ*、Ｉｂ*及びＩｃ*の化合物の中で、各々のＲ４がメチルである当該式Ｉａ*の化合物が一層特に強調される。

【０１４７】

【表１】

第１表：

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.1	メチル	$-CH_3$
1.2	メチル	-Br
1.3	メチル	-F
1.4	メチル	$-OCH_3$
1.5	メチル	$-OCH_2CH_3$
1.6	メチル	-Cl
1.7	メチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.8	メチル	シクロプロピルメトキシ
1.9	メチル	$-CF_3$
1.10	メチル	ジフルオロメトキシ
1.11	メチル	トリフルオロメトキシ
1.12	２－(ジメチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.13	２－(ジメチルアミノ)エチル	-Br
1.14	２－(ジメチルアミノ)エチル	-F
1.15	２－(ジメチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.16	２－(ジメチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$

【０１４８】

【表２】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.17	２－(ジメチルアミノ)エチル	-Cl
1.18	２－(ジメチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.19	２－(ジメチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.20	２－(ジメチルアミノ)エチル	$-CF_3$
1.21	２－(ジメチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.22	２－(ジメチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.23	２－(ジメチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.24	２－(ジメチルアミノ)プロピル	-Br
1.25	２－(ジメチルアミノ)プロピル	-F
1.26	２－(ジメチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.27	２－(ジメチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.28	２－(ジメチルアミノ)プロピル	-Cl
1.29	２－(ジメチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.30	２－(ジメチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.31	２－(ジメチルアミノ)プロピル	$-CF_3$
1.32	２－(ジメチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.33	２－(ジメチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.34	２－(モルホリン－４－イル)エチル	$-CH_3$
1.35	２－(モルホリン－４－イル)エチル	-Br
1.36	２－(モルホリン－４－イル)エチル	-F
1.37	２－(モルホリン－４－イル)エチル	$-OCH_3$
1.38	２－(モルホリン－４－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.39	２－(モルホリン－４－イル)エチル	-Cl
1.40	２－(モルホリン－４－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.41	２－(モルホリン－４－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.42	２－(モルホリン－４－イル)エチル	$-CF_3$
1.43	２－(モルホリン－４－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.44	２－(モルホリン－４－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.45	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.46	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	-Br
1.47	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	-F
1.48	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.49	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.50	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	-Cl
1.51	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.52	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.53	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	$-CF_3$

【０１４９】

【表３】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.54	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.55	２－(ピロリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.56	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.57	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	-Br
1.58	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	-F
1.59	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.60	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.61	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	-Cl
1.62	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.63	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.64	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	$-CF_3$
1.65	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.66	２－(イミダゾール－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.67	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.68	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	-Br
1.69	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	-F
1.70	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.71	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.72	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	-Cl
1.73	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.74	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.75	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	$-CF_3$
1.76	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.77	２－(４－メチルピペラジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.78	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	$-CH_3$
1.79	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	-Br
1.80	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	-F
1.81	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.82	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.83	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	-Cl
1.84	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.85	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.86	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	$-CF_3$
1.87	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.88	３－(モルホリン－４－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.89	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.90	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	-Br

【０１５０】

【表４】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.91	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	-F
1.92	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.93	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.94	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	-Cl
1.95	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.96	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.97	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	$-CF_3$
1.98	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.99	３－(ピロリジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.100	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.101	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	-Br
1.102	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	-F
1.103	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.104	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.105	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	-Cl
1.106	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.107	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.108	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	$-CF_3$
1.109	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.110	３－(イミダゾール－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.111	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.112	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	-Br
1.113	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	-F
1.114	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.115	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.116	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	-Cl
1.117	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.118	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.119	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-CF_3$
1.120	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.121	３－(４－メチルピペラジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.122	３－アミノプロピル	$-CH_3$
1.123	３－アミノプロピル	-Br
1.124	３－アミノプロピル	-F
1.125	３－アミノプロピル	$-OCH_3$
1.126	３－アミノプロピル	$-OCH_2CH_3$
1.127	３－アミノプロピル	-Cl

【０１５１】

【表５】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.128	２－アミノプロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.129	２－アミノプロピル	シクロプロピルメトキシ
1.130	２－アミノプロピル	トリフルオロメチル
1.131	２－アミノプロピル	ジフルオロメトキシ
1.132	２－アミノプロピル	トリフルオロメトキシ
1.133	２－アミノエチル	$-CH_3$
1.134	２－アミノエチル	-Br
1.135	２－アミノエチル	-F
1.136	２－アミノエチル	$-OCH_3$
1.137	２－アミノエチル	$-OCH_2CH_3$
1.138	２－アミノエチル	-Cl
1.139	２－アミノエチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.140	２－アミノエチル	シクロプロピルメトキシ
1.141	２－アミノエチル	トリフルオロメチル
1.142	２－アミノエチル	ジフルオロメトキシ
1.143	２－アミノエチル	トリフルオロメトキシ
1.144	２－(メチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.145	２－(メチルアミノ)エチル	-Br
1.146	２－(メチルアミノ)エチル	-F
1.147	２－(メチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.148	２－(メチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.149	２－(メチルアミノ)エチル	-Cl
1.150	２－(メチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.151	２－(メチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.152	２－(メチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.153	２－(メチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.154	２－(メチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.155	２－(エチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.156	２－(エチルアミノ)エチル	-Br
1.157	２－(エチルアミノ)エチル	-F
1.158	２－(エチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.159	２－(エチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.160	２－(エチルアミノ)エチル	-Cl
1.161	２－(エチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.162	２－(エチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.163	２－(エチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.164	２－(エチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ

【０１５２】

【表６】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.165	２－(エチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.166	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.167	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	-Br
1.168	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	-F
1.169	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.170	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.171	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	-Cl
1.172	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.173	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.174	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	トリフルオロメチル
1.175	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.176	２－(アゼチジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.177	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.178	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	-Br
1.179	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	-F
1.180	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.181	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.182	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	-Cl
1.183	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.184	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.185	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	トリフルオロメチル
1.186	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.187	２－(４－アセチルピペラジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.188	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.189	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	-Br
1.190	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	-F
1.191	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.192	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.193	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	-Cl
1.194	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.195	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.196	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメチル
1.197	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.198	２－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.199	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.200	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	-Br
1.201	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	-F

【０１５３】

【表７】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.202	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.203	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.204	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	-Cl
1.205	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.206	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.207	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.208	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.209	２－(２－フルオロエチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.210	２－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.211	２－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)エチル	-Br
1.212	２－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)エチル	-F
1.213	２－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.214	２－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.215	２－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)エチル	-Cl
1.216	２－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.217	２－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.218	２－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.219	２－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.220	２－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.221	２－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.222	２－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	-Br
1.223	２－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	-F
1.224	２－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.225	２－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.226	２－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	-Cl
1.227	２－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.228	２－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.229	２－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.230	２－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.231	２－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.232	２－(イソプロピルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.233	２－(イソプロピルアミノ)エチル	-Br
1.234	２－(イソプロピルアミノ)エチル	-F
1.235	２－(イソプロピルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.236	２－(イソプロピルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.237	２－(イソプロピルアミノ)エチル	-Cl
1.238	２－(イソプロピルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$

【０１５４】

【表８】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.239	２－(イソプロピルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.240	２－(イソプロピルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.241	２－(イソプロピルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.242	２－(イソプロピルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.243	２－(イソブチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.244	２－(イソブチルアミノ)エチル	-Br
1.245	２－(イソブチルアミノ)エチル	-F
1.246	２－(イソブチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.247	２－(イソブチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.248	２－(イソブチルアミノ)エチル	-Cl
1.249	２－(イソブチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.250	２－(イソブチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.251	２－(イソブチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.252	２－(イソブチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.253	２－(イソブチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.254	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.255	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	-Br
1.256	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	-F
1.257	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.258	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.259	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	-Cl
1.260	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.261	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.262	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.263	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.264	２－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.265	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.266	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	-Br
1.267	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	-F
1.268	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.269	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.270	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	-Cl
1.271	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.272	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.273	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.274	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.275	２－(シクロプロピルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ

【０１５５】

【表９】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.276	２－(シクロブチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.277	２－(シクロブチルアミノ)エチル	-Br
1.278	２－(シクロブチルアミノ)エチル	-F
1.279	２－(シクロブチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.280	２－(シクロブチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.281	２－(シクロブチルアミノ)エチル	-Cl
1.282	２－(シクロブチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.283	２－(シクロブチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.284	２－(シクロブチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.285	２－(シクロブチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.286	２－(シクロブチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.287	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.288	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-Br
1.289	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-F
1.290	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.291	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.292	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-Cl
1.293	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.294	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.295	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.296	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.297	２－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.298	２－(ジエチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.299	２－(ジエチルアミノ)エチル	-Br
1.300	２－(ジエチルアミノ)エチル	-F
1.301	２－(ジエチルアミノ)エチル	$-OCH_3$
1.302	２－(ジエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.303	２－(ジエチルアミノ)エチル	-Cl
1.304	２－(ジエチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.305	２－(ジエチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.306	２－(ジエチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.307	２－(ジエチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.308	２－(ジエチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.309	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-CH_3$
1.310	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-Br
1.311	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-F
1.312	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-OCH_3$

【０１５６】

【表１０】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.313	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.314	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	-Cl
1.315	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.316	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.317	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	トリフルオロメチル
1.318	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	ジフルオロメトキシ
1.319	２－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)エチル	トリフルオロメトキシ
1.320	２－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.321	２－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	-Br
1.322	２－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	-F
1.323	２－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.324	２－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.325	２－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	-Cl
1.326	２－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.327	２－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.328	２－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメチル
1.329	２－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.330	２－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.331	２－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.332	２－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	-Br
1.333	２－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	-F
1.334	２－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.335	２－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.336	２－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	-Cl
1.337	２－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.338	２－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.339	２－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメチル
1.340	２－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.341	２－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.342	２－(４－メチルピペリジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.343	２－(４－メチルピペリジン－１－イル)エチル	-Br
1.344	２－(４－メチルピペリジン－１－イル)エチル	-F
1.345	２－(４－メチルピペリジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.346	２－(４－メチルピペリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.347	２－(４－メチルピペリジン－１－イル)エチル	-Cl
1.348	２－(４－メチルピペリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.349	２－(４－メチルピペリジン－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ

【０１５７】

【表１１】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.350	２－(４－メチルピペリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメチル
1.351	２－(４－メチルピペリジン－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.352	２－(４－メチルピペリジン－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.353	３－(メチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.354	３－(メチルアミノ)プロピル	-Br
1.355	３－(メチルアミノ)プロピル	-F
1.356	３－(メチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.357	３－(メチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.358	３－(メチルアミノ)プロピル	-Cl
1.359	３－(メチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.360	３－(メチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.361	３－(メチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.362	３－(メチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.363	３－(メチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.364	３－(エチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.365	３－(エチルアミノ)プロピル	-Br
1.366	３－(エチルアミノ)プロピル	-F
1.367	３－(エチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.368	３－(エチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.369	３－(エチルアミノ)プロピル	-Cl
1.370	３－(エチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.371	３－(エチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.372	３－(エチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.373	３－(エチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.374	３－(エチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.375	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.376	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	-Br
1.377	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	-F
1.378	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.379	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.380	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	-Cl
1.381	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.382	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.383	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.384	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.385	３－(アゼチジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.386	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$

【０１５８】

【表１２】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.387	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	-Br
1.388	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	-F
1.389	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.390	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.391	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	-Cl
1.392	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.393	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.394	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.395	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.396	３－(４－アセチルピペラジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.397	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.398	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-Br
1.399	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-F
1.400	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.401	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.402	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-Cl
1.403	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.404	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.405	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.406	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.407	３－(3,3－ジフルオロピロリジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.408	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.409	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	-Br
1.410	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	-F
1.411	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.412	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.413	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	-Cl
1.414	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.415	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.416	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.417	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.418	３－(２－フルオロエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.419	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.420	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	-Br
1.421	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	-F
1.422	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.423	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$

【０１５９】

【表１３】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.424	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	-Cl
1.425	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.426	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.427	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.428	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.429	３－(２，２－ジフルオロエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.430	３－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.431	３－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	-Br
1.432	３－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	-F
1.433	３－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.434	３－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.435	３－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	-Cl
1.436	３－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.437	３－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.438	３－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.439	３－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.440	３－(2,2,2－トリフルオロエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.441	３－(イソプロピルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.442	３－(イソプロピルアミノ)プロピル	-Br
1.443	３－(イソプロピルアミノ)プロピル	-F
1.444	３－(イソプロピルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.445	３－(イソプロピルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.446	３－(イソプロピルアミノ)プロピル	-Cl
1.447	３－(イソプロピルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.448	３－(イソプロピルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.449	３－(イソプロピルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.450	３－(イソプロピルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.451	３－(イソプロピルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.452	３－(イソブチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.453	３－(イソブチルアミノ)プロピル	-Br
1.454	３－(イソブチルアミノ)プロピル	-F
1.455	３－(イソブチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.456	３－(イソブチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.457	３－(イソブチルアミノ)プロピル	-Cl
1.458	３－(イソブチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.459	３－(イソブチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.460	３－(イソブチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル

【０１６０】

【表１４】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.461	３－(イソブチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.462	３－(イソブチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.463	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.464	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	-Br
1.465	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	-F
1.466	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.467	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.468	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	-Cl
1.469	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.470	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.471	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.472	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.473	３－(Ｎ－シクロプロピルメチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.474	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.475	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	-Br
1.476	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	-F
1.477	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.478	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.479	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	-Cl
1.480	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.481	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.482	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.483	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.484	３－(シクロプロピルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.485	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.486	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	-Br
1.487	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	-F
1.488	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.489	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.490	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	-Cl
1.491	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.492	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.493	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.494	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.495	３－(シクロブチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.496	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.497	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	-Br

【０１６１】

【表１５】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.498	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	-F
1.499	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.500	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.501	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	-Cl
1.502	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.503	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.504	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.505	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.506	３－(Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.507	３－(ジエチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.508	３－(ジエチルアミノ)プロピル	-Br
1.509	３－(ジエチルアミノ)プロピル	-F
1.510	３－(ジエチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.511	３－(ジエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.512	３－(ジエチルアミノ)プロピル	-Cl
1.513	３－(ジエチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.514	３－(ジエチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.515	３－(ジエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.516	３－(ジエチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.517	３－(ジエチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.518	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.519	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	-Br
1.520	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	-F
1.521	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.522	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.523	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	-Cl
1.524	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.525	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.526	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.527	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.528	３－(Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.529	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.530	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-Br
1.531	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-F
1.532	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.533	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.534	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-Cl

【０１６２】

【表１６】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.535	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.536	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.537	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.538	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.539	３－((Ｒ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.540	３－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.541	３－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-Br
1.542	３－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-F
1.543	３－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.544	３－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.545	３－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	-Cl
1.546	３－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.547	３－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.548	３－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.549	３－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.550	３－((Ｓ)－３－フルオロピロリジン－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.551	３－(４－メチルピペリジン１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.552	３－(４－メチルピペリジン１－イル)プロピル	-Br
1.553	３－(４－メチルピペリジン１－イル)プロピル	-F
1.554	３－(４－メチルピペリジン１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.555	３－(４－メチルピペリジン１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.556	３－(４－メチルピペリジン１－イル)プロピル	-Cl
1.557	３－(４－メチルピペリジン１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.558	３－(４－メチルピペリジン１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.559	３－(４－メチルピペリジン１－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.560	３－(４－メチルピペリジン１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.561	３－(４－メチルピペリジン１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.562	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	$-CH_3$
1.563	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	-Br
1.564	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	-F
1.565	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	$-OCH_3$
1.566	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.567	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	-Cl
1.568	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.569	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.570	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	トリフルオロメチル
1.571	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)アミノ〕プロピル	ジフルオロメトキシ

【０１６３】

【表１７】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.572	３－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル	トリフルオロメトキシ
1.573	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル	$-CH_3$
1.574	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル	-Br
1.575	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル	-F
1.576	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル	$-OCH_3$
1.577	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.578	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル	-Cl
1.579	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.580	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.581	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル	トリフルオロメチル
1.582	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル	ジフルオロメトキシ
1.583	３－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル	トリフルオロメトキシ
1.584	３－（第三ブチルアミノ）プロピル	$-CH_3$
1.585	３－（第三ブチルアミノ）プロピル	-Br
1.586	３－（第三ブチルアミノ）プロピル	-F
1.587	３－（第三ブチルアミノ）プロピル	$-OCH_3$
1.588	３－（第三ブチルアミノ）プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.589	３－（第三ブチルアミノ）プロピル	-Cl
1.590	３－（第三ブチルアミノ）プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.591	３－（第三ブチルアミノ）プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.592	３－（第三ブチルアミノ）プロピル	トリフルオロメチル
1.593	３－（第三ブチルアミノ）プロピル	ジフルオロメトキシ
1.594	３－（第三ブチルアミノ）プロピル	トリフルオロメトキシ
1.595	３－（アリルアミノ）プロピル	$-CH_3$
1.596	３－（アリルアミノ）プロピル	-Br
1.597	３－（アリルアミノ）プロピル	-F
1.598	３－（アリルアミノ）プロピル	$-OCH_3$
1.599	３－（アリルアミノ）プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.600	３－（アリルアミノ）プロピル	-Cl
1.601	３－（アリルアミノ）プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.602	３－（アリルアミノ）プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.603	３－（アリルアミノ）プロピル	トリフルオロメチル
1.604	３－（アリルアミノ）プロピル	ジフルオロメトキシ
1.605	３－（アリルアミノ）プロピル	トリフルオロメトキシ
1.606	３－（プロパルギルアミノ）プロピル	$-CH_3$
1.607	３－（プロパルギルアミノ）プロピル	-Br
1.608	３－（プロパルギルアミノ）プロピル	-F

【０１６４】

【表１８】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.609	３－(プロパルギルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.610	３－(プロパルギルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.611	３－(プロパルギルアミノ)プロピル	-Cl
1.612	３－(プロパルギルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.613	３－(プロパルギルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.614	３－(プロパルギルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.615	３－(プロパルギルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.616	３－(プロパルギルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.617	３－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）プロピル	$-CH_3$
1.618	３－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）プロピル	-Br
1.619	３－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）プロピル	-F
1.620	３－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）プロピル	$-OCH_3$
1.621	３－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.622	３－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）プロピル	-Cl
1.623	３－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.624	３－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.625	３－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）プロピル	トリフルオロメチル
1.626	３－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）プロピル	ジフルオロメトキシ
1.627	３－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）プロピル	トリフルオロメトキシ
1.628	３－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)プロピル	$-CH_3$
1.629	３－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)プロピル	-Br
1.630	３－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)プロピル	-F
1.631	３－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)プロピル	$-OCH_3$
1.632	３－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.633	３－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)プロピル	-Cl
1.634	３－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.635	３－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.636	３－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)プロピル	トリフルオロメチル
1.637	３－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.638	３－(Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.639	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	$-CH_3$
1.640	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	-Br
1.641	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	-F

【０１６５】

【表１９】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.642	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	$-OCH_3$
1.643	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.644	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	-Cl
1.645	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.646	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.647	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	トリフルオロメチル
1.648	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	ジフルオロメトキシ
1.649	３－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	トリフルオロメトキシ
1.650	３－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	$-CH_3$
1.651	３－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	-Br
1.652	３－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	-F
1.653	３－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	$-OCH_3$
1.654	３－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.655	３－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	-Cl
1.656	３－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.657	３－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.658	３－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	トリフルオロメチル
1.659	３－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	ジフルオロメトキシ

【０１６６】

【表２０】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.660	３－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕プロピル	トリフルオロメトキシ
1.661	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	$-CH_3$
1.662	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	-Br
1.663	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	-F
1.664	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	$-OCH_3$
1.665	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.666	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	-Cl
1.667	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.668	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.669	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	トリフルオロメチル
1.670	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	ジフルオロメトキシ
1.671	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕プロピル	トリフルオロメトキシ
1.672	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	$-CH_3$
1.673	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	-Br
1.674	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	-F
1.675	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	$-OCH_3$
1.676	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.677	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	-Cl

【０１６７】

【表２１】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.678	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.679	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.680	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	トリフルオロメチル
1.681	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	ジフルオロメトキシ
1.682	３－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－メトキシエチル)－アミノ〕プロピル	トリフルオロメトキシ
1.683	３－（ピペリジン－１－イル）プロピル	$-CH_3$
1.684	３－（ピペリジン－１－イル）プロピル	-Br
1.685	３－（ピペリジン－１－イル）プロピル	-F
1.686	３－（ピペリジン－１－イル）プロピル	$-OCH_3$
1.687	３－（ピペリジン－１－イル）プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.688	３－（ピペリジン－１－イル）プロピル	-Cl
1.689	３－（ピペリジン－１－イル）プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.690	３－（ピペリジン－１－イル）プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.691	３－（ピペリジン－１－イル）プロピル	トリフルオロメチル
1.692	３－（ピペリジン－１－イル）プロピル	ジフルオロメトキシ
1.693	３－（ピペリジン－１－イル）プロピル	トリフルオロメトキシ
1.694	３－（ホモピペリジン－１－イル）プロピル	$-CH_3$
1.695	３－（ホモピペリジン－１－イル）プロピル	-Br
1.696	３－（ホモピペリジン－１－イル）プロピル	-F
1.697	３－（ホモピペリジン－１－イル）プロピル	$-OCH_3$
1.698	３－（ホモピペリジン－１－イル）プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.699	３－（ホモピペリジン－１－イル）プロピル	-Cl
1.700	３－（ホモピペリジン－１－イル）プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.701	３－（ホモピペリジン－１－イル）プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.702	３－（ホモピペリジン－１－イル）プロピル	トリフルオロメチル
1.703	３－（ホモピペリジン－１－イル）プロピル	ジフルオロメトキシ
1.704	３－（ホモピペリジン－１－イル）プロピル	トリフルオロメトキシ
1.705	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	$-CH_3$
1.706	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	-Br
1.707	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	-F
1.708	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	$-OCH_3$
1.709	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$

【０１６８】

【表２２】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.710	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	-Cl
1.711	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.712	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.713	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.714	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.715	３－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.716	3-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	$-CH_3$
1.717	3-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	-Br
1.718	3-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	-F
1.719	3-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	$-OCH_3$
1.720	3-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	$-OCH_2CH_3$
1.721	3-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	-Cl
1.722	3-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.723	3-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	シクロプロピルメトキシ
1.724	3-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	トリフルオロメチル
1.725	3-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	ジフルオロメトキシ
1.726	3-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル	トリフルオロメトキシ
1.727	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル	$-CH_3$
1.728	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル	-Br
1.729	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル	-F
1.730	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル	$-OCH_3$
1.731	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_3$
1.732	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル	-Cl
1.733	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.734	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル	シクロプロピルメトキシ
1.735	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル	トリフルオロメチル
1.736	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル	ジフルオロメトキシ
1.737	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル	トリフルオロメトキシ
1.738	２－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル	$-CH_3$
1.739	２－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル	-Br
1.740	２－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル	-F
1.741	２－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル	$-OCH_3$
1.742	２－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_3$
1.743	２－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル	-Cl
1.744	２－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.745	２－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル	シクロプロピルメトキシ
1.746	２－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル	トリフルオロメチル

【０１６９】

【表２３】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.747	２－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル	ジフルオロメトキシ
1.748	２－〔Ｎ－（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル	トリフルオロメトキシ
1.749	２－（第三ブチルアミノ）エチル	$-CH_3$
1.750	２－（第三ブチルアミノ）エチル	-Br
1.751	２－（第三ブチルアミノ）エチル	-F
1.752	２－（第三ブチルアミノ）エチル	$-OCH_3$
1.753	２－（第三ブチルアミノ）エチル	$-OCH_2CH_3$
1.754	２－（第三ブチルアミノ）エチル	-Cl
1.755	２－（第三ブチルアミノ）エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.756	２－（第三ブチルアミノ）エチル	シクロプロピルメトキシ
1.757	２－（第三ブチルアミノ）エチル	トリフルオロメチル
1.758	２－（第三ブチルアミノ）エチル	ジフルオロメトキシ
1.759	２－（第三ブチルアミノ）エチル	トリフルオロメトキシ
1.760	２－（アリルアミノ）エチル	$-CH_3$
1.761	２－（アリルアミノ）エチル	-Br
1.762	２－（アリルアミノ）エチル	-F
1.763	２－（アリルアミノ）エチル	$-OCH_3$
1.764	２－（アリルアミノ）エチル	$-OCH_2CH_3$
1.765	２－（アリルアミノ）エチル	-Cl
1.766	２－（アリルアミノ）エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.767	２－（アリルアミノ）エチル	シクロプロピルメトキシ
1.768	２－（アリルアミノ）エチル	トリフルオロメチル
1.769	２－（アリルアミノ）エチル	ジフルオロメトキシ
1.770	２－（アリルアミノ）エチル	トリフルオロメトキシ
1.771	２－（プロパルギルアミノ）エチル	$-CH_3$
1.772	２－（プロパルギルアミノ）エチル	-Br
1.773	２－（プロパルギルアミノ）エチル	-F
1.774	２－（プロパルギルアミノ）エチル	$-OCH_3$
1.775	２－（プロパルギルアミノ）エチル	$-OCH_2CH_3$
1.776	２－（プロパルギルアミノ）エチル	-Cl
1.777	２－（プロパルギルアミノ）エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.778	２－（プロパルギルアミノ）エチル	シクロプロピルメトキシ
1.779	２－（プロパルギルアミノ）エチル	トリフルオロメチル
1.780	２－（プロパルギルアミノ）エチル	ジフルオロメトキシ
1.781	２－（プロパルギルアミノ）エチル	トリフルオロメトキシ
1.782	２－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）エチル	$-CH_3$
1.783	２－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）エチル	-Br

【０１７０】

【表２４】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.784	２－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）エチル	-F
1.785	２－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）エチル	$-OCH_3$
1.786	２－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）エチル	$-OCH_2CH_3$
1.787	２－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）エチル	-Cl
1.788	２－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.789	２－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）エチル	シクロプロピルメトキシ
1.790	２－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）エチル	トリフルオロメチル
1.791	２－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）エチル	ジフルオロメトキシ
1.792	２－（Ｎ－アリル－Ｎ－メチルアミノ）エチル	トリフルオロメトキシ
1.793	２－（Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ）エチル	$-CH_3$
1.794	２－（Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ）エチル	-Br
1.795	２－（Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ）エチル	-F
1.796	２－（Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ）エチル	$-OCH_3$
1.797	２－（Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ）エチル	$-OCH_2CH_3$
1.798	２－（Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ）エチル	-Cl
1.799	２－（Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ）エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.800	２－（Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ）エチル	シクロプロピルメトキシ
1.801	２－（Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ）エチル	トリフルオロメチル
1.802	２－（Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ）エチル	ジフルオロメトキシ
1.803	２－（Ｎ－メチル－Ｎ－プロパルギルアミノ）エチル	トリフルオロメトキシ
1.804	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-CH_3$
1.805	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	-Br
1.806	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	-F
1.807	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-OCH_3$
1.808	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_3$
1.809	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	-Cl
1.810	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.811	２－〔Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	シクロプロピルメトキシ

【０１７１】

【表２５】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.812	２－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	トリフルオロメチル
1.813	２－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	ジフルオロメトキシ
1.814	２－〔Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	トリフルオロメトキシ
1.815	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-CH_3$
1.816	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	-Br
1.817	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	-F
1.818	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-OCH_3$
1.819	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_3$
1.820	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	-Cl
1.821	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.822	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	シクロプロピルメトキシ
1.823	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	トリフルオロメチル
1.824	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	ジフルオロメトキシ
1.825	２－〔Ｎ－(２－メトキシエチル)－Ｎ－メチル－アミノ〕エチル	トリフルオロメトキシ
1.826	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	$-CH_3$
1.827	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	-Br
1.828	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	-F
1.829	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－(２－ヒドロキシエチル)－アミノ〕エチル	$-OCH_3$

【０１７２】

【表２６】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.830	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_3$
1.831	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－アミノ〕エチル	$-Cl$
1.832	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.833	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－アミノ〕エチル	シクロプロピルメトキシ
1.834	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－アミノ〕エチル	トリフルオロメチル
1.835	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－アミノ〕エチル	ジフルオロメトキシ
1.836	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－アミノ〕エチル	トリフルオロメトキシ
1.837	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）－アミノ〕エチル	$-CH_3$
1.838	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）－アミノ〕エチル	$-Br$
1.839	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）－アミノ〕エチル	$-F$
1.840	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）－アミノ〕エチル	$-OCH_3$
1.841	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_3$
1.842	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）－アミノ〕エチル	$-Cl$
1.843	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）－アミノ〕エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.844	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）－アミノ〕エチル	シクロプロピルメトキシ
1.845	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）－アミノ〕エチル	トリフルオロメチル
1.846	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）－アミノ〕エチル	ジフルオロメトキシ
1.847	２－〔Ｎ－エチル－Ｎ－（２－メトキシエチル）－アミノ〕エチル	トリフルオロメトキシ
1.848	２－（ピペリジン－１－イル）エチル	$-CH_3$

【０１７３】

【表２７】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.849	２－（ピペリジン－１－イル）エチル	-Br
1.850	２－（ピペリジン－１－イル）エチル	-F
1.851	２－（ピペリジン－１－イル）エチル	$-OCH_3$
1.852	２－（ピペリジン－１－イル）エチル	$-OCH_2CH_3$
1.853	２－（ピペリジン－１－イル）エチル	-Cl
1.854	２－（ピペリジン－１－イル）エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.855	２－（ピペリジン－１－イル）エチル	シクロプロピルメトキシ
1.856	２－（ピペリジン－１－イル）エチル	トリフルオロメチル
1.857	２－（ピペリジン－１－イル）エチル	ジフルオロメトキシ
1.858	２－（ピペリジン－１－イル）エチル	トリフルオロメトキシ
1.859	２－（ホモピペリジン－１－イル）エチル	$-CH_3$
1.860	２－（ホモピペリジン－１－イル）エチル	-Br
1.861	２－（ホモピペリジン－１－イル）エチル	-F
1.862	２－（ホモピペリジン－１－イル）エチル	$-OCH_3$
1.863	２－（ホモピペリジン－１－イル）エチル	$-OCH_2CH_3$
1.864	２－（ホモピペリジン－１－イル）エチル	-Cl
1.865	２－（ホモピペリジン－１－イル）エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.866	２－（ホモピペリジン－１－イル）エチル	シクロプロピルメトキシ
1.867	２－（ホモピペリジン－１－イル）エチル	トリフルオロメチル
1.868	２－（ホモピペリジン－１－イル）エチル	ジフルオロメトキシ
1.869	２－（ホモピペリジン－１－イル）エチル	トリフルオロメトキシ
1.870	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.871	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	-Br
1.872	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	-F
1.873	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.874	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$
1.875	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	-Cl
1.876	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.877	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.878	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	トリフルオロメチル
1.879	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.880	２－(２，５－ジヒドロピロール－１－イル)エチル	トリフルオロメトキシ
1.881	２－(1，2，3，6－テトラヒドロピリジン－１－イル)エチル	$-CH_3$
1.882	２－(1，2，3，6－テトラヒドロピリジン－１－イル)エチル	-Br
1.883	２－(1，2，3，6－テトラヒドロピリジン－１－イル)エチル	-F
1.884	２－(1，2，3，6－テトラヒドロピリジン－１－イル)エチル	$-OCH_3$
1.885	２－(1，2，3，6－テトラヒドロピリジン－１－イル)エチル	$-OCH_2CH_3$

【０１７４】

【表２８】

No.	Ｒ１	Ｒ５
1.886	2-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)エチル	-Cl
1.887	2-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)エチル	$-OCH_2CH_2OCH_3$
1.888	2-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)エチル	シクロプロピルメトキシ
1.889	2-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)エチル	トリフルオロメチル
1.890	2-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)エチル	ジフルオロメトキシ
1.891	2-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)エチル	トリフルオロメトキシ

【０１７５】

本発明に係る例示的化合物として、それらに限定されることなく、以下のものから選択された任意の化合物が挙げられる：

1.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ-10－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

2.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

3.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

4.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

5.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０１７６】

6.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

7.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

8.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

9.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

10.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０１７７】

11.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

12.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチ

ル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
13.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
14.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（４－ジメチルアミノブチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
15.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０１７８】
16.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
17.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
18.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
19.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
20.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イミダゾール－１－イルプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０１７９】
21.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－シクロプロピルメトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
22.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
23.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
24.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
25.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０１８０】
26.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
27.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

28. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
29. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼチジン－１－イルエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
30. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アミノエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０１８１】

31. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
32. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
33. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼチジン－１－イルエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
34. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（３，３－ジフルオロピロリジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
35. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－エチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０１８２】

36. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
37. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－エチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
38. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
39. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
40. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０１８３】

41. （３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
42. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
43. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－（２－ジメチルア

ミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
44.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼチジン－１－イルエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
45.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０１８４】

46.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼチジン－１－イルエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
47.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
48.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
49.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
50.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－シクロブチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０１８５】

51.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－エチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
52.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；及び
53.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－シクロプロピルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
並びにそれらの塩。

【０１８６】

本発明に係る別の例示的化合物としては、それに限定することなく、下記のものから選択された化合物を挙げることができる：
54.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
55.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－クロロプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０１８７】

56.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－クロロプロピル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
57.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－クロロプロピル）－10－（３－ヒドロ

キシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
58.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（３－クロロプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
59.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－クロロプロピル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
60.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０１８８】
61.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
62.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
63.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－クロロプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
64.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－クロロプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
65.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－クロロプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０１８９】
66.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－６－ヒドロキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
67.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソプロピルアミノプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
68.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
69.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジエチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
70.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０１９０】
71.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
72.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９

，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
73.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（２，２－ジフルオロエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
74.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼパン－１－イルエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
75.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペリジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０１９１】

76.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
77.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
78.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
79.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０１９２】

80.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
81.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
82.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（２－ヒドロキシエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
83.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
84.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
85.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－プロパ－２－イニルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０１９３】

86.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロブチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
87.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼチジン－１－イルプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２

，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
88.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
89.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
90.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０１９４】
91.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
92.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソブチルアミノプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
93.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロプロピルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
94.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０１９５】
95.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
96.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
97.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
98.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
99.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
100.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０１９６】
101.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

102. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－シクロプロピルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
103. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－シクロブチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
104. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼパン－１－イルエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
105. （３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０１９７】

106. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
107. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジエチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
108. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
109. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
110. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－ジエチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０１９８】

111. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
112. （３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
113. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
114. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
115. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０１９９】

116. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テト

ラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
117.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
118.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛２－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
119.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
120.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２００】
121.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
122.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（２－ヒドロキシエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
123.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（２，２－ジフルオロエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
124.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
125.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２０１】
126.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛２－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
127.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－プロパ－２－イニルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
128.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
129.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（３，３－ジフルオロピロリジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
130.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチ

ル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２０２】
131.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－エチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
132.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
133.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
134.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（２－メチル－２Ｈ－ピラゾール－３－イルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
135.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソブチルアミノプロピル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２０３】
136.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（（Ｒ及びＳ）１－メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
137.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－ジエチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
138.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－シクロブチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
139.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アリルアミノプロピル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
140.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２０４】
141.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼチジン－１－イルプロピル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
142.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（２，２－ジフルオロエチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
143.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
144.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メ

チル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

145.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（２－ヒドロキシエチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２０５】

146.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アリルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

147.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－プロパ－２－イニルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

148.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

149.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

150.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２０６】

151.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

152.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

153.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

154.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

155.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－シクロブチルアミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２０７】

156.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

157.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

158.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－

２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
159.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－〔２－（２－ヒドロキシエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
160.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２０８】
161.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－シクロプロピルアミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
162.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジエチルアミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
163.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
164.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
165.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２０９】
166.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼパン－１－イルエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
167.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－tert－ブチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
168.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
169.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
170.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２１０】
171.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
172.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
173.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10

－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
174.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
175.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２１１】
176.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジエチルアミノプロピル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
177.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
178.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
179.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
180.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２１２】
181.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
182.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－tert－ブチルアミノプロピル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
183.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
184.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
185.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２１３】
186.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メ

チル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
187.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－（３－エチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
188.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
189.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（２－メトキシエチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
190.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロプロピルアミノプロピル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２１４】
191.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アリルアミノプロピル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
192.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
193.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
194.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
195.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２１５】
196.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
197.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
198.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼチジン－１－イルプロピル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
199.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソブチルアミノプロピル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
200.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－

３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２１６】
201.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－〔３－（２－ヒドロキシエチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
202.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロプロピルアミノプロピル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
203.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
204.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－（３－エチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
205.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（２－メトキシエチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２１７】
206.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アリルアミノプロピル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
207.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
208.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
209.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
210.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２１８】
211.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
212.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（３－エチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
213.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－

イソブチルアミノプロピル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
214.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（２－メトキシエチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
215.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（３－シクロプロピルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２１９】
216.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
217.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
218.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
219.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
220.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２２０】
221.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
222.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
223.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
224.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペリジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
225.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－プロパ－２－イニルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２２１】
226.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
227.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－

テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
228.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
229.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
230.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２２２】
231.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
232.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
233.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
234.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
235.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－〔３－（２－ヒドロキシエチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２２３】
236.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
237.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
238.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－〔３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
239.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
240.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フル

オレン－１，３－ジオン；
【０２２４】
241.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
242.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
243.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
244.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
245.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－２－〔２－（２－ヒドロキシエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２２５】
246.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－２－｛２－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
247.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
248.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
249.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－エチルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
250.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２２６】
251.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
252.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
253.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９

，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
254.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
255.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２２７】
256.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
257.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
258.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジエチルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
259.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
260.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２２８】
261.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
262.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
263.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
264.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペリジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
265.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２２９】
266.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

267. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
268. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
269. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
270. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２３０】

271. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
272. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－シクロブチルアミノエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
273. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
274. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
275. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２３１】

276. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジエチルアミノエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
277. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
278. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
279. （３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキ

シフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
280.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２３２】
281.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
282.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼパン－１－イルエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
283.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アミノエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
284.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－（２－エチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
285.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－〔２－（２－ヒドロキシエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２３３】
286.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（シクロプロピルアミノエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
287.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－プロパ－２－イニルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
288.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－｛２－〔２－（ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
289.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－｛２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
290.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２３４】
291.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕

－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
292.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
293.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペリジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
294.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
295.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２３５】
296.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－（２－エチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
297.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－｛２－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
298.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
299.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－２－｛２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
300.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２３６】
301.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
302.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペリジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
303.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
304.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，

３－ジオン；
305.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－２－〔３－（２－ヒドロキシエチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２３７】
306.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－〔３－（２－メトキシエチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
307.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロプロピルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
308.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－tert－ブチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
309.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－プロパ－２－イニルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
310.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２３８】
311.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
312.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
313.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジエチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
314.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
315.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２３９】
316.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
317.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－７－フルオ

ロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
318.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
319.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
320.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼチジン－１－イルプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２４０】
321.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
322.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
323.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
324.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
325.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２４１】
326.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
327.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペリジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
328.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
329.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－７－フルオロ－1

0－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
330.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－エチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２４２】
331.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソプロピルアミノプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
332.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソブチルアミノプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
333.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロブチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
334.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アリルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
335.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２４３】
336.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－ジエチルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
337.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
338.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－エチルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
339.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
340.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２４４】
341.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
342.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－２－〔２－（２－ヒドロキシエチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
343.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

344. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（２－シクロブチルアミノエチル）７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
345. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２４５】
346. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
347. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
348. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－２－｛２－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
349. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
350. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２４６】
351. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
352. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
353. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
354. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
355. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２４７】
356. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
357. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペリジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４

，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
358.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
359.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
360.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２４８】
361.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼパン－１－イルエチル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
362.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
363.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アリルアミノプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
364.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
365.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２４９】
366.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
367.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペリジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
368.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
369.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（３－シクロブチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
370.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，

10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２５０】

371. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

372. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

373. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

374. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

375. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２５１】

376. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

377. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

378. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

379. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

380. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－｛２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２５２】

381. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

382. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

383. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

384. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－｛２－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

385. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（２－ジエチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２５３】

386. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

387. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

388. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

389. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

390. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２５４】

391. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

392. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソプロピルアミノプロピル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

393. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－（２－エチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

394. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

395. （３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２５５】

396. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼパン－１－イルエチル）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

397. （３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

398. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アゼパン－１－イルエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

399. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－

１，３－ジオン；
400.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２５６】
401.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）エチル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
402.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペリジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
403.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピペリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
404.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）エチル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
405.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２５７】
406.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
407.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－エチルアミノエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
408.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
409.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
410.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２５８】
411.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）エチル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
412.　（３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－〔２－（２－メトキシエチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

413. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－シクロブチルアミノエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
414. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－tert－ブチルアミノエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
415. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－アリルアミノエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２５９】
416. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－プロパ－２－イニルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
417. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
418. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
419. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－２－｛２－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕エチル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
420. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジエチルアミノエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２６０】
421. （３ａＳ，10Ｒ）－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
422. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
423. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
424. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
425. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２６１】

426. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－シクロブチルアミノエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
427. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
428. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－エチルアミノプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
429. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソプロピルアミノプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
430. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソブチルアミノプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２６２】
431. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
432. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－２－〔３－（２－ヒドロキシエチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
433. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－〔３－（２－メトキシエチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
434. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロプロピルアミノプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
435. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－シクロブチルアミノプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２６３】
436. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－tert－ブチルアミノプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
437. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－プロパ－２－イニルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
438. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
439. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

440. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－ジエチルアミノプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２６４】

441. （３ａＳ，10Ｒ）－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

442. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

443. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

444. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

445. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２６５】

446. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

447. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

448. （３ａＳ，10Ｒ）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

449. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

450. （３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２６６】

451. （３ａＳ，10Ｒ）－２－｛２－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕エチル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

452. （３ａＳ，10Ｒ）－２－〔２－（アリルメチルアミノ）エチル〕－７－フルオロ

－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
453.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
454.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－｛２－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕エチル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
455.　（３ａＳ，10Ｒ）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２６７】
456.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－メチルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
457.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－エチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
458.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソプロピルアミノプロピル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
459.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イソブチルアミノプロピル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
460.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２６８】
461.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－２－〔３－（２－ヒドロキシエチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
462.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（２－メトキシエチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
463.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－シクロブチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
464.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－tert－ブチルアミノプロピル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
465.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アリルアミノプロピル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２６９】
466.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－プロパ－２－イニルアミノプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
467.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（エチルメチルアミノ）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
468.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－２－｛３－〔（２－ヒドロキシエチル）メチルアミノ〕プロピル｝－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
469.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－（３－ジエチルアミノプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
470.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛３－〔エチル（２－ヒドロキシエチル）アミノ〕プロピル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２７０】
471.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－｛３－〔エチル（２－メトキシエチル）アミノ〕プロピル｝－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
472.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（アリルメチルアミノ）プロピル〕－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
473.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（メチルプロパ－２－イニルアミノ）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
474.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔３－（イソプロピルメチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
475.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
【０２７１】
476.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピロリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
477.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（２，５－ジヒドロピロール－１－イル）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
478.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－ピペリジン－１－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テ

トラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
479.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペリジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
480.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピリジン－１－イル）プロピル〕－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２７２】

481.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
482.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－〔３－（４－アセチルピペラジン－１－イル）プロピル〕－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
483.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－アゼパン－１－イルプロピル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
484.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（３－モルホリン－４－イルプロピル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
485.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔３－（４－メチルピペリジン－１－イル）プロピル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；

【０２７３】

486.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
487.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペリジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
488.　（３ａＳ，10Ｒ）－６－クロロ－２－〔３－（シクロプロピルメチルアミノ）プロピル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；
489.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－tert－ブチルアミノプロピル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン；及び
490.　（３ａＳ，10Ｒ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－〔３－（２－メトキシエチルアミノ）プロピル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
並びにそれらの塩。

【０２７４】

本発明に係る化合物は、例えば下記のように例示的に記載される通りそして下記に具体的に記載される反応工程に従って、又は特に、下記実施例に例として記載される方法で、あるいは当業者に公知の調製手順又は合成方策に従ってそれと類似にもしくは同様に製造することができる。

【０２７５】

Ｒ４，Ｒ５及びＲ６が上記に与えた意味を有する式IVのエステル化合物（特に式IVのエチルエステル、又は特にメチルエステル）を、Ｒ２とＲ３が上記に与えた意味を有する式IIIのベンズアルデヒドとのPicket－Spengler反応において縮合・環化させると、式IIａ及び／又は式IIｂの対応化合物が主に混合物として得られる。前記Picket－Spengler反応は、当業者に公知のようにして又は下記実施例に記載される通りに、有利には、触媒又は反応促進剤としての適当な酸（例えばトリフルオロ酢酸）の存在下で、好適な溶剤、例えばトルエン又は特にジクロロメタン中で、高められた温度で又は室温で実施することができる。

【０２７６】

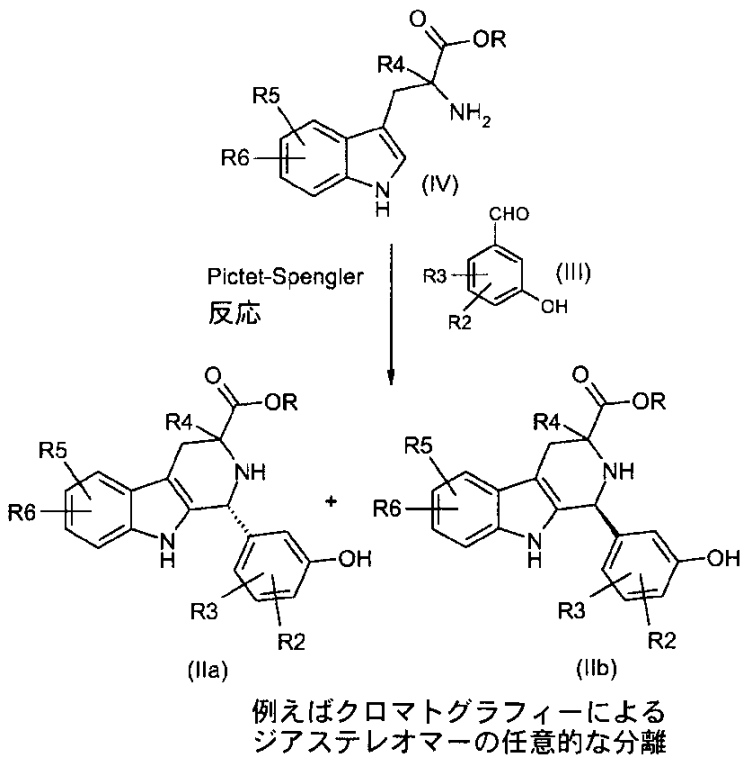
Ｒがメチル又はエチルでありそしてＲ４，Ｒ５及びＲ６が上記に与えた意味を有する式IVの化合物は、既知であるか、又は既知手法と類似もしくは同様にして調製することができるか、又は後述するように入手することができる。

【０２７７】

式IIIの化合物は、既知であるか、又は既知のやり方で、例えば適当な芳香族化合物のホルミル化により、例えば、ヒドロキシメチル化とその後のアルデヒドへの酸化により、又は適当な安息香酸誘導体のアルデヒドへの還元により、得ることができる。

【０２７８】

【化９】



【０２７９】

式IVの化合物は、上記Picter－Spengler反応においてラセミ体として又は鏡像異性的に純粋な化合物として使用することができる。それに応じて、得られる混合物は、ジアステレオマー又はジアステレオマーラセミ体として式IIａ又は式IIｂの化合物を含み得る。前記混合物は当業者にそれ自体公知である手法で光学的に分割することができ、例えば式IIａとIIｂのジアステレオマー化合物は、例えばカラムクロマトグラフィーにより分離することができる。

【０２８０】

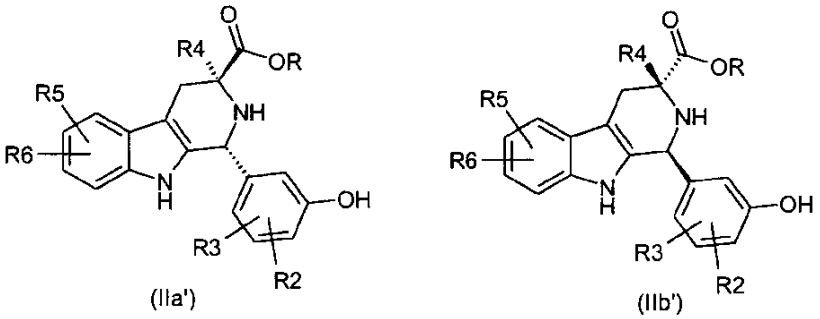
適当ならば、ジアステレオマーの更なる分離を行わずに前記混合物を次の段階に使用す

ることもできる。次いで、下記段階のうちの１段階の後にジアステレオマーの分離を実施することができる。

式IVの化合物を上記Picket－Spengler反応においてラセミ体として使用する場合、式IIａ′及び式IIｂ′の鏡像体化合物を含んでなるラセミ体が、前記反応から優先的に又は過剰に得られる。

【０２８１】

【化１０】



【０２８２】

式VIの化合物の適当な純粋鏡像体から出発して、式IIａ′又はIIｂ′のいずれかの化合物（式IVの出発化合物の立体配置に依存して）を優先的に得ることができる。例えば、（Ｓ）－α－メチルトリプトファンメチルエステル誘導体〔即ち、（Ｓ）－２－アミノ－３－（１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチルプロピオン酸メチルエステル〕を上記Picket－Spengler反応において使用すると、式IIａ′の対応する化合物が優先的に得られる。

【０２８３】

式IIａ′及びIIｂ′の化合物は、当業者にそれ自体既知の方法で、例えばカラムクロマトグラフィーにより、ジアスレテオマー化合物から分離することができる。同様に、式IIａ′の化合物は、当業者に既知の方法により、例えば不斉支持体材料上でのカラムクロマトグラフィーにより（例えば下記実施例に一例として記載される通りに又はそれと類似もしくは同様にして）、又は光学活性酸（例えば本明細書中に口述するもの）とラセミ化合物とのジアステレオマー塩の形成により、式IIｂ′の鏡像体化合物から分離することができる。

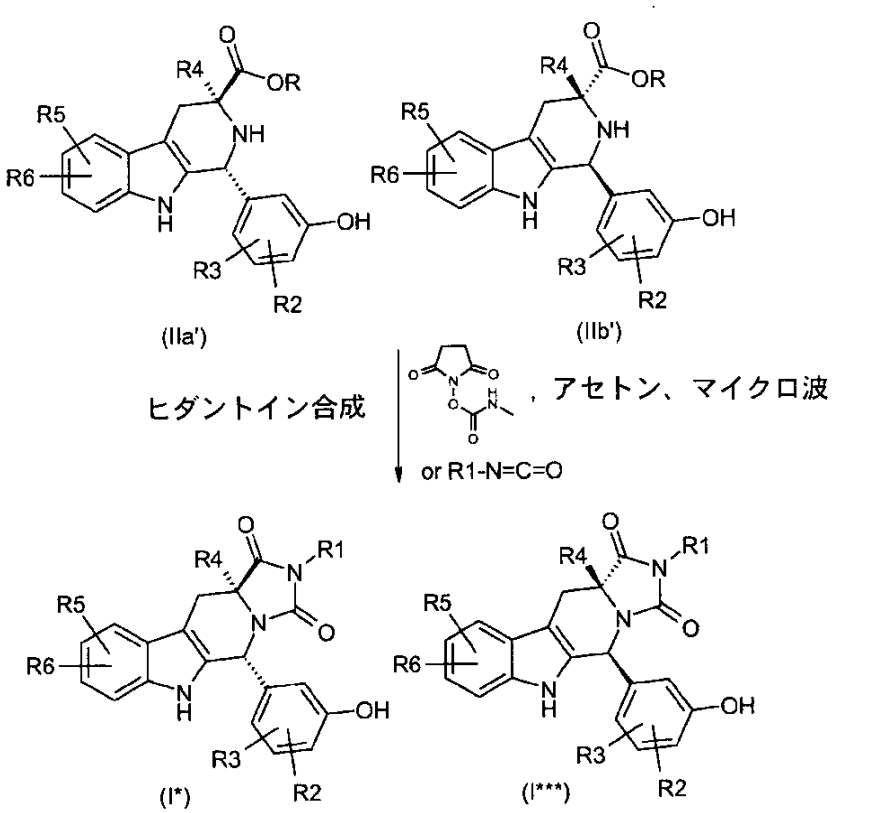
【０２８４】

例えば鏡像異性的に純粋な形又はラセミ体混合物としての、又は上記Picket－Spengler反応で同時形成された対応するジアステレオマーを含有する、式IIａ′又はIIｂ′の化合物を、式Ｒ1－Ｎ＝Ｃ＝Ｏのイソシアネートと、又は対応する活性化カルバミン酸エステル、例えばＮ－ヒドロキシスクシンイミド活性化ウレタン、例えばH_3C-NH-C(O)-OR（ここでＲはN^1－スクシンイミジルである）と、反応スキーム２に示されるようなヒダントイン合成において反応させて、式Ｉ*の所望の対応するヒダントイン（式IIａ′の化合物から）又は式Ｉ***の所望の対応するヒダントイン（式IIｂ′の化合物から）を得ることができる。前記ヒダントイン合成は、当業者に既知の方法で又は下記実施例に記載の通りに、例えばマイクロ波の存在下で、実施することができる。

【０２８５】

【化１１】

反応スキーム２：



【０２８６】

Ｒ１が上記に与えた意味を有する式Ｒ１－Ｎ＝Ｃ＝Ｏのイソシアネートは、それ自体既知であるか、又は既知手法と類似もしくは同様にして得ることができる。例えば、Ｒ１が－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112により置換されたＣ2～Ｃ7アルキルである式Ｒ１－Ｎ＝Ｃ＝Ｏの化合物は、当業者にそれ自体既知である方法で又は下記実施例に例として記載されたのと同様にして、式ＨＮ（Ｒ111）Ｒ112の対応するアミンとの求核置換反応により、Ｒ１が適当な脱離基（例えば臭素）により置換されたＣ2～Ｃ7アルキルである式Ｒ１－Ｎ＝Ｃ＝Ｏの化合物から、得ることができる。例えば、本発明のイソシアネートは、イソシアネート塩を使った置換反応により、例えばB. Akhlaghinia, Synthesis, 2005, 1955-1958に記載された手順に従って、アセトニトリル中でのトリフェニルホスフィン／２，３－ジクロロ－５，６－ジシアノベンゾキノン／Bu_4NOCNとの反応により、対応するアルコール、チオール又はトリメチルシリルエーテルから出発して、得ることができる。更に別に、本発明のイソシアネートは、当業者に既知のイソシアネート合成により対応するアミン化合物から得ることができる。

【０２８７】

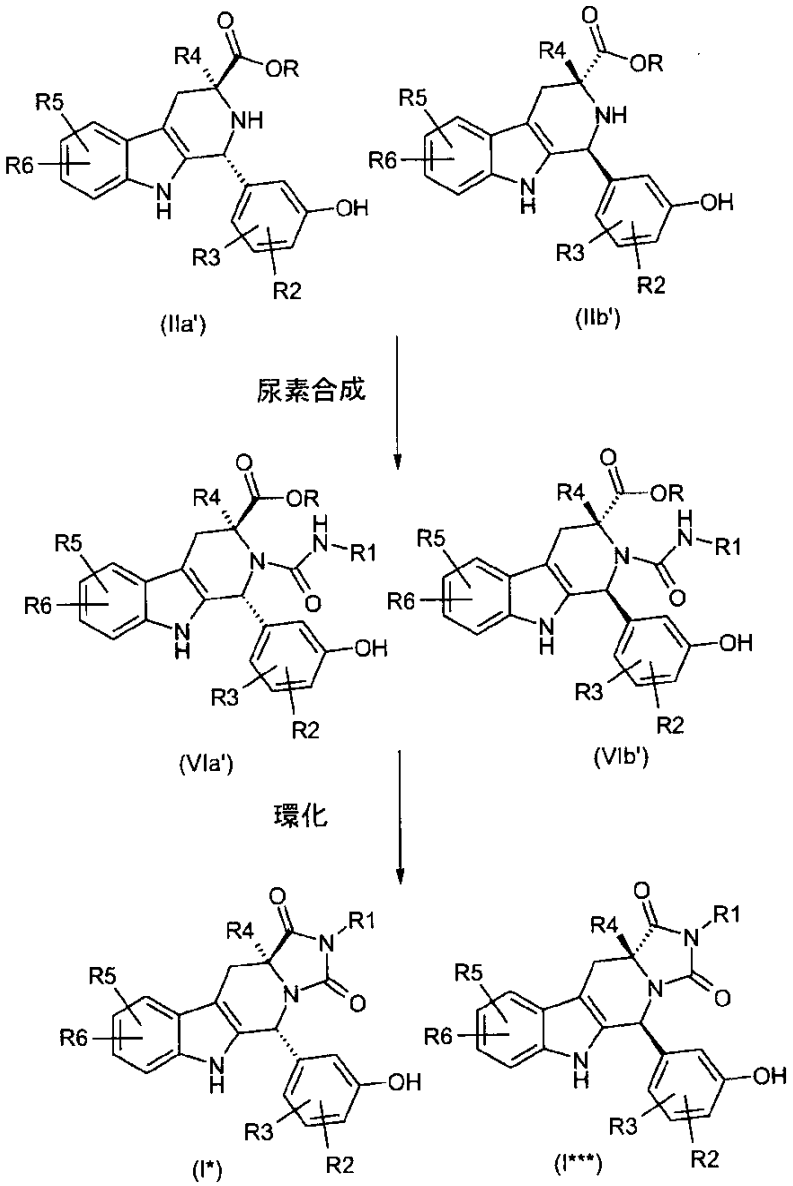
或いは、特にＲ１がメチルではない場合、例えば鏡像異性的に純粋な形もしくはラセミ体混合物として存在するか又は上記Picket－Spengler反応で同時形成された対応するジアステレオマーを含有する、式IIａ′又はIIｂ′の化合物は、反応スキーム３に示されるように式VIａ′の対応する尿素化合物（式IIａ′の化合物から）又は式VIｂ′の対応する尿素化合物（式IIｂ′の化合物から）へと変換することができる。この尿素合成は、当業者に既知である方法で又は下記実施例に記載の通りに、例えば反応スキーム４に概略される反応工程に従って、実施することができる。次いで、式IVの化合物を環化せしめて式Ｉ*の所望の対応化合物（式IIａ′の化合物から）又は式Ｉ***の所望の対応化合物（式IIｂ′の化合物から）を与えることができる。この環化は、当業者に既知である方法で又は下

記実施例に記載の通りに実施することができる。

【０２８８】

反応スキーム３

【化１２】



【０２８９】

式Ｉ*及びＩ**の化合物は、当業者にそれ自体既知である方法で、たとえばカラムクロマトグラフィーにより、ジアステレオマー化合物から分離することができる。式Ｉ*及びＩ***の化合物がラセミ体混合物として得られる場合、当業者に既知の分離技術、例えば上記に記載の技術により、鏡像体的に純粋な化合物を入手することができる。

【０２９０】

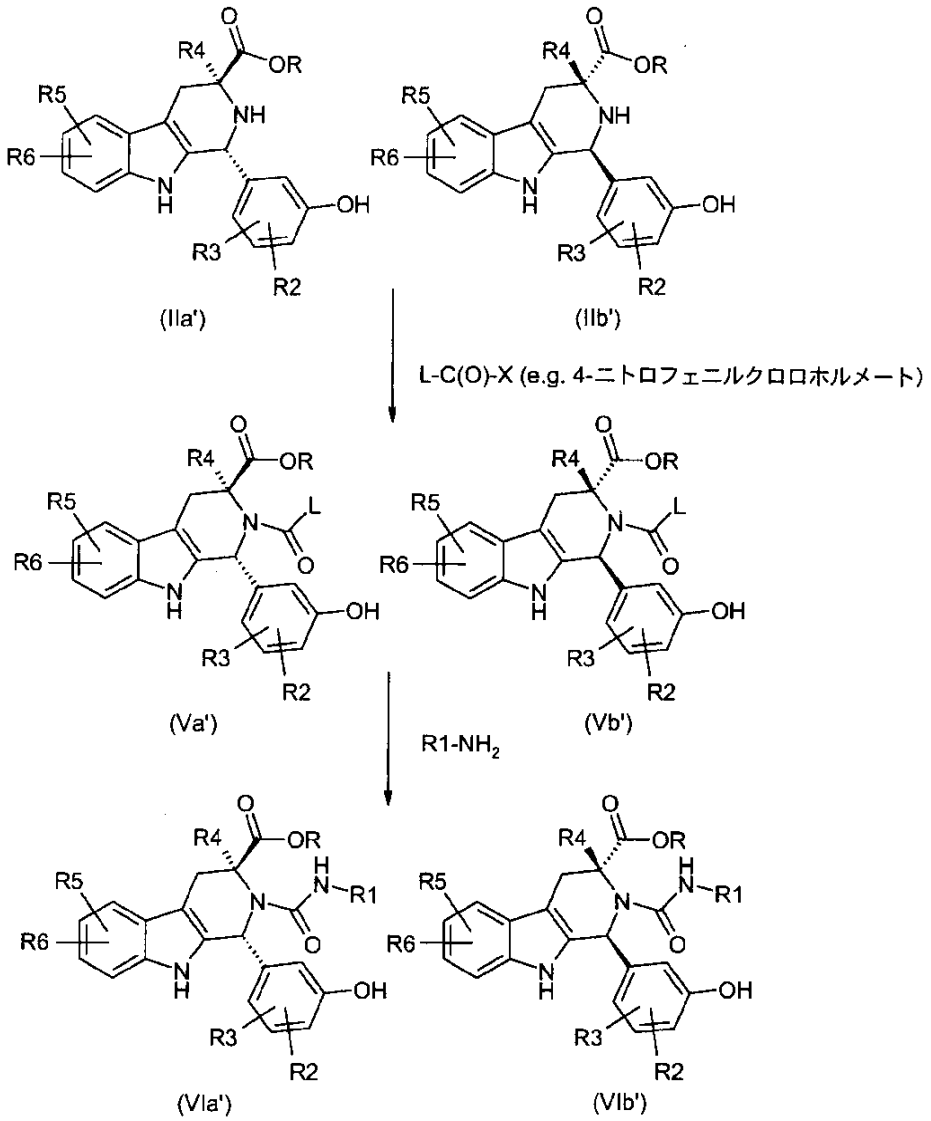
式VIａ′又はVIｂ′の化合物は、式IIａ′又はIIｂ′の化合物から出発して、まず式Ｌ－Ｃ（Ｏ）－Ｘ（ここでＸとＬは適当な脱離基であり、例えばＸが塩素でありそしてＬが４－ニトロフェノールである）の化合物との反応により式Ｖａ′又はＶｂ′の対応化合物を与え、次いで式Ｒ１－NH_2のアミン（ここでＲ１は上記に与えた意味を有する）と反応させて式VIａ′又はVIｂ′の対応化合物を与えるという、反応スキーム４に示される通りに得ることができる。これらの反応は、当業者にそれ自体既知である方法で又は下記実

施例に記載の通りに実施することができる。

【０２９１】

反応スキーム４

【化１３】



【０２９２】

Ｒ２，Ｒ３，Ｒ４，Ｒ５及びＲ６が上記に与えた意味でありそしてＲ１がＸにより置換されたＣ2～Ｃ7アルキル（有利にはＣ2～Ｃ4アルキル）であり、ここでＸが適当な脱離基、例えば塩素又は臭素である、式Ｉの化合物は、式ＨＮ（Ｒ111）Ｒ112のアミン〔ここでＲ111とＲ112は上記に与えた基を表し、それらは必要ならば、適当な保護基により一時的に保護することができる（例えば遊離アミノ機能はtert－ブチルオキシカルボニル（Boc）保護基により一時的に保護することができる）〕と求核置換反応において反応させ、Ｒ１が－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112により置換されたＣ2～Ｃ7アルキルである式Ｉの対応化合物を調製することができる。この求核置換反応は、当業者にそれ自体既知である方法で、又は下記実施例に記載の通りにもしくはそれと同様にして、例えば適当な溶媒（例えばアセトニトリル、メタノール又はテトラヒドロフラン等）中で、所望により適当な塩基の存在下で又は所望により過剰量の式ＨＮ（Ｒ111）Ｒ112を使って、マイクロ波の存在下で、大気圧又は加圧（例えば密封容器中で）下で、室温において、高温、沸騰／還流温度において、

又はマイクロ波で超加熱した１もしくは複数の使用溶媒の沸騰温度において、実施することができる。

【０２９３】

Ｒ２，Ｒ３，Ｒ４，Ｒ５及びＲ６が上記に与えた意味を有し、そしてＲ１がＸにより置換されたＣ2～Ｃ7アルキル（有利にはＣ2～Ｃ4アルキル）であり、ここでＸが適当な脱離基、例えば塩素又は臭素である、式Ｉの化合物は、本明細書に記載のヒダントイン合成により、対応する式Ｒ１－ＮＣＯのイソシアネートを使って得ることができる。より詳しくは、前記ヒダントイン反応は、適当な溶媒（例えばケトン、例えば２－ブロモエチルイソシアネートを使用する場合には、例えば２－ブタノン等）中で、好ましくは高められた温度又は沸騰／還流温度において実施される。

【０２９４】

Ｒ１がメチル又はエチルでありそしてＲ４，Ｒ５及びＲ６が上記に与えた意味を有する式IVの化合物は、反応スキーム５に示した通りにそして下記実施例に例として記載した通りに、又はそれと類似にもしくは同様にして、入手することができる。

Ｒ５とＲ６が上記に与えた意味を有する式Ｘの化合物から出発して、当業者にそれ自体常用されるアミノメチル化反応（Mannich反応）により、式VIIIの対応化合物を得ることができる。

【０２９５】

式VIIIの化合物は、求核置換反応において、Ｒがメチル又はエチルでありそしてＲ４が上記に与えた意味を有する式IXの化合物と反応させると、対応する式VIIの化合物を与える。前記置換反応は、当業者に既知である方法で又は下記実施例に記載の通りに、又はそれと類似もしくは同様にして実施することができる。

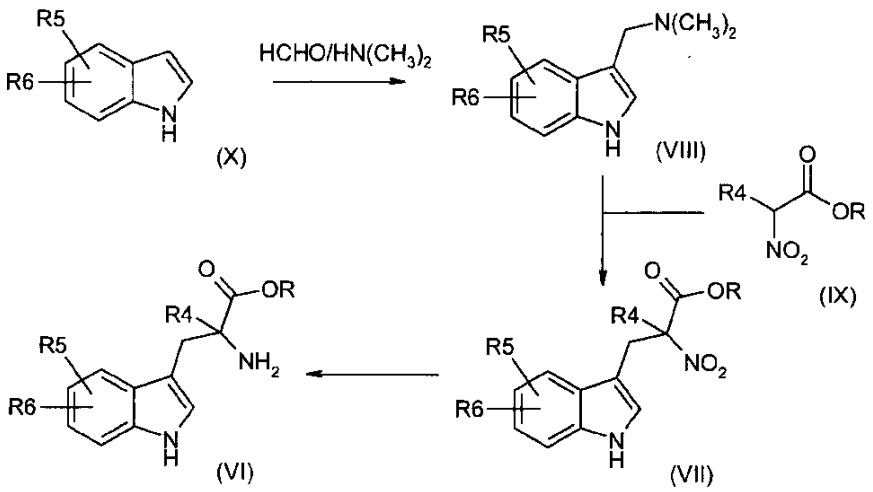
【０２９６】

式VIIの化合物をニトロ基の還元反応にかけると、対応する式VIのアミン化合物を与える。前記還元反応は、当業者にそれ自体既知のように、例えば接触水素添加により、例えば貴金属触媒、例えば活性炭上のパラジウム、又は特にRaneyニッケルの存在下で実施することができる。場合により、触媒量の酸、例えば塩酸を溶媒に添加することができる。或いは、水素発生混合物、例えば亜鉛、亜鉛－銅、又は鉄のような金属と、有機酸例えば酢酸又は無機酸例えば塩酸とを使って、還元を実施してもよい。

【０２９７】

反応スキーム５：

【化１４】



【０２９８】

場合により、式VIのエステル化合物を、既知のケン化反応により、対応する遊離酸に変

換することができる。所望により、式VIの化合物の遊離酸を、当業者に既知のエステル化反応により、例えば塩化チオニル／メタノールを使って、対応するエステル、特にメチルエステルに変換することもできる。

【０２９９】

式IXの化合物は、既知であるか、市販されている（例えば２－ニトロプロピオン酸エチル又は２－ニトロ酪酸エチル）か、又は既知手順に従って得ることができる。

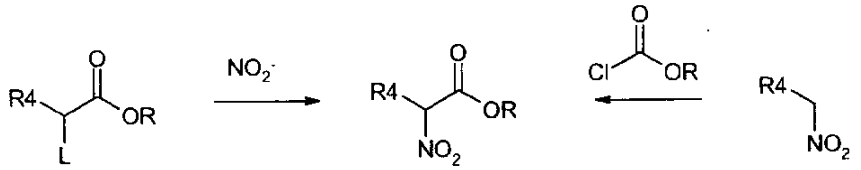
２－ニトロプロピオン酸メチルは、例えば、H.L. Finkbeiner, G.W. Wagner, J. Org. Chem. 1963, 28, 215-217から知られている。

より詳しくは、Ｒがメチル又はエチルでありそしてＲ４が上記に与えた意味を有する式Ｘの化合物は、反応スキーム６に概略される通りに得ることができる。

【０３００】

反応スキーム６：

【化１５】



(IX)

【０３０１】

式IXの化合物は、Ram他、Synthesis 1986, 133-135に記載の通りに、又はそれと類似もしくは同様にして、式Ｒ４－ＣＨ$_2$－ＮＯ$_2$の化合物（ここでＲ４は上記に与えた意味を有し、例えばシクロプロピルである）とクロロ蟻酸エステルとの反応により、調製することができる。

【０３０２】

或いは、式IXの化合物は、J. Am. Chem. Soc. 77, 6654 (1955)に記載の通りに、式Ｒ４－Ｃ(Ｈ)Ｌ－ＣＯ$_2$Ｒ（ここでＬは適当な脱離基、例えばヨウ素であり、そしてＲは上記に与えた意味を有し、例えばイソプロピルである）の化合物と、適当な亜硝酸試薬、例えば亜硝酸ナトリウム又は亜硝酸銀との反応により調製することができる。

【０３０３】

式Ｒ４－ＣＨ$_2$－ＮＯ$_2$と式Ｒ４－Ｃ(Ｈ)Ｌ－ＣＯ$_2$Ｒの化合物は既知であるか、又は既知手法と同様にして得ることができ〔例えば式Ｒ４－Ｃ(Ｈ)Ｌ－ＣＯ$_2$Ｒの化合物はFinkelstein反応により得ることができる〕；例えばニトロメチル－シクロプロパンはHelv. Chim. Acta 1982, 65, 137-162に記載の通りに得ることができ；そして２－ヨード－３－メチル酪酸エチルエステルはOrg. Lett. 1999, 1, 1419-1422に記載の通りに又はそれと類似もしくは同様にして、２－ブロモ－３－メチル酪酸エチルエステルから得ることができる。

【０３０４】

式Ｘの化合物は既知であるか、又は既知手順に従って、又は下記実施例に記載の通りに、又はそれと類似もしくは同様にして得ることができる。

例えば、５－メトキシ－１Ｈ－インドール、５－クロロ－１Ｈ－インドール、５－ブロモ－１Ｈ－インドール、５－フルオロ－１Ｈ－インドール及５－トリフルオロメチル－１Ｈ－インドールは市販されている。

【０３０５】

エーテル化合物である式Ｘの化合物は、当業者に既知のエーテル化反応により、対応するアルコールから得られる。例えば、Ｒ５がヒドロキシルである式Ｘの化合物を、下記実

施例に記載の通りに又はそれと類似もしくは同様にして、対応するエーテル化合物に変換することができる。

【０３０６】

例えば、Ｒ５がヒドロキシルである式Ｘの化合物は、適当なアルキル化試薬を使ったアルキル化反応により、Ｒ５がエトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、シクロプロピルメトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシである式Ｘの対応化合物に変換することができる。

【０３０７】

本発明に係る鏡像異性的に純粋な出発化合物は、当業者に既知の方法に従って、例えば上記方法に従って、対応するラセミ体から得ることができる。よって、鏡像異性的に純粋なトリプトファン又はトリプトファン誘導体（例えばエステル誘導体）は、例えば光学的に活性な酸、好ましくはカルボン酸（この意味で言及することができる光学的に活性な酸の例は、それに限定することなく、マンデル酸、酒石酸、Ｏ，Ｏ′－ジベンゾイル酒石酸、ショウノウ酸、キナ酸、グルタル酸、ピログルタミン酸、リンゴ酸、カンファースルホン酸、３－ブロモカンファースルホン酸、α－メトキシフェニル酢酸、α－メトキシ－α－トリフルオロメチルフェニル酢酸及び２－フェニルプロピオン酸の鏡像体形である）を用いたラセミ体化合物の塩形成と、それに続く前記塩の分割〔例えば適当な溶媒からの（分別）結晶による〕と及び該塩からの所望の化合物の遊離により；ラセミ化合物の速度論的分割、例えば酵素的ラセミ体分割により、例えば適当なリパーゼを使った対応するラセミ体アミノ酸エステルの酵素的ケン化（例えばHoung他、Chirality 1996，8，418-422に記載された手法と同様）の間に；又は例えば適当な不斉助剤を使った立体選択的アミノ酸合成により；又は不斉分離カラム上でのラセミ体化合物のクロマトグラフィー分離により；得ることができる。

【０３０８】

よって、鏡像異性的に純粋なトリプトファンは、例えばTetrahedron Letters 39（1998），9589-9592に記載の通りに、又はそれと類似もしくは同様にして得ることができ、例えば鏡像異性的に純粋なα－メチルトリプトファン、α－エチルトリプトファン又はα－イソプロピルトリプトファンは、Ｎ－Boc－（３－ブロモメチル）インドールと鏡像異性的に純粋なアラニン、２－アミノ酪酸又はバリンからそれぞれ出発して、本明細書に記載の通りに得ることができる。

【０３０９】

より詳細な例としては、鏡像異性的に純粋な５－メトキシ－α－メチルトリプトファンメチルエステルは、不斉分離カラム、例えばDaicel CHIRALPAK AD-RH又はDaicel CHIRALPAK AD-H上での対応するラセミ体のクロマトグラフィー分離により；又は光学的に活性な酸、例えばマンデル酸、ピログルタミン酸又は特に（Ｓ，Ｓ）－ジ－ｐ－アニソイル酒石酸を用いた対応するラセミ体の塩形成と、その後の該塩の分割〔例えば適当な溶媒、例えば酢酸エチル、アセトン、又は特にメタノール／水からの（分別）結晶による分割〕及び該塩からの所望の化合物の遊離により、得ることができる。

【０３１０】

当業者は、本発明に係る幾つかの化合物が、既知の合成方法及び当業者にそれ自体周知である反応により、本発明の更に別の化合物へと変換できるということを理解するだろう。

【０３１１】

従って、式Ｉの化合物は、当業者に既知である方法により式Ｉの別の化合物へと変換することができる。より詳しくは、例えば、

a）Ｒ113が水素である式Ｉの化合物から、還元的アミノ化又は求核置換反応により、対応するＮ－アルキル化化合物を得ることができ；

b）Ｒ111及び／又はＲ112が水素である式Ｉの化合物から、還元的アミノ化又は求核置換反応により、対応するＮ－アルキル化化合物を得ることができ；

c）Ｒ11が塩素又は臭素である式Ｉの化合物から、式ＨＮ（Ｒ111）Ｒ112のアミンとの求

核置換反応により、Ｒ11が－Ｎ（Ｒ111）Ｒ112である対応する化合物を得ることができる。

【０３１２】

上記a)～c)のもとに言及した方法は、当業者に既知の方法と同様にして又は下記実施例において例として記載した通りに実施することができる。

所望により、式Ｉの化合物をそれらの塩に変換することができ、又は所望により式Ｉの化合物の塩を遊離化合物に変換することができる。対応する方法は当業者に周知である。

【０３１３】

最終段階の１つ又は精製が無機酸又は有機酸（例えば塩酸、トリフルオロ酢酸、酢酸又は蟻酸等）の存在下で実施される場合、式Ｉの化合物は、それらの個々の化学的性質と使用する酸の個々の性質に依存して、遊離塩基として得られるか、又は化学量論量もしくは非化学量論量で前記酸を含む場合がある。含まれる酸の量は、当業者に既知の方法に従って、例えば滴定又はＮＭＲにより、測定することができる。

【０３１４】

出発化合物又は中間体化合物上に多数の反応中心が存在する場合には、所望の反応中心に特異的に反応を進行せしめるために、１又は複数の反応中心を保護基により遮蔽する必要があるかもしれないことは、更に当業者の知るところである。多数の保護基の使用についての詳細な記載は、例えば、T. Greene & P. Wuts著“Protective Groups in Organic Synthesis”(John Wiley & Sons, Inc. 1999, 第三版)又はP. Kocienski著“Protecting Groups (Thieme Foundations Organic Chemistry Series N Group)”（Thieme Medical Publishers, 2000）中に見つかる。

【０３１５】

本発明に係る物質は、それ自体既知のやり方で、例えば減圧下で溶媒を留去し、そして得られた残渣を適当な溶媒から再結晶するか、又は該残渣を常用の精製方法の１つ、例えば適当な担体材料上でのカラムクロマトグラフィーにかけることにより、単離・精製される。

【０３１６】

塩は、所望の酸又は塩基を含有するか所望の酸又は塩基をその後で添加する適当な溶媒（例えばケトン、例えばアセトン、メチルエチルケトンもしくはメチルイソブチルケトン、エーテル、例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフランもしくはジオキサン、塩素化炭化水素、例えば塩化メチレンもしくはクロロホルム、低分子量脂肪族アルコール、例えばメタノール、エタノールもしくはイソプロパノール、又はエステル、例えば酢酸エチル）中に遊離化合物を溶解させることにより、得ることができる。それらの塩は、付加塩の場合には無溶媒下で、濾過、再沈澱、沈澱することにより、又は溶媒を蒸発させることにより得ることができる。得られた塩は、遊離化合物に変換することができ、その遊離化合物はその後でアルキル化又は酸性化により塩に変換することができる。こうして、薬理学的に許容されない塩を薬理学的に許容される塩へと変換することができる。

【０３１７】

本発明に言及される変換は、適当には、当業者にそれ自体周知である方法と類似して又は同様にして実施することができる。

当業者は、自身の知識に基づいてそして本明細書中に図示及び記載されているそれらの合成経路に基づいて、本発明に係る化合物のための別の可能な合成経路を見出すことに精通している。これらの別の可能な合成経路も全て、本発明を構成する部分である。

【０３１８】

本発明は、本明細書中に開示されそして本発明化合物を合成するのに有用である、中間体（それらの塩、立体異性体及びそれら立体異性体の塩を含む）、方法及び工程にも関する。よって、本発明は、本発明化合物を調製するための本明細書中に記載の方法にも関し、該方法は上述した中間体を、本明細書中に開示されるような条件下で適当な反応相手により変換しそして／又は反応させるという１又は複数の工程を含んで成る。

【０３１９】
本発明を詳細に説明するが、本発明の範囲はそれらの記載される特徴又は態様のみに制限されるものではない。当業者に明らかなように、記載の発明に対する改変、類推、変更、誘導、相同化及び適応は、当該分野で知られる知識に基づきそして／又は、特に、本発明の開示（例えば明確な開示、暗示又は本質的な開示）に基づき、添付の特許請求の範囲によって定義されるような本発明の精神及び範囲から逸脱することなく行うことができる。

【０３２０】
以下の実施例は本発明を更に説明するものであり、それを制限するものではない。同様に、製造方法が明記されていない本発明に係る他の化合物も、同様な又は類似した方法で又は当業者に周知の方法で常用の製造技術を用いて製造することができる。
下記実施例で最終化合物として言及される式Ｉのいずれかの又は全ての本発明化合物、並びに、それらの塩、立体異性体及び該立体異性体の塩は、本発明の好ましい主題である。

【０３２１】
実施例において、m.p.は融点を表し、ｈは時間を表し、minは分を表し、conc.は濃厚を表し、calc.は計算値を表し、fnd.は実測値を表し、EFは元素式を表し、MSは質量分析を表し、Mは質量分析法における分子イオンを表し、そして他の略語は当業者にそれ自体慣用される意味を有する。

【０３２２】
更に、立体化学における通常のプラクチスに従って、ＲＳ及びＳＲという記号はラセミ体の指定の不斉中心の各々の特定の立体配置を示すために使用される。より詳細には、例えば“（３ａＳＲ，10ＲＳ）”という用語は、立体配置（３ａＳ，10Ｒ）を有する一方の鏡像体と立体配置（３ａＲ，１０Ｓ）を有する他方の鏡像体とを含んで成るラセミ体を表し；更に詳細には、例えば“（３ａＲＳ，10ＲＳ）”という用語は、立体配置（３ａＲ，10Ｒ）を有する一方の鏡像体と立体配置（３ａＳ，１０Ｓ）を有する他方の鏡像体とを含んで成るラセミ体を表し；それらの鏡像体の各々、及び純粋な形でのそれらの塩、並びにラセミ体を含むそれらの混合物は、本発明の一部である。それにより、Ｒ４がメチル又はエチルである式Ｉの化合物に関しては、立体配置（３ａＳ，10Ｒ）を有するこの鏡像体が本発明の好ましい構成部分であり；そしてＲ４がイソプロピル又はシクロプロピルである式Ｉの化合物に関しては、立体配置（３ａＲ，10Ｒ）を有するこの鏡像体が本発明の好ましい構成部分である。

【実施例】

【０３２３】
最終化合物

１．　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
５mlのアセトニトリルと1 mlの水中の125 mgの（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－エトキシ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルと226 mgのＮ－スクシンイミジル－Ｎ－メチルカルバメートの溶液を、マイクロ波反応器を使って150℃に30分間加熱する。その溶液に水と酢酸エチルを添加する。水性相を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥する。溶媒を減圧下で留去する。カラムクロマトグラフィー（トルエン／酢酸エチル 4:1）による精製後、無色泡状物として15 mgの表題化合物が得られる（MS：m/z (MH^+)＝406.1）。

【０３２４】
２．　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例１に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝436.1。

【０３２５】

３．　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例１に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝392.1。

【０３２６】

４．　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として化合物Ａ４を使って、例１に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝440.0／442.0、m.p.:248-251℃。

【０３２７】

５．　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として化合物Ａ５を使って、例１に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝396.0，m.p.:248-250℃。

【０３２８】

６．　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

４mlのジクロロメタン中の100 mg（240μモル）の（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの懸濁液に、126μl（970μモル、4.00当量）のトリエチルアミンを添加する。この溶液を０℃に冷却し、そこに１ mlのジクロロメタン中の123 mg（610μモル、2.5当量）のクロロ蟻酸４－ニトロフェニルの溶液を滴下添加する。混合物を０℃で10分間、室温で更に30分間攪拌する。該溶液を再び０℃に冷却し、そして１ mlのジクロロメタン中の72.0μl（660μモル、2.7当量）の２－ジメチルアミノエチルアミンの溶液をゆっくり添加する。混合物を一晩かけて室温にもどす。水と飽和炭酸ナトリウム水溶液を加え、水性相をジクロロメタンで抽出する。合わせた有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥し、減圧下で溶媒を留去する（210 mgの粗製中間体）。

【０３２９】

その粗製中間体を5 mlのアセトンに溶かし、マイクロ波反応器を使って該溶液を150℃に60分間加熱する。溶媒を減圧留去する。カラムクロマトグラフィーによる精製後、24.5 mgの（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオンが得られる（m/z (MH^+)＝493.2）。

【０３３０】

７．　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

例６に記載したのと同様に、（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの代わりに、（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って表題化合物を調製する。m/z（MH^+）＝449.2。

【０３３１】

あるいは、出発物質として（±）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24）とジメチルアミンから、表題化合物を得ることができる。

【０３３２】

７ａ．　（＋）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、例30について記載したのと同様にして、出発物質として（＋）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24ａ）とジメチルアミンを使って調製される。

【０３３３】

（＋）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオンの絶対立体化学は、暫定的に（３ａＲ，10Ｓ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオンに指定される。

MS：m/z（MH+）＝449.2；$[\alpha]^{20}_{D}$＝＋157°（ｃ＝0.5400、メタノール）。

【０３３４】

７ｂ．　（－）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、例30について記載したのと同様にして、出発物質として（－）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24ｂ）とジメチルアミンを使って調製される。

【０３３５】

（－）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオンの絶対立体化学は、暫定的に（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオンに指定される。

MS：m/z（MH+）＝449.3；$[\alpha]^{20}_{D}$＝－159°（ｃ＝0.5400、メタノール）。

【０３３６】

８．　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの代わりに（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－ブロモ－１－（３

－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例６に記載したのと同様にして調製される。m/z（MH^+）＝497.2/499.1；m.p.:286℃-288℃。

【０３３７】

９．　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの代わりに（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－クロロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例６に記載したのと同様にして調製される。m/z（MH^+）＝453.2；m.p.:283℃-286℃。

【０３３８】

10．　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの代わりに（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使いそして２－ジメチルアミノエチルアミンの代わりにＮ－（２－アミノエチル）モルホリンを使って、例６に記載したのと同様にして調製される。m/z（MH^+）＝491.2；m.p.:260℃-263℃。

【０３３９】

11．　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの代わりに（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使いそして２－ジメチルアミノエチルアミンの代わりに１－（２－アミノエチル）ピロリジンを使って、例６に記載したのと同様にして調製される。m/z（MH^+）＝475.2；m.p.:252℃-255℃。

【０３４０】

12．　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの代わりに（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使いそして２－ジメチルアミノエチルアミンの代わりに１－（２－アミノエチル）－４－メチルピペラジンを使って、例６に記載したのと同様にして調製される。m/z（MH^+）＝504.2；m.p.:224℃-227℃。

【０３４１】

13．　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの代わりに（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使いそして２－ジメチルアミノエチルアミンの代わりに２－（イミダゾール－１－イル）エチルアミンを使って、例６に記載したのと同様にして調製される。m/z（MH^+）＝472.2；m.p.:321℃-324℃。

【０３４２】

14.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（４－ジメチルアミノブチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの代わりに（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使いそして２－ジメチルアミノエチルアミンの代わりに４－（ジメチルアミノ）ブチルアミンを使って、例６に記載したのと同様にして調製される。m/z（MH^+）＝477.3。

【０３４３】

15.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの代わりに（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使いそして２－ジメチルアミノエチルアミンの代わりに３－ジメチルアミノプロピルアミンを使って、例６に記載したのと同様にして調製される。m/z（MH^+）＝463.2；m.p.:228℃-231℃。

【０３４４】

（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－エトキシ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルから出発して、ただし反応相手として適当なアミンを選択して、例６に与えたものと同様な手順を使って次の化合物を調製することができる：

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

【０３４５】

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン。

【０３４６】

（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルから出発して、ただし反応相手として適当なアミンを選択して、例６に与えたものと同様な手順を使って次の化合物を調製することができる：

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン。

【０３４７】

後述する化合物４から出発して、ただし反応相手として適当なアミンを選択して、例６に与えたものと同様な手順を使って次の化合物を調製することができる：

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン。

【０３４８】

後述する化合物Ａ５から出発して、ただし反応相手として適当なアミンを選択して、例６に与えたものと同様な手順を使って次の化合物を調製することができる：

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，

10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン。

【０３４９】

後述する適当な化合物Ａ６～Ａ10から出発して、例１に与えたものと同様な手順を使って次の化合物を調製することができる：
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－エトキシ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－２－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン。

【０３５０】

後述する適当な化合物Ａ６～Ａ10から出発してそして反応相手として適当なアミンを選択して、例６に与えたものと同様な手順を使って次の化合物を調製することができる：
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－２－（２－ジメチルアミノエチル）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－２－（２－ジメチルアミノエチル）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

【０３５１】

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－６－メトキシ－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（４－ジメチルアミノブチル）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

【０３５２】

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－３ａ－エチル－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－エトキシ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－エトキシ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａトリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－エトキシ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａトリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

【０３５３】

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－エトキシ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａトリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－６－エトキシ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａトリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、

【０３５４】

（３ａＳＲ，10ＲＳ）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－

２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａトリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａトリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
【０３５５】
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－モルホリン－４－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａトリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（４－メチルピペラジン－１－イル）エチル〕－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
【０３５６】
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン、
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン。
【０３５７】
16.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
表題化合物は、出発物質として（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－クロロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルと３－ジメチルアミノプロピルアミンを使って、例６に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝467.2。
【０３５８】
17.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－ピロリジン－１－イルエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
表題化合物は、出発物質として（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－クロロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルと１－（２－アミノエチル）ピロリジンを使って、例６に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝479.2。
【０３５９】
18.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９

，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
表題化合物は、出発物質として（１ＲＳ，３ＳＲ）－３－エチル－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸エチルエステルを使って、例６に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝463.2。

【０３６０】

19.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（３－ジメチルアミノプロピル）－３ａ－エチル－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
表題化合物は、出発物質として（１ＲＳ，３ＳＲ）－３－エチル－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸エチルエステルと３－ジメチルアミノプロピルアミンを使って、例６に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝477.2。

【０３６１】

20.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（３－イミダゾール－１－イルプロピル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
表題化合物は、出発物質としてＮ－（３－アミノプロピル）イミダゾールを使って、例６に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝486.2。

【０３６２】

21.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－シクロプロピルメトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３ａ－ジメチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
表題化合物は、出発物質として（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－シクロプロピルメトキシ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例６に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝432.0。

【０３６３】

22.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
25 mlの２－ブタノン中の500 mg（1.31ミリモル）の（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－エトキシ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの溶液に、120μl（1.31ミリモル）のイソチオシアン酸ブロモエチルを添加する。混合物を加熱して24時間還流させる。溶媒を減圧留去する。粗生成物をカラムクロマトグラフィーにより精製する（シリカゲル；トルエン：酢酸エチル 6:1）。260 mg（40%）の表題化合物が無色固体として得られる。m.p.：250-252℃、MS：m/z（MH^+）＝498.1/500.0。

【０３６４】

23.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
10 mlのアセトニトリル中の200 mgの（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－エトキシ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオンの懸濁液に、200μlのテトラヒドロフラン中２Ｍジメチルアミン溶液と85 mgの炭酸ナトリウムを添加する。該混合物を加熱して還流させ、追加の１mlのTHF中２Ｍジメチルアミン溶液を加える。更に２時間加熱して還流させた後、追加の600μlのTHF中ジメチルアミン溶液を添加する。混合物を加熱して15時間還流させる。水を加え、混合物を酢酸エチルで抽出する。合わせた有機相をブラインで洗浄し硫酸マグネシウム上で乾燥する。減圧

下で溶媒を除去した後、残渣をジイソプロピルエーテルで粉砕する。82mg（44％）の表題化合物が無色固体として得られる。MS：m/z（MH^+）＝463.2。

【０３６５】

24.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

35 mlの２－ブタノン中の3.17 gの（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの溶液に、860μlのイソチオシアン酸ブロモエチルを添加する。混合物を加熱して７時間還流させ、そして室温で一晩攪拌する。沈澱した化合物を濾過し、２－ブタノンで洗浄する。3.09ｇ（74％）の表題化合物が得られる。m.p.：299-302℃、MS：m/z（MH^+）＝484.0/486.0。

【０３６６】

24ａ.　（＋）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（－）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例24に記載したのと同様にして調製される。

（＋）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオンの絶対立体化学は、暫定的に（３ａＲ，10Ｓ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオンに指定される。

MS：m/z（$M\text{-}H^+$）＝482.1/484.1；〔α〕$^{20}_{D}$＝＋115°（ｃ＝0.8550，メタノール）。

【０３６７】

24ｂ.　（－）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（＋）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例24に記載したのと同様にして調製される。

（－）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオンの絶対立体化学は、暫定的に（３ａＳ，10Ｒ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオンに定められる。

MS：m/z（$M\text{-}H^+$）＝482.3/484.3；〔α〕$^{20}_{D}$＝－108°（ｃ＝0.5450，メタノール）。

【０３６８】

25.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－アミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

２mlのメタノール中の150 mgの（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24）の溶液に、メタノール中７Ｍアンモニア溶液１mlを添加する。マイクロ波反応器を使って、混合物を封管中130℃に20分間、次いで140℃に更に60分間加熱する。水を加え、混合物を酢酸エチルで抽出する。合わせた有機相をブラインで洗浄し、そして硫酸マグネシ

ウム上で乾燥する。溶媒の減圧蒸発後、粗生成物をカラムクロマトグラフィーにより精製する（シリカゲル；酢酸エチル：メタノール：アンモニア 10:0.3:0.2）。90 mgの油状物が得られ、それはジイソプロピルエーテルでの粉砕後に結晶化する。62 mg（48％）の表題化合物が無色固体として得られる。MS：m/z（MH^+）＝421.1。

【０３６９】

26.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

20 mlの２－ブタノン中の1.66 g（5.39ミリモル）の（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－クロロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの懸濁液に、490μlのイソシアン酸２－ブロモエチルを添加する。混合物を加熱して４時間還流させた後、追加の490μlのイソシアン酸２－ブロモエチルを添加し、混合物を加熱して一晩還流させる。溶媒を減圧留去し、残渣を20 mlのジメチルホルムアミド中に溶解させる。その混合物を80℃で15時間攪拌する。溶媒を減圧留去し、残渣を酢酸エチル中に溶解させる。水を加え、有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥する。溶媒を減圧留去し、残渣をトルエンと酢酸エチル（４：１）の混合物中に懸濁させる。該懸濁液を濾過する。1.35ｇ（62％）の表題化合物が沈澱物として得られる。m.p.：262-264℃、MS：m/z（MH^+）＝488.0/490.0。

【０３７０】

27.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

5 mlのアセトニトリル中の150 mgの（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24）の溶液に、66 mgの炭酸ナトリウムとテトラヒドロフラン中２Ｍメチルアミン溶液920μlを添加する。マイクロ波反応器を使って該混合物を封管中で140℃に３時間加熱する。水を加え、混合物を酢酸エチルで抽出する。有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥する。溶媒を減圧留去する。カラムクロマトグラフィー（シリカゲル；酢酸エチル：メタノール：アンモニア 10:1:0.5）及びジイソプロピルエーテルでの粉砕後、60 mgの表題化合物が無色固体として得られる。MS：m/z（MH^+）＝435.1。

【０３７１】

28.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例26）を使って、例27（426160）に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝439.1。

【０３７２】

29.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－アゼチジン－１－イルエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

5 mlのアセトニトリル中の200 mgの（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例26）の溶液に、87 mgの炭酸ナトリウムと83μlのアゼチジンを添加する。混合物を加熱して４時間還流させる。水を加え、混合物を酢酸エチルで抽出する。有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥する。溶媒を減圧留去する。カラムクロマトグラフィー（シリカゲル；酢

酸エチル：メタノール：アンモニア 10:0.2:0.1）及びジイソプロピルエーテルでの粉砕後、61 mgの表題化合物が無色固体として得られる。MS：m/z（MH^+）＝465.1。

【０３７３】

30.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－アミノエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

３mlのメタノール中の200 mgの（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例26）の溶液に、メタノール中７Ｍアンモニア溶液1.2 mlを添加する。マイクロ波反応器を使って混合物を封管中140℃に１ｈ加熱する。溶媒を減圧留去する。水を加え、混合物を酢酸エチルで抽出する。有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥する。溶媒を減圧留去する。粗生成物を調製用HPLCにより精製する。24 mgの表題化合物が得られる。MS：m/z（MH^+）＝425.1。

【０３７４】

31.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イミダゾール－１－イルエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質としてアゼチジンの代わりにイミダゾールを使って、例29について記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝476.2。

【０３７５】

32.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－〔２－（４－アセチルピペラジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24）とＮ－アセチルピペラジンを使って、例29に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝532.1。

【０３７６】

33.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－アゼチジン－１－イルエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24）を使って、例29に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝461.1。

【０３７７】

34.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－〔２－（３，３－ジフルオロピロリジン－１－イル）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として３，３－ジフルオロピロリジン塩酸塩を使って、例27に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝511.1。

【０３７８】

35.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－エチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－10

－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24）とメタノール中２Ｍエチルアミン溶液を使って、例30に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝449.1。

【０３７９】

36.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

10 mlの２－ブタノン中の5.5 mgの（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの溶液に、132μlのイソシアン酸ブロモエチルを添加する。混合物を加熱して30ｈ還流させる。炭酸水素ナトリウム水溶液を添加し、混合物を酢酸エチルで抽出する。有機相をブラインで洗浄し、そして硫酸マグネシウム上で乾燥する。溶媒を減圧留去する。カラムクロマトグラフィー（シリカゲル；トルエン：酢酸エチル 4:1）及びジイソプロピルエーテルでの粉砕後、550 mg（61％）の表題化合物が無色固体として得られる。MS：m/z（MH^+）＝519.9/522.0。

【０３８０】

37.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－２－（２－エチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質としてメタノール中２Ｍエチルアミン溶液を使って、例30に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝453.2。

【０３８１】

38.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質としてイソプロピルアミンを使って例30に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝467.2。

【０３８２】

39.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－〔２－（イソプロピルメチルアミノ）エチル〕－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質としてアゼチジンの代わりにＮ－イソプロピルメチルアミンを使って、例29に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝481.2。

【０３８３】

40.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質としてアゼチジンの代わりにＮ－エチルメチルアミンを使って、例29に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝467.1。

【０３８４】

41.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例22）と、アゼチジンの代わりにテトラヒドロフラン中２Ｍメチルアミン溶液を使って、例29に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝449.1。

【０３８５】

42. （３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－２－（２－メチルアミノエチル）－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例36）とテトラヒドロフラン中２Ｍメチルアミン溶液を使って、例30に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝471.2。

【０３８６】

43. （３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例36）と、アゼチジンの代わりにジメチルアミンを使って、例29に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝485.2。

【０３８７】

44. （３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－アゼチジン－１－イルエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例36）を使って、例29に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝497.2。

【０３８８】

45. （３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－アミノエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例22）を使って、例30に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝435.1。

【０３８９】

46. （３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－アゼチジン－１－イルエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオンを使って、例29に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝475.2。

【０３９０】

47. （３ａＳＲ，10ＲＳ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソプロピルアミノエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テト

ラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24）とイソプロピルアミンを使って、例30に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝463.2。

【０３９１】

48.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－〔２－（シクロプロピルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24）とＣ－シクロプロピルメチルアミンを使って、例30に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝475.2。

【０３９２】

49.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－２－（２－イソブチルアミノエチル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24）とイソブチルアミンを使って、例30に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝477.2。

【０３９３】

50.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－シクロブチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24）とシクロブチルアミンを使って、例30に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝475.2。

【０３９４】

51.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（３－エチルアミノプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24）とエチルアミンを使って、例30に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝463.2。

【０３９５】

52.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－〔２－（エチルメチルアミノ）エチル〕－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24）とＮ－エチルメチルアミンを使って、例30に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝463.2。

【０３９６】

53.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－シクロプロピルアミノエチル）－10－（３－ヒ

ドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
表題化合物は、出発物質として（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例24）とシクロプロピルアミンを使って、例30に記載したのと同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝461.2。

【０３９７】

下記に言及する適当な出発化合物から出発しそして反応相手としてイソシアン酸ブロモエチルを選択して、例22，24，26又は36に記載したのと同様な手順を使って、次の化合物を調製することができる：
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－メトキシ－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－シクロプロピルメトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－６－トリフルオロメトキシ－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン。

【０３９８】

54.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－２－（２－ブロモエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
表題化合物は、（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－ブロモ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルから出発して、例22に記載した手順と同様にして調製される。MS：m/z（$M-H^+$）$^-$＝531.9/533.8。

【０３９９】

55.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（３－クロロプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
表題化合物は、イソシアン酸クロロプロピルエステルと（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例22に記載した手順と同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝454.0。

【０４００】

55ａ.　（３ａＳ，10Ｒ）－２－（３－クロロプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
表題化合物は、イソシアン酸クロロプロピルエステルと（１Ｒ，３Ｓ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例22に記載した手順と同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝454.0。

【０４０１】

56.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（３－クロロプロピル）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
表題化合物は、イソシアン酸クロロプロピルエステルと（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，

４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例22に記載した手順と同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝490.0。

【０４０２】

57.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－２－（３－クロロプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、イソシアン酸クロロプロピルエステルと（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－クロロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例22に記載した手順と同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝457.9。

【０４０３】

58.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－ブロモ－２－（３－クロロプロピル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、イソシアン酸クロロプロピルエステルと（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－ブロモ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例22に記載した手順と同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝501.9/503.9。

【０４０４】

59.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（３－クロロプロピル）－６－エトキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、イソシアン酸クロロプロピルエステルと（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－エトキシ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例22に記載した手順と同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝468.1。

【０４０５】

60.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、（１ＲＳ，３ＳＲ）－７－フルオロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルから出発して、例22に記載した手順と同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝502.0。

【０４０６】

61.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－６－クロロ－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－クロロ－７－フルオロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルから出発して、例22に記載した手順と同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝505.9。

【０４０７】

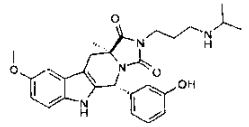
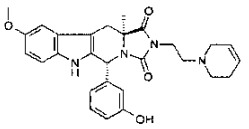
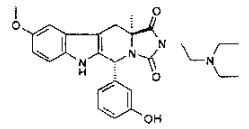
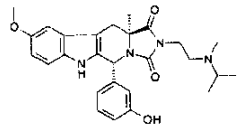
62.　（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ブロモエチル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン

表題化合物は、（１ＲＳ，３ＳＲ）－５－フルオロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例22に記載した手順と同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝501.9/503.8。

【０４０８】
63. （３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（３－クロロプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
表題化合物は、イソシアン酸クロロプロピルエステルと（１ＲＳ，３ＳＲ）－７－フルオロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例22に記載した手順と同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝472.0。
【０４０９】
64. （３ａＳＲ，10ＲＳ）－６－クロロ－２－（３－クロロプロピル）－７－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
表題化合物は、イソシアン酸クロロプロピルエステルと（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－クロロ－７－フルオロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例22に記載した手順と同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝474.0。
【０４１０】
65. （３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（３－クロロプロピル）－５－フルオロ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
表題化合物は、イソシアン酸クロロプロピルエステルと（１ＲＳ，３ＳＲ）－５－フルオロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを使って、例22に記載した手順と同様にして調製される。MS：m/z（MH^+）＝472.0。
【０４１１】
66. （３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－６－ヒドロキシ－10－（３－ヒドロキシフェニル）－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン
５mlのジクロロメタン中の150 mgの（３ａＳＲ，10ＲＳ）－２－（２－ジメチルアミノエチル）－10－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３ａ－メチル－３ａ，４，９，10－テトラヒドロ－２，９，10ａ－トリアザシクロペンタ〔ｂ〕フルオレン－１，３－ジオン（例７）の溶液を－78℃に冷却する。そこに20 mlの三臭化ホウ素を滴下添加する。生じた懸濁液を－78℃で30分間攪拌し、次いで室温まで温める。室温で１ｈ攪拌した後、混合物を０℃に冷却し、炭酸水素ナトリウム水溶液を添加する。有機相を分離し、硫酸マグネシウム上で乾燥する。溶媒を減圧留去する。カラムクロマトグラフィー（シリカゲル；酢酸エチル：メタノール：アンモニア 10:0.3:0.2）後、49 mgの表題化合物が無色泡状物として得られる。MS：m/z（MH^+）＝435.2。
【０４１２】
次の例67～544の調製についての一般手順：
ＴＨＦ中の表示の出発物質（１当量）と表示のアミン（20当量）の溶液を、封管中で150℃に加熱する。或る場合には、反応を促進するために触媒量のヨウ化ナトリウムが添加される。反応をLC-MSによりモニタリングする。完全な変換（24～48ｈ）後、溶媒を減圧留去する。残渣をジクロロメタンに溶かし、炭酸水素ナトリウム水溶液で抽出する。有機相を分離し、溶媒を除去する。最終化合物を調製用HPLCとその後の凍結乾燥により精製する。
【０４１３】

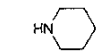
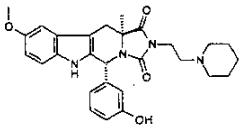
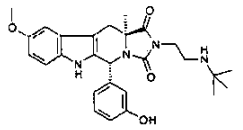
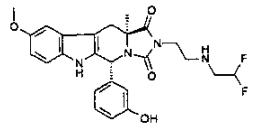
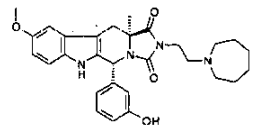
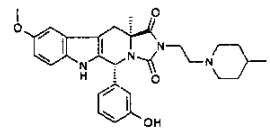
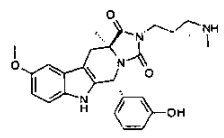
【表２９】

第２表

例	化学名	出発物質	アミン	構造	MS: m/z (MH+)
67	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-イソプロピルアミノプロピル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			477.2
68	(3aSR, 10RS)-2-[2-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			487.2
69	(3aSR, 10RS)-2-(2-ジエチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			477.2
70	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[2-(イソプロピルメチルアミノ)エチル]-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			477.2

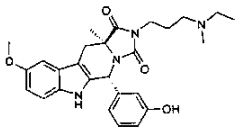
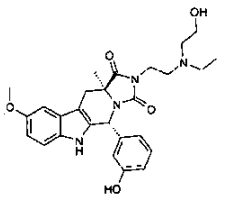
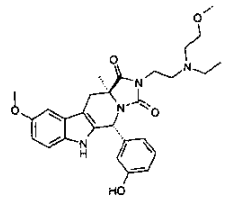
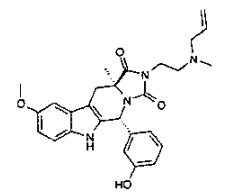
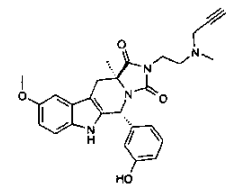
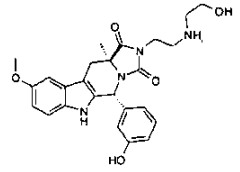
【０４１４】

【表３０】

71	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-ピペリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			489.2
72	(3aSR, 10RS)-2-(2-tert-ブチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザ-シクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			477.1
73	(3aSR, 10RS)-2-[2-(2, 2-ジフルオロエチルアミノ)-エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			485.1
74	(3aSR, 10RS)-2-(2-アゼパン-1-イルエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			503.3
75	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[2-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			503.3
76	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-メチルアミノ-プロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			499.1

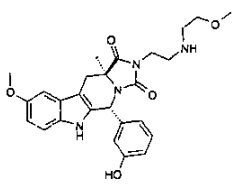
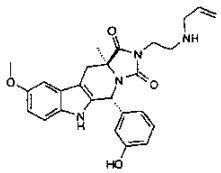
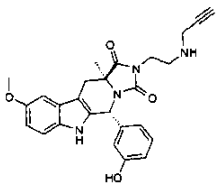
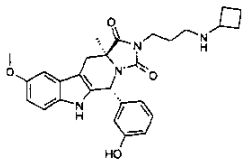
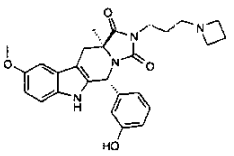
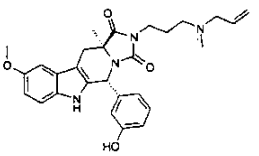
【０４１５】

【表３１】

77	(3aSR, 10RS)-2-[3-(エチルメチルアミノ)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			477.2
78	(3aSR, 10RS)-2-{2-[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			493.2
79	(3aSR, 10RS)-2-{2-[エチル(2-メトキシエチル)アミノ]-エチル}-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			507.2
80	(3aSR, 10RS)-2-[2-アリルメチルアミノ)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			475.2
81	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[2-(メチル-プロパ-2-イニルアミノ)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			473.2
82	(3aSR, 10RS)-2-[2-(2-ヒドロキシエチルアミノ)エチル]--10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンター[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			465.1

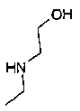
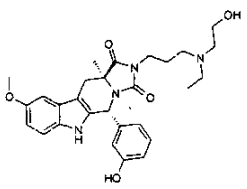
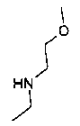
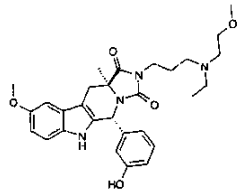
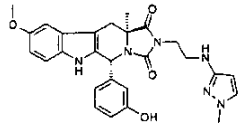
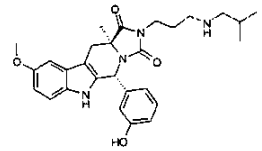
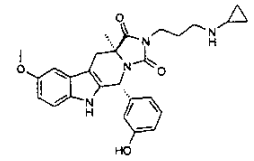
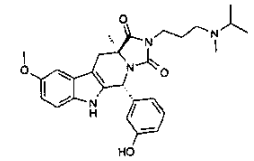
【０４１６】

【表３２】

83	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[2-(2-メトキシエチルアミノ)-エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			479.1
84	(3aSR, 10RS)-2-(2-アリルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザ-シクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			461.1
85	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-プロパ-2-イニルアミノエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			459.1
86	(3aSR, 10RS)-2-(3-シクロブチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			489.2
87	(3aSR, 10RS)-2-(3-アゼチジン-1-イルプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			475.2
88	(3aSR, 10RS)-2-[2-(3-(アリルメチルアミノ)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			489.2

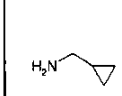
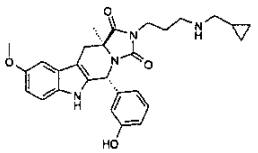
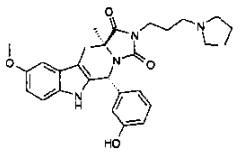
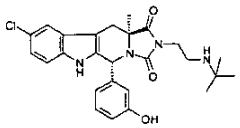
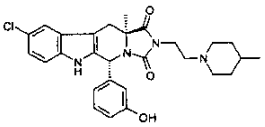
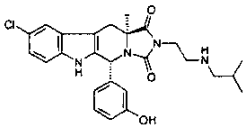
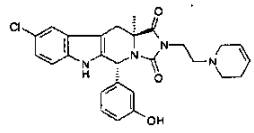
【０４１７】

【表３３】

89	(3aSR, 10RS)-2-{3-[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			507.2
90	(3aSR, 10RS)-2-{3-[エチル(2-メトキシエチル)アミノ]-プロピル}-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンター[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			521.2
91	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[2-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イルアミノ)-エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			501.2
92	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-イソブチルアミノプロピル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			491.1
93	(3aSR, 10RS)-2-(3-シクロプロピルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			475.1
94	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[3-(イソプロピルメチルアミノ)-プロピル]-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			491.2

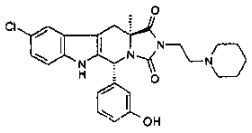
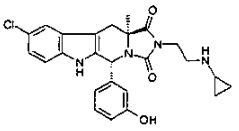
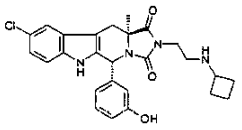
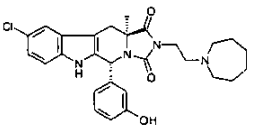
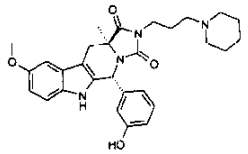
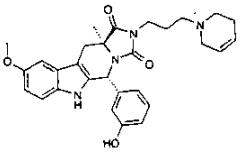
【０４１８】

【表３４】

95	(3aSR, 10RS)-2-[3-(シクロプロピルメチルアミノ)-プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			489.2
96	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			489.2
97	(3aSR, 10RS)-2-(2-tert-ブチルアミノエチル)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			481.0
98	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)--3a-メチル-2-[2-(4-メチルピペリジン-1-イル)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ-[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			507.2
99	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソブチルアミノエチル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			481.1
100	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[2-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)--3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			491.1

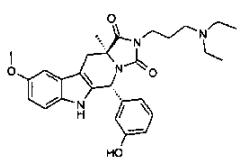
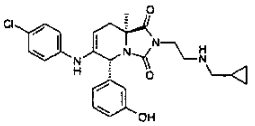
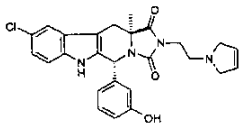
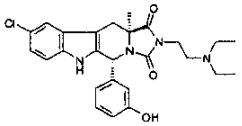
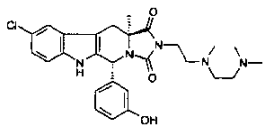
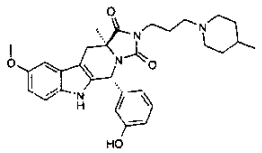
【０４１９】

【表３５】

101	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-ピペリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			493. 2
102	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-(2-シクロプロピルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			465. 0
103	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-(2-シクロブチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			479. 2
104	(3aSR, 10RS)-2-(2-アゼパン-1-イルエチル)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			507. 2
105	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-ピペリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			503. 2
106	(3aSR, 10RS)-2-[3-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			501. 2

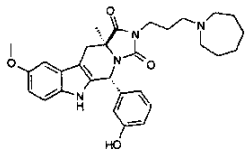
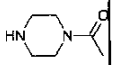
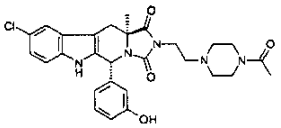
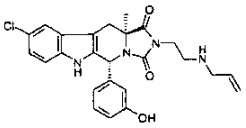
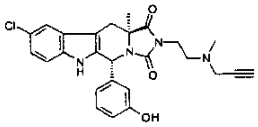
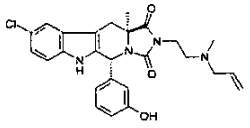
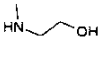
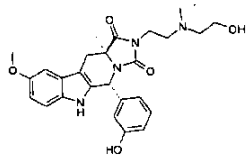
【０４２０】

【表３６】

107	(3aSR, 10RS)-2-(3-ジエチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			491.3
108	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[2-(シクロプロピルメチルアミノ)-エチル]-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザ-シクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			479.1
109	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[2-(2, 5-ジヒドロピロール-1-イル)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			477.1
110	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-(2-ジエチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			481.1
111	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			508.2
112	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[3-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			517.3

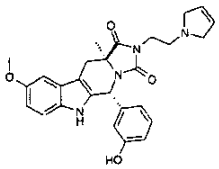
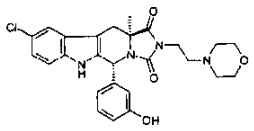
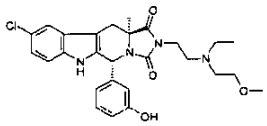
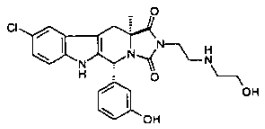
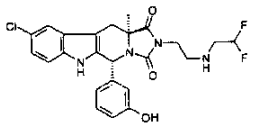
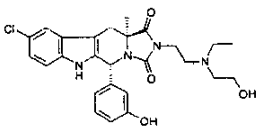
【０４２１】

【表３７】

113	(3aSR, 10RS)-2-(3-アゼパン-1-イルプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			517.3
114	(3aSR, 10RS)-2-[2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-エチル]-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザ-シクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			536.2
115	(3aSR, 10RS)-2-(2-アリルアミノエチル)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			465.2
116	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[2-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			477.2
117	(3aSR, 10RS)-2-[2-(アリルメチルアミノ)エチル]-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			479.1
118	(3aSR, 10RS)-2-(2-[(2-ヒドロキシエチル)メチルアミノ]-エチル)-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			479.2

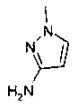
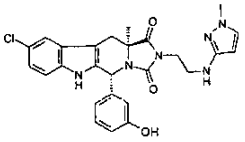
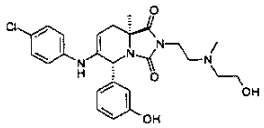
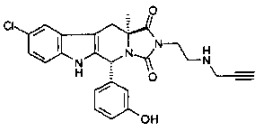
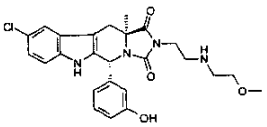
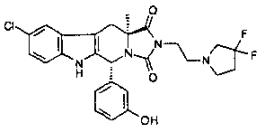
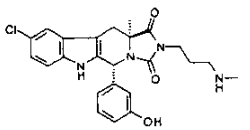
【０４２２】

【表３８】

119	(3aSR, 10RS)-2-[2-(2, 5-ジヒドロピロール-1-イル)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			473.1
120	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-モルホリン-4-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザ-シクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			495.2
121	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-{2-[エチル(2-メトキシエチル)-アミノ]エチル}-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			511.2
122	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[2-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			469.1
123	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[2-(2, 2-ジフルオロエチル-アミノ)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			489.3
124	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-{2-[エチル(2-ヒドロキシ-エチル)アミノ]エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			497.3

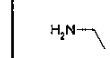
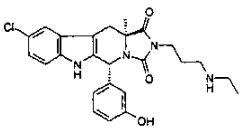
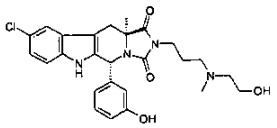
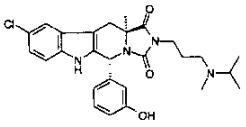
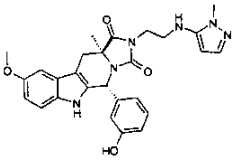
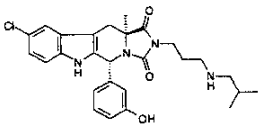
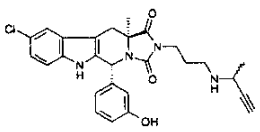
【０４２３】

【表３９】

125	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[2-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イルアミノ)-エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			505.2
126	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-{2-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			483.1
127	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-プロパ-2-イニルアミノエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			463.1
128	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[2-(2-メトキシエチルアミノ)-エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			483.2
129	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[2-(3, 3-ジフルオロピロリジン-1-イル)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例26			515.1
130	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-メチルアミノプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			453.1

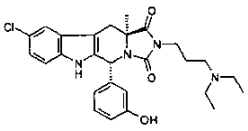
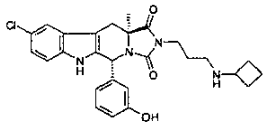
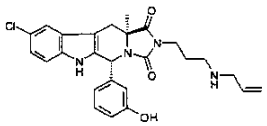
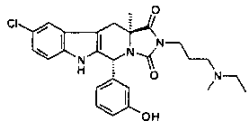
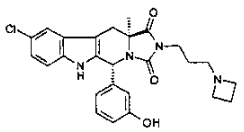
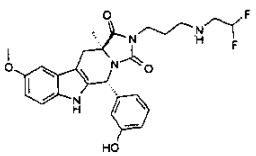
【０４２４】

【表４０】

131	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-(3-エチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			467.1
132	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-{3-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			497.1
133	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[3-(イソプロピルメチルアミノ)-プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			495.2
134	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[2-(2-メチル-2H-ピラゾール-3-イルアミノ)-エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24			501.2
135	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-イソブチルアミノ-プロピル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			495.2
136	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-((R及びS)-1-メチルプロパ-2-イニルアミノ)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			491.2

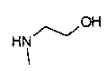
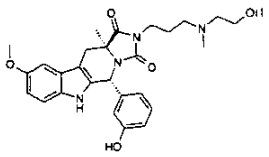
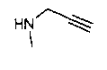
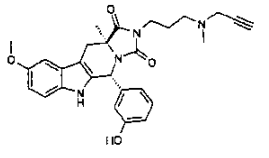
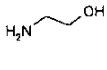
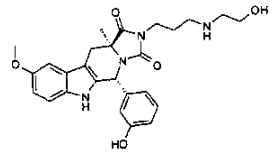
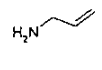
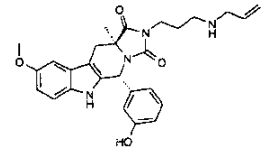
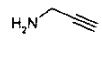
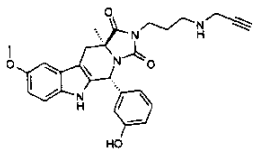
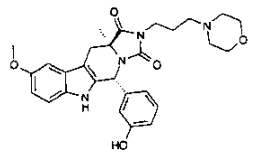
【０４２５】

【表４１】

137	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-(3-ジエチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル--3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			495.1
138	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-(3-シクロプチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			493.1
139	(3aSR, 10RS)-2-(3-アリルアミノプロピル)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			479.1
140	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[3-(エチルメチルアミノ)-プロピル]-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			481.1
141	(3aSR, 10RS)-2-(3-アゼチジン-1-イルプロピル)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			479.1
142	(3aSR, 10RS)-2-[3-(2, 2-ジフルオロエチルアミノ)-プロピル-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			499.1

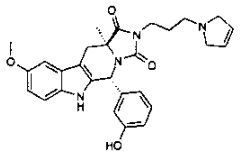
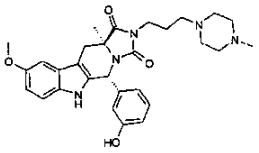
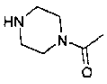
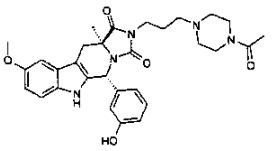
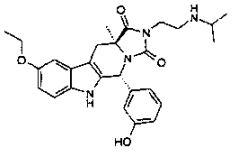
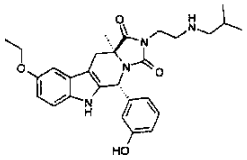
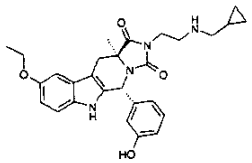
【０４２６】

【表４２】

143	(3aSR, 10RS)-2-{3-[(2-ヒドロキシエチル)メチルアミノ]プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			493.2
144	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[3-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザ-シクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			487.2
145	(3aSR, 10RS)-2-[3-(2-ヒドロキシエチルアミノ)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			479.1
146	(3aSR, 10RS)-2-(3-アリルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ--3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			475.1
147	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-プロパ-2-イニルアミノプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザ-シクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			473.0
148	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-モルホリン-4-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			505.2

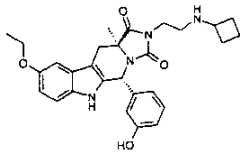
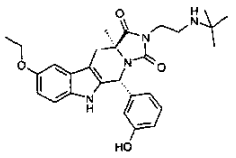
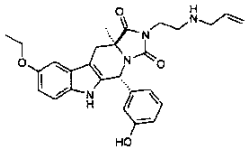
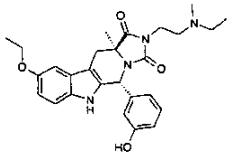
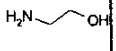
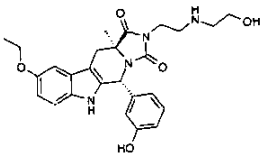
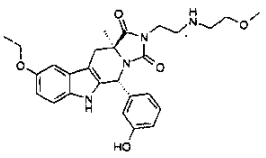
【０４２７】

【表４３】

149	(3aSR, 10RS)-2-[3-(2, 5-ジヒドロピロール-1-イル)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			487. 1
150	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			518. 3
151	(3aSR, 10RS)-2-[3-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			546. 2
152	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソプロピルアミノエチル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			477. 2
153	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソブチルアミノエチル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			491. 3
154	(3aSR, 10RS)-2-[2-(シクロプロピルメチルアミノ)-エチル]-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			489. 2

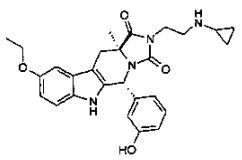
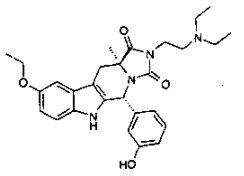
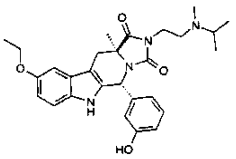
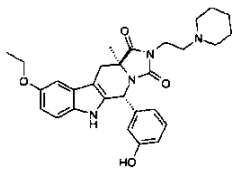
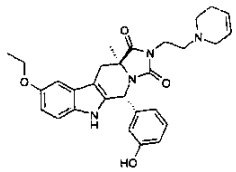
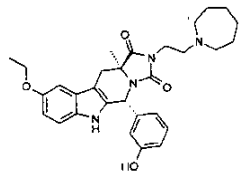
【０４２８】

【表４４】

155	(3aSR, 10RS)-2-(2-シクロブチルアミノエチル)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			489.1
156	(3aSR, 10RS)-2-(2-tert-ブチルアミノエチル)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			491.1
157	(3aSR, 10RS)-2-(2-アリルアミノエチル)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			475.1
158	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-2-[2-(エチルメチルアミノ)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			477.2
159	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-2-[2-(2-ヒドロキシエチルアミノ)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			479.1
160	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[2-(2-メトキシエチルアミノ)-エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			493.1

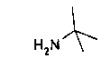
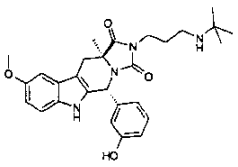
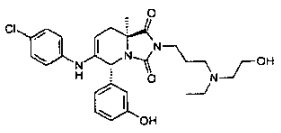
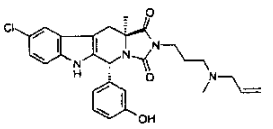
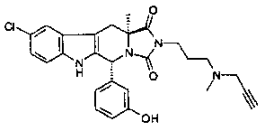
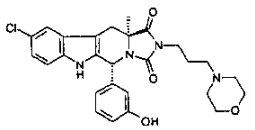
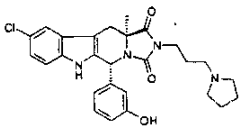
【０４２９】

【表４５】

161	(3aSR, 10RS)-2-(2-シクロプロピルアミノエチル)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			475.1
162	(3aSR, 10RS)-2-(2-ジエチルアミノエチル)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			491.2
163	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[2-(イソプロピルメチルアミノ)-エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			491.2
164	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-ピペリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			503.3
165	(3aSR, 10RS)-2-[2-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)エチル]-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			501.2
166	(3aSR, 10RS)-2-(2-アゼパン-1-イルエチル)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			517.2

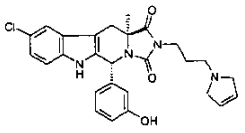
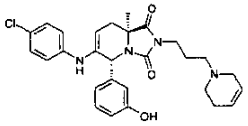
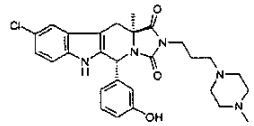
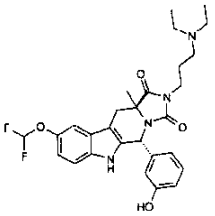
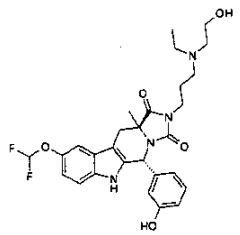
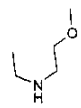
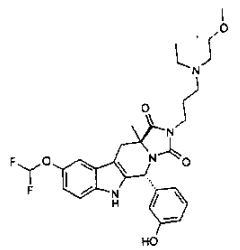
【０４３０】

【表４６】

167	(3aSR, 10RS)-2-(3-tert-ブチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55			491.1
168	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-{3-[エチル(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			511.2
169	(3aSR, 10RS)-2-[3-(アリルメチルアミノ)プロピル]-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			493.2
170	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			491.1
171	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-モルホリン-4-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			509.2
172	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			493.1

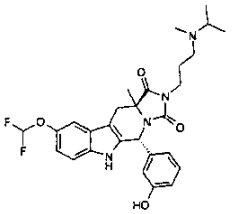
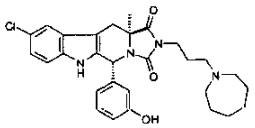
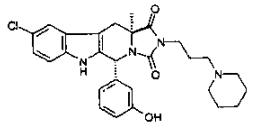
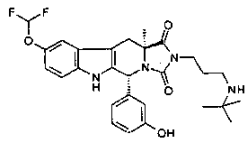
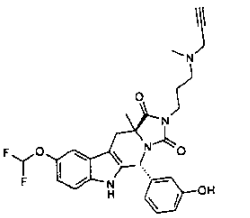
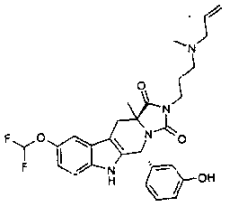
【０４３１】

【表４７】

173	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[3-(2, 5-ジヒドロピロール-1-イル)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			491.1
174	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[3-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			505.1
175	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			522.2
176	(3aSR, 10RS)-2-(3-ジエチルアミノプロピル)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			527.2
177	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-(3-[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]プロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			543.2
178	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-(3-[エチル(2-メトキシエチル)アミノ]-プロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			557.1

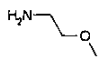
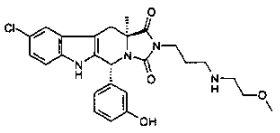
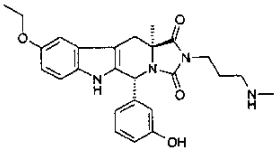
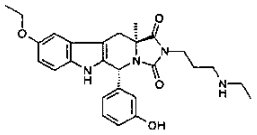
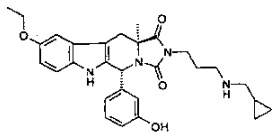
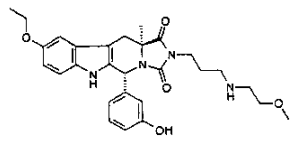
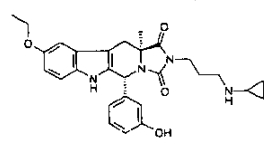
【０４３２】

【表４８】

179	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[3-(イソプロピルメチルアミノ)-プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			527.2
180	(3aSR, 10RS)-2-(3-アゼパン-1-イルプロピル)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			521.2
181	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-ピペリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			507.2
182	(3aSR, 10RS)-2-(3-tert-ブチルアミノプロピル)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			527.1
183	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			523.1
184	(3aSR, 10RS)-2-[3-(アリルメチルアミノ)プロピル]-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			525.2

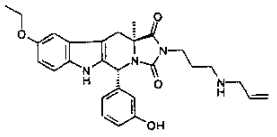
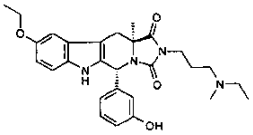
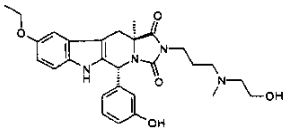
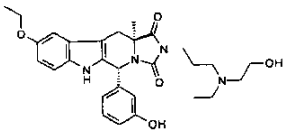
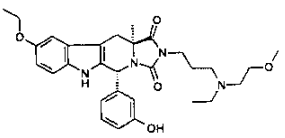
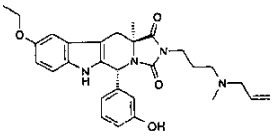
【０４３３】

【表４９】

185	(3aSR, 10RS)-6-クロロ--10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[3-(2-メトキシエチルアミノ)-プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			497.1
186	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-メチルアミノ-プロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			463.2
187	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-2-(3-エチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			477.2
188	(3aSR, 10RS)-2-[3-(シクロプロピルメチルアミノ)-プロピル]-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			503.2
189	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[3-(2-メトキシエチルアミノ)-プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			507.2
190	(3aSR, 10RS)-2-(3-シクロプロピルアミノプロピル)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル--3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			489.2

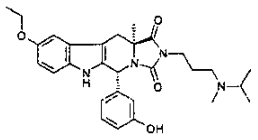
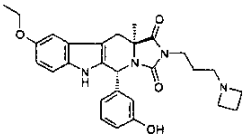
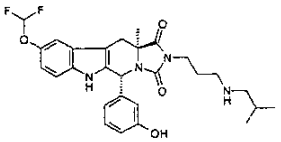
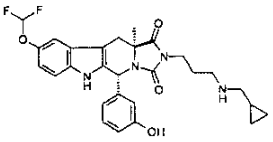
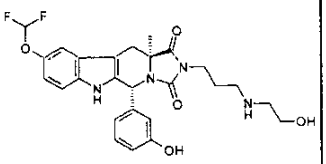
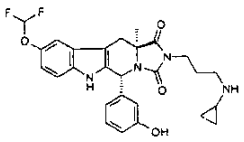
【０４３４】

【表５０】

191	(3aSR, 10RS)-2-(3-アリルアミノプロピル)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			489. 2
192	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-2-[3-(エチルメチルアミノ)-プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			491. 2
193	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-2-{3-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			507. 2
194	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-2-{3-[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			521. 3
195	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-2-{3-[エチル(2-メトキシエチル)-アミノ]プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			535. 3
196	(3aSR, 10RS)-2-[3-(アリルメチルアミノ)プロピル]-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル--3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			503. 1

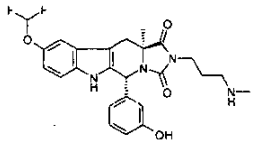
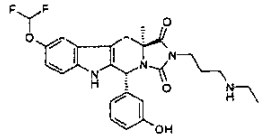
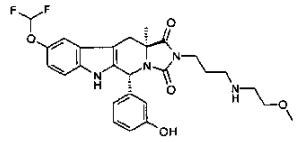
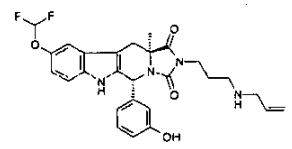
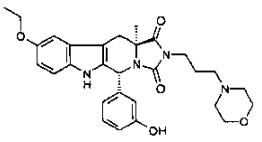
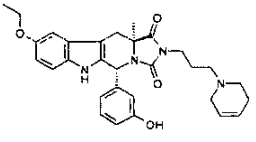
【０４３５】

【表５１】

197	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[3-(イソプロピルメチルアミノ)-プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			505.2
198	(3aSR, 10RS)-2-(3-アゼチジン-1-イルプロピル)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			489.3
199	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-イソブチルアミノプロピル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			527.2
200	(3aSR, 10RS)-2-[3-(シクロプロピルメチルアミノ)-プロピル]-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			525.1
201	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-[3-(2-ヒドロキシエチルアミノ)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			515.2
202	(3aSR, 10RS)-2-(3-シクロプロピルアミノプロピル)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			511.2

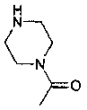
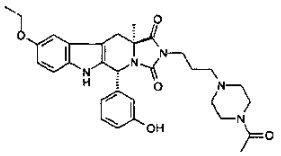
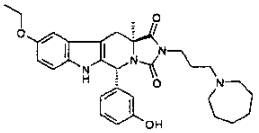
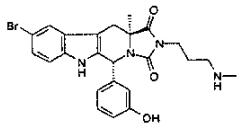
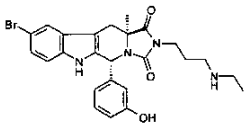
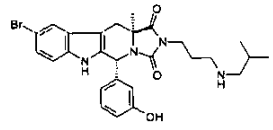
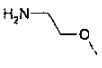
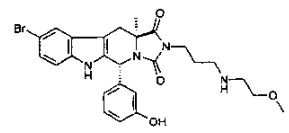
【０４３６】

【表５２】

203	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-メチルアミノプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56	H_2N—		485. 2
204	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-(3-エチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56	H_2N—		499. 1
205	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[3-(2-メトキシエチルアミノ)プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56	H_2N—		529. 3
206	(3aSR, 10RS)-2-(3-アリルアミノプロピル)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56	H_2N—		511. 0
207	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-モルホリン-4-イル-プロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			519. 1
208	(3aSR, 10RS)-2-[3-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)プロピル]-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			515. 2

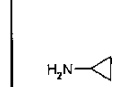
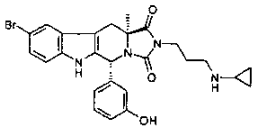
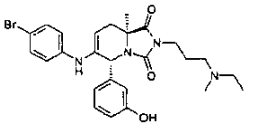
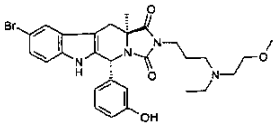
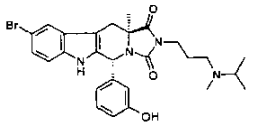
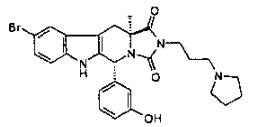
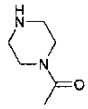
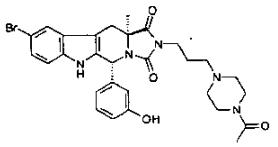
【０４３７】

【表５３】

209	(3aSR, 10RS)-2-[3-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			560.2
210	(3aSR, 10RS)-2-(3-アゼパン-1-イルプロピル)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			531.2
211	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-メチルアミノプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			497.1 499.0
212	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			511.0 513.0
213	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-イソブチルアミノプロピル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			539.0 541.1
214	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[3-(2-メトキシエチルアミノ)-プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			541.1 543.0

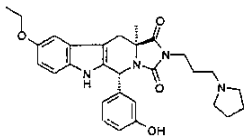
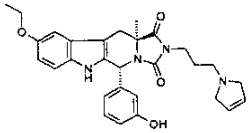
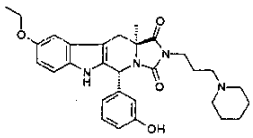
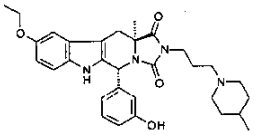
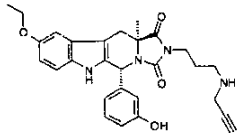
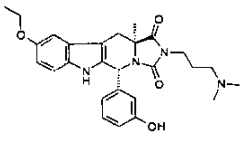
【０４３８】

【表５４】

215	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-(3-シクロプロピルアミノ-プロピル)-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			523.0 525.0
216	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-[3-(エチルメチルアミノ)-プロピル]-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			525.1 527.0
217	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-{3-[エチル(2-メトキシエチル)-アミノ]プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			569.1 571.1
218	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[3-(イソプロピルメチルアミノ)プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			539.2 541.1
219	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			537.2 539.1
220	(3aSR, 10RS)-2-[3-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-プロピル]-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			594.1 596.1

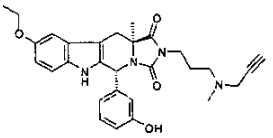
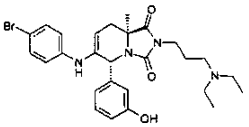
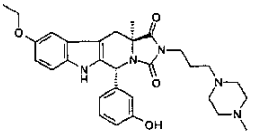
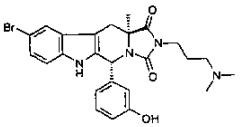
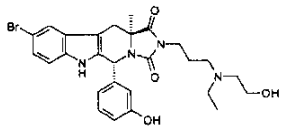
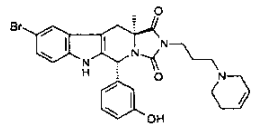
【０４３９】

【表５５】

221	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			503.2
222	(3aSR, 10RS)-2-[3-(2, 5-ジヒドロピロール-1-イル)プロピル]-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			501.2
223	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-ピペリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			517.2
224	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			531.2
225	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-プロパ-2-イニルアミノプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			487.2
226	(3aSR, 10RS)-2-(3-ジメチルアミノプロピル)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			477.2

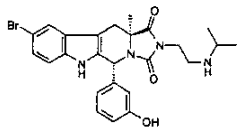
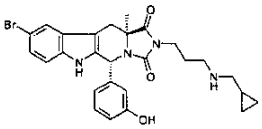
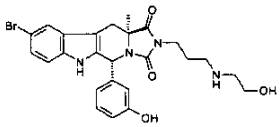
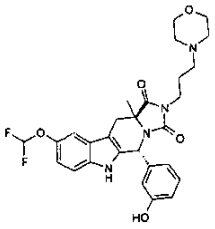
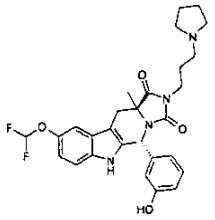
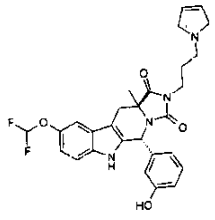
【０４４０】

【表５６】

227	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			501.2
228	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-(3-ジエチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			539.1 541.1
229	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例59			532.2
230	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-(3-ジメチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			511.1 513.0
231	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-{3-[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			555.1 557.1
232	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-[3-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			549.1 551.1

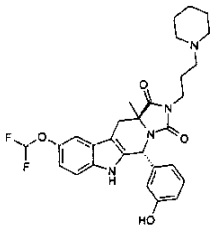
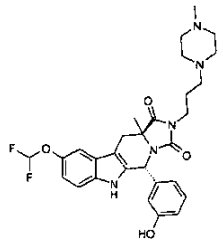
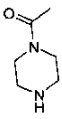
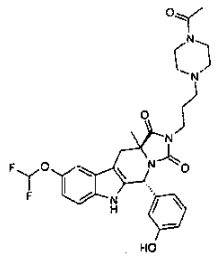
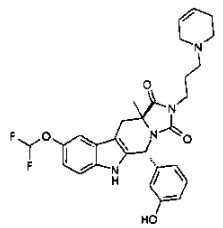
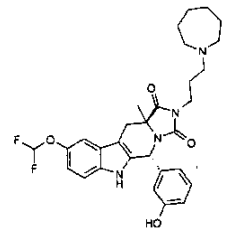
【０４４１】

【表５７】

233	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソプロピルアミノエチル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			511.2 513.2
234	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-[3-(シクロプロピルメチルアミノ)-プロピル]-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			537.1 539.1
235	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-[3-(2-ヒドロキシエチルアミノ)プロピル]-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			527.0 529.0
236	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-モルホリン-4-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			541.1
237	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イル-プロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			525.2
238	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-[3-(2, 5-ジヒドロピロール-1-イル)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			523.2

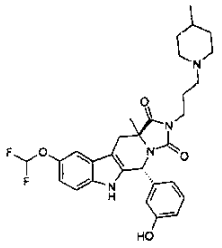
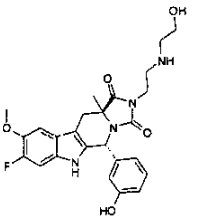
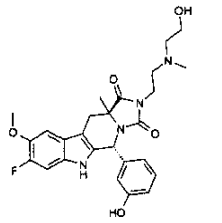
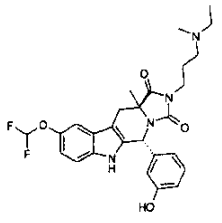
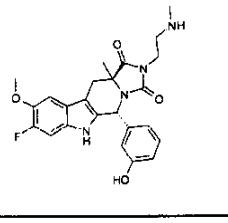
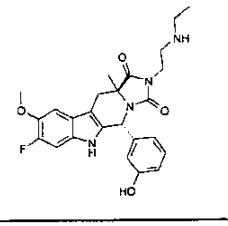
【０４４２】

【表５８】

239	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-ピペリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			539.2
240	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)プロピル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			554.2
241	(3aSR, 10RS)-2-[3-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-プロピル]-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			582.2
242	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフロロメトキシ)-2-[3-(3, 6-ジフルオロ-2H-ピリジン-1-イル)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			537.2
243	(3aSR, 10RS)-2-(3-アゼパン-1-イルプロピル)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			553.2

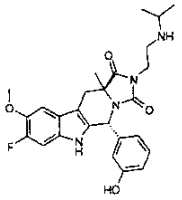
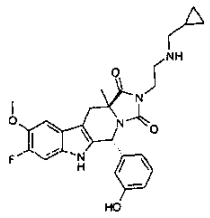
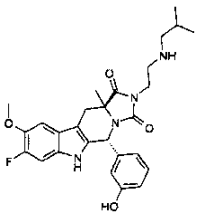
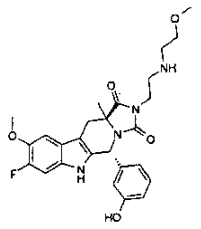
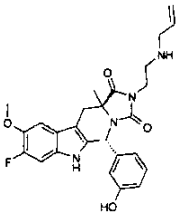
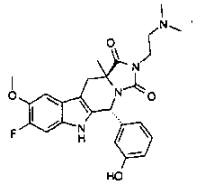
【０４４３】

【表５９】

244	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフロオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-(4-メチルピペリジン-1-イル)プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			553. 2
245	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-2-[2-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-エチル]-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			483. 1
246	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-2-{2-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			497. 1
247	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-[3-(エチル-メチルアミノ)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			513. 1
248	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-メチルアミノエチル)-1-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			453. 1
249	(3aSR, 10RS)-2-(2-エチルアミノエチル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			467. 2

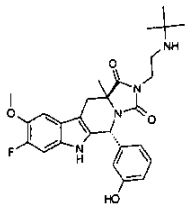
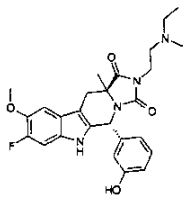
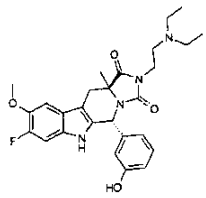
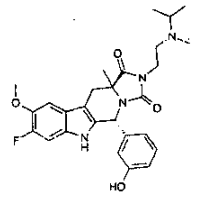
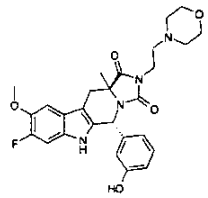
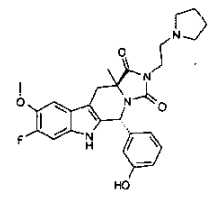
【０４４４】

【表６０】

250	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソプロピルアミノエチル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			481.2
251	(3aSR, 10RS)-2-[2-(シクロプロピルメチルアミノ)エチル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			493.2
252	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソブチルアミノエチル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			495.2
253	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[2-(2-メトキシエチルアミノ)エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			497.2
254	(3aSR, 10RS)-2-(2-アリルアミノエチル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			479.1
255	(3aSR, 10RS)-2-(2-ジメチルアミノエチル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			467.2

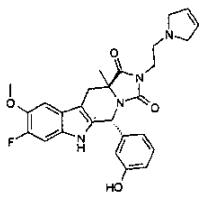
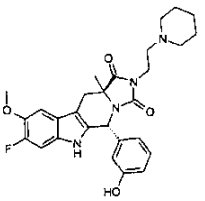
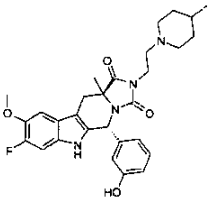
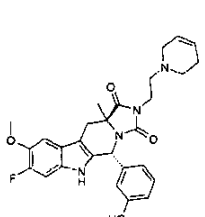
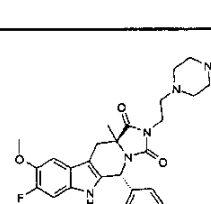
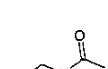
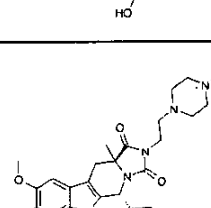
【０４４５】

【表６１】

256	(3aSR, 10RS)-2-(2-tert-ブチルアミノエチル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			495.1
257	(3aSR, 10RS)-2-[2-(エチルメチルアミノ)エチル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			481.2
258	(3aSR, 10RS)-2-(2-ジエチルアミノエチル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			495.2
259	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[2-(イソプロピルメチルアミノ)-エチル]-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			495.1
260	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-モルホリン-4-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			509.2
261	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-ピロリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			493.2

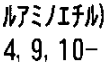
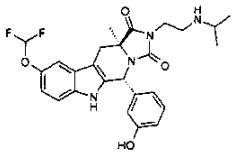
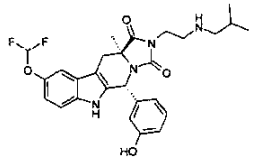
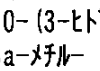
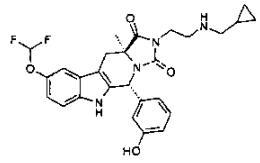
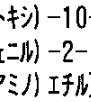
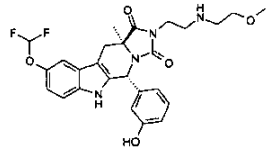
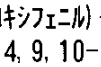
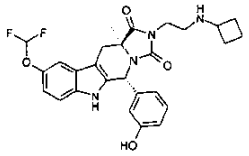
【０４４６】

【表６２】

262	(3aSR, 10RS)-2-[2-(2, 5-ジヒドロピロール-1-イル)エチル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			491. 1
263	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-ピペリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			507. 2
264	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[2-(4-メチルピペリジン-1-イル)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			521. 2
265	(3aSR, 10RS)-2-[2-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)エチル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			505. 2
266	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			522. 2
267	(3aSR, 10RS)-2-[2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-エチル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			550. 2

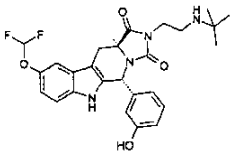
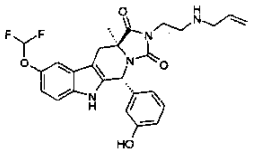
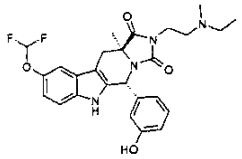
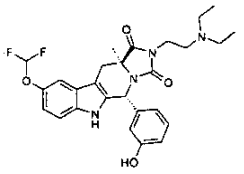
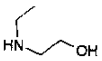
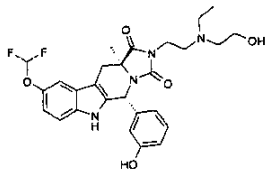
【０４４７】

【表６３】

268	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソプロピルアミノエチル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			499.2
269	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソブチルアミノエチル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			513.1
270	(3aSR, 10RS)-2-[2-(シクロプロピルメチルアミノ)-エチル]-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			511.1
271	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[2-(2-メトキシエチルアミノ)エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			515.1
272	(3aSR, 10RS)-2-(2-シクロブチルアミノエチル)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			511.1

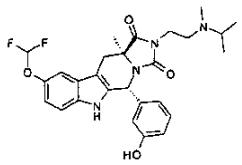
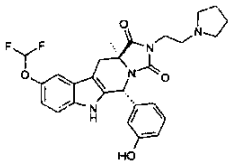
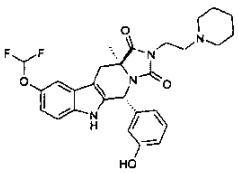
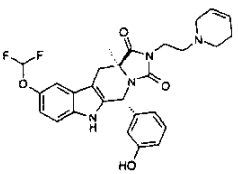
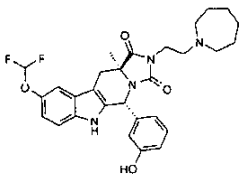
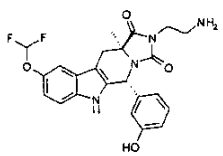
【０４４８】

【表６４】

273	(3aSR, 10RS)-2-(2-tert-ブチルアミノエチル)-6-(1, 1-ジフルオロメチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			513.1
274	(3aSR, 10RS)-2-(2-アリルアミノエチル)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			497.1
275	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-[2-(エチルメチルアミノ)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			499.2
276	(3aSR, 10RS)-2-(2-ジエチルアミノエチル)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			513.1
277	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-(2-[エチル(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]エチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			529.2

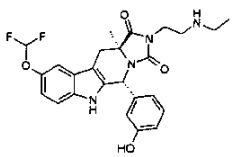
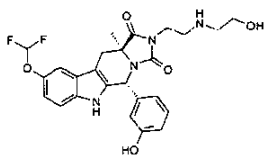
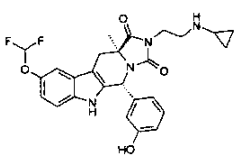
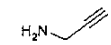
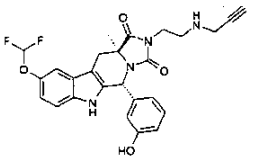
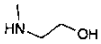
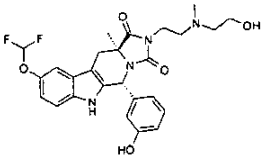
【０４４９】

【表６５】

278	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[2-(イソプロピルメチルアミノ)エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			513.2
279	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-ピロリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			511.2
280	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-ピペリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			525.1
281	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-[3-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			523.1
282	(3aSR, 10RS)-2-(2-アゼパン-1-イルエチル)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			539.2
283	(3aSR, 10RS)-2-(2-アミノエチル)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			457.1

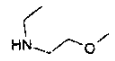
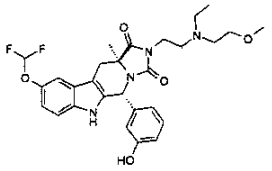
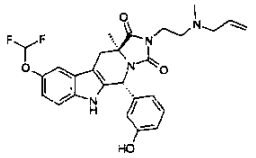
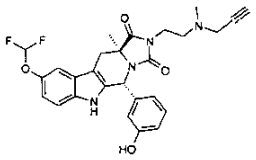
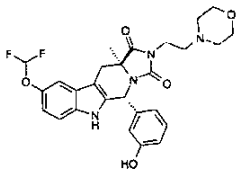
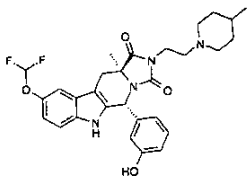
【０４５０】

【表６６】

284	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-(2-エチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			485.1
285	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-[2-(2-ヒドロキシエチルアミノ)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			501.1
286	(3aSR, 10RS)-2-(2-シクロプロピルアミノエチル)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			497.2
287	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-プロパ-2-イニルアミノ-エチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			495.1
288	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-{2-[(2-ヒドロキシエチル)メチルアミノ]エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			515.2

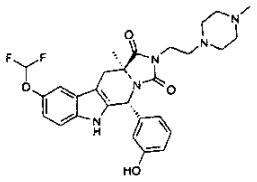
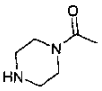
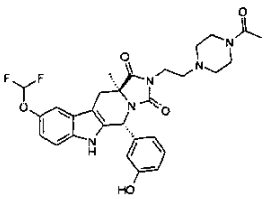
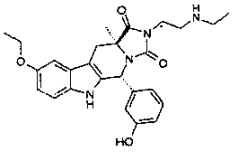
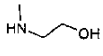
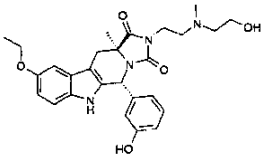
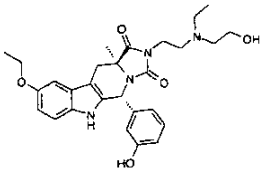
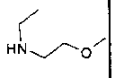
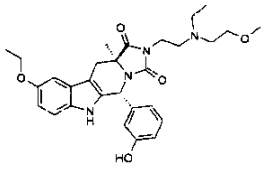
【０４５１】

【表６７】

289	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-{2-[エチル(2-メトキシエチル)アミノ]-エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			543.2
290	(3aSR, 10RS)-2-[2-(アリルメチルアミノ)エチル]-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			511.1
291	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[2-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			509.1
292	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-モルホリン-4-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			527.1
293	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[2-(4-メチルピペリジン-1-イル)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			539.2

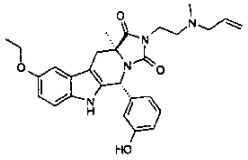
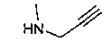
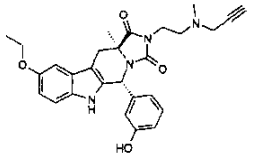
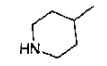
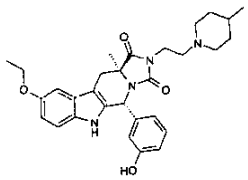
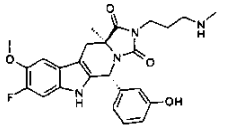
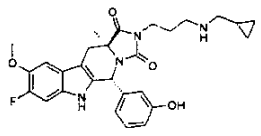
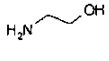
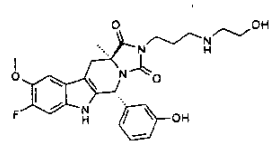
【０４５２】

【表６８】

294	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			540. 2
295	(3aSR, 10RS)-2-[2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-エチル]-6-(1, 1-ジフルオロ-メトキシ)-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例36			568. 2
296	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-2-(2-エチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			463. 1
297	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-2-{2-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			493. 2
298	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-2-{2-[エチル(2-ヒドロキシ-エチル)アミノ]エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			507. 1
299	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-2-{2-[エチル(2-メトキシエチル)-アミノ]エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			521. 1

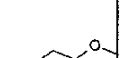
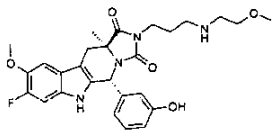
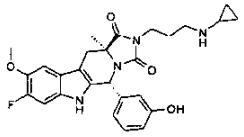
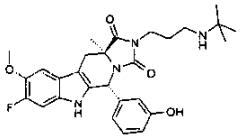
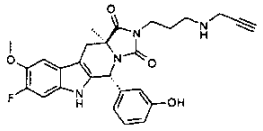
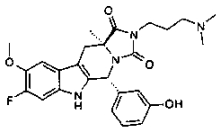
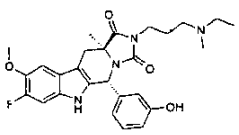
【０４５３】

【表６９】

300	(3aSR, 10RS)-2-[2-(アリルメチルアミノ)エチル]-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			489.2
301	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[2-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			487.2
302	(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[2-(4-メチルピペリジン-1-イル)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例22			517.2
303	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-メチルアミノプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			467.1
304	(3aSR, 10RS)-2-[3-(シクロプロピルメチルアミノ)-プロピル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			507.1
305	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-2-[3-(2-ヒドロキシエチルアミノ)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			497.0

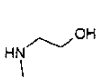
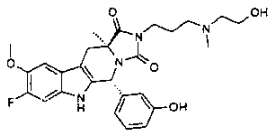
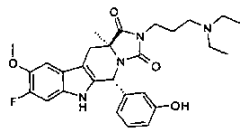
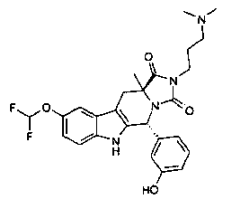
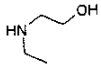
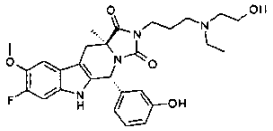
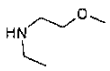
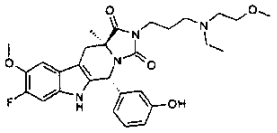
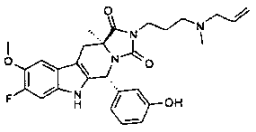
【０４５４】

【表７０】

306	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[3-(2-メトキシエチルアミノ)プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			511.1
307	(3aSR, 10RS)-2-(3-シクロプロピルアミノプロピル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			493.1
308	(3aSR, 10RS)-2-(3-tert-ブチルアミノプロピル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			509.1
309	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-プロパ-2-イニルアミノプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			491.1
310	(3aSR, 10RS)-2-(3-ジメチルアミノプロピル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			481.1
311	(3aSR, 10RS)-2-[3-(エチルメチルアミノ)プロピル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			495.2

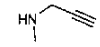
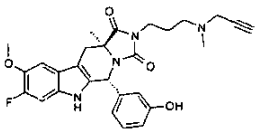
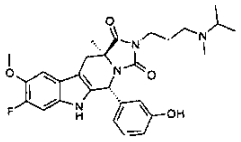
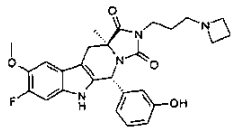
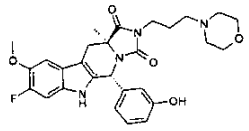
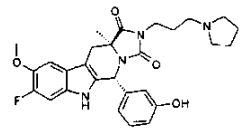
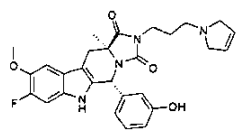
【０４５５】

【表７１】

312	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-2-{3-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			511.1
313	(3aSR, 10RS)-2-(3-ジエチルアミノプロピル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			509.1
314	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-(3-ジメチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			499.2
315	(3aSR, 10RS)-2-{3-[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]プロピル}-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			525.2
316	(3aSR, 10RS)-2-{3-[エチル(2-メトキシエチル)アミノ]-プロピル}-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			539.1
317	(3aSR, 10RS)-2-[3-(アリルメチルアミノ)プロピル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			507.2

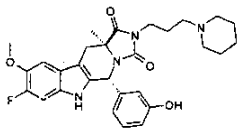
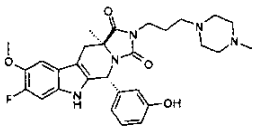
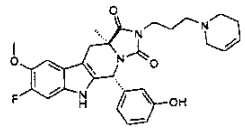
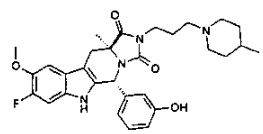
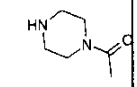
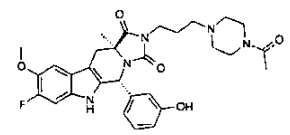
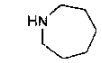
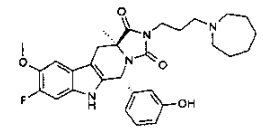
【０４５６】

【表７２】

318	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[3-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			505.1
319	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[3-(イソプロピルメチルアミノ)-プロピル]-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			509.2
320	(3aSR, 10RS)-2-(3-アゼチジン-1-イルプロピル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			493.2
321	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-モルホリン-4-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			523.1
322	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			507.2
323	(3aSR, 10RS)-2-[3-(2, 5-ジヒドロピロール-1-イル)プロピル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			505.2

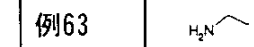
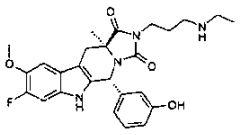
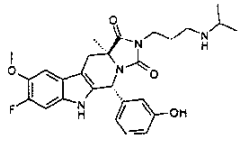
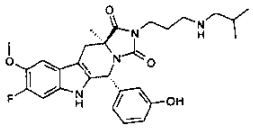
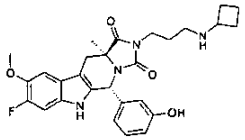
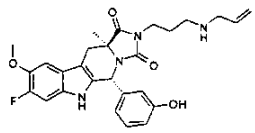
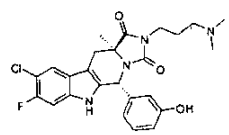
【０４５７】

【表７３】

324	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-ピペリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			521.2
325	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			536.2
326	(3aSR, 10RS)-2-[3-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)プロピル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			519.1
327	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[3-(4-メチルピペリジン-1-イル)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			535.2
328	(3aSR, 10RS)-2-[3-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-プロピル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			564.2
329	(3aSR, 10RS)-2-(3-アゼパン-1-イルプロピル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			535.2

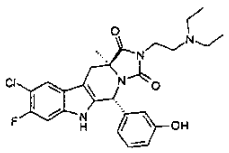
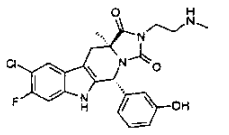
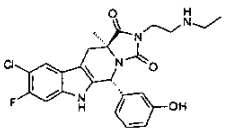
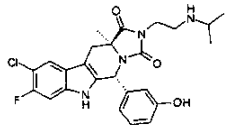
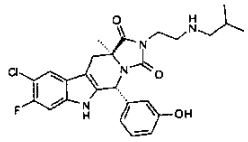
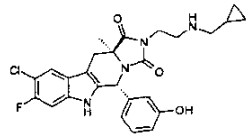
【０４５８】

【表７４】

330	(3aSR, 10RS)-2-(3-エチルアミノプロピル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			481.1
331	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-イソプロピルアミノプロピル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			495.2
332	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-イソブチルアミノプロピル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			509.1
333	(3aSR, 10RS)-2-(3-シクロブチルアミノプロピル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル--3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			507.1
334	(3aSR, 10RS)-2-(3-アリルアミノプロピル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例63			493.1
335	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-(3-ジメチルアミノプロピル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			485.1

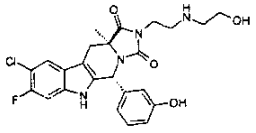
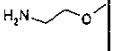
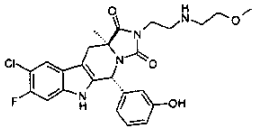
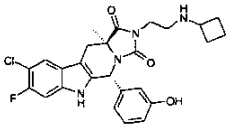
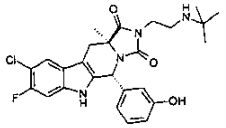
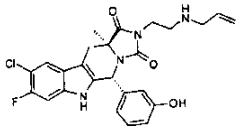
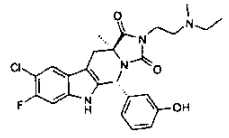
【０４５９】

【表７５】

336	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-(2-ジエチルアミノエチル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			499.1
337	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-メチルアミノエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			457.1
338	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-(2-エチルアミノエチル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			471.2
339	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソプロピルアミノエチル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			485.2
340	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソブチルアミノエチル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			499.2
341	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[2-(シクロプロピルメチルアミノ)-エチル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			497.2

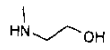
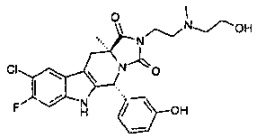
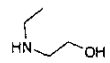
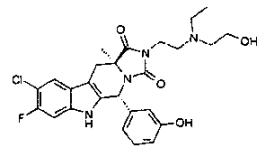
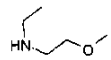
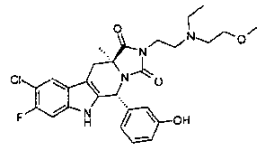
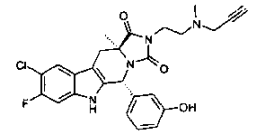
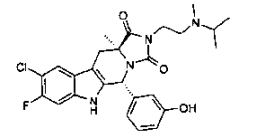
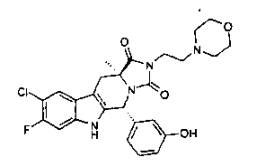
【０４６０】

【表７６】

342	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-2-[2-(2-ヒドロキシエチルアミノ)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			487.2
343	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[2-(2-メトキシエチルアミノ)エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			501.2
344	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-(2-シクロブチルアミノエチル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			497.2
345	(3aSR, 10RS)-2-(2-tert-ブチルアミノエチル)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			499.1
346	(3aSR, 10RS)-2-(2-アリルアミノエチル)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			483.2
347	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[2-(エチルメチルアミノ)エチル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			485.2

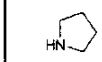
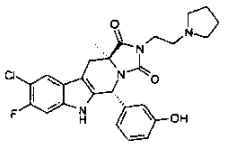
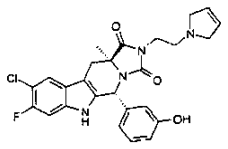
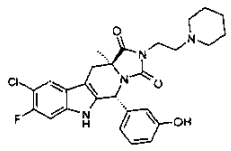
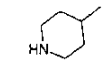
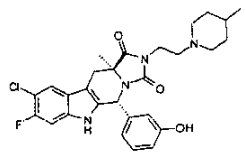
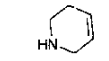
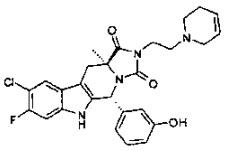
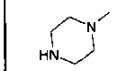
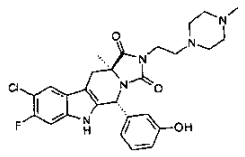
【０４６１】

【表７７】

348	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-2-{2-[(2-ヒドロキシエチル)メチルアミノ]エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			501.2
349	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-{2-[エチル(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]エチル}-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			515.2
350	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-{2-[エチル(2-メトキシエチル)-アミノ]エチル}-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			529.2
351	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[2-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)-エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			495.2
352	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[2-(イソプロピル-メチルアミノ)エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			499.2
353	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-モルホリン-4-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			513.2

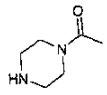
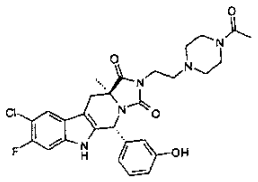
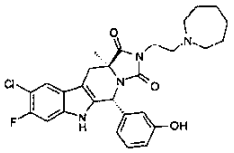
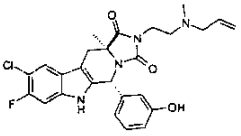
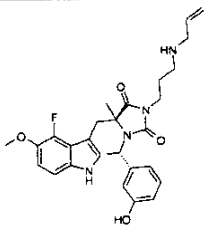
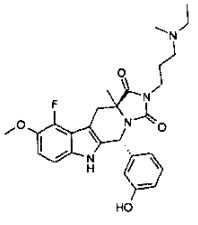
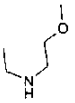
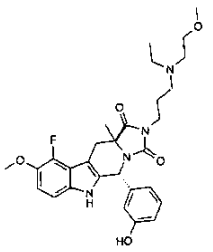
【０４６２】

【表７８】

354	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-ピロリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			497.2
355	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[2-(2, 5-ジヒドロピロール-1-イル)エチル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			495.2
356	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-ピペリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			511.2
357	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[2-(4-メチルピペリジン-1-イル)-エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			525.2
358	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[2-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)エチル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			509.2
359	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			526.2

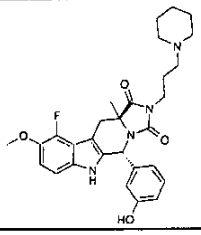
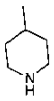
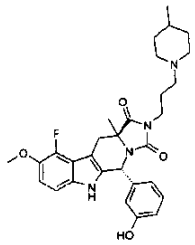
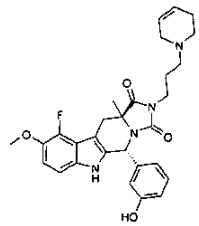
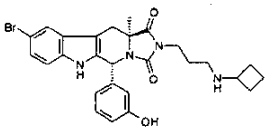
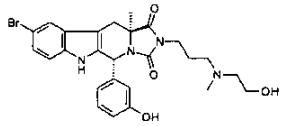
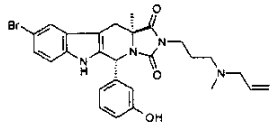
【０４６３】

【表７９】

360	(3aSR, 10RS)-2-[2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-エチル]-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			554.2
361	(3aSR, 10RS)-2-(2-アゼパン-1-イルエチル)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			525.2
362	(3aSR, 10RS)-2-[2-(アリルメチルアミノ)エチル]-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例61			497.2
363	(3aSR, 10RS)-2-(3-アリルアミノプロピル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			493.2
364	(3aSR, 10RS)-2-[3-(エチルメチルアミノ)プロピル]-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			495.2
365	(3aSR, 10RS)-2-(3-[エチル(2-メトキシエチル)アミノ]-プロピル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			539.3

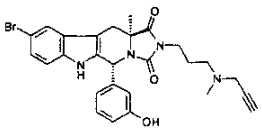
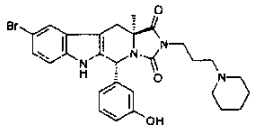
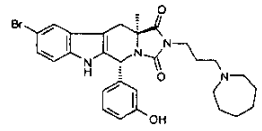
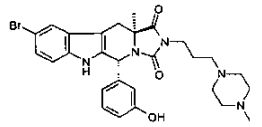
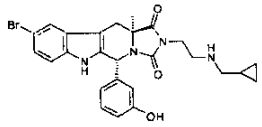
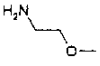
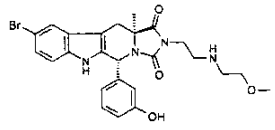
【０４６４】

【表８０】

366	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-ピペリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			521.3
367	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[3-(4-メチルピペリジン-1-イル)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			535.3
368	(3aSR, 10RS)-2-[3-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)プロピル]-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			519.2
369	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-(3-シクロブチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			537.1 539.1
370	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-{3-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			541.1 543.1
371	(3aSR, 10RS)-2-[3-(アリルメチルアミノ)プロピル]-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			537.0 539.1

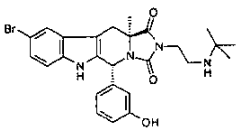
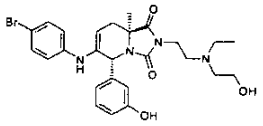
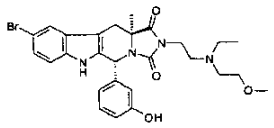
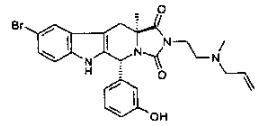
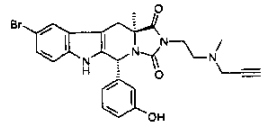
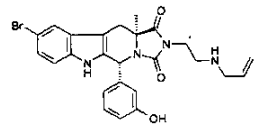
【０４６５】

【表８１】

372	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			535.1 537.0
373	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-ピペリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			551.1 553.2
374	(3aSR, 10RS)-2-(3-アゼパン-1-イルプロピル)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			565.2 567.1
375	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			566.2 568.1
376	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-[2-(シクロプロピルメチルアミノ)-エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			523.1 525.1
377	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[2-(2-メトキシエチルアミノ)-エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			527.1 529.0

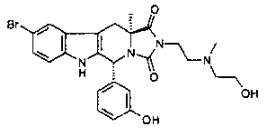
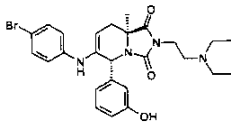
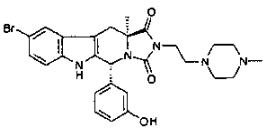
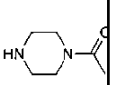
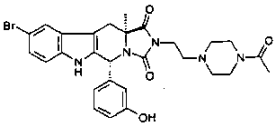
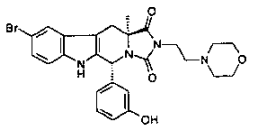
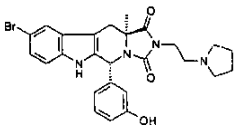
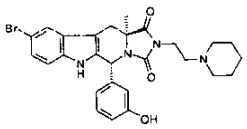
【０４６６】

【表８２】

378	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-(2-tert-ブチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			525.0 527.0
379	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-{2-[エチル(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			541.1 543.1
380	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-{2-[エチル(2-メトキシエチル)-アミノ]エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			555.1 557.1
381	(3aSR, 10RS)-2-(アリル-メチルアミノ)エチル-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			523.1 525.1
382	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[2-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			521.0 523.1
383	(3aSR, 10RS)-2-(アリルアミノエチル)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			509.1 511.0

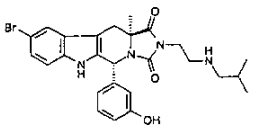
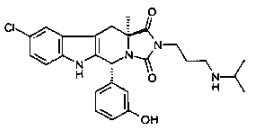
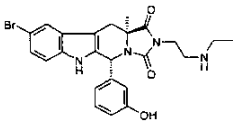
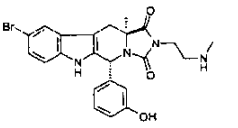
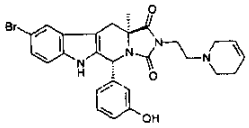
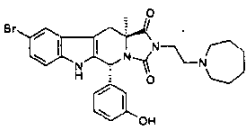
【０４６７】

【表８３】

384	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-{2-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ-[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			527.1 529.0
385	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-(2-ジエチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシエチル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			525.1 527.1
386	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			552.1 554.1
387	(3aSR, 10RS)-2-[2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-エチル]-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ-[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			580.1 582.1
388	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-モルホリン-4-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			529.1 541.1
389	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-ピロリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			523.1 525.1
390	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-ピペリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			537.1 539.1

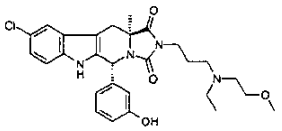
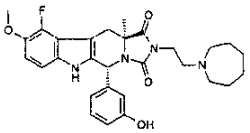
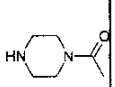
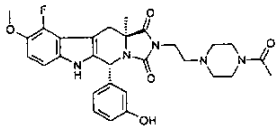
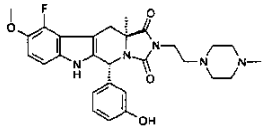
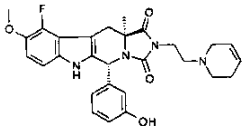
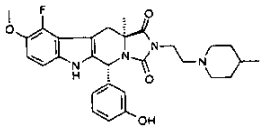
【０４６８】

【表８４】

391	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソブチルアミノエチル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			525.1 527.0
392	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-イソプロピルアミノプロピル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			481.1
393	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-(2-エチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			497.0 499.0
394	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-メチルアミノエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			483.0 484.9
395	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-2-[2-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			535.2 537.1
396	(3aSR, 10RS)-2-(2-アゼパン-1-イルエチル)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			551.2 553.2

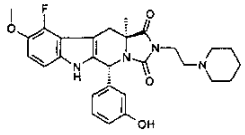
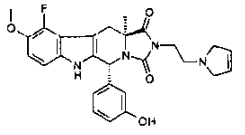
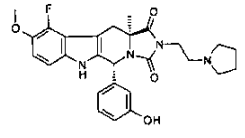
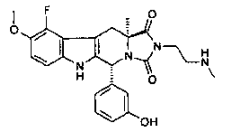
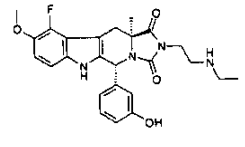
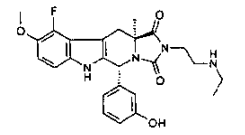
【０４６９】

【表８５】

397	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-{3-[エチル(2-メトキシエチル)-アミノ]プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			525.2
398	(3aSR, 10RS)-2-(2-アゼパン-1-イルエチル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			521.2
399	(3aSR, 10RS)-2-[2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-エチル]-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			550.2
400	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)-エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			522.2
401	(3aSR, 10RS)-2-[2-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)エチル]-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			505.2
402	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[2-(4-メチルピペリジン-1-イル)-エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			521.3

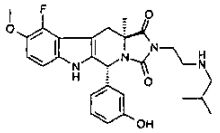
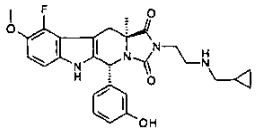
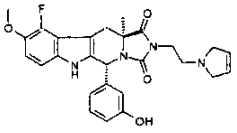
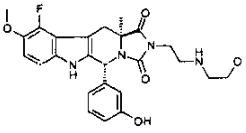
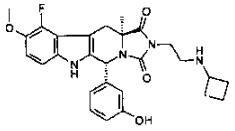
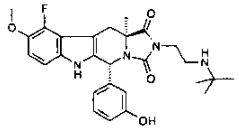
【０４７０】

【表８６】

403	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-ピペリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			507.2
404	(3aSR, 10RS)-2-[2-(2, 5-ジヒドロピロール-1-イル)エチル]-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			491.2
405	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-ピロリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			493.2
406	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-メチルアミノエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			453.2
407	(3aSR, 10RS)-2-(2-エチルアミノエチル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			467.2
408	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソプロピルアミノエチル)-6-メトキシ-3a-メチル--3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			481.2

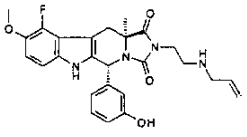
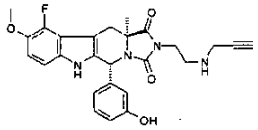
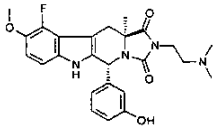
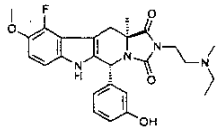
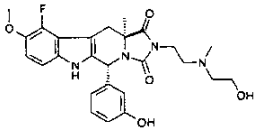
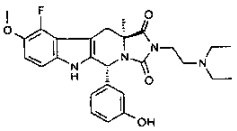
【０４７１】

【表８７】

409	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソプチルアミノエチル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			495.2
410	(3aSR, 10RS)-2-[2-(シクロプロピルメチルアミノ)-エチル]-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			493.2
411	(3aSR, 10RS)-2-[2-(2, 5-ジヒドロピロール-1-イル)エチル]-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			483.2
412	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[2-(2-メトキシ-エチルアミノ)エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			497.2
413	(3aSR, 10RS)-2-(2-シクロプチルアミノエチル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			493.2
414	(3aSR, 10RS)-2-(2-tert-ブチルアミノエチル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			495.1

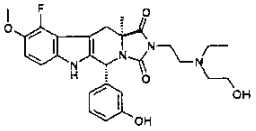
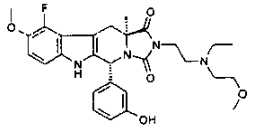
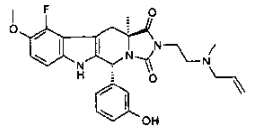
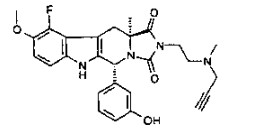
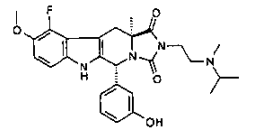
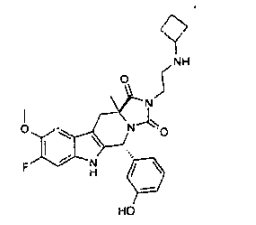
【０４７２】

【表８８】

415	(3aSR, 10RS)-2-(2-アリルアミノエチル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			479.2
416	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-プロパ-2-イニルアミノエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			477.2
417	(3aSR, 10RS)-2-(2-ジメチルアミノエチル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			467.2
418	(3aSR, 10RS)-2-[2-(エチルメチルアミノ)エチル]-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			481.2
419	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-2-{2-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			497.2
420	(3aSR, 10RS)-2-(2-ジエチルアミノエチル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル--3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			495.2

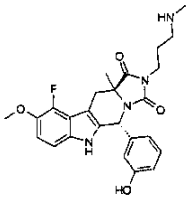
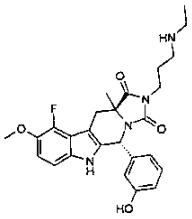
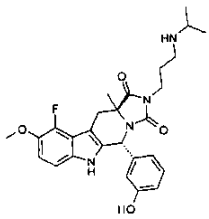
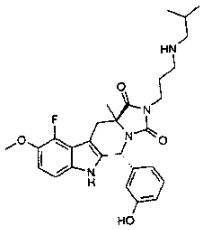
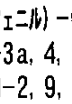
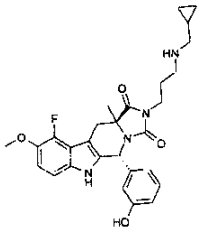
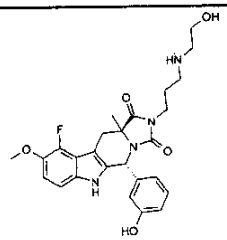
【０４７３】

【表８９】

421	(3aSR, 10RS)-2-{2-[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]-エチル}-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			511.2
422	(3aSR, 10RS)-2-{2-[エチル(2-メトキシエチル)アミノ]-エチル}-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			525.2
423	(3aSR, 10RS)-2-[2-(アリルメチルアミノ)エチル]-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			493.1
424	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[2-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			491.1
425	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[2-(イソプロピルメチルアミノ)-エチル]-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			495.1
426	(3aSR, 10RS)-2-(2-シクロプチルアミノエチル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル--3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例62			493.4

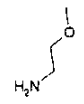
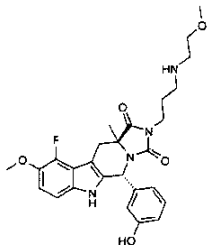
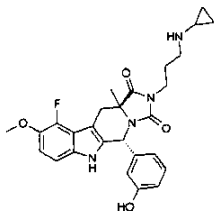
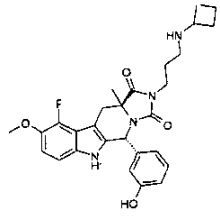
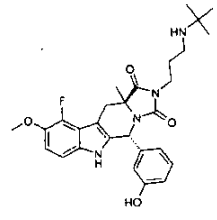
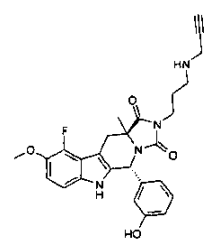
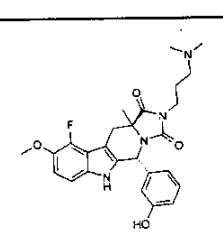
【０４７４】

【表９０】

427	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-メチルアミノプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			467.3
428	(3aSR, 10RS)-2-(3-エチルアミノプロピル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			481.3
429	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-イソプロピルアミノプロピル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			495.3
430	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-イソブチルアミノプロピル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			509.3
431	(3aSR, 10RS)-2-[3-(シクロプロピルメチルアミノ)-プロピル]-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			507.3
432	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-2-[3-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル--3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			497.3

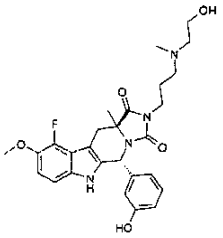
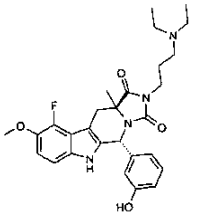
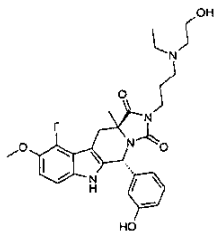
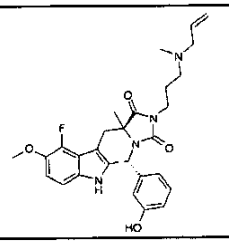
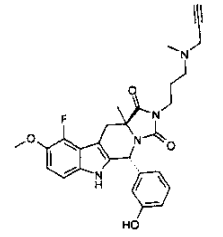
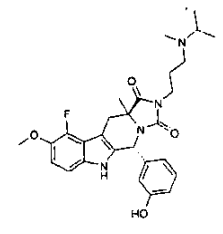
【０４７５】

【表９１】

433	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[3-(2-メトキシエチルアミノ)-プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			511.3
434	(3aSR, 10RS)-2-(3-シクロプロピルアミノプロピル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			493.3
435	(3aSR, 10RS)-2-(3-シクロブチルアミノプロピル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			507.3
436	(3aSR, 10RS)-2-(3-tert-ブチルアミノプロピル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			509.3
437	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-プロパ-2-イニルアミノ-プロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			491.3
438	(3aSR, 10RS)-2-(3-ジメチルアミノプロピル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル--3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			481.3

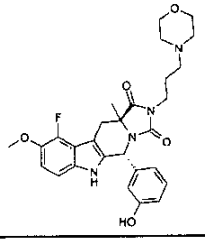
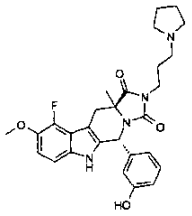
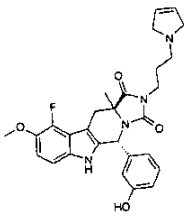
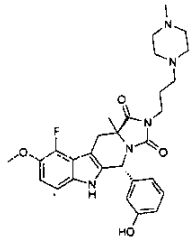
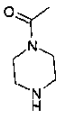
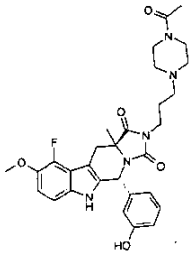
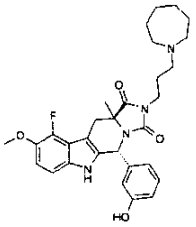
【０４７６】

【表９２】

439	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-2-{3-[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			511.3
440	(3aSR, 10RS)-2-(3-ジエチルアミノプロピル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			509.3
441	(3aSR, 10RS)-2-{3-[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]-プロピル}-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			525.3
442	(3aSR, 10RS)-2-[3-(アリルメチルアミノ)プロピル]-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			507.3
443	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[3-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			505.3
444	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[3-(イソプロピルメチルアミノ)-プロピル]-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			509.3

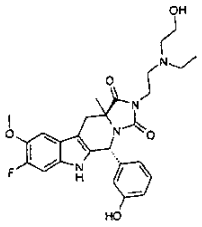
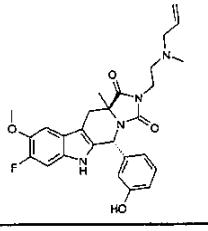
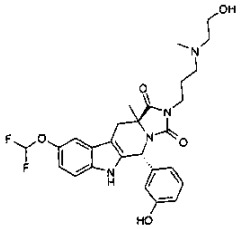
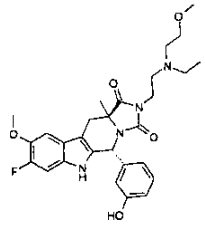
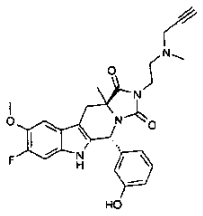
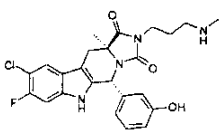
【０４７７】

【表９３】

445	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-モルホリン-4-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			523.3
446	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			507.3
447	(3aSR, 10RS)-2-[3-(2, 5-ジヒドロピロール-1-イル)プロピル]-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			505.3
448	(3aSR, 10RS)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			536.4
449	(3aSR, 10RS)-2-[3-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-プロピル]-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			564.4
450	(3aSR, 10RS)-2-(3-アゼパン-1-イルプロピル)-5-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例65			535.3

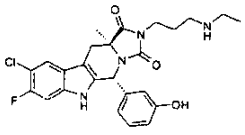
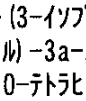
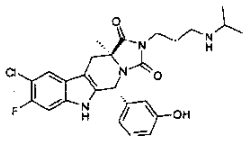
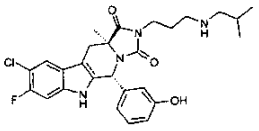
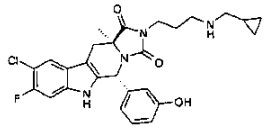
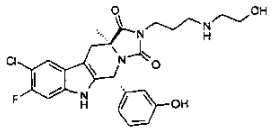
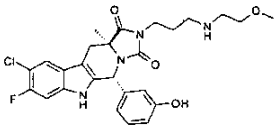
【０４７８】

【表９４】

451	(3aSR, 10RS)-2-{2-[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]エチル}-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			511.3
452	(3aSR, 10RS)-2-[2-(アリルメチルアミノ)エチル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			493.3
453	(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-2-{3-[(2-ヒドロキシエチル)メチルアミノ]-プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			529.1
454	(3aSR, 10RS)-2-{2-[エチル(2-メトキシエチル)アミノ]-エチル}-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			525.1
455	(3aSR, 10RS)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[2-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)-エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザ-シクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			491.1
456	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-メチルアミノプロピル)- -3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ -2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			471.4

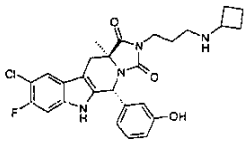
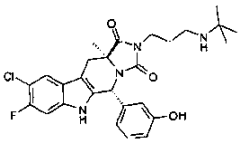
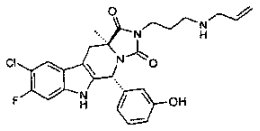
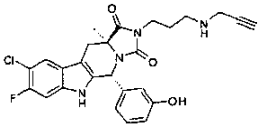
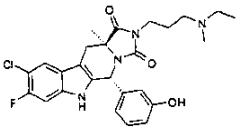
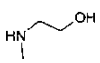
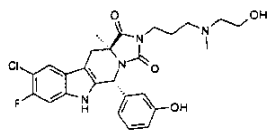
【０４７９】

【表９５】

457	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-(3-エチルアミノプロピル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			511.3
458	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-イソプロピルアミノプロピル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			493.3
459	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-イソブチルアミノプロピル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例56			529.1
460	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[3-(シクロプロピルメチルアミノ)-プロピル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			525.1
461	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-2-[3-(2-ヒドロキシエチルアミノ)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例60			491.1
462	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[3-(2-メトキシエチルアミノ)プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			471.4

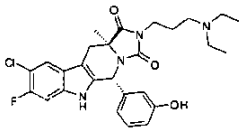
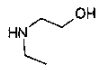
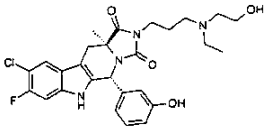
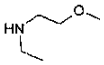
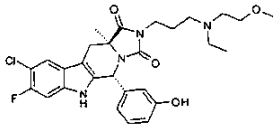
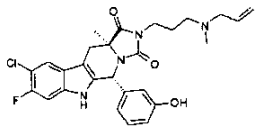
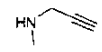
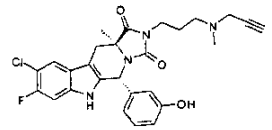
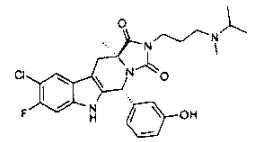
【０４８０】

【表９６】

463	(3aSR, 10RS) -6-クロロ-2-(3-シクロブチルアミノプロピル) -7-フルオロ-10- (3-ヒドロキシフェニル) -3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			511.5
464	(3aSR, 10RS) -2- (3-tert-ブチルアミノプロピル) -6-クロロ-7-フルオロ-10- (3-ヒドロキシフェニル) -3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			513.0
465	(3aSR, 10RS) -2- (3-アリルアミノプロピル) -6-クロロ-7-フルオロ-10- (3-ヒドロキシフェニル) -3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			497.4
466	(3aSR, 10RS) -6-クロロ-7-フルオロ-10- (3-ヒドロキシフェニル) -3a-メチル-2-(3-プロパ-2-イニルアミノプロピル) -3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			495.3
467	(3aSR, 10RS) -6-クロロ-2-[3- (エチルメチルアミノ) プロピル] -7-フルオロ-10- (3-ヒドロキシフェニル) -3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			499.5
468	(3aSR, 10RS) -6-クロロ-7-フルオロ-2- (3-[(2-ヒドロキシエチル) メチルアミノ] -プロピル) -10- (3-ヒドロキシフェニル) -3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			515.4

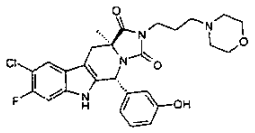
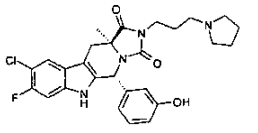
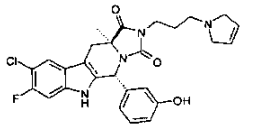
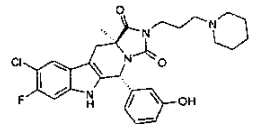
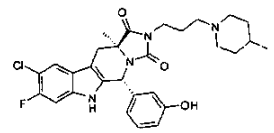
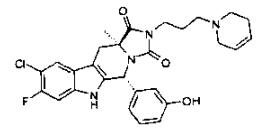
【０４８１】

【表９７】

469	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-(3-ジエチルアミノプロピル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			513.5
470	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-(3-[エチル(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]プロピル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			529.5
471	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-(3-[エチル(2-メトキシエチル)-アミノ]プロピル)-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			543.5
472	(3aSR, 10RS)-2-[3-(アリルメチルアミノ)プロピル]-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			511.5
473	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			509.4
474	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[3-(イソプロピル-メチルアミノ)プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			513.1

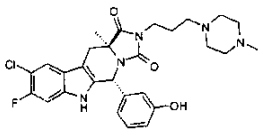
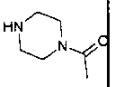
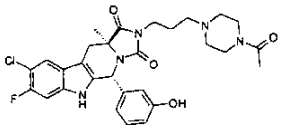
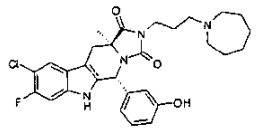
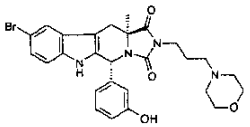
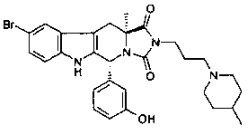
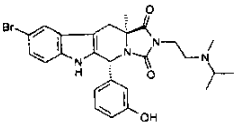
【０４８２】

【表９８】

475	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-モルホリン-4-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			527.5
476	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			511.1
477	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[3-(2, 5-ジヒドロピロール-1-イル)プロピル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			509.4
478	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			525.5
479	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-(4-メチルピペリジン-1-イル)プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			539.6
480	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[3-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)プロピル]-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			523.5

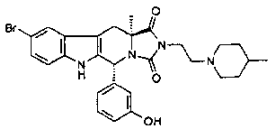
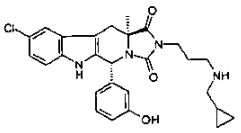
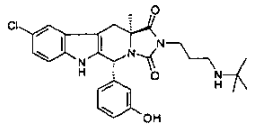
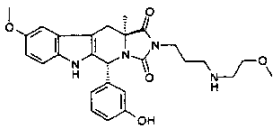
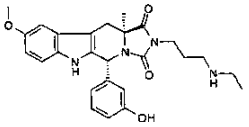
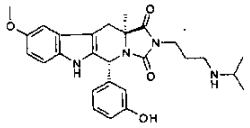
【０４８３】

【表９９】

481	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			540.5
482	(3aSR, 10RS)-2-[3-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-プロピル]-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			568.5
483	(3aSR, 10RS)-2-(3-アゼパン-1-イルプロピル)-6-クロロ-7-フルオロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例64			539.5
484	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-モルホリン-4-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			553.1 555.0
485	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[3-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例58			565.2 567.1
486	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[2-(イソプロピルメチルアミノ)-エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			525.1 527.1

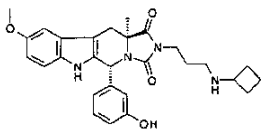
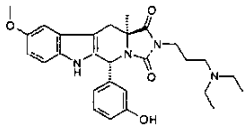
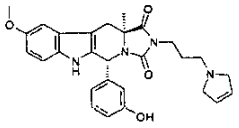
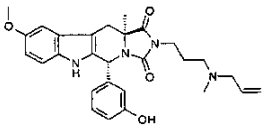
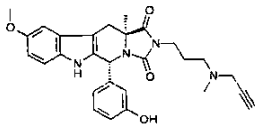
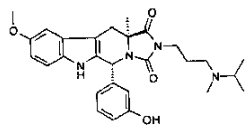
【０４８４】

【表１００】

487	(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-[2-(4-メチルピペリジン-1-イル)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例54			551.1 553.1
488	(3aSR, 10RS)-6-クロロ-2-[3-(シクロプロピルメチルアミノ)-プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			493.1
489	(3aSR, 10RS)-2-(3-tert-ブチルアミノプロピル)-6-クロロ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例57			495.1
490	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[3-(2-メトキシエチルアミノ)-プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			493.1
491	(3aSR, 10RS)-2-(3-エチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			463.1
492	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-イソプロピルアミノプロピル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			477.1

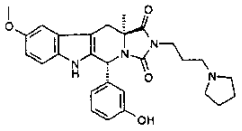
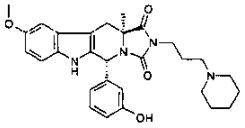
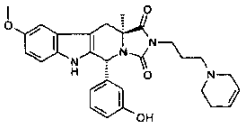
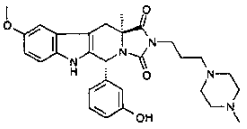
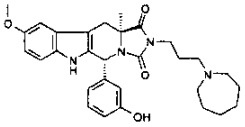
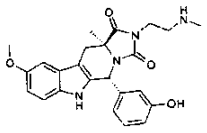
【０４８５】

【表１０１】

493	(3aSR, 10RS)-2-(3-シクロブチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			489.1
494	(3aSR, 10RS)-2-(3-ジエチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			491.1
495	(3aSR, 10RS)-2-[3-(2, 5-ジヒドロピロール-1-イル)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			487.1
496	(3aSR, 10RS)-2-[3-(アリルメチルアミノ)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			489.1
497	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[3-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			487.0
498	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[3-(イソプロピルメチルアミノ)-プロピル]-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			491.2

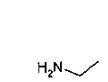
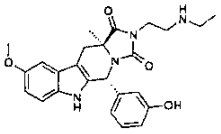
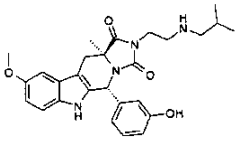
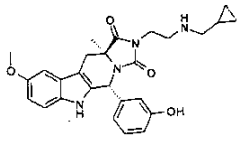
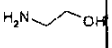
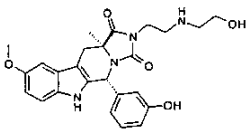
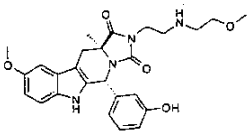
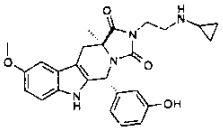
【０４８６】

【表１０２】

499	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			489.1
500	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-ピペリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			503.1
501	(3aSR, 10RS)-2-[3-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			501.1
502	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[3-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-プロピル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			518.1
503	(3aSR, 10RS)-2-(3-アゼパン-1-イルプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			517.2
504	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-メチルアミノ-エチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			435.0

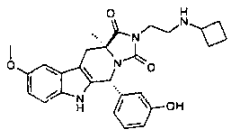
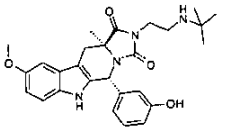
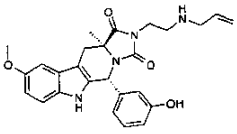
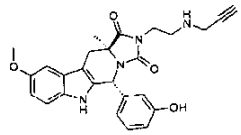
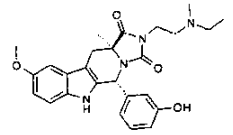
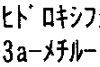
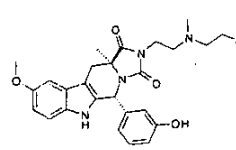
【０４８７】

【表１０３】

505	(3aSR, 10RS)-2-(2-エチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			449.1
506	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソプチルアミノエチル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			477.1
507	(3aSR, 10RS)-2-[2-(シクロプロピルメチルアミノ)-エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			475.1
508	(3aSR, 10RS)-2-[2-(2-ヒドロキシエチルアミノ)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			465.1
509	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[2-(2-メトキシエチルアミノ)-エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			479.1
510	(3aSR, 10RS)-2-(2-シクロプロピルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル--3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			461.0

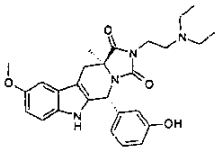
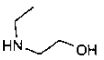
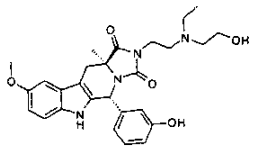
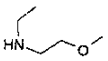
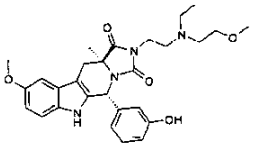
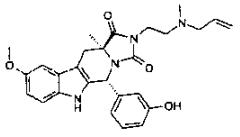
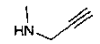
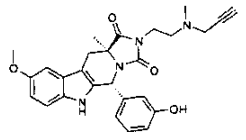
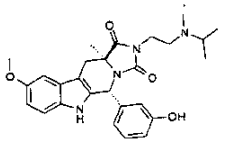
【０４８８】

【表１０４】

511	(3aSR, 10RS)-2-(2-シクロブチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			475.1
512	(3aSR, 10RS)-2-(2-tert-ブチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			477.1
513	(3aSR, 10RS)-2-(2-アリルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			461.1
514	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-プロパ-2-イニルアミノエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			459.0
515	(3aSR, 10RS)-[2-(エチルメチルアミノ)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			463.1
516	(3aSR, 10RS)-2-{2-[(2-ヒドロキシエチル)メチルアミノ]エチル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			479.1

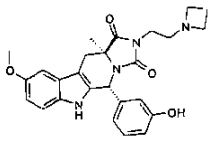
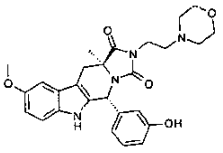
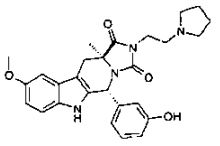
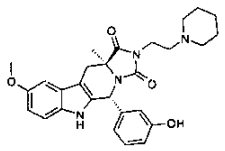
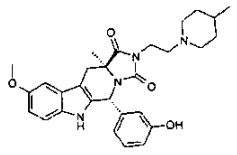
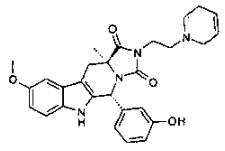
【０４８９】

【表１０５】

517	(3aSR, 10RS)-2-(2-ジエチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			477.2
518	(3aSR, 10RS)-2-(2-[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]-エチル)-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			493.1
519	(3aSR, 10RS)-2-(2-[エチル(2-メトキシエチル)アミノ]-エチル)-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			507.1
520	(3aSR, 10RS)-2-[2-(アリルメチルアミノ)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			475.1
521	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[2-(メチルプロパ-2-イニルアミノ)-エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			473.1
522	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-[2-(イソプロピルメチルアミノ)エチル]-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			477.1

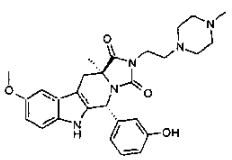
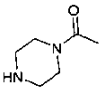
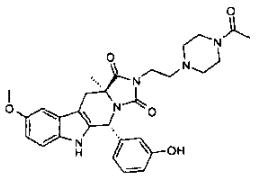
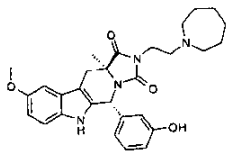
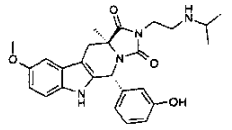
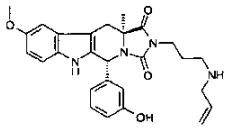
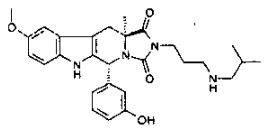
【０４９０】

【表１０６】

523	(3aSR, 10RS)-2-(2-アゼチジン-1-イルエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			461.1
524	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-モルホリン-4-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			491.1
525	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-ピロリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			475.1
526	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-ピペリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			489.1
527	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[2-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)エチル]-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			503.1
528	(3aSR, 10RS)-2-[2-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル)エチル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			487.1

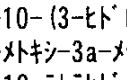
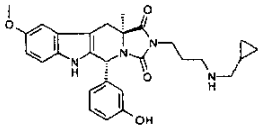
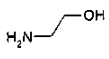
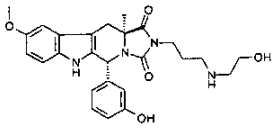
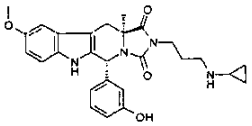
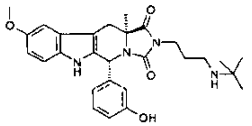
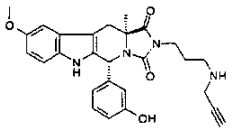
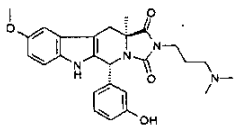
【０４９１】

【表１０７】

529	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エチル]--3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			504.1
530	(3aSR, 10RS)-2-[2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-エチル]-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			532.1
531	(3aSR, 10RS)-2-(2-アゼパン-1-イルエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			503.2
532	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(2-イソプロピルアミノエチル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例24b			463.1
533	(3aSR, 10RS)-2-(3-アリルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			475.1
534	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-2-(3-イソプチルアミノプロピル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			491.2

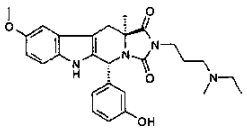
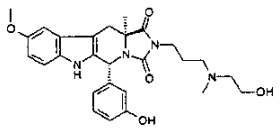
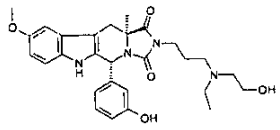
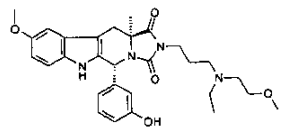
【０４９２】

【表１０８】

535	(3aSR, 10RS)-2-[3-(シクロプロピルメチルアミノ)-プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			489.1
536	(3aSR, 10RS)-2-[3-(2-ヒドロキシエチルアミノ)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			479.1
537	(3aSR, 10RS)-2-(3-シクロプロピルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			475.0
538	(3aSR, 10RS)-2-(3-tert-ブチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			491.1
539	(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-プロパ-2-イニルアミノプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			473.0
540	(3aSR, 10RS)-2-(3-ジメチルアミノプロピル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			463.1

【０４９３】

【表１０９】

541	(3aSR, 10RS)-2-[3-(エチルメチルアミノ)プロピル]-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			477.1
542	(3aSR, 10RS)-2-{3-[(2-ヒドロキシエチル)メチルアミノ]-プロピル}-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			493.1
543	(3aSR, 10RS)-2-{3-[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]-プロピル}-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			507.1
544	(3aSR, 10RS)-2-{3-[エチル(2-メトキシエチル)アミノ]-プロピル}-10-(3-ヒドロキシ-フェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオン	例55a			521.2

【０４９４】

下記の表に与える塩の調製ための一般手順：

100 mgの適当な遊離塩基、1.00当量の対応する酸及び１mlの表示の溶媒の混合物を加熱して還流させる。該溶液を室温まで冷却する。沈澱した塩を濾過し、溶媒で洗浄し、そして40℃にて減圧乾燥する。或る例の化合物は微量の溶媒を含有する。

【０４９５】

【表１１０】

名称	溶媒	m.p. [℃]
(3aSR, 10RS)-2-(2-ジメチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの塩酸塩	メタノール	259-260
(3aSR, 10RS)-2-(2-ジメチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのメタンスルホン酸塩	メタノール	174-175
(3aSR, 10RS)-2-(2-ジメチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのp-トルエンスルホン酸塩	メタノール	274-275
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[2-(2-メトキシエチルアミノ)エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの塩酸塩	ジイソプロピルエーテル	156-162
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[2-(2-メトキシエチルアミノ)エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのリン酸塩	エタノール	186-191
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[2-(2-メトキシエチルアミノ)エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの硫酸塩	ジイソプロピルエーテル	105-109
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[2-(2-メトキシエチルアミノ)エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの酒石酸塩	エタノール	196-198
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[2-(2-メトキシエチルアミノ)エチル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのクエン酸塩	エタノール	181-184
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-ピロリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの塩酸塩	エタノール	291-295
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-ピロリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのリン酸塩	エタノール	172-176
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-ピロリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの硫酸塩	アセトン	> 150 分解
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-ピロリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの酒石酸塩	酢酸エチル	> 120 分解
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(2-ピロリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのクエン酸塩	エタノール	170-174

【０４９６】

【表１１１】

(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの塩酸塩	エタノール	291-294
(3aSR, 10RS)-6-エトキシ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのクエン酸塩	エタノール	176-180
(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの塩酸塩	エタノール	240-244
(3aSR, 10RS)-6-(1, 1-ジフルオロメトキシ)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのクエン酸塩	エタノール	133-137
(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-ピロリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの塩酸塩	エタノール	232-236
(3aSR, 10RS)-6-ブロモ-10-(3-ヒドロキシフェニル)-3a-メチル-2-(2-ピロリジン-1-イルエチル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのクエン酸塩	2-プロパノール	> 119 分解
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの塩酸塩	エタノール	208-212
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのリン酸塩	エタノール	> 110 分解
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの酒石酸塩	エタノール	220-222
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a-メチル-2-(3-ピロリジン-1-イルプロピル)-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのクエン酸塩	2-プロパノール	> 105 分解

【０４９７】

【表１１２】

(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[3-(2-メトキシエチルアミノ)プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの塩酸塩	2-プロパノール	188-192
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[3-(2-メトキシエチルアミノ)プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのリン酸塩	エタノール	179-181
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[3-(2-メトキシエチルアミノ)プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの硫酸塩	酢酸エチル	205-207
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[3-(2-メトキシエチルアミノ)プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの酒石酸塩	エタノール	219-220
(3aSR, 10RS)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-2-[3-(2-メトキシエチルアミノ)プロピル]-3a-メチル-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのクエン酸塩	エタノール	174-177
(3aSR, 10RS)-2-(2-ジメチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのリン酸塩	エタノール	>101 分解
(3aSR, 10RS)-2-(2-ジメチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの硫酸塩	アセトン	90-95
(3aSR, 10RS)-2-(2-ジメチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンの酒石酸塩	エタノール	197-199
(3aSR, 10RS)-2-(2-ジメチルアミノエチル)-10-(3-ヒドロキシフェニル)-6-メトキシ-3a, 4, 9, 10-テトラヒドロ-2, 9, 10a-トリアザシクロペンタ[b]フルオレン-1, 3-ジオンのクエン酸塩	2-プロパノール	>102 分解

【０４９８】

出発化合物

Ａ1．（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル及び（１ＲＳ，３ＲＳ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル

乾燥ジクロロメタン（80 ml，19.5ミリモル）中の（±）－２－アミノ－３－（５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチルプロピオン酸メチルエステル（5.178 g，19.5ミリモル）と３－ヒドロキシベンズアルデヒド（2.85 g，23.4ミリモル，1.2当量）の溶液に、トリフルオロ酢酸（1.5 ml，19.5ミリモル，1当量）を添加し、そして混合物を室温にてアルゴン下で攪拌する。TLCが（±）－２－アミノ－３－（５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチルプロピオン酸メチルエステルの消失を示した時（１日）、少量のメタノールを加えて反応中に沈澱した生成物を溶解させる。次いで混合物をジクロロメタン（750 ml）で希釈し、２Ｍ水性HCl、水性$NaHCO_3$及び水で洗浄し、乾燥し、濃縮する。残渣のカラムクロマトグラフィー（ジクロロメタン－酢酸エチル、9:1→7:1）により、5.22ｇ（73%）の（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル（酢酸エチル－軽油からm.p. 183-184℃）と1.07ｇ（15%）の（１ＲＳ，３ＲＳ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メ

チル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル（酢酸エチル－軽油からm.p. 175-177℃）が得られる。

【０４９９】

NMR実験によると（例えば核オーバーハウザー効果）、Picket-Spengler反応の主生成物は立体配置（１ＲＳ，３ＳＲ）を有するジアスレテオマーである。このジアステレオマーは、立体配置（１ＲＳ，３ＲＳ）を有する副生成物よりも高い保持率（シリカゲル、酢酸エチル－石油エーテル）を有する。

【０５００】

（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの鏡像体分離：

58.4ｇのラセミ体（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルを、下記条件を用いる調製用HPLCによりその鏡像体に分離する：

【０５０１】

カラム：CHIRALPAK AD 20μm, 250×50 mm
移動相：ｎ－ヘプタン／エタノール／ジエチルアミン 60/40/0.1 (v/v/v)
流速：120 ml/分
検出：UV 315 nm
温度：25℃

【０５０２】

29.1ｇの（－）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル｛τ＝6.5分，＞99.5%ee，$[\alpha]^{20}_{D}$＝－53°（ｃ＝0.5200,メタノール）｝及び27.6ｇの（＋）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル｛τ＝12.7分，＞99.0%ee，$[\alpha]^{20}_{D}$＝＋54°（ｃ＝0.5150,メタノール）｝が得られる。

【０５０３】

（＋）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルの絶対立体化学は、（１Ｒ,３Ｓ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルに暫定的に指定される。

【０５０４】

A2. （１ＲＳ，３ＳＲ）－６－エトキシ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル

乾燥ジクロロメタン（40 ml）中の（±）－２－アミノ－３－（５－エトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチルプロピオン酸メチルエステル（829 mg, 3ミリモル）、３－ヒドロキシベンズアルデヒド（439 mg, 3.6ミリモル）及びトリフルオロ酢酸（223μl, 3ミリモル）の混合物をアルゴン下で６時間攪拌する。メタノール（2 ml）を添加して沈澱生成物を溶解させ、混合物をジクロロメタン（150 ml）で希釈する。それを飽和水性$NaHCO_3$（２×50 ml）及び水（２×50 ml）で洗浄し、乾燥し、そして溶媒を減圧留去する。残渣をカラムクロマトグラフィー（ジクロロメタン－酢酸エチル、7:1→4:1）により精製すると、（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－エトキシ－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステルが得られる（1.05 g, 93%）。m.p. 173-175℃（酢酸エチル－ヘキサンから）。

【０５０５】

A3. （１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエト

キシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル及び（１ＲＳ，３ＲＳ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル

乾燥ジクロロメタン（20 ml）中の（±）－２－アミノ－３－〔５－（２－メトキシエトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イル〕－２－メチルプロピオン酸メチルエステル（800 mg，2.60ミリモル）と３－ヒドロキシベンズアルデヒド（383 mg，3.14ミリモル，1.2当量）の溶液に、トリフルオロ酢酸（200μl，2.6ミリモル，1当量）を添加し、そして混合物を室温にてアルゴン下で攪拌する。TLCが出発物質の消失を示した時（１日）、少量のメタノールを加えて沈澱生成物を溶解させる。次いで混合物をCH_2Cl_2（250 ml）で希釈し、２M水性HCl、水性$NaHCO_3$及び水で洗浄し、乾燥し、濃縮する。残渣のカラムクロマトグラフィー（ジクロロメタン－酢酸エチル、7:1→5:1）により、（１ＲＳ，３ＳＲ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル（839 mg，78%）と（１ＲＳ，３ＲＳ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル（152 mg，14%）が得られる。

【０５０６】

Ａ4．（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－クロロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル

適当な出発物質から出発して、化合物Ａ1について記載したの同様にして表題化合物を調製する。m.p.:240-241℃。

【０５０７】

Ａ5．（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－ブロモ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル

適当な出発物質から出発して、化合物Ａ1について記載したの同様にして表題化合物を調製する。m/z (MH^+)＝415.0/417.1。m.p.:240-241℃。

【０５０８】

適当な化合物Ｂ6～Ｂ10から出発して、化合物Ａ1を得るためのものと同様な手順を使って、下記化合物Ａ6～Ａ10を調製することができる。

Ａ6．（１ＲＳ，３ＳＲ）－３－エチル－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル；MS：m/z（MH^+）＝394.9

Ａ7．（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－エトキシ－３－エチル－１－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル

Ａ8．（１ＲＳ，３ＳＲ）－３－エチル－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－（２－メトキシエトキシ）－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸エチルエステル

Ａ9．（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－クロロ－３－エチル－１－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル

Ａ10．（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－ブロモ－３－エチル－１－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル

【０５０９】

Ａ11．（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－シクロプロピルメトキシ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カル

ボン酸メチルエステル
適当な出発物質から出発して、化合物Ａ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。MS：m/z（MH^+）＝406.9。
【０５１０】
Ａ12.　（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル
適当な出発物質から出発して、化合物Ａ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。MS：m/z（MH^+）＝402.9。
【０５１１】
Ａ13.　（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－トリフルオロメトキシ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－３－メチル－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル
適当な出発物質から出発して、化合物Ａ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。
【０５１２】
適当な化合物Ｂ14～Ｂ16から出発して、化合物Ａ1を得るためのものと同様な手順を使って、下記化合物Ａ14～Ａ16を調製することができる。
Ａ14.　（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－シクロプロピルメトキシ－３－エチル－１－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸エチルエステル
Ａ15.　（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－（１，１－ジフルオロメトキシ）－３－エチル－１－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸エチルエステル
Ａ16.　（１ＲＳ，３ＳＲ）－３－エチル－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－トリフルオロメトキシ－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸エチルエステル
【０５１３】
Ａ17.　（１ＲＳ，３ＳＲ）－５－フルオロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル
適当な出発化合物から出発して、化合物Ａ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。m/z（MH^+）＝385.0。
【０５１４】
Ａ18.　（１ＲＳ，３ＳＲ）－７－フルオロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－６－メトキシ－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル
適当な出発化合物から出発して、化合物Ａ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。m/z（MH^+）＝385.0。
【０５１５】
Ａ19.　（１ＲＳ，３ＳＲ）－６－クロロ－７－フルオロ－１－（３－ヒドロキシフェニル）－２，３，４，９－テトラヒドロ－１Ｈ－β－カルボリン－３－カルボン酸メチルエステル
適当な出発化合物から出発して、化合物Ａ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。m/z（MH^+）＝389。
【０５１６】
Ｂ1.　（±）－２－アミノ－３－（５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチルプロピオン酸メチルエステル
メタノール（80mL）中の（±）－３－（５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル（4.26ｇ）の溶液に、湿潤Raney

ニッケル（約12ｇ）を添加し、そして混合物を室温で大気圧にて水素下で一晩攪拌する。セライトを通して固体を濾過し、メタノールで洗浄し、濾液を濃縮する。残渣のカラムクロマトグラフィー（ジクロロメタン－メタノール、98:2→95:5）により、表題化合物が得られる（3.45ｇ，90％）。m.p. 131-132℃（酢酸エチル－軽油から）。

【０５１７】

Ｂ2.　（±）－２－アミノ－３－（５－エトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチルプロピオン酸メチルエステル

乾燥メタノール（50 mL）中の（±）－３－（５－エトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル（5.3ｇ，17.3ミリモル）の溶液に、Raneyニッケルを添加し、そして混合物を室温で大気圧にてH_2下で一晩攪拌する。セライトを通して反応混合物を濾過し、固体をメタノールで洗浄する。濾液を濃縮し、そして残渣をカラムクロマトグラフィー（ジクロロメタン－メタノール、95:5）により精製すると、（±）－２－アミノ－３－（５－エトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチルプロピオン酸メチルエステルが白色固体（4.2ｇ,90％）として得られる。m.p. 165-166℃（酢酸エチル－ヘキサンから）。

【０５１８】

Ｂ3.　（±）－２－アミノ－３－〔５－（２－メトキシエトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イル〕－２－メチルプロピオン酸メチルエステル

乾燥メタノール（200 mL）中の（±）－３－〔５－（２－メトキシエトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イル〕－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル（12.7ｇ，37.8ミリモル）の攪拌溶液に、Raneyニッケル（約20ｇ）を添加し、そして混合物を室温で大気圧にてH_2下で一晩攪拌する。セライトのパッドを通して反応混合物を濾過し、固体をメタノールで洗浄する。濾液を濃縮し、そして残渣をカラムクロマトグラフィー（ジクロロメタン－メタノール、9:1）により精製すると、（±）－２－アミノ－３－〔５－（２－メトキシエトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イル〕－２－メチルプロピオン酸メチルエステルが得られる（5.98 ｇ，52％）。m.p. 117-118℃（酢酸エチル－軽油から）。

【０５１９】

Ｂ4.　（±）－２－アミノ－３－（５－クロロ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチルプロピオン酸メチルエステル

適当な出発化合物から出発して、化合物Ｂ1について記載した手順と同様にして、表題化合物を調製する。m.p.:170℃。

【０５２０】

Ｂ5.　（±）－２－アミノ－３－（５－ブロモ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチルプロピオン酸メチルエステル

適当な出発化合物から出発して、化合物Ｂ1について記載した手順と同様にして、表題化合物を調製する。m/z（MH^+）＝311.0/313.0，m.p.:181℃。

【０５２１】

適当な化合物Ｃ6～Ｃ10から出発して、化合物Ｂ1を得るためのものと同様な手順を使って、下記化合物Ｂ6～Ｂ10を調製することができる：

Ｂ6.　（±）－２－アミノ－２－エチル－３－（５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）プロピオン酸エチルエステル；MS：m/z（MH^+）＝291.0

Ｂ7.　（±）－２－アミノ－３－（５－エトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－エチルプロピオン酸エチルエステル

Ｂ8.　（±）－２－アミノ－２－エチル－３－〔５－（２－メトキシエトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イル〕プロピオン酸エチルエステル

Ｂ9.　（±）－２－アミノ－３－（５－クロロ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－エチルプロピオン酸エチルエステル

Ｂ10.　（±）－２－アミノ－３－（５－ブロモ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－エチルプロピオン酸エチルエステル

【０５２２】
Ｂ11.　（ＲＳ）－２－アミノ－３－（５－シクロプロピルメトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチルプロピオン酸メチルエステル
適当な出発化合物から出発して、化合物Ｂ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。m.p. 172℃（ジクロロメタン－軽油から）。
^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 0.36 (m, 2H ,シクロプロピルCH_2), 0.64 (m, 2H, シクロプロピルCH_2), 1.26 (m, 1H, シクロプロピルCH), 1.44 (s, 3H ,CMe), 2.95及び3.23 (2d ,2H ,CCH_2), 3.61 (s, 3H, OMe), 3.84 (d, 2H, CH_2O), 6.85-7.3 (m, 4H, 芳香族), 7.95 (bs, 1H, NH)。
【０５２３】
Ｂ12.　（ＲＳ）－２－アミノ－３－〔５－（１，１－ジフルオロメトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イル〕－２－メチルプロピオン酸メチルエステル
適当な出発化合物から出発して、化合物Ｂ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。m.p. 140-142℃（酢酸エチル－軽油から）。
^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.46 (s, 3H, CMe), 2.93及び3.30 (2d, 2H , J=14.3 Hz, CH_2), 3.60 (bs, 2H, NH_2) 3.66 (s, 3H, OMe), 6.53 (t, 1H, $J_{H,F}$=75 Hz, CHF_2), 6.95 (dd, 1H, 芳香族), 7.08 (bs, 1H, NH), 7.30 (m, 3H, 芳香族)。^{13}C-NMR ($CDCl_3$): 26.2 (CCH_3), 36.1 (CH_2), 52.2 (OMe), 58.6 (CNH_2), 109.6, 112.1, 115.0, 125.5 (芳香族CHs), 109.9, 128.2, 133.9, 144.9 (第四級芳香族炭素), 168.1 (COOMe)。
【０５２４】
Ｂ13.　（ＲＳ）－２－アミノ－３－（５－トリフルオロメトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチルプロピオン酸メチルエステル
適当な出発化合物から出発して、化合物Ｂ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。
【０５２５】
適当な化合物Ｃ14～Ｃ16から出発して、化合物Ｂ1を得るためのものと同様な手順を使って、下記化合物Ｂ14～Ｂ16を調製することができる：
Ｂ14.　（±）－２－アミノ－３－（５－シクロプロピルメトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－エチルプロピオン酸エチルエステル
Ｂ15.　（±）－２－アミノ－３－〔５－（１，１－ジフルオロメトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イル〕－２－エチルプロピオン酸エチルエステル
Ｂ16.　（±）－２－アミノ－２－エチル－３－（５－トリフルオロメトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）プロピオン酸エチルエステル
【０５２６】
Ｂ17.　（ＲＳ）－２－アミノ－２－（５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イルメチル）－３－メチル酪酸エチルエステル
適当な出発化合物から出発して、化合物Ｂ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。MS：m/z (MH^+)＝305.0。
【０５２７】
Ｂ18.　（ＲＳ）－２－アミノ－３－（４－フルオロ－５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチルプロピオン酸メチルエステル
適当な出発化合物から出発して、化合物Ｂ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。MS：m/z (MH^+)＝264。
【０５２８】
Ｂ19.　（ＲＳ）－２－アミノ－３－（６－フルオロ－５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチルプロピオン酸メチルエステル
適当な出発化合物から出発して、化合物Ｂ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。MS：m/z (MH^+)＝264。
【０５２９】
Ｂ20.　（ＲＳ）－２－アミノ－３－（５－クロロ－６－フルオロ－１Ｈ－インドール－

３－イル）－２－メチルプロピオン酸メチルエステル
適当な出発化合物から出発して、化合物Ｂ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。MS：m/z (MH^+)＝284.8。
【０５３０】
Ｃ1.　（±）－３－（５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル
トルエン（50ml）とＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（２ml）の混合物中の市販の５－メトキシグラミン（6.24ｇ）と市販の２－ニトロプロピオン酸メチル（4.07ｇ）の溶液を、反応混合物にアルゴンを通気しながら１日間還流させる。溶媒を蒸発させ、残渣をジクロロメタン（300 ml）中に取り、2 Ｍ水性HCl、2 Ｍ水性NaOH及び水で順次洗浄し、乾燥し、濃縮する。残渣のカラムクロマトグラフィー（トルエン－アセトン、98:2→95:5）により、表題化合物が得られる（3.42ｇ，38％）。m.p. 109-110℃（酢酸エチル－石油から）。
【０５３１】
Ｃ2.　（±）－３－（５－エトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル
乾燥トルエン（17 ml）中の（５－エトキシ－１Ｈ－インドール－イルメチル）ジメチルアミン（2.18ｇ，10ミリモル）と市販の２－ニトロプロピオン酸メチル（1.60ｇ，12ミリモル，1.2当量）の混合物を還流させる。TLC（トルエン－アセトン、9:1）が出発物質の欠失をしめした時、混合物を冷却し、クロロホルム（35 ml）で希釈する。それを10％水性HCｌ（２×10 ml）、水（10 ml）、５％水性NaOH（２×10 ml）、水（10 ml）及び20％水性Na_2SO_4（10 ml）で順次洗浄し、乾燥し、そして溶媒を減圧留去する。残渣をカラムクロマトグラフィー（軽油－酢酸エチル、4:1→7:3）により精製すると、白色固体として（±）－３－（５－エトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル（2.07ｇ、68％）。m.p. 80-82℃（酢酸エチル－ヘキサンから）。
【０５３２】
Ｃ3.　（±）－３－〔５－（２－メトキシエトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イル〕－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル
トルエン（100 ml）とＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（50 ml）の混合物中の〔５－（２－メトキシエトキシ）－１Ｈ－インドール－イルメチル〕ジメチルアミン（15.2ｇ，61.4ミリモル）の溶液に、２－ニトロプロピオン酸メチル（8.5ｇ、63.9ミリモル）を添加する。溶液に急速なアルゴン流を通気しながら、混合物を２日間攪拌しながら還流させる。溶媒を蒸発させ、残渣をジクロロメタン（600 ml）中に取り、２Ｍ塩酸、２Ｍ水性NaOH及び水で順次洗浄し、乾燥し、そして蒸発させる。残渣をカラムクロマトグラフィー（トルエン－アセトン、9:1）により精製すると、（±）－３－〔５－（２－メトキシエトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イル〕－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル（9.34ｇ、45％）が得られる。
【０５３３】
Ｃ4.　（±）－３－（５－クロロ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル
適当な出発化合物から出発して、化合物Ｃ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。
【０５３４】
Ｃ5.　（±）－３－（５－ブロモ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル
適当な出発化合物から出発して、化合物Ｃ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。
【０５３５】
２－ニトロ酪酸エチルから出発しそして反応相手として適当なアミン化合物Ｄ1～Ｄ5の

選択を伴って、化合物Ｃ1を得るのと同様な手順を使って、下記化合物Ｃ6～Ｃ10を調製することができる。

Ｃ6.　（±）－２－エチル－３－（５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－ニトロプロピオン酸エチルエステル；MS：m/z (MH^+)＝320.2

Ｃ7.　（±）－３－（５－エトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－エチル－２－ニトロプロピオン酸エチルエステル

Ｃ8.　（±）－２－エチル－３－〔５－（２－メトキシエトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イル〕－２－ニトロプロピオン酸エチルエステル

Ｃ9.　（±）－３－（５－クロロ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－エチル－２－ニトロプロピオン酸エチルエステル

Ｃ10.　（±）－３－（５－ブロモ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－エチル－２－ニトロプロピオン酸エチルエステル

【０５３６】

Ｃ11.　（ＲＳ）－３－（５－シクロプロピルメトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル

化合物Ｄ6から出発して、化合物Ｃ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 0.39 (m, 2H ,シクロプロピルCH_2), 0.68 (m, 2H, シクロプロピルCH_2), 1.32 (m, 1H, シクロプロピルCH), 1.74 (s, 3H ,CMe), 3.59及び3.81 (2d ,2H ,CCH_2), 3.82 (s, 3H, OMe), 3.82-3.87 (m, 2H, CH_2O), 6.86-7.3 (m, 4H, 芳香族), 8.06 (bs, 1H, NH)。

【０５３７】

Ｃ12.　（ＲＳ）－３－〔５－（１，１－ジフルオロメトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イル〕－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル

化合物Ｄ7から出発して、化合物Ｃ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.73 (s, 3H, CMe), 3.57及び3.75 (2d, 2H , J=15 Hz, CH_2), 3.76 (s, 3H, OMe), 6.49 (t, 1H, $J_{H,F}$=75 Hz, CHF_2), 6.92-7.36 (m, 3H, 芳香族), 8.42 (bs, 1H, NH)。^{13}C-NMR ($CDCl_3$): 21.3 (CCH_3), 32.2 (CH_2), 53.5 (OMe), 93.6 (CNO_2), 109.4, 112.3, 115.6, 126.2 (芳香族CHs), 107.4, 128.3, 133.6, 145.2 (第四級芳香族炭素), 168.1 (COOMe)。

【０５３８】

Ｃ13.　（ＲＳ）－３－（５－トリフルオロメトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル

化合物Ｄ8から出発して、化合物Ｃ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。

【０５３９】

２－ニトロ酪酸エチルから出発しそして反応相手として適当なアミン化合物Ｄ6～Ｄ8を選択して、化合物Ｃ1を得るのと同様な手順を使って、下記化合物Ｃ14～Ｃ16を調製することができる。

Ｃ14.　（±）－３－（５－シクロプロピルメトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－エチル－２－ニトロプロピオン酸エチルエステル

Ｃ15.　（±）－３－〔５－（１，１－ジフルオロメトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イル〕－２－エチル－２－ニトロプロピオン酸エチルエステル

Ｃ16.　（±）－２－エチル－２－ニトロ－３－（５－トリフルオロメトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）プロピオン酸エチルエステル

【０５４０】

Ｃ17.　（ＲＳ）－２－（５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イルメチル）－３－メチル－２－ニトロ酪酸エチルエステル

３－メチル－２－ニトロ酪酸エチルエステルと化合物Ｄ1から出発して、化合物Ｃ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。この場合、反応混合物に１当量の

炭酸水素カリウムを添加する。MS：m/z (MH^+)＝334.9。

【０５４１】

Ｃ18.　（ＲＳ）－３－（４－フルオロ－５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸エチルエステル

適当な出発化合物から出発して、化合物Ｃ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。m/z (MH^+)＝310.7。

【０５４２】

Ｃ19.　（ＲＳ）－３－（６－フルオロ－５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル

適当な出発化合物から出発して、化合物Ｃ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。m/z (MH^+)＝310.6。

【０５４３】

Ｃ20.　（ＲＳ）－３－（６－クロロ－５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イル）－２－メチル－２－ニトロプロピオン酸メチルエステル

適当な出発化合物から出発して、化合物Ｃ1について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。m/z (MH^+)＝313.2。

【０５４４】

Ｄ1.　（５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イルメチル）ジメチルアミン

表題化合物（５－メトキシグラミン）は市販されている。

【０５４５】

Ｄ2.　（５－エトキシ－１Ｈ－インドール－３－イルメチル）ジメチルアミン

５－エトキシインドール（7.84 g，48.7ミリモル）、40％水性ジメチルアミン（9.25 ml，73ミリモル，1.5当量）及び96％酢酸（30 ml）の混合物を０℃で攪拌し、次いで36％水性ホルムアルデヒド溶液（6.33 ml，82.7ミリモル，1.7当量）を滴下添加する。混合物を室温に戻し、そして一晩攪拌後、TLC（ジクロロメタン－メタノール、4:1）は出発物質が存在しないことを示す。10％水性NaOH（150 ml）を添加し、混合物を室温で２ｈ攪拌する。次いでそれをジクロロメタン（４×200 ml）で抽出し、有機相を乾燥し、濃縮する。残渣をカラムクロマトグラフィー（ジクロロメタン－メタノール 4:1→メタノール－水性アンモニア 50:1）により精製して粗生成物（10.18 g，96％）を与え、それをアセトンから結晶化すると、白色結晶として純粋な（５－エトキシ－１Ｈ－インドール－３－イルメチル）ジメチルアミン（10.2 g，96％）が得られる。m.p. 95-97℃。

【０５４６】

Ｄ3.　〔５－（２－メトキシエトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イルメチル〕ジメチルアミン

酢酸（7 ml）と40％水性ジメチルアミン（2.1 ml）中の５－（２－メトキシエトキシ）インドール（2.06 g，11.0ミリモル）の溶液を０℃に冷却し、そして36％水性ホルムアルデヒド溶液（1.38 ml，０℃に予冷したもの）を滴下添加する。混合物を室温で一晩攪拌後、２Ｍ塩酸を添加し、そして混合物をジクロロメタンで洗浄する。水性相を10％NaOHでアルカリ性にし、ジクロロメタンで抽出する。合わせた有機相を水で洗浄し、乾燥し、濃縮する。残渣をカラムクロマトグラフィー（ジクロロメタン－メタノール 4:1→ジクロロメタン－メタノール－水－水性アンモニア 10:20:1:1）により精製すると、〔５－（２－メトキシエトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イルメチル〕ジメチルアミン（2.42 g，90％）が得られる。m.p. 163-164℃（トルエン／Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミドから）。

【０５４７】

Ｄ4.　（５－クロロ－１Ｈ－インドール－３－イルメチル）ジメチルアミン

適当な出発化合物から出発して、化合物Ｄ2又はＤ3について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。m.p. 127-130℃。

【０５４８】

Ｄ5.　（５－ブロモ－１Ｈ－インドール－３－イルメチル）ジメチルアミン

適当な出発化合物から出発して、化合物Ｄ2又はＤ3について記載した手順と同様にして

表題化合物を調製する。m.p. 139℃。

【０５４９】

D6.　（５－シクロプロピルメトキシ－１Ｈ－インドール－３－イルメチル）ジメチルアミン

適当な出発化合物から出発して、化合物Ｄ2又はD3について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 0.36 (m, 2H, シクロプロピルCH_2), 0.64 (m, 2H, シクロプロピルCH_2), 1.26 (m, 1H, シクロプロピルCH), 2.34 (s, 6H, 2 NMe_2), 3.8 (m, 2H, CH_2O), 6.8-7.4 (m, 4H, 芳香族), 8.84 (bs, 1H, NH)。

【０５５０】

D7.　〔５－（１，１－ジフルオロメトキシ）－１Ｈ－インドール－３－イルメチル〕ジメチルアミン

適当な出発化合物から出発して、化合物Ｄ2又はD3について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。^{1}H-NMR ($CDCl_3$＋CD_3OD) : 2.30 (s, 6H, NMe_2), 3.66 (s, 2H, CH_2), 6.53 (t, 1H, $J_{H,F}$＝75 Hz, CHF_2), 6.95 (dd, 1H, 芳香族), 7.2-7.4 (m, 3H, 芳香族)。^{13}C-NMR ($CDCl_3$): 44.4 (NMe_2), 53.6 (CH_2), 109.2, 109.7, 112.1, 114.8, 126.6, 128.1, 133.9, 145.0 (芳香族)。

【０５５１】

D8.　（５－トリフルオロメトキシ－１Ｈ－インドール－３－イルメチル）ジメチルアミン

適当な出発化合物から出発して、化合物Ｄ2又はD3について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。

【０５５２】

D9.　（４－フルオロ－５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イルメチル）ジメチルアミン

適当な出発化合物から出発して、化合物Ｄ2又はD3について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。m/z (MH^+)＝222.8。

【０５５３】

D10.　（６－フルオロ－５－メトキシ－１Ｈ－インドール－３－イルメチル）ジメチルアミン

適当な出発化合物から出発して、化合物Ｄ2又はD3について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。m/z (MH^+)＝222.6。

【０５５４】

D11.　（５－クロロ－５－フルオロ－１Ｈ－インドール－３－イルメチル）ジメチルアミン

適当な出発化合物から出発して、化合物Ｄ2又はD3について記載した手順と同様にして表題化合物を調製する。m/z (MH^+)＝226.8。

【０５５５】

E1.　５－エトキシインドール

市販の５－ヒドロキシインドール（18 g, 13.5ミリモル）、水性K_2CO_3（93.5 g, 5当量）及びヨードエタン（40.5 ml, 3.75当量）の混合物をアルゴン下で50℃にて攪拌する。TLC（ジクロロメタン－メタノール, 95:5）が５－ヒドロキシインドールの消失を示した時（４日目）、混合物を濾過し、固体をアセトンで洗浄し、次いで濾液を濃縮すると17.67 g（90%）の表題化合物を与え、これは次の段階に使用するのに十分な位純粋である。m.p. 144-146℃（エタノールから）。

【０５５６】

E2.　５－（２－メトキシエトキシ）－１Ｈ－インドール

250 mlの乾燥アセトン中の５－ヒドロキシインドール（15.2 g, 114ミリモル）の溶液に、ヨウ化２－メトキシエチル（15 ml, 141ミリモル, 1.25当量）及び水性K_2CO_3（46.7 g, 338ミリモル, 3当量）を添加し、その混合物を還流させる。追加量の0.5当量のヨウ化２－メトキシエチルとK_2CO_3を毎日添加する。６日後、TLC（トルエン－アセトン, 9:1）

は出発物質の消失を示す。固体を濾過により除去し、溶媒を蒸発させる。残渣をジクロロメタン（800 ml）中に取り、該溶液を２Ｍ水性HCl、10％水性$NaHCO_3$及び水で洗浄する。有機相を乾燥しそして濃縮する。カラムクロマトグラフィー（トルエン－アセトン、9:1）の結果、５－（２－メトキシエトキシ）－１Ｈ－インドール（18.8 g，86％）が得られる。m.p. 58-60℃（酢酸エチル－軽油から）。

【０５５７】

Ｅ3.　５－クロロ－１Ｈ－インドール

表題化合物は市販されている。

Ｅ4.　５－ブロモ－１Ｈ－インドール

表題化合物は市販されている。

【０５５８】

Ｅ5.　５－シクロプロピルメトキシ－１Ｈ－インドール

130 mlの乾燥アセトン中の7.3 gの５－ヒドロキシインドールの溶液に、10.5 mlのブロモメチルシクロプロパンと22.7 gの水性炭酸カリウムを添加する。その混合物を24時間加熱して還流させ、そして追加量の5 mlのブロモメチルシクロプロパンを添加する。混合物を加熱して更に４日間還流させる。それを濾過し、溶媒を減圧留去する。残渣をジクロロメタン中に溶かし、水性塩酸（２Ｍ）、10％水性$NaHCO_3$及び水で洗浄する。有機相を乾燥し、溶媒を減圧留去する。カラムクロマトグラフィー（シリカゲル；トルエン－アセトン 95:5）による精製後、9.62 g（94％）の表題化合物が油状物として得られる。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 0.36 (m, 2H, シクロプロピルCH_2), 0.64 (m, 2H, シクロプロピルCH_2), 1.30 (m, 1H, シクロプロピルCH), 3.83 (d, 2H, J=7.0 Hz, CH_2O), 6.45 (s, 1H, 芳香族), 6.90 (dd, 1H, 芳香族), 7.09-7.27 (m, 3H, 芳香族), 8.05 (bs, 1H, NH)。

^{13}C-NMR ($CDCl_3$): 3.1 (2 シクロプロピルCH_2), 10.4 (シクロプロピルCH), 74.2 (CH_2O), 101.2, 101.6, 104.0, 104.6, 149.8 (芳香族)。

【０５５９】

Ｅ6.　５－（１，１－ジフルオロメトキシ）－１Ｈ－インドール

70 mlのジオキサンと20 mlの水酸化ナトリウム水溶液(50％)の混合物中の6.65 gの５－ヒドロキシインドールと3.69 gのヨウ化テトラブチルアンモニウムの氷冷溶液に、クロロジフルオロメタンを通気する。TLCが出発物質の欠失を示した後、500 mlのジクロロメタンを加える。混合物を水で洗浄する。有機相を乾燥し、溶媒を減圧留去する。カラムクロマトグラフィー（シリカゲル；トルエン－アセトン 99:1）による精製後、2.19 g（24％）の表題化合物が無色液体として得られる。MS:[M+H]: 184.1, [M-H]: 182.0。

^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 6.48 (t, 1H, $J_{H,F}$＝75 Hz, CHF_2), 6.52 (m, 1H, 芳香族), 6.98 (dd, 1H, 芳香族), 7.2-7.4 (m, 3H, 芳香族)。^{13}C-NMR ($CDCl_3$): 103.0, 111.5, 111.9, 115.4, 117.1, 122.2, 126.0, 128.4, 133.6 (芳香族炭素)。

【０５６０】

Ｅ7.　５－トリフルオロメトキシ－１Ｈ－インドール

表題化合物は５－ヒドロキシ－１Ｈ－インドールからトリフルオロメチル化反応により得ることができる。

【０５６１】

Ｅ8.　６－フルオロ－５－メトキシ－１Ｈ－インドール、及び

Ｅ9.　４－フルオロ－５－メトキシ－１Ｈ－インドール

両表題化合物とも、４－フルオロ－５－メトキシインドールと６－フルオロ－５－メトキシインドールの調製についてWO 2003/064413（91ｆ頁）に記載された手順と同様にして混合物として調製される。この場合には、レギオ異性中間体（４－フルオロ－５－メトキシ－２－ニトロフェニル）アセトニトリルと（２－フルオロ－３－メトキシ－６－ニトロフェニル）アセトニトリルは、２－プロパノールからの（４－フルオロ－５－メトキシ－２－ニトロフェニル）アセトニトリル（m/z [MH^+]＝166.1）の結晶化と、前記結晶化の母液を使ったその後のトルエンからの（２－フルオロ－３－メトキシ－６－ニトロフェニル）アセトニトリル（m/z [MH^+]＝166.1）の結晶化の順序により、分離される。

【０５６２】
Ｅ10.　５－クロロ－６－フルオロ－１Ｈ－インドール
30 mlのアセトニトリル中の12.4ｇの１－アセチル－６－フルオロ－１Ｈ－インドール－２－スルホン酸ナトリウムの懸濁液に、7.1 gのＮ－クロルスクシンイミドを添加する。混合物を室温で２時間攪拌し、次いで110℃に加熱する。450 mlの水酸化ナトリウム水溶液（１Ｍ）を添加する。該溶液を110℃で１時間攪拌し、０℃に冷却する。有機相を分離し、溶媒を留去する。カラムクロマトグラフィー（ヘプタン／メチルtert－ブチルエーテル）による残渣の精製後、7.82ｇ（39％）の表題化合物が得られる。m/z $[M-H^+]^-$＝168.0。
【０５６３】
Ｆ1.　ヨウ化２－メトキシエチル
粗製２－メトキシエチルトシレートを1600 mlのアセトン中に溶かし、そこにNaI（300 g，2モル，2当量）を加える。混合物を加熱して還流させ、反応の進行をTLC（トルエン－アセトン、9：1）によりモニタリングする。３時間後、混合物を室温に冷却し、固体を濾過により除去する。溶媒を蒸発させ、残渣をジクロロメタン（700 ml）中に取り、10％水性$Na_2S_2O_3$と水で洗浄する。有機相を乾燥し、溶媒を蒸発させる。残渣を減圧蒸留すると108ｇ（58％）のヨウ化２－メトキシエチルが得られる。30ミリバールでのb.p. 34-36℃。
【０５６４】
Ｇ1.　トルエン－４－スルホン酸２－メトキシエチルエステル
ｐ－トルエンスルホニルクロリド（205 g，1.08モル）とピリジン（150 mL）のスラリーをアルゴン雰囲気下で攪拌する。温度を５℃以下に維持しながら（氷浴）、エチレングリコールモノメチルエーテル（80 ml，1モル）を滴下漏斗からゆっくり添加する。混合物を氷水（１L）中に注ぎ、ジクロロメタン（1.2 L）で抽出する。有機相を氷冷6 M HCl（３×350 ml）で洗浄し、真空蒸発により最少量にまで濃縮する。
【０５６５】
Ｈ1.　３－メチル－２－ニトロ酪酸エチルエステル
70 mlのジメチルホルムアミド中の5.31 gの亜硝酸ナトリウムと8 gの乾燥フロログリシノールの氷冷溶液に、30 mlのジメチルホルムアミド中の11.3 gの２－ヨード－３－メチル酪酸エチルエステルの溶液を添加する。生じた溶液を室温に温め、一晩攪拌する。溶媒を減圧留去する。残渣を酢酸エチル中に溶かし、水で洗浄する。有機相を乾燥し、溶媒を除去する。表題化合物が油状物として得られる。MS：m/z (M^+)＝176.1。
【０５６６】
Ｉ1.　２－ヨード－３－メチル酪酸エチルエステル
150 mlのアセトン中の10 gの市販の２－ブロモイソ吉草酸エチルエステルと17.8ｇのヨウ化ナトリウムの混合物を加熱して一晩還流させる。溶媒を減圧留去する。残渣にジクロロメタンを添加し、溶液をチオ硫酸ナトリウム水溶液（10％）とブラインで洗浄する。有機相を乾燥し、溶媒を減圧留去する。11.34 ｇ（93％）の表題化合物が黄色油状物として得られる。MS：m/z (M^+)＝255.9。
【０５６７】
Ｊ1.　１－アセチル－６－フルオロ－１Ｈ－インドール－２－スルホン酸ナトリウム
14.0 gの６－フルオロ－１Ｈ－インドール－２－スルホン酸と87 mlの無水酢酸の混合物を70℃で20分間攪拌する。35 mlの追加の無水酢酸を添加し、温度を70℃に15分間維持する。追加の46 mlの無水酢酸を加え、温度を110℃に上げる。１時間後、次の90分間温度を90℃に下げる。室温に冷却した後、180 mlのジエチルエーテルを添加する。沈澱を濾過し、減圧乾燥する。12.5ｇ（76％）の表題化合物が無色固体として得られる。MS：m/z $(M-H^+)^-$＝258。
【０５６８】
Ｋ1.　６－フルオロ－１Ｈ－インドール－２－スルホン酸ナトリウム
80 mlの水中の23.4 gの亜硫酸水素ナトリウムの溶液に、エタノール中の13.5ｇの６－フルオロインドールの溶液を滴下添加する。得られた懸濁液を室温で一晩攪拌する。沈澱

を濾過し、氷水、冷エタノール及びジエチルエーテルで洗浄する。7.0 g（29%）の表題化合物が無色固体として得られる。

【０５６９】

産業上利用性

本発明に係る化合物は、それらを産業上利用可能にする有効な薬理学的性質を有する。例えば、本発明に係る化合物は有糸分裂キネシンEg5の阻害剤として作用することができるので、これらの化合物は前記キネシンの阻害に応答性である疾病、例えば下記に挙げる疾病の治療において産業上利用可能であると期待される。また、例えば、本発明化合物は、細胞周期依存性、抗増殖性及び／又はアポトーシス誘導性活性を示すことができる。

【０５７０】

有糸分裂キネシンEg5は、双極性紡錘体の重合と機能にとって必須の酵素である。Eg5は、有糸分裂の様々な段階にわたり必須の役割を果たす。有糸分裂を混乱させる薬剤は、多くの癌の治療において臨床的に有効であることが証明されている。新規癌療法の発見のための標的として利用できる重要な紡錘体タンパク質が多数存在するにもかかわらず、今日臨床的用途におけるどの紡錘体標的療法も、唯１つのタンパク質、つまりチューブリンに対して作用する。驚くべきことに、キネシンEg5発現は増殖中のヒト組織中で最も豊富であるが、一方で、それは殆どの有糸分裂後細胞、例えばヒト中枢神経系ニューロンには存在せず、このことは細胞増殖におけるEg5の排他的な又はほぼ限定された役割と一致している。微小管の動的不安定性を直接妨げる薬剤に対比して、Eg5キネシン阻害剤は、増殖に無関係である、微小管ベースの細胞過程、例えばニューロン輸送を妨害しないと想定される。有糸分裂中、Eg5は、紡錘体を形成する双極性構造へと微小管を編成することに本質的に関与している。Eg5機能の実験的混乱は、紡錘体の特徴的奇形又は機能不全を引き起こし、しばしば細胞周期の停止や細胞死をもたらす。

【０５７１】

本発明に係る化合物は紡錘体形成を活性調節するのに利用できるので、しばしば後にアポトーシスが起こる有糸分裂中の細胞分裂停止の延長を引き起こす。ここでの「活性調節」とは、紡錘体形成を増加させることと減少させることを含む、紡錘体形成を改変することを意味する。「紡錘体形成」とは、微小管が有糸分裂キネシンによって双極性構造へと編成されることを意味する。「紡錘体の機能不全」とは、有糸分裂停止及び単極性紡錘体形成を意味する。「紡錘体の奇形」とは、紡錘体の極の扁平化を含むか、又は他の方法で紡錘体の形態学的混乱を引き起こすことを含む。

【０５７２】

更に、本発明化合物は良性又は悪性の新形成の治療において利用することができる。「新形成」は、異常な細胞増殖及び／又は生存及び／又は分化の妨害を示す細胞により定義される。「良性の新形成」は、進行性で転移性の腫瘍を生体内で形成できない、細胞の過剰増殖により説明される。対照的に、「悪性の新形成」は、全身性疾病を形成する、例えば遠位の器官に腫瘍転移を生じることができる、多細胞性で且つ生化学的異常を有する細胞により説明される。

【０５７３】

種々の疾病は、異常な細胞増殖（「過剰増殖」）並びにアポトーシスからの回避によって引き起こされる。これらの疾病は、良性前立腺過形成（“ＢＰＨ”）又は結腸上皮過形成良性過形成、乾癬、糸球体腎炎又は変形性関節炎を包含する。最も重要であるのは、これらの疾病が通常は癌として説明され、且つ別の器官又は組織に最終的に転移する腫瘍細胞によって特徴付けられる悪性新形成を包含することである。悪性新形成は固形腫瘍及び血液腫瘍を含む。固形腫瘍は、胸部、膀胱、骨、脳、中枢神経系及び末梢神経系、結腸、内分泌腺（例えば甲状腺及び副腎皮質）、食道、子宮内膜、生殖細胞、頭部及び頚部、腎臓、肝臓、肺、喉頭及び下咽頭の腫瘍、中皮腫、肉腫、卵巣、膵臓、前立腺、直腸、腎、小腸、軟部組織、精巣、胃、皮膚、尿管、膣及び肛門の腫瘍により例示される。悪性新形成は、網膜芽細胞腫及びウィルムス腫瘍によって例示される遺伝性の癌を包含する。更に、悪性新形成は、前記器官における原発性腫瘍と別の器官における相応の二次性腫瘍（「

腫瘍転移」）を包含する。血液腫瘍は、白血病及びリンパ腫の進行性形及び無痛性形態、即ち非ホジキン病、慢性及び急性骨髄性白血病（ＣＭＬ／ＡＭＬ）、急性リンパ芽球性白血病（ＡＬＬ）、ホジキン病、多発性骨髄腫及びＴ細胞リンパ腫により例示される。また骨髄異形成症候群、形質細胞新形成、腫瘍随伴症候群、未知の原発部位の癌並びにエイズ（AIDS）関連悪性疾患も含まれる。

【０５７４】

癌疾患並びに悪性新形成は遠位器官における転移の形成を必ずしも必要としないことに留意すべきである。或る腫瘍は、その原発器官に対してそれらの集中的増殖特性を通して壊滅的作用を発揮する。これらは組織及び器官構造の破壊を引き起こし、最終的に、指定された器官機能の不全を引き起こし得る。

【０５７５】

腫瘍性細胞増殖は、正常な細胞挙動と器官機能を侵すことがある。例えば、血管新生として記載される過程である、新血管の形成は、腫瘍又は腫瘍転移によって誘発される。本発明化合物は、良性又は腫瘍性の細胞増殖によって引き起こされる病態生理学的関連過程、例えば非限定的に、血管内皮細胞の非生理学的増殖による血管新生、の治療のために産業上利用可能である。

【０５７６】

標準的癌療法において頻繁に生じる不成功には、薬剤耐性が特に重要となる。この薬剤耐性は、薬剤排出ポンプの過剰発現又は細胞標的タンパク質内の突然変異といった様々な細胞機構又は分子機構によって引き起こされる。本発明化合物の産業上利用可能性は、患者の第一選択薬治療（first line treatment）に制限されるものではない。規定の癌化学療法剤又は標的特異的抗癌剤（第二選択薬治療又は第三選択薬治療）に対する耐性を有する患者も、本発明化合物での治療を受けることができる。

【０５７７】

本発明化合物は、細胞に対する抗増殖特性のため、細胞周期又は細胞増殖に関連した疾患、例えば上述した癌の他に、例えば線維増殖性及び分化性疾患、乾癬、関節リウマチ、アテローム動脈硬化症、過形成、再狭窄、心臓肥大、（自己）免疫疾患、真菌病、骨疾患、又は急性もしくは慢性炎症の治療のためにも産業上利用可能である。

【０５７８】

本発明化合物は、上述した良性及び悪性性質の疾病、例えば良性又は悪性新形成、特に癌（例えば上述した癌疾患のいずれか）、特にEg5阻害に感受性である癌、の治療、予防又は緩和のために産業上利用可能である。

【０５７９】

本明細書に記載するそれらの性質、機能及び利用可能性に照らして、本発明に係る化合物は、それと関連する有効で且つ望ましい効果、例えば低い毒性、一般に優れた生物学的利用能（例えば良好な腸内吸収）、優れた治療濃度域、有意な副作用の不在、及び／又はそれらの治療上及び製剤上の適合性に関連した更なる有益な効果により、区別されるべきである。

【０５８０】

本発明は更に、ヒトを含む哺乳動物において、アポトーシスの誘導に応答性である（過剰）増殖疾病及び／又は疾患、特に上述した疾病、疾患、状態又は病気、を治療する方法であって、それを必要とする前記哺乳動物に、薬理学的に活性で且つ治療上有効で且つ許容できる量の１又は複数の本発明化合物を投与することを含んで成る方法に関する。

【０５８１】

本発明は更に、良性又は悪性の腫瘍疾患、例えば癌の治療において、アポトーシス及び／又は異常細胞増殖を活性調節するのに有用な方法であって、そのような治療を必要とする被検体に、薬理学的に活性で且つ治療上有効で且つ許容できる量の１又は複数の本発明化合物を投与することを含んで成る方法に関する。

【０５８２】

本発明は更に、細胞のEg5活性を活性調節する方法、特に阻害する方法であって、その

ような活性調節、特に阻害を必要とする患者に、薬理学的に活性で且つ治療上有効で且つ許容できる量の１又は複数の本発明化合物を投与することを含んで成る方法に関する。

【０５８３】

本発明は更に、紡錘体を活性調節する方法、即ち、例えば紡錘体形成を改変し、例えば紡錘体極の奇形を引き起こす紡錘体極の分離を増加又は減少させる方法であって、そのような活性調節を必要とする患者に、薬理学的に活性で且つ治療上有効で且つ許容できる量の１又は複数の本発明化合物を投与することを含んで成る方法に関する。

【０５８４】

本発明は更に、細胞における有糸分裂を阻害する方法であって、そのような阻害を必要とする患者に、薬理学的に活性で且つ治療上有効で且つ許容できる量の１又は複数の本発明化合物を投与することを含んで成る方法にも関する。

【０５８５】

本発明は更に、哺乳動物においてEg5キネシン活性に関連した疾病及び／又は疾患、例えばアポトーシスの誘導に応答する（過剰）増殖性疾病及び／又は障害、例えば良性もしくは悪性腫瘍、例えば癌、を治療、予防又は緩和するための方法であって、それを必要とする前記哺乳動物に、薬理学的に活性で且つ治療上有効で且つ許容できる量の１又は複数の本発明化合物を投与することを含んで成る方法にも関する。

【０５８６】

本発明は更に、上述した１又は複数の疾病の治療、予防及び／又は緩和のために使用される医薬組成物の製造のための、本発明化合物の使用に関する。

更に本発明は、哺乳動物における良性又は悪性性質の過剰増殖性疾病及び／又はアポトーシスの誘導に応答性である疾患、例えば癌、の治療、予防又は緩和において使用できる医薬組成物の製造のための、本発明化合物の使用に関する。

本発明は、異常細胞増殖の停止及び／又はアポトーシスの誘導に応答性である疾患の治療、予防又は緩和に用いることができる医薬組成物の製造のための、本発明化合物の使用に関する。

【０５８７】

本発明は更に、１又は複数の本発明化合物と医薬上許容される担体又は希釈剤とを含有する医薬組成物に関する。

本発明は更に、１又は複数の本発明化合物と医薬上許容される担体又は希釈剤とを組み合わせることにより製造される医薬組成物に関する。

更に本発明は、１又は複数の本発明化合物と医薬上許容される助剤及び／又は賦形剤とを含んで成る医薬組成物にも関する。

【０５８８】

本発明は更に、良性又は悪性新形成、特に癌、例えば上述した癌疾患のいずれか、を治療、予防又は緩和するための、１又は複数の本発明化合物と医薬上許容される助剤、賦形剤及び／又はビヒクルとを含んで成る組成物に関する。

本発明は更に、良性又は悪性新形成、特に癌、例えば上述した癌疾患のいずれか、を治療、予防又は緩和するための、本発明化合物と医薬上許容される賦形剤、担体及び／又は希釈剤とを含んで成る組成物に関する。

【０５８９】

本発明は更に、例えば過剰増殖性疾病、例えば癌、及び／又はアポトーシスの誘導に応答する疾患を治療、予防又は緩和するための、治療上有効で且つ許容できる量の１又は複数の本発明化合物と、療法に使用される有用な医薬上許容されるビヒクル、希釈剤及び／又は賦形剤とから本質的に成る組成物に関する。

【０５９０】

更に本発明は、抗増殖活性及び／又はアポトーシス誘導活性を有する本発明に係る化合物に関する。

本発明は更に、Eg5阻害特性を有する本発明に係る化合物に関する。

本発明は更に、Eg5阻害特性を有する本発明に係る医薬組成物に関する。

本発明は更に、抗増殖活性を有する本発明に係る医薬組成物に関する。
本発明は更に、アポトーシス誘導活性を有する本発明に係る医薬組成物に関する。
【０５９１】
本発明は更に、上述した病気の治療及び／又は予防のための医薬品の製造における、唯一の活性成分としての１又は複数の本発明化合物と医薬上許容される担体又は希釈剤とを含有する医薬組成物の使用に関する。
【０５９２】
その上、本発明は、包装材料と前記包装材料内に含まれる薬剤とを含んで成る製品であって、ここで前記薬剤は治療上効果的にEg5を阻害しそして／又は細胞（過剰）増殖を阻害しそして／又はアポトーシスを誘導し、Eg5により媒介される疾患及び／又は（過剰）増殖性疾患及び／又はアポトーシスの誘導に応答性である疾患の症状を緩和し、前記包装材料は薬剤がEg5媒介疾患及び／又は（過剰）増殖性疾患及び／又はアポトーシスの誘導に応答性である障害を予防又は治療するのに有用であることを示すラベル又は添付物を含んで成り、そして前記薬剤が１又は複数の本発明化合物を含んで成ることを特徴とする製品である。
【０５９３】
本発明に係る医薬組成物は、それ自体公知であり且つ当業者に周知の方法により製造される。医薬組成物としては、本発明化合物（＝活性化合物）はそれ自体で使用されるか、又は好ましくは適当な医薬助剤及び／又は賦形剤と組み合わせて、例えば錠剤、コーティング錠、糖衣錠、ピル剤、カプセル剤、粒剤、カプレット、坐剤、パッチ剤（例えばＴＴＳ）、乳剤（例えばマイクロエマルジョン又は乳濁液）、懸濁剤（例えばナノ懸濁剤）、ゲル剤、可溶化物もしくは溶液（例えば無菌溶液）の形で使用されるか、或いはリポソーム中に封入されるか又はβ－デキストリンもしくはβ－シクロデキストリン誘導体封入体として封入され、ここで前記活性化合物の含量は有利には0.1～95％であり、そして助剤及び／又は賦形剤の適当な選択により、活性化合物に及び／又は作用の所望の開始に厳密に適合した医薬投与形（例えば遅延放出形又は腸溶性形）を達成することができる。
【０５９４】
当業者はその専門知識のために所望の医薬製剤に適当である助剤、ビヒクル、賦形剤、希釈剤、担体又はアジュバントに精通している。溶剤、ゲル形成剤、軟膏基剤及び別の活性化合物に加えて、賦形剤、例えば酸化防止剤、分散剤、乳化剤、保存剤、可溶化剤（例えばポリオキシエチレングリセロールトリリシンオレエート 35、PEG 400、Tween 80、Captisol、 Solutol HS15等）、着色剤、錯生成剤、浸透促進剤、安定剤、充填剤、結合剤、増量剤、崩壊剤、緩衝剤、pH調節剤（例えば中性、アルカリ性又は酸性製剤を得るため）、ポリマー、潤滑剤、コーティング剤、噴射剤、張力調節剤、界面活性剤、矯味矯臭剤、甘味料又は顔料を使用することができる。
【０５９５】
特に、所望の製剤及び所望の投与形態に適当である種類の助剤及び／又は賦形剤が使用される。
【０５９６】
本発明に係る化合物、医薬組成物又は組合せ物の投与は、当該技術分野で利用可能な一般に許容される任意の投与方法で実施することができる。適当な投与方法の代表的例としては、静脈内、経口、経鼻、非経口、局所、経皮、及び直腸輸送である。経口投与と静脈投与が好ましい。
【０５９７】
皮膚病の治療には、本発明化合物を特に局所適用に適した医薬組成物の形で投与することができる。医薬組成物の製造には、本発明化合物（＝活性化合物）を好ましくは適当な医薬助剤と混合し、そして更に加工して適当な医薬製剤を提供する。適当な医薬製剤は、例えば粉剤、乳剤、懸濁液剤、スプレー剤、オイル、軟膏、油脂軟膏、クリーム、ローション、ペースト、ゲル、又は溶液である。
【０５９８】

本発明に係る医薬組成物は、それ自体既知の方法により調製することができる。本発明化合物（活性化合物）の投与は、Eg5阻害剤、細胞（過剰）増殖阻害剤又はアポトーシス誘導剤について常用される桁で実施される。皮膚病の治療用の局所投与形（例えば軟膏）は、例えば0.1～99％の濃度で活性化合物を含有する。全身投与の場合の常用投与量は、（p.o.）では0.03～60 mg/kg/日であり、（i.p.）では0.03～60 mg/kg/hであることができる。別の態様では、全身投与の場合の常用投与量は（p.o.）では0.3～30 mg/kg/日であり、（i.v.）では0.3～30 mg/kg/hである。

【０５９９】

各場合に必要である活性化合物の最適な投与方法及び治療の期間、特に最適投与量及び投与方法の選択は、当業者によりその専門知識に基づいて決定することができる。

【０６００】

治療又は予防すべき特定の疾病に依存して、場合によりその疾病を治療又は予防するために通常投与される付加的な治療活性物質を本発明化合物と同時に投与してもよい。ここで用いる場合、特定の疾病を治療又は予防するために通常投与される付加的な治療活性物質は、治療すべき疾病に好適であると知られているものである。

例えば、本発明化合物を、上述した疾病の治療に使用される１又は複数の標準的な治療剤と組み合わせてもよい。

【０６０１】

特定の一態様においては、本発明化合物を、１又は複数の当該技術分野で公知の抗癌剤、例えば下記に記載されるような１又は複数の化学療法剤及び／又は標的特異的抗癌剤と組み合わせることができる。

【０６０２】

組合せ療法において汎用される既知の化学療法抗癌剤の例としては、(i) アルキル化剤／カルバミル化剤、例えばシクロホスファミド（Endoxan（登録商標））、イホスファミド（Holoxan（登録商標））、チオテパ（Thiotepa Lederle（登録商標））、メルファラン（Alkeran（登録商標））又はクロロエチルニトロソウレア（BCNU）；(ii) 白金誘導体、例えばシスプラチン（Platinex（登録商標）BMS）、オキサリプラチン、サトラプラチン又はカルボプラチン（Carboplat（登録商標）BMS）；(iii) 有糸分裂阻害剤／チューブリン阻害剤、例えばビンカ・アルカロイド（ビンクリスチン、ビンブラスチン、ビンオレルビン）、タキサン類、例えばパクリタキセル（Taxol（登録商標））、ドセタキセル（Taxotere（登録商標））及びその類似体並びにその新規製剤及び接合体（例えばアルブミンに結合したパクリタキセルを有するナノ粒子製剤Abraxane（登録商標））、エポチロン、例えばエポチロンＢ（Patupilone（登録商標））、アザエポチロン（Ixabepilone（登録商標））又はZK-EPO、全合成エポチロンＢ類似体；(iv)トポイソメラーゼ阻害剤、例えばアントラサイクリン類（例えば、ドキソルビシン／Adriblastin（登録商標））、エピポドフィロトキシン類（例えばエトポシド／Etopophos（登録商標））及びカンプトセシン及びカンプトセシン類似体（例えばイリノテカン／Camptosar（登録商標）又はトポテカン／Hycamtin（登録商標））；(v) ピリミジンアンタゴニスト、例えば５－フルオロウラシル（5-FU）、カペシタビン（Xeloda（登録商標））、アラビノシルシトシン／シタラビン（Alexan（登録商標））又はゲムシタビン（Gemzar（登録商標））；(vi) プリンアンタゴニスト、例えば６－メルカプトプリン（Puri-Nethol（登録商標））、６－チオグアニン又はフルダラビン（Fludara（登録商標））並びに最後に(vii) 葉酸アンタゴニスト、例えばメトトレキセート（Farmitrexat（登録商標））及びプレメトレキセド（Alimta（登録商標））が挙げられるが、それらに限定されない。

【０６０３】

実験的な及び標準の癌療法で使用される標的特異的抗癌剤クラスの例としては、(i)キナーゼ阻害剤、例えばイマチニブ（Glivec（登録商標））、ZD-1839／ゲフィチニブ（Iressa（登録商標））、BAY43-9006（ソラフェニブ、Nexavar（登録商標））、SU11248／スニチニブ（Sutent（登録商標））、OSI-774／エルロチニブ（Tarceva（登録商標））、デサチニブ（Sprycel（登録商標））、ラパチニブ（Tykerb（登録商標））又はバタラニブ

、バンデタニブ（Zactima（登録商標））もしくはパゾパニブ；(ii) プロテアソーム阻害剤、例えばPS-341／ボルテゾミブ（Velcade（登録商標））；(iii)ヒストンデアセチラーゼ阻害剤、例えばSAHA（Zolinza）、PXD101、MS275、MGCD0103、デプシペプチド／FK228、NVP-LBH589、NVP-LAQ824、バルプロン酸（VPA）、CRA/PCI24781、ITF2357、SB939及び酪酸塩；(iv)熱ショックタンパク質90阻害剤、例えば17－アリルアミノゲルダナマイシン（17-AAG）又は17－ジメチルアミノゲルダナマイシン（17－DMAG）；(v) 血管標的薬剤（VTA）、例えばコンブレタスタチンA4リン酸塩又はAVE8062／AC7700及び抗血管新生薬、例えばVEGF抗体、例えばベバシズマブ（Avastin（登録商標））、又はKDRチロシンキナーゼ阻害剤、例えばPTK787／ZK222584（Vatalanib）もしくはバンデタニブ（Zactima（登録商標））もしくはパゾパニブ；(vi) モノクローナル抗体、例えばトラスツズマブ（Herceptin（登録商標））又はリツキシマブ（MabThera/Rituxan（登録商標））又はエレムツズマブ（Campath（登録商標））又はトシツモマブ（Bexxar（登録商標））又はC225／セツキシマブ（Erbitux（登録商標））又はアバスチン（上記参照）又はパニツムマブ（Vectibix（登録商標））並びにモノクローナル抗体の変異体及び接合体、例えばゲムツズマブ－オゾガミシン（Mylotarg（登録商標））又はイブリツモマブ－チウキセタン（Zevalin（登録商標））、及び抗体断片；(vii) オリゴヌクレオチド系治療薬、例えばG-3139／オブリメルセン（Genasense（登録商標））又はDNMT1阻害剤MG98；(viii) Toll様受容体／TLR9アゴニスト、例えばPromune（登録商標）、TLR７アゴニスト、例えばイミキモド（Aldara（登録商標））又はイサトリビン及びその類似体、又はTLR7/8アゴニスト、例えばレシキモド、並びにTLR7/8アゴニストとしての免疫感受性RNA；(ix) プロテアーゼ阻害剤；(x) ホルモン治療剤、例えば抗エストロゲン類（例えばタモキシフェン又はラロキシフェン）、抗アンドロゲン類（例えばフルタミド又はカソデックス）、LHRH類似体（例えばロイプロリド、ゴセレリン又はトリプトレリン）及びアロマターゼ阻害剤が挙げられるが、それらに限定されない。

【０６０４】

組合せ療法に使用できる他の既知の標的特異的抗癌剤としては、ブレオマイシン、レチノイド類、例えばオールトランス型レチノイン酸（ATRA）、ＤＮＡメチルトランスフェラーゼ阻害剤、例えば５－アザ－２′－デオキシシチジン（デシタビン、Dacogen（登録商標））及び５－アザシチジン、アラノシン、サイトカイン、例えばインターロイキン－２、インターフェロン、例えばインターフェロンα２もしくはインターフェロン－γ、死受容体アゴニスト、例えばTRAIL、DR4/5アゴニスト抗体、FasL及びTNF-Rアゴニスト（例えばTRAIL受容体アゴニスト、例えばマパツムマブ又はレキサツムマブ）が挙げられるが、それらに限定されない。

【０６０５】

本発明に係る組合せ療法において有用である抗癌剤の例としては、以下の薬剤：
5-FU、アクチノマイシンＤ、アバレリクス(ABARELIX)、アブシキシマブ(ABCIXIMAB)、アクラルビシン(ACLARUBICIN)、アダパレン(ADAPALENE)、アレムツズマブ(ALEMTUZUMAB)、アルトレタミン(ALTRETAMINE)、アミノグルテチミド(AMINOGLUTETHIMIDE)、アミプリローズ(AMIPRILOSE)、アムルビシン(AMRUBICIN)、アナストロゾール(ANASTROZOLE)、アンシタビン(ANCITABINE)、アルテミシニン(ARTEMISININ)、アザチオプリン(AZATHIOPRINE)、バシリキシマブ(BASILIXIMAB)、ベンダムスチン(BENDAMUSTINE)、ベバシズマブ(BEVACIZUMAB)、ベキサール(BEXXAR)、ビカルタミド(BICALUTAMIDE)、ブレオマイシン(BLEOMYCIN)、ボルテゾミブ(BORTEZOMIB)、ブロクスリジン(BROXURIDINE)、ブスルファン(BUSULFAN)、カムパト(CAMPATH)、カペシタビン(CAPECITABINE)、カルボプラチン(CARBOPLATIN)、カルボコン(CARBOQUONE)、 カルムスチン(CARMUSTINE)、セトロレリクス(CETRORELIX)、クロラムブシル(CHLORAMBUCIL)、クロルメチン(CHLORMETHINE)、シスプラチン(CISPLATIN)、クラドリビン(CLADRIBINE)、クロミフェン(CLOMIFENE)、シクロホスファミド(CYCLOPHOSPHAMIDE)、ダカルバジン(DACARBAZINE)、ダクリズマブ(DACLIZUMAB)、ダクチノマイシン(DACTINOMYCIN)、ダサチニブ(DASATINIB)、ダウノルビシン（DAUNORUBICIN）、デシタビン(DECITABINE)、デスロレリン(DESLORELIN)、デクスラゾキサン(DEXRAZOXANE)、ドセタキセ

ル(DOCETAXEL)、ドキシフルリジン(DOXIFLURIDINE)、ドキソルビシン(DOXORUBICIN)、ドロロキシフェン(DROLOXIFENE)、ドロスタノロン(DROSTANOLONE)、エデルフォシン(EDELFOSINE)、エフロルニチン(EFLORNITHINE)、エミテフル(EMITEFUR)、エピルビシン(EPIRUBICIN)、エピチオスタノール(EPITIOSTANOL)、エプタプラチン(EPTAPLATIN)、エルビツクス(ERBITUX)、エルロチニブ(ERLOTINIB)、エストラムスチン(ESTRAMUSTINE)、エトポシド(ETPOSIDE)、エキセメスタン(EXEMESTANE)、ファドロゾール(FADROZOLE)、フィナステリド(FINASTERIDE)、フロクスウリジン(FLOXURIDINE)、フルシトシン(FLUCYTOSINE)、フルダラビン(FLUDARABINE)、フルオロウラシル(FLUOROURACL)、フルタミド(FLUTAMIDE)、ホルメスタン(FORMESTANE)、ホスカルネト(FOSCARNET)、ホスフェストロール(FOSFESTROL)、フォテムスチン(FOTEMUSTIN)、フルベストラント(FULVESTRANT)、ゲフィチニブ(GEFITINIB)、ゲナセンセ(GENASENSE)、ゲムシタビン(GEMCITABINE)、グリベック(GLIVEC)、ゴセレリン(GOSERELIN)、グスペリムス(GUSPERIMUS)、ヘルセプチン(HERCEPTIN)、イダルビシン(IDARUBICIN)、イドクスウリジン(IDOXURIDINE)、イホスファミド(IFOSFAMIDE)、イマチニブ(IMATINIB)、イムプロスルファン(IMPROSULFAN)、インフリキシマブ(INFLIXIMAB)、イリノテカン(IRINOTECAN)、イクサベピロン(IXABEPILONE)、ランレオチド(LANREOTIDE)、ラパチビブ(LAPATINIB)、レトロゾール(LETROZOLE)、リュープロレリン(LEUPRORELIN)、ロバプラチン(LOBAPLATIN)、ロムスチン(LOMUSTINE)、リュープロライド(LUPROLIDE)、メルファラン(MELPHALAN)、メルカプトプリン(MERCAPTOPURINE)、メトトレキセート(METHOTREXATE)、メツレデパ(METUREDEPA)、ミボプラチン(MIBOPLATIN)、ミフェプリストン(MIFEPRISTONE)、ミルテホシン(MILTEFOSINE)、ミリモスチム(MIRIMOSTIM)、ミトグアゾン(MITOGUAZONE)、ミトラクトール(MITOLACTOL)、マイトマイシン(MITOMYCIN)、ミトキサントロン(MITOXANTRONE)、ミゾリビン(MIZORIBINE)、モテキサフィン(MOTEXAFIN)、ミロタルグ(MYLOTARG)、ナルトグラスチム(NARTOGRASTIM)、ネバズマブ(NEBAZUMAB)、ネダプラチン(NEDAPLATIN)、ニルタミド(NILUTAMIDE)、ニムスチン(NIMUSTINE)、オクトレオチド(OCTREOTIDE)、オルメロキシフェン(ORMELOXIFENE)、オキサリプラチン(OXALIPLATIN)、パクリタキセル(PACLITAXEL)、パリビズマブ(PALIVIZUMAB)、パニツムマブ(PANITUMUMAB)、パツピロン(PATUPILONE)、パゾパニブ(PAZOPANIB)、ペガスパルガーゼ(PEGASPARGASE)、ペグフィルグラスチム(PEGFILGRASTIM)、メメトレキセド(PEMETREXED)、ペンテトレオチド(PENTETREOTIDE)、ペントスタチン(PENTOSTATIN)、ペルホスファミド(PERFOSFAMIDE)、ピポスルファン(PIPOSULFAN)、ピラルビシン(PIRARUBICIN)、プリカマイシン(PLICAMYCIN)、プレドニムスチン(PREDNIMUSTINE)、プロカルバジン(PROCARBAZINE)、プロパゲルマニウム(PROPAGERMANIUM)、塩化プロスピジウム(PROSPIDIUM CHLORIDE)、ラロキシフェン(RALOXIFEN)、ラルチトレキセド(RALTITREXED)、ラニムスチン(RANIMUSTINE)、ランピルナーゼ(RANPIRNASE)、ラスブリカーゼ(RASBURICASE)、ラゾキサン(RAZOXANE)、リツキシマブ(RITUXIMAB)、リファンピシン(RIFAMPICIN)、リトロスルファン(RITROSULFAN)、ロムルチド(ROMURTIDE)、ルボキシスタウリン(RUBOXTAURIN)、サルグラモスチム(SARGRAMOSTIM)、サトラプラチン(SATRAPLATIN)、シロリムス(SIROLIMUS)、ソブゾキサン(SOBUZOXANE)、ソラフェニブ(SORAFENIB)、スピロムスチン(SPIROMUSTINE)、ストレプトゾシン(STREPTOZOCIN)、スニチニブ(SUNITINIB)、 タモキシフェン(TAMOXIFEN)、タソネルミン(TASONERMIN)、テガフール(TEGAFUR)、テモポルフィン(TEMOPORFIN)、テモゾロミド(TEMOZOLOMIDE)、テニポシド(TENIPOSIDE)、テストラクトン(TESTOLACTONE)、チオテパ(THIOTEPA)、チマルファシン(THYMALFASIN)、チアミプリン(TIAMIPRINE)、トポテカン(TOPOTECAN)、トレミフェン(TOREMIFENE)、トライル(TRAIL)、トラスツズマブ(TRASTUZUMAB)、トレオスルファン(TREOSULFAN)、トリアジクオン(TRIAZIQUONE)、トリメトレキセート(TRIMETREXATE)、トリプトレリン(TRIPTORELIN)、トロホスファミド(TROFOSFAMIDE)、ウレデパ(UREDEPA)、バルルビシン(CALRUBICIN)、バタラニブ(VATALANIB)、バンデタニブ(VANDETANIB)、ベルテポルフィン(VERTEPORFIN)、ビンブラスチン(VINBLASTINE)、ビンクリスチン(VINCRISTINE)、ビンデシン(VINDESINE)、ビノレルビン(VINORELBIN)、ボロゾール(VOROZOLE)及びゼバリン(ZEVALIN)が挙げられるが、それらに限定されない。

【０６０６】

本発明化合物の組み合わせ相手としての上記に言及した抗癌剤は、医薬上許容されるその誘導体、例えばそれらの医薬上許容される塩を包含する。

【０６０７】

当業者は、その分野の専門知識に基づいて、同時投与される追加の治療剤の全１日量及び投与形を承知している。前記全１日量は広範囲で異なることができる。

【０６０８】

本発明の実施において、本発明に係る化合物は、組合せ療法において別々に、連続的に、同時に又は時間差的に交互に（例えば組合せ単位投与形として、別々の単位投与形として、隣接した別個の単位投与形として、固定のもしくは非固定の組合せ物として、小分けのキットとして、又は混合物として）、１又は複数の標準的な治療剤（例えば化学療法薬及び／又は標的特異的抗癌剤）、特に当該技術分野で既知である抗癌剤、例えば上述した抗癌剤と共に投与することができる。

【０６０９】

これに関連して、本発明は更に、少なくとも１つの本発明化合物である第一の活性成分と、少なくとも１つの当該技術分野で既知の抗癌剤、例えば上記に挙げた抗癌剤の１つ又は複数である第二の活性成分とを含有する組合せ物であって、療法において、例えば本明細書中に記載した疾患のいずれかの療法において、別々に、連続的に、同時に又は時差的に交互に使用するための組合せ物に関する。

【０６１０】

本発明に係る用語「組合せ物」は、固定の組合せ物、非固定の組合せ物又は部品キットとして存在してよい。

【０６１１】

「固定の組合せ物」は、前記第一活性成分と第二活性成分とが１つの単位用量で又は単一存在物として一緒に存在する組合せ物として定義される。「固定組合せ物」の一例は、前記第一活性成分と前記第二活性成分とが、例えば一製剤中に同時投与用に混合状態で存在する医薬組成物である。「固定組合せ物」の別の例は、前記第一活性成分と前記第二活性成分とが、混合されることなく１単位で存在する医薬品組合せ物である。

【０６１２】

「部品キット」は、前記第一活性成分と前記第二活性成分とが複数の単位で存在する組合せ物として定義される。「部品キット」の一例は、前記第一活性成分と前記第二活性成分とが別々に存在する組合せ物である。部品キットの成分は、別々に、連続的に、同時に又は時差的に交互に投与することができる。

【０６１３】

本発明は、少なくとも１つの本発明化合物である第一の活性成分、及び
少なくとも１つの当該技術分野で既知の抗癌剤、例えば１又は複数の前記抗癌剤である第二の活性成分、並びに場合により、
医薬上許容される担体又は希釈剤
を含んで成り、療法において別々に、連続的に、同時に又は時差的に交互に使用するための医薬組成物に関する。

【０６１４】

本発明は更に、
a) 少なくとも１つの本発明化合物と医薬上許容される担体又は希釈剤との配合物及び
b)少なくとも１つの当該技術分野で既知の抗癌剤、例えば１又は複数の前記抗癌剤と、医薬上許容される担体又は希釈剤との配合物
を含んで成る組合せ物に関する。

【０６１５】

本発明は更に、本発明化合物である第一の活性成分と医薬上許容される担体又は希釈剤との調剤；当該技術分野で既知の抗癌剤、例えば前記抗癌剤のうちの１つである第二の活性成分と医薬上許容される担体又は希釈剤との調剤を含んで成り、療法において同時に、連続的に、別々に又は時差的に交互に使用するための部品キットに関する。場合により、

前記キットは、療法において、例えば過剰増殖性疾病及び／又はアポトーシスの誘導に応答性である疾患、例えば癌、より詳しくは上記に記載した癌疾患のいずれか、を治療するための療法において、それを使用するための説明書を含んで成る。

【０６１６】

本発明は更に、少なくとも１つの本発明化合物と少なくとも１つの当該技術分野で既知の抗癌剤とを含んで成る、同時、連続又は別々の投与用の組合せ調剤に関する。

本発明は更に、Eg5阻害活性及び／又は抗増殖特性及び／又はアポトーシス誘導特性を有する本発明に係る組合せ物、組成物、製剤、調剤又はキットに関する。

【０６１７】

加えて、本発明は更に、患者において（過剰）増殖性疾病及び／又はアポトーシス誘導に応答性である疾患、例えば癌、を治療する方法であって、それを必要とする前記患者に、本明細書に記載される組合せ物、組成物、製剤、調剤又はキットを投与することを含んで成る方法に関する。

【０６１８】

その上更に、本発明は、患者において悪性もしくは良性の（過剰）増殖性疾病及び／又はアポトーシス誘導に応答性である疾患、例えば癌、を治療する方法であって、本発明化合物及び医薬上許容される担体又は希釈剤を含んで成る医薬組成物の医薬上活性で且つ治療上有効で且つ許容できる量と、１又は複数の当該技術分野で既知の抗癌剤、例えば前記抗癌剤のうちの１つ又は複数の医薬上活性で且つ治療上有効で且つ許容できる量とを、それを必要とする患者に、組合せ療法において別々に、同時に、連続的に又は交互に時差的に投与することを含んで成る方法に関する。

【０６１９】

更に加えて、本発明は、患者において、（過剰）増殖性疾病及び／又はアポトーシス誘導に応答性である疾患、例えば良性又は悪性新形成、例えば癌、特に本明細書に記載される癌疾患のいずれかを治療、予防又は緩和するための方法であって、本発明化合物である第一の活性化合物の一定量と、標準の治療剤、特に少なくとも１つの当該技術分野で既知の抗癌剤、例えば本明細書に言及した化学療法剤と標的特異的抗癌剤のうちの１つ又は複数である、少なくとも１つの第二の活性化合物の一定量とを、それを必要とする前記患者に、組合せ療法において別々に、同時に、連続的に又は交互に時差的に投与することを含んで成り、ここで前記第一の活性化合物と前記第二の活性化合物の前記一定量は治療効果をもたらす量である方法に関する。

【０６２０】

更に加えて、本発明は、患者において（過剰）増殖性疾病及び／又はアポトーシス誘導に応答性である疾患、例えば良性又は悪性新形成、例えば癌、特に上記に記載した癌疾患のいずれかを治療、予防又は緩和する方法であって、本発明に係る組合せ物を投与することを含んで成る方法に関する。

【０６２１】

更に、本発明は、（過剰）増殖性疾病、例えば癌、及び／又はアポトーシス誘導に応答性である疾患、特に上記に記載した疾病、例えば悪性又は良性新形成を、治療、予防又は緩和するための医薬品、例えば市販包装品又は薬品の製造における、本発明に係る組成物、組合せ物、製剤、調剤又はキットの使用に関する。

【０６２２】

本発明は更に、１又は複数の化学療法剤及び／又は標的特異的抗癌剤、例えば本明細書に記載のもののいずれか、の同時、連続又は別々の使用のための説明書と一緒に、１又は複数の本発明化合物を含んで成る市販包装品に関する。

本発明は更に、唯一の活性成分としての１又は複数の本発明化合物を、１又は複数の化学療法剤及び／又は標的特異的抗癌剤、例えば本明細書に記載したもののいずれかとの同時、連続又は別々の使用のための説明書と一緒に含んで成る、市販包装品に関する。

【０６２３】

本発明は更に、１又は複数の本発明化合物との同時、連続又は別々の使用のための説明

書と一緒に、１又は複数の化学療法剤及び／又は標的特異的抗癌剤、例えば本明細書に記載のもののいずれかを含んで成る市販包装品に関する。

本発明に係る組合せ療法に関連して言及される組成物、組合せ物、調剤、製剤、キット又は包装品は、複数の本発明化合物及び／又は複数の当該技術分野で既知の抗癌剤を含んでもよい。

【０６２４】

本発明に係る部品キットの第一及び又は第二活性成分は、別々の製剤（即ち互いに独立に）として提供することができ、次いで該製剤を組合せ療法における同時、連続、別々又は交互に時差的な使用のために一緒にされてもよく；或いは、組合せ療法における同時、連続、別々又は交互に時差的な使用のための組合せパックの別個の成分として一緒に包装され提供されてもよい。

【０６２５】

本発明に係る組合せ又は部品キットの第一及び第二活性成分の医薬製剤のタイプは、同様であることができ、即ち両成分を別々の錠剤又はカプセル中に製剤するか、あるいは前記タイプは異なることができ、即ち異なる投与形態、例えば一方の活性成分を錠剤又はカプセルとして製剤しそして他方を例えば静脈投与用に製剤することができる。

【０６２６】

本発明に係る組合せ物、組成物又はキットの第一及び第二活性成分の量は、一緒になって、（過剰）増殖性疾患及び／又はアポトーシス誘導に応答性である疾患、特に上述した疾病の１つ、例えば良性もしくは悪性新形成、特に癌、の治療、予防又は緩和のための治療上有効な量を含んで成ることができる。

【０６２７】

更に、本発明化合物は、癌の術前又は術後の治療に使用することができる。

更に加えて、本発明化合物は放射線療法と組み合わせて使用することができる。

【０６２８】

本発明に係る組合せ物は、本発明化合物と他の有効な抗癌剤の両方を固定の組合せで含有する組成物（固定単位投与形）、又は２以上の活性成分を別個の投与形として含有する医薬包装品（非固定組合せ物）を指すことができる。２以上の活性成分を含有する医薬パックの場合、活性成分は、有利にはコンプライアンスの改善に適するブリスターカード中に包装される。

【０６２９】

各ブリスターカードは、好ましくは一日に摂取されるべき医薬品を含有する。それらの薬品が一日の異なる時点で摂取される場合には、薬剤は、それらが摂取される日の種々の時間の範囲に応じて（例えば朝と夕、又は朝、昼及び夕）ブリスターカード上の異なる区画に配置することができる。一日の特定時点で一緒に摂取されるべき医薬品のためのブリスター空隙は、一日の時間のそれぞれの範囲に合わせられる。一日の種々の時間は、もちろん明瞭に見えるやり方でブリスター上に記入される。もちろん、例えば医薬品を摂取すべきである時間を指示すること、例えばその時間を具体的に示すことも可能である。

【０６３０】

日割は、ブリスターカードの１本の線を表すことがあり、そして一日の時間はこの縦列での時間的順序で同定される。

【０６３１】

一日の特定時間で一緒に摂取しなければならない医薬品は、有利には間隔を離さずに、ブリスターカード上の適当な時間のところに配置され、それらを容易にブリスターから押し出すことができ、そしてブリスターから剤形を取り出すのを忘れないという効果を有する。

【０６３２】

生物学的研究

Eg5キネシンモーター領域（Cytoskeleton，カタログ番号EG01）のATPアーゼ活性を用いて、活性調節剤の効果をモニタリングすることができる。まず試験化合物をジメチルスル

ホキシド（DMSO）中の10 mM溶液として溶解させる。試験化合物の適当なDMSO希釈液2μlを96ウエル平底プレートの各ウエルに添加する。各化合物希釈液を三重反復試験する。試薬を添加し、標準アッセイの最終反応液は、100μlの反応容量において15 mM Pipes，pH 6.8，5.0 mM $MgCl_2$，0.5 mM KCl，1 mM EGTA，0.1 mg/ml BSA，1μM パクリタキセル，250 nM 予備形成微小管（Cytoskeleton，カタログ番号 MT001），300μM ATP，及びEg5タンパク質(50 ng)を含有する。対照は、ATPと2% DMSOを含む緩衝液ウエルである。ATPAの添加により反応を開始し、室温で30分間インキュベートし、そして20μlの反応容量を取り、それを80μlの1M過塩素酸に添加することによって反応を停止させ、続いて80μlのマラカイトグリーン試薬を添加する。マラカイトグリーン試薬は、100 mlの4 N HCl中の4.2gのモリブデン酸アンモニウムの溶液を、300 mlのH_2O中の0.135gのマラカイトグリーンの溶液と混合することにより調製する。前記反応液を更に20分間インキュベートし、次いで615 nmで読み取る。

【0633】

Eg5阻害についての化合物の対応するIC_{50}値を、濃度－効果曲線から決定する。

前記アッセイで測定された代表的阻害値〔－log EC_{50}（モル/L）として測定〕を下記表Aに示すが、表中の化合物の番号は実施例の番号に相当する。

【0634】

【表113】

表A

Eg5活性の阻害

化合物	-log EC_{50} [モル/l]
1～15，16～24，25，27～35，37～53，7b	列記した化合物の阻害値は全て≧6.3である

【0635】

本明細書に記載の化合物の抗増殖活性／細胞毒性活性は、PKO型ヒト結腸腺癌細胞のサブクローン（Schmidt他、Oncogene 19，2423-2429，2000）において、Alamar Blue 細胞生死判別試験（O'Brien他、Eur J Biochem 267，5421-5426，2000に記載）を用いて試験することができる。化合物をDMSO中の10 mM溶液として溶解させ、次いで片対数目盛で希釈する。DMSO希釈物を更に10%の仔ウシ血清を含有するダルベッコ改変イーグル培地（DMEM）中に1：100希釈して、試験の際の最終濃度の2倍に等しい最終濃度にする。RKOサブクローンを、96ウエル平底プレート中に1ウエルあたり4000細胞数の密度でウエルあたり50μlの容量で播種する。播種24時間後、DMEM培地中の化合物希釈液それぞれ50μlを96ウエルプレートの各ウエルに添加する。各化合物希釈物を三重反復試験する。未処置の対照細胞を含有するウエルを、1%DMSOを含有する50μlのDMEM培地で満たす。次いでこれらの細胞を試験物質と共に、5%二酸化炭素を含む湿潤雰囲気中で37℃にて72時間インキュベートする。細胞の生存度を測定するために、10μlのAlamar Blue（Biosource社）を添加しそして544 nmの消光及び590 nmの発光で蛍光を測定する。細胞生存度の計算のために、未処置細胞からの蛍光放出率を100%生存度として定め、処置細胞の蛍光放出率を未処置細胞の値に比較して定める。生存度は%値として表わす。得られた用量－応答曲線からの抗増殖活性／細胞毒性のEC_{50}の計算には、Graphpad Prismプログラムを使用する。

【0636】

細胞周期に特異的な作用機構を調べるために、RKO結腸腺癌細胞のサブクローン（Schmidt他、Oncogene 19，2423-2429，2000に記載されたようなRKOp21又はRKOp27）を96ウエル平底プレート中に、1ウエル当たり16000細胞数の密度において、10μMポナステロンAを含有する10%FCS＋DMEM増殖培地中、1ウエル当たり50μlの容量で播種する。播種24時間後、DMEM培地中の化合物希釈液の各50μlを96ウエルプレートの各ウエルに添加する。各

化合物希釈液を四重反復試験する。未処置の対照細胞を含有するウエルを、１％DMSOを含有する50μｌのDMEM培地で満たす。次いでこれらの細胞を試験物質と共に、５％二酸化炭素を含有する湿潤雰囲気中で37℃にて72時間インキュベートする。細胞生存度を測定するために、10μｌのAlamar Blue（Biosource社）を添加し、そして544 nmｎｍの消光及び590 nmの発光で蛍光を測定する。細胞生存度の計算のために、未処置細胞からの蛍光放出率を100％生存度として定め、処置細胞の蛍光放出率を未処置細胞の値に対比して定める。生存度は％値として表わす。得られた用量－応答曲線からのEC_{50}値の計算には、Graphpad Prism プログラム（GraphPad Spftware, Inc.）を用いる。誘導物質であるポナステロンＡの不在下で増殖した増殖性細胞の生存度を、ポナステロンＡによって誘導された異所性p27Kip1の発現により停止した細胞の生存度に対して比較する。

【０６３７】

前記アッセイで測定された抗増殖性／細胞毒性についての代表的IC_{50}値［－log EC_{50}（モル/L）として測定］は下記表Ｂ１、Ｂ２及びＢ３から分かり、表中の化合物の番号は実施例の番号に相当する。

【０６３８】

【表１１４】

表Ｂ１

RKO結腸癌細胞に対する抗増殖活性／細胞毒性活性

	-log EC_{50} [モル/l] RKO p27誘導（静止）≦5.5	-log EC_{50} [モル/l] RKO p27誘導（静止）≦6.5
-log EC_{50} [モル/l] RKO p27未誘導（増殖）≧7.4	3, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 14, 15, 16-20, 23, 25, 27-30, 33, 35, 39-44, 46-53, 7b	37, 38, 45
-log EC_{50} [モル/l] RKO p27未誘導（増殖）＜7.4で≧6.6	1, 4, 5, 12, 13, 22, 24, 31, 32, 34	

【０６３９】

【表１１５】

表Ｂ２

RKO結腸癌細胞に対する抗増殖活性／細胞毒性活性

	-log EC_{50} [モル/l] RKO p27又はp21誘導（静止）≦5.5	-log EC_{50} [モル/l] RKO p27又はp21誘導（静止）≦6.5
-log EC_{50} [モル/l] RKO p27又はp21未誘導（増殖）≧7.4	67-72, 74, 76-81, 82-84, 86-90, 92-104, 135-141	105-115, 117-119, 122, 124, 126-128, 130-133, 143, 145-149
-log EC_{50} [モル/l] RKO p27又はp21未誘導（増殖）＜7.4で≧6.6	73, 75, 81, 85	55, 57, 116, 120, 121, 123, 125, 129, 142, 144

【０６４０】

【表１１６】

表Ｂ３
RKO結腸癌細胞に対する抗増殖活性／細胞毒性活性

-log EC_{50} [モル/l] RKO p21未誘導 (増殖)≧7.4	150, 152-158 163, 167-169, 171-182, 185, 211-219, 228, 230-233, 234, 235, 237-239, 242, 243, 247, 249-251, 256, 268-276, 278, 279, 284, 296, 314, 337-339, 341-347, 352, 354, 369-371, 373, 375-379 383-387, 389-394, 397, 426, 453, 462, 467-470, 474, 476, 478, 490, 533-544
-log EC_{50} [モル/l] RKO p21未誘導 (増殖)＜7.4で≧6.6	55a, 151, 159-162, 164-166, 170, 184, 186-208, 210, 220-224, 225, 226, 229, 236, 240, 241, 244-246, 248, 252-255, 257-259, 261-266, 277, 280-283, 285-290, 292-295, 297-300, 302-306, 308-313, 315-317, 319, 321-327, 329-336, 340, 348-350, 353, 355-357, 359-362, 380-382, 388, 395, 396, 406-408, 410, 413, 414, 451, 452, 454, 456-461, 463-466, 471, 472, 475, 477, 479-483

【０６４１】
アポトーシスの誘導は、細胞死検出ELISA（Roche Biochemicals, Mannheim,ドイツ）を用いて測定することができる。NCI-H460非小細胞肺癌細胞を、96ウエル平底プレート中に、１ウエル当たり10000細胞数の密度で、１ウエル当たり50μｌ容量のRPMI培地（10％仔ウシ血清を含有する）中に播種する。播種24時間後に、RPMI培地中の化合物希釈液各50μｌを96ウエルプレートの各ウエルに添加する。各化合物希釈液は少なくとも三重反復試験として試験する。未処置の対照細胞を含有するウエルを１％RPMI含有DMEM培地50μｌで満たす。次いでこれらの細胞を試験物質と共に、５％二酸化炭素を含有する湿潤雰囲気中で37℃にて24時間インキュベートする。アポトーシスの誘導についての正の対照として、50μMシスプラチン（Gry Pharmaceuticals, Kirchzarten, ドイツ）で処置する。次いで培地を除去し、200μｌの溶解緩衝液中で細胞を溶解させる。製造業者により記載された通りの遠心分離の後、10μｌの細胞溶解物をプロトコルに記載の通りに処理する。アポトーシスの程度は以下のように算出される：50μMシスプラチンで処置した細胞からの溶解物を用いて得られた405 nmでの吸光度を100 cpu（シスプラチン単位）として設定し、一方で405 nmでの吸光度0.0を0.0 cpuとして設定する。アポトーシスの程度は、50μMシスプラチン処置細胞から得られた溶解物を使って達成された100 cpuの値に対比したcpuとして表わされる。

【０６４２】
Eg5機能の実験的混乱は紡錘体の特徴的奇形を引き起こし、これは共焦点レーザー走査顕微鏡により検査することができる。HeLa子宮頸癌細胞を、カバーガラス片（Nunc(商標) Lab-Tek(商標)チャンバースライド）上で、10％仔ウシ血清を含有するDMEM 1800μｌ中で一晩増殖させる。試験化合物をDMSO中10 mM溶液として溶解させる。試験化合物の適当なDMSO希釈液を、10％仔ウシ血清含有DMEM中に１：10希釈して、試験の最終濃度の10倍に等しい最終濃度を与える。播種24時間後、DMEM培地中の化合物希釈液200μｌを、カバー片の各ウエルに添加する。対照として、10％DMSO含有DMEM 200μｌを添加する。試験化合物とのインキュベーション後24時間目に、細胞をPBSで洗浄し、そしてH_2O中3.7％ホルムアルデヒドで37℃にて20分間固定する。続いて、細胞をPBSで洗浄し、1.471 mM KH_2PO_4, 8.504 mM Na_2HPO_4, 137 mM NaCl, 1.325 mM $CaCl_2$, 2.685 mM KCl, 0.542 mM $MgCl_2$を含有する緩衝液, pH 7.2中の0.1％Triton X-100と共に室温で15分間インキュベートする。非特異的結合の飽和のため、細胞をPBS中の2％BSA／10％FCS（＝遮断緩衝液）中で室温にて30

分間インキュベートし、その後、抗α－チューブリンモノクローナル抗体（Sigma, #T5168；1：1000）と共にインキュベートし、引き続きCy3-接合ウサギ抗マウスIgG(H+L)抗体（Jackson Immuno Research; １：1000）と共にインキュベートする。全ての抗体インキュベーションは遮断緩衝液中で37℃にて１時間実施し、そして異なるインキュベーションの間に細胞をPBSで３回洗浄する。Hoechst 33342（0.1μg/ml）でDNAを対比染色する。スライドガラスをVectashield（Vector Laboratories, Burlingame, CA）中にはめ込み、そして適当なフィルターが取り付けられたライカ社製TCS SP2共焦点レーザ走査顕微鏡（Leica Microsystems, Bensheim, ドイツ）を用いて検査する。

【０６４３】

本発明化合物の幾つかは、ｐ糖タンパク質により媒介される多剤耐性腫瘍細胞系（例えばHCT-15）に対して有効であり、これは次のようにして測定することができる：

【０６４４】

全ての細胞系は、37℃，5%CO_2及び湿度95%にて組織培養インキュベーター中で標準条件にて培養する。１日目に、細胞をトリプシン／EDTAにより脱着させ、そして遠心分離によりペレット状にする。細胞を培地中に適当な密度に再懸濁し、96ウエルマイクロタイタープレート中に播種し、37℃，5%CO_2及び湿度95%にて組織培養インキュベーター中で一晩インキュベートする。試験すべき全ての化合物の原液をDMSO中10 Mとなるよう溶解し、そして２日目に所望の希釈率でマイクロタイタープレートに添加する。マイクロタイタープレート中の最終DMSO濃度は１％に維持される。対照細胞はDMSOのみで処置する。マイクロタイタープレートを37℃，5%CO_2及び湿度95%にて組織培養インキュベーター中で更に72時間インキュベートする。細胞の生存度を５日目に測定するため、Alamar Blue溶液（Biosource）をマイクロタイタープレートに１/10培養容量で添加する。細胞を37℃，5%CO_2及び湿度95%にて組織培養インキュベーター中で更に３～６時間インキュベートし、そして544 nmの消光と590 nmの発光において蛍光を測定する。細胞生存度の算出のため、未処置細胞からの蛍光放出率を100%生存度として設定し、そしてその未処置細胞の値に対しての処置細胞の蛍光放出率を%値として表す。

【０６４５】

得られた用量－応答曲線からのEC_{50}値の算出には、Graphpad Prismプログラムを使用する。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		FI	
A61P 31/18	*(2006.01)*	A61K 45/00	
A61K 31/437	*(2006.01)*	A61P 35/02	
A61K 31/444	*(2006.01)*	A61P 31/18	
A61K 31/4545	*(2006.01)*	A61K 31/437	
A61K 31/55	*(2006.01)*	A61K 31/444	
A61K 31/496	*(2006.01)*	A61K 31/4545	
A61K 31/5377	*(2006.01)*	A61K 31/55	
A61P 17/06	*(2006.01)*	A61K 31/496	
A61P 19/02	*(2006.01)*	A61K 31/5377	
A61P 29/00	*(2006.01)*	A61P 17/06	
A61P 9/10	*(2006.01)*	A61P 19/02	
A61P 37/06	*(2006.01)*	A61P 29/00	１０１
A61P 31/10	*(2006.01)*	A61P 9/10	１０１
A61P 19/08	*(2006.01)*	A61P 9/10	
A61P 9/00	*(2006.01)*	A61P 37/06	
A61P 35/04	*(2006.01)*	A61P 29/00	
		A61P 31/10	
		A61P 19/08	
		A61P 9/00	
		A61P 35/04	

(74)代理人 100108903
弁理士 中村 和広
(74)代理人 100141977
弁理士 中島 勝
(72)発明者 フェンネマン，マティアス
ドイツ連邦共和国，７８４６２ コンスタンツ，ライナーシュトラーセ ２０
(72)発明者 ベーア，トーマス
ドイツ連邦共和国，７８４７９ ライヒェナウ，ベルクゲッスレ ５
(72)発明者 ブラウンガー，ユルゲン
オーストリア国，アー－２３４０ メドリンク，プロフェッソルーバルターーレドルガッセ ６
(72)発明者 ツィメルマン，アストリト
ドイツ連邦共和国，７８４６７ コンスタンツ，ヒンデンブルクシュトラーセ ２
(72)発明者 ゲケラー，フォルカー
ドイツ連邦共和国，７８４６５ コンスタンツ，イム グリューン １５

審査官 小出 直也

(56)参考文献 米国特許出願公開第２００５／０００４１５６（ＵＳ，Ａ１）
特表２００８－５０９９７１（ＪＰ，Ａ）

(58)調査した分野(Int.Cl.，ＤＢ名)
Ｃ０７Ｄ ４７１／００－４７１／２２

ＣＡｐｌｕｓ／ＲＥＧＩＳＴＲＹ（ＳＴＮ）